

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Рег. №	20180069
Разрешение №	
BG/MA/MP -	64635 / 09-02-2024
Оборудване №	

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Бестарен 25 mg филмирани таблетки
Bestaren 25 mg film-coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Една филмирана таблетка съдържа 36,9 mg декскетопрофен трометамол (dexketoprofen trometamol), еквивалентен съответно на 25 mg декскетопрофен (dexketoprofen).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка
Бели, кръгли филмирани таблетки с делителна черта от двете страни. Таблетката може да бъде разделена на две равни дози.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Симптоматично лечение на лека до умерена болка, напр. в мускулно-скелетната система, при дисменорея и зъбобол.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни

В зависимост от вида и интензитета на болката, препоръчителната доза е 12,5 mg на интервали 4-6 часа или 25 mg на всеки 8 часа. Общата дневна доза не трябва да надвишава 75 mg.

Нежеланите лекарствени реакции могат да бъдат намалени като за контролиране на симптомите се използва най-ниската ефективна доза за най-кратък период от време (вж. точка 4.4).

Бестарен не е предназначен за продължително приложение и лечението трябва да се ограничи в симптоматичния период.

Едновременното приложение с храна забавя скоростта на резорбция на лекарството (вж. "Фармакокинетични свойства") и затова в случай на остра болка се препоръчва да се прилага поне 30 минути преди хранене.

Пациенти в старческа възраст

При пациенти в старческа възраст се препоръчва лечението да започне с по-ниска доза в определените граници на дозировката (обща дневна доза 50 mg). Дозата може да се увеличи до препоръчителната за общата популация само след установяване на добра обща поносимост.

Нарушена чернодробна функция

Пациенти с леко до умерено нарушена чернодробна функция трябва да започнат лечението с намалени дози (обща дневна доза 50 mg) и да се проследяват внимателно. Бестарен не трябва да се използва при пациенти с тежко нарушена чернодробна функция.

Нарушена бъбречна функция

При пациенти с леко нарушена бъбречна функция (креатининов клирън 50-80 ml/min), началната доза трябва да се намали до 50 mg обща дневна доза (вж. точка 4.4). Бестарен не трябва да се



използва при пациенти с умерено до тежко нарушена бъбречна функция (креатининов клирънс <50 ml/min) (вж. точка 4.3).

Деца и юноши

Бестарен не е проучен при деца и юноши. Тъй като безопасността и ефикасността не е проучена, продуктът не трябва да се прилага при деца и юноши.

4.3 Противопоказания

Бестарен не трябва да се прилага в следните случаи:

- пациенти със свръхчувствителност към декскетопрофен, към някое друго нестероидно противовъзпалително средство (НСПВС) или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- пациенти, при които вещества с подобно действие (напр. ацетилсалицилова киселина или други НСПВС) предизвикват астматични пристъпи, бронхоспазъм, остър ринит или причиняват назална полипоза, уртикария или ангионевротичен едем;
- пациенти с активна или суспектна пептична язва/кръвоизлив, анамнеза за рекурентна пептична язва/кръвоизлив (два или повече отделни епизода на доказана язва или кръвоизлив) или хронична диспепсия;
- пациенти с анамнеза за стомашно-чревен кръвоизлив или перфорация, в резултат на предшестващо лечение с НСПВС;
- пациенти със стомашно-чревен кръвоизлив, кръвоизлив от друг произход или други заболявания, свързани с кървене;
- пациенти с болест на Crohn или улцерозен колит;
- пациенти с анамнеза за бронхиална астма;
- пациенти с тежка сърдечна недостатъчност;
- пациенти с умерено до тежко нарушена бъбречна функция (креатининов клирънс <50 ml/min);
- пациенти с тежко нарушена чернодробна функция (Child-Pugh score 10-15);
- пациенти с хеморагична диатеза и други коагулационни нарушения;
- по време на трети триместър на бременността и по време на кърмене (вж. точка 4.6).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

При деца и юноши безопасността не е установена.

При пациенти с анамнеза за алергични състояния трябва да се прилага с внимание.

Трябва да се избягва едновременно приложение на Бестарен с други НСПВС, включително селективни инхибитори на циклооксигеназа-2.

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

Стомашно-чревен кръвоизлив, язва или перфорация, които може да са фатални, са съобщавани при всички НСПВС по всяко време на лечението, с или без предупредителни симптоми или предшестваща анамнеза за сериозни стомашно-чревни нарушения. Ако при приложение на Бестарен възникне стомашно-чревен кръвоизлив или язва, лечението трябва да се преустанови. Рискът от стомашно-чревен кръвоизлив, язва или перфорация е по-висок при увеличаване дозата на НСПВС, при пациенти с анамнеза за язва, особено ако е усложнена с кръвоизлив или перфорация (вж. точка 4.3) и в старческа възраст.

Употреба в старческа възраст: пациентите в старческа възраст са с по-висок риск за нежелани реакции към НСПВС, особено стомашно-чревен кръвоизлив и перфорация, които може да са фатални (вж. точка 4.2). Тези пациенти трябва да започнат лечението с възможно най-ниска доза.



Както при всички НСПВС, трябва внимателно да се търси анамнеза за езофагит, гастрит и/или пептична язва, с цел тяхното напълно излекуване преди започване на лечение с декскетопрофен трометамол. Пациентите със стомашно-чревни симптоми или с анамнеза за стомашно-чревна заболяване трябва да се наблюдават за храносмилателно нарушения, особено за стомашно-чревна кървене.

НСПВС трябва да се прилагат внимателно при пациенти с анамнеза за стомашно-чревни заболявания (улцерозен колит, болест на Крон), тъй като тяхното заболяване може да се изостри (вж. точка 4.8). При тези пациенти, както и при пациенти, при които трябва едновременно да се прилагат ниски дози ацетилсалицилова киселина или други лекарства, които могат да увеличат стомашно-чревния риск, трябва да се има предвид комбинирано лечение с протективни агенти (напр. мизопростол или инхибитори на протонната помпа) (вж. точка 4.5).

Пациенти с анамнеза за стомашно-чревна токсичност, особено в старческа възраст, трябва да съобщават всички необичайни коремни симптоми (особено стомашно-чревен кръвоизлив), особено в началните етапи на лечение.

Препоръчва се внимание при пациенти, които приемат едновременно лекарства, които могат да увеличат риска от улцерация и кървене, като перорални кортикостероиди, антикоагуланти, напр. варфарин, селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина или антитромбоцитни лекарства, като ацетилсалицилова киселина (вж. точка 4.5).

Всички неселективни НСПВС могат да инхибират тромбоцитната агрегация и да удължат времето на кървене чрез инхибиране на простагландиновата синтеза. Ето защо не се препоръчва приложението на декскетопрофен трометамол при пациенти, които получават други лекарства, повлияващи хемостазата, като варфарин или други кумарини или хепарин (вж. точка 4.5).

Както всички НСПВС, може да се повишат плазмените нива на уреята и креатинина. Както при други инхибитори на простагландиновата синтеза, това може да е свързано с нежелани реакции от страна на бъбреците, които да доведат до гломерулонефрит, интерстициален нефрит, бъбречна папиларна некроза, нефротичен синдром и остра бъбречна недостатъчност.

Подобно на други НСПВС, може да се предизвика преходно леко увеличение на някои чернодробни параметри, както и значително увеличение на SGOT и SGPT. В случай на значително увеличение на тези параметри, лечението трябва да се преустанови.

Бестарен трябва да се прилага внимателно при пациенти с хемопоеични нарушения, системен лупус еритематодес или смесена съединително-тъканна болест.

Подобно на друг и НСПВС, декскетопрофен може да маскира симптомите на инфекциозни заболявания.

Внимание се изисква при пациенти с нарушена чернодробна и/или бъбречна функция, анамнеза за хипертония и/или сърдечна недостатъчност. При тези пациенти приложението на НСПВС може да доведе до нарушение на бъбречната функция, задръжка на течности и отоци. Внимание се налага и при пациенти на диуретична терапия или при риск от хиповолемия поради повишен риск от нефротоксичност. Особено внимание е необходимо при пациенти с анамнеза за сърдечно заболяване, особено при тези с предшестващи епизоди на сърдечна недостатъчност, тъй като е налице повишен риск от предизвикване на сърдечна недостатъчност.

Пациентите в старческа възраст често страдат от нарушена бъбречна, сърдечно-съдова или чернодробна функция (вж. точка 4.2).

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 задръжка на течности и отоци, свързани с лечението с НСПВС.



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

Пациенти с неконтролирана хипертония, застойна сърдечна недостатъчност, доказана исхемична болест на сърцето, заболяване на периферните артерии и/или мозъчно-съдова болест трябва да се лекуват с декскетопрофен трометамол само след внимателно обмисляне. Такова обмисляне трябва да се прави и преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови заболявания (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене).

Сериозни кожни реакции, някои от тях фатални, включително ексфолиативен дерматит, синдром на Стивънс-Джонсън и токсична епидермална некролиза са съобщавани много рядко във връзка с приложението на НСПВС (вж. точка 4.8). Рискът за тези реакции е най-висок рано в курса на лечението, като в по-голяма част от случаите началото на реакциите е през първия месец от лечението. Бестарен трябва да се преустанови при първата проява на кожен обрив, мукозни лезии или друг признак на свръхчувствителност.

Подобно на другите НСПВС, приложението на декскетопрофен трометамол може да наруши фертилитета на жената и не се препоръчва при жени, които се опитват да забременеят. При жени, които имат проблеми със забременяването или които се изследват за безплодие, трябва да се има предвид преустановяване на лечението с декскетопрофен трометамол. Декскетопрофен не трябва да се прилага по време на първи и втори триместър на бременността, освен ако не е абсолютно необходимо.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

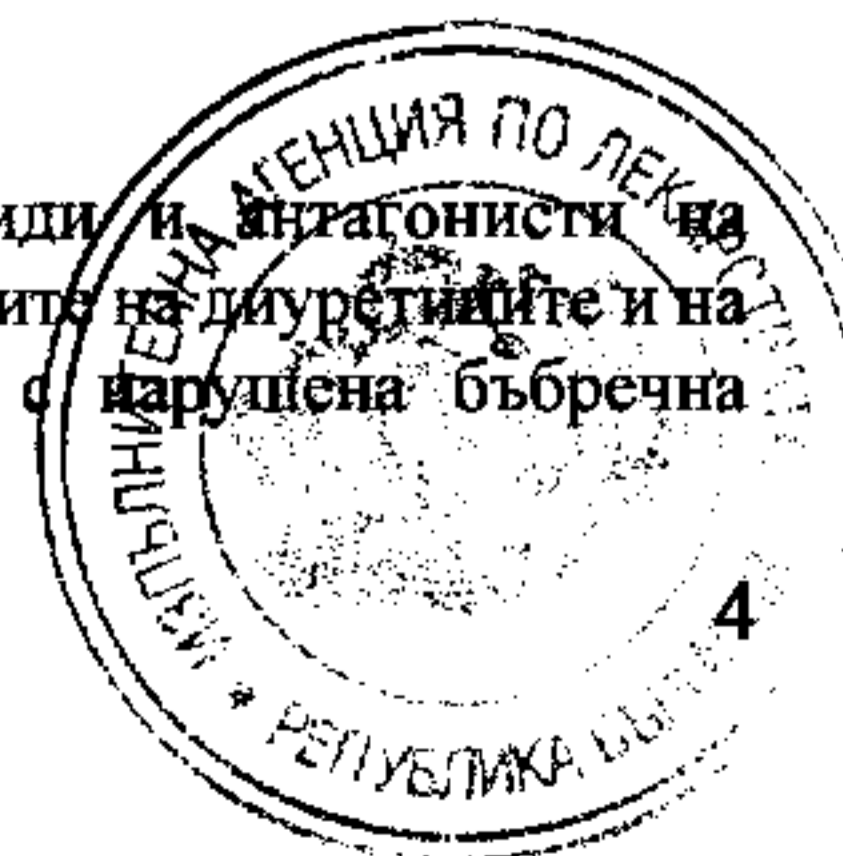
По принцип за НСПВС са характерни следните взаимодействия:

Комбинации, които не се препоръчват:

- Други НСПВС, включително високи дози салицилати (≥ 3 g/ден): едновременното приложение на няколко НСПВС може да увеличи риска от стомашно-чревна язва или кръвоизлив посредством синергичен ефект;
- Антикоагуланти: НСПВС могат да усилят ефектите на антикоагулантите, напр. варфарин (вж. точка 4.4), поради висока степен на свързване с плазмените протеини на декскетопрофен и инхибиране на тромбоцитната функция и увреждане на стомашно-чревната лигавица). Ако комбинираното лечение не може да се избегне е необходимо близко клинично наблюдение и проследяване на клиничните параметри;
- Хепарини: повишен риск от кървене (поради инхибиране на тромбоцитната функция и увреждане на стомашно-чревната лигавица). Ако комбинираното лечение не може да се избегне е необходимо стриктно клинично наблюдение и проследяване на клиничните параметри;
- Кортикостероиди: налице е повишен риск от стомашно-чревна язва или кръвоизлив (вж. точка 4.4);
- Литий (описано е с няколко НСПВС): НСПВС повишават нивата на литий в кръвта, които могат да достигнат токсични стойности (понижена бъбречна екскреция на литий). Следователно този параметър трябва да се проследява при започване, адаптиране и преустановяване на лечението с декскетопрофен;
- Метотрексат, използван във високи дози от 15 mg/седмица или повече: засилена хематологична токсичност на метотрексат посредством понижение на бъбречния му клирънс от противовъзпалителни средства по принцип;
- Хидантоини и сулфонамиди: токсичните ефекти на тези вещества могат да се засилят.

Комбинации, които изискват предпазни мерки:

- Диуретици, ACE-инхибитори, антибактериални аминогликозиди и антагонисти на ангиотензин II рецептор: декскетопрофен може да понижи ефектите на диуретиците и на други антихипертензивните лекарства. При някои пациенти с нарушена бъбречна



функция (напр. дехидратирани пациенти или пациенти в старческа възраст с нарушена бъбречна функция), едновременното приложение на вещества, които инхибират циклооксигеназата и АСЕ-инхибитори, ангиотензин II рецепторни антагонисти или антибактериални аминогликозиди може да доведе до допълнително нарушение на бъбречна функция, което обикновено е обратимо. В случай на комбинирано предписване на декскетопрофен и диуретик е важно да се осигури адекватно хидратиране на пациента и да се изследва бъбречната функция при започване на лечението (вж. т. 4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба);

- Метотрексат, използван в ниски дози, по-малко от 15 mg/седмица: хематологичната токсичност на метотрексат по принцип се засилва при понижаване на бъбречния му клирънс от противовъзпалителните средства. Ежеседмично изследване на кръвната картина през първите седмици от комбинираното лечение. Внимателно наблюдение при наличие дори и на леко увреждане на бъбречната функция, както и при пациенти в старческа възраст;
- Пентоксифилин: повишен риск от кървене. По-активно клинично наблюдение и по-често изследване на времето на кървене;
- Зидовудин: риск от засилване на токсичността върху еритроцитната редица посредством действие върху ретикулоцитите с възникване на тежка анемия една седмица след започване на НСПВС. Проверка на пълната кръвна картина и броя на ретикулоцитите една до две седмици след започване на лечението с НСПВС;
- Сулфанилурейни лекарства: НСПВС могат да засилят хипогликемичния ефект на сулфанилурейните лекарства посредством изместването им от местата за свързване с плазмените протеини.

Комбинации, които трябва да се имат предвид:

- Бета-блокери: лечението с НСПВС може да понижи антихипертензивното им действие чрез инхибиране синтезата на простагландините;
- Циклоспорин и такролимус: нефротоксичността може да се засили от НСПВС, посредством медиран от простагландините ефект върху бъбреците. По време на комбинирано лечение трябва да се изследва бъбречната функция;
- Тромболитици: повишен риск от кървене;
- Антитромбоцитни лекарства и селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (SSRI): повишен риск от стомашно-чревно кървене (вж. точка 4.4).
- Пробенецид: плазмените концентрации на декскетопрофен може да се повишат; това взаимодействие може да се дължи на инхибиране на мястото на бъбречната тубулна секреция и на глокуроновата конюгация и се изисква адаптиране на дозата на декскетопрофен;
- Сърдечни гликозиди: НСПВС могат да увеличат плазмената концентрация на гликозидите;
- Мифепристон: поради теоретичния риск за промяна в ефективността на мифепристон от инхибиторите на простагландиновата синтеза, НСПВС не трябва да се използват за повече от 8-12 дни след приложението на мифепристон;
- Хинолонови антибиотици: опитите при животни показват, че високи дози хинолони в комбинация с НСПВС могат да увеличат риска от проява на конвулсии.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Инхибирането на простагландиновата синтеза може да повлияе неблагоприятно бременността и/или ембрио/феталното развитие. Данни от епидемиологични проучвания повдигат съмнение за повишен риск от аборт и сърдечна малформация и гастросхизис след приложение на инхибитори на простагландиновата синтеза при ранна бременност. Абсолютният риск за сърдечно-съдови малформации се увеличава от по-малко от 1 % до около 1,5 %. Счита се, че рискът се увеличава с увеличение на дозата и продължителността на лечението. При животни е демонстрирано, че инхибиторите на простагландиновата синтеза водят до увеличаване на аборт и постимплантационни загуби и ембрио-фетален леталитет. В допълнение към това при



приложение на инхибитори на простагландиновата синтеза при животни по време на органогенезата се наблюдават различни малформации, включително и сърдечно-съдови. Независимо от това, проучванията при животни с декскетопрофен трометамол не са показали репродуктивна токсичност (вж. точка 5.3). От 20-та седмица на бременността нататък, употребата на декскетопрофен може да причини олигохидрамнион в резултат на бъбречна дисфункция на плода. Това може да настъпи скоро след започване на лечението и обикновено е обратимо след преустановяване на приема. Освен това, има съобщения за стесняване на дуктус артериозус след лечение във втория триместър, повечето от които са отшумели след прекратяване на лечението. Следователно, по време на първия и втория триместър от бременността, декскетопрофен трометамол не трябва да се прилага, освен ако не е абсолютно необходимо. Ако декскетопрофен трометамол се използва от жени, които се опитват да забременеят или по време на първи или втори триместър на бременността, дозата трябва да бъде възможно най-ниска и продължителността на лечение трябва да е възможно най-кратка. В случай на експозиция в продължение на няколко дни от 20-та гестационна седмица нататък, трябва да се обмисли наблюдение за олигохидрамнион и стесняване на дуктус артериозус след раждането. Употребата на декскетопрофен трябва да се преустанови, ако се установи олигохидрамнион или стесняване на дуктус артериозус.

По време на трети триместър на бременността, всички инхибитори на простагландиновата синтеза могат да изложат плода на :

- Кардиопулмонална токсичност (преждевременно стесняване/затваряне на дуктус артериозус и белодробна хипертония);
- нарушена бъбречна функция (вж. по-горе);

майката и новороденото в края на бременността на:

- възможно удължаване на времето на кървене, антиагрегантен ефект, който може да се наблюдава дори при много ниски дози;
- подтискане на маточните контракции, което води до забавено или удължено раждане.

Следователно, Бестарен е противопоказан през трети триместър от бременността (вж. точки 4.3 и 5.3).

Не е известно дали декскетопрофен се излъчва с кърмата. Бестарен е противопоказан по време на кърмене.

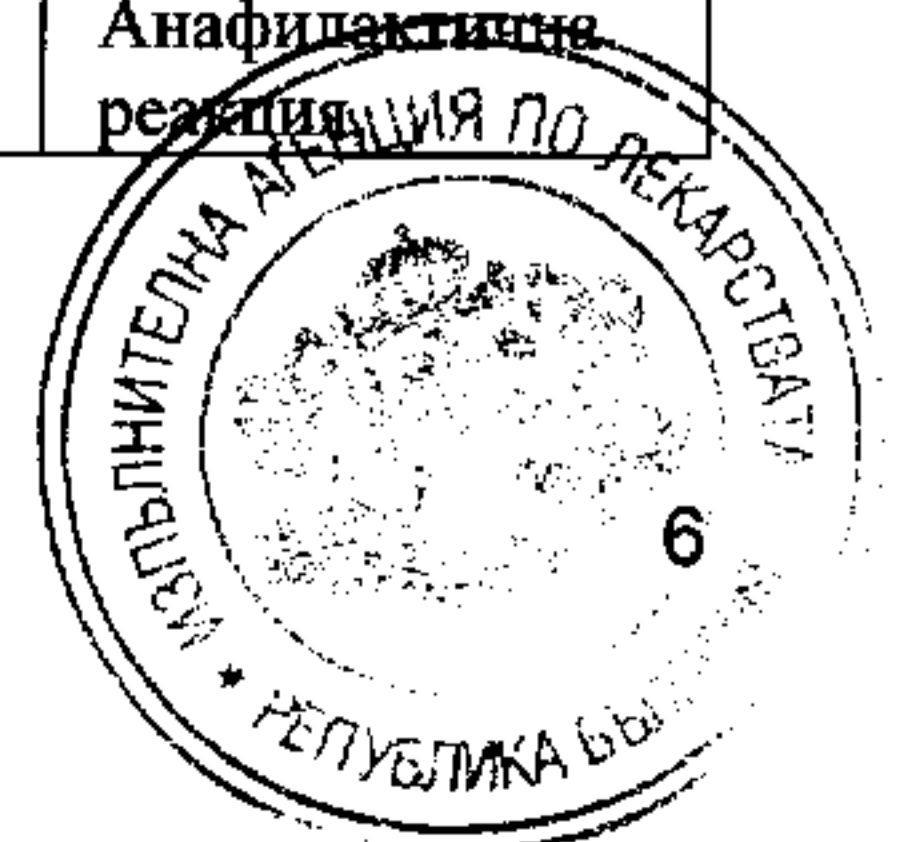
4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Бестарен може леко до умерено да повлияе способността за шофиране и работа с машини, тъй като може да доведе до замаяност и сънливост.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

В таблицата са описани нежеланите събития, които са поне вероятно свързани с парентералното приложение на декскетопрофен трометамол, подредени по системно-органна класификация и по честота.

Системо-органни класове	Чести (≥1/100 до <1/10)	Нечести (≥1/1 000 до <1/100)	Редки (≥1/10 000 до <1/1 000)	Много редки/изолирани съобщения (<1/10 000)
Нарушения на кръвта и лимфната система	---	---	---	Неутропения, тромбоцитопения
Нарушения на имунната система	---	---	Оток на ларинкса	Анафилактична реакция



Системо-органични класове	Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)	Нечести ($\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$)	Редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$)	Много редки/изолирани съобщения ($< 1/10\ 000$)
				включително анафилактичен шок
Нарушения на метаболизма и храненето	---	---	Анорексия	---
Психични нарушения	---	Безсъние, безпокойство	---	---
Нарушения на нервната система		Главоболие, замаяност, сънливост	Парестезии, синкоп	
Нарушения на очите	---	---	---	Замъглено виждане
Нарушения на ухото и лабиринта	---	Вертиго	---	Тинитус
Сърдечни нарушения	---	Сърцебиене	---	Тахикардия
Съдови нарушения	---	Зачервяване	Хипертония	Хипотония
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения	---	---	Брадикардия	Бронхоспазъм, диспнея
Стомашно-чревни нарушения	Гадене и/или повръщане, коремна болка, диария, диспепсия	Гастрит, запек, суха уста, флатуленция	Пептична язва, кръвоизлив от пептична язва или перфорация на пептична язва (вж. точка 4.4.)	Панкреатит
Хепато-билиарни нарушения	---	---	Хепатит	Хепатоцелуларно увреждане
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	---	Обрив	Уртикария, акне, повишено изпотяване	Синдром на Stevens Johnson, токсична епидермална некролиза (синдром на Lyell), ангиоедем, фациален оток, реакции на фото чувствителност, сърбеж
Нарушения на мускулно-скелетната система и съединителната тъкан	---	---	Болки в гърба	---
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	---	---	Остра бъбречна недостатъчност, полиурия	Нефрит или нефротичен синдром
Нарушения на възпроизводителната система и гърдата	---	---	Менструални нарушения,	---



Системо-органични класове	Чести (≥1/100 до <1/10)	Нечести (≥1/1 000 до <1/100)	Редки (≥1/10 000 до <1/1 000)	Много редки/изолирани съобщения (<1/10 000)
			засягане на простатата	
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение	---	Умора, болка, астения, ригор, обща слабост	Периферен оток	---
Изследвания	---	---	Отклонение в чернодробните функционални проби	---

Най-често наблюдаваните нежелани реакции са стомашно-чревни. Може да се наблюдават пептична язва, перфорация или стомашно-чревен кръвоизлив, понякога фатални, особено в старческа възраст (вж. точка 4.4). След приложение са съобщавани гадене, повръщане, диария, флатуленция, констипация, диспепсия, коремна болка, мелена, хематемеза, улцеративен стоматит, усложняване на колит или болест на Крон (вж. точка 4.4). По-рядко е наблюдаван гастрит. Има съобщения за отоци, хипертония и сърдечна недостатъчност, свързани с употребата на НСПВС. Клинични проучвания и епидемиологични данни показват, че употребата на някои НСПВС (особено във високи дози и при продължително приложение) може да се свърже с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например миокарден инфаркт или инсулт) (вж. точка 4.4).

Подобно на други НСПВС, могат да се появят и следните нежелани лекарствени реакции: асептичен менингит, който се проявява най-вече при пациенти със системен лупус еритематодес или смесена съединително-тъканна болест; хематологични реакции (пурпура, апластична и хемолитична анемия, рядко агранулоцитоза или костно-мозъчна хипоплазия). Булзни реакции, включително синдром на Stevens Johnson и токсична епидермална некролиза (много рядко).

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.: +359 2 8903417
уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Не са известни симптомите при предозиране. Подобни лекарствени продукти водят до стомашно-чревни (повръщане, анорексия, коремна болка) и неврологични (сомнолентност, вертиго, дезориентация, главоболие) нарушения.

В случай на непредумишлено предозиране или приложение на по-висока доза се налага незабавно симптоматично лечение в зависимост от клиничното състояние на пациента. Ако са приети повече от 5 mg/kg от възрастен или дете в рамките на един час трябва да се приложи активен въглен.

Декскетопрофен треметамол може да се елиминира с диализа.



5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: пропионова киселина и производни, АТС код: M01AE17

Декскетопрофен трометамол е трометаминова сол на S-(+)-2-(3-benzoylphenyl)propionic acid - лекарствен продукт с аналгетични, противовъзпалителни и антипиретични свойства, което принадлежи към нестероидните противовъзпалителни средства (M01AE).

Механизмът на действие на нестероидните противовъзпалителни средства се свързва с намаление на простагландиновата синтеза чрез инхибиране на циклооксигеназата. По-специално е налице инхибиране на превръщането на арахидонова киселина в циклични ендопероксидази, P_gG₂ и P_gH₂, които образуват P_gE₁, P_gE₂, P_gF₂α и P_gD₂ и също простациклини P_gI₂ и тромбоксани (TxA₂ и TxB₂). Освен това, инхибирането на простагландиновата синтеза може да повлияе и други медиатори на възпалението, като кинините. Това е един индиректен ефект, който допълва директното действие.

В проучвания при животни и хора е доказано, че декскетопрофен инхибира активността на COX-1 и COX-2.

Клинични проучвания върху различни болкови модели демонстрират ефективна аналгетична активност на декскетопрофен трометамол. В някои проучвания началото на аналгетичното действие се проявява до 30 минути след приложението. Аналгетичният ефект е с продължителност от 4 до 6 часа.

5.2 Фармакокинетични свойства

След перорално приложение на декскетопрофен трометамол при хора, C_{max} се постига на 30-тата минута (в границите 15-60 минути).

Времето на полуживот във фазата на разпределение и на елиминиране на декскетопрофен трометамол е съответно 0,35 часа и 1,65 часа. Както при други лекарства с висока степен на свързване с плазмените протеини (99%), обемът на разпределение е средно под 0,25 l/kg. Основният път на елиминиране на декскетопрофен е с глюкуронова конюгация, последвана от излъчване през бъбреците.

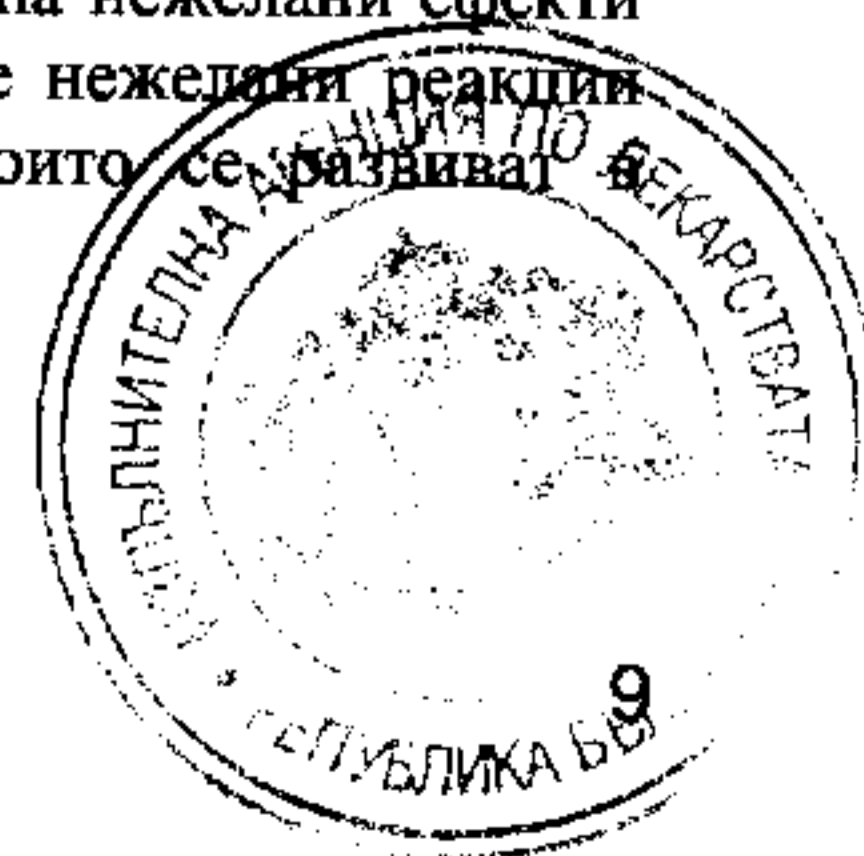
След приложението на декскетопрофен трометамол, в урината се отделя само S-(+)-енантиомера, което показва, че при хората няма конверсия в R-(-)-енантиомер.

При фармакокинетични проучвания с многократно приложение се наблюдава, че AUC след последното приложение не се различава от получената след еднократно приложение, което показва, че няма кумулиране на лекарството.

При едновременно приложение с храна, AUC не се променя, въпреки че C_{max} на декскетопрофен трометамол се понижава и скоростта на резорбция се забавя (увеличава се t_{max}).

5.3 Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват специфичен риск за хора, като се основават на конвенционални изследвания за безопасност, токсичност при многократно приложение, генотоксичност, репродуктивна токсичност и имунофармакология. Проведените върху мишки и маймуни изследвания за хронична токсичност са показали ниво на липса на нежелани ефекти (NOAEL, No Observed Adverse Effect Level) при 3 mg/kg/ден. Основните нежелани реакции наблюдавани при високи дози, са стомашно-чревни ерозии и язви, които се развиват в зависимост от дозата.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Ядро
царевично нишесте
прежелатинизирано царевично нишесте
микростална целулоза
хидроксипропилцелулоза
магнезиев стеарат,

Филмово покритие
опадрай бял ОУ-Д-7192 състоящ се от:
хипромелоза
титанов диоксид (E171)
макрогол 400

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

Блистер от PVC/PVDC/Al фолио: 2 години
Блистер от PA/Al/PVC/Al фолио: 3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 30°C. Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина - за таблетки, опаковани в блистер от PA/Al/PVC/Al фолио.
Да се съхранява под 25°C - за таблетки, опаковани в блистер от PVC/PVDC/Al фолио.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Таблетките се предлагат в блистери (PA/Al/PVC/Al и PVC/PVDC/Al).

По 7, 10, 14 или 20 таблетки в блистер от PA/Al/PVC/Al фолио. По 1 или 2 блистера в картонена кутия.

По 10 или 20 таблетки в блистер от PVC/PVDC/Al фолио. По 1 или 2 блистера в картонена кутия.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Беста Мед ЕООД
ул. "Кънчо Скорчев" № 8
5350, гр.Трявна
България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg. №: 20180069



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

Дата на първо разрешаване: 15 март 2018 г.

Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

