

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA WŁASNA PRODUKTU LECZNICZEGO

ETOMAR 300 mg + 100 mg + 50 mg tabletki

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNYCH

Jedna tabletki zawiera jako substancje czynne:

Acidum acetylsalicylicum (kwas acetylosalicylowy) – 300 mg

Ethoxybenzamidum (etoksybenzamid) – 100 mg

Coffeinum (kofeina) – 50 mg

Substancje pomocnicze, patrz: pkt 6.1

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Bóle różnego pochodzenia o małym i umiarkowanym nasileniu (np. bóle głowy, nerwobóle, bóle stawowo - mięśniowe, ból zęba). Ponadto stany gorączkowe, leczenie objawowe grypy i przeziębień.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Nie stosować u dzieci w wieku poniżej 12 lat. U młodzieży w wieku powyżej 12 lat stosować ostrożnie ze względu na zawartość kofeiny. Zazwyczaj stosuje się 1 tabletkę 2 do 6 razy na dobę, nie częściej niż co 4 godziny. Preparatu nie należy stosować długotrwale. Nie należy przekraczać maksymalnej dawki dobowej, która wynosi 6 tabletek. Nie stosować na czczo. Tabletkę należy przyjmować doustnie, popijając dużą ilością płynu.

4.3 Przeciwwskazania

Preparat jest przeciwwskazany:

W okresie ciąży i karmienia piersią.

W przypadku nadwrażliwości na którykolwiek składnik preparatu lub na salicylany, stany zapalne przewodu pokarmowego, ostra faza choroby wrzodowej żołądka (lub) dwunastnicy, stany, w których zmniejszenie krzepliwości krwi może być przyczyną przedłużającego się krwawienia.

W przypadku ciężkiej niewydolności wątroby lub nerek

U dzieci w wieku poniżej 12 lat.

U pacjentów z napadami astmy oskrzelowej w wywiadzie, wywołanymi podaniem salicylanów lub substancji o podobnym działaniu, szczególnie niesteroidowych leków przeciwzapalnych.

Jednocześnie z metotreksatem w dawkach 15 mg na tydzień lub większych.

W ciężkiej niewydolności serca.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Preparat należy stosować ostrożnie:

- w przypadku nadwrażliwości na niesteroidowe leki przeciwzapalne i przeciwreumatyczne lub inne substancje alergizujące;
- podczas jednoczesnego stosowania leków przeciwzakrzepowych;
- u pacjentów z chorobą wrzodową lub krwawieniami z przewodu pokarmowego w wywiadzie;
- u pacjentów z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej;
- u pacjentów z nadczynnością tarczycy;
- u pacjentów z nadciśnieniem tętniczym.

Należy ostrożnie stosować u pacjentów z chorobami alergicznymi (astma oskrzelowa, katar sienny z polipami błony śluzowej nosa), przed zabiegami chirurgicznymi, w zaburzeniach czynności wątroby i nerek, w przypadku stosowania wewnątrzmacicznej wkładki antykoncepcyjnej lub w przypadku obfitych krwawień miesięczkowych.

Istnieją dowody na to, że leki hamujące cyklooksygenazę (syntezę prostaglandyn) mogą powodować zaburzenia płodności u kobiet przez wpływ na owulację. Działanie to jest przemijające i ustępuje po zakończeniu terapii.

Przyjmowanie leku w najmniejszej dawce skutecznej przez najkrótszy okres konieczny do łagodzenia objawów zmniejsza ryzyko działań niepożądanych (patrz wpływ na przewód pokarmowy i układ krążenia poniżej).

Wpływ na układ krążenia i naczynia mózgowe

Z badań klinicznych i danych epidemiologicznych wynika, że przyjmowanie niektórych NLPZ (szczególnie długotrwale w dużych dawkach) jest związane z niewielkim zwiększeniem ryzyka zatorów tętnic (np. zawał serca lub udar). Dostępne dane są niewystarczające, aby wykluczyć takie ryzyko w przypadku przyjmowania Etomar w dawkach dobowych nie większych niż 6 tabletek.

4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Przeciwwskazane jest jednoczesne stosowanie z metotreksatem w dawkach 15 mg na tydzień lub większych. Metotreksat w dawkach mniejszych niż 15 mg na tydzień - nasilenie toksycznego działania metotroksatu na szpik kostny.

Równoczesne stosowanie z tyklopidyną zwiększa ryzyko wystąpienia krwawienia, jeśli istnieje konieczność jednoczesnego podawania obu preparatów należy kontrolować czas krwawienia. Skuteczność leków zwiększających wydalanie kwasu moczowego, leków moczopędnych np. spironolakton i furosemid, leków obniżających ciśnienie krwi może być zmniejszona, gdy stosowane są równocześnie z kwasem acetylosalicylowym. Kwas acetylosalicylowy nasila ototoksyczność furosemidu.

W trakcie ogólnego stosowania glikokortyosteroidów zmniejsza się stężenie salicylanów we krwi. Po odstawieniu steroidów istnieje ryzyko przedawkowania salicylanów. Dawkę salicylanów należy ustalić oddzielnie w okresie równoczesnego podawania z preparatami steroidowymi i ponownie po ich odstawieniu. Jednoczesne stosowanie preparatu z pochodnymi fluorochinolonu (np. cyprofloksacyna), może spowodować kumulację kofeiny w organizmie. Cymetydyna i disulfiram oraz doustne środki antykoncepcyjne zwalniają, a barbiturany przyspieszają metabolizm kofeiny. Kofeina może nasilać działanie izoprenaliny. Kwas acetylosalicylowy i etoksybenzamid nasila hipoglikemizujące działanie doustnych leków przeciwcukrzycowych z grupy sulfonilomocznika i działanie wszystkich leków zmniejszających krzepliwość krwi, w tym pochodnych kumaryny i niektórych antybiotyków. Jednoczesne stosowanie kwasu acetylosalicylowego i innych

niesteroidowych leków przeciwzapalnych zwiększa ryzyko uszkodzenia błony śluzowej przewodu pokarmowego, oraz uszkodzenie nerek.

Picie alkoholu podczas leczenia zwiększa podrażnienie błon śluzowych i niebezpieczeństwo krwawień z przewodu pokarmowego.

Kofeina osłabia działanie leków uspokajających i nasennych.

Nasila działanie leków wywołujących tachykardię np. sympatykomimetyków, tyroksyny.

Lek:

- hamuje działanie inhibitorów ACE oraz beta-adrenolityków,
- skraca czas działania sulfonamidów.

Leki metabolizowane przez cytochrom P-450 np. cymetydyna zwalniają metabolizm kwasu acetylosalicylowego.

4.6 Ciąża lub laktacja

Stosowanie preparatu w okresie ciąży i karmienia piersią jest przeciwwskazane.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu

Nie wpływa lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8 Działania niepożądane

Zaburzenia serca

Kofeina może powodować zaburzenia rytmu serca. W związku z leczeniem NLPZ zgłaszano występowanie obrzęków, nadciśnienia i niewydolności serca.

Z badań klinicznych i danych epidemiologicznych wynika, że przyjmowanie niektórych NLPZ (szczególnie długotrwale w dużych dawkach) może być związane z niewielkim zwiększeniem ryzyka zatorów tętnic (np. zawał serca lub udar), patrz punkt 4.4.

Zaburzenia krwi i układu chłonnego

Zwiększone ryzyko krwawień, wydłużenie czasu krwawienia, czasu protrombinowego, małopłytkowość.

Zaburzenia układu nerwowego

Zawroty głowy, szumy uszne. Kofeina zawarta w preparacie może powodować bezsenność, niepokój ruchowy.

Długotrwale przyjmowanie preparatu zawierającego kwas acetylosalicylowy może być przyczyną bólu głowy, który nasila się podczas przyjmowania kolejnych dawek

Zaburzenia żołądka i jelit

Bóle brzucha, zgaga, nudności, wymioty, krwawienie z przewodu pokarmowego: jawne (fusowate wymioty, smoliste stolce) lub utajone, które mogą powodować niedokrwistość

z niedoboru żelaza, choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy, perforacje.

Zaburzenia nerek i dróg moczowych

Rzadko, po długotrwałym stosowaniu dużych dawek kwasu acetylosalicylowego zanotowano martwicę brodawek nerkowych i śródmiąższowe zapalenie nerek.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Reakcje nadwrażliwości - pokrzywka, odczyny skórne, reakcje anafilaktyczne, astma oskrzelowa, obrzęk naczynioruchowy.

Zaburzenia wątroby i dróg żółciowych

Rzadko zaburzenia czynności wątroby (zwiększenie aktywności aminotransferaz).

4.9 Przedawkowanie

Objawy przedawkowania przeważnie występują po 2 godzinach.

Po przedawkowaniu mogą wystąpić: drżenie rąk, biegunka, senność, szumy uszne, bóle i zawroty głowy, dezorientacja, przyspieszony oddech, zaburzenia gospodarki kwasowo - zasadowej i kwasica metaboliczna, wymioty i bóle brzucha, podwyższenie temperatury ciała, zmniejszenie stężenia protrombiny, drgawki. W przypadku ciężkiego przedawkowania może wystąpić hiperwentylacja, zaburzenia oddychania, gorączka, kwasica metaboliczna, śpiączka.

Objawami przedawkowania kofeiny są zaburzenia ze strony centralnego układu nerwowego tj. niepokój, pobudzenie, gonitwa myśli, bezsenność, drgawki, kołatanie serca, ból brzucha, biegunka, nudności i wymioty.

Postępowanie po przedawkowaniu

Pacjenta należy natychmiast przewieźć do szpitala.

Postępowanie zależy od wielkości przyjętej dawki, stadium i objawów klinicznych.

Należy zastosować środki mające na celu zmniejszenie wchłaniania substancji czynnej: płukanie żołądka, podanie węgla aktywowanego oraz kontrolować równowagę kwasowo - zasadową (niezbędna jest kontrola następujących parametrów krwi: pH, pCO₂, stężenia wodorowęglanów, stężenia potasu). Jeśli zachowana jest prawidłowa czynność nerek, można zastosować diurezę alkaliczną aż do uzyskania pH moczu w zakresie 7,5-8; w przypadku stężenia salicylanów w osoczu powyżej 500 mg/l (3,6 mmol/l) u dorosłych lub 300 mg/l (2,2 mmol/l) u dzieci należy rozważyć możliwość zastosowania forsowanej diurezy alkalicznej. Należy stosować wlewy dożylnie zawierające NaHCO₃, KCl oraz leki moczopędne.

W przypadku wystąpienia objawów pobudzenia centralnego układu nerwowego podaje się pochodne 1,4-benzodiazepiny.

W przypadkach ciężkiego zatrucia można zastosować hemodializę lub dializę otrzewnową.

Należy uzupełniać płyny oraz prowadzić ogólne postępowanie objawowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: inne leki przeciwbólowe i przeciwgorączkowe, kwas salicylowy i jego pochodne, kwas acetylosalicylowy, mieszaniny z wyłączeniem leków psycholeptycznych; kod ATC: N 02 BA 51.

Salicylany, działają depresyjnie na ośrodki podkorowe mózgu, działają przeciwbólowo oraz przeciwgorączkowo u ludzi z podwyższoną temperaturą ciała. Działanie przeciwbólowe salicylanów jest znacznie słabsze niż opioidowych leków przeciwbólowych. Salicylany są nieskuteczne w bólach pochodzenia trzewnego. Działają natomiast w bólach głowy, zębów, tkanki mięśniowej i stawów. Zaletą ich

jest to, że nie wywołują głębszych zaburzeń czynności psychicznych, euforii, tolerancji i nie prowadzą do przyzwyczajania. Są obecnie najpopularniejszymi lekami przeciwbólowymi i przeciwgorączkowymi.

Salicylany wpływają na czynność oddechową. Przez zwiększenie procesów utleniania w organizmie zwiększają stężenie dwutlenku węgla, który powoduje pobudzenie ośrodka oddechowego i zwiększenie wentylacji pęcherzyków płucnych. Nie zmienia się natomiast częstość oddychania. Stosowanie równocześnie z salicylanami morfiny lub barbituranów może wywołać kwasicę oddechową: wymienione leki hamują bowiem wrażliwość ośrodka oddechowego na dwutlenek węgla i powodują zwiększenie jego stężenia we krwi. Oprócz tego pośredniego działania na ośrodek oddechowy, salicylany zastosowane w dużych dawkach bezpośrednio pobudzają ośrodek oddechowy, zwiększają głębokość i częstość oddechów.

Na skutek hiperwentylacji zmniejsza się stężenie dwutlenku węgla we krwi, co wywołuje zasadowicę. Organizm broni się przed nią przez zwiększenie wydalania nerkowego wodorowęglanów. Wraz ze wzmożonym wydalaniem wodorowęglanów występuje utrata jonów sodowych i potasowych. Wytwarza się więc stan wyrównanej zasadowicy oddechowej. Salicylany w dużych dawkach powodują dalsze zmniejszenie pH krwi i stężenia wodorowęglanów oraz hamują wrażliwość ośrodka oddechowego na dwutlenek węgla. Wytwarza się więc również nie wyrównana kwasica oddechowa. Na skutek zmniejszenia się pH krwi, spowodowanego nie wyrównaną kwasicą oddechową, salicylany we krwi dysocjują i w postaci zjonizowanej wypierają z krwi wodorowęglany.

Duże dawki salicylanów porażają ośrodek naczynioruchowy i zaburzając ukrwienie nerek, prowadzą do zahamowania wydzielania z moczem kwasu siarkowego i fosforowego, które gromadzą się w organizmie. Dochodzi również do nagromadzenia się we krwi dużych ilości kwasu acetylooctowego, pirogronowego i mlekowego, co prowadzi do kwasicy metabolicznej. Występuje ona wówczas, gdy stężenie salicylanów we krwi wynosi ok. 3,62 mmol/l. Nie należy przekraczać stężenia 2,53 mmol/l salicylanów we krwi, gdyż niewielkie nawet zwiększenie tego stężenia powoduje powstawanie pierwotnie zasadowicy oddechowej, która następnie zapoczątkowuje wyżej opisane zaburzenia metaboliczne.

Pochodne kwasu salicylowego wywołują owrzodzenia i krwawienia z błony śluzowej żołądka. Mechanizm tego toksycznego wrzodotwórczego działania salicylanów jest związany zarówno z ich właściwościami miejscowo drażniącymi, jak również z hamowaniem biosyntezy prostaglandyn w ścianie żołądka. Prostaglandyny prawdopodobnie pełnią fizjologiczną funkcję ochronną w błonie śluzowej żołądka głównie wskutek hamowania wydzielania soku żołądkowego. Ludzie cierpiący na chorobę wrzodową są szczególnie podatni na to działanie salicylanów. Salicylany mogą powodować nudności, wymioty i bóle żołądka. W dawkach leczniczych salicylany nie wpływają na układ sercowo-naczyniowy.

Ostatnio wykazano silne działanie salicylanów, zwłaszcza kwasu acetylosalicylowego, hamujące agregację płytek krwi. Działanie to jest spowodowane hamowaniem syntezy tromboksanu A, jednego z metabolitów kwasu arachidowego, który jest najsilniejszą substancją endogenną, wytwarzaną w płytkach krwi i powodującą ich agregację.

W związku z tym w ścianach naczyń krwionośnych znajduje się więcej prostacykliny (PGI₂), innego metabolitu kwasu arachidowego silnie hamującego agregację płytek krwi. Wskutek tego kwas acetylosalicylowy działa zapobiegawczo w powstawaniu zawałów serca.

Salicylany stosowane w dużych dawkach, działając antagonistycznie w stosunku do witaminy K, mogą spowodować hipoprotrombinemię. Wywołują ponadto hipoglikemię, spowodowaną zwiększoną glikolizą oraz zmniejszoną glikoneogenezą.

Salicylany zwiększają wydalanie kwasu moczowego z moczem, co ma pewne zastosowanie w leczeniu dny moczanowej.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Salicylany łatwo wchłaniają się z przewodu pokarmowego, częściowo w żołądku, głównie zaś w górnym odcinku jelita cienkiego. Szybkość wchłaniania zależy od stopnia jonizacji i wartości pH w danym odcinku przewodu pokarmowego. Salicylany, jako słabe kwasy, są częściowo zjonizowane w środowisku zasadowym, w środowisku kwaśnym natomiast występują głównie w formie niezjonizowanej, która łatwo się wchłania. Stosowanie zatem środków neutralizujących łącznie z salicylanami, chociaż zmniejsza ich działanie drażniące na błonę śluzową żołądka, zmniejsza również w pewnym stopniu ich wchłanianie w żołądku.

Salicylany łatwo przenikają do różnych tkanek i płynów ustrojowych, m.in. przez łożysko do tkanek płodu. W organizmie są metabolizowane do kwasu salicylomoczowego, kwasu gentyzynowego oraz są sprzęgane z kwasem glukuronowym. Zazwyczaj tylko 10 % salicylanów wydalają się z moczem w stanie nie zmienionym.

Pochodne kwasu salicylowego powoli wydalają się z moczem, mogą się więc kumulować w organizmie. Alkalizacja moczu zwiększa 4-krotnie szybkość wydalania salicylanów.

W chorobach nerek oraz przy równoczesnym stosowaniu leków, które konkurują z salicylanami o mechanizmy transportujące w kanalikach nerkowych (probenecyd, acetazolamid), szybkość wydalania salicylanów zmniejsza się, co przyczynia się do ich kumulacji w organizmie. Salicylany wiążą się w 50 – 80 % z albuminami krwi. Z tego powodu w reumatoidalnym zapaleniu stawów, często przebiegającym z hipoalbuminemią, stężenie wolnych salicylanów w surowicy jest znacznie większa niż u ludzi z prawidłowym stężeniem albumin. W tej sytuacji już dawki lecznicze mogą spowodować zatrucie. Kwas acetylosalicylowy może u niektórych ludzi spowodować acetylację lizyny, aminokwasu znajdującego się w albuminach. Ta przemiana aminokwasu może wywołać zmianę antygenowości albumin oraz wystąpienie nadwrażliwości na kwas acetylosalicylowy. Po tych samych dawkach salicylanów występują różne ich stężenia we krwi u poszczególnych ludzi. Dlatego też przy stosowaniu dużych dawek salicylanów należy oznaczać ich stężenie w surowicy, aby uniknąć wystąpienia działań niepożądanych. Dłuższe stosowanie salicylanów nie wywołuje tolerancji.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

W badaniach na zwierzętach salicylany powodowały uszkodzenie nerek, lecz nie wywoływały innych zmian chorobowych.

Kwas acetylosalicylowy został przebadany pod kątem działania mutagennego i rakotwórczego. Nie znaleziono dowodów, świadczących o właściwościach mutagennych i rakotwórczych kwasu acetylosalicylowego.

Badania na zwierzętach wykazały teratogenne działanie kofeiny, jednakże w badaniach u ludzi nie wykazano związku pomiędzy występowaniem wad wrodzonych, a spożyciem kofeiny przez kobiety w ciąży.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Skrobia ziemniaczana, talk

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C, chronić od światła.
Przechowywać w miejscu niedostępnym i niewidocznym dla dzieci
Nie należy stosować leku Etomar po upływie terminu ważności zamieszczonego na opakowaniu.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

6 tabletek w blistrze z folii celofanowej i papieru laminowanego polietylenem w tekturowym pudełku.
8 tabletek w blistrze PVC/Al w tekturowym pudełku.

6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Vitama S.A.
ul. Bonifraterska 17
00-203 Warszawa

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr 4341

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

17.08.1999 r. / 11.03.2004 r. / 18.06.2007 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO