

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

OxyContin, 5 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

OxyContin, 10 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

OxyContin, 20 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

OxyContin, 40 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

OxyContin, 80 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

OxyContin 5 mg:

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 5 mg oksykodonu chlorowodoru (*oxycodoni hydrochloridum*), co odpowiada 4,5 mg oksykodonu.

OxyContin 10 mg:

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 10 mg oksykodonu chlorowodoru (*oxycodoni hydrochloridum*), co odpowiada 9,0 mg oksykodonu.

OxyContin 20 mg:

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 20 mg oksykodonu chlorowodoru (*oxycodoni hydrochloridum*), co odpowiada 17,9 mg oksykodonu.

OxyContin 40 mg:

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 40 mg oksykodonu chlorowodoru (*oxycodoni hydrochloridum*), co odpowiada 35,9 mg oksykodonu.

OxyContin 80 mg:

Każda tabletki o przedłużonym uwalnianiu zawiera 80 mg oksykodonu chlorowodoru (*oxycodoni hydrochloridum*), co odpowiada 71,7 mg oksykodonu.

OxyContin 5 mg:

Substancje pomocnicze: Jedna tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin 5 mg zawiera 73,4 mg laktozy. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

OxyContin 10 mg:

Substancje pomocnicze: Jedna tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin 10 mg zawiera 65,8 mg laktozy. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

OxyContin 20 mg:

Substancje pomocnicze: Jedna tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin 20mg zawiera 56,3 mg laktozy. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

OxyContin 40 mg:

Substancje pomocnicze: Jedna tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin 40mg zawiera 33,5 mg laktozy. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

OxyContin 80 mg:

Substancje pomocnicze: Jedna tabletko o przedłużonym uwalnianiu OxyContin 80mg zawiera 74,6 mg laktozy. Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletka o przedłużonym uwalnianiu

OxyContin 5 mg – okrągła, pozbawiona kreski dzielącej, wypukła tabletko koloru jasnoniebieskiego, z napisem OC i 5.

OxyContin 10 mg - okrągła, pozbawiona kreski dzielącej, wypukła tabletko koloru białego, z napisem OC i 10.

OxyContin 20 mg - okrągła, pozbawiona kreski dzielącej, wypukła tabletko koloru różowego, z napisem OC i 20.

OxyContin 40 mg - okrągła, pozbawiona kreski dzielącej, wypukła tabletko koloru żółtego, z napisem OC i 40.

OxyContin 80 mg - okrągła, pozbawiona kreski dzielącej, wypukła tabletko koloru zielonego, z napisem OC i 80.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Ból od umiarkowanego do silnego nasilenia.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Podanie doustne

Dawkowanie należy dostosować do nasilenia bólu oraz indywidualnej wrażliwości pacjenta.

W celu odpowiedniego doboru dawki produkt dostępny jest w różnych dawkach.

O ile nie zostanie zalecone inaczej, OxyContin należy podawać w następujący sposób:

♦ Dorośli i młodzież (w wieku powyżej 12 lat)

Dawka początkowa

Dawka początkowa stosowana zazwyczaj u pacjenta, który nie otrzymywał dotychczas opioidów, wynosi 10 mg oksykodonu chlorowodoru doustnie co 12 godzin.

U pacjentów leczonych opioidami, dawka początkowa produktu OxyContin może być większa, w zależności od wcześniejszych reakcji pacjenta na opioidy.

Na podstawie dobrze kontrolowanych badań klinicznych ustalono, że dawki od 10 do 13 mg oksykodonu chlorowodoru odpowiadają około 20 mg siarczanu morfiny, przy czym oba te produkty były stosowane w postaci o przedłużonym uwalnianiu.

Ustalenie dawkowania

OxyContin jest produktem o przedłużonym uwalnianiu, dlatego nie jest przeznaczony do leczenia bólu przebijającego. Niektórzy pacjenci leczeni przewlekłe opioidami o kontrolowanym uwalnianiu wymagają podawania leku przeciwbólowego o natychmiastowym uwalnianiu, doraźnie, w celu leczenia bólu przebijającego. Pojedyncza dawka leku przyjmowanego doraźnie powinna odpowiadać jednej szóstej dawki dobowej leku przeciwbólowego w dawce równoważnej. Konieczność zastosowania więcej niż dwóch dawek leku doraźnego w ciągu doby zazwyczaj wskazuje na potrzebę zwiększenia dawki podstawowej produktu OxyContin o kontrolowanym uwalnianiu. Dawkę tę powinno się zwiększać nie częściej niż co 1 lub 2 dni, aż do czasu osiągnięcia stabilnej dawki przyjmowanej co 12 godzin. Poza zwiększeniem dawki od 10 do 20 mg co 12 godzin, należy ją zwiększać w przybliżeniu o jedną trzecią, aż do uzyskania pożądanego efektu leczniczego. Celem takiego dawkowania jest ustalenie właściwej dla pacjenta dawki leku podawanego co 12 godzin, która wywołuje odpowiednie działanie przeciwbólowe, przy możliwych do zaakceptowania przez pacjenta działaniach niepożądanych oraz minimalnym stosowaniu dodatkowego leku doraźnego w czasie kiedy konieczne jest leczenie bólu.

Większość pacjentów wymaga podawania równych dawek leku co 12 godzin (ta sama dawka rano i wieczorem), w niektórych przypadkach korzystniejsze może być dostosowanie dawki leku do zmian natężenia bólu w czasie i podawanie innej dawki rano i wieczorem. Zasadniczo należy wybierać najmniejszą skuteczną dawkę przeciwbólową. W przypadku bólu nienowotworowego wystarcza na ogół dawka dobową 40 mg, chociaż może wystąpić konieczność zastosowania większych dawek. Pacjenci z bólem nowotworowym mogą wymagać zastosowania dawek większych od 80 do 120 mg, a w pojedynczych przypadkach nawet do 400 mg.

◆ Dzieci (w wieku poniżej 12 lat)

Produkt OxyContin nie jest zalecany do stosowania u dzieci w wieku poniżej 12 lat ze względu na niewystarczające dane o jego bezpieczeństwie i skuteczności stosowania w tej grupie wiekowej.

◆ Pacjenci w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku, u których nie występują jawne klinicznie zaburzenia czynności wątroby lub nerek, nie ma na ogół konieczności zmniejszania dawkowania.

◆ Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek i wątroby

W tej grupie pacjentów ustalenie dawki początkowej należy oprzeć na ostrożnych i konserwatywnych założeniach. Dawkę należy zmniejszyć o połowę względem dawki początkowej zalecanej dla dorosłych (np. dla pacjentów nie leczonych wcześniej opioidami całkowita dawka dobową to 10 mg doustnie), a następnie należy wymiarem indywidualnie dawkę skuteczną u danego pacjenta, dostosowując ją do sytuacji klinicznej pacjenta.

◆ Inni pacjenci z grupy podwyższonego ryzyka

Pacjenci z niską masą ciała lub wolno metabolizujący leki, którzy dotychczas nie byli leczeni opioidami, powinni otrzymać początkową dawkę o połowę mniejszą od zazwyczaj zalecanej u dorosłych. W takich przypadkach najmniejsza zalecana, w niniejszej ChPL dawka, tj. 10 mg, może być nieodpowiednia jako dawka początkowa i wówczas można zastosować produkt OxyContin 5 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu.

Sposób podawania

Tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin należy przyjmować zgodnie z ustalonym dawkowaniem dwa razy na dobę, zawsze w tych samych godzinach.

Tabletki o przedłużonym uwalnianiu można przyjmować podczas posiłków lub niezależnie od nich, popijając je wystarczającą ilością płynu. Tabletek OxyContin nie należy łamać ani żuć.

Czas trwania leczenia

Oksykodonu nie należy stosować przez okres dłuższy niż to konieczne. W przypadku konieczności długotrwałego leczenia bólu ze względu na charakter i ciężkość choroby, należy starannie obserwować pacjenta, aby ustalić, czy dalsze leczenie jest potrzebne, a jeżeli tak, to, w jakim zakresie.

Przerwanie leczenia

Jeżeli pacjent nie będzie już wymagał leczenia oksykodonem, zaleca się stopniowe zmniejszanie dawki, aby uniknąć wystąpienia objawów odstawienia.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na oksykodonu chlorowodorek lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

Oksykodonu nie wolno stosować w żadnej sytuacji, w której stosowanie opioidów jest przeciwwskazane: ciężka depresja oddechowa z niedotlenieniem, podwyższony poziom dwutlenku węgla we krwi (hiperkarbia), ciężka przewlekła obturacyjna choroba płuc, serce płucne, ciężka astma oskrzelowa lub niedrożność porażenna jelit.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Nie zaleca się stosowania produktu OxyContin u dzieci w wieku poniżej 12 lat ze względu na niewystarczające dane dotyczące bezpieczeństwa i skuteczności stosowania w tej grupie wiekowej.

Najpoważniejszym zagrożeniem związanym z przedawkowaniem opioidów jest depresja oddechowa. Depresja oddechowa wywołana przez oksykodon może prowadzić do kumulowania dwutlenku węgla we krwi, a wtórnie w płynie mózgowo-rdzeniowym. Opioidy mogą powodować ciężkie niedociśnienie tętnicze u podatnych osób.

Należy zachować ostrożność w przypadku podawania oksykodonu u osłabionych pacjentów w podeszłym wieku, pacjentów z ciężkimi zaburzeniami czynności płuc, zaburzeniami czynności wątroby lub nerek, obrzękiem śluzowatym, niedoczynnością tarczycy, chorobą Addisona, niewydolnością kory nadnerczy, łagodnym rozrostem gruczołu krokowego, psychozą organiczną ostrą po zatruciu (np. alkoholem), alkoholizmem, majaczeniem alkoholowym, stwierdzonym uzależnieniem od opioidów, chorobami dróg żółciowych, zapaleniem trzustki, kamicą żółciową, obturacyjnymi i zapalnymi chorobami jelit, stanami zapalnymi jelit, urazem głowy (z powodu ryzyka podwyższonego ciśnienia śródczaszkowego), nadciśnieniem, hypowolemią, padaczką lub ze skłonnością do drgawek oraz pacjentów stosujących inhibitory MAO. W przypadku wystąpienia lub podejrzenia niedrożności porażennej jelit, produkt OxyContin należy natychmiast odstawić.

OxyContin 80 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu

Produkt OxyContin 80 mg, tabletki o przedłużonym uwalnianiu, nie jest zalecany do stosowania u pacjentów, którzy dotychczas nie przyjmowali opioidów, ponieważ dawka ta może spowodować wystąpienie u nich zagrażającej życiu depresji oddechowej.

Podczas przewlekłego stosowania u pacjenta może się rozwinąć tolerancja na lek i będzie wymagane stopniowe zwiększanie dawki dla utrzymania stałej kontroli bólu. Przewlekłe stosowanie tego produktu może prowadzić do uzależnienia fizycznego, a w przypadku nagłego przerwania leczenia – do rozwoju zespołu odstawienia. Gdy pacjent nie będzie już wymagał leczenia oksykodonem, zaleca się stopniową redukcję dawki, aby zapobiec wystąpieniu objawów odstawienia. Objawy odstawienne obejmują: ziewanie, rozszerzenie źrenic, łzawienie, wyciek wodnisty z nosa, drżenie, nadmierne pocenie się, lęk, pobudzenie, drgawki, bezsenność.

W rzadkich przypadkach może wystąpić zjawisko hiperalgezji, która nie ustępuje po zwiększeniu dawki oksykodonu, szczególnie u pacjentów dotychczas leczonych dużymi dawkami. Konieczne może być zmniejszenie dawki oksykodonu lub zmiana na inny opioid.

Oksykodon może być przedmiotem nadużywania, podobnie jak inne silne opioidy. Osoby z ukrytym lub jawnym uzależnieniem psychicznym mogą poszukiwać leku i nadużywać go w celach innych niż medyczne. Istnieje ryzyko rozwoju uzależnienia psychicznego (nałóg) od leków opioidowych, w tym oksykodonu. U pacjentów nadużywających alkoholu lub leków wywładzie, produkt OxyContin powinien być stosowany ze szczególną ostrożnością.

Aby nie doszło do uszkodzenia systemu kontrolowanego uwalniania substancji czynnej, tabletki o przedłużonym uwalnianiu należy połykać w całości, nie łamać, nie żuć i nie kruszyć. Stosowanie przelamanych, przeżutych lub rozkruszonych tabletek oksykodonu o przedłużonym uwalnianiu prowadzi do szybkiego uwolnienia i wchłonięcia potencjalnie śmiertelnej dawki oksykodonu (patrz punkt 4.9 – „Przedawkowanie”).

Jednoczesne picie alkoholu i stosowanie OxyContin może nasilać działania niepożądane leku OxyContin; należy unikać równoczesnego przyjmowania.

OxyContin zawiera podwójną otoczkę polimerową i przeznaczony jest wyłącznie do stosowania doustnego. Nadużywanie formy doustnej przez podanie dożylnie może prowadzić do wystąpienia ciężkich, potencjalnie śmiertelnych działań niepożądanych.

OxyContin nie jest polecany do stosowania przed operacją lub w ciągu 12 do 24 godzin po operacji. Czas, w którym rozpoczyna się stosowanie OxyContinu w okresie pooperacyjnym zależy od rodzaju i zakresu operacji, procedury anestezjologicznej, stosowania innych leków i ogólnego stanu pacjenta oraz od wnikliwej oceny współczynnika korzyści do ryzyka indywidualnie dla każdego pacjenta.

Podobnie jak w przypadku wszystkich opioidów, oksykodon należy stosować ostrożnie po operacjach w obrębie jamy brzusznej. Opioidy zaburzają perystaltykę jelit, zatem nie należy ich stosować dopóki prawidłowa funkcja jelit nie zostanie medycznie potwierdzona.

Pozostałość tabletki można znaleźć w kale.

Produkt leczniczy zawiera laktozę. Pacjenci z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją galaktozy, niedoborem laktazy typu Lapp czy zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy nie powinni przyjmować tego produktu.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Może wystąpić nasilenie działania leków hamujących aktywność OUN podczas jednoczesnego stosowania oksykodonu z produktami leczniczymi o działaniu ośrodkowym, takimi jak: leki uspokajające, leki nasenne, pochodne fenotiazyny, neuroleptyki, leki przeciwdepresyjne, leki przeciwhistaminowe, leki przeciwwymiotne i inne opioidy, które mogą nasilać ryzyko wystąpienia działań niepożądanych, zwłaszcza depresji oddechowej.

Znane są interakcje inhibitorów MAO z opioidowymi lekami przeciwbólowymi. Inhibitory MAO powodują pobudzenie ośrodkowego układu nerwowego (OUN) lub jego hamowanie, powiązane z przełomem nadciśnieniowym lub nagłym spadkiem ciśnienia (patrz punkt 4.4). Oksykodon należy stosować ostrożnie u pacjentów stosujących jednocześnie inhibitory MAO lub u pacjentów, którzy stosowali inhibitory MAO w ciągu ostatnich dwóch tygodni (patrz punkt 4.4).

Alkohol może wzmacniać działanie farmakodynamiczne leku OxyContin; należy unikać równoczesnego przyjmowania.

Leki o działaniu cholinolitycznym (np. psychotropowe, przeciwhistaminowe, przeciwwymiotne, leki przeciw chorobie Parkinsona) mogą nasilać cholinolityczne działania niepożądane oksykodonu, takie jak zaparcia, suchość w jamie ustnej lub zaburzenia wydalania moczu.

W trakcie równoczesnego stosowania oksykodonu i leków przeciwzakrzepowych pochodnych kumaryny obserwowano przypadki klinicznie istotnego zmniejszenia lub zwiększenia wartości wskaźnika protrombinowego - INR.

Oksykodon jest metabolizowany głównie przy udziale izoenzymów CYP3A4 a także, częściowo, przez CYP2D6. Aktywność obu szlaków metabolicznych może być hamowana lub intensyfikowana przez różne, jednocześnie podawane produkty lecznicze lub składniki diety.

Inhibitory CYP3A4, takie jak antybiotyki makrolidowe (np. klarytromycyna, erytromycyna, telitromycyna), azolowe leki przeciwgrzybiczne (np. ketokonazol, worykonazol, itraconazol, pozakonazol), inhibitory proteazy (np. boceprewir, rytonawir, indinawir, nelfinawir, sakwinawir), cymetydyna, a także sok grejfrutowy mogą powodować zmniejszenie klirensu oksykodonu, co może prowadzić do zwiększenia stężenia oksykodonu w osoczu. W takiej sytuacji konieczne może być dostosowanie dawki oksykodonu.

Poniżej szczegółowe dane:

- itraconazol – silny inhibitor CYP3A4, w dawce 200 mg doustnie przez pięć dni, zwiększył wartości AUC doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była około 2,4 razy wyższa (zakres 1,5 - 3,4).
- worykonazol, inhibitor CYP3A4, w dawce 200 mg dwa razy na dobę przez cztery dni (400 mg podane w pierwszych dwóch dawkach), zwiększył wartości AUC doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była około 3,6 razy wyższa (zakres 2,7 - 5,6).
- telitromycyna, inhibitor CYP3A4, w dawce 800 mg doustnie przez cztery dni, zwiększył wartości AUC dla doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była około 1,8 razy wyższa (zakres 1,3 - 2,3).
- sok grejfrutowy, inhibitor CYP3A4, w ilości 200 ml trzy razy dziennie przez pięć dni, zwiększył wartości AUC dla doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była około 1,7 razy wyższa (zakres 1,1 - 2,1).

Leki aktywujące CYP3A4, takie jak ryfampicyna, karbamazepina, fenytoina i dziurawiec zwyczajny,

mogą przyspieszać metabolizm oksykodonu. Może to spowodować zwiększenie klirensu oksykodonu i zmniejszenie stężenia oksykodonu w osoczu. W takiej sytuacji dawka oksykodonu może wymagać odpowiedniego dostosowania.

Poniżej szczegółowe dane:

- dziurawiec zwyczajny, induktor CYP3A4, w dawce 300 mg trzy razy dziennie podawanej przez piętnaście dni, zmniejszył wartości AUC dla doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była o około 50% niższa (zakres 37-57%).
- ryfampicyna, induktor CYP3A4, podawany po 600 mg raz na dobę przez siedem dni, zmniejszył wartości AUC dla doustnego oksykodonu. Średnio, wartość AUC była około 86% niższa.

Leki hamujące aktywność CYP2D6, takie jak paroksetyna i chinidyna, mogą powodować zmniejszenie klirensu oksykodonu, co może prowadzić do wzrostu stężenia oksykodonu w osoczu.

Nie jest znany wpływ innych istotnych inhibitorów izoenzymów układu cytochromu na metabolizm oksykodonu. Należy uwzględnić możliwość wystąpienia interakcji.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

O ile to możliwe należy unikać stosowania produktu u kobiet w ciąży lub u kobiet karmiących piersią.

Ciąża

Dane dotyczące stosowania oksykodonu u kobiet w ciąży są ograniczone. Oksykodon przenika przez łożysko. Noworodki, których matki stosowały opioidy w czasie ostatnich 3-4 tygodni przed porodem powinny być monitorowane pod kątem wystąpienia depresji oddechowej. W przypadku podawania produktu OxyContin w trakcie porodu, u płodu może się rozwinąć depresja oddechowa.

Karmienie piersią

Oksykodon może być wydzielany do mleka ludzkiego i może wywołać depresję oddechową u płodu. Według wykonanych oznaczeń, stosunek stężenia leku w osoczu do stężenia w mleku wynosił 3,4 : 1. Dlatego oksykodon nie powinien być stosowany przez matki karmiące piersią.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Oksykodon może obniżać zdolność do prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Jest to szczególnie prawdopodobne na początku leczenia produktem OxyContin, po zwiększeniu dawki lub rotacji produktu oraz gdy OxyContin jest łączony z alkoholem lub lekami, które ograniczają działanie centralnego układu nerwowego.

U pacjentów otrzymujących stałe dawki leku wpływ taki może nie występować. Dlatego lekarz prowadzący powinien zdecydować czy pacjent może prowadzić pojazdy mechaniczne lub obsługiwać urządzenia mechaniczne w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

Ze względu na swoje właściwości farmakologiczne, oksykodon może powodować depresję oddechową, zwężenie źrenic, skurcz oskrzeli i skurcz mięśni gładkich oraz może znosić odruch kaszlowy.

Najczęstsze działania niepożądane to nudności (szczególnie na początku leczenia) oraz zaparcia.

Depresja oddechowa jest głównym zagrożeniem przy przedawkowaniu opioidów i pojawia się najczęściej u osób w podeszłym wieku lub pacjentów osłabionych.

W ocenie działań niepożądanych uwzględnia się następującą częstość ich występowania:

Bardzo często: $\geq 1/10$

Często: $\geq 1/100$ do $< 1/10$

Niezbyt często: $\geq 1/1000$ do $< 1/100$

Rzadko: $\geq 1/10000$ do $< 1/1000$

Bardzo rzadko: $< 1/10000$,

Nieznana: częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych

Zakażenia i zarażenia pasożytnicze

Rzadko: Opryszczka

Zaburzenia układu immunologicznego

Niezbyt często: Nadwrażliwość

Nieznana: Reakcje anafilaktyczne

Zaburzenia metabolizmu i odżywiania

Często: Zmniejszenie apetytu do utraty apetytu

Niezbyt często: Odwodnienie

Rzadko: Zwiększenie apetytu

Zaburzenia psychiczne

Często: Zmiany nastroju i osobowości (np. lęk, depresja), zmniejszona aktywność, niepokój, nadmierna aktywność psychoruchowa, nerwowość, bezsenność, nieprawidłowe myślenie, stan splątania

Niezbyt często: Pobudzenie, chwiejność emocjonalna, euforia, zaburzenia percepcji (np. halucynacje, brak świadomości), spadek popędu płciowego, uzależnienie od leku (patrz punkt 4.4)

Nieznana: Zachowania agresywne

Zaburzenia układu nerwowego:

Bardzo często: Uspokojenie polekowe (senność aż do zaburzeń świadomości), zawroty głowy, ból głowy

Często: Drżenie mięśniowe

Niezbyt często: Niepamięć, zaburzenia koncentracji, napady drgawkowe (zwłaszcza u osób z padaczką lub ze skłonnością do drgawek), migrena, zaburzenia smaku, zwiększone napięcie mięśniowe, mimowolne skurcze mięśni, niedoczulica, zaburzenia koordynacji, parestezje, zaburzenia mowy, omdlenia

Nieznana: Hiperalgezia

Zaburzenia oka

Niezbyt często: Zwężenie źrenic, osłabienie widzenia

Zaburzenia ucha i błędnika

Niezbyt często: Zaburzenia słuchu, zawroty głowy

Zaburzenia serca

Niezbyt często: Kołatanie serca (w kontekście objawów zespołu odstawienia), tachykardia

Zaburzenia naczyń

Niezbyt często: Rozszerzenie naczyń

Rzadko: Niedociśnienie tętnicze, hipotonia ortostatyczna

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Często: Duszność

Niezbyt często: Zmiany głosu, kaszel, depresja oddechowa

Zaburzenia żołądka i jelit

Bardzo często: Zaparcia, nudności, wymioty

Często: Ból brzucha, biegunka, suchość w jamie ustnej, czkawka, niestrawność

Niezbyt często: Dysfagia, odbijanie się, wzdęcia z oddawaniem wiatrów, niedrożność jelit, owrzodzenie jamy ustnej, zapalenie błony śluzowej jamy ustnej

Rzadko: Smoliste stolce, choroby zębów, krwawienia z dziąseł

Nieznana: Próchnica zębów

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Niezbyt często: Zwiększenie aktywności enzymów wątrobowych

Nieznana: Cholestaza, kolka żółciowa

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Bardzo często: Świąd

Często: Reakcje skórna / wysypka, nadmierna potliwość

Niezbyt często: Suchość skóry

Rzadko: Pokrzywka

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Często: Bolesne oddawanie moczu, nagłe parcie na pęcherz

Niezbyt często: Zatrzymanie moczu

Zaburzenia układu rozrodczego i piersi

Niezbyt często: Impotencja

Nieznana: Zanik miesiączki

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania:

Często: Stany osłabienia

Niezbyt często: Dreszcze, uzależnienie fizyczne obejmujące objawy odstawienia, tolerancja na lek, ból (np. ból w klatce piersiowej), złe samopoczucie, obrzęk, obrzęk obwodowy, pragnienie

Rzadko:

Zwiększenie lub zmniejszenie masy ciała

Urazy, zatrucia i powikłania po zabiegach:

Niezbyt często:

Przypadkowe urazy.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem

Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C

PL-02 222 Warszawa

Tel.: +48 22 49 21 301

Faks.: +48 22 49 21 309

e-mail: ndl@urpl.gov.pl

4.9 Przedawkowanie

Objawy zatrucia

Ostre przedawkowanie oksykodonu może objawiać się depresją oddechową, sennością prowadzącą do osłupienia lub śpiączki, niedociśnieniem, zwężeniem źrenic, bradykardią, niedociśnieniem tętniczym i śmiercią.

Postępowanie w przypadku zatrucia

Należy utrzymywać drożność dróg oddechowych. Czyści antagoniści opioidowi np. nalokson są specyficznym antidotum przeciwko objawom przedawkowania opioidów. Inne środki podtrzymujące powinny być stosowane w razie konieczności.

Przedawkowanie można leczyć podaniem antagonistów opioidów (np. naloksonu dożylnie w dawce 0,4 do 2 mg). Podawanie należy powtarzać co 2–3 minuty w miarę potrzeby lub lek należy podawać we wlewie dożylnym w ilości 2 mg na 500 ml 0,9% chlorku sodu lub 5% dekstrozy (0,004 mg/ml naloksonu). Wlew powinien być podawany z szybkością odpowiadającą wcześniej podawanym dawkom uderzeniowym i powinien być dostosowany do reakcji pacjenta.

Należy rozważyć płukanie żołądka.

W przypadku wystąpienia wstrząsu krążeniowego wskutek przedawkowania leku należy zastosować środki podtrzymujące (w tym sztuczne oddychanie oraz podanie tlenu, leków obkurczających naczynia i płynów infuzyjnych). Zatrzymanie akcji serca lub zaburzenia rytmu mogą wymagać masażu serca lub defibrylacji. W razie potrzeby należy zastosować sztuczne oddychanie. Należy również zapewnić odpowiednią ilość płynów i elektrolitów.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: naturalne alkaloidy opium

Kod ATC: N02A A05

Oksykodon wykazuje powinowactwo do receptorów opioidowych kappa, mi i delta w mózgu, rdzeniu kręgowym i narządach obwodowych. Oksykodon jest agonistą receptorów opioidowych nieposiadającym działania przeciwbólowego. W leczeniu wykorzystuje się przede wszystkim jego właściwości przeciwbólowe i uspokajające. W porównaniu do konwencjonalnego oksykodonu podawanego w monoterapii lub leczeniu skojarzonym, tabletki o przedłużonym uwalnianiu OxyContin zapewniają dużo dłuższy okres łagodzenia bólu bez nasilania działań niepożądanych.

Układ wewnątrzwydzielniczy

Opioidy mogą wywierać wpływ na oś podwzgórze-przysadka-nadnercza lub gonady. Do stwierdzanych zmian należą zwiększenie stężenia prolaktyny w surowicy i zmniejszenie stężenia kortyzolu i testosteronu w osoczu. Te zmiany hormonalne mogą powodować objawy kliniczne.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie oksykodonu z tabletek o przedłużonym uwalnianiu OxyContin ma charakter dwufazowy, z początkowo krótkim okresem półtrwania wynoszącym 0,6 godziny w odniesieniu do ok. 40% substancji czynnej i dłuższym okresem półtrwania wynoszącym 6,9 godziny w odniesieniu do ok. 60% substancji czynnej.

Aby nie doszło do zaburzenia właściwości kontrolowanego uwalniania substancji czynnej, tabletek nie można łamać, kruszyć ani żuć, ponieważ prowadzi to do szybkiego uwalniania oksykodonu.

Względna dostępność biologiczna oksykodonu o przedłużonym uwalnianiu jest porównywalna do konwencjonalnego oksykodonu doustnego, jednak w przypadku tego pierwszego maksymalne wartości stężenia w osoczu są uzyskiwane odpowiednio w ciągu około 3 godzin i od 1 do 1,5 godziny. Maksymalne i minimalne stężenia oksykodonu o przedłużonym uwalnianiu i o natychmiastowym uwalnianiu są podobne, gdy lek jest dawkowany odpowiednio, co 12 i co 6 godzin, z podaniem takiej samej całkowitej dawki dobowej. Bezwzględna dostępność biologiczna oksykodonu wynosi od 42 do 87% dostępności biologicznej leku podanego pozajelitowo. Objętość dystrybucji oksykodonu w stanie równowagi wynosi 2,6 l/kg; stopień wiązania leku z białkami osocza waha się około 45 %; okres półtrwania w fazie eliminacji wynosi od 4 do 6 godzin. Pozorny okres półtrwania w fazie eliminacji oksykodonu z tabletek o przedłużonym uwalnianiu OxyContin wynosi 4,5 godziny, przy czym stan równowagi zostaje osiągnięty przeciętnie w ciągu około jednej doby. Tabletki o przedłużonym uwalnianiu 5, 10, 20, 40 i 80 mg wykazują równoważność biologiczną pod względem zarówno szybkości, jak i stopnia wchłaniania i cechują się proporcjonalnością dawek w relacji do stopnia wchłaniania. Spożycie standardowego, wysokotłuszczowego posiłku nie zmienia maksymalnego stężenia oksykodonu ani zakresu jego wchłaniania.

Oksykodon jest metabolizowany w jelicie i w wątrobie do noroksykodonu i oksymorfonu oraz do różnych związków sprzężonych z kwasem glukuronowym. Noroksykodon, oksymorfon i noroksymorfon powstają z udziałem układu cytochromu P450. Badania *in vitro* sugerują, że dawki terapeutyczne cymetydyny nie powinny istotnie wpłynąć na wytwarzanie noroksykodonu. Chinidyna zmniejsza wytwarzanie oksymorfonu

u mężczyzn bez istotnego wpływu na farmakodynamikę oksykodonu. Metabolity przyczyniają się do ogólnego działania farmakodynamicznego leku jedynie w nieistotnym stopniu. Oksykodon i jego metabolity są wydalane zarówno z moczem, jak i z kałem. Oksykodon przechodzi również przez łożysko i może być wykrywany w mleku ludzkim.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Nie przeprowadzono wystarczających badań nad toksycznym wpływem oksykodonu na reprodukcję. Nie przeprowadzono badań nad poporodowymi skutkami ekspozycji na lek w macicy. Oksykodon nie wywierał niekorzystnego wpływu na płodność i wczesny rozwój zarodkowy samców i samic szczurów w dawkach do 8 mg/kg masy ciała i nie indukował wad rozwojowych u szczurów w dawkach do 8 mg/kg/dobę i u królików w dawkach do 5 mg/kg/dobę.

Oksykodon wykazuje działanie klastogenne w badaniach *in vitro*. Jednak nie obserwowano podobnych skutków podania leku w warunkach *in vivo*, nawet po zastosowaniu dawek toksycznych.

Nie przeprowadzono długoterminowych badań nad potencjalnym działaniem rakotwórczym leku.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Rdzeń tabletki: Laktoza jednowodna,
Magnezu stearynian,
Kopolimer (typ B) amoniowego metakrylanu,
Alkohol stearylowy,
Powidon K30,
Talk,
Triacetyna,
Kwas sorbowy (E200).

Otoczka tabletki:

OxyContin 5 mg (niebieski): Hypromeloza (E464),
Tytanu dwutlenek (E171),
Makrogol 400,
Błękit brylantowy.

OxyContin 10 mg (biały): Hypromeloza (E464),
Hyproloza,
Makrogol 400,
Tytanu dwutlenek (E171).

OxyContin 20 mg (różowy): Hypromeloza (E464),
Makrogol 400,
Polisorbat 80,
Żelaza tlenek czerwony (E172),
Tytanu dwutlenek (E171).

OxyContin 40 mg (żółty): Hypromeloza (E464),
Makrogol 400,
Polisorbat 80,
Żelaza tlenek żółty (E172),
Tytanu dwutlenek (E171).

OxyContin 80 mg (zielony): Hypromeloza (E464),
Hyproloza,
Makrogol 400,
Tytanu dwutlenek (E171),
Żelaza tlenek żółty (E172),
Indygokarmina (E132).

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

OxyContin 5 mg: Nie przechowywać w temperaturze powyżej 30°C.

OxyContin 10 mg, 20 mg, 40 mg, 80 mg: Brak specjalnych zaleceń dotyczących przechowywania.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry PVC/Aluminium w tekturowym pudełku.

Wielkości opakowań:

20 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

30 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

50 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

60 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

100 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

Opakowanie szpitalne: 10 x 10 tabletek o przedłużonym uwalnianiu

Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Norpharma A/S
Frydenlandsvej 30
2950 Vedbæk
Dania

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

OxyContin 5 mg: 14524
OxyContin 10 mg: 14525
OxyContin 20 mg: 14526
OxyContin 40 mg: 14527
OxyContin 80 mg: 14528

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu:

OxyContin 5 mg: 26.03.2008
OxyContin 10 mg: 26.03.2008
OxyContin 20 mg: 26.03.2008
OxyContin 40 mg: 26.03.2008
OxyContin 80 mg: 26.03.2008

Data ostatniego przedłużenie pozwolenia:

OxyContin 5 mg: 27.03.2013
OxyContin 10 mg: 27.03.2013
OxyContin 20 mg: 27.03.2013
OxyContin 40 mg: 27.03.2013
OxyContin 80 mg: 27.03.2013

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

06/2014

DOKUMENT OBOWIĄZUJĄCY

Charakterystyka zatwierdzona w procedurze zmiany porejestracyjnej nr
DE/H/1026/001-005/IAin/015.

Zgodnie z wytycznymi Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych nie posiada
pieczęci.