

FK-tekst CHAMPIX

ChamPIX Pfizer Røykeavenningspreparat ATC-nr.: N07B A03
TABLETTER, filmdrasjerte 0,5 mg og 1 mg: Hver tablett inneh.: Vareniklin 0,5 mg, resp. 1 mg. Fargestoff: 0,5 mg: Titandioksid (E 171). 1 mg: Indigokarmin aluminiumlake (E 132), titandioksid (E 171). **Indikasjoner:** Røykeavvenning hos voksne. **Dosering:** Dag 1-3: 0,5 mg 1 gang daglig. Dag 4-7: 0,5 mg 2 ganger daglig. Fra dag 8 til behandlingsslutt: 1 mg 2 ganger daglig. Pasienten bør fastsette en dato for røykeslutt. Dosering bør igangsettes 1-2 uker før denne dato. Pasienter som ikke tolererer bivirkningene kan midlertidig eller permanent få redusert dosen til 0,5 mg 2 ganger daglig. Bør svelges hele med vann. Tas med eller uten mat. 12 ukers behandling anbefales. For pasienter som har klart å slutte å røyke etter 12 uker, kan tilleggsbehandling på ytterligere 12 uker med 1 mg 2 ganger daglig vurderes. Ved høy risiko for tilbakefall kan gradvis dosereduksjon vurderes. Mild til moderat nedsatt nyrefunksjon: Ingen dosejustering. Ved moderat nedsatt nyrefunksjon kan dosen reduseres til 1 mg 1 gang daglig, dersom bivirkninger ikke tolereres. Alvorlig nedsatt nyrefunksjon: 0,5 mg 1 gang daglig de første 3 dager, deretter 1 mg 1 gang daglig. Anbefales ikke ved nyresykdom i siste stadium. Nedsatt leverfunksjon: Dosejustering ikke nødvendig. Bør ikke brukes til barn eller ungdom <18 år. **Kontraindikasjoner:** Overfølsomhet for vareniklin eller noen av hjelpestoffene. **Forsiktighetsregler:** Fysiologiske endringer som resultat av røykeavvenning, uavhengig av vareniklinbehandling, kan endre farmakokinetikken/dynamikken til enkelte legemidler. Dosejustering kan være nødvendig (gjelder f.eks. teofyllin, warfarin og insulin). Røykeavvenning kan resultere i økt plasmanivå av CYP 1A2-substrat. Røykeavvenning med eller uten farmakoterapi, er assosiert med forverring av underliggende psykiatrisk sykdom (f.eks. depresjon). Sikkerhet og effekt av preparatet er ikke fastslått ved alvorlig psykiatrisk sykdom, som f.eks. schizofreni, bipolar lidelse og alvorlig depresjon. Varsomhet bør utvises ved psykiatrisk sykdom i anamnesen. Nedstemthet, sjeldent med selvmordstanker og selvmordsforsøk, kan oppstå som følge av avbrutt nikotininntak. Behandlerne lege bør være oppmerksom på ev. utvikling av alvorlige depressive symptomer og pasienten bør rettelles deretter. Preparatet bør seponeres omgående ved selvmordstanker/atferd eller agitasjon, nedstemthet eller atferdsendring som skaper bekymring hos lege, pasient eller familie. Det er rapportert endringer i atferd eller tankemønster, angst, psykoser, humørsvingninger, aggressiv atferd. Det er også sett tilfeller av hypersensitivitetsreaksjoner inkl. angioødem. Kliniske symptomer som hevelser i ansiktet, munn (tunge, lepper og tannkjøtt), halsen (strupe og strupehode) og ekstremiteter. Det er i sjeldne tilfeller sett livstruende tilfeller av angioødem som krever øyeblikkelig medisinsk hjelp som følge av respiratoriske komplikasjoner. Pasienter som opplever slike symptomer skal avslutte behandlingen med vareniklin og kontakte helsepersonell umiddelbart. I mange kasus etter markedsføring er det rapportert at symptomene opphørte etter seponering av vareniklin, men hos enkelte vedvarte symptomene. Det bør derfor sørges for oppfølging av pasienten til symptomene har opphørt. Det er sett sjeldne, men alvorlige, tilfeller av hudreaksjoner, inkl. Stevens-Johnsons syndrom og erythema multiforme. Ettersom disse hudreaksjonene kan være livstruende, skal pasienter avslutte behandlingen ved første tegn til utslett eller hudreaksjoner og kontakte helsepersonell umiddelbart. Ingen klinisk erfaring med epileptikere. Seponering ved behandlingsslutt har vist økt irritabilitet, røykesug, depresjon og/eller søvnløshet. Vareniklin kan forårsake svimmelhet og døsighet. Dette kan påvirke evnen til å kjøre bil og bruke maskiner. Forsiktighet må utvises. **Interaksjoner:** Ingen kjente av klinisk betydning. Ved alvorlig nedsatt nyrefunksjon bør samtidig bruk av cimetidin unngås. **Graviditet/Amming:** Overgang i placenta: Bør ikke

brukes under graviditet. Overgang i morsmelk: Ved amming må fordeler avveies mot potensiell risiko for barnet. **Bivirkninger:** Hyppige (>1/100): Gastrointestinale: Kvalme, oppkast, forstoppelse, diaré, abdominal distensjon, ubehag i magen, dyspepsi, flatulens, munntørrethet. Metabolske: Økt appetitt. Neurologiske: Hodepine, søvnløshet, svimmelhet, nedsatt smakssans. Psykiske: Unormale drømmer, søvnløshet. Øvrige: Tretthet. Mindre hyppige: Gastrointestinale: Blodig oppkast, blodig avføring, gastritt, gastroøsofageal reflukssykdom, abdominalsmerter, endret tarmfunksjon, unormal avføring, luftoppstøt, afløs stomatitt, tannkjøttsmerter, belegg på tungen. Hud: Generelle utslett, erytem, kløe, akne, hyperhidrose, nattesvette. Hørsel: Tinnitus. Luftveier: Dyspné, hoste, heshet, hals- og strupesmerter, halsirritasjon, tett lunfrø, tette bihuler, dryppende nese, snue, snorking, bronkitt, nasofaryngitt, sinusitt. Metabolske: Anoreksi, nedsatt appetitt, sterk tørste. Muskel-skjelettsystemet: Leddstivhet, muskelkramper, smerter i brystveggen, costokondritt. Neurologiske: Tremor, unormal koordinasjon, dysartri, hypertoni, rastløshet, dysfori, hypoestesi, nedsatt smaksopplevelse, letargi, forhøyet libido, nedsatt libido. Psykiske: Panikkreaksjon, bradyfreni, unormalt tankemønster, humørsvingninger. Sirkulatoriske: Atrieflimmer, palpitasjoner, forhøyet blodtrykk, ST-segmentdepresjon og redusert T-bølgeamplitude ved EKG, forhøyet hjerterytme. Syn: Skotom, skleral misfarging, øyesmerter, mydriasis, fotofobi, myopi, forhøyet tåreproduksjon. Urogenitale: Glukosuri, nokturni, polyuri, menoragi, vaginal utflod, seksuell dysfunksjon, unormal sæd. Øvrige: Ubegag i brystet, brystsmertor, feber, kuldefølelse, asteni, døgnytmeforstyrrelser, generell sykdomsfølelse, cyste, soppinfeksjon, virusinfeksjon, vektøkning. Ukjent frekvens: Hud: Alvorlige hudreaksjoner, inkl. Stevens-Johnsons syndrom, erythema multiforme og angioødem. Psykiske: Selvmordstanker, depresjon, psykoser, hallusinasjoner, angst, aggressiv og irrasjonell atferd. Sirkulatoriske: Myokardinfarkt. Laboratorieverdier: Unormale leverfunksjonstester, reduksjon i blodplatetall, forhøyet CRP, nedsatt blodkalsium. **Overdosering/Forgiftning:** Symptomer: Ingen rapporterte overdosetilfeller for markedsføring. Behandling: Støttende. Ved nyresykdom i siste stadium kan vareniklin fjernes ved dialyse. Ingen erfaring med dialyse etter overdose. Se Giftinformasjonens anbefalinger N07B A03. **Egenskaper:** Klassifisering: Middell ved nikotinavhengighet. Virkningsmekanisme: Partiell agonist til nevralt nikotin- α 4 β 2-acetylcholinreseptorer. Bindes med høy affinitet og selektivitet. Nikotin konkurrerer om samme bindingsstedet. Vareniklin har høyere reseptoraffinitet enn nikotin, og kan derfor effektivt redusere nikotinetns evne til å aktivere α 4 β 2-reseptorer og det mesolimbiske dopaminsystemet. Dette reduserer belønnings- og forsterkningseffektene ved røyking (antagonistaktivitet), samtidig som vareniklin gir tilstrekkelig stimulering til å lindre røyketrang og avvenningsproblemer (agonistaktivitet). Sikkerhet og effekt av vareniklin ble evaluert hos røykere med stabil hjerte-karsykdom, og insidensen av hjerte-kar-relaterte hendelser var lav. Absorpsjon: Så å si fullstendig. Maks. plasmakonsentrasjon etter 3-4 timer. Høy systemisk biotilgjengelighet. Proteinbinding: Lav (\leq 20%), uavhengig av alder og nyrefunksjon. Fordeling: Tilsynelatende distribusjonsvolum: 415 liter. Halveringstid: Ca. 24 timer. Ved gjentatt dosering nås «steady state» etter 4 dager. Eliminering i nyrene skjer hovedsakelig gjennom glomerulusfiltrasjon og aktiv tubulær sekresjon. Metabolisme: Minimal. Utskillelse: 92% utskilles uforandret i urin, <10% som metabolitter. **Pakninger og priser:** Startpakn.: 11 tabl. 0,5 mg + 42 tabl. 1 mg (blister) kr 750,20. 0,5 mg: 56 stk. (boks) kr 738,80. 1 mg: 56 stk. (blister) kr 738,80. 112 stk. (blister) kr 1442,60. **Sist endret: 23.03.2010**

Referanser

Referanser: **1.** Coe JW *et al.* Varenicline: An $\alpha 4\beta 2$ nicotinic receptor partial agonist for smoking cessation. *J Med Chem* 2005; 48: 3474-3477. **2.** Jorenby D *et al.* Efficacy of varenicline, an $\alpha 4\beta 2$ nicotinic acetylcholine receptor partial agonist, vs placebo or sustained-release bupropion for smoking cessation. A randomized controlled trial. *JAMA* 2006; 296: 56-63. **3.** CHAMPIX Preparatomtale. **4.** Jarvis MJ. Why people smoke. *BMJ* 2004; 328: 277-279. **5.** Zaniewska M *et al.* Nicotine dependence – human and animal studies, current pharmacotherapies and future perspectives. *Pharmacol Rep* 2009; 61: 957-65. **6.** Picciotto MR *et al.* Use of knock-out mice to determine the molecular basis for the actions of nicotine. *Nicotine Tob Res* 1999; 1: S121-5. **7.** Dani JA and Harris RA. Nicotine addiction and comorbidity with

alcohol abuse and mental illness. *Nature Neuroscience* 2005; 8: 1465-1470. **8.** Gonzales D *et al.* Varenicline, an $\alpha 4\beta 2$ nicotinic acetylcholine receptor partial agonist, vs sustained-release bupropion and placebo for smoking cessation. A randomized controlled trial. *JAMA* 2006; 296: 47-55. **9.** Rigotti NA *et al.* Efficacy and safety of varenicline for smoking cessation in patients with cardiovascular disease: A randomized trial. *Circulation* 2010; 121: 221-229. **10.** Tashkin DP *et al.* Effects of varenicline on smoking cessation in mild-to-moderate COPD: A randomized controlled trial. *CHEST* 2010; doi: 10.1378/chest.10-0865 **11.** IMS Norge, 2006-2010. **12.** Hughes JR. New treatments for smoking cessation. *CA Cancer J Clin* 2000; 50:143-151.



Dato for forberedelse: November 2010 EUCHAM1140



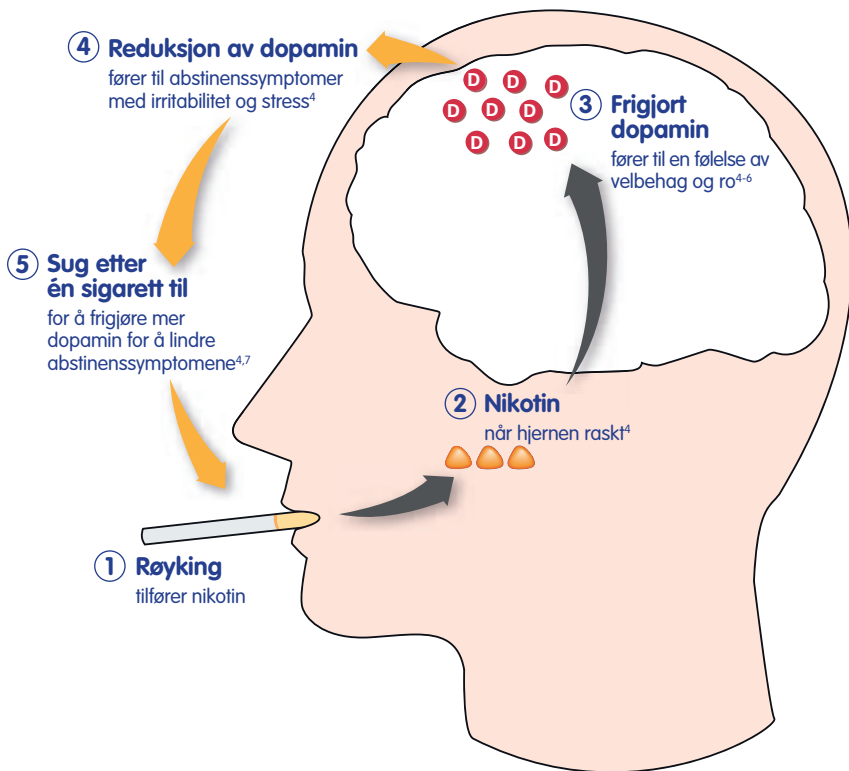
**CHAMPIX® – En todelt virkningsmekanisme
som kan gjøre vellykket røykeslutt mer
oppnåelig for pasientene dine¹⁻³**



CHAMPIX® 
vareniklin
STYRKE TIL Å SLUTTE^{2,9,10}

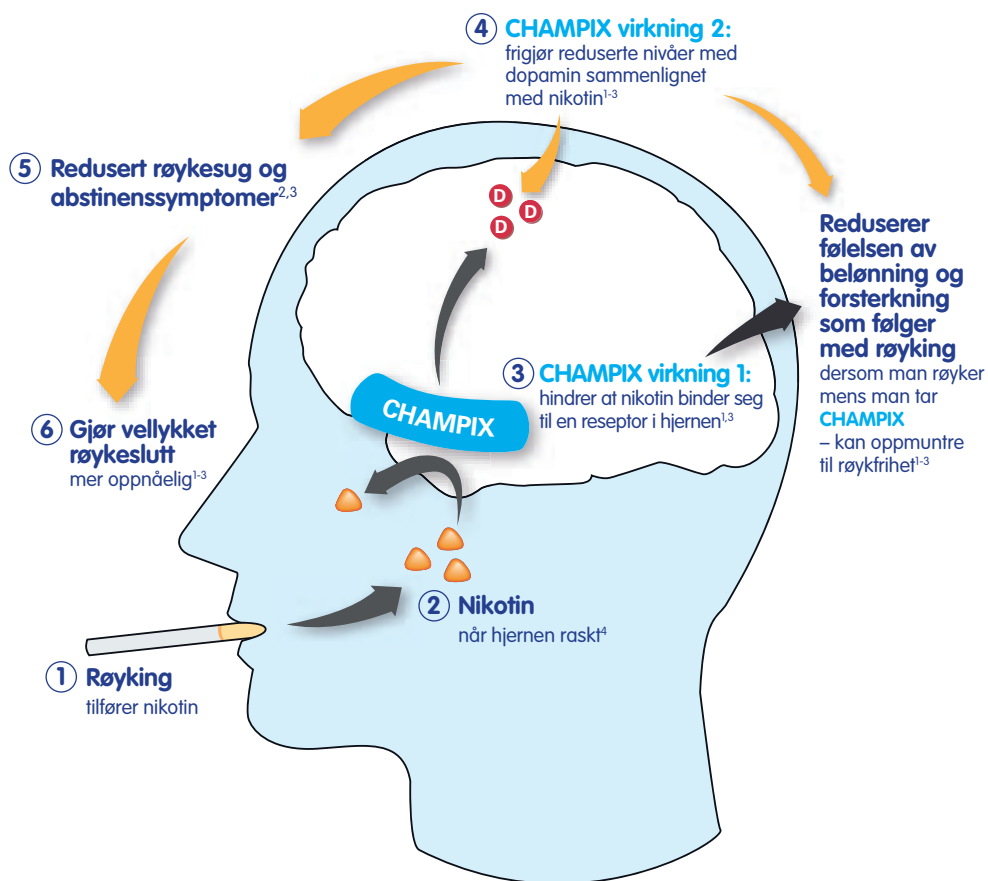
FK-tekst finnes på innsiden av bakre omslagsside.

Utviklingen av nikotinavhengighet



Bryt sirkelen av nikotinavhengighet ved hjelp av veiledning og effektiv behandling¹²

CHAMPIX er en nikotinfri behandling med todelt virkningsmekanisme^{1,3}



CHAMPIX gjør vellykket røykeslutt mer oppnåelig for pasientene¹⁻³

CHAMPIX – kan hjelpe deg å gjøre en forskjell²

CHAMPIX er en 12 ukers behandling som kan gjøre det lettere for pasientene dine å slutte å røyke:³

- Dokumentert effektivt som hjelp til røykeavvenning^{2,8}
- Todelt virkningsmekanisme **reduserer følelsen av belønning** og forsterkning som følger med røyking, samt **røykesug og abstinenssymptomer** som følger av nikotin¹⁻³
- Også dokumentert effektivt for risikopasienter – pasienter med stabil kardiovaskulær sykdom og mild til moderat KOLS^{9,10}
- Flere enn 120 000 norske røykere har forsøkt å slutte med hjelp av **CHAMPIX**¹¹

Forskriv CHAMPIX 12-ukers kur for å øke dine pasienters muligheter for vellykket røykeslutt³