

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

РУПАЛИН 200 mg филмирани таблетки
RUPALYN 200 mg film-coated tablets

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка филмирана таблетка съдържа 200 mg ибупрофен (еквивалентно на 342 mg ибупрофен лизин (ibuprofen lysine)).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Филмирана таблетка

Бледо червена, кръгла, двойноизпъкнала филмирана таблетка, гладка от двете страни с диаметър на ядрото 11 mm.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Показан за симптоматично облекчение на лека до умерена болка като главоболие, зъбобол, болки в мускулите и менструални болки.

Използва се също за симптоматично лечение на температура.

Рупалин 200 mg е показан при възрастни и юноши с телесно тегло 40 kg и повече (на възраст над 12 години).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Най-ниската ефективна доза трябва да бъде използвана за възможно най-краткия период, необходим за облекчаване на симптомите (вижте точка 4.4).

Дозировка

Възрастни и юноши с телесно тегло 40 kg и повече (на възраст над 12 години)

Началната доза е 200 mg до 400 mg (1 до 2 таблетки), след това, ако е необходимо, може да се повтори на всеки 6 часа.

Да не се превишава максималната дневна доза от 1200 mg (6 таблетки) за 24 часа.

Ако този лекарствен продукт е необходим за повече от 3 дни в случай на температура и 5 дни за лечение на болка или ако симптомите се влошат, пациентът трябва да бъде посъветван да се посъветва с лекар.

Ако този лекарствен продукт е необходим при юноши (на възраст на и над 12 години) за повече от 3 дни или ако симптомите се влошат е необходима консултация с лекар.

Пациенти в старческа възраст

Не се налага специфично адаптиране на дозата.

Пациенти с бъбречно/ чернодробно увреждане

ИЗПОЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20200252
Разрешение №	70977 / 20-01-2026
BG/MA/MP -	
Одобрение №	



При пациенти с леко до умерено бъбречно или чернодробно увреждане трябва да се използва най-ниската ефективна доза и е необходимо внимание (за пациенти с тежко бъбречно или чернодробно заболяване вижте точка 4.3).

Начин на приложение

За перорално приложение, за предпочитане след хранене, приет с чаша вода.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Анамнеза за гастроинтестинално кървене или перфорация, свързани с предшестващо лечение с НСПВС.

Активна или анамнеза за рекурентна пептична язва/ кръвоизлив (два или повече отделни епизода на доказана улцерация или кървене).

Пациенти с известна анамнеза за реакции на свръхчувствителност (напр. астма, бронхоспазъм, ринит, ангиоедем или уртикария) в отговор на, ацетилсалицилова киселина или други НСПВС. Тежка чернодробна недостатъчност.

Тежка бъбречна недостатъчност.

Тежка сърдечна недостатъчност (Клас IV по NYHA).

Нарушения в коагулацията (със склонност към повишено кървене), мозъчен кръвоизлив или друг активен кръвоизлив.

Тежка дехиратация (причинена от повръщане, диария или недостатъчен прием на течности).

Последните три месеца от бременността.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Нежеланите реакции могат да бъдат сведени до минимум чрез употребата на най-ниската ефективна доза за възможно най-краткия период от време, необходим за овладяване на симптомите (вижте точка 4.2 и Стомашно-чревни и Сърдечно-съдови рискове по-долу).

Необходимо е внимание при пациенти с:

- Пациенти с анамнеза за хипертония или конгестивна сърдечна недостатъчност;
- Установена исхемична болест на сърцето;
- Периферна артериална болест и/или мозъчно-съдова болест;
- Улцерозен колит, болест на Крон;
- Системен еритематозен лупус (СЛЕ) или други аутоимунни заболявания.

Сърдечно-съдови и мозъчно-съдови ефекти

Клиничните проучвания показват, че употребата на ибупрофен, особено във високи дози (2400 mg/ дневно) може да бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (например инфаркт на миокарда и инсулт). Като цяло епидемиологичните проучвания не предполагат, че ниските дози ибупрофен (≤ 1200 mg/ дневно) се свързват с повишен риск от артериални тромботични събития.

Пациентите с неконтролирана хипертония, конгестивна сърдечна недостатъчност (NYHA II-III), установена исхемична болест на сърцето, периферна артериална болест и/или мозъчно-съдова болест трябва да бъдат лекувани с ибупрофен само след внимателна преценка, а високите дози (2400 mg/ дневно) трябва да бъдат избягвани.

Необходима е внимателна преценка преди започване на продължително лечение при пациенти с рискови фактори за сърдечно-съдови събития (напр. хипертония, хиперлипидемия, захарен диабет, тютюнопушене), особено, ако са необходими високи дози ибупрофен (2400 mg/ дневно).

При пациенти, лекувани с ибупрофен, се съобщава за случаи на синдром на Коупи. Синдромът на Коупи се определя като вторични сърдечно-съдови симптоми на алергична реакция или реакция на свръхчувствителност, свързани с констрикция на коронарните артерии, потенциално водеща до миокарден инфаркт.



Необходимо е внимание (обсъждане с лекар или фармацевт) преди започване на лечение при пациенти с анамнеза за хипертония и/или сърдечна недостатъчност, тъй като задържане на течности и едем са съобщавани във връзка с лечение с НСПВС.

Стомашно-чревни ефекти

При пациенти в старческа възраст е налице повишена честота на нежеланите реакции към НСПВС, особено стомашно-чревно кървене и перфорация, които могат да бъдат фатални (вижте точка 4.2).

Стомашно-чревно кървене, язва и перфорация, които могат да бъдат фатални са съобщавани при всички НСПВС по всяко време от лечението, със или без предупредителни симптоми или предходна анамнеза за сериозни стомашно-чревни събития.

Рискът от стомашно-чревно кървене, язва или перфорация е по-висок при повишаване на дозата на НСПВС, при пациенти с анамнеза за язва, особено ако е усложнена от кървене или перфорация (вижте точка 4.3) и при пациенти в старческа възраст. Тези пациенти трябва да започват лечение с най-ниската възможна доза. При тези пациенти трябва да се обмисли комбинирано лечение с протективни агенти (като мизопростол или инхибитори на протонната помпа), както и при пациенти, при които е необходим приемът на ниски дози ацетилсалицилова киселина или други лекарства, които могат да повишат стомашно-чревния риск (вижте по-долу и точка 4.5).

Необходимо е внимание при пациенти, които приемат съвместно лекарства, които могат да повишат риска от язва и кървене, като перорални кортикостероиди, антикоагуланти като варфарин, селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина или антитромботични агенти като ацетилсалицилова киселина (вижте точка 4.5).

При поява на стомашно-чревно кървене или язва при пациенти, които приемат ибупрофен, лечението трябва да бъде преустановено.

НСПВС трябва да бъдат прилагани с внимание при пациенти с анамнеза за стомашно-чревно заболяване (улцерозен колит, болест на Крон), тъй като тяхното състояние може да се обостри (вижте точка 4.8).

Чернодробни ефекти

Чернодробната функция трябва да бъде внимателно проследявана при пациенти, лекувани с ибупрофен, които съобщават симптоми, съвместими с чернодробно увреждане (анорексия, гадене, повръщане, жълтеница) и/или отклонения в чернодробната функция (трансаминази, билирубин, алкална фосфатаза, гама-ГТ).

При наличие на стойности по-високи от 2 пъти над нормалната горна граница на трансаминазите, конюгиран билирубин или алкална фосфатаза, лекарственият продукт трябва да бъде спрян незабавно и трябва да бъдат извършени изследвания за изясняване на находките. Трябва да се избягва повторно започване на ибупрофен.

Бъбречни ефекти

В началото на лечението ибупрофен, както и останалите НСПВС, трябва да бъде прилаган с внимание при пациенти със значима дехидратация.

Необходимо е внимание при пациенти с бъбречно, сърдечно или чернодробно увреждане, тъй като бъбречната функция може да се влоши.

Тежки кожни нежелани реакции (ТКНР)

Тежки кожни нежелани реакции (ТКНР), включително ексфолиативен дерматит, еритема мултиформе, синдром на Stevens-Johnson, токсична епидермална некролиза, и лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (синдром DRESS) и остра генерализирана екзантематозна пустулоза (ОГЕП), които могат да бъдат животозастрашаващи или да доведат до летален изход, се съобщават във връзка с употребата на ибупрофен (вж. раздел 4.8). Повечето от тези реакции настъпват през първия месец.

При поява на признаци и симптоми, показателни за тези реакции, ибупрофен трябва да бъде спряно незабавно и да се обмисли друго лечение (според необходимостта).

Ефекти на тромбоцитна агрегация



Ибупрофен, както и останалите НСПВС, може да инхибира тромбоцитна агрегация и да удължи времето на кървене при здрави пациенти.

Зрителни нарушения

В случай на зрителни нарушения, които се появят по време на лечението с ибупрофен, лекарственият продукт трябва да бъде спрян незабавно и да бъде извършен подробен офталмологичен преглед.

Системен еритематозен лупус

Трябва да бъде използван с внимание при пациенти със системен еритематозен лупус и смесено заболяване на съединителната тъкан, поради повишен риск от асептичен менингит (вижте точка 4.8).

Респираторни ефекти

Бронхоспазмът може да преципитира при пациенти със симптоми на или анамнеза за бронхиална астма, хроничен ринит, хроничен синусит, назални полипи и/ или алергични заболявания.

Други ефекти

Съвместната употреба на ибупрофен с други НСПВС, включително селективни инхибитори на циклооксигеназа-2, трябва да бъде избягвана поради потенциал за адитивни ефекти.

Маскиране на симптомите на подлежаща инфекция

Ибупрофен може да маскира симптомите на инфекция, което може да доведе до забавено започване на подходящо лечение и, поради това, влошаване на изхода от инфекцията. Това е наблюдавано при бактериална пневмония, придобита в обществото, и бактериални усложнения от варицела. Когато ибупрофен се прилага при температура и за облекчаване на болката във връзка с инфекция се препоръчва проследяване на инфекцията. При извънболнични условия пациентът трябва да се посъветва с лекар, ако симптомите продължат или се влошат.

По време на лечението не трябва да бъде приеман алкохол.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Ибупрофен е противопоказан в комбинация с:

Мифамуртид: При високи дози НСПВС съществува риск от намалена ефикасност на мифамуртид.

Ибупрофен трябва да се избягва в комбинация с:

Ацетилсалицилова киселина: Съвместното приложение на ибупрофен и ацетилсалицилова киселина обичайно не се препоръчва. Експериментални данни показват, че ибупрофен може конкурентно да потисне ефекта на ниски дози ацетилсалицилова киселина върху тромбоцитната агрегация, когато се приемат едновременно. Въпреки че има несигурност при екстраполирането на тези данни от клинични случаи, не може да се изключи възможността редовния, продължителен прием на ибупрофен да намали кардиопротективния ефект на ниски дози ацетилсалицилова киселина. Не се очаква клинично значим ефект при нередовна употреба на ибупрофен (вижте точка 5.1).

Други НСПВС: Съвместната употреба на две или повече НСПВС, включително селективни инхибитори на циклооксигеназа-2, трябва да бъде избягвана поради потенциал за адитивни ефекти.

Ибупрофен трябва да се прилага с внимание в комбинация с:

Перорални антикоагуланти: НСПВС могат да засилят ефекта на антикоагулантите като варфарин (вижте точка 4.4).



Нефракционирани хепарини, хепарини с ниско молекулно тегло и подобни (в лечебни дози и/или при пациенти в старческа възраст): Повишен риск от кървене (обостряне на гастродуоденалната лигавица от НСПВС). Ако съвместно приложение не може да се избегне, се препоръчва внимателно клинично наблюдение.

Антихипертензивни лекарства (АСЕ инхибитори, ангиотензин-II антагонисти, бета-блокери): Риск от остра бъбречна недостатъчност при рискови пациенти (хора в старческа възраст, дехидратация, комбинирано лечение с диуретици, нарушена бъбречна функция), чрез намаляване на гломерулната филтрация (инхибиране на вазодилаторните простагландини, дължащи се на НСПВС). Тези ефекти обикновено са обратими. Освен това, намаляване на антихипертензивния ефект. Пациентите трябва да бъдат адекватно хидратирани и трябва да се обмисли проследяване на бъбречната функция след започване на съвместно лечение, както и периодично след това.

Диуретици: Риск от остра бъбречна недостатъчност при рискови пациенти (възрастни и/или дехидратирани пациенти) чрез намаляване на гломерулната филтрация (инхибиране на вазодилаторните простагландини поради НСПВС). Освен това, намаляване на антихипертензивния ефект. Пациентите трябва да бъдат адекватно хидратирани и трябва да се обмисли проследяване на бъбречната функция след започване на съпътстващата терапия и периодично след това.

Кортикостероиди: Съвместното приложение на кортикостероиди и ибупрофен може да повиши риска от гастро-интестинални язви или кървене (вижте точка 4.4).

Пентоксифин: Повишен риск от кървене.

Антитромбоцитни агенти и селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина (СИОЗС): Съвместното приложение на НСПВС и антитромбоцитни агенти или селективни инхибитори на обратното захващане на серотонина повишава риска от стомашно-чревно кървене (вижте точка 4.4).

Дефезиракс: Повишен риск от стомашно-чревни язви и кървене.

Сърдечни гликозиди: НСПВС могат да обострят сърдечната недостатъчност, да намалят гломерулната филтрация и да повишат плазмените нива на гликозидите.

Литий: Ибупрофен, както и останалите НСПВС, не трябва да бъдат използвани с литий. Има потенциал за повишаване на плазмените нива на литий.

Метотрексат: Ибупрофен, както и останалите НСПВС, не трябва да бъдат използвани с метотрексат. Има потенциал за повишаване на плазмените нива на метотрексат.

Пеметрексед (пациенти с ниска до умерена бъбречна функция, креатининов клирънс между 45 ml/min и 80 ml/min): Риск от повишена токсичност на пеметрексед (намален бъбречен клирънс от НСПВС).

Никорандил: Повишен риск от язва и стомашно-чревно кървене.

Циклоспорин: Съвместното приложение на НСПВС и циклоспорин създава повишен риск от нефротоксичност.

Мифепристон: НСПВС не трябва да се използват в рамките на 8-12 дни след мифепристон, тъй като НСПВС могат да намалят ефекта от мифепристон.

Такролимус: Съвместният прием на НСПВС и такролимус създава повишен риск от нефротоксичност.



Зидовудин: Има доказателства за повишен риск от хемартроза и хематом при HIV (+) хемофилици, които получават съвместно лечение със зидовудин и ибупрофен.

Хинолонови антибиотици: Данните при животни показват, че НСПВС може да повиши риска от гърчове, свързани с хиноловите антибиотици. При пациентите, които приемат НСПВС и хинолони, може да е налице повишен риск от развиване на гърчове.

Кобиметиниб: Повишен риск от кървене. Пациентите трябва да бъдат клинично наблюдавани.

Тенофовир дизопроксил: Риск от повишена нефротоксичност на тенофовир, особено при високи дози от противовъзпалителното средство или при наличие на рискови фактори за бъбречна недостатъчност. В случай на комбинация се препоръчва проследяване на бъбречната функция.

Ибупрофен може да взаимодейства също и със следните лекарства:

- Холестирамин
- Тиклопидин
- Аминогликозиди
- Гинко билоба
- СУР2С9 инхибитори
- Перорални антидиабетни продукти (сулфонилурея)
- Фенитоин
- Пробенецид или сулфинпиразон.

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Инхибирането на простагландиновия синтез може да повлияе неблагоприятно бременността и/или ембрионалното/феталното развитие. Данните от епидемиологични проучвания показват повишен риск от спонтанен аборт и сърдечни малформации и гастросхизис след прием на инхибитор на простагландиновия синтез в ранните етапи на бременността. Абсолютният риск от сърдечно-съдови малформации е повишен от 1% до приблизително 1,5%. Счита се, че рискът се повишава с повишаване на дозата и продължителността на лечение. При животни приложението на инхибитор на простагландиновия синтез води до повишена пре- и пост-имплантационна загуба и ембрио-фетална смъртност. В допълнение, при животни, на които е прилаган инхибитор на простагландиновия синтез по време на органогенезата е съобщавана и повишена честота на различни малформации, включително сърдечно-съдови.

От 20-та седмица на бременността нататък употребата на ибупрофен може да причини олигохидрамнион, дължащ се на нарушение на бъбречната функция на фетуса. Това може да се случи скоро след започване на лечението и обикновено е обратимо при прекратяване му. В допълнение, има съобщения за стесняване на ductus arteriosus след лечение през втория триместър, повечето от които отзвучават след прекратяване на лечението. Поради това, ибупрофен не трябва да бъде прилаган през първия и втория триместър на бременността, освен ако не е категорично необходимо. Ако ибупрофен се използва от жени, които се опитват да забременеят или през първия и втория триместър от бременността, дозата трябва да бъде възможно най-ниска, а продължителността на лечение възможно най-кратка.

Аntenатално наблюдение за олигохидрамнион и стесняване на дуктус артериозус трябва да се обмисли след излагане на ибупрофен в продължение на няколко дни от 20-та гестационна седмица нататък. Ибупрофен трябва да се прекрати, ако се установи олигохидрамнион или стесняване на дуктус артериозус.

През третия триместър от бременността всички инхибитори на простагландиновия синтез могат да изложат на риск:

- фетуса на риск от:



- кардиопулмонална токсичност (преждевременно стесняване/ затваряне на дуктус артериозус и белодробна хипертония);
- бъбречна дисфункция (вижте по-горе);
- майката в края на бременността и новороденото на риск от:
 - възможно удължаване на времето на кървене, антиагрегантен ефект, който може да се появи дори и при много ниски дози;
 - потискане на маточните контракции, което да доведе до забавено или продължително раждане.

Следователно ибупрофен е противопоказан през посления триместър от бременността (вижте точки 4.3 и 5.3).

Кърмене

В ограничени изпитвания ибупрофен се проявява в кърмата в много ниски концентрации и не се очаква да повлияе негативно кърмачето.

Фертилитет

Има доказателства, че лекарствен продукт, който инхибира циклооксигеназата/ простагландиновия синтез, може да увреди фертилитета при жени като повлияе върху овулацията. Ефектът е обратим след спиране на лечението.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Рупалин не повлиява или повлиява пренебрежимо способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Списъкът на следните нежелани реакции е свързан с тези, изпитани при ибупрофен, приложен в дози без лекарско предписание (максимално 1200 mg дневно) за кратък период. При лечение на хронични заболявания и дългосрочна употреба могат да се проявят допълнителни нежелани реакции.

Клиничните проучвания и епидемиологичните данни предполагат, че употребата на ибупрофен, особено във високи дози (по-големи или равни на 2400 mg дневно), вероятно ще бъде свързана с леко повишен риск от артериални тромботични събития (напр. миокарден инфаркт или инсулт) (вж. раздел 4.4).

Нежеланите реакции, асоциирани с ибупрофен са посочени по-долу, категоризирани по система, орган, клас и честота. Честотата е дефинирана както следва: много чести ($\geq 1/10$), 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 ($< 1/10\ 000$) и с неизвестна честота (не може да бъде направена оценка от наличните данни). Във всяка от групите по честота нежеланите реакции са посочени в низходящ ред по отношение на тяхната сериозност.

Най-често наблюдаваните нежелани реакции са от стомашно-чревен характер. Нежеланите реакции най-често са дозозависими, по-специално рискът от поява на стомашно-чревен кръвоизлив, който зависи от дозировката и продължителността на лечението.

Страничните ефекти са по-редки, когато максималната дневна доза е 1200 mg.

<i>Система орган клас</i>	<i>Честота</i>	<i>Нежелана реакция</i>
Нарушения на кръвта и лимфната система	Много редки	Нарушения на хемопоезата ¹
Нарушения на имунната система	Нечести	Свръхчувствителност с уртикария и пруритус ²
	Много редки	Тежки реакции на свръхчувствителност, включително оток на лицето, езика, гърлото, диспнея, тахикардия и хипотония (анафилаксия, ангиоедем и др.)



Система орган клас	Честота	Нежелана реакция
		тежък шок) ²
Нарушения на нервната система	Нечести	Главоболие
	Много редки	Асептичен менингит ³
	С неизвестна честота	Замаяност
Очни нарушения	С неизвестна честота	Зрителни нарушения
Сърдечни нарушения	С неизвестна честота	Сърдечна недостатъчност и едем ⁴ , синдром на Kounis
Съдови нарушения	С неизвестна честота	Хипертония ⁴
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения	С неизвестна честота	Повишена реактивност на респираторния тракт, включително с астма, бронхоспазъм или диспнея ⁵
Стомашно-чревни нарушения	Нечести	Болка в корема, гадене и диспепсия ⁵
	Редки	Диария, флатуленция, запек и повръщане
	Много редки	Пептична язва, стомашно-чревна перфорация или стомашно-чревен кръвоизлив, мелена и хематемеза ⁶ . Язви в устата и гастрит.
	С неизвестна честота	Екзацербация на колит и Болест на Крон ⁷
Чернодробни нарушения	Много редки	Чернодробно увреждане
	С неизвестна честота	Хепатит, повишени нива на трансаминази
Нарушения на кожата и подкожната тъкан	Нечести	Кожен обрив ²
	Много редки	Булозни реакции ² , Тежки кожни нежелани реакции (ТКНР) (включително еритема мултиформе, ексфолиативен дерматит, синдром на Stevens-Johnson и токсична епидермална некролиза), кожна инфекция ²
	С неизвестна честота	Остра генерализирана екзантематозна пустулоза (ОГЕП) Лекарствена реакция с еозинофилия и системни симптоми (DRESS синдром) Реакции на фоточувствителност
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища	Много редки	Остра бъбречна недостатъчност ⁸
	С неизвестна честота	Бъбречна недостатъчност, олигурия
Изследвания	Много редки	Понижен хемоглобин

¹Примерите включват анемия, левкопения, тромбоцитопения, панцитопения и агранулоцитоза. Първи признаци са висока температура, болки в гърлото, повърхностни язви в устата, симптоми, наподобяващи грип, тежко изтощение, необяснимо кървене и получаване на синини.

²Реакции на свръхчувствителност: Те могат да се състоят в (а) неспецифични алергични реакции и анафилаксия, (б) реактивност на респираторния тракт, включително астма, обострена астма, бронхоспазъм и диспнея или (в) различни кожни реакции, включително пруритус, уртикария, пурпура, ангиоедем и по-рядко ексфолиативен и булозен дерматит, включително

токсична епидермална некролиза, Синдром на Стивънс-Джонсън и еритема мултиформе.
³Патогенният механизъм на отключения от лекарството асептичен менингит сочи към реакция на свръхчувствителност (поради временната връзка с приема на лекарството и изчезване на симптомите след преустановяване на лечението). Следва да се отбележи, че единични случаи на симптоми на асептичен менингит (като скованост във врата, главоболие, гадене, повръщане)



висока температура или дезориентация) са наблюдавани по време на лечението с ибупрофен при пациенти с подлежащо аутоимунно заболяване (като системен еритематозен лупус и смесено заболяване на съединителната тъкан).

⁴Клиничните изпитвания и епидемиологичните проучвания показват, че употребата на ибупрофен (особено във високи дози от 2400 mg дневно) и при дългосрочно лечение може да се асоциира с леко повишен риск от артериални тромботични събития (като инфаркт на миокарда и инсулт) (вижте точка 4.4).

⁵Най-често наблюдаваните нежелани реакции са стомашно-чревни по природа.

⁶Понякога фатални.

⁷Вижте точка 4.4.

⁸Особено при дългосрочно приложение, във връзка с повешена серумна урея и едем. Включва също папиларна некроза.

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:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев” № 8

1303 София

Тел.: +359 2 890 3417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

При възрастни ефектът доза-отговор е по-слабо забележим отколкото при деца, при които приемът на повече от 400 mg/kg може да причини симптоми. Полуживотът при предозиране е 1,5 – 3 часа.

Симптоми

Повечето пациенти, приели клинично значими дози НСПВС, развиват не повече от симптоми, които включват гадене, повръщане, замаяност, сънливост, хипотония, болка в корема или по-рядко диария. Тинитус, главоболие и стомашно-чревно кървене също са възможни. При по-тежко отравяне е наблюдавана токсичност от страна на централната нервна система, понякога възбуда и дезориентация или кома.

Понякога пациентите получават гърчове. При тежко отравяне може да се прояви метаболитна ацидоза и протромбиновото време/ INR може да бъде удължено, вероятно поради намеса във функциите на циркулиращите фактори на кръвосъсирването. Могат да се проявят тежка бъбречна недостатъчност и чернодробно увреждане. При астматици е възможно обостряне на астмата.

Продължителната употреба на по-високи от препоръчаните дози или предозирането може да доведе до бъбречна тубулна ацидоза и хипокалиемия.

Овладяване на симптомите

Овладяването на симптомите трябва да бъде симптоматично, поддържащо, включително поддържане проходимостта на дихателните пътища, проследяване на сърдечните и жизнените показатели и тяхното стабилизиране.

Трябва да се обмисли приложението на активен въглен до 1 час след прием на потенциално токсична доза. Честите и продължителни гърчове трябва да бъдат лекувани с диазепам или лоразепам интравенозно. При астма се прилагат бронходилататори.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА



5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Противовъзпалителни и антиаритмични продукти, нестероидни продукти, Деривати на пропионовата киселина, АТС код: M01AE01.

Ибупрофен е нестероидно противовъзпалително средство (НСПВС), което е показало ефективност чрез инхибиране на простагландиновия синтез. При хора ибупрофен намалява болката при възпаление, отока и високата температура. В допълнение, ибупрофен обратимо инхибира тромбоцитната агрегация.

Ибупрофен лизин е лизинова сол на ибупрофен. След перорално приложение ибупрофен лизин се разпада до ибупрофен киселина и лизин. Лизинът не притежава фармакологична активност. Поради това фармакологичните свойства на ибупрофен лизин са същите като тези на ибупрофен киселина.

Експерименталните данни предполагат, че ибупрофен може конкурентно да инхибира ефекта на ниските дози ацетилсалицилова киселина върху тромбоцитната агрегация, когато се прилага едновременно. Някои фармакодинамични проучвания показват, че когато единична доза ибупрофен 400 mg е приета 8 часа преди или в рамките на 30 минути след ацетилсалицилова киселина с незабавно освобождаване (81 mg) е наблюдаван понижен ефект на ацетилсалициловата киселина върху образуването на тромбоксан или агрегацията на тромбоцитите. Въпреки, че има несигурност при екстраполация на тези данни от клинични случаи, не може да бъде изключена възможността, че при редовна продължителна употреба на ибупрофен може да се намали кардиопротективния ефект на ниски дози ацетилсалицилова киселина. Не е възможно да се наблюдава клинично значим ефект при нередовна употреба на ибупрофен (вижте точка 4.5).

5.2 Фармакокинетични свойства

След приложение ибупрофен лизин се разделя на ибупрофен и лизин. Лизиновата сол на ибупрофен е по-разтворима във вода от киселината ибупрофен, което позволява по-бърза абсорбция. Фармакокинетиката на ибупрофен е линейна при терапевтични дози.

Абсорбция

Ибупрофен се абсорбира бързо след прием и се разпределя бързо в цялото тяло. Храната забавя абсорбцията на ибупрофен.

Разпределение

Приложението на ибупрофен не води до натрупвания. Свързването с плазмените протеини е 99%.

В синовиалната течност ибупрофен запазва стабилни концентрации между втория и осмия час след прием, като синовиалната Стах е приблизително равна на една трета от плазмената Стах. След приложение на 400 mg ибупрофен на всеки 6 часа при бременни жени количеството ибупрофен, което се открива в кърмата е по-малко от 1 mg за 24 часа.

Биотрансформация

След чернодробния метаболизъм (хидролизиране, карбоксилиране, конюгиране) ибупрофен няма индуциращ ензимите ефект. 90% от него се метаболизира под формата на фармакологично неактивни метаболити.

Елиминиране

Елиминирането е основно чрез урината (90%), но също и през жлъчката. Тя приключва в рамките на 24 часа в размер на 10% в непроменена форма и 90% неактивни метаболити, съществено глюкороконюгати.

Елиминационният полуживот при здрави индивиди и при такива с бъбречно и чернодробно заболяване е 1,8 до 3,5 часа.



Кинетичните параметри на ибупрофен са слабо променени при пациенти в старческа възраст, при бъбречна недостатъчност и при чернодробна недостатъчност. Наблюдаваните смущения не оправдават промяна на дозировката.

Продуктово специфични фармакокинетични свойства

Времето за достигане на плазмени концентрации (T_{max}) е силно намалено за продукти, съдържащи ибупрофен лизин, в сравнение с еквивалентни продукти, съдържащи ибупрофен киселина.

Максималната серумна концентрация се достига приблизително за 35 минути след перорален прием. След еднократен прием на таблетка от 200 mg, максималните серумни концентрации при възрастни са $48,5 \pm 3,4 \mu\text{g/mL}$ за ибупрофен лизин, а T_{max} е 0,58 часа за ибупрофен лизин в сравнение с 1,33 часа за киселина ибупрофен.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Няма налична допълнителна информация, която да не е посочена в останалите раздели на Кратката характеристика на продукта.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Микрокристална целулоза PH102
Кросповидон (тип А)
Коповидон (Plasdone S-630)
Пречистен талк
Магнезиев стеарат

Покритие

Опадрай II бяло 85F18422:

Поливинилов алкохол, частично хидролизиран
Титанов диоксид (E171)
Макрогол 4000
Пречистен талк

Червен железен оксид (E-172)

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.

6.3 Срок на годност

3 години

6.4 Специални условия на съхранение

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Непрозрачни PVC/PVDC/Alu блистери, поставени в кутии, съдържащи 2, 4, 6, 8, 20, 24 или 30 таблетки.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.



6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Ибупрофен може да представлява риск за околната среда.

Неизползваният лекарствен продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с месните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Medochemie Ltd, 1-10 Constantinoupoleos Street, 3011 Limassol, Кипър

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg. №: 20200252

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

Дата на първо разрешаване: 15 декември 2020 г.

Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

07/2024

