

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ <u>11-1201</u> / <u>13.03.08</u>
Одобрено: <u>12/12.02.08</u>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име на лекарствения продукт

PROFENID 100 mg
ПРОФЕНИД 100 mg

2. Количествен и качествен състав

1 супозитория съдържа 100 mg кетопрофен (ketoprofen)

3. Лекарствена форма

супозитории

4. Клинични данни

4.1 Показания

Те произтичат от противовъзпалителното действие на кетопрофена, от значимостта на симптомите на непоносимост, които лекарствения продукт поражда и от мястото му сред разнообразните лекарствени продукти, които са на разположение сега.

Те се ограничават при възрастни и деца над 15 години в:

Симптоматично лечение на:

- възпалителни форми на хроничен ревматизъм, в това число и ревматоиден полиартрит, анкилозиращ спондилартрит (или сходни заболявания, като синдрома на Файсингер-Лерой-Райтер и псориатичен ревматизъм);

- някои болезнени и инвалидизиращи артрози.

Краткотрайно симптоматично лечение на остри пристъпи на:

- извънставни форми на артрит, като скапулохумерални (раменни) периартрити, тендинити, бурсити,

- микрокристални артрити,

- артрози,

- болки в кръста,

- радикулитни болки,

- остри постравматични доброкачествени заболявания на двигателния апарат.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Дозировка:

Симптоматично лечение

- 1 до 2 супозитории от 100 mg дневно, или 100 до 200 mg на ден.

- Краткотрайно симптоматично лечение на остри пристъпи:

- 3 супозитории от 100 mg дневно

-

Рискови групи:

Пациенти с нарушена бъбречна функция и пациенти в напреднала възраст:

Препоръчва се да се намали началната доза и такива пациенти да се поддържат на минимална ефективна доза. Индивидуалното коригиране на дозата може да се има предвид само след установяване на индивидуалната поносимост на пациента.

Хиповолемични пациенти: вж Предупреждения и Предпазни мерки при употреба.

Пациенти с нарушена чернодробна функция:

Тези пациенти трябва внимателно да се наблюдават и да запазят минималната ефективна дневна доза (виж точки 4.4 и

Деца

Безопасността и ефективността на кетопрофен таблетки, капсули и супозитории не е била установена при деца



Нежеланите лекарствени реакции могат да бъдат намалени като за контролиране на симптомите се употребява възможно най-ниската ефективна доза за възможно най-кратък срок.

Продължителност на приложение:

Ректалното приложение трябва да бъде с възможно по-кратка продължителност поради риска от локална токсичност, който се добавя към рисковете при орално приложение.

Приложение:

Прилага се ректално.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност спрямо ketoprofen или някоя от помощните вещества на лекарствения продукт.

Кетопрофен е противопоказан при пациенти с изявени в миналото реакции на свръхчувствителност като астматични пристъпи или други алергични реакции, към кетопрофен, ацетилсалицилова киселина или други нестероидни противовъзпалителни лекарствени средства. Тежки, рядко с фатален изход анафилактични реакции са били докладвани при такива пациенти (вж точка 4.8 Нежелани лекарствени реакции).

Кетопрофен е противопоказан също и при следните случаи:

- тежка сърдечна недостатъчност
- Анамнеза за стомашно-чревно кървене или перфорация, свързани с предишно лечение с НСПВС.
- активна или анамнеза за язва на стомаха/хеморагия
- кървене от стомашно-чревния тракт, мозъчно-съдов кръвоизлив или каквото и да е друго активно кървене,
- тежка чернодробна недостатъчност,
- тежка бъбречна недостатъчност,
- трети триместър от бременността

4.4 Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба **Специални предупреждения**

Нежеланите лекарствени реакции могат да бъдат намалени като за контролиране на симптомите се употребява възможно най-ниската ефективна доза за възможно най-кратък срок от време (вж т.4.2 и по-долу посочените гастроинтестинални и сърдечно-съдови рискове).

Особено внимание трябва да се обръща на пациенти с комбинирано лечение, поради увеличен риск от язва или кървене, като перорални кортикостероиди, антикоагуланти като варфарин, селективни серотонинови инхибитори или антиагрегационни продукти като ацетилсалициловата киселина (вж точка 4.5 Лекарствени и други форми на взаимодействие).

Пациенти, страдащи от астма, свързана с хроничен ринит и/или с хроничен синусит и/или с назална полипоза рискуват повече от останалите да получат алергична реакция по време на приема на аспирин и/или други нестероидни противовъзпалителни (НСПВС) лекарствени средства. Прилагането на този вид НСПВС може да доведе до появата на астматична криза или спазъм на бронхите, в това число и на хора алергични към аспирина или към НСПВС.

Стомашно-чревно кървене, язва и перфорация: стомашно-чревно кървене, язва или перфорация, които могат да са фатални, са били докладвани при всички нестероидни противовъзпалителни средства по всяко време на лечението, с или без предшествващи симптоми или с предишна анамнеза за кървене или гастроинтестинални събития.



Пациенти в напреднала възраст: При пациентите в напреднала възраст честотата на нежеланите лекарствени реакции към НСПВС е увеличена, особено стомашно-чревна кървене и перфорация, които могат да са с фатален изход.

Тежки кожни реакции, някои от тях фатални, включително ексфолиативен дерматит, синдром на Steven-Johnson, и токсична епидермална некролиза са били докладвани много рядко в комбинация с НСПВС. Пациентите са изложени на най-голям риск в начало на лечението, както и повечето случаи на поява на такива реакции са през първия месец на лечението.

Предпазни мерки при употреба

Пациенти с активна или анамнеза за пептична язва.

НСПВС трябва да прилагат внимателно на пациенти с анамнеза за стомашно-чревна заболяване (улцерозен колит, болест на Crohn), тъй като техните състояния могат да се влошат.

В началото на лечението, бъбречната функция трябва внимателно да се наблюдава при пациенти със сърдечна недостатъчност, цирроза и нефроза при пациенти получаващи диуретична терапия, при пациенти с хронична бъбречна недостатъчност, особено ако пациентът е в напреднала възраст. При тези пациенти употребата на ketoprofen може да предизвика намаляване на бъбречния кръвоток причинено от подтискането на простагландините и води до бъбречна недостатъчност.

Сърдечно-съдови и мозъчно съдови ефекти

Необходимо е да се осигурят подходящо наблюдение и съвет за пациенти с анамнеза за хипертония и/или лека до умерена застойна сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за отоци и задръжка на течности, свързани с лечението с неселективни НСПВС.

Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на някои НСПВС (особено във високи дози и при продължително приложение) може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт). Няма достатъчно данни, за да се изключи такъв риск при кетопрофен.

Пациенти с неконтролирана хипертония, застойна сърдечна недостатъчност, установена исхемична болест на сърцето, заболяване на периферните артерии и/или мозъчно-съдова болест трябва да се лекуват с кетопрофен само след внимателно обмисляне. Такова обмисляне трябва да се прави преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови събития (например хипертония, хиперлипидимия, захарен диабет, тютюнолушене).

Подобно на другите НСПВС, при наличието на инфекциозно заболяване, трябва да се отбележи, че противовъзпалителните и антипиретичните свойства на ketoprofen могат да замаскират обичайните признаци за развитието на инфекция, например треска.

– При пациенти с изразено нарушение на чернодробните функции или с анамнеза за чернодробно заболяване, се препоръчва периодично проследяване нивата на аминотрансаминазите, особено по време на продължително лечение. Редки случаи на жълтеница и хепатит са били описани с кетопрофен.

Ако зрителни нарушения като замъглено виждане се появи, лечението трябва да се прекъсне.



Пациентите с данни за реакции на фоточувствителност или фототоксичност трябва да се следят внимателно.

Употребата на НСПВС може да наруши фертилността при жени и затова не се препоръчва при жени, желаещи да забременеят. При жени, които не могат да забременеят или провеждат изследвания за стерилност, трябва да преустановят приемането на НСПВС.

Пациенти, с данни за изяви в миналото реакции на фоточувствителност или фототоксичност трябва да бъдат стриктно наблюдавани.

Употребата на НСПВС може да наруши фертилността при жени и затова не се препоръчва при жени, желаещи да забременеят. При жени, които не могат да забременеят или провеждат изследвания за стерилност, трябва да преустановят приемането на НСПВС.

4.5 Лекарствени и други взаимодействия

Риск свързан с хиперкалиемия:

Някои лекарства или терапевтични класове могат да предизвикат появата на хиперкалиемията: солите на калия, калий задържащи диуретици, инхибитори на конвертиращия ензим, инхибитори на ангиотензин II рецепторите, НСПВС, хепарини (нискомолекулни или нефракционирани), cyclosporin, tacrolimus и trimethoprim. Появата на хиперкалиемия може да зависи от наличието на взаимосвързани фактори.

Този риск се засилва в случай на комбинирано лечение с гореспоменатите лекарствени продукти.

Риск, свързан с антиагрегантното действие върху тромбоцитите:

Поради свойствата си да инхибират тромбоцитите, някои продукти участват в лекарствени взаимодействия : аспирин и НСПВС, ticlopidine и clopidogrel, tirofiban, eptifibatide и abciximab, iloprost.

Употребата на някои тромбоцитни инхибитори повишава риска от кървене, както и тяхното комбиниране с хепарин или подобни продукти (хирудини), перорални антикоагуланти и тромболитици, което налага редовно клинично проследяване и лабораторни изследвания.

Едновременното прилагане на ketoprofen със следните продукти налага внимателно проследяване на клиничното състояние на пациента и лабораторните му показатели:

Не се препоръчва комбинирането с:

Други НСПВС (включително циклооксигеназа-2-селективни инхибитори) и високи дози салицилати: повишен риск от язва на стомаха и кървене

Антикоагуланти (хепарин и варфарин) и тромболитни антиагреганти (като тиклопидин, клопидогрел): Ако едновременното им приложение не може да се избегне, пациентът трябва стриктно да се наблюдава.

Литий:

Риск от повишаване нивото на литий в кръвта понякога може да достигне токсични нива поради понижена на бъбречна екскреция. При необходимост, нивото на лития в кръвта трябва строго да се следи и дозата на лития да се коригира по време и след спиране на терапията с НСПВС.

Methotrexate (в дози над 15 mg седмично):



Увеличен риск от хематолигичната токсичност на methotrexate, особено ако се прилага във високи дози (> 15 mg/седмично), вероятно се дължи на изместване от свързания с плазмените протеини метотрексат и намелен бъбречен клирънс

Комбиниране, изискващо предпазни мерки:

Кортикостероиди: увеличен риск от стомашно-чревна язва или кървене (вж точка 4.4)

Диуретици:

Пациенти и особено дехидратирани пациенти, вземащи диуретици са с най-голям риск от развитието на бъбречна недостатъчност и вторично намаляване на гломерулната филтрация поради намаляване синтезата на бъбречните простагландини. Такива пациенти трябва да се хидратират преди започване на комбинираното лечение и изследване на бъбречната функция преди лечението (вж т 4.4).

АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите: При пациенти с нарушена бъбречна функция (напр. дехидратирани пациенти или при пациенти в напреднала възраст, едновременно употребявани АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите и агенти, които подтискат циклооксигеназата може да предизвика нарушение на бъбречната функция, включително остра бъбречна недостатъчност.

Ниски дози methotrexate (под 15 mg седмично): през първите седмици на комбинираното лечение, веднъж седмично се прави пълна кръвна картина. Ако има някакво отклонение от бъбречната функция или пациентът е в напреднала възраст, наблюдението се извършва по-често.

Пентоксифилин: Има увеличен риск от кървене. Изисква се по-често клинично наблюдение и проследяване времето на кървене.

Да се вземе под внимание комбинирането с:

Антихипертензивни продукти (бетаблокери, инхибитори на конвертиращия ензим, диуретици): риск от намален антихипертензивен ефект (подтискане на съдоразширяващите простагландини от НСПВС).

Тромболитици

Увеличен риск от кървене

Probenecid : едновременното приложение с пробеницид води до значително понижение на плазмения клирънс на кетопрофен.

Селективни серотонинови инхибитори (SSRIs): увеличен риск от стомашно-чревна кървене.

4.6 БРЕМЕННОСТ И КЪРМЕНЕ

Бременност:

При хората, няма данни за нежелани ефекти върху плода. Въпреки това са необходими допълнителни епидемиологични изследвания, за да се изключи всякакъв риск.

По време на третото тримесечие, всички инхибитори на синтеза на простагландините могат да изложат:

- Плода на кардиопулмонарна токсичност (повишено артериално кръвно налягане с преждевременно затваряне на артериалния канал) и на бъбречна дисфункция, която може да доведе до бъбречна недостатъчност с олигохидрамнион.



- Майката и детето, в края на бременността, на едно евентуално удължаване на времето на кървене.

Според случая, предписването на НСПВ трябва да бъде извършвано само когато е крайно наложително през първите пет месеца на бременността.

Извън изключително ограничена акушерска употреба, предписването на НСПВ е абсолютно противопоказно след шестия месец.

Кърмене:

НСПВ преминават в майчиното мляко и поради мерки за безопасност би следвало да се избягва да се прилагат при кърмачки.

4.7 ШОФИРАНЕ И РАБОТА С МАШИНИ

Пациентите да бъдат предупреждавани за възможна поява на световъртеж, сънливост, конвулсии или зрителни смущения. Препоръчва се да не се шофира или да се работи с машини, ако един от тези симптоми се прояви.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Стомашно-чревни реакции:

- стомашна болка, затруднено храносмилане, коремна болка, гадене, повръщане, диария, констипация, флатуленция.
- Гастрит, стоматит, обострен колит, и болест на Крон.
- Язва на стомаха, кръвоизлив на стомаха и перфорация.

Реакции на свръхчувствителност:

- Дерматологични реакции: обрив, силен сърбеж, уртикария, ангиоедем

Кожни реакции:

Фоточувствителност, алопеция, булозни дерматози (Стивънс-Джонсън и токсични епидермални некролизи)

Респираторни:

може да възникнат астматични пристъпи или бронхоспазм, особено при лица алергични спрямо аспиринов и други НСПВС.

Невро-психични разстройства: възможно е да възникнат главоболие, световъртеж, сомнолентност, и рядко гърчове и нарушения на настроението.

Очни смущения: замъглено зрение.

Слухови смущения: звън в ушите.

Бъбречни смущения: остра бъбречна недостатъчност, подпомогната от предшестващо бъбречно нарушение и/или понижен обем на циркулираща кръв, в редки случаи интерстициален нефрит, нефротичен синдром.

Хематологични смущения: тромбоцитопения, анемия дължаща се на кървене, агранулоцитоза, левкопения, костно-мозъчна аплазия

Чернодробни смущения: повишени нива на трансаминазите, в редки случаи хепатит.

Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на някои НСПВС (особено във високи дози и при продължително приложение) може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт).

Има съобщения за отоци, хипертония и сърдечна недостатъчност свързани с употребата на НСПВС.



Странични явления, свързани с начина на приложение (супозитории): риск от локална токсичност, което зачестява и се усилва с продължителността на лечението, завишен ритъм на приложение и дозировка. Могат да се появят ректални раздразнения от типа на парене.

4.9 ПРЕДОЗИРАНЕ

При възрастните основните белези на предозирание са главоболие, световъртеж, сънливост, гадене, повръщане, диария и коремни болки. В случай на тежка интоксикация се наблюдават понижаване на кръвното налягане, подтискане на дишането, стомашно-чревни кръвоизливи.

Пациентът трябва да се отведе незабавно в специализирано болнично заведение, където да му бъде приложено симптоматично лечение.

За да се ограничи абсорбцията на кетопрофен може да се извърши стомашна промивка и прилагане на активен въглен.

Няма специфичен антидот.

5. Фармакологични данни

5.1 Фармакодинамични свойства

Нестероидно противовъзпалително (М : мускул и скелет).

Кетопрофен е нестероидно противовъзпалително, производно на арил карбоксиловата киселина от групата на пропионатите.

Той притежава следните качества:

- Централно и периферно аналгетично,
- Антипиретично,
- Противовъзпалително,
- Краткотрайно инхибиране на тромбоцитната функция.

Като цяло тези качества се дължат на инхибирането на простагландиновата синтеза.

На базата на много експериментални модели при кетопрофен се наблюдава, за разлика от другите НСПВ, съставка с централно аналгетично действие.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция:

Супозитория от 100 mg

Последователните измервания на серумните нива след приложение на една терапевтична доза показват, че кетопрофенът се абсорбира много бързо. Срокт за достигане на максимално серумно ниво е от 60 до 90 мин след орално приложение, 45 до 60 мин след ректално приложение.

Разпределение:

Средният плазмен полуживот е от 1,5 до 2 часа при орален прием (форми с бързо освобождаване), от 2,2 часа при ректален прием.

Кетопрофенът се свързва до 99% с плазмените протеини.

Кетопрофенът преминава в синовиалната течност и там се открива в по-високи нива от плазмените на 4-тия час след орален прием. Той преминава плацентарната и хемато-енцефалната бариера.

Обемът на разпределение е около 7 l.

Метаболизъм:

Биотрансформацията на кетопрофен се извършва по два начина: единият в незначителна степен (хидроксилиране), другият значително доминиращ (конюгация с глюкуронова киселина).

По-малко от 1% от приложената доза кетопрофен се намира в непроменена форма в урината, докато свързаната с глюкуронова киселина представлява около 65 – 75% .

Отделяне:



Отделянето, изключително чрез урината е бързо защото 50% от приложената доза се елиминира по време на първите 6 след приема, независимо от начина на приложение. Формата с постепенно освобождаване не променя процеса на бъбречното елиминироване на кетопрофена.

5 дни след оралното приложение, 75 до 90% от дозата се елиминират чрез бъбреците и 1 до 8% чрез изпражненията.

Физиопатологични разновидности:

Хора в напреднала възраст: при хора в напреднала възраст, абсорбцията на кетопрофен не е променена, но за сметка на това полу-живота на елиминироване е удължен (3h).

Хора с бъбречна недостатъчност: при тези пациенти, пълното почистване се удължава пропорционално на степента на бъбречна недостатъчност.

5.3 ПРЕДКЛИНИЧНИ ДАННИ ЗА БЕЗОПАСНОСТ

6. Фармацевтични данни

6.1 Списък на помощните вещества и техните количества :

Hydrophobic silica 100mg, solid semi synthetic glycerides(type supporicet)
2.50mg.

6.2 Физико - химични несъвместимости

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.5 Данни за опаковката

Запечатан чрез нагриване полиетиленов- поливинилхлориден филм
по 12 броя супозитории в опаковка

6.6 Препоръки при употреба

Няма специални препоръки

7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Aventis Pharma S.A.

20 avenue Raymond Aron 92160 Antony Cedex

France

8. Регистрационен № в регистъра

20030008/13.01.2003

9. Дата на първо разрешаване/последно подновяване на разрешението за употреба

13.01.2003

10. Дата на последна редакция на текста

май 2007

