

P

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към РУ 11-1750	13.03.08
Одобрено: 12 / 12.02.08	

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

PROFENID 50 mg, капсули

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 капсула съдържа 50 mg кетопрофен (*ketoprofen*)
За пълния списък на помощните вещества виж т. 6.1

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Желатинови капсули

4. Клинични данни

4.1 Терапевтични показания

Те произтичат от противовъзпалителното действие на кетопрофена, от значимостта на симптомите на непоносимост, които лекарствения продукт епоражда и от мястото му сред разнообразните противовъзпалителни продукти, които са на разположение сега.

Те се ограничават при възрастните и децата над 15 год в:

Дълготраен курс на симптоматично лечение на:

- възпалителни форми на хроничен ревматизъм, в това число и ревматоиден полиартрит, анкилозиращ спондилартрит (или сходни заболявания, като синдрома на Файсингер-Лерой-Райтер и псориатичен ревматизъм);
- някои болезнени и инвалидизиращи артрози.

Краткотрайно симптоматично лечение на остри пристъпи на:

- извънставни форми на артрит, като скапулохумерални (раменни) периартрити, тендинити, бурсити,
- микрокристални артрити,
- артрози,
- лумбаго (болки в кръста),
- радикулитни болки,
- остри посттравматични доброкачествени заболявания на двигателния апарат.

4.2 Дозировка и начин на употреба

Дозировка:

Profenid 50 mg капсула:

- 6 капсули от 50 mg дневно (300 mg на ден).

Честота на приложение:

- Капсули 50 mg: дневната доза се разпределя на 2 до 3 приема.

Специални популации:

Пациенти с нарушена бъбречна функция и пациенти в напреднала възраст:



Препоръчва се да се намали началната доза и такива пациенти да се поддържат на минимална ефективна доза. Индивидуално коригиране на дозата може да се има предвид само след установяване на индивидуалната поносимост на пациента.

Хиповолемични пациенти: вж Предупреждения и Предпазни мерки при употреба.

Пациенти с нарушена чернодробна функция:

Тези пациенти трябва внимателно да се наблюдават и да се придържат към минималната ефективна дневна доза (виж точки 4.4 и

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 от време.

4.2 Приложение:

Капсулите се поглъщат цели, с пълна чаша вода по време на хранене.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към кетопрофен или към някое от помощните вещества на лекарствения продукт.

Кетопрофен е противопоказан при пациенти с изяви в миналото реакции на свърхчувствителност като астматични пристъпи или други алергични реакции, към кетопрофен, ацетилсалицилова киселина или други нестероидни противовъзпалителни лекарствени средства. Тежки, рядко с фатален изход анафилактични реакции са били докладвани при такива пациенти (вж точка 4.8 Нежелани лекарствени реакции)

Кетопрофен е противопоказан и при следните случаи:

- ✓ - Тежка сърдечна недостатъчност
- Анамнеза за стомашно-чревна кървене или перфорация, свързани с предишно лечение с НСПВС.
- Активна или анамнеза за стомашна язва/хеморагия .
- Тежка чернодробна недостатъчност.
- Тежка бъбречна недостатъчност
- Трети триместър от бременността
- Изяви наскоро проктити или ректоргии (при ректално приложение)

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Специални 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 (виж т.4.2 и по-долу посочените гастро-интестинални 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 серотонинови инхибитори или антитромбоцитни продукти като ацетилсалициловата киселина (вж точка 4.5 Лекарствени и други форми на взаимодействие).

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

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

Тежки кожни реакции, някои от тях фатални, включително ексфолиативен дерматит, синдром на Steven-Johnson, и токсична епидермална некролиза са били докладвани много рядко в комбинация с НСПВС. 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.

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 нестероидни противовъзпалителни (НСПВС) лекарствени средства. Прилагането на този вид НСПВС може да доведе до появата на астматична криза или спазъм на бронхите, в това число и на хора алергични към аспирин или към НСПВС.

Предпазни мерки при употреба

Пациенти с активна или анамнеза за пептична язва.

НСПВС трябва да се дават особено внимателно на пациенти с анамнеза за стомашно-чревно заболяване (улцерозен колит, заболяване на Crohn), тъй като техните състояния могат да се влошат.

В начало 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 хронични бъбречна недостатъчност, особено ако пациентът е в напреднала възраст. При тези пациенти, употребата на кетопрофен може да предизвика намаляване на бъбречния кръвоток, причинено от подтискането на простагландините и води до бъбречна недостатъчност.

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 застойна сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за отоци и задръжка на течности, свързани с лечението с неселективни 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 кетопрофен.

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 внимателно обмисляне. Такова обмисляне трябва да се прави преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови събития (например хипертония, хиперлипидимия, захарен диабет, тютюнопушене).

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

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.

Ако зрителни нарушения като замъглено виждане се появи, лечението трябва да се прекъсне.

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

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

Поради наличие на лактоза, таблетките от 100 mg и капсулите от 50 mg са противопоказни при случаите на наследствена галактоземия, на синдром на лошо усвояване на глюкозата и галактозата, или на недостиг на лактаза.

4.5 Лекарствени и други форми на взаимодействия

Рискове свързани с хиперкалиемия:

Някои лекарства или терапевтични класове могат да предизвикат появата на хиперкалиемия: солите на калия, калий задържащи диуретици, инхибиторите на конвертиращия ензим, инхибиторите на ангиотензин II, нестероидни противовъзпалителни, хепарините (нискомолекулни или нефракционирани), циклоспорин и такролим, триметоприм. Появата на хиперкалиемия може да зависи от съществуването на взаимосвързани фактори.

Този риск се засилва в случай на съвместно лечение с изброените продукти.

Риск, свързан с антиагрегантното действие върху тромбоцитите:

Много субстанции участват във взаимодействия, свързани с техните антиагрегантни свойства: аспирин и НСПВС, тиклопидин и клопидогрел, тирофибан, ептифибатид и абциксимаб, илопрост.



Използването на много тромбоцитни антиагреганти увеличава риска от кървене също както и съвместното им приложение с хепарин, с орални антикоагуланти, и с тромболитици, и изисква редовно клинично и биологично наблюдение. Едновременното прилагане на кетопрофен със следните лекарства налага строго наблюдение на клиничното и биологичното състояние на болния.

Не се препоръчва комбинирането с:

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

Антикоагуланти (хепарин и варфарин) и тромбоцитни антиагреганти (като тиклопидин, клопидогрел): 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 на хематологичната токсичност на метотрексат, особено ако се прилага във високи дози (>15 mg/седмично), вероятно се дължи на изместване от свързания с плазмените протеини метотрексат и намален бъбречен клирънс.

Комбинации, изискващи предпазни мерки при употреба:

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 от развитието на бъбречна недостатъчност и вторично намаляване на гломерулната филтрация поради намаляване синтезата на бъбречните простагландини. Такива пациенти трябва да се хидратират преди започване на комбинираното лечение и изследване на бъбречната функция преди лечението (вж т 4.4).

АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите: При пациенти с нарушена бъбречна функция (напр. дехидратирани пациенти или при пациенти в напреднала възраст, едновременната употребана АСЕ инхибитори и инхибитори на ангиотензин II рецепторите и агенти, които подтискат 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 напреднала възраст, наблюдението се извършва по-често.

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



Да се вземе под внимание комбинирането с:

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

Тромболитици:
Увеличен риск от кървене

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

Селективни серотонинови инхибитори (SSRIs): увеличен риск от стомашно-чревна кървене.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност:

При хората, няма данни за нежелани ефекти върху плода. Въпреки това са необходими допълнителни епидемиологични изследвания, за да се изключи всякакъв риск.

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

- Плода на кардиопулмонарна токсичност (повишено артериално кръвно налягане с преждевременно затваряне на артериалния канал) и на бъбречна дисфункция, която може да доведе до бъбречна недостатъчност с олигохидрамнион.
- Майката и детето, в края на бременността, на едно евентуално удължаване на времето на кърмене.

Според случая, предписването на НСПВС трябва да бъде извършвано само когато е крайно наложително през първите пет месеца на бременността.

Извън изключително ограничена акушерска употреба, предписването на НСПВС е абсолютно противопоказно след шестия месец.

Кърмене:

НСПВС преминават в майчиното мляко и поради мерки за безопасност би следвало да се избягва да се прилагат при кърмачки.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Пациентите да бъдат предупреждавани за възможна поява на световъртеж, сънливост, конвулсии или зрителни смущения. Препоръчва се да не се шофира или да се работи с машини, ако един от тези симптоми се прояви.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Стомашно-чревни реакции

- Стомашна болка, затруднено храносмилане, коремна болка, гадене, повръщане, диария, запек, флатуленция,
- Гастрит, стоматит, обострен колит, и болест на Крон.
- Язва на стомаха, кръвоизлив на стомаха и перфорация.



Реакции на свръхчувствителност:

- Дерматологични реакции: обрив, силен сърбеж, уртикария, ангиоедем;

Кожни реакции:

фоточувствителност, алопеция, булозни дерматози (Стивънс – Джонсън и токсични епидермални некролизи).

Респираторни: възможна внезапна поява на астматична криза или спазъм на бронхите, особено при пациенти, алергични към аспирин и другите НСПВ.

Невропсихични смущения: могат да се наблюдават главоболие, световъртеж, сънливост и в изключително редки случаи конвулсии и промени в настроението.

Зрителни смущения: нарушена зрителна острота.

Слухови смущения: шум в ушите (акуфония).

Бъбречни смущения: остра бъбречна недостатъчност, благоприятствана от предходна бъбречна криза и/или хиповолемия, в изключително редки случаи интерстициален нефрит, нефротичен синдром.

Хематологични смущения:

- тромбоцитопения, анемия, дължаща се на кръвоизливи, агранулоцитоза, левкопения, костно-мозъчна аплазия..

Чернодробни смущения: увеличаване на нивото на трансаминазите, изключително редки случаи на хепатит.

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).

Има съобщения за отоци, хипертония и сърдечна недостатъчност, свързани с употребата на НСПВС.

Странични явления, свързани с начина на приложение (супозитории): риск от локална токсичност, което зачестява и се усилва с продължителността на лечението, завишен ритъм на приложение и дозировка. Могат да се появят ректални раздразнения от типа на парене.

4.9 Предозиране

При възрастните основните белези на предозиране са главоболие, световъртеж, сънливост, гадене, повръщане, диария и коремни болки. В случай на тежка интоксикация се наблюдават понижаване на кръвното налягане, подтискане на дишането, стомашно-чревни кръвоизливи.

Пациентът трябва да се отведе незабавно в специализирано болнично заведение, където да му бъде приложено симптоматично лечение.



За да се ограничи абсорбцията на кетопрофен може да се извърши стомашна промивка и прилагане на активен въглен.
Няма специфичен антидот.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1 Фармакодинамични свойства

Нестероидно противовъзпалително (М : мускул и скелет).

АТС код – М 01АЕ 03

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

Той притежава следните качества:

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

Като цяло тези качества се дължат на инхибирането на простагландиновата синтеза.

На базата на много експериментални модели при кетопрофен се наблюдава, за разлика от другите НСПВ, съставка с централно аналгетично действие.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция:

- Капсула от 50 mg :

Последователните измервания на серумните нива след приложение на една терапевтична доза показват, че кетопрофенът се абсорбира много бързо. Сроктът за достигане на максимално серумно ниво е от 60 до 90 мин след орално приложение, 45 до 60 мин след ректално приложение.

Когато кетопрофенът се приема с храна, нивото на абсорбция намалява като провокира закъснение на пика на плазмената концентрация (С_{max}). Въпреки това общата бионаличност остава непроменена.

Разпределение:

Средният плазмен полуживот е от 1,5 до 2 часа при орален прием (форми с бързо освобождаване), от 2,2 часа при ректален прием.

Кетопрофенът се свързва до 99% с плазмените протеини.

Кетопрофенът преминава в синовиалната течност и там се открива в по-високи нива от плазмените на 4-тия час след орален прием. Той преминава плацентарната и хемато-енцефалната бариера.

Обемът на разпределение е около 7 l.

Метаболизъм:

Биотрансформацията на кетопрофен се извършва по два начина: единият в незначителна степен (хидроксилиране), другият значително доминиращ (конюгация с глюкуронова киселина).

По-малко от 1% от приложената доза кетопрофен се намира в непроменена форма в урината, докато свързаната с глюкуронова киселина представлява около 65 – 75% .

Отделяне:

Отделянето, изключително чрез урината е бързо защото 50% от приложената доза се елиминира по време на първите 6 след приема, независимо от начина на приложение. Формата с постепенно освобождаване не променя процеса на бъбречното елиминирание на кетопрофена.

5 дни след оралното приложение, 75 до 90% от дозата се елиминират чрез бъбреците и 1 до 8% чрез изпражненията.



Физиопатологични разновидности:

Хора в напреднала възраст: при хора в напреднала възраст, абсорбцията на кетопрофен не е променена, но за сметка на това полу-живота на елиминиране е удължен (3h).

Хора с бъбречна недостатъчност: при тези пациенти, пълното очистване се удължава пропорционално на степента на бъбречна недостатъчност.

5.3 Предклинични данни за безопасност

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощни вещества

Lactose monohydrate, magnesium stearate, iron oxide yellow, titanium dioxide, Gelatin

6.2 Физико- химични несъвместимости

6.3 Срок на годност

5 години

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C

6.5 Данни за опаковката

Първична опаковка – 2 алуминиеви блистера x 12 капсули

Вторична опаковка – картонена кутия

6.6 Препоръки при употреба

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Aventis Pharma S.A.

20 avenue Raymond Aron

92160 Antony Cedex 12

France

8. Регистрационен № в регистъра

200300009/13.01.2003

9. Дата на първото разрешаване/последно подновяване

13.01.2003

10. Дата на последна редакция на текста

Март 2007

