

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

Dolgit 800 mg potahované tablety

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jedna potahovaná tableta obsahuje ibuprofenum 800 mg.
Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Potahovaná tableta
Bílé oválné bikonvexní potahované tablety s půlicí rýhou na obou stranách.
Tabletu lze rozdělit na stejné dávky.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

Dolgit 800 je indikován k symptomatické léčbě zánětlivých a degenerativních chorob kloubních a mimokloubního revmatismu. Používá se při revmatoidní artritidě, včetně juvenilní idiopatické artritidy, osteoartróze, ankylozující spondylitidě, psoriatické artritidě, dnové artritidě, chondrokalcinóze (pseudodna). Dále se používá při distorzi kloubů a zhmoždění pohybového ústrojí při sportu nebo při nehodách. Jako analgetikum lze přípravek použít k léčbě bolesti po operaci, bolestí hlavy, zubů, zad, při dysmenoree.

4.2 Dávkování a způsob podání

Dávkování

Výskyt nežádoucích účinků lze minimalizovat podáváním nejnižší účinné dávky po nejkratší dobu nutnou k potlačení příznaků onemocnění (viz bod 4.4).
Délku léčby a přesné dávkování určí lékař podle závažnosti onemocnění a reakce pacienta na léčbu.

Dospělí

Dospělí obvykle užívají 2 až 3x denně 800 mg ibuprofenu. Mezi jednotlivými dávkami musí být časový odstup nejméně 8 hodin. Denní dávka 2,4 g nesmí být překročena. Maximální jednotlivá dávka 800 mg ibuprofenu nesmí být překročena.

Zvláštní skupiny pacientů

Starší pacienti

Není nutná úprava dávkování. Vzhledem k profilu nežádoucích účinků je třeba pacienty pečlivě sledovat (viz bod 4.4).

Pacienti se sníženou funkcí jater nebo ledvin

U pacientů s lehce až středně omezenou funkcí jater a ledvin není nutná úprava dávkování. U pacientů s těžkou insuficiencí jater a ledvin je ibuprofen kontraindikován (viz bod 4.3).

Děti a dospívající do 18 let

Přípravek není určen pro terapii dětí a dospívajících do 18 let. Pro tuto věkovou skupinu jsou dostupné jiné léčivé přípravky s nižším obsahem léčivé látky ibuprofen.

Způsob podání

Tablety se polykají nerozkousané, zapíjejí se dostatečným množstvím tekutiny. Doporučuje se, aby pacienti s citlivým zažíváním užívali přípravek Dolgit 800 s jídlem.

4.3 Kontraindikace

Dolgit 800 nesmí být podán:

- pacientům s hypersenzitivitou na léčivou látku nebo na kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1;
- pacientům s hypersenzitivitou na kyselinu acetylsalicylovou a jiná nesteroidní antiflogistika projevující se jako bronchospasmus, astma, rhinitis, urtikárie, angioedém nebo jiná alergická reakce;
- pacientům s anamnesticky gastrointestinálním krvácením nebo perforací ve vztahu k předchozí léčbě nesteroidními antirevmatiky;
- při aktivním nebo anamnesticky rekurentním peptickém vředu/hemoragii (dvě nebo více epizod prokázané ulcerace nebo krvácení);
- nemocným s poruchou hemopoezy a hemokoagulace nejasné etiologie;
- pacientům se závažným srdečním selháním (třída IV dle NYHA);
- při cerebrovaskulárním nebo jiném aktivním krvácení;
- při těžké insuficienci jater a ledvin;
- při závažné dehydrataci (způsobené zvracením, průjmem nebo nedostatečným příjmem tekutin)
- v posledním trimestru těhotenství.

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Dolgit 800 nemá být podáván společně s jinými nesteroidními antirevmatiky včetně selektivních inhibitorů cyklooxygenázy.

Nežádoucí účinky lze minimalizovat podáváním nejmenší účinné dávky po co nejkratší dobu nutnou k léčbě příznaků.

Pokud se v průběhu užívání přípravku Dolgit 800 objeví známky infekce nebo dojde k jejich zhoršení, pacient musí ihned vyhledat lékaře. Je potřeba zvážit, zda je vhodné zahájit léčbu infekce (např. antibiotickou léčbu).

U starších pacientů je zvýšený výskyt nežádoucích účinků, zejména gastrointestinálního krvácení a perforací, které mohou být fatální. Gastrointestinální krvácení, ulcerace a perforace, které mohou být fatální, byly hlášeny u všech nesteroidních antirevmatik kdykoli během léčby, s varujícími příznaky ale i bez nich, i bez předchozí anamnézy závažných gastrointestinálních příhod.

Riziko gastrointestinálního krvácení, ulcerací a perforací stoupá se zvyšující se dávkou přípravku, u pacientů s anamnézou peptického vředu, zejména pokud byl komplikován krvácením nebo perforací, a u starších osob. Tito pacienti by měli zahajovat léčbu nejnižší možnou dávkou.

U pacientů se zvýšeným rizikem nežádoucích účinků, mezi něž patří i pacienti dlouhodobě léčení acetylsalicylovou kyselinou v antiagregačních dávkách nebo jinými léky zvyšujícími gastrointestinální riziko, je vhodné zvážit souběžné podávání protektivních látek (např. misoprostol nebo inhibitory protonové pumpy).

Pacienti s anamnézou gastrointestinální toxicity, obzvláště ve starším věku, musí být poučeni, aby včas hlásili všechny neobvyklé gastrointestinální příznaky (zejména gastrointestinální krvácení), především na počátku léčby.

Obzvláštní opatrnost je doporučována u pacientů užívajících konkomitantní léčbu, která by mohla zvyšovat riziko ulcerací nebo krvácení (např. orálně podávané kortikosteroidy, SSRI (selective serotonin reuptake inhibitors), antikoagulancia jako warfarin, nebo antiagregancia jako kyselina acetylsalicylová). U pacientů užívajících kumarinová antikoagulancia je vhodná častější kontrola hemokoagulačních parametrů. Rovněž je vhodná občasná kontrola glykémie.

Pokud se během léčby přípravkem Dolgit 800 objeví gastrointestinální vředy nebo krvácení, musí být léčba ukončena.

Nesteroidní antirevmatika musí být podávána s opatrností pacientům s gastrointestinálními chorobami v anamnéze (ulcerózní kolitida, Crohnova choroba), protože jejich stav se může touto léčbou zhoršit.

Závažné kožní reakce

Velmi vzácně byly ve vztahu k léčbě nesteroidními antirevmatiky hlášeny závažné kožní reakce, z nichž některé byly fatální, včetně Stevensova-Johnsonova syndromu a toxické epidermální nekrolýzy. Těmito reakcemi jsou nejvíce ohroženi pacienti na počátku léčby, začátek reakce se nejčastěji objevuje během prvního měsíce léčby.

V souvislosti s přípravky obsahujícími ibuprofen byl hlášen výskyt akutní generalizované exantematózní pustulózy. Dolgit 800 musí být vysazen při prvních známkách výskytu vyrážky, slizničních lézí nebo jakýchkoli jiných příznaků hypersenzitivity. Pacienta je potřeba informovat o tom, že v případě hypersenzitivní reakce, která se může objevit hned po zahájení léčby, je třeba léčbu přerušit a okamžitě vyhledat lékaře.

Opatrnosti je třeba u nemocných s hepatální a renální insuficiencí, u astmatiků a u pacientů se systémovým lupus erythematosus a jinými onemocněními pojivové tkáně vzniklými na imunologickém podkladě (riziko aseptické meningitidy).

U rizikových pacientů, tj. u pacientů s omezením funkce srdce a ledvin, pacientů léčených diuretiky či při dehydrataci jakékoliv etiologie se doporučuje kontrola renálních funkcí. V případě dehydratace musí být lékařem před zahájením léčby přípravkem Dolgit 800 pečlivě zvážena poměr přínosu a rizika této léčby. Funkci ledvin je doporučeno pravidelně monitorovat.

Objeví-li se poruchy vizu, zastřené vidění, skotomy nebo poruchy barvocitu, je třeba přerušit léčbu. Terapii je nutné rovněž vysadit, přetrvává-li zhoršení jaterních funkcí nebo objeví-li se příznaky hepatopatie. Při dlouhodobé terapii je vhodná kontrola krevního obrazu a rutinní sledování jaterních funkcí.

Kardiovaskulární a cerebrovaskulární účinky

Je třeba poučit a monitorovat pacienty s anamnézou hypertenze a/nebo mírného až středně těžkého srdečního selhání, protože v souvislosti s léčbou NSA byly hlášeny případy retence tekutin a edémů.

Klinické studie ukazují na to, že podávání ibuprofenu, obzvláště ve vysokých dávkách (2 400 mg/den), může souviset s mírným zvýšením rizika arteriálních trombotických příhod (např. infarktu myokardu nebo cévní mozkové příhody). Epidemiologické studie nepoukazují na zvýšené riziko arteriálních trombotických příhod při podávání nízkých dávek ibuprofenu (např. $\leq 1\,200$ mg/den). Pacienti s nekontrolovanou hypertenzí, kongestivním srdečním selháním (NYHA II–III), prokázanou ischemickou chorobou srdeční, onemocněním periferních tepen a/nebo cerebrovaskulárním onemocněním smí být léčeni ibuprofenem pouze po důkladném zvážení a je třeba se vyhnout podávání vysokých dávek (2 400 mg/den).

Obdobně je třeba zvážit zahájení dlouhodobé léčby u pacientů s rizikovými faktory pro kardiovaskulární choroby (např. hypertenze, hyperlipidemie, diabetes mellitus, kouření), zejména pokud je nutné podávat vysoké dávky ibuprofenu (2 400 mg/den).

Zvýšené riziko alergické reakce existuje i u pacientů, kteří trpí sennou rýmou, nosními polypy nebo chronickou obstrukční plicní nemocí. Takové reakce se mohou projevat jako astmatické záchvaty (tzv. analgetické astma), Quinckeho edém nebo kopřivka.

Varicella může být výjimečně příčinou závažných komplikací postihujících kůži a měkké tkáně. Podíl nesteroidních antiflogistik na zhoršení těchto infekcí nelze dosud vyloučit. Proto se doporučuje nepodávat ibuprofen při tomto onemocnění.

Během léčby není vhodné pít alkoholických nápojů a kouření.

Nesteroidní antirevmatika mohou maskovat příznaky zánětu nebo zvýšené teploty.

Maskování symptomů základního infekčního onemocnění

Dolgit 800 může maskovat symptomy infekčního onemocnění, což může vést k opožděnému zahájení vhodné léčby a tím ke zhoršení průběhu infekce. Tato skutečnost byla pozorována u bakteriální komunitní pneumonie a bakteriálních komplikací varicelly. Když se Dolgit 800 podává ke zmírnění horečky nebo bolesti související s infekčním onemocněním, doporučuje se sledovat průběh infekce. V prostředí mimo nemocnici se má pacient poradit s lékařem, jestliže symptomy onemocnění přetrvávají nebo se zhoršují.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Souběžné podání glukokortikoidů anebo dalších NSAID zvyšuje riziko krvácení do gastrointestinálního traktu (GIT) a riziko vzniku ulcerací.

Při současném podávání NSAID a antikoagulancií, např. warfarinu, dochází k prodloužení protrombinového času a zvýšenému riziku krvácení.

Souběžné podávání antiagregačních látek nebo SSRI zvyšuje riziko gastrointestinálního krvácení.

Kyselina acetylsalicylová

Současné podávání ibuprofenu a kyseliny acetylsalicylové se obecně nedoporučuje vzhledem k možnosti zvýšeného výskytu nežádoucích účinků.

Preklinické údaje poukazují na to, že ibuprofen při současném podávání s nízkou dávkou kyseliny acetylsalicylové může kompetitivně inhibovat její vliv na agregaci krevních destiček. Ačkolí panuje určitá nejistota týkající se extrapolace těchto údajů na klinickou situaci, nelze vyloučit možnost, že pravidelné a dlouhodobé užívání ibuprofenu může snížit kardioprotektivní účinek nízké dávky kyseliny acetylsalicylové. Při občasné užití ibuprofenu není klinicky významný vliv pravděpodobný (viz bod 5.1).

Fenobarbital

Fenobarbital zrychluje metabolizaci ibuprofenu.

Lithium, digoxin, fenytoin, methotrexát a baklofen

Ibuprofen zvyšuje plazmatické hladiny lithia, digoxinu a fenytoinu, zvyšuje toxicitu methotrexátu a baklofenu.

Diuretika

Souběžné podání kalium šetřících diuretik může vést k hyperkalémii.

Sulfonfylmočovina

Při souběžném podávání ibuprofenu s deriváty sulfonfylmočoviny u pacientů s diabetes mellitus může snadněji dojít k projevům hypoglykemie je doporučeno pravidelně sledovat hladinu glykémie.

Cyklosporin

Zásahem ibuprofenu do syntézy prostaglandinů v ledvinách by mohlo dojít ke zvýšení nefrotoxicity cyklosporinu.

Probenecid a sulfinpyrazon

Ibuprofen snižuje urikosurický účinek probenecidu a sulfinpyrazonu. Je možné snížení účinku diuretik a antihypertonik.

Takrolimus

Při souběžném podání ibuprofenu a takrolimu je zvýšeno riziko nefrotoxicity.

Zidovudin

Při souběžném podání ibuprofenu a zidovudinu je zvýšené riziko hemartrosu a hematomu u HIV pozitivních pacientů s hemofilií.

Chinolonová antibiotika

Výsledky studií na zvířatech ukazují, že nesteroidní antirevmatika mohou zvyšovat riziko křečí spojených s užíváním chinolonových antibiotik. Pacienti užívající nesteroidní antirevmatika a chinolony mohou mít zvýšené riziko vzniku těchto křečí.

CYP2C9 inhibitory

Současné užívání ibuprofenu a inhibitorů CYP2C9 může zvýšit expozici ibuprofenu (substrát CYP2C9). Ve studii s vorikonazolem a flukonazolem (CYP2C9 inhibitory) byla prokázána zvýšená expozice S(+) ibuprofenu přibližně o 80 až 100 %. Pokud jsou souběžně užívány i účinné CYP2C9 inhibitory, a to zejména při podávání vysokých dávek ibuprofenu současně s vorikonazolem nebo flukonazolem, je potřeba zvážit redukci dávky ibuprofenu.

Ginkgo biloba

Ginkgo biloba může zvyšovat riziko krvácení spojeného s užíváním nesteroidních antirevmatik.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Inhibice syntézy prostaglandinů může mít nežádoucí vliv na těhotenství a fetální/embryonální vývoj. Data z epidemiologických studií naznačují zvýšené riziko potratů a kardiálních malformací po užívání inhibitorů syntézy prostaglandinů v počátku těhotenství. Absolutní riziko kardiovaskulárních malformací se zvýšilo z méně než 1 % na přibližně 1,5 %. Předpokládá se, že se riziko zvyšuje s dávkou a trváním terapie.

U zvířat se prokázalo, že podání inhibitorů syntézy prostaglandinů vede k zvýšení pre- a postimplantačních ztrát a k fetální/embryonální letalitě. Navíc byla hlášena zvýšená incidence různých malformací včetně kardiovaskulárních po podání inhibitorů syntézy prostaglandinů zvířatům v průběhu organogenetické periody.

Od 20. týdne těhotenství může užívání ibuprofenu způsobit oligohydramnion v důsledku poruchy funkce ledvin u plodu. K tomu může dojít krátce po zahájení léčby a po jejím ukončení tento stav obvykle odezní. Kromě toho byly po léčbě ve druhém trimestru hlášeny případy konstrikce ductus arteriosus, z nichž většina po ukončení léčby odezněla. Z těchto důvodů nemá být během prvního a druhého trimestru těhotenství ibuprofen podáván, pokud to není absolutně nutné. Pokud ibuprofen užívá žena v době, kdy se snaží otěhotnět, nebo během prvního a druhého trimestru těhotenství, má užívat co nejnižší dávku po co nejkratší dobu. Při podávání ibuprofenu po dobu několika dnů od 20. gestačního týdne je třeba zvážit předporodní monitorování z důvodu možného výskytu oligohydramnie a konstrikce ductus arteriosus. V případě nálezů oligohydramnie nebo konstrikce ductus arteriosus má být podávání ibuprofenu ukončeno.

Během třetího trimestru těhotenství mohou všechny inhibitory syntézy prostaglandinu vystavit plod:

- kardiopulmonální toxicitě (předčasná konstrikce/uzávěr ductus arteriosus a pulmonální hypertenze);
- renální dysfunkci (viz výše);

matku a novorozence na konci těhotenství:

- možnému prodloužení doby krvácivosti, antiagregačnímu účinku na trombocyty, který se může objevit i při velmi nízkých dávkách;
- inhibici děložních kontrakcí vedoucí k oddálenému nebo prodlouženému porodu.

Proto je ibuprofen během třetího trimestru těhotenství kontraindikován (viz body 4.3 a 5.3).

Kojení

Ibuprofen a jeho metabolity přestupují do mateřského mléka pouze v extrémně nízkých koncentracích (0,0008 % dávky podané matce). Vzhledem k tomu, že množství ibuprofenu v mateřském mléce je minimální, jeho eliminační poločas krátký a dosud nebyly zjištěny nežádoucí účinky u kojených dětí, je ibuprofen považován za lék první volby k léčbě bolesti a příznaků zánětu u kojících matek, zejména při krátkodobém použití. Bezpečnost při dlouhodobém podávání nebyla stanovena.

Fertilita

Používání ibuprofenu může negativně ovlivnit ženskou fertilitu a není doporučeno u žen, které se snaží otěhotnět. Tento účinek je však reverzibilní a odezní po ukončení terapie.

Mělo by být zváženo přerušení podávání ibuprofenu u žen, které mají problémy s početím nebo které jsou vyšetřovány pro infertilitu.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Dolgit 800 při podání větších dávek nebo dlouhodobé léčbě může u některých jedinců způsobit únavu a závratě, které ovlivňují schopnost řídit nebo obsluhovat stroje.

Při krátkodobém užití nemá žádný vliv na schopnost řídit nebo obsluhovat stroje.

4.8 Nežádoucí účinky

Nežádoucí účinky byly rozděleny podle četnosti výskytu za použití následující konvence: Velmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); méně časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$); vzácné ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$); velmi vzácné ($< 1/10\,000$), není známo (z dostupných údajů nelze určit).

Nejčastěji pozorované nežádoucí účinky jsou gastrointestinální. Mohou se objevit peptické vředy, perforace nebo gastrointestinální krvácení, někdy fatální, zejména u starších osob (viz bod 4.4).

Nežádoucí účinky přípravku jsou závislé na dávce, délce podávání a individuální citlivosti pacienta.

Infekce a infestace

Velmi vzácné: Symptomy aseptické meningitidy (ztuhlost krku, bolest hlavy, nevolnost, zvracení, horečka nebo dezorientace) byly ojediněle zaznamenány u osob s autoimunními onemocněními (lupus erytematoses, systémová onemocnění pojivové tkáně).

Poruchy krve a lymfatického systému

Velmi vzácné: poruchy hematopoiezy – leukopenie, agranulocytóza, aplastická nebo hemolytická anémie, trombocytopenie, pancytopenie.

První příznaky jsou horečka, bolest v krku, povrchové ulcerace ústní sliznice, symptomy chřipkového onemocnění, vyčerpání, krvácení z nosu a do kůže. Při dlouhodobém užívání by měl být kontrolován pravidelně krevní obraz.

Poruchy imunitního systému

Méně časté: hypersenzitivní reakce projevující se jako vyrážka, pruritus, u astmatiků astmatický záchvat s možností snížení krevního tlaku.

Velmi vzácné: při dlouhodobém užívání závažné hypersenzitivní reakce projevující se otokem v obličeji, otokem jazyka, laryngu, dušností, tachykardií, hypotenzí až šokovým stavem.

Psychiatrické poruchy

Velmi vzácné: deprese, psychotické reakce.

Poruchy nervového systému

Časté: bolest hlavy, závratě, nespavost, emoční labilita.

Poruchy oka

Méně časté: poruchy vidění, poruchy percepce barev a toxická amblyopie.

Poruchy ucha a labyrintu

Velmi vzácné: tinitus

Srdeční poruchy

Velmi vzácné: srdeční insuficience, infarkt myokardu.

Cévní poruchy

Velmi vzácné: hypertenze.

Gastrointestinální poruchy

Velmi časté: nauzea, pálení žáhy, zvracení, bolesti břicha, průjem, zácpa, flatulence, slabé krvácení do gastrointestinálního traktu, které může v ojedinělých případech vést k anemii.

Časté: žaludeční nebo duodenální vřed s možným krvácením z GIT a/nebo perforace v oblasti trávicího traktu, někdy fatální, zejména u starších osob, meléna, hematemeza, ulcerózní stomatitida, exacerbace kolitidy a Crohnovy choroby. Pacienta je třeba informovat o tom, že v případě častých bolestí v epigastriu nebo při hematemeze a meléně je třeba přerušit léčbu a okamžitě vyhledat lékaře.

Méně časté: gastritida.

Velmi vzácné: ezofagitida, tvorba striktur střevní stěny.

Poruchy jater a žlučových cest

Velmi vzácné: poruchy jaterních funkcí, zvláště při dlouhodobé terapii, změny v jaterních testech. Při dlouhodobém podávání se doporučuje pravidelná kontrola jaterních funkcí.

Není známo: akutní hepatitida.

Poruchy kůže a podkožní tkáň

Velmi vzácné: bulózní reakce včetně Stevensova-Johnsonova syndromu a toxické epidermální nekrolýzy (Lyellův syndrom), alopecie.

Není známo: hypersenzitivní syndrom s eozinofilií a systémovými příznaky (DRESS syndrom), akutní generalizovaná exantematózní pustulóza, fotosenzitivní reakce.

Poruchy ledvin a močových cest

Méně časté: tvorba edémů, zvláště u pacientů s hypertenzí nebo ledvinnou nedostatečností, nefrotický syndrom, intersticiální nefritida, která může vést až k renální nedostatečnosti.

Při dlouhodobém podávání je vhodná pravidelná kontrola renálních funkcí.

Velmi vzácné: papilární nekróza, pokles exkrece kyseliny močové a zvýšení její koncentrace v krvi.

Klinické studie poukazují na to, že podávání ibuprofenu, obzvláště ve vysokých dávkách (2 400 mg/den), může souviset s mírným zvýšením rizika arteriálních trombotických příhod (např. infarktu myokardu nebo cévní mozkové příhody) (viz bod 4.4).

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv

Šrobárova 48

100 41 Praha 10

Webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek.

4.9 Předávkování

Symptomy zahrnují nauzeu, bolesti žaludku, zvracení (pravděpodobně s výskytem krve), bolest hlavy, tinnitus, zmatenost, nystagmus, slabost, závrať, nespavost, ospalost, ztrátu vědomí a křeče (především

u dětí včetně myoklonických křečí). V případě závažné otravy může dojít k hypotermii, hypotenzi, k zástavě dechu, rozvoji cyanózy a metabolické acidózy.

Neexistují specifická antidota, proto bývá indikována podpůrná a symptomatická terapie. U akutního předávkování obvykle co nejdříve provést výplach žaludku s podáním aktivního uhlí nebo projímadla či vyvolat dávicí reflex. Symptomatická terapie spočívá v kontrole a úpravě bilance tekutin a elektrolytů, udržování funkcí respiračních a kardiovaskulárních, při křečích možno podat diazepam, při hypotenzi doplnění objemu cirkulující tekutiny, případně dopamin či noradrenalin. Forsírovaná diuréza a hemodialýza se prokázaly neúčinnými, o hemoperfúzi nejsou údaje.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: nesteroidní protizánětlivá a protirevmatická léčiva, deriváty kyseliny propionové, ATC kód: M01AE01.

Ibuprofen je přípravek ze skupiny nesteroidních antiflogistik, je derivátem kyseliny propionové s analgetickým, antipyretickým a protizánětlivým účinkem. Je to reverzibilní inhibitor cyklooxygenázy (inhibice syntézy prostaglandinů). Ibuprofen zmírňuje projevy zánětu pomocí snížení uvolňování mediátorů zánětu z granulocytů, bazofilů a žírných buněk. Ibuprofen snižuje citlivost cév vůči bradykininu a histaminu, ovlivňuje produkci lymfokinů v T lymfocytech a potlačuje vazodilataci. Tlumí též agregaci trombocytů. V nižších dávkách působí hlavně analgeticky, ve vyšších protizánětlivě.

Účinek se dostavuje po 30 minutách, trvá několik hodin (4–6).

Preklinické údaje poukazují na to, že ibuprofen při současném podávání s nízkou dávkou kyseliny acetylsalicylové může kompetitivně inhibovat její vliv na agregaci krevních destiček. Některé farmakodynamické studie ukazují, že pokud byla užita jednorázová dávka 400 mg ibuprofenu během 8 h před nebo do 30 min po podání kyseliny acetylsalicylové s rychlým uvolňováním (81 mg), došlo ke sníženému účinku kyseliny acetylsalicylové na tvorbu tromboxanu nebo agregaci destiček. Ačkoli panuje určitá nejistota týkající se extrapolace těchto údajů na klinickou situaci, nelze vyloučit možnost, že pravidelné a dlouhodobé užívání ibuprofenu může snížit kardioprotektivní účinek nízké dávky kyseliny acetylsalicylové. Při občasné užití ibuprofenu není klinicky významný vliv pravděpodobný (viz bod 4.5).

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Ibuprofen je rychle vstřebán trávicím traktem, při perorálním podání dosahuje vrcholu plazmatické koncentrace za 1–2 hodiny. Ibuprofen se váže na plazmatické proteiny (99 %), ale vazba je reverzibilní. Po biotransformaci v játrech (hydroxylace, karboxylace) jsou farmakologicky inaktivní metabolity vyloučeny hlavně močí (90 %), zbytek žlučí do stolice. Biologický poločas ibuprofenu je asi 1,8–3,5 hodiny. Při sníženém vylučování může dojít ke kumulaci léku v organismu.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti přípravku

Akutní toxicita: LD₅₀ u myši je při perorálním podání 800 mg/kg a při intraperitoneálním podání 320 mg/kg. LD₅₀ u potkana je při perorálním podání 1 600 mg/kg a při subkutánním podání 1 300 mg/kg.

Subchronická a chronická toxicita: Při pokusech na zvířatech se projevy toxicity objevily ve formě lézí a vředů GIT. Ulcerogenní efekt byl pozorován u myši od dávky 300 mg/kg, u potkanů 180 mg/kg a u psa 8 mg/kg. Tyto reakce byly vysvětleny systémovým účinkem ibuprofenu. Vysoká citlivost psů souvisí s vysokými a dlouhotrvajícími plazmatickými hladinami vyskytujícími se u tohoto druhu zvířete.

Mutagenita a karcinogenita nebyla prokázána v in vitro a in vivo testech na myších a potkanech.

Teratogenní a embryotoxické účinky viz bod 4.6.

Ibuprofen představuje riziko pro biocenózu žijící v povrchové vodě (viz bod 6.6).

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

Jádro

Sodná sůl karboxymethylškrobu (typ A)
Hypromelosa 2910/3 (E 464)
Koloidní bezvodý oxid křemičitý (E 551)
Kyselina stearová (E 570)
Mastek (E 553b)
Mikrokrytalická celulóza (E 460)

Potahová vrstva

Potahová soustava Opadry Y-1-7000 bílá
hypromelosa 2910/5 (E 464)
makrogol 400 (E 1521)
oxid titaničitý (E 171)

6.2 Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3 Doba použitelnosti

4 roky

6.4 Zvláštní opatření pro uchovávání

Tento léčivý přípravek nevyžaduje žádné zvláštní podmínky uchovávání.

6.5 Druh obalu a obsah balení

Bílý neprůhledný PVC/Al-papír blistr, krabička.
Velikost balení: 20, 50 a 100 tablet.
Na trhu nemusí být všechny velikosti balení.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku a pro zacházení s ním

Tento léčivý přípravek představuje riziko pro životní prostředí (viz bod 5.3).
Veškerý nepoužitý léčivý přípravek nebo odpad musí být zlikvidován v souladu s místními požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

Dolorgiet GmbH & Co. KG
Otto-von-Guericke-Straße 1
53757 Sankt Augustin, Německo

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO

29/575/95-C

9. DATUM REGISTRACE/DATUM PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 2. 8. 1995

Datum posledního prodloužení registrace: 29. 10. 2015

10. DATUM POSLEDNÍ REVIZE TEXTU

31. 5. 2023