

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Разр. №	9900097
Разрешение №	62830 / 26-06-2023
BG/MA/MP -	/
Одобрение №	/

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

БИ-ПРОФЕНИД 150 mg таблетки с изменено освобождаване
BI-PROFENID 150 mg modified release tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 двупластова таблетка съдържа 150 mg кетопрофен (ketoprofen)

Бял пласт – съдържа 75 mg кетопрофен (ketoprofen)

Жълт пласт – съдържа 75 mg кетопрофен (ketoprofen)

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Двупластови делими таблетки с изменено освобождаване

Таблетка е с форма на капсула, изпъкнала от двете страни, гравирани с "RPR 225" от едната страна и с делителна черта от другата страна.

Цвят:

Единият слой е бял, а другият е светло жълт.

Таблетката може да бъде разделена на равни дози.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лекарственият продукт се прилага при лица над 15 годишна възраст, като:

- продължително симптоматично лечение при: хроничен възпалителен ревматизъм, особено ревматоиден артрит, анкилозиращ спондилит (или свързаните с него синдроми като синдром на Файсингер-Лерой-Райтер и псориаатичен артрит);
- някои форми на болезнен инвалидизиращ остеоартрит.

Краткотрайно симптоматично лечение на остри епизоди на:

- извънставен ревматизъм, като скапулохумерални (раменни) периартрити, тендинит и бурсит;
- микрокристален артрит;
 - остеоартрит;
 - болки в долната част на гърба;
 - радикулит болки;
- остри постравматични доброкачествени заболявания на двигателния апарат.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

В областта на ревматологията

- продължително симптоматично лечение: 150 mg дневно, т.е. една таблетка под формата на еднократна доза или два приема на половин таблетка.



- краткотрайно симптоматично лечение на остри епизоди: 300 mg дневно, т.е. две таблетки от 150 mg на два приема.

В НИКАКЪВ СЛУЧАЙ ДА НЕ СЕ ПРЕВИШАВА дозата от две таблетки по 150 mg за 24 часа (300 mg дневно).

Най-ниската ефективна доза трябва да се използва за възможно най-краткото време, необходимо за облекчаване на симптомите (вж. точка 4.4).

Честота на приложение:

Таблетките трябва да се приемат по време на хранене или с лека закуска. Дневната доза трябва да се взема на 1 или 2 приема.

Рискови популации:

Пациенти с нарушена бъбречна функция и пациенти в старческа 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.

Пациенти с намален обем на циркулиращата кръв: вж. точка "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 (вж. точка 4.4).

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 (вж. точка 4.4).

Начин на приложение

За перорално приложение.

Таблетките трябва да се поглъщат цели (без да се сдъвкват) с голяма чаша вода.

4.3 Противопоказания

Кетопрофен е противопоказан при пациенти с изявени в миналото реакции на свръхчувствителност като спазъм на бронхите, астматични пристъпи, ринит, уртикария или други алергични реакции към кетопрофен, ацетилсалицилова киселина или други нестероидни противовъзпалителни лекарствени средства (НСПВС).

Тежки, рядко с фатален изход, анафилактични реакции са били докладвани при такива пациенти (вж. точка 4.8).

Кетопрофен е противопоказан при пациенти със свръхчувствителност към някое от помощните вещества на лекарствения продукт.

Кетопрофен е също противопоказан в третото тримесечие на бременността.

Кетопрофен е противопоказан и при следните случаи:

- Тежка сърдечна недостатъчност;
- Активна стомашна язва или всяка анамнеза за стомашно-чревна кървене, язва или перфорация;



- Хеморагична диатеза;
- Тежка чернодробна недостатъчност;
- Тежка бъбречна недостатъчност;
- Кървене от стомашно-чревния тракт, мозъчно-съдов кръвоизлив или каквото и да е друго активно кървене.

Свръхчувствителност или непоносимост към глутен, поради наличието на пшенично нишесте (глутен).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Пациенти с редки наследствени заболявания като галактозна непоносимост, Lapp лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

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. точка 4.2 и по-долу посочените стомашно-чревни 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 инхибитори на обратното поемане на серотонин или антитромбоцитни продукти като ацетилсалициловата киселина (вж. точка 4.5).

Използването на кетопрофен в комбинация с нестероидни противовъзпалителни средства, включително и циклооксигеназа-2 селективни инхибитори трябва да се избягва.

- **Стомашно-чревни нарушения**

Препоръчва се повишено внимание при пациенти, приемащи едновременно лекарства, които могат да повишат риска от язва или кървене, като перорални кортикостероиди, антикоагуланти като варфарин, селективни инхибитори на обратното захващане на серотонин (SSRIs), антитромбоцитни средства като аспирин или никорандил.

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

Някои епидемиологични доказателства показват, че кетопрофен може да е асоцииран с висок риск от сериозна стомашно-чревна токсичност, сравнима с тази при някои други НСПВС, особено във високи дози (вижте също точка 4.3).

Рискът от стомашно-чревно кървене, язва или перфорация е по-висок с увеличаване на дозите на НСПВС, при пациенти с анамнеза за язва, особено при усложнения с хеморагия или перфорация (вж. точка 4.3) и при пациенти в старческа възраст. Тези пациенти трябва да започнат лечение с най-ниските възможни дози.

Комбинирана терапия с протективни продукти (например мизопростол или инхибитори на протонната помпа), трябва да се обмисли за тези пациенти, а също и за пациенти нуждаещи се едновременно да приемат и ниски дози ацетилсалицилова киселина, или други лекарствени продукти, увеличаващи стомашно-чревния риск (вж. по-надолу и точка 4.5).



Пациенти с анамнеза за стомашно-чревна токсичност, особено в старческа възраст, трябва да докладват всички необичайни абдоминални симптоми (особено стомашно-чревно кървене), особено в началото на лечението.

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

Когато се появи стомашно-чревно кървене или язва при пациенти приемащи кетопрофен, лечението трябва да се прекрати.

- **Сърдечно-съдови реакции**

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

Както при всички НСПВС, трябва внимателно да се обмисли приложението на кетопрофен при лечение на пациенти със съществуваща неконтролирана хипертония, конгестивна сърдечна недостатъчност, установена исхемична болест на сърцето, периферна артериална болест и / или мозъчно-съдова болест, както и преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови заболявания (например хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене).

Повишен риск за артериални тромботични събития са съобщавани при пациенти, лекувани с неаспиринови НСПВС за периперативна болка при поставянето на аорто-коронарен байпас (CABG).

- **Кожни реакции**

Тежки кожни реакции, някои от тях с фатален изход, включително ексфолиативен дерматит, синдром на Steven-Johnson, и токсична епидермална некролиза са били докладвани много рядко в комбинация с НСПВС (вж. точка 4.8). 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. Кетопрофен трябва да бъде спрял при първата поява на обрив по кожата, мукозни лезии или някакъв друг знак за свръхчувствителност.

Предпазни мерки при употреба

НСПВС трябва да се дават особено внимателно на пациенти с анамнеза за стомашно-чревно заболяване (улцерозен колит, болест на Крон), тъй като тези състояния могат да се влошат (вж. точка 4.8).

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

Необходимо е повишено внимание при 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 НСПВС.



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 внимателна преценка. Такава преценка трябва да се направи и преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови заболявания (например хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене).

Повишен риск от предсърдно мъждене е докладвано във връзка с употребата на НСПВС.

Хиперкалиемия може да възникне, особено при пациенти с диабет, с бъбречна недостатъчност, и /или съпътстващо лечение с п лекарствени вещества водещи до хиперкалиемия (вж.точка 4.5). Нивата на калий, трябва да бъдат изследвани при тези обстоятелства.

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

Маскиране на симптомите на подлежащите инфекции

БИ-ПРОФЕНИД 150 mg таблетки с изменено освобождаване може да маскира симптомите на инфекция, което може да доведе до забавяне на започване на подходящо лечение и по този начин да влоши изхода от инфекцията. Това се наблюдава при бактериална пневмония, придобита в обществото, както и при бактериалните усложнения на варицела. Когато БИ-ПРОФЕНИД 150 mg таблетки с изменено освобождаване се прилага за лечение на повишена температура или за облекчаване на болката във връзка с инфекция, се препоръчва наблюдение на инфекцията. При извънболнични условия пациентът трябва да се консултира с лекар, ако симптомите персистират или се влошават.

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

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

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 ацетилсалицилова киселина и/или други НСПВС. Прилагането на този лекарствен продукт може да доведе до астматичен пристъп или спазъм на бронхите, особено при хора, алергични към ацетилсалицилова киселина или към НСПВС.

Ако се появят зрителни нарушения като замъглено виждане, лечението трябва да се преустанови.

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

Пшенично нишесте (съдържащо глутен)

Това лекарство съдържа само много ниски нива на глутен (от пшенично нишесте). Пациентите с чувствителност към глутен трябва да се следят внимателно, тъй като това лекарство може да съдържа глутен. Пациентите с чувствителност към глутен трябва да се следят внимателно, тъй като това лекарство може да съдържа глутен.

Една таблетка с изменено освобождаване съдържа не повече от 3,80 микрограма глутен.



Пациентите с алергия към пшеница (различно от цьолиакия) не трябва да приемат това лекарство.

Това лекарство съдържа по-малко от 1 mmol натрий (23 mg) на таблетка, с изменено освобождаване, тоест може да се каже, че практически не съдържа натрий.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Не се препоръчва комбинирането с:

Други НСПВС (включително циклооксигеназа-2 селективни инхибитори) и високи дози салицилати: увеличен риск от стомашно-чревна язва и кървене.

Антикоагуланти:

Повишен риск от кървене (вж. точка 4.4):

- Хепарин
- Антагонисти на витамин К
- Антагонисти на тромбоцитната агрегация (такива като тиклопидин, клопидогрел)
- Тромбинови инхибитори (такива като дабигатран)
- Директни инхибитори на фактор Ха (такива като апиксабан, ривароксабан, едоксабан).

Ако едновременното им приложение не може да се избегне, пациентът трябва стриктно да се наблюдава.

Литий:

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

Метотрексат в доза над 15 mg/седмично:

Увеличен риск от хематологична токсичност на метотрексат, особено ако се прилага във високи дози (>15 mg/седмично), вероятно дължащ се на изместване от свързания с плазмените протеини метотрексат и намален бъбречен клирънс.

Комбинации, изискващи предпазни мерки при употреба

Лекарствените продукти и терапевтични групи, които могат да доведат до хиперкалиемия (т.е. калиеви соли, калий-съхраняващи диуретици, ACE инхибитори и ангиотензин II антагонисти, нестероидни противовъзпалителни средства (НСПВС), хепарин (с ниско молекулно тегло или нефракциониран, циклоспорин, такролимус и триметоприм): Рискът от хиперкалиемия може да се повиши, когато лекарствата, споменати по-горе се прилагат едновременно (вж. точка 4.4).

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 за развитие на бъбречна недостатъчност и вторично намаляване на гломерулната филтрация поради намаляване синтеза на бъбречните простагландини. Такива пациенти трябва да се хидратират и да се изследва бъбречната им функция преди започване на комбинираното лечение (вж. точка 4.4).



АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите:

При пациенти с нарушена бъбречна функция (напр. дехидратирани пациенти или при пациенти в старческа възраст, едновременната употреба на АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите и агенти, които потискат циклооксигеназата може да предизвика нарушение на бъбречната функция, включително остра бъбречна недостатъчност.

Метотрексат в дози по-ниски от 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 старческа възраст, наблюдението се извършва по-често.

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

Тенофовир: Едновременното приложение на тенофовир дизопроксил фумарат и НСПВС може да увеличи риска от бъбречни нарушения.

Никорандил: При пациенти, получаващи едновременно никорандил и НСПВС, е налице повишен риск от тежки усложнения като язва, перфорация или кръвоизлив на храносмилателния тракт.

Сърдечни гликозиди: Фармакокинетичното взаимодействие между кетопрофен и дигоксин не е доказана. Въпреки това, препоръчва се повишено внимание, особено при пациенти с бъбречно увреждане, тъй като НСПВС могат да намалят бъбречната функция и намаляват бъбречния клирънс на сърдечни гликозиди.

Циклоспорин: Повишен риск от нефротоксичност.

Такролимус: Повишен риск от нефротоксичност.

Да се вземе под внимание комбинирането с:

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

Тромболитици: Увеличен риск от кървене.

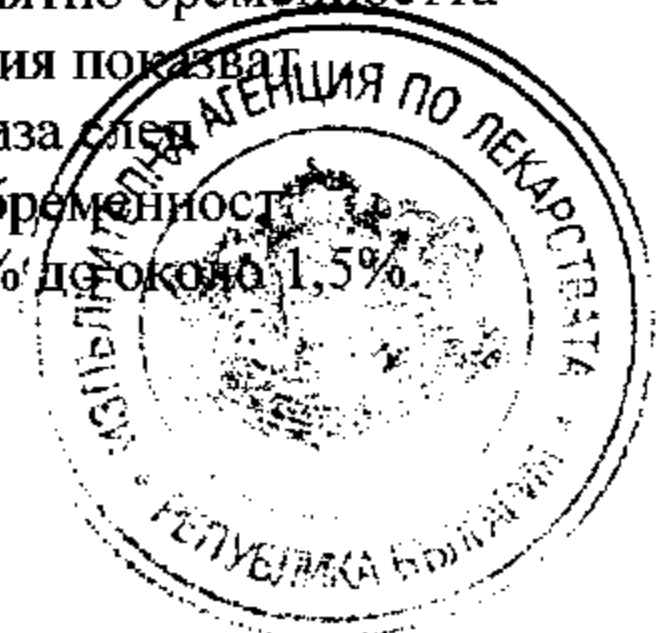
Пробенецид: Едновременното приложение на пробенецид може значително да намали плазмения клирънс на кетопрофен.

Селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (SSRIs): Увеличен риск от стомашно-чревно кървене (вж. точка 4.4).

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност:

Инхибирането на синтеза на простагландините може да повлияе неблагоприятно бременността и/или развитието на ембриона/плода. Данни от епидемиологични изследвания показват повишен риск от спонтанен аборт, от сърдечни малформации и от гастросхиза след използването на инхибитори на синтеза на простагландините през ранната бременност. Абсолютният риск от кардиоваскуларни малформации е увеличен от под 1% до около 1,5%.



Счита се, че риска се увеличава с увеличаване на дозата и продължителността на терапията. При животни, прилагането на инхибитори на синтеза на простагландините е показало увеличаване на загубата преди и след имплантиране и на смъртността на ембриона/плода. В допълнение, увеличена честота на различни малформации, включително кардиоваскуларни, са били докладвани при животни, на които са били давани инхибитори на синтеза на простагландините по време на органогенезисния период. След 20-та гестационна седмица употребата на кетопрофен може да причини олигохидрамнион в резултат на бъбречна дисфункция на плода. Това може да се случи скоро след започване на лечението и обикновено е обратимо след преустановяване. В допълнение, има съобщения за стесняване на ductus arteriosus след лечение през втория триместър, повечето от които отзвучават след прекратяване на лечението. Следователно, по време на първото и второто тримесечие на бременността, кетопрофен не трябва да се използва, освен ако не е крайно наложително. Ако кетопрофен се използва от жена, желаеща да забременее, или по време на първото и второто тримесечие на бременността, то дозата трябва да е възможно най-ниска и продължителността на лечението възможно най-кратка. Наблюдението преди раждане за олигохидрамнион и стесняване на ductus arteriosus трябва да се обмисли след излагане на кетопрофен в продължение на няколко дни от 20-та гестационна седмица нататък. Кетопрофен трябва да се преустанови, ако се установи олигохидрамнион или стесняване на ductus arteriosus.

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

- кардиопулмонарна токсичност (с преждевременно стесняване/затваряне на ductus arteriosus и белодробна хипертензия);
- бъбречна дисфункция (вижте по-горе);

В края на бременността майката и детето могат да бъдат изложени на:

- евентуално удължаване на времето на кървене, антиагрегантен ефект който може да се появи дори и при много ниски дози;
- отложено или удължено раждане в резултат на потискане на контракциите на матката.

Следователно, кетопрофен е противопоказан през третото тримесечие на бременността (вж. точки 4.3 и 5.3).

Кърмене:

Няма налични данни за преминаването на кетопрофен в майчиното мляко. Кетопрофен не се препоръчва при кърмачки.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите да бъдат предупреждавани за възможна поява на световъртеж, сънливост, замаяност, конвулсии или зрителни смущения и да бъдат съветвани да не шофират или да не работят с машини, ако един от тези симптоми се прояви.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Класификация на очакваните честоти:

Много чести ($\geq 1/10$); чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редки ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); много редки ($< 1/10000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).



Следващите нежелани реакции са били докладвани с кетопрофен при възрастни:

Нарушения на кръвта и лимфната система:

- редки: анемия дължаща се на кръвоизливи;
- с неизвестна честота: тромбоцитопения, агранулоцитоза, костно-мозъчна аплазия, левкопения, хемолитична анемия.

Нарушения на имунната система:

- с неизвестна честота: анафилактични реакции (включително шок).

Психични нарушения:

- с неизвестна честота: депресия, халюцинации, объркване, промени в настроението.

Нарушения на нервната система:

- нечести: главоболие, замаяност, сънливост;
- редки: парестезия;
- с неизвестна честота: асептичен менингит, конвулсии, дисгеузия, световъртеж.

Нарушения на очите:

- редки: нарушена зрителна острота (вж. точка 4.4).

Нарушения на ухото и лабиринта:

- редки: шум в ушите.

Сърдечни нарушения:

- с неизвестна честота: обостряне на сърдечната недостатъчност, предсърдно мъждене.

Съдови нарушения:

- с неизвестна честота: хипертония, вазодилатация, васкулити (включително левкоцитокластни васкулити).

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения:

- редки: астма;
- с неизвестна честота: спазъм на бронхите (особено при пациенти, алергични към ацетилсалициловата киселина и към други НСПВС).

Стомашно-чревни нарушения:

- чести: диспепсия, коремна болка, гадене, повръщане;
- нечести: диария, запек, флатуленция, гастрит;
- редки: стоматит, язва на стомаха;
- с неизвестна честота: обострен колит и болест на Крон, стомашно-чревна хеморагия и перфорация, стомашна болка, затруднено храносмилане, панкреатит.

Хепато-билиарни нарушения:

- редки: хепатит, увеличаване на нивото на трансaminaзите.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан:

- нечести: обрив, силен сърбеж;
- с неизвестна честота: фоточувствителност, алопеция, уртикария, ангиоедем, булозни дерматози като синдром на Стивънс – Джонсън, токсична епидермална некролиза, остра генерализирана екзантематозна пустулоза.



Нарушения на бъбреците и пикочните пътища:

- с неизвестна честота: остра бъбречна недостатъчност особено при данни за предходящо бъбречно увреждане и/или хиповолемия, интерстициален нефрит, нефрозен синдром, необичайни тестове на бъбречната функция.

Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение:

- нечести: оток;
- с неизвестна честота: умора.

Нарушения на метаболизма и храненето:

- с неизвестна честота: хипонатриемия, хиперкалиемия.

Изследвания:

- редки: увеличаване на телесното тегло.

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: Изпълнителна агенция по лекарствата ул. „Дамян Груев” № 8, 1303 София, Тел.: +35 928903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

Случаи на предозиране са докладвани с дози над 2,5 g кетопрофен. В повечето случаи, наблюдаваните симптоми са били в лека форма и са се ограничили до летаргия, сънливост, гадене, повръщане и коремни болки.

Няма специфични антидоти при предозиране на кетопрофен. В случай на подозирана тежка интоксикация се препоръчва да се извърши стомашна промивка, симптоматично и поддържащо лечение, за да се компенсира дехидратацията, да се наблюдава отделянето на урината и да се предприемат корективни мерки в случай на ацидоза.

В случай на бъбречна недостатъчност, хемодиализа би могла да бъде от полза, за да бъде премахнат циркулиращия лекарствен продукт.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Нестероидно противовъзпалително (М : мускулно- скелетна система).

АТС код M01 AE 03

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

Той притежава следните свойства:

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

Начинът му на действие не е напълно обяснен.

Той инхибира простагландиновата синтетаза и тромбоцитната агрегация.



5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция:

Кетопрофен бързо и напълно се абсорбира от стомашно-чревния тракт. Максималните плазмени нива се достигат в рамките на 60 до 90 минути след перорално приложение. Пиковите плазмени концентрации са $7,72 \pm 1,6 \text{ mg/l}$. Когато кетопрофен се приема с храна, скоростта на абсорбция се забавя, което води до отложени и снижени пикови плазмени нива (C_{max}). Общата му бионаличност обаче, не се променя.

Разпределение:

Кетопрофен е свързан в 99% с плазмените протеини. Той дифундира в синовиалната течност и е налице в нива по-високи от серумните концентрации след 4-тия час след перорален прием. Той преминава плацентарната бариера и кръвно-мозъчната бариера. Плазменият елиминационен полуживот е приблизително 2 часа. Обемът на разпределение е приблизително 7 литра.

Биотрансформация:

Кетопрофен се биотрансформира чрез два процеса: хидроксилиране и конюгация с глюкуроновата киселина, като последния процес е основен при хората. По-малко от 1% от приложената доза кетопрофен се открива в непроменено състояние в урината, докато конюгатът на глюкуроновата киселина представлява приблизително 65% до 85%.

Елиминиране:

Екскрецията, главно бъбречна, е бърза тъй като 50% от приложената доза се елиминира в рамките на 6 часа след приемане, независимо от пътя на приложение. В рамките на 5 дни след перорален прием, 75% до 90% от дозата се екскретира от бъбреците и 1% до 8% чрез изпражненията.

Физиопатологични разновидности:

Хора в старческа възраст

При хора в старческа възраст, абсорбцията на кетопрофен не се променя, но се удължава елиминационният полуживот 3 часа и се намалява бъбречния и плазмен клирънс.

Хора с бъбречни нарушения

При тези пациенти е налице съответстващо на тежестта на бъбречната недостатъчност снижаване на общия клирънс и удължаване на елиминационният полуживот.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма нови данни.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

- Бял пласт: лактоза - 257 mg; пшенично нишесте – 38 mg; силициев диоксид, колоиден хидратиран – 3,8 mg; желатин - 0,38 mg; магнезиев стеарат – 5,7 mg;
- Жълт пласт: хидроксиетилцелулоза- 75 mg; калциев хидроген фосфат дихидрат - 259 mg, натриев рибофлавин фосфат(E 101) – 0,38 mg; магнезиев стеарат - 7,6 mg.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

2 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25°C.

Да се съхранява на места, защитени от светлина и влага.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Първична опаковка – PVC /Al фолио

Вторична опаковка – картонена кутия x 20 таблетки

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Sanofi Winthrop Industrie

82 avenue Raspail

94250 Gentilly

Франция

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg. №: 9900097

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

Дата на първо разрешаване: 18.03.1999 г.

Дата на последно подновяване: 27.08.2010 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

09/06/2023

