



11-7912/05.08.07	
642/15.07.03	<i>Мед</i>

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Наименование на лекарствения продукт

Tilidine Sopharma

2. Количествен и качествен състав

Съдържание в 1 ml:

Tilidine hydrochloride hemihydrate 102,9 mg

Тилидин Софарма хидрохлорид хемихидрат

Еквивалент на Tilidine hydrochloride 100 mg

В 1 ml разтвор има 40 капки.

3. Лекарствена форма

Капки перорални, разтвор

4. Клинични данни

4.1. Показания

Силен болков синдром при злокачествени новообразувания, следоперативни болки, болки при травми и изгаряния, невралгии и неврити и особено невралгия на n. trigeminus.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозировката и продължителността на лечението се определя от лекуващия лекар в зависимост от заболяването и поносимостта към продукта.

За потискане на болката при възрастни и деца над 14 години продуктът се прилага перорално по 5-20 капки 3-4 пъти дневно или 3-4



пъти по 50 mg. При деца от 2 до 14 години се прилага по 1 капка (2,5 mg.) за година възраст от 3 до 4 пъти дневно. При 11-14 годишни деца еднократната доза от 25 mg (10 капки) на прием не трябва да се превишава.

При болни с бъбречни увреждания елиминирането на Тилидин Софарма е затруднено, поради което се препоръчва дневната терапевтична доза да се редуцира наполовина.

За аналгезия в оперативната практика или при болезнени терапевтични и диагностични процедури при възрастни се прилага до 100 mg, като максималната еднократна доза не трябва да превишава 150 mg.

За по-бързо настъпване на ефекта е желателно капките да се задържат максимално дълго в устата.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към Тилидин Софарма или към някоя от съставките на продукта, респираторна депресия, придружена с цианоза и ексцесивна бронхиална секреция, бронхиална астма или сърдечен пристъп, възникнал в резултат на хронично белодробно заболяване, черепно-мозъчни травми и състояния с повишено интракраниално налягане или количествени промени в съзнанието, бъбречна недостатъчност (терминална), остро алкохолно отравяне, феохромоцитом (стимулира се освобождаването на ендогенен



хистамин и катехоламини), остър корем. Тилидин Софарма не се прилага при бременни, кърмещи и при деца под 1 година.

4.4. Специални предупреждения за употреба

Да се прилага с внимание или с редуцирана доза при пациенти с адрено-кортикална недостатъчност, хипотиреоидизъм, чернодробна недостатъчност, бъбречни увреждания, възпалителни и обструктивни чревни заболявания, хипертрофия на простатата, остър сърдечен инфаркт.

Не се прилага по време на раждане поради опасност да предизвика респираторна депресия у новороденото.

Не се препоръчва за лечение на по-слаби по интензивност болки.

Да не се консумира алкохол по време на лечението с продукта.

Продуктът води до зависимост, особено ако е прилаган продължително време. При необходимост от продължителна употреба на Тилидин Софарма е желателно той да се прилага едновременно с ниски дози налоксон с което значително се намалява риска от развитие на зависимост. При спиране на лечението с Тилидин Софарма могат да се наблюдават симптоми на отнемане.

Този лекарствен продукт съдържа 19,58 об. % етанол. Всяка доза съдържа 0,08 g алкохол. Представлява опасност за страдащите от чернодробни заболявания, алкохолизъм, епилепсия, мозъчни увреждания или заболявания, както и за бременни и деца. Може да се промени или засили действието на други лекарства.



4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Тилидин Софарма усилва централнодепресивното действие на алкохол, невролептици, други наркотични и ненаркотични аналгетични средства, барбитурати, транквилизатори, общи анестетици, седативни и сънотворни, централни миорелаксанти, антихистаминови средства, антиепилептични средства.

С цел премахване на спазмогенното действие на Тилидин Софарма върху жлъчните пътища и уретрата той може да се прилага със спазмолитични средства от рода на холинолитиците, папаверин и др.

Някои ефекти на Тилидин Софарма се премахват от опиоидните агонисти-антагонисти от рода на налорфон или опиоидните антагонисти – налоксон, налтрексон и др.

4.6. Бременност и кърмене

Не се прилага при бременни и кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Не се назначава на водачи на моторни превозни средства и работещи с машини.

4.8. *Нежелани лекарствени реакции*

Нежелани реакции могат да се наблюдават от страна на:

- Централна и вегетативна нервна система – главоболие, световъртеж, обърканост, неспокойствие, промени в настроението, конвулсии (при деца), хипотермия, зачервяване на лицето, миоза;
- Храносмилателна система – гадене, повръщане, сухота в устата, запек;
- Дихателна система – респираторна депресия;
- Други - циркулаторна недостатъчност, ортостатичен колапс, уртикария и сърбеж;
- Физическа и психическа зависимост, толерантност към ефекта на Тилидин.

4.9. *Предозиране*

При предозиране с Тилидин Софарма, остро или хронично се проявяват страничните ефекти свързани с фармакодинамиката му. Клиничната картина на остро отравяне се характеризира с потискане на дишането с развитие на Чейн-Стоксово дишане, точковидни зеници, нереагиращи на светлина, циркулаторен колапс, настъпване на дълбок сън до кома. Спирането на дишането може да е свързано с директно потискане на дихателния център.

Лечение: стомашна промивка, лаваж с 0,02% разтвор калиев перманганат и очистително (30 g натриев сулфат в 250 ml вода).



С голямо внимание трябва да се контролират показателите на дишането. При тежка апнея – интубация, асистирано дишане и форсирана диуреза. При настъпили дихателни смущения се инжектират специфични антидоти (налоксон хидрохлорид и N-алилнорморфин).

Дозата от 400 μg налоксон хидрохлорид се прилага i.v. като може да бъде повторена през интервали от 3-5 min ако е нужно. При деца дозата е от 5-10 $\mu\text{g}/\text{kg}$. При новородени дозата е 10 $\mu\text{g}/\text{kg}$. Налоксонът може да бъде направен s.c. или i.m. Ефектът от налоксона може да бъде по-краткотраен от този на Тилидин Софарма поради което, за предотвратяване на релапси може да са нужни допълнителни дози.

При хронична интоксикация се наблюдава развитие на лекарствена зависимост, характеризираща се с толеранс, физическа и психическа зависимост.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамика

Тилидин Софарма е синтетичен наркотичен аналгетик от групата на фениламино-циклохексаните. Притежава мощен аналгетичен ефект, повлиявайки предимно централните звена в патогенезата на болката. Ефективността на продукта при екстеро- и проприоцептивна болка е близка до тази на морфина и значително по-висока в сравнение с ненаркотичните аналгетици. Аналгетичната му активност, както и редица други негови ефекти са свързани с активиране на специфични опиоидни рецептори в централната нервна система, които регулират



антиноцицепцията. Опиатоподобното действие на Тилидин се дължи на неговите метаболити – норТилидин и биснорТилидин, които показват по-голям афинитет към опиатните рецептори, отколкото самия Тилидин.

Тилидин Софарма както и другите опиоиди предизвиква потискане на дишането. Респираторната депресия е дозозависима и възниква вследствие директното въздействие върху дихателния и вентилаторен център като намалява тяхната чувствителност към парциалното налягане на CO_2 и чрез депресия на мозъчните центрове, отговорни за честотата и ритъма на дихателните движения. В еквивалентични дози с морфин, Тилидин Софарма оказва по-слабо изразено потискане на дихателния център.

Тилидин Софарма потиска центъра на кашлицата чрез пряко действие върху продълговатия мозък.

Тилидин Софарма притежава възбуждащи ефекти върху някои структури на ЦНС: гадене и повръщане (опиоидното стимулиране предизвиква освобождаване на допамин в продълговатия мозък) и миоза в резултат на възбуда на централните парасимпатикови ядра на п. oculomotorius.

Тилидин Софарма във високи дози може да предизвика ригидност на скелетната мускулатура и конвулсии.

В стомашно-чревния тракт Тилидин Софарма увеличава тонуса на сфинктерите и потиска тонуса на надлъжните мускулни влакна, което води до намалена перисталтика и констипация.

По отношение на сърдечно-съдовата система Тилидин Софарма предизвиква ортостатична хипотензия чрез периферна артериоларна или венозна вазодилатация. Това е вследствие или на директен ефект, или на опиоид стимулирано освобождаване на хистамин.

Други ефекти, които може да предизвика Тилидин Софарма са спазъм на циркулярната мускулатура на бронхите; понижаване на основната обмяна; оказва антидиуретичен ефект (засилва секрецията на вазопресин); потиска маточните контракции; причинява хипергликемия и глюкозурия.

Тилидин Софарма притежава значително по-слаба способност от морфина да предизвиква зависимост.

5.2. Фармакокинетика

Силата на действие и обезболяващият ефект на Тилидин Софарма са еднакви независимо от начина на въвеждане.

Обезболяващият ефект настъпва бързо при перорално приложение. Резорбцията му се осъществява чрез обикновена дифузия и започва още през устната лигавица. Приложението на разтвор под формата на капки, които се задържат в устата или се накапват върху бучка захар, води до бърз ефект още в първите 5-15 минути. По време на абсорбцията Тилидин претърпява значителен първоначален

метаболизъм - first pass ефект. В черния дроб той се разгражда основно чрез деметилиране до основния си активен метаболит норТилидин, който по-късно се метаболизира до биснорТилидин и някои други все още недобре проучени метаболити. След перорално приложение в плазмата се откриват по-високи концентрации на метаболитите му отколкото на непроменената субстанция. Най-високи концентрации на медикамента се установяват в бъбреците, черния дроб и слезката, в по-ниски концентрации се установява в мозъка, мускулите и кръвта. Времето на полуживот на норТилидин е 3.5-4 часа. Времето на действие е 4-6 часа. Тилидин преминава през плацентата и следи от него могат да се появят в млякото и потта. Тилидин се екскретира предимно през бъбреците под формата на метаболити (90%) и в незначителна част като непроменена субстанция, малка част се елиминира през жлъчката и фекалиите.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Досега няма данни за евентуален ембриотоксичен, тератогенен, канцерогенен и мутагенен ефект на продукта. До момента липсват данни за хепато- и нефротоксичност.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Съдържание в g за 1 опаковка /10 ml/:

Methyl Parahydroxybenzoate	0,008
Propyl Parahydroxybenzoate	0,002
Saccharin sodium	0,010
Sorbitol	2,800
Ethanol 96 per cent	1,590 (19,58 об.%)
Menthol	0,005
Hydrochloric acid, concentrated	q.s.
Water for injections ad	10,000

6.2. Физико-химични несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

Три години от датата на производство и 1 месец от отваряне на опаковката.

6.4. Условия на съхранение

В оригинални опаковки на защитено от светлина място при температура под 25⁰ С. Да не се охлажда или замразява!

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Данни за опаковката

По 10 ml от разтвора се дозират в кръгли бутилки от кафяво стъкло с вместимост 10 ml, с апликатор-капкомер и капачка на винт.

Бутилките се поставят в единични картонени кутии заедно с листовка с указания за употреба.

6.6. Препоръки за употреба

По специално лекарско предписание!

7. Притежател на разрешението за употреба:

СОФАРМА АД, България

София, ул. "Илиенско шосе" N 16

8. Регистрационен № в Регистъра по чл. 28 от ЗЛАХМ

9. Дата на първо разрешаване за употреба на лекарствения продукт (подновяване на разрешението)

10. Дата на (частична) актуализация на текста

16.07.2003 г.