

20060070
B6/M/M/B-47293

22-08-2019

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Афламил 100 mg филмирани таблетки

Aflamil 100 mg film-coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 100 mg ацеклофенак (*aceclofenac*).

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка.

Бели, кръгли, двойноизпъкнали филмирани таблетки с буква "А", изписана на едната страна. При счупване на таблетката вътрешността е бяла.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Симптоматично лечение на възпалението и болките при остеоартрит, ревматоиден артрит, анкилозиращ спондилит, както и при други болезнени заболявания на опорно-двигателния апарат (напр. хумероскапуларен периартрит и извънставен ревматизъм). Аналгетично действие при болезнени състояния (включително лумбална болка или зъбобол и първична дисменорея).

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозировка

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. точка 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба). Афламил 100 mg филмирани таблетки са предназначени за перорално приложение и трябва да се поглъщат с поне ½ чаша течност. Афламил 100 mg филмирани таблетки може да бъде приеман с храна.

Възрастни

Максималната препоръчвана доза е 200 mg дневно, приета като две отделни дози от 100 mg една филмирана таблетка сутрин и една вечер.

Педиатрична популация

Безопасността и ефикасността при деца и подрастващи не е установена.



Старческа възраст

В повечето случаи намаляване на дозата не е необходимо, но все пак трябва да се имат предвид предпазните мерки в точка 4.4.

Чернодробна недостатъчност

Дозата на ацеклофенак трябва да се редуцира при пациенти с леко до умерено нарушена чернодробна функция. Препоръчаната начална доза е 100 mg дневно.

Бъбречна недостатъчност

Не съществува доказателство, че дозата на ацеклофенак трябва да бъде променяна при пациенти с леко нарушена бъбречна функция, но предпазливостта е уместна.

4.3. Противопоказания

Ацеклофенак е противопоказан при следните случаи:

- свръхчувствителност към активното(ите) вещество(а) или някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- при пациенти, при които вещества с подобно действие, (напр. ацетилсалицилова киселина или други НСПВС), предизвикват пристъпи на астма, бронхоспазъм, остър ринит или уртикария или пациенти свръхчувствителни към тези лекарства;
- пациенти с анамнеза за гастро-интестинално кървене или перфорация, свързани с предишна терапия с НСПВС. Активна или анамнеза за рецидивираща пептична язва/крвоизлив (два или повече отделни епизода на доказана язва или кървене), или пациенти с гастро-интестинално кървене, или други активни кръвотечения или кървящи заболявания;
- пациенти с активни кръвотечения или кървящи заболявания (хемофилия или коагулационни нарушения
- пациенти с установена застойна сърдечна недостатъчност (клас II-IV по NYHA), исхемична болест на сърцето, периферно артериално заболяване и/или мозъчно-съдова болест;
- пациенти със сериозно нарушена чернодробна или бъбречна функция;
- бременност, особено през последните три месеца, освен ако няма основателни причини за използването му. В този случай, трябва да се използва най-ниската ефективна дозировка. (вж. точка 4.6).

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Едновременната употреба на Афламил с други НСПВС, включително селективни инхибитори на циклооксигеназа-2 трябва да се избягва.

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. точка 4.2 и по-долу посочените гастро-интестинални и сърдечно-съдови рискове).

Гастро-интестинални ефекти



Гастро-интестинално кървене, язва или перфорация, които могат да бъдат фатални са съобщавани при всички НСПВС по всяко време на лечението, със или без предупредителни симптоми или предишна анамнеза за сериозни гастро-интестинални събития.

Рискът от гастро-интестинално кървене, язва или перфорация е по-висок с увеличаване на дозите на НСПВС, при пациенти с анамнеза за язва, особено ако е усложнена с кръвоизлив или перфорация (вж. точка 4.3), както и при пациенти в старческа възраст. Тези пациенти трябва да започват лечението с възможно най-ниската доза, която е налична. Комбинираната терапия с протективни средства (напр. мизопростол или инхибитори на протонната помпа) трябва да се има предвид при тези пациенти, а също така и при пациенти, нуждаещи се от едновременно приложение на ниска доза ацетилсалицилова киселина или други лекарства, които могат да увеличат гастро-интестиналния риск (вж. по-долу и точка 4.5).

Пациентите с анамнеза за гастро-интестинална токсичност, по-специално тези в старческа възраст, трябва да съобщават за всички необичайни абдоминални симптоми (особено за гастро-интестинално кървене), особено в началните етапи на лечение. Препоръчва се повишено внимание при пациенти, получаващи съпътстващо лечение, което може да увеличи риска от язва или кървене, като системни кортикостероиди, антикоагуланти като варфарин, селективни инхибитори на обратното захващане на серотинина или тромбоцитни антиагреганти като ацетилсалицилова киселина (вж. точка 4.5).

При поява на гастро-интестинално кървене или язва при пациенти, приемащи ацеклофенак, лечението трябва да се преустанови.

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 конгестивна сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за отоци и задръжка на течности, свързани с лечението с НСПВС.

Пациенти със застойна сърдечна недостатъчност (NYHA-I), и пациенти със значителни рискови фактори за сърдечно-съдови събития (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене) трябва да бъдат лекувани с ацеклофенак само след внимателна преценка. Тъй като сърдечно-съдовият риск при ацеклофенак може да нарасне с дозата и продължителността на експозицията, трябва да се прилага най-ниската ефективна доза за възможно най-краткия период от време. Периодично трябва да се извършва преценка на необходимостта на пациента от облекчаване на симптомите и на отговора към терапията.

Ацеклофенак също трябва да се прилага с повишено внимание и под строго медицинско наблюдение при пациенти с анамнеза за мозъчно-съдов кръвоизлив.

Ацеклофенак трябва да се прилага с повишено внимание и под строго медицинско наблюдение при пациенти със следните състояния, тъй като може да се влошат (вж. точка 4.8):

- Симптоми показателни за стомашно-чревни нарушения, включващи горния или долния стомашно-чревен тракт
- Анамнеза за стомашно-чревна язва, кървене или перфорация
- Улцерозен колит
- Болест на Крон,



- Хематологични аномалии, СЛЕ, порфирия и хематопоеични нарушения

Чернодробни и бъбречни ефекти

Приложението на НСПВС може да причини дозозависимо намалено образуване на простагландини и да ускори бъбречна недостатъчност. Значението на простагландините при поддържане на бъбречния кръвоток трябва да се има предвид при пациенти с увредена сърдечна или бъбречна функция, чернодробна дисфункция, при тези, които се лекуват с диуретици или се възстановяват след сериозна операция, и при лица в старческа възраст.

Необходимо е повишено внимание при пациенти с леко до умерено увреждане на чернодробната и бъбречната функция, както и при пациенти с други състояния, предразполагащи към задръжка на течности. При тези пациенти, употребата на НСПВС може да доведе до влошаване на бъбречната функция и задръжка на течности. Необходимо е повишено внимание също при пациенти с диуретично лечение или с риск от хиповолемия. Трябва да се използва най-ниската ефективна доза и редовно да се мониторира бъбречната функция. Ефектите върху бъбречната функция обикновено са обратими при спиране на приема на ацеклофенак.

Приемът на ацеклофенак трябва да се прекрати, ако абнормните показатели на чернодробната функция персистират или се влошават, ако се развият клинични признаци и симптоми, отговарящи на чернодробното заболяване или има други прояви (еозинофилия, обрив). Може да се появи хепатит без продромални симптоми.

Употребата на НСПВС при пациенти с чернодробна порфирия може да отключи пристъп.

Свръхчувствителност и кожни реакции

Както и при другите НСПВС, алергични реакции, включително анафилактични/анафилактоидни реакции, може да се появят без предишна експозиция на активното вещество. Сериозни кожни реакции, някои от които фатални, включително екسفолитивен дерматит, синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза, за съобщавани много рядко във връзка с употребата на НСПВС (вж. точка 4.8). Изглежда, че пациентите са с най-висок риск от такива реакции в началото на курса на лечение, появата на реакция се проявява при по-голямата част от случаите през първия месец от лечението. Приемът на ацеклофенак трябва да се преустанови при първата проява на кожен обрив, мукозни лезии или други признаци на свръхчувствителност.

Като изключение, варицела може да предизвика сериозни усложнения от инфекция на кожата и меките тъкани.

Понастоящем, допринасящата роля на НСПВС при влошаване на тези инфекции не може да се изключи. Затова е препоръчително да се избягва употребата на Афламил 100 mg филмирани таблетки в случай на варицела.

Хематологични ефекти

Ацеклофенак може да инхибира обратимо агрегацията на тромбоцитите (вж. точка 4.5).

Респираторни нарушения



Необходимо е повишено внимание, ако се прилага при пациенти, страдащи от или с анамнеза за бронхиална астма, тъй като има съобщения, че НСПВС засилват бронхоспазма при такива пациенти.

Старческа възраст

Пациентите в старческа възраст са с повишена честота на нежелани реакции към НСПВС, особено гастро-интестинално кървене и перфорация, които могат да бъдат фатални (вж. точка 4.2). Пациенти в старческа възраст е по-вероятно да страдат от нарушена бъбречна, сърдечно-съдова или чернодробна функция.

Дългосрочно лечение

Като предпазна мярка при всички пациенти с дългосрочно лечение с НСПВС трябва да бъдат проследявани (напр. бъбречна, чернодробна функция и кръвна картина).

Помощно вещество

Това лекарство съдържа по-малко от 1 mmol натрий (23 mg) на филмирана таблетка, т.е. може да се каже, че практически не съдържа натрий.

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

Проучвания за лекарствени взаимодействия не са провеждани с изключение за варфарин.

Ацеклофенак се метаболизира чрез цитохром P450 2C9 като *in vitro* данни показват, че ацеклофенак може да бъде инхибитор на този ензим. По тази причина е възможен риск от фармакокинетични взаимодействия с фенитонин, циметидин, толбутамид, фенилбутазон, амиодарон, миконазол и сулфафеназол. Също като при другите продукти от групата на НСПВС, съществува риск от фармакокинетични взаимодействия с други активни съставки отделяни чрез активна ренална секреция, като метотрексат и литий. На практика ацеклофенак е напълно свързан с плазмения албумин и като следствие възможността от взаимодействия на изместването с други силно свързани с протеините активни съставки трябва да се има предвид.

Поради липса на проучвания върху фармакокинетичните взаимодействия с ацеклофенак, последващото изложение се базира на познанията от другите НСПВС.

Следните комбинации трябва да се избягват:

НСПВС инхибират тубуларната секреция на метотрексат като е възможно да настъпят слаби метаболитни взаимодействия водещи до намален клирънс на метотрексат. По тази причина по време на лечение с високи дози метотрексат предписването на НСПВС трябва винаги да се избягва.

Литий и дигоксин: Някои НСПВС инхибират бъбречния клирънс на литий и дигоксин, което води до повишени серумни концентрации и на двете. Комбинацията трябва да се избягва, освен ако има възможност за често проследяване на нивата на литий и дигоксин.

Антикоагуланти: НСПВС инхибират тромбоцитната агрегация и увреждат мукозната мембрана в гастро-интестиналния тракт, което може да засили активността на антикоагулантите и да повиши риска от гастроинтестинално кървене при пациенти



използващи антикоагуланти. Комбинацията от ацеклофенак с перорални антикоагуланти от кумариновата група, тиклопидин и тромболитици и хепарин трябва да се избягва, освен ако не се извършва внимателно проследяване.

Тромбоцитни антиагреганти и селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (SSRI): повишен риск от гастроинтестинално-кървене (вж. точка 4.4).

Следните комбинации могат да изискват корекции на дозата и специални предпазни мерки:

Метотрексат: Трябва да се помисли и за възможно взаимодействие между НСПВС и метотрексат, също и при употребата на ниски дози метотрексат, особено при пациенти с намалена бъбречна функция. Когато се налага комбинирана терапия, бъбречната функция трябва да се проследява. Ако двете, НСПВС и метотрексат, се прилагат в 24-часов период е необходимо повишено внимание, тъй като нивата на метотрексат могат да се повишат, а като резултат и неговата токсичност.

Циклоспорин, такролимус: Счита се, че едновременното приложение на НСПВС и циклоспорин или такролимус повишава риска от нефротоксичност поради понижена синтеза на простаглицлин в бъбрека. Поради тази причина по време на комбинирано лечение, от значение е внимателно да се проследява бъбречната функция.

Други НСПВС: Съпътстващата терапия с ацетилсалицилова киселина и други НСПВС може да повиши честотата на нежелани ефекти и поради тази причина предпазливостта е наложителна.

Диуретици: Ацеклофенак, както другите НСПВС, може да редуцира диуретичния ефект на фуросемид, буметанид, както и антихипертензивния ефект на тиазидите. Едновременното приложение с калий запазващи диуретици може да бъде свързана с повишени нива на калий: следователно серумния калий трябва да бъде проследяван.

Антихипертензивни средства: НСПВС могат също така да редуцират ефекта на някои антихипертензивни лекарствени продукти. Комбинацията на ACE – инхибитори или ангиотензин II рецепторни антагонисти с НСПВС може да доведе до влошаване на бъбречната функция. Рискът от остра бъбречна недостатъчност, която обикновено е обратима, може да се повиши при някои пациенти с нарушена бъбречна функция (напр. дехидратирани пациенти или пациенти в старческа възраст). Поради тази причина комбинацията с НСПВС трябва да се назначава предпазливо, особено при лица в старческа възраст. Пациентите трябва да са адекватно хидратирани, както и да се обмисли евентуално проследяване на бъбречната функция след започване на съвместната терапия и периодично след това.

Не е установено влияние на ацеклофенак върху контрола на кръвното налягане при едновременното му приложение с бендрофлуазид, въпреки че взаимодействия с други диуретици не може да бъде изключено.

Кортикостероиди: повишен риск от гастроинтестинална язва или кървене (вж. точка 4.4).

Антикоагуланти: Както другите НСПВС, ацеклофенак може да усилва действието на антикоагулантите. Трябва да се извършва внимателно проследяване на пациентите, които са на комбинирана терапия с антикоагулант и ацеклофенак.



Антидиабетни средства: клинични проучвания показват, че диклофенак може да се прилага съвместно с перорални антидиабетни средства, без да повлияе клиничния им ефект. Въпреки това, има отделни случаи на хипогликемични и хипергликемични ефекти. Затова при прием на ацеклофенак, трябва да се обмисли корекция на дозата на средствата, които могат да доведат до хипогликемия.

Зидовудин: когато се дават НСПВС заедно с зидовудин има повишен риск от хематологична токсичност. Има показания за повишен риск от хемартроза и хематом при HIV(+) хемофилици, получаващи едновременно лечение със зидовудин и ибупрофен.

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Няма информация за употребата на ацеклофенак по време на бременност.

Инхибицията на простагландиновата синтеза може да въздейства злополучно върху бременността и/или на ембрионалното/феталното развитие.

Данни от епидемиологични проучвания показват повишен риск от аборти, сърдечни малформации и гастросхиза след употреба на инхибитори на простагландиновата синтеза през ранната бременност. Абсолютният риск от малформации е повишен от по-малко от 1% до приблизително 1,5%. Предполага, се, че рискът нараства с дозата и продължителността на лечението. При животни, приложението на инхибитори на простагландиновата синтеза е демонстрирало повишена пре- и постимплантационна загуба и ембрио-фетална леталност. В допълнение, повишена заболеваемост от различни малформации, включително сърдечно-съдови, са съобщени при животни, на които са давани инхибитори на простагландиновата синтеза по време на периода на органогенеза. По време на първия и втория триместър от бременността ацеклофенак не трябва да се прилага, освен ако не е налице ясна необходимост. Ако ацеклофенак се употребява от жена опитваща да забременее, или по време на първия и втория триместър от бременността, дозата трябва да бъде възможно най-ниска и продължителността на лечение трябва да е възможно най-кратка.

По време на третия триместър на бременността всички инхибитори на простагландиновата синтеза могат да изложат фетуса на:

- кардиопулмонална токсичност (с преждевременно затваряне на дуктус артериозус и пулмонална хипертензия);
- бъбречна дисфункция, която може да прогресира до бъбречна недостатъчност с олиго-хидроамниоза;

майката и новороденото в края на бременността на:

- евентуално удължаване на времето на кървене, анти-агрегантен ефект може да се постигне дори при много ниски дози;
- инхибиране на маточните контракции водещо до удължаване на раждането.

Следователно, ацеклофенак е противопоказан през третия триместър на бременността (вж. точки 4.3 и 4.4).

Кърмене



Няма информация относно секрецията на ацеклофенак в кърмата. Има обаче незначителен трансфер на радиокативен (C^{14}) ацеклофенак в млякото на кърмещи пълхове. Употребата на ацеклофенак трябва следователно да се избягва по време на бременност и кърмене, освен ако потенциалните ползи за майката не превишават възможните рискове за плода.

Фертилитет

Употребата на Афламил, както и всяко лекарство инхибиращо циклооксигеназите/простагландиновата синтеза, може да влоши фертилитета и не се препоръчва при жени, които се опитват да забременеят. При жени изпитващи трудности в зачеването или такива които предприемат изследвания за установяване на безплодието трябва да се обмисли прекратяване приема на Афламил.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Пациенти, които изпитват замаяност, световъртеж или други нарушения свързани с централната нервна система докато приемат НСПВС трябва се въздържат от шофиране или използване на опасни машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Стомашно-чревни нарушения: най-често наблюдаваните нежелани реакции са стомашно-чревни по характер. Могат да се появят пептична язва, перфорация или стомашно-чревно кървене, понякога с фатален изход, особено при пациенти в старческа възраст (вж. точка 4.4). Съобщават се гадене, повръщане, диария, флатуленция, запек, диспепсия, коремна болка, мелена, хематемеза, улцерозен стоматит, обостряне на колит и болест на Крон (вж. точка 4.4) при приложение на НСПВС. По-рядко се наблюдава гастрит.

Има съобщения за оток, хипертония и сърдечна недостатъчност във връзка с лечение с НСПВС.

Ацеклофенак е структурно свързан и се метаболизира до диклофенак, по отношение на което множество клинични и епидемиологични данни еднозначно показват повишен риск от възникване на общи артериални тромботични инциденти (миокарден инфаркт или инсулт, особено при високи дози и при продължително лечение).

От епидемиологичните данни се установява също повишен риск от развитие на остър коронарен синдром и миокарден инфаркт във връзка с употребата на ацеклофенак (вж. точки 4.3 "Противопоказания" и 4.4 "Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба").

Следва таблица с нежелани лекарствени реакции съобщени в клинични проучвания и при употреба след разрешаване на ацеклофенак, групирани по категории системо-органични класове и изчислени честоти. Много редки ($\geq 1/10$); чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$), много редки ($< 1/10\ 000$).

<i>MedDRA SOC</i>	<i>Чести</i> ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)	<i>Нечести</i> ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$)	<i>Редки</i> ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$)	<i>Много редки</i> ($< 1/10\ 000$)
-------------------	--	--	--	---



Нарушения на кръвта и лимфната система			Анемия	Потискане на костния мозък Гранулоцитопения Томбоцитопения Неутропения Хемолитична анемия
Нарушения на имунната система			Анафилактична реакция (включително шок) Свръхчувствителност	
Нарушения на метаболизма и храненето				Хиперкалиемия
Психични нарушения				Депресия Необичайни сънища Безсъние
Нарушения на нервната система	Замаяност			Парестезии Тремор Сомнолентност Главоболие Дисгеузия (промени във вкуса)
Нарушения на очите			Смущения в зрението	
Нарушения на ухото и лабиринта				Световъртеж Тинитус
Сърдечни нарушения			Сърдечна недостатъчност	Палпитации
Съдови нарушения			Хипертония Влошаване на хипертония	Зачервяване на лицето Горещина Васкулит
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения			Диспнея	Бронхоспазъм
Стомашно-чревни нарушения	Диспепсия Абдоминална болка Гадене Диария	Флатуленция Гастрит Констипация Повръщане Улцерации в устата	Мелена Гастроинтестинална язва Хеморагична диария Гастроинтестинални хеморагии	Стоматит Хематемеза Чревна перфорация Влошаване на болест на Крон и улцерозен колит Панкреатит
Хепатобилиарни нарушения	Повишени чернодробни ензими			Увреждане на черния дроб (включително) Повишаване на чернодробната фосфатаза в



				кръвта
<i>Нарушения на кожата и подкожната тъкан</i>		Пруритус Обрив Дерматит Уртикария	Ангиоедем	Пурпура Екзема Тежки мукокутани кожни реакции (включително синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза)
<i>Нарушения на бъбреците и пикочните пътища</i>		Повишена урея в кръвта Повишен креатинин в кръвта		Нефротичен синдром Бъбречна недостатъчност
<i>Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение</i>				Оток Умора Мускулни спазми (в краката)
<i>Изследвания</i>				Повишено телло

Друга категория нежелани реакции съобщени във връзка с НСПВС са:

Много редки (<1/10 000):

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища: интерстициален нефрит.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан: булзни реакции, включително синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза (много редки).

Като изключение, има съобщения за поява на сериозни усложнения от инфекция на кожата и меките тъкани по време на варицела във връзка с лечение с НСПВС.

Вижте също точки 4.4 и 4.5.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване към Изпълнителната агенция по лекарствата, ул. „Дамян Груев“ № 8, 1303 София, тел.: +35928903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9. Предозиране

Липсват данни за хора относно последствията от предозиране с ацеклофенак.

Симптомите могат да са: гадене, стомашна болка, замаяност, сомнолентност и др.



Лечението на остро отравяне с нестероидни противовъзпалителни средства се състои основно от антиацидни средства, при необходимост и друго поддържащо и симптоматично лечение на усложнения като хипотония, бъбречна недостатъчност, конвулсии, стомашно-чревна дразнене и потискане на дишането.

Действията при остро отравяне с перорален ацеклофенак се състоят от предотвратяване на абсорбцията, възможно най-скоро след предозиране с помощта на стомашна промивка и лечение с активен въглен в повтарящи се дози. Форсирана диуреза, диализа или хемоперфузия не могат да елиминират НСПВС, поради високата им скорост на свързване с протеините и екстензивния метаболизъм.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Противовъзпалителни и антиревматични продукти, нестероиди, АТС код: M01AB16

Ацеклофенак е не-стероидно вещество с противовъзпалителен и аналгетичен ефект. Счита се, че неговият механизъм на действие се дължи на инхибиране на простагландиновата синтеза.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След перорален прием, ацеклофенак се резорбира бързо и неговата бионаличност е почти 100%. Пиковите плазмени концентрации се достигат приблизително 1.25 до 3 часа след приема. Тмах е забавено при едновременен прием с храна, докато степента на абсорбция не се повлиява.

Разпределение

Ацеклофенак е свързан във висока степен с протеините (>99,7%). Ацеклофенак прониква в синовиалната течност, където концентрациите достигат приблизително 60% от тези в плазмата. Обемът на разпределение е приблизително 30 l.

Елиминиране

Средният елиминационен полуживот е 4-4,3 часа. Клирънсът е приблизително 5 литра на час. Приблизително две трети от приложената доза се екскретират с урината, основно като конюгирани хидроксиметаболити. Само 1% от перорална единична доза се екскретира непроменен.

Ацеклофенак вероятно се метаболизира чрез CYP2C9 до основния си метаболит 4-ОН-ацеклофенак, чийто принос към клиничната активност вероятно е незначителен. Диклофенак и 4-ОН-диклофенак са открити измежду многото метаболити.

Характеристики при пациентите

Няма промени във фармакокинетичните свойства на ацеклофенак при пациенти в старческа възраст.



По-бавна скорост на елиминиране на ацеклофенак е открита при пациенти с намалена чернодробна функция след единична доза ацеклофенак. При многодозово проучване с 100 mg, еднократно дневно, няма разлика във фармакокинетичните параметри между пациенти с лека до умерена чернодробна цироза и нормални лица.

При пациенти с леко до умерено нарушена бъбречна функция не са наблюдавани клинично значими разлики във фармакокинетиката след единична доза.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Подобно на другите НСПВС, ацеклофенак се понася зле от експериментални животни. В допълнение, фармакокинетичните разлики между животни и човек правят трудна оценката на потенциалната токсичност на ацеклофенак. Основният таргетен орган е стомашно-чревния тракт. Все пак проучвания върху токсичността служещи си с максимално толерирани дози при плъх, вид който метаболизира ацеклофенак в диклофенак и при маймуна (експозиция към непроменен ацеклофенак) не показват токсичност, различна от обикновено наблюдаваната при НСПВС.

Проучванията при животни показват, че няма доказателства за тератогенност при плъхове; въпреки че системната експозиция е ниска при зайци, лечението с ацеклофенак (10 mg/kg/ден) води до поредица от морфологични изменения в някои фетуси.

Проучвания върху карциногенността при мишка (неизвестна системна експозиция на ацеклофенак) не показват никакъв карциногенен ефект и ацеклофенак е негативен в тестове за генотоксичност.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Ядрото на таблетката съдържа:

Микрокристална целулоза
Натриева кроскармелоза
Повидон
Глицерил палмитостеарат

Филмовото покритие съдържа:

Хипромелоза
Микрокристална целулоза
Макрогол 40 стеарат
Титанов диоксид

6.2. Несъвместимости

Неприложимо.

6.3. Срок на годност

3 години



6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25 °С. Да се съхранява в оригинална опаковка.

6.5. Данни за опаковката

Блистер от PA/Al/PVC-Al.

Един блистер съдържа 10 филмирани таблетки, 20 или 60 филмирани таблетки са опаковани в сгъваема картонена кутия.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

Всеки неупотребен продукт или негоден материал трябва да се унищожава в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Gedeon Richter Plc.
H-1103 Budapest
Gyömrői út 19-21.
Унгария

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20060070

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

22.02.2006

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

