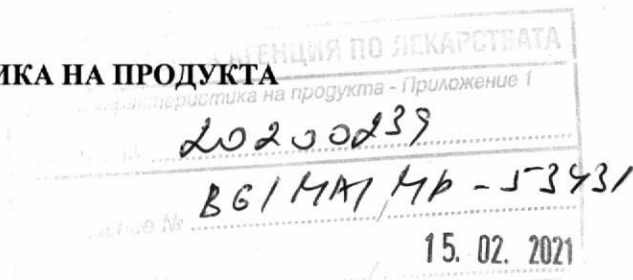


## КАРТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА



### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Афлак 100 mg филмирани таблетки

Aflac 100 mg film-coated tablets

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 100 mg ацеклофенак (acesclofenac)

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка.

Бели, кръгли, двойноизпъкнали филмирани таблетки.

### 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. Аналгетично действие при болезнени състояния (включително лумбална болка, зъбобол и първична дисменорея).

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

##### Дозировка

##### *Възрастни:*

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

##### *Педиатрична популация:*

Безопасността и ефикасността при деца и подрастващи не е установена.

##### *Старческа възраст:*

Пациентите в старческа възраст, които са с увредена бъбречна, сърдечно-съдова или чернодробна функция и получават съпътстващо лечение за тези заболявания, са изложени на повишен риск и сериозни последствия от нежеланите реакции. Ако НСПВС се считат за необходимост, трябва да се използва най-ниската ефективна доза и за възможно най-кратко време. Пациентът трябва редовно да се проследява за гастроинтестинално кървене по време на лечението с НСПВС.

Фармакокинетиката на филмирани таблетки Ацеклофенак 100 mg не се променя при пациенти в старческа възраст, поради което не се налага промяна на дозата или честотата на прием.

##### *Бъбречна недостатъчност:*

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

##### *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.



## Начин на приложение

Афлак 100 mg филмирани таблетки са предназначени за перорално приложение и трябва да се поглъщат цели с достатъчно течност. Препоръчително е Афлак 100 mg филмирани таблетки да бъде приеман по време или след храна.

Нежеланите реакции могат да бъдат сведени до минимум като се използва най-ниската ефективна доза за най-кратък период от време, необходима за контролиране на симптомите (вж. точка 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба).

### **4.3 Противопоказания**

Ацеклофенак е противопоказан при следните случаи:

- свръхчувствителност към активното вещество или някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- активна или анамнеза за рецидивираща пептична язва/кръвоизлив (два или повече отделни епизода на доказана язва или кръвене);
- при пациенти, при които вещества с подобно действие (напр. ацетилсалицилова киселина, ибупрофен или други НСПВС) предизвикват пристъпи на астма, бронхоспазм, остър ринит или уртикария или пациенти свръхчувствителни към тези лекарства;
- пациенти с чернодробна или бъбречна недостатъчност (вж. точка 4.4);
- пациенти с анамнеза за гастроинтестинално кръвене или перфорация, свързани с предишна терапия с НСПВС.
- 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;
- бременност, особено през последните три месеца, освен ако няма основателни причини за използването му. В този случай, трябва да се използва най-ниската ефективна доза (вж. точка 4.6).

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

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 гастроинтестинални и сърдечно-съдови рискове).

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

#### *Старческа възраст*

Пациентите в старческа възраст са с повишена честота на нежелани реакции към НСПВС, особено гастроинтестинално кръвене и перфорация, които могат да бъдат фатални (вж. точка 4.2).

#### *Респираторни ефекти*

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.

#### *Сърдечносъдови, бъбречни и чернодробни ефекти*

Приложението на НСПВС може да причини дозозависимо намалено образуване на простагландини и да ускори развитието на 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, тъй като при тях рискът е най-голям. Бъбречната функция трябва да се мониторира при тези пациенти.



### *Бъбречни ефекти*

Пациенти с леко до умерено бъбречно увреждане трябва да бъдат наблюдавани, тъй като употребата на НСПВС може да доведе до влошаване на бъбречната функция. 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.

### *Чернодробни ефекти*

Приемът на ацеклофенак трябва да се прекрати, ако аномалните 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.

### *Сърдечносъдови и мозъчносъдови 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 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-краткият период от време. Периодично трябва да се извършва преоценка 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.

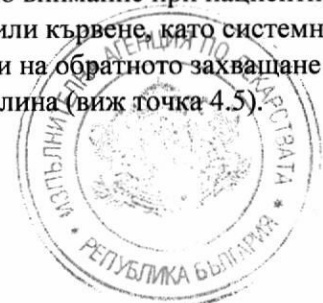
### *Гастроинтестинални ефекти*

Гастроинтестинално 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 гастроинтестинални събития.

Необходимо е внимателно медицинско наблюдение при пациенти със симптоми, които са показателни за стомашно-чревни нарушения, включващи горния и/или долния гастроинтестинален тракт, с анамнеза за гастроинтестинални язви, кървене или перфорация, с улцерозен колит или болест на Крон или хематологични аномалии, тъй като тези състояния могат да се обострят (вж. точка 4.8).

Рискът от гастроинтестинално 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 започнат 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 гастроинтестиналния риск (вж. по-долу и точка 4.5).

Пациентите с анамнеза за гастроинтестинална токсичност, по-специално тези в старческа възраст, трябва да съобщават за всички необичайни абдоминални симптоми (особено за гастроинтестинално 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 гастроинтестинално кървене или язва при пациенти, приемащи ацеклофенак, лечението трябва да се преустанови.

#### *СЛЕ и смесени заболявания на съединителната тъкан*

При пациенти със системен лупус еритематозус (СЛЕ) и смесени заболявания на съединителната тъкан може да има повишен риск от асептичен менингит (вж. точка 4.8).

#### *Кожни реакции*

Сериозни кожни реакции, някои от които фатални, включително ексфолиативен дерматит, синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза, са 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: при по-голямата част от случаите появата на реакция се проявява 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, приносът на НСПВС за влошаване на тези инфекции не може да се изключи. Затова е препоръчително да се избягва употребата на Афлак 100 mg филмирани таблетки в случай на варицела.

#### *Реакции на свръхчувствителност*

Както и при другите НСПВС, алергични реакции, включително анафилактични/ анафилактоидни реакции, може да се появят без предишна експозиция на лекарството.

#### *Хематологични ефекти*

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

#### *Дългосрочно лечение*

Като предпазна мярка при всички пациенти с дългосрочно лечение с НСПВС трябва да им бъдат проследявани бъбречната, чернодробната функция и кръвната картина.

### **4.5 Взаимодействие 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 фенитоин, циметидин, толбутамид, фенилбутазон, амиодарон, миконазол, сулфафеназол. Също като при другите продукти от групата на НСПВС, съществува риск от фармакокинетични взаимодействия с други активни съставки отделяни чрез активна бъбречна секреция, като метотрексат и литий. На практика, ацеклофенак е напълно свързан с плазмения албумин и като следствие трябва да се има предвид възможността от взаимодействия на изместването с други силно свързани с протеините активни съставки.

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

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

*Антихипертензивни средства:* НСПВС могат да редуцират ефекта на някои антихипертензивни лекарствени продукти. Комбинацията на АСЕ 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 с предпазливост, 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 взаимодействие с други диуретици не може да бъде изключено.

*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.

*Сърдечни гликозиди, дигоксин:* НСПВС могат да обострят сърдечната недостатъчност, да намалят GFR (скоростта на гломерулна филтрация) и да инхибират бъбречния клирънс на гликозидите, което да повиши плазмените им нива. Комбинацията трябва да се избягва, освен ако има възможност за често проследяване на нивата на гликозидите.

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

*Метотрексат:* Възможното взаимодействие между НСПВС и метотрексат трябва да се има предвид и когато се използват ниски дози метотрексат, особено при пациенти с намалена бъбречна функция. Когато се налага комбинирана терапия, трябва да се проследява бъбречната функция. Трябва да се подхожда с повишено внимание ако НСПВС и метотрексат се прилагат в рамките на 24 часа един от друг, тъй като НСПВС могат да повишат плазмените нива на метотрексат, което да доведе до повишена токсичност.

*Мифепристон:* НСПВС не трябва да се използват 8-12 дни след приложението на мифепристон, тъй като НСПВС могат да намалят неговия ефект.

*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 пациенти, които са на комбинирана терапия с антикоагулант и ацеклофенак.

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

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

*Зидовудин:* когато се дават НСПВС заедно със 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.

*Антидиабетни средства:* клинични проучвания показват, че диклофенак може да се прилага съвместно с перорални антидиабетни средства, без да повлиява 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.

## 4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

### Бременност



Няма информация за употребата на ацеклофенак по време на бременност.

Инхибицията на простагландиновата синтеза може да въздейства нежелателно върху ембрионалното и/или феталното развитие. Данни от епидемиологични проучвания показват повишен риск от аборт, 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 заболяемост 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 олигохидроамниоза.

Майката и новороденото в края на бременността на:

- евентуално удължаване на времето на кървене, анти-агрегантен ефект, който може да се прояви 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 (<sup>14</sup>C) ацеклофенак в млякото на кърмещи плъхове.

Следователно употребата на ацеклофенак трябва да се избягва по време на бременност и кърмене, освен ако потенциалните ползи за майката не превишават възможните рискове за плода.

#### Фертилитет

Употребата на Афлак 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 Афлак.

#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Нежелани реакции като замаяност, световъртеж или други нарушения свързани с централната нервна система са възможни след прием на НСПВС. Пациентите, които ги получават, 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). При приложение на НСПВС са съобщавани гадене, повръщане, диария, флатуленция, запек, диспепсия, коремна болка, мелена,



хематемеза, улцерозен стоматит, обостряне на колит и болест на Крон (виж точка 4.4). По-рядко е наблюдаван гастрит. Панкреатит е докладван много рядко.

**Свръхчувствителност:** Съобщавани са реакции на свръхчувствителност след лечение с НСПВС. Те могат да се състоят от:

- неспецифични алергични реакции и анафилаксия;
- реактивност на дихателните пътища, включваща астма, утежнена астма, бронхоспазъм или диспнея;
- разнообразни кожни нарушения, включително обриви от различен вид, сърбеж, уртикария, пурпура, ангиоедем и по-рядко, ексфолиативни и булозни дерматози (включително епидермална некролиза и мултиформена еритема).

**Сърдечно-съдови и мозъчно-съдови:** Съобщава се за оток, хипертония и сърдечна недостатъчност във връзка с лечението с НСПВС.

Ацеклофенак е структурно свързан и се метаболизира до диклофенак, по отношение на който 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 също се установява 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").

Като изключение се съобщава за появата на сериозни инфекции на кожата и меките тъкани по време на варицела, свързани с лечението с НСПВС.

Други нежелани реакции, съобщавани по-рядко, включват:

Бъбречни нарушения: интерстициален нефрит.

Неврологични и сетивни нарушения: оптичен неврит, съобщения за асептичен менингит (особено при пациенти със съществуващи аутоимунни заболявания като системен лупус еритематозус или смесени заболявания на съединителната тъкан), със симптоми като схващане на врата, главоболие, гадене, повръщане, треска или дезориентация (Вж. Точка 4.4), объркване, халюцинации, неразположение и сънливост.

Хематологични: агранулоцитоза, апластична анемия.

Дерматологични: булозни реакции, включително синдром на Стивън-Джонсън и токсична епидермална некролиза (много редки). Фоточувствителност.

Ако се появят сериозни нежелани реакции, приемът на Афлак 100 mg филмирани таблетки трябва да се преустанови.

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

Класификация по MedDRA SOC	Чести 1/100 до <1/10	Нечести ≥1/1000 до <1/100	Редки ≥1/10 000 до <1/1000	Много редки/ <1/10 000
Нарушения на кръвта и лимфната система			Анемия	Потискане на костния мозък; Гранулоцитопения; Тромбоцитопения; Неутропения; Хемолитична анемия
Нарушения на имунната система			Анафилактична реакция (включително шок); Свръхчувствителност	



Нарушения на метаболитизма и храненето				Хиперкалемия
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; Хрипове
Стомашно-чревни нарушения	Диспепсия; Абдоминална Болка; Гадене; Диария	Флатуленция; Гастрит; Констипация; Повръщане; Улцерации в устата	Мелена; Гастроинтестинална хеморагия; Гастроинтестинална язва	Стоматит; Чревна перфорация; Влошаване на болест на Крон и улцерозен колит; Хематемеза; Панкреатит
Хепатобилиани нарушения	Повишени чернодробни ензими			Увреждане на черния дроб (включително хепатит); Повишаване на алкалната фосфатаза в кръвта
Нарушения на кожата и подкожната тъкан		Пруритус; Обрив; Дерматит; Уртикария	Ангиоедем	Пурпура; Екзема; Тежки кожно-лигавични кожни реакции (включително синдром на Stevens- Johnson и токсична епидермална некролиза)
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища		Повишена урея в кръвта; Повишен креатинин в кръвта		Нефротичен синдром; Бъбречна недостатъчност
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение				Оток; Умора; Мускулни крампи (в краката)
Изследвания				Повишено телно





## 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 националната 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 включват главоболие, гадене, повръщане, епигастриална болка, стомашно-чревна дразнене, гастроинтестинално кървене, рядко диария, дезориентация, възбуда, кома, сънливост, световъртеж, тинитус, хипотония, респираторна депресия, припадък, от време на време конвулсии. В случаи на значимо отравяне е възможна остра бъбречна недостатъчност и увреждане на черния дроб.

Специфични терапии като диализа или хемоперфузия не могат да елиминират НСПВС поради високата степен на свързване на протеините и екстензивния метаболизъм.

Трябва да се осигури добра продукция на урината.

Бъбречната и чернодробната функция трябва да се следят внимателно.

Пациентите трябва да се наблюдават най-малко четири часа след поглъщане на потенциално токсични количества.

В случаи на чести или продължителни конвулсии, пациентите трябва да бъдат лекувани с интравенозен диазепам.

Терапията на остро отравяне с перорален ацеклофенак се състои основно от прекратяване на абсорбцията възможно най-скоро след предозиране, поддържащи и симптоматични мерки за усложнения като хипотония, бъбречна недостатъчност, конвулсии, стомашно-чревна дразнене и респираторна депресия.

## **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА**

### **5.1 Фармакодинамични свойства**

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

#### Механизъм на действие

Ацеклофенак е нестероидно вещество с противовъзпалителен и аналгетичен ефект. Начинът на действие на ацеклофенак до голяма степен се основава на инхибирането на простагландиновия синтез. Ацеклофенак е мощен инхибитор на ензима циклооксигеназа, който участва в производството на простагландини.

### **5.2 Фармакокинетични свойства**

#### Абсорбция

След перорален прием, ацеклофенак бързо се резорбира непроменен и неговата бионаличност е почти 100%. Пиковите плазмени концентрации се достигат приблизително 1,25 до 3 часа след приема.

#### Разпределение



Ацеклофенак е свързан във висока степен с протеините (>99,7%). Ацеклофенак циркулира като непроменено лекарство. Ацеклофенак прониква в синовиалната течност, където концентрациите достигат приблизително 57% от тези в плазмата. Обемът на разпределение е приблизително 30 l.

#### Биотрансформация

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

#### Елиминиране

Средният елиминационен полуживот е 4 часа. Клирънсът е приблизително 5 литра на час. Приблизително две трети от приложената доза се екскретират с урината, основно като конюгирани хидроксиметаболити.

#### Специални популации

##### *Старческа възраст*

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

##### *Чернодробно увреждане*

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

### **5.3 Предклинични данни за безопасност**

Резултатите от предклиничните проучвания проведени с ацеклофенак, съответстват на очакванията за НСПВС. Основният целеви орган е стомашно-чревния тракт. Не са записани неочаквани резултати. В три *in vitro* проучвания и едно проучване *in vivo* при мишки не е отчетено, че ацеклофенак има някаква мутагенна активност.

Не е установено, че ацеклофенак е канцерогенен при мишки или плъхове.

Проучвания при животни показват, че няма данни за тератогенност при плъхове, въпреки че системната експозиция е била ниска, а при зайци лечението с ацеклофенак (10 mg/kg/ден) доведе до серия от морфологични промени в някои фетуси.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

Ядро на таблетката:

Микрокристална целулоза 101;

Микрокристална целулоза 102;

Повидон К-25;

Кроскармелоза натрий;

Глицерил дистеарат.

Филмово покритие:

Хидроксипропил метил целулоза;



Микрокристална целулоза;  
Макрогол 40 ОЕ стеарат тип I;  
Титанов диоксид.

**6.2 Несъвместимости**

Неприложимо.

**6.3 Срок на годност**

3 години.

**6.4 Специални условия на съхранение**

Да се съхранява под 30 °С.

**6.5 Вид и съдържание на опаковката**

Афлак 100 mg филмирани таблетки са предлагат в картонени кутии с 10 или 20 филмирани таблетки, опаковани в блистери от PA/Al/PVC – Al/PVC/PVDC, заедно с листовка за пациента. 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**

УНИФАРМА ООД  
Ул. Хан Тервел 7, София 1517,  
България

**8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

20200239

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

08.12.2020

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

01.2021

