

Корекция
23/07/02

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

UPFEN®
УПФЕН

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Ibuprofen 200.000 mg

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 6206/21.10.02

625/17.09.02 *Мечини*

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ефервесцентни таблетки

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Симптоматично лечение на слаби до умерени болки и/или фебрилни състояния

4.2. Дозировка и метод на приложение

Метод на приложение

Перорално приложение

Таблетките се разтварят в голяма чаша вода, за препоръчване по време на хранене.

Дозировка:

ПРИЛОЖЕНИЕТО Е ЗА ВЪЗРАСТНИ И ДЕЦА (НАД 12 ГОДИНИ)

Една ефервесцентна таблетка (200 mg), при необходимост може да се повтори след 6 часа. При по-интензивна болка или фебрилитет дозировката е две ефервесцентни таблетки от 200 mg, при необходимост може да се повтори след 6 часа.

Дозата не трябва да превишава 6 таблетки дневно (1200 mg дневно).

Честота и време на приложение:

Редовното приложение допринася за избягване на колебанията в температурата или болката.

Между дозите трябва да има интервал от най-малко 6 часа.

4.3. Противопоказания



Този лекарствен продукт е противопоказан при следните случаи:

- по време и след 6-ия месец на бременността (виж раздел “Бременност и кърмене”)
- анамнеза за алергия или астма, предизвикани от приложението на ибупрофен или вещества с подобна активност като други НСПВС, аспирин
- анамнеза за алергия към други съставки на таблетката
- активна пептична язва
- тежка хепатоцелуларна недостатъчност
- тежка бъбречна недостатъчност
- системен лупус еритематозус.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки при употреба

Предупреждения

Пациенти с астма, съпроводена с хроничен ринит, хроничен синусит и/или назална полипоза, са подложени на по-голям риск от развитие на алергия след прием на аспирин и/или нестероидни противовъзпалителни лекарства в сравнение с останалата популация.

Приложението на този лекарствен продукт може да предизвика пристъп от астма, особено при някои лица, алергични на аспирин или НСПВС (виж раздел “Противопоказания”).

По всяко време на лечението може да възникне кръвоизлив от стомашно-чревния тракт или язва/перфорация, без непременно да има предупредителни признаци или анамнеза за това. Относителният риск нараства при пациентите в напреднала възраст, изтощени болни, пациенти с ниско телесно тегло, болни, подложени на лечение с антикоагуланти или антиагреганти (виж раздел “Взаимодействие с други медицински продукти и други форми на взаимодействие”).

При поява на кръвоизлив от стомашно-чревния тракт или язва лечението трябва да се преустанови незабавно.

Тъй като съдържа лактоза, това лекарство е противопоказано в следните случаи: вродена галактоземия, малабсорбционен синдром на глюкоза или галактоза, лактазна недостатъчност.

Пациенти в напреднала възраст: тъй като възрастта не променя кинетиката на ибупрофена, дозировката не трябва да се променя съответно.

Ибупрофен трябва да се прилага внимателно и под специално наблюдение на пациента при анамнеза за храносмилателни нарушения (пептична язва, хиатусна херния, кръвоизлив от стомашно-чревния тракт и др.).

В началото на лечението се налага внимателно проследяване на обема на диурезата и бъбречната функция при болни, страдащи от хронична сърдечна, чернодробна или бъбречна недостатъчност, при пациенти, приемащи диуретици, след голяма операция, която е довела до хиповолемия и особено при пациенти в напреднала възраст. В случаи на тежка сърдечна недостатъчност състоянието на пациента може да се влоши.



В случай на някакви зрителни смущения трябва да се извърши пълен офталмологичен преглед.

При продължително лечение се препоръчва проследяване на диференциалната кръвна картина, чернодробната и бъбречната функция.

Като всяко лекарство, подтискащо простагландиновата синтеза, UPFEN може да доведе до увреждане на фертилитета и не се препоръчва при жени, които планират бременност. Прекратяването на неговата употреба трябва да се обсъди при пациентки със съмнения за или в хода на диагностични процедури за стерилитет.

Това лекарство съдържа 150 mg натрий във всяка ефервесцентна таблетка, който трябва да се вземе предвид при лечението на пациенти с ограничение на натрия в диетата.

Това лекарство съдържа 1.4 g лактоза във всяка ефервесцентна таблетка, която трябва да се отчете в дневния прием на пациенти с ограничение на захарта в диетата или с диабет.

4.5. Взаимодействия с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Риск свързан с хиперкалиемия:

Някои лекарства или терапевтични класове могат да увеличат вероятността от възникване на хиперкалиемия: калиеви соли, калий-съхраняващи диуретици, инхибитори на ангиотензин-конвертиращия ензим, инхибитори на ангиотензин II, нестероидни противовъзпалителни средства, хепарини (с ниско молекулярно тегло или нефракционирани), циклоспорин и такролимус, триметоприм. Възникването на хиперкалиемия може да зависи от наличието на съпътстващи фактори.

Този риск се увеличава при комбиниране с гореспоменатите лекарства.

- Риск свързан с действието на тромбоцитни анти-агреганти:

Няколко субстанции са включени във взаимодействията поради тромбоцитните си анти-агрегантни свойства: аспирин и НСПВС, ticlopidine и clopidogrel, tirofiban, eptifibatide .

Използването на няколко тромбоцитни анти-агреганти повишава риска от кръвоизливи: комбинацията от тромбоцитни анти-агреганти и хепарин или подобни субстанции (hirudines), орални анти-коагуланти и тромболитици, и трябва да се вземе под внимание като редовно се следят клиничните и биологични показатели.

- Едновременното приложение на ибупрофен със следните продукти изисква стриктно наблюдение на клиничното състояние и параклиничните показатели на пациента.

Непрепоръчителни комбинации:

- Други НСПВС (включително салицилати в големи дози): повишава се рискът от язва и кръвоизлив от стомашно-чревния тракт (адитивен синергизъм).



- **орални антикоагуланти:** повишава се рискът от кръвоизливи при приложение на оралните антикоагуланти (инхибиране на тромбоцитната функция и дразнене на гастро-дуоденалната лигавица от НСПВС). Ако тази комбинация не може да се избегне, необходимо е внимателно клинично и параклинично мониториране.
- **Хепарини в лечебни дози или при пациенти в напреднала възраст:** повишава се рискът от кръвоизливи (инхибиране на тромбоцитната функция и дразнене на гастро-дуоденалната лигавица от НСПВС). Ако тази комбинация не може да се избегне, необходимо е внимателно клинично проследяване (и параклинично мониториране при нефракционирани хепарини).
- **Литий :** повишават се серумните нива на лития, които могат да достигнат токсични стойности (намаление на реналната екскреция на лития). Ако тази комбинация не може да се избегне, необходимо е внимателно да се проследяват нивата на лития и да се коригира дозировката му по време на комбинираното лечение и след преустановяване на НСПВС.
- **Метотрексат, използван в дози над 15 mg седмично:** засилва се хематологичната токсичност на метотрексата (намаление на бъбречния клирънс на метотрексата, дължащ се на приложението на противовъзпалителните продукти).

Комбинации, които изискват предпазливост при употреба:

- **Диуретици, инхибитори на ангиотензин-конвертиращия ензим (АКЕ), инхибитори на ангиотензин II:** остра бъбречна недостатъчност при дехидратирани пациенти (намаление на гломерулната филтрация поради намаление на синтезата на бъбречните простагландини). Изисква се хидратиране на пациента и проследяване на бъбречната функция в началото на лечението.
- **Метотрексат, използван в дози по-малки от 15 mg седмично:** засилва се хематологичната токсичност на метотрексата (намаление на бъбречния клирънс на метотрексата, дължащ се на приложението на противовъзпалителните продукти). Изисква се ежеседмично проследяване на кръвната картина през първите седмици на комбинирано лечение. Засилено мониториране в случай на увреждане (дори слабо изразено) на бъбречната функция, както и при пациенти в напреднала възраст.

Комбинации, които трябва да се имат предвид:

- **Други тромбоцитни анти-агреганти (abciximab, eptifibatide, clopidrogel, iloprost, ticlopidine, tirofiban), хепарини в профилактични дози:** повишава се риска от кръвоизливи.
- **Други субстанции, които предизвикват хиперкалиемия (калиеви соли, диуретици, които водят до хиперкалиемия, инхибитори на ангиотензин-конвертиращия ензим (АКЕ), инхибитори на ангиотензин II, други НСПВС, хепарини (с ниско молекулярно тегло или нефракционирани, диклоспорин, такролимус, триметоприм):** риск от хиперкалиемия.



- **Бета-блокери** (екстраполиране от индометацина): намаление на антихипертензивния ефект (инхибиране на простагландините с вазодилаторно действие от НСПВС).
- **Циклоспорин**: риск от адитивен ефект по отношение на нефротоксичните ефекти, особено при болни в напреднала възраст.
- **Вътрематочна спирала**: спорен риск от намаляване на ефективността на вътрематочната спирала.

4.6. Бременност и кърмене

Бременност

Не се съобщава за особено малформативно действие при хора. Необходими са обаче допълнителни епидемиологични проучвания, за да се потвърди отсъствието на риск.

По време на последните три месеца от бременността всички инхибитори на простагландиновата синтеза може да изложат :

- плода на:
 - кардио-пулмонарна токсичност (белодробна хипертония с преждевременно затваряне на ductus arteriosus),
 - бъбречна дисфункция, която може да доведе до бъбречна недостатъчност с олигохидрамнион,
- майката и детето в края на бременността до удължено време на кърмене.

Следователно, предписването на НСПВС през първите 5 месеца от бременността трябва да се обмисля само при необходимост.

Освен крайно ограниченото приложение в акушерството, което изисква специално мониториране, предписването на НСПВС е противопоказано след 6-ия месец.

Кърмене

Тъй като НСПВС преминават в кърмата, като предпазна мярка тяхното прилагане при кърмачки трябва да се избягва.

4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите трябва да знаят, че може да настъпят замайване и зрителни смущения.

4.8. Нежелани реакции



- Стомашно-чревни:
Стомашно-чревни проблеми като гадене, повръщане, стомашна болка, диспепсия, преходни нарушения, окултни или изявени кръвоизливи са били съобщавани често. Колкото използваната доза и продължителността на лечение са по-големи, толкова по-чести са тези ефекти.
- Реакции на свръхчувствителност:
 - дерматологични: кожен обрив, сърбеж, оток, обостряне на хронична уртикария.
 - респираторни: появата на астматичен пристъп при някои лица може да бъде свързана с употребата на аспирин или НСПВС (виж “Противопоказания”).
 - системни: Едем на Квинке, анафилактичен шок
- Ефекти върху централната нервна система:
В изключителни случаи ибупрофен може да предизвика замаяване и главоболие.
- Други:
 - има съобщения за няколко редки случаи на зрителни смущения
 - олигурия, бъбречна недостатъчност
 - диагностицирането на асептичен менингит по време на приема на ибупрофен трябва да предизвика изследване за евентуално наличие на лупус еритематозус или колагеноза.
- Наблюдавани са някои параклинични промени:
 - чернодробни: преходно увеличение на нивата на трансaminaзите
 - хематологични: агранулоцитоза, хемолитична анемия.

4.9. Предозиране

- Незабавно пренасяне в специализирана болнична среда;
- Бързо отстраняване на погълнатия продукт чрез стомашна промивка;
- Активен въглен за намаление на резорбцията на ибупрофена;
- Симптоматично лечение

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

ПРОТИВОВЪЗПАЛИТЕЛНИ И ПРОТИВОРЕВМАТИЧНИ ЛЕКАРСТВЕНИ ПРОДУКТИ, НЕСТЕРОИДНИ

(M: мускулно-скелетна система)

Ибупрофен е нестероидно противовъзпалително средство, принадлежащо към пропионовата група, производно на арил-карбоксилната киселина. Той има следните свойства:

- аналгетични свойства;



- антипиретични свойства;
- противовъзпалителни свойства;
- краткотрайно подтискане на тромбоцитната функция.

Всички тези свойства са свързани с инхибирането на простагландиновата синтеза.

5.2. Фармакокинетични свойства

Фармакокинетиката на ибупрофена е линейна в терапевтични дози.

Резорбция

Максимална серумна концентрация се достига приблизително 90 минути след перорално приложение.

След еднократна доза максималните серумни концентрации при възрастни са пропорционални на дозата (Стах $17 \pm 3.5 \mu\text{g/ml}$ за една таблетка от 200 mg и $30.3 \pm 4.7 \mu\text{g/ml}$ за една таблетка от 400 mg).

Храната забавя резорбцията на ибупрофена.

Разпределение

Употребата на ибупрофен не води до кумулиране. Той се свързва с плазмените протеини в 99%.

При равновесни концентрации ибупрофен се намира в синовиалната течност между втория и осмия час след приложението, като синовиалната Стах е около една трета от плазмената Стах.

След приемане на 400 mg ибупрофен на всеки 6 часа от кърмачки количеството на ибупрофена, открито в тяхната кърма, е под 1 mg на 24 часа.

Метаболизъм

Ибупрофен не е индуктор на чернодробните ензими. Той се метаболизира в 90% до неактивни метаболити.

Екскреция

Елиминирането се извършва предимно през бъбреците. То е пълно след 24 часа, като 10% се елиминират в непроменена форма, а 90% под формата на неактивни, главно глюкуронизирани метаболити.

Времето на полуелиминиране е приблизително 2 часа.

Кинетичните параметри на ибупрофена са леко изменени при пациенти в напреднала възраст, болни с увредена бъбречна или чернодробна функция. Наблюдаваните изменения не налагат коригиране на дозата.

5.3. Предклинични данни за безопасност



Не е приложимо.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Помощни вещества

Docusate sodium	0.125 mg
Povidone	1.000 mg
Alpha-tocopherol	0.084 mg
Sodium hydrogen carbonate	540.000 mg
Anhydrous citric acid	900.000 mg
Saccharin sodium	10.000 mg
Anhydrous lactose	1373.541 mg
Anhydrous trimagnesium dicitrate	50.000 mg
Anhydrous colloidal silica	0.250 mg
Natural lemon powder flavouring*	25.000 mg

За една ефервесцентна таблетка с тегло 3.1 г.

*Състав на лимоновата есенция: essential oils of lemon (от Гвинея, Италия и Аржентина), Curcuma infusion, acacia gum, maltodextrin, ВНА antioxidant (E320).

Натрий: 150 г в една таблетка

6.2. Несъвместимости

Не е приложимо.

6.3. Срок на годност

Пет години

6.4. Специални предпазни мерки за съхранение

Да се съхраняват под 25°C на сухо място.

6.5. Данни за опаковката

Полипропиленова туба с полиетиленова запушалка, съдържаща изсушител (силикагел).

10 таблетки - 1 туба (полипропилен) x 10

6.6. Указания за употреба

Не е приложимо.

7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

Laboratoires UPSA — a Bristol-Myers Squibb Company



**8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА
BRISTOL-MYERS SQUIBB COMPANY, USA**

9. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

11. ДАТА НА АКТУАЛИЗАЦИЯ НА ТЕКСТА

юли 2001 г.

