

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
НА ПРОДУКТА	20080221
Към Рег. №	
Разрешение №	B61/M7/Mp-61237
Срок на действие №	20-12-2022

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Ибупром Синус 200 mg/30 mg обвити таблетки
Ibuprom Sinus 200 mg/30 mg coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 таблетка съдържа:

Ибупрофен (Ibuprofen) 200 mg

Псевдоэфедринов хидрохлорид (Pseudoephedrine hydrochloride) 30 mg

Помощни вещества с известно действие

Една таблетка съдържа:

Захароза – 119 mg

Натриев бензоат – 0,005 mg

Сънсет жълто FCF (E110) – 0,05 mg

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Обвити таблетки

Гладки, овални обвити таблетки с керемидено-червен цвят, шамповани с надпис „IBZ” от едната страна.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Този лекарствен продукт е предназначен за облекчаване на симптомите, свързани с простудни заболявания и грип като: главоболие, болка и запушване на околоносните синуси, ринит, висока температура, възпалено гърло, миалгия.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Възрастни и деца над 12 години: 1-2 таблетки на всеки 4-6 часа. Да не се използват повече от 6 таблетки дневно.

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

Нежеланите реакции могат да се сведат до минимум, като се използва най-ниската ефективна доза за най-краткия период, необходим за контролиране на симптомите (вж. точка 4.4).

При необходимост от прием на лекарствения продукт за повече от 3 дни или при продължително състояние, пациентът трябва да се консултира с лекар.



4.3 Противопоказания

- свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1
- данни за свръхчувствителност (ринит, астматичен пристъп, уртикария) към ацетилсалицилова киселина или към други НСПВС
- лечение с МАО инхибитори и 2 седмици след преустановяването му
- активна или предишна дуоденална язва
- тежки сърдечносъдови смущения, тахикардия, артериална хипертония, нестабилна ангина пекторис
- тежка сърдечна недостатъчност (клас IV по NYHA)
- хипертиреозидизъм
- захарен диабет
- феохромоцитома
- закритоъгълна глаукома
- хиперплазия на простатата
- бременност и кърмене

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Продуктът да се прилага възможно най-непродължително време и във възможно най-ниската терапевтична доза.

Необходимо е повишено внимание (обсъждане с лекар или фармацевт), преди започване на лечение при пациенти с анамнеза за хипертония и/или сърдечна недостатъчност, тъй като има съобщения за задръжка на течности, повишено артериално налягане и оток, свързани с лечението с НСПВС.

Не трябва да се използва заедно с други НСПВС. Да се прилага внимателно при пациенти с бронхиална астма, тъй като продуктът може да предизвика бронхоспазм.

При пациенти с анамнеза за стомашна и/или дуоденална язва употребата на продукта увеличава риска от стомашно-чревен кръвоизлив.

При пациенти с чернодробно и бъбречно функционално увреждане трябва да се мониторира чернодробните ензими и бъбречната функция при употребата на лекарствения продукт.

Употребата на този лекарствен продукт при дехидратирани пациенти увеличава риска от бъбречно увреждане.

При индивиди с нарушения в кръвосъсирването времето на кървене може да се удължи.

Мониторирането на кръвното налягане и евентуалното оптимизиране на дозировката на хипотензивни средства при пациенти с хипертония са също необходими (вж. точка 4.5).

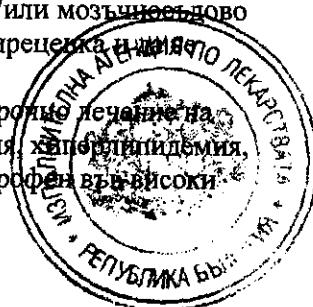
При пациенти в напреднала възраст рискът от усложнения се повишава при поява на нежелани реакции.

Сърдечносъдови и мозъчно-съдови ефекти

Клиничните проучвания показват, че употребата на ибупрофен, особено във високи дози (2400 mg/ден), може да е свързана с повишаване на риска от артериални тромботични събития (например инфаркт на миокарда или инсулт). Като цяло епидемиологичните проучвания не показват връзка между приема на ибупрофен в ниски дози (т.е. ≤ 1200 mg/ден) и повишаване на риска от артериални тромботични събития.

Пациентите с неконтролирана хипертония, застойна сърдечна недостатъчност (II-III по NYHA), установена исхемична болест на сърцето, периферна артериална болест и/или мозъчносъдово заболяване трябва да бъдат лекувани с ибупрофен само след внимателна преценка и избягват високите дози (2400 mg/ден).

Трябва да се извършва внимателна преценка и преди започване на дългосрочно лечение на пациенти с рискови фактори за сърдечносъдови събития (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене), особено ако е необходим прием на ибупрофен във високи дози (2400 mg/ден).



Тежки кожни реакции

При употреба на продукти, съдържащи ибупрофен и псевдоефедрин, могат да настъпят тежки кожни реакции, като остра генерализирана екзантематозна пустулоза (acute generalised exanthematous pustulosis, AGEP). Този остър пустулозен обрив може да се появи в рамките на първите 2 дни от лечението, с повишена температура и многобройни малки, предимно нефоликуларни пустули, възникващи върху обширен едематозен еритем и локализирани главно в кожните гънки, по торса и горните крайници. Пациентите трябва да се наблюдават внимателно. Ако се появят признаци и симптоми като пирексия, еритем или множество малки пустули, приложението на Ибупром Синус трябва да се преустанови и ако е необходимо, да се вземат подходящи мерки.

Исхемичен колит

Съобщени са случаи на исхемичен колит при употреба на псевдоефедрин. Ако се появи внезапна коремна болка, ректално кървене или други симптоми на исхемичен колит, трябва да се преустанови приемът на псевдоефедрин и да се потърси консултация с лекар.

Исхемична оптична невропатия

Получени са съобщения за случаи на исхемична оптична невропатия при псевдоефедрин. Псевдоефедрин трябва да се прекрати, ако се появи внезапна загуба на зрение или намаление на зрителната острота, като скотома.

Маскиране на симптомите на подлежащите инфекции

Ибупром Синус 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 Ибупром Синус 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.

Пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към фруктоза, глюкозо-галактозна малабсорбция или захарозо-изомалтазен дефицит не трябва да приемат това лекарство.

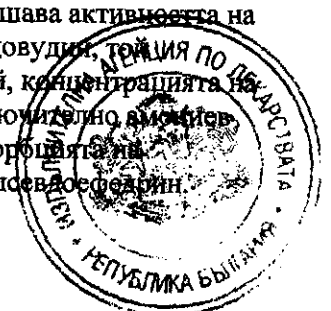
Багрилото сънсет жълто (E 110) може да причини алергични реакции.

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

Това лекарство съдържа 0,005 mg натриев бензоат във всяка таблетка.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Едновременното прилагане с други НСПВС може да засили нежеланите реакции. Ибупрофен увеличава токсичността на метотрексат. Комбинацията с кортикостероиди увеличава риска от стомашно-чревни кръвоизливи. Може да се потисне действието на диуретиците (бримкови диуретици и тиазиди) и антихипертензивни продукти, като инхибитори на ангиотензин конвертиращ ензим (АСЕ инхибитори), блокери на бета-адренергични рецептори и метилдопа. При едновременна употреба на дигиталисови гликозиди може да предизвика сърдечни аритмии. Той усилва ефектите на други симпатомиметични средства. Когато се използва с моноаминооксидазни (МАО) инхибитори и трициклически антидепресанти, може да предизвика значително повишение на артериалното кръвно налягане. Продуктът повишава активността на антикоагулантите от кумариновата група. При пациенти, лекувани със зидовудин, той удължава времето на кървене. Когато се употребява едновременно с литий, концентрацията на литий в плазмата се повишава. Субстанциите, алкализирани урината (включително амфотерин бикарбонат, натриев бикарбонат, неутрализиращи средства) увеличават реабсорбцията на псевдоефедриновите метаболити в бъбреците и удължават действието на псевдоефедрин.



Ацетилсалицилова киселина

Едновременната употреба на ибупрофен и ацетилсалицилова киселина обикновено не е препоръчителна поради повишения риск от нежелани реакции.

Експерименталните данни показват, че при едновременен прием ибупрофен може конкурентно да потиска ефекта на ниски дози ацетилсалицилова киселина по отношение на тромбоцитната агрегация. Въпреки че има неясноти относно екстраполирането на тези данни към клиничния случай, не може да се изключи възможността редовната дългосрочна употреба на ибупрофен да намалява кардиопротективния ефект на ацетилсалицилова киселина в ниски дози. Смята се, че няма голяма вероятност обичайната употреба на ибупрофен да доведе до клинично значим ефект (вж. точка 5.1).

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Ибупром Синус не трябва да се прилага по време на бременност и в периода на кърмене.

От 20-ата седмица от бременността нататък употребата на ибупрофен може да причини олигохидрамнион, дължащ се на нарушение на бъбречната функция на фетуса. Това може да се появи скоро след започване на лечението и обикновено е обратимо при прекратяването му. Докладвани са случаи на стесняване на ductus arteriosus след лечение във втория триместър, повечето от които се възстановяват след прекратяване на лечението. По време на първия и втория триместър на бременността ибупрофен не трябва да се прилага, освен ако е абсолютно необходимо. Ако ибупрофен се използва от жена, която се опитва да зачене, или по време на първия и втория триместър на бременността, дозата трябва да се поддържа възможно най-ниска, а продължителността на лечението — възможно най-кратка. След експозиция на ибупрофен в продължение на няколко дни от 20-ата гестационна седмица нататък трябва да се обмисли антенатално проследяване за олигохидрамнион и стесняване на ductus arteriosus. Употребата на ибупрофен трябва да се преустанови, ако се установи олигохидрамнион или стесняване на ductus arteriosus.

През третия триместър на бременността всички инхибитори на синтеза на простагландин могат да изложат плода на:

- кардиопулмонална токсичност (с преждевременно стесняване/затваряне на ductus arteriosus и белодробна хипертония)

- бъбречна дисфункция (вж. по-горе);

майката и новороденото, в края на бременността, на:

- възможно удължаване на времето на кървене, антиагрегиращ ефект, който може да се прояви дори при много ниски дози;

- инхибиране на контракциите на матката, водещо до забавено или удължено раждане.

Следователно ибупрофен е противопоказан по време на третия триместър на бременността (вж. точки 4.3 и 5.3).

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

При употреба на този продукт трябва да се внимава специално при шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

При оценка на нежеланите лекарствени реакции се използват следните данни за тяхната честота:

Много често ($\geq 1/10$)



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 ($< 1/10\,000$)

С неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка)

Нежеланите лекарствени реакции от всяка група са подредени в низходяща градация по отношение на тяхната тежест.

Ибупрофен

Списъкът от следните нежелани лекарствени реакции включва всички известни нежелани лекарствени реакции, свързани с лечението с ибупрофен, включително тези, отбелязани при пациенти с ревматизъм, провеждали дълготрайно, във високи дози лечение. Данните за честотата, освен много редки съобщения, се основават на краткотрайното приложение на максимални дневни дози от 1 200 mg ибупрофен за приложени орално лекарствени форми или 1 800 mg като супозитории.

При следните нежелани лекарствени реакции трябва да се има предвид, че те са предимно дозозависими и варират индивидуално.

Най-често наблюдаваните нежелани лекарствени реакции са от страна на храносмилателната система. Възможна е поява на пептични язви, перфорация или кървене от стомашно-чревните пътища, понякога с фатален изход, особено при пациенти в напреднала възраст (вж. точка 4.4). След прием са отбелязани гадене, повръщане, диария, много газове в червата, запек, диспепсия, коремни болки, мелена, хематемеза, улцеративен стоматит, обостряне на колит или болест на Crohn (вж. точка 4.4). По-рядко са наблюдавани случаи на гастрит.

Рискът от кървене от стомашно-чревните пътища е зависим от дозировката и продължителността на приложение.

Във връзка с провеждано лечение с нестероидни противовъзпалителни средства се съобщава за поява на отоци, хипертония и сърдечна недостатъчност.

Клиничните проучвания показват, че употребата на ибупрофен, особено във високи дози (2400 mg/ден), може да е свързана с повишаване на риска от артериални тромботични събития (например инфаркт на миокарда или инсулт) (вижте точка 4.4).

Инфекции и инфестации

Много редки: Съобщава се за обостряне на инфекциозно свързани възпаления (напр. развитие на некротизиращ васкулит) при употреба на нестероидни противовъзпалителни средства. Това вероятно е свързано с механизма на действие на нестероидните противовъзпалителни средства. При поява на признаци за инфекция или влошаване по време на употребата на ибупрофен 200 mg, пациентът трябва да бъде посъветван незабавно да се консултира с лекар. Трябва да се прецени дали има показания за провеждане на антиинфекционно (антибиотично) лечение. При употреба на ибупрофен са наблюдавани симптоми на асептичен менингит с вратна ригидност, главоболие, гадене, повръщане, фебрилитет или замъглено съзнание. Налице е предразположение при пациентите с автоимунни заболявания (SLE, смесени колагенози).

Нарушения на кръвта и лимфната система

Много редки: нарушена хемопоеза (анемия, левкопения, тромбоцитопения, панцитопения, агранулоцитоза). Първите признаци може да бъдат: фебрилитет, възпаление на гърлото, повърхностни лезии на устната кухина, грипозни симптоми, тежко изтощение, кървене от носа и кожата. В подобни случаи, пациентът трябва да бъде посъветван незабавно да преустанови приема на лекарствения продукт, да избягва самолечението с аналгетици или антипиретици и да се консултира с лекар.

По време на дълготрайно лечение редовно трябва да се проследява броят на кръвните клетки.

Нарушения на имунната система

Нечести: реакции на свръхчувствителност с кожни обриви и сърбеж, както и остри пристъпи (възможно е и понижаване на кръвното налягане).



Много редки: тежки генерализирани реакции на свръхчувствителност. Възможно е да се изияват с оток на лицето, езика и ларинкса, задух, тахикардия, хипотония до животозастрашаващ шок.

Обостряне на астма и бронхоспазм.

Пациентът трябва да бъде информиран, при поява на подобни симптоми, незабавно да преустанови приема на лекарствения продукт и да се консултира с лекар.

Психични нарушения

Много редки: психични реакции, депресия.

Нарушения на нервната система

Нечести: главоболие, замаяност, безсъние, възбуда, раздразнителност или умора.

Нарушения на очите

Нечести: нарушения на зрението.

Нарушения на ухото и лабиринта

Редки: шум в ушите.

Сърдечни нарушения

Много редки: палпитации, сърдечна недостатъчност, миокарден инфаркт.

Съдови нарушения

Много редки: артериална хипертония.

Стомашно-чревни нарушения

Чести: стомашно-чревни разстройства, като стомашни киселини, коремна болка, гадене, повръщане, много газове в червата, диария, запек и леки кръвозагуби от стомашно-чревните пътища, които в единични случаи може да причинят анемия.

Нечести: стомашно-чревни язви, при които са възможни кървене и перфорация. Улцеративен стоматит, обостряне на колит или болест на Crohn (вж. точка 4.4), гастрит.

Много редки: езофагит, панкреатит, развитие на чревни, мембраноподобни структури.

Пациентът трябва да бъде уведомен да преустанови приема на лекарствения продукт и незабавно да се консултира с лекар при поява на силна болка в горната коремна половина, мелена или хематемеза.

Хепатобилиарни нарушения

Много редки: нарушена функция на черния дроб, чернодробно увреждане, особено при продължително лечение, чернодробна недостатъчност, остър хепатит.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

Много редки: булозни реакции, включително Синдром на Stevens Johnson и токсична некролиза на епидермиса. В единични случаи, по време на варицела може да възникнат тежки кожни инфекции с усложнения от страна на меките тъкани (вж. също "Инфекции и инфестации").

С неизвестна честота: лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (DRESS синдром), остра генерализирана екзантематозна пустулоза (AGEP), реакции на фоточувствителност.

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

Редки: папиларна некроза, повишени нива на пикочната киселина.

Много редки: образуване на отоци с артериална хипертония или бъбречна недостатъчност, нефрозен синдром, интерстициален нефрит, които може да бъдат съпроводени с остър бъбречен синдром. По тази причина трябва редовно да се контролира бъбречната функция.



Псевдофедрин хидрохлорид

Поради малкото съобщения за нежелани лекарствени реакции, свързани с употребата на псевдофедрин хидрохлорид, не е възможно точно определяне на честотата на тяхната поява, но вероятно тези реакции са редки или много редки.

Нарушения на метаболизма и храненето

С неизвестна честота: повишена жажда.

Психични нарушения

С неизвестна честота: халюцинации (особено при деца).

Нарушения на нервната система

С неизвестна честота: безсъние, неспокойство, възбуда, замаяност, мускулна слабост, тремор.

Сърдечни нарушения

С неизвестна честота: аритмия, тахикардия.

Стомашно-чревни нарушения

С неизвестна честота: диспепсия, нарушена стомашно-чревна функция, гадене, повръщане, сухота в устата, исхемичен колит.

Нарушения на кожата и подкожната тъкан

С неизвестна честота: зачервяване, обрив, обилно изпотяване, тежки кожни реакции, включително остра генерализирана екзантематозна пустулоза (AGEP).

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища

С неизвестна честота: задръжка на урината (предимно при мъже).

Нарушения на очите

С неизвестна честота: исхемична оптична невропатия

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 Изпълнителната агенция по лекарствата, ул. "Дамян Груев" № 8, 1303 София, тел.: +359 2 8903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9 Предозиране

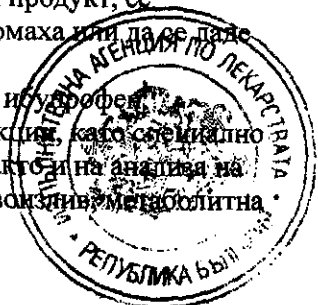
В случай на остро предозиране, нежеланите реакции зависят от количеството прието лекарствено средство и отрязъка от време след приема. Първите нежелани симптоми, които обичайно се появяват са: гадене, повръщане, главоболие, вертиго, болка в епигастриума и сънливост. В случай на значително предозиране (над 400 mg/kg телесно тегло) може да се появи кома, хипотония, хиперкалиемия със сърдечна аритмия, висока температура, дихателни смущения и бъбречно увреждане.

При сериозно отравяне може да настъпи метаболитна ацидоза.

След продължителна употреба много рядко може да се появи хемолитична анемия, гранулоцитопения и тромбоцитопения.

Ако не е минал повече от час след острото предозиране на лекарствения продукт, се препоръчва да се предизвика повръщане, да се извърши промивка на стомаха или да се даде активен въглен.

Няма специфичен антидот, нито специфично лечение за предозиране на псевдофедрин хидрохлорид. Симптоматичното лечение се състои в мониториране на жизнените функции, като специално внимание се обръща на мониторирането на кръвното налягане и ЕКГ, както и на анализа на признаците и симптомите, показващи евентуален стомашно-чревен кръвоизлив и метаболитна



ацидоза и нарушения на ЦНС. В случай на силно безпокойство, предизвикано от псевдоефедрин и ако няма противопоказания, типични за бензодиазепини, е възможно прилагане на средство от последната група.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Противовъзпалителни, аналгетични, антипиретични средства, АТС код: M01AE51.

Ибупром Синус е лекарствено средство с аналгетични, противовъзпалителни и антипиретични ефекти. Той намалява отока на носната лигавица и количеството на секрета. Той изчиства носа и околоносните синуси.

Ибупрофен

Механизъм на действие

Ибупрофен (производно на пропионовата киселина) спада към нестероидните противовъзпалителни средства (НСПВС). Терапевтичните ефекти се осъществяват посредством инхибиране на простагландиновата синтеза.

Фармакодинамични ефекти

Ибупрофен има аналгетично, понижаващо телесната температура и противовъзпалително действие. Терапевтичният ефект при краткотрайно лечение започва да се проявява около 30 минути след приема.

Клинична ефикасност и безопасност

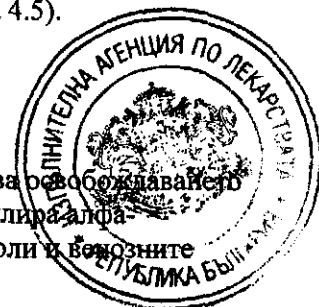
Данните от клиничните изследвания показват, че при едновременен прием на ибупрофен с малка доза ацетилсалицилова киселина, може да се намали ефектът на ацетилсалициловата киселина, който се изразява в потискане на тромбоцитната агрегация. При едно от проучванията, след прием на еднократна доза от 400 mg ибупрофен, в продължение на 8 часа или 30 минути след прием на ацетилсалицилова киселина с бързо освобождаване (81 mg), било отчетено намаляване на ефекта на ацетилсалициловата киселина върху образуването на тромбосан или тромбоцитната агрегация. Поради ограничените данни, както и затрудненията в интерпретацията на *in vivo* проучванията, не е възможно да се направят твърди заключения отнасящи се за редовна употреба на ибупрофен, докато при краткотрайна употреба на ибупрофен не се очакват клинично значими взаимодействия.

Експерименталните данни показват, че при едновременен прием ибупрофен може конкурентно да потиска ефекта на ниски дози ацетилсалицилова киселина по отношение на тромбоцитната агрегация. Някои фармакодинамични проучвания показват, че когато се приемат единични дози ибупрофен 400 mg до 8 ч. преди или 30 мин. след прием на ацетилсалицилова киселина с незабавно освобождаване (81 mg), се наблюдава намаляване на ефекта по отношение на образуването на тромбосан или тромбоцитната агрегация. Въпреки че има неясноти относно екстраполирането на тези данни към клиничния случай, не може да се изключи възможността редовната дългосрочна употреба на ибупрофен да намалява кардиопротективния ефект на ацетилсалицилова киселина в ниски дози. Смята се, че няма голяма вероятност обичайната употреба на ибупрофен да доведе до клинично значим ефект (вижте точка 4.5).

Псевдоефедрин

Механизъм на действие

Псевдоефедрин е симпатикомиметично лекарствено средство. Предизвиква освобождаването на норадреналин от симпатиковите нервни окончания и директно стимулира алфа-рецепторите в клетките на гладката мускулатура на резистентните артериоли и венозните



синуси на носната лигавица и параназалните синуси. Симпатикомиметичното действие се дължи на псевдоефедрин и на неговия активен метаболит норпсевдоефедрин.

Фармакодинамични ефекти

След прилагане на псевдоефедрин се установява намаляване на отока и свиване на назалната лигавица.

5.2 Фармакокинетични свойства

Ибупрофен

Абсорбция

След орално приложение ибупрофен се резорбира бързо и добре в стомашно-чревния тракт – една част в стомаха, а друга част в тънките черва. Бионаличността на рацемичната форма на ибупрофен е 71%.

Максимални плазмени концентрации се достигат за 1 до 2 часа след приложението.

Разпределение

Ибупрофен се свързва в повече от 90% с плазмените протеини. Разпространява се добре, макар и за по-дълго време, в ставните кухини, достигайки максимални концентрации в синовиалната течност след 7 до 8 часа. Полуживотът на ибупрофен е около 2 часа.

Биотрансформация

Ибупрофен се метаболизира в черния дроб в карбоксиларни и хидроксилирани производни.

Елиминиране

До 24 часа от приема на последната доза, около 75% се екскретират чрез бъбреците като неактивни метаболити – като карбоксиларни производни на пропионова киселина (2-(p-(2-хидроксиметилпропил) фенил) - около 37%, като хидроксилирани производни на пропионова киселина (2-(p-(2-хидроксиметилпропил)фенил) - около 25% и в непроменен вид - около 14%.

Псевдоефедрин

Абсорбция

Псевдоефедрин се абсорбира лесно от храносмилателния тракт. Максимални плазмени концентрации се достигат след 1,5-2 часа.

Разпределение

Псевдоефедрин се разпределя бързо в целия организъм.

Биотрансформация

Псевдоефедрин се метаболизира главно в черния дроб до норпсевдоефедрин (10-30%).

Елиминиране

Псевдоефедрин се екскретира (70-90%) в урината в непроменен вид. Биологичният полуживот на псевдоефедрин е 9-16 часа. Плазменият полуживот на псевдоефедрин значително се намалява чрез подкиселяване на урината и се повишава чрез алкализиране.

Комбинация между ибупрофен и псевдоефедрин

Ибупрофен и псевдоефедрин не оказват взаимно влияние върху тяхната бионаличност и не променят други фармакокинетични параметри. Продуктът има ефективност от 4 до 6 часа.

Абсорбция

След орално приложение, активното вещество се резорбира бързо и добре в стомашно-чревния тракт – една част в стомаха, а друга част в тънките черва. S(+) ибупрофен (дексипрофен) е активният енантиомер, R(-) ибупрофен е предшественик на активното вещество, което "ин-виво" отчасти се метаболизира /~60%/ до активното вещество. Бионаличността на рацемичната



форма на ибупрофен е 71%. Симпатикомиметичната активност се дължи на свойствата на псевдоефедрина и активния му метаболит норпсевдоефедрин.

Лечебният ефект се проявява 15-30 минути след приема. Двете субстанции достигат максимални плазмени концентрации за 1,5-2 часа след приложението. Времето на полуживот на ибупрофен е около 2 часа, а на псевдоефедрин – 9-16 часа, но има връзка между времето на полуживот на псевдоефедрин и pH на урината, при алкализиране на урината може да се увеличи до 50 часа.

Активните съставки се метаболизират в черния дроб: ибупрофен до карбоксилани и хидроксилирани производни и псевдоефедрин до норпсевдоефедрин (10 -30%).

Елиминирание

След 24 часа от приема на последната доза 70-90% от активните съставки се елиминират. Над 75% от ибупрофен се екскретират чрез бъбреците като неактивни метаболити – като карбоксилани производни на пропионова киселина (2- (p-(α -карбоксипропил) фенил) около 37%, като хидроксилирани производни на пропионова киселина (2-(p-(2-хидроксиметилпропил) фенил) около 25% и в непроменен вид около 14%. Псевдоефедрин се елиминира в урината (70-90%) в непроменен вид.

Ибупрофен и псевдоефедрин не влияят взаимно върху бионаличността си, не променят другите фармакокинетични показатели. Ефективността на продукта продължава 4-6 часа.

5.3 Предклинични данни за безопасност

При предклинични изпитвания при зайци и плъхове, прилагането на ибупрофен при бременни животни, в дози неколккратно по-високи от тези, използвани при хора, е било установено, че не предизвиква статистически значимо увеличение на малформациите по отношение на плода в сравнение с контролна група. Отсъствието на тератогенни ефекти е наблюдавано и при мишки C57BL/6J, при които е прилаган ибупрофен в количество над 100 пъти по-високо от дозите, прилагани при хора.

Няма литературни данни за изпитвания на тератогенността на псевдоефедрин при животни.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Състав на сърцевината

целулоза на прах (P-100),
целулоза на прах (F-150),
царевично нишесте,
нишесте, прежелатинизирано,
гуарова гума,
талк,
кроскармелоза натрий,
кросповидон (тип А),
силициев диоксид, колоиден хидратиран,
хидрогенирано растително масло.

Състав на обвивката

Хидроксипропилцелулоза, макрогол 400, талк, желатин, захароза, сладкарска захар, каолин, калциев карбонат, арабска гума, изсушена, царевично нишесте, Опаглос прозрачен (карнаубски восък, пчелен восък, бял, SDA 3A, алкохол).

Опалукс кафяв AS-16518 съдържа: захароза, титанов диоксид (E 171), съставителят РСЕ лак (E 110), алура червен АС лак (E 129), повидон, натриев бензоат (E 211), индигокарминов лак (E 132).

Печатарско мастило



Опакод черен съдържа: шеллак, железен оксид, черен, N-бутилов алкохол, изопропилов алкохол, амониев хидроксид, пропиленгликол.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо

6.3 Срок на годност

Саше - 2 години.

Блистери в картонена кутия – 3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

Да се съхранява под 25°C.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

2 обвити таблетки – саше, съдържащо 2 таблетки

6 обвити таблетки – 3 сашета по 2 таблетки в картонена кутия. Сашета от ламинат (хартия/PE/Al/PE)

6 обвити таблетки в блистер от PVC/Al фолио

12 обвити таблетки в блистер от PVC/Al фолио

24 обвити таблетки – 2 блистера от PVC/Al фолио по 12 таблетки

Блистери в картонена кутия.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

US Pharmacia Sp. z o.o.

Ziębicka 40

50-507 Wrocław, Полша

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

20080222

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

Дата на първо разрешаване: 30 октомври 2008 г.

Дата на последно подновяване: 14 октомври 2013 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

10/2022

