

1. RAVIMPREPARAADI NIMETUS

OxyContin 10 mg, toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid
OxyContin 20 mg, toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid
OxyContin 40 mg, toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid
OxyContin 80 mg, toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid

2. KVALITATIIVNE JA KVANTITATIIVNE KOOSTIS

10 mg tablett sisaldab 10 mg oksükodoonvesinikkloriidi, mis vastab 9,0 mg oksükodoonile.
20 mg tablett sisaldab 20 mg oksükodoonvesinikkloriidi, mis vastab 18,0 mg oksükodoonile.
40 mg tablett sisaldab 40 mg oksükodoonvesinikkloriidi, mis vastab 36,0 mg oksükodoonile.
80 mg tablett sisaldab 80 mg oksükodoonvesinikkloriidi, mis vastab 72,0 mg oksükodoonile.
INN. *Oxycodum*

Abiained vt 6.1.

3. RAVIMVORM

Toimeainet prolongeeritult vabastavad, ümara kujuga, kumerad tabletid.

10 mg tabletid on valget värvi, nende ühele küljele on märgitud "OC" ja teisele "10".
20 mg tabletid on roosat värvi, nende ühele küljele on märgitud "OC" ja teisele "20".
40 mg tabletid on kollast värvi, nende ühele küljele on märgitud "OC" ja teisele "40".
80 mg tabletid on rohelist värvi, nende ühele küljele on märgitud "OC" ja teisele "80".

4. KLIINILISED ANDMED

4.1 Näidustused

Mõõdukas ja tugev valu.

4.2 Annustamine ja manustamisviis

OxyContin tabletid tuleb alla neelata tervelt ning neid ei tohi poolitada, närida ega purustada. Poolitatud, katkinäritud või purustatud tablettide sissevõtmine põhjustab oksükodooni kiire vabanemise ning potentsiaalselt letaalse annuse imendumise.

Täiskasvanud ja eakad patsiendid:

OxyContin tablette võetakse 12-tunniste intervallidega. Annused määratakse sõltuvalt valu tugevusest, patsiendi varasemast valuvaigistite vajadusest, patsiendi kehakaalust ja soost (naistel kujunevad sama annuse juures vereplasmas kõrgemad kontsentratsioonid). Tavaliselt ei ole eakatel annuse muutmine vajalik.

Nõrgestatud organismiga eakatel patsientidel, opioide varem mittekasutanud patsientidel või patsientidel, kellel ei ole tugevat valu võimalik korrigeerida nõrgemate opioiididega, on tavaline algannus 10 mg iga 12 tunni järel. Annust tuleb seejärel ettevaatlikult suurendada, vajadusel iga päev, kuni saavutatakse valu leevendumine. Kui võimalik, tuleb annuseid suurendada 25...50% inkrementidega. Sobiv annus konkreetsel patsiendil on selline, mis tagab valu leevendumise kogu 12 tunni vältel (mis jääb kahe manustamiskorra vahele) ning mis on hästi talutav. Kui nn hädaabi ravimit (läbilöögivalu leevendamiseks) tuleb manustada rohkem kui kaks korda ööpäevas, viitab see vajadusele suurendada OxyContin tablettide annust.

Üleminek seniselt suukaudselt morfiinilt:

Nendele patsientidele, kes seni kasutasid suukaudset morfiini, määratakse OxyContin'i ööpäevane annus järgmise suhte alusel: 10 mg oksükodooni suukaudne annus vastab 20 mg-le morfiini suukaudsele annusele. Tuleb arvestada, et antud suhe on ainult soovituslik juhul OxyContin tablettide annuse määramiseks ning patsientidevaheliste erinevuste tõttu tuleb igal konkreetsetel patsiendil sobilik annus ettevaatlikult välja tiitrida.

Eakad patsiendid:

Eakatel (üle 65-aastastel) patsientidel teostatud kontrollitud farmakokineetikauuringutes on leitud, et eakatel on nooremate täiskasvanutega võrreldes oksükodooni kliirens ainult vähesel määral vähenenud. Vanusega seotud soovimatuid kõrvaltoimeid täheldatud ei ole; seetõttu võib ravimit eakatel kasutada samades annustes ja samasuguste intervallidega, nagu noorematel täiskasvanutel.

Valu, mis ei ole tingitud pahaloomulisest kasvajast:

Sõltuvusriski minimeerimiseks peaks ravi olema lühiajaline ja vahelduv. Ravi pikaajalise jätkamise vajadust tuleks kindlate ajavahemike järel uuesti hinnata. Tavaliselt ei ole sellistel patsientidel vaja kasutada suuremaid annuseid kui 160 mg ööpäevas.

Pahaloomulisest kasvajast tingitud valu:

Ravimi annus tuleb iga konkreetsetel patsiendil individuaalselt tiitrida tasemeni, mille juures saavutatakse piisav valu leevendumine, ilma et sellega kaasneks mittekorrigeeritavaid kõrvaltoimeid.

Neeru- või maksapuudulikkusega patsiendid:

Erinevalt morfiinipreparaatidest ei teki OxyContin tablettide manustamisel märkimisväärset kogust aktiivseid metaboliite. Siiski võib selles patsiendirühmas esineda oksükodooni kõrgemat kontsentratsiooni vereplasmas kui normaalse neeru- või maksafunktsiooniga patsientidel. Seetõttu tuleb neil patsientidel ravi alustada ettevaatlikult, kasutades üht kolmandikku kuni poolt tavalisest annusest ning tiitrides edasisi annuseid ettevaatlikult. Raske maksapuudulikkuse korral võib olla vajalik ka manustamisintervallide pikendamine. Andmeid OxyContin'i kasutamise kohta hemodialüüsravi saavatel patsientidel ei ole.

Alla 20-aastased täiskasvanud ja lapsed:

Ravimi kasutamine ei ole soovitatav.

Ravi kestus

Oksükodooni ei tohi kasutada kauem kui vajalik.

Ravi lõpetamine

Kui patsient ei vaja enam ravi oksükodooniga, on soovitatav annuse astmeline vähendamine, et vältida ärajätunähtude teket.

4.3 Vastunäidustused

Ülitundlikkus toimeaine või ravimi ükskõik millise abiaine suhtes, mis on märgitud lõigus 6.1. Oksükodooni ei tohi kasutada mis tahes olukorras, kus opioidid on vastunäidustatud: krooniline obstruktiivne kopsuhaigus, *cor pulmonale*, äge kõht, mao aeglustunud tühjenemine, äge maksahaigus,

raske bronhiaalastma, raske hingamistegevuse pärssumine koos hüpoksiaga, tõusnud süsihappegaasi tase veres või halvatuslik soolesulgus.

4.4 Erihoiatused ja ettevaatusabinõud kasutamisel

Opioidide üleannustamise suurim oht on hingamisdepressiooni teke. Ravimit tuleb ettevaatlikult kasutada nõrga tervisega eakatel, raske kopsufunktsiooni vähenemisega, maksa- või neerukahjustusega, müksödeemiga, hüpotüreosiga, Addisoni tõvega, toksilise psühhoosiga, eesnäärme hüpertroofiaga, adrenokortikaalse puudulikkusega, alkoholismiga, *delirium tremens*'iga, sapiteede haigustega, pankreatiidiga, põletikulise soolehaigusega, hüpotensiooniga, hüповoleemilistel, peavigastusega (koljusisese rõhu võimaliku tõusu tõttu) või MAO inhibiitoreid võtvatel patsientidel.

Nagu kõiki teisi opioidpreparaate, tuleb ka OxyContin tablette kasutada ettevaatusega kõhuõõne operatsioonide järgses perioodis, sest teadaolevalt halvendavad opioidid sooletrakti motoorikat. Ravimit ei tohi kasutada enne, kui arst on veendunud patsiendi normaalse soolefunktsiooni taastumises.

Pikaajalise ravi korral võib patsiendil areneda ravimi suhtes tolerantsus ja valu vaigistamiseks võib olla vaja üha suuremaid annuseid. OxyContin'i pikaajaline kasutamine võib põhjustada patsientidel füüsilist sõltuvust ning ravi järsul katkestamisel võib tekkida ärajätusündroom. Kui patsient ei vaja enam ravi oksükodooniga, on soovitatav annust järk-järgult vähendada, et vältida ärajätunähte. Ärajätunähtudeks võivad olla: haigutamine, müdriaas, lakrimatsioon, rinorröa, treemor, hüperhidroos, ärevus, ärritatus, krambid ja unetus.

Väga harva, eriti oksükodooni suurte annuste kasutamisel võib esineda hüperalgeesia, mis ei allu järgnevale annuse tõstmisele. Vajalikuks võib osutada oksükodooni annuse vähendamise või mõne teise opioidi kasutamisele.

Oksükodooni väärkasutamise profiil on sarnane teiste tugevatoimeliste opioidagonistide omale. Latentse või manifesteerunud sõltuvusega patsientidel võib esineda oksükodooni otsivat käitumist ja selle aine väärkasutust. Opioidanalgeetikumide, sh oksükodooni puhul esineb võimalus psüühilise sõltuvuse tekkeks. OxyContin'i tuleb erilise ettevaatusega kasutada patsientidel, kellel esineb anamneesis alkoholi või ravimite väärkasutust.

Toimeainet prolungeeritult vabastavad tabletid tuleb neelata tervelt, neid ei tohi murda, närida ega purustada. Murtud, näritud või purustatud toimeainet kontrollitult vabastavate tablettide manustamine põhjustab toimeaine kiire vabanemise ja potentsiaalselt eluohtliku oksükodooni annuse imendumise (vt lõik 4.9).

Peroraalse ravimvormi parenteraalne manustamine võib põhjustada raskeid kõrvaltoimeid, mis võivad olla eluohtlikud.

Alkoholi ja OxyContin'i samaaegne kasutamine võib suurendada OxyContin'i kõrvaltoimeid; samaaegset kasutamist tuleks vältida.

Oxycontin'i kasutamist ei soovitata preoperatiivselt ega 12...24 tundi pärast kirurgilist operatsiooni.

Kui OxyContin tablettide kasutamise ajal tekib paralüütilise iileuse kahtlus, tuleb ravimi kasutamine viivitamatult katkestada. Sarnaselt kõigi opioidpreparaatidega, tuleb ka OxyContin tablettide kasutamine katkestada 24 tundi enne planeeritavat kordotoomiat või mõnda muud valuvaigistamisele suunatud kirurgilist protseduuri. Kui pärast seda protseduuri on OxyContin tablettide kasutamine jätkuvalt näidustatud, tuleb annused kohandada vastavalt uuele postoperatiivsele vajadusele.

OxyContin 80 mg tablette kasutatakse ainult patsientidel, kellel on tekkinud opioidide suhtes taluvus ning kelle ööpäevane annus on 160 mg või üle selle. Selle tugevuse määramisel tuleb olla ettevaatlik.

Kõik OxyContin tablettide tugevused sisaldavad laktoosi: 10 mg tablett 69,25 mg, 20 mg tablett 59,25 mg, 40 mg tablett 35,25 mg ning 80 mg tablett 78,50 mg laktoosi.

4.5 Koostoimed teiste ravimitega ja muud koostoimed

OxyContin'i manustamisel koos kesknärvisüsteemi (KNS) toimivate ravimitega, nagu teised opioidid, rahustid, uinutid, antidepressandid, fenotiasiidid ja neuroleptikumid, võib KNSi pärssiv toime tugevneda. Monoamiini oksüdaasi (MAO) inhibiitorid omavad teadaolevat koostoimet narkootiliste valuvaigistitega. MAO inhibiitorid põhjustavad KNSi erutuvust või pärssumist, mida seostatakse hüper- või hüpotensiivse kriisiga (vt lõik 4.4).

Alkohol võib tugevdada OxyContin'i farmakodünaamilisi toimeid; samaaegset kasutamist tuleks vältida.

Oksükodoon metaboliseerub peamiselt CYP3A4 kaudu ja osaliselt CYP2D6 abil. Nende metaboolsete radade aktiivsust võivad indutseerida või inhibeerida erinevad kaasvalt manustatavad ravimid või toidu koostisosad.

CYP3A4 inhibiitorid, nagu makroliidantibiootikumid (nt klaritromütsiin, erütrümütsiin ja telitromütsiin), asool-tüüpi seenevastased ravimid (nt ketokonasool, vorikonasool, itrakonasool ja posakonasool), proteaasi inhibiitorid (nt botsepreviir, ritonaviir, indinaviir, nelfinaviir ja sakvinaaviir), tsimetidiin ja greipfruudi mahl võivad vähendada oksükodooni kliirensit, mis võib põhjustada oksükodooni kontretsiooni suurenemist vereplasmas. Seetõttu võib osutada vajalikuks oksükodooni annuse kohandamine.

Järgnevad mõned näited:

- Itrakonasool (tugev CYP3A4 inhibiitor), mida manustati viie päeva jooksul 200 mg suukaudselt, põhjustas suukaudselt manustatud oksükodooni AUC suurenemise. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 2,4 korda kõrgem (vahemikus 1,5...3,4).
- Vorikonasool (CYP3A4 inhibiitor), mida manustati 4 päeva jooksul 2 korda 200 mg ööpäevas (esimesed 2 annust olid 400 mg-sed), tõstis suukaudselt manustatud oksükodooni AUCd. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 3,6 korda kõrgem (vahemikus 2,7...5,6).
- Telitromütsiin (CYP3A4 inhibiitor), mida manustati 4 päeva jooksul 800 mg suukaudselt, tõstis suukaudselt manustatud oksükodooni AUCd. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 1,8 korda kõrgem (vahemikus 1,3...2,3).
- Greipfruudimahl (CYP3A4 inhibiitor), mida manustati 200 ml kolm korda ööpäevas viie päeva jooksul, tõstis suukaudselt manustatud oksükodooni AUCd. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 1,7 korda kõrgem (vahemikus 1,1...2,1).

CYP3A4 indutseerijad nagu rifampitsiin, karbamasepiin, fenütoiin ja lihtnaistepuna võivad indutseerida oksükodooni metabolismi ja põhjustada oksükodooni plasmakliirensi suurenemist, mis võib viia oksükodooni plasmataseme languseni. Võib osutada vajalikuks oksükodooni annust vastavalt kohandada.

Järgnevad mõned näited:

- Lihtnaistepuna (CYP3A4 indutseerija), mida manustati 300 mg kolm korda ööpäevas 15 päeva jooksul, vähendas suukaudselt manustatud oksükodooni AUCd. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 50% madalam (vahemikus 37...57%).
- Rifampitsiin (CYP3A4 indutseerija), mida manustati 600 mg üks kord ööpäevas 7 päeva jooksul, põhjustas suukaudselt manustatud oksükodooni AUC vähenemise. Keskmiselt oli AUC ligikaudu 86% madalam.

Ravimid, mis inhibeerivad CYP2D6 aktiivsust, nagu nt paroksetiin ja kinidiin, võivad põhjustada oksükodooni kliirensi vähenemist, mis võib viia oksükodooni taseme suurenemiseni vereplasmas.

4.6 Fertiilsus, rasedus ja imetamine

Oksükodoon läbib platsentaarbarjääri. Selle ravimi kasutamist tuleb rasedatel ja imetavatel patsientidel vältida nii palju kui võimalik.

Rasedus

Oksükodooni kasutamise kohta rasedatel naistel on andmeid piiratud. Imikuid, kelle emad on võtnud oksükodooni 3...4 nädalat enne sünnitust, tuleb monitoorida hingamisdepressiooni esinemise suhtes. Oksükodooni võtnud emade vastsündinutel võivad ilmnedä ärajätunähud.

Imetamine

Oksükodoon võib erituda rinnapiima ning võib põhjustada vastsündinul hingamisdepressiooni. Seetõttu ei tohiks OxyContin tablette kasutada rinnaga toitvatel emadel.

4.7 Toime reaktsioonikiirusele

Oksükodoon võib kahjustada võimet juhtida autot või kasutada keerukaid seadmeid. Kui patsiendi reaktsioonivõime on häiritud, ei tohiks ta autot juhtida või masinaid käsitseda.

4.8 Kõrvaltoimed

Kõrvaltoimed on liigitatud järgmiste sageduskategooriate alusel.

Termin	Sagedus
Väga sage	$\geq 1/10$
Sage	$\geq 1/100$ kuni $<1/10$
Aeg-ajalt	$\geq 1/1,000$ kuni $<1/100$
Harv	$\geq 1/10,000$ kuni $<1/1,000$
Väga harv	$<1/10,000$
Sagedus teadmata	Ei saa hinnata olemasolevate andmete alusel

Tänu oma farmakoloogilistele omadustele võib oksükodoon põhjustada hingamisdepressiooni, mioosi, bronhospasmi ja silelihaste spasme ning pärssida kõharefleksi.

Immuunsüsteemi häired

Aeg-ajalt: ülitundlikkus

Sagedus teadmata: anafülaktiline reaktsioon

Ainevahetus- ja toitumishäired

Sage: söögiisu vähenemine

Aeg-ajalt: veetustumine

Psühhiaatrilised häired

Sage: ärevus, segasusseisund, depressioon, unetus, närvilisus, ebatavalised mõtted

Aeg-ajalt: ärritus, tundelabiilsus, eufooriline tuju, vähenenud libiido, ravimsõltuvus (vt lõik 4.4)

Sagedus teadmata: agressioon

Närvisüsteemi häired

Väga sage: unisus, pearinglus, peavalu

Sage: treemor

Aeg-ajalt: amneesia, krampid, hüpertoonია, hüpesteesia, tahtmatud lihaskontraktsioonid, kõnehäire, minestus, paresteesia, düsgeusia

Sagedus teadmata: hüperalgeesia

Silma kahjustused

Aeg-ajalt: nägemise halvenemine, mioos

Kõrva ja labürindi kahjustused

Aeg-ajalt: pearinglus

Südame häired

Aeg-ajalt: südamepekslemine (ärajätusündroomi puhul)

Vaskulaarsed häired

Aeg-ajalt: vasodilatsioon

Harv: hüpotensioon, ortostaatiline hüpotensioon

Respiatoorsed, rindkere ja mediastiinumi häired

Sage: düspnoe

Aeg-ajalt: hingamistegevuse pärssumine

Seedetrakti häired

Väga sage: kõhukinnisus, iiveldus, oksendamine

Sage: kõhuvalu, kõhulahtisus, suukuivus, düspepsia

Aeg-ajalt: düsfaagia, kõhupuhitus, röhitsemine, soolesulgus

Sagedus teadmata: hambakaaries

Maksa ja sapiteede häired

Aeg-ajalt: maksaensüümide aktiivsuse tõus

Sagedus teadmata: kolestaas, sapikoolik

Naha ja nahaaluskoe kahjustused

Väga sage: sügelus

Sage: lööve, liighigistamine

Aeg-ajalt: nahakuivus

Harv: urtikaaria

Neerude ja kuseteede häired

Aeg-ajalt: uriinipeetus

Reproduktiivse süsteemi ja rinnanäärme häired

Aeg-ajalt: erektsioonihäired

Sagedus teadmata: amenorröa

Üldised häired ja manustamiskoha reaktsioonid

Sage: asteenilised seisundid

Aeg-ajalt: külmavärinad, ravimi ärajätusündroom, üldine halb enesetunne, tursed, perifeersed tursed, ravimtaluvus, janu

Võimalikest kõrvaltoimetest teavitamine

Ravimi võimalikest kõrvaltoimetest on oluline teavitada ka pärast ravimi müügiloa väljastamist. See võimaldab jätkuvalt hinnata ravimi kasu/riski suhet. Tervishoiutöötajatel palutakse teavitada kõigist võimalikest kõrvaltoimetest www.ravimiamet.ee kaudu.

4.9 Üleannustamine

Oksükodooni üleannustamisel võivad tekkida järgmised sümptomid: mioos, hingamisdepressioon, unisus, skeletilihaste lõtvus ja hüpotensioon. Rasketel juhtudel võib tekkida vereringepuudulikkus, stuupor, kooma, bradükardia ja mitte-kardiogeenne kopsuturse; suurte annuste korral on võimalik ka surm.

Üleannustamist võib ravida, manustades opioidantagoniste (nt 0,4...2 mg naloksooni intravenoosselt). Vajadusel korratakse naloksooni manustamist 2...3-minutiliste intervallidega või manustatakse ravimit infusioonina: 2 mg naloksooni 500 ml-s füsioloogilises naatriumkloriidi lahuses või 5% glükoosilahuses (0,004 mg/ml). Infusioonilahus infundeeritakse kiirusega, mis vastab eelnevalt manustatud boolusannuste suurusele ja patsiendi reaktsioonile manustatud annustele.

Vajalikuks võib osutada mao tühjendamise.

Toetavaid meetmeid (sh kunstlik hingamine, hapnik, vasopressorid ja vedelike infusioonid) tuleb rakendada üleannustamisega kaasneva tsirkulatoorse šoki leevendamiseks. Südameseiskus või arütmiaid võivad vajada südamemassaazi või defibrillatsiooni. Säilitada tuleb vedelike ja elektrolüütide metabolism.

5. FARMAKOLOOGILISED OMADUSED

5.1 Farmakodünaamilised omadused

Farmakoterapeutiline grupp: looduslikud oopiumi alkaloidid, ATC-kood: N02AA05

Oksükodoon on puhas opioidi agonist, millel puuduvad antagonistlikud toimed ning mis toimib aju ja seljaaju kappa-, müü- ja delta-opioidretseptoritesse. Ravimi terapeutilised toimed on peamiselt valuvaigistav, anksiolüütiline, kõhavadane ja sedatiivne toime. Ravimi täpset toimemehhanismi ei ole seni veel täielikult kirjeldatud.

5.2 Farmakokineetilised omadused

Suukaudsel manustamisel on oksükodooni absoluutne biosaadavus kõrge – kuni 87%. Oksükodooni eliminatsiooni poolväärtusaeg on ligikaudu 3 tundi. Oksükodoon metaboliseeritakse maksas noroksükodooniks, oksümorfooniks ja noroksümorfooniks, mis alluvad edasisele glükuronisatsioonile. Noroksükodoon, oksümorfoon ja noroksümorfoon tekivad oksükodoonist valdavalt CYP3A4 ja CYP2D6 vahendusel. In vitro koostoimeuringutes noroksümorfooniga CYP3A4 ja CYP2D6 aktiivsus oluliselt pärssitud ei olnud, seega ei tarvitse noroksümorfoon teiste CYP3A4 ja CYP2D6 kaudu metaboliseeruvate ravimite muundamist mõjutada. On leitud, et noroksümorfoon seondub opioidide müü-retseptoritega. Oksümorfoonil esineb mõningane valuvaigistav toime, kuid seda ainet esineb vereplasmas niivõrd madalas kontsentratsioonis, et eeldatavalt ei oma see metaboliit oksükodooni farmakoloogilise toime kujunemises olulist rolli.

Oksükodooni vabanemine OxyContin'i tablettidest toimub aeglasemalt kui toimeainet koheselt vabastavatest ravimvormidest. Toimeaine vabanemine toimub kahefaasiliselt – alguses vabaneb toimeaine suhteliselt kiiresti, mistõttu tekib kiiresti ka valuvaigistav toime; seejärel hakkab toimeaine vabanema aeglasemalt, nii et ravimi toime jätkub veel 12 tunni jooksul. Näivad imendumise poolväärtusajad on 0,6 ja 6,9 tundi. OxyContin'i keskmine näiv eliminatsiooni poolväärtusaeg on 4,5 tundi, mistõttu kujunevad püsiseisundi tingimused välja ravimi ühepäevase kasutusperioodi vältel.

Oksükodooni vabanemine OxyContin'i tablettidest ei sõltu keskkonna pH väärtusest.

Pärast imendumist jaotub oksükodoon kogu organismi ulatuses. Umbes 45% oksükodoonist seondub vereplasma valkudega.

OxyContin tablettide biosaadavus suukaudsel manustamisel on võrreldav biosaadavusega oksükodooni sisaldava tavalise ravimvormi biosaadavusega, kuid toimeainet prolongeeritult vabastava ravimvormi puhul kujuneb maksimaalne kontsentratsioon vereplasmas 3 tunni jooksul, samas kui tavalise preparaadi puhul on see aeg umbes 1...1,5 tundi. OxyContin 10 mg tableti 12-tunniste intervallidega manustamisel kujunev maksimaalne ja minimaalne kontsentratsioon on samaväärsed

konsentratsioonidega, mis on mõõdetud tavaliste oksükodooni 5 mg tablettide manustamisel 6-tunniste intervallidega.

OxyContin 10 mg, 20 mg, 40 mg ja 80 mg tabletid on bioekvivalentsed nii toimeaine imendumiskiiruse kui imenduva koguse suhtes. Tavalise rasvarikka toidu söömine ei mõjuta oksükodooni maksimaalset kontsentratsiooni vereplasmas ega ka OxyContin'i tablettidest vabanevat ja imenduvat oksükodooni kogust.

Nii toimeaine kui metaboliidid erituvad uriini ja väljaheitega.

Oksükodooni kontsentratsioon vereplasmas on eakatel patsientidel ainult vähesel määral muutunud, olles kuni 15% suuremad vastavatest väärtustest noorematel täiskasvanutel.

Naistel on oksükodooni kontsentratsioonid vereplasmas keskmiselt kuni 25% kõrgemad vastavatest väärtustest meestel (arvestatud on ka naiste ja meeste erineva kehakaaluga).

Mõõduka kuni raske maksapuudulikkusega patsientidel võivad oksükodooni ja noroksükodooni kontsentratsioonid vereplasmas suurenenud ning oksümorfooni kontsentratsioonid vähenenud olla. Oksükodooni eliminatsiooni poolväärtusaeg võib neil patsientidel pikenenud olla, see võib põhjustada ravimi toimete tugevnemise.

Mõõduka kuni raske neerupuudulikkusega patsientidel (kreatiniini kliirens <60 ml/min) võivad oksükodooni ja selle metaboliitide kontsentratsioonid vereplasmas suurenenud olla. Oksükodooni eliminatsiooni poolväärtusaeg võib neil patsientidel pikenenud olla, see võib põhjustada ravimi toimete tugevnemise.

5.3 Prekliinilised ohutusandmed

Teratogeensus:

Oksükodooni reproduktiivtoksilisi toimeid inimestel ei ole piisavalt uuritud. Selgitamiseks toimeid fertiilsusele või intrauteriinssele ekspositsioonile järgnevale postnataalsele arengule ei ole uuringuid läbi viidud. Siiski, rottidel ja küülikutel läbiviidud uuringutes, kus kasutati inimeste annusest 160 mg/ööpäevas 3 ja 47 korda suuremaid oksükodooni suukaudseid annuseid, ei täheldatud oksükodoonist tingitud kahjulikke toimeid loodetele.

Kartsinogeensus:

Oksükodooni kartsinogeense potentsiaali hindamiseks ei ole loomkatseid läbi viidud.

Mutageensus:

Mitmete uuringute tulemustele toetudes võib oksükodoonist tingitud genotoksilisuse riski inimestel madalaks lugeda. Oksükodoon ei osutunud mutageenseks järgmistes uuringutes: Ames'i Salmonella ja E. coli test, nii metaboolse aktivatsiooniga kui ilma, annustes kuni 5000 mcg; kromosomaalsete aberratsioonide test inimese lümfotsüütidel, ilma metaboolse aktivatsioonita annustes kuni 1500 mcg/ml ja koos aktivatsiooniga 48 tundi pärast ekspositsiooni, annustes kuni 5000 mcg/ml; ning in vivo luuüdi mikronukleuste test hiirtel (plasmakontsentratsioonidega kuni 48 mcg/ml).

Mutageenseid toimeid täheldati metaboolse aktivatsiooni kasutamisel inimese kromosomaalsete aberratsioonide testis (kontsentratsioonides ≥ 1250 mcg/ml) 24 tundi, kuid mitte 48 tundi pärast ekspositsiooni; ning hiirte lümfoomirakkude testis metaboolse aktivatsiooniga (annuses 50 mcg/ml) ja ilma metaboolse aktivatsioonita (annuses 400 mcg/ml).

6. FARMATSEUTILISED ANDMED

6.1 Abiainete loetelu

Laktoos
Povidoon
Ammooniummetakrülaatpolümeer
Sorbiinhape
Triatsetiin
Stearüülalkohol
Talk
Magneesiumstearaat
Hüpromelloos
Hüdroksüpropüütselluloos (ainult 10 mg ja 80 mg tabletid)
Titaandioksiid (E171)
Makrogool
Polüsorbaat 80 (ainult 20 mg ja 40 mg tabletid)
Raudoksiid (E172) (ainult 20, 40 ja 80 mg tabletid)
Indigokarmiin (E132) (ainult 80 mg tabletid)

6.2 Sobimatus

Ei ole kohaldatav.

6.3 Kõlblikkusaeg

3 aastat

6.4 Säilitamise eritingimused

Hoida temperatuuril kuni 25 °C.

6.5 Pakendi iseloomustus ja sisu

PVC-blisterpakendid pappkarbis
25, 28, 30, 56, 60 või 100 tabletti ühes karbis

6.6 Kasutamise- ja käsitlemisjuhend

Erinõuded puuduvad.

7. MÜÜGILOA HOIDJA

Mundipharma Ges.m.b.H., Apollogasse 16-18, A-1070 Viin, Austria

8. MÜÜGILOA NUMBRID

OxyContin 10 mg toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid: 300500
OxyContin 20 mg toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid: 300600
OxyContin 40 mg toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid: 300700
OxyContin 80 mg toimeainet prolongeeritult vabastavad tabletid: 300800

9. ESMASE MÜÜGILOA VÄLJASTAMISE/MÜÜGILOA UUENDAMISE KUUPÄEV

25.02.2000/31.05.2010

10. TEKSTI LÄBIVAATAMISE KUUPÄEV

Ravimiametis kinnitatud juulis 2013