

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Scorbolamid, 300 mg + 100 mg + 5 mg, tabletki drażowane

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda tabletki drażowana zawiera: 300 mg salicylamidu (*Salicylamidum*), 100 mg kwasu askorbowego (*Acidum ascorbicum*), 5 mg rutozydu (*Rutosidum*).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu: sacharoza i żółcień chinolinowa (E104).

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Tabletki drażowane

Okrągłe, obustronnie wypukłe tabletki drażowane, barwy żółtej

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Gorączka i ból związane z przeziębieniem lub grypą, bóle głowy, nerwobóle.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dorośli i młodzież w wieku powyżej 16 lat:

Doustnie, zwykle 1 do 2 tabletek drażowanych 3 razy na dobę.

Produkt najlepiej przyjmować w czasie posiłku albo popić szklanką wody lub mleka.

Należy stosować najmniejsze skuteczne dawki. Leczenie objawowe bez porady lekarskiej należy prowadzić najkrócej jak to możliwe.

4.3 Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na substancje czynne lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1;
- nadwrażliwość na inne niesteroidowe leki przeciwzapalne;
- astma z polipami nosa (wywołana lub zaostrzona przez kwas acetylosalicylowy);
- czynna choroba wrzodowa żołądka i dwunastnicy, stany zapalne przewodu pokarmowego;
- zaburzenia równowagi kwasowo-zasadowej (cukrzyca, mocznica, tężyczka);
- zaburzenia krzepliwości krwi (np. hemofilia, trombocytopenia);
- genetycznie uwarunkowany niedobór dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej (ryzyko hemolizy po długotrwałym, doustnym przyjmowaniu kwasu askorbowego);
- kamica nerkowa w wywiadzie (ryzyko powstawania kamieni moczowych po zastosowaniu dużych dawek kwasu askorbowego);
- hemochromatoza, niedokrwistość syderoblastyczna, nadmierna ilość kwasu moczowego we krwi lub szczawianów w moczu;
- ciąża;
- karmienie piersią.

Produktu nie należy stosować u dzieci w wieku poniżej 16 lat, poza rzadkimi chorobami, takimi jak np. choroba Kawasaki, ze względu na ryzyko wystąpienia zespołu Reye'a.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Lek stosować ostrożnie w astmie oskrzelowej (możliwość nasilenia napadów astmy), w niewydolności wątroby lub nerek oraz u pacjentów po przebytej chorobie wrzodowej i krwawieniach z przewodu pokarmowego.

Produkt zawiera sacharozę. Pacjenci z rzadkimi dziedzicznymi zaburzeniami związanymi z nietolerancją fruktozy, zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy lub niedoborem sacharazy-izomaltazy, nie powinni przyjmować produktu leczniczego.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Salicylamid:

- zwiększa stężenie kwasu acetylosalicylowego i niesteroidowych leków przeciwzapalnych (np. ibuprofenu, diklofenaku) w surowicy krwi;
- nasila objawy niepożądane ze strony przewodu pokarmowego podczas równoczesnego stosowania z kortykosteroidami;
- nasila działanie doustnych leków przeciwcukrzycowych z grupy sulfonilomocznika (tolbutamid, chlorpropamid), leków przeciwzakrzepowych z grupy kumaryny i heparyny (większe ryzyko krwawień i wydłużenia czasu krwawienia), metotreksatu, kwasu walproinowego oraz sulfonamidów;
- zmniejsza skuteczność leków stosowanych w dnie moczanowej (probenecyd, sulfinpirazon).

Kwas askorbowy:

- może zmniejszać skuteczność warfaryny i stężenie flufenazyny w osoczu;
- zmniejsza pH moczu, co może mieć wpływ na wydalanie innych, równocześnie stosowanych leków.

Rutozyd:

- nie należy stosować z sulfonamidami.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę lub laktację

Ciąża

Bezpieczeństwo stosowania salicylamidu u kobiet w ciąży oraz w okresie karmienia piersią nie zostało ustalone. Lecz z uwagi na to, że istnieją dane świadczące o działaniu teratogennym salicylamidu u zwierząt doświadczalnych nawet po zastosowaniu niskich dawek (patrz punkt 5.3), produktu nie należy stosować u kobiet w ciąży.

Karmienie piersią

Nie należy stosować produktu w okresie karmienia piersią.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Brak danych na temat przeciwwskazań do prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn w czasie stosowania produktu.

4.8 Działania niepożądane

Najczęstsze objawy niepożądane, o stopniu nasilenia zależnym od dawki salicylamidu obserwowano ze strony przewodu pokarmowego i ośrodkowego układu nerwowego. Występowały one rzadko po dawkach salicylamidu wynoszących 325-600 mg, częściej po dawkach wyższych.

Zaburzenia żołądka i jelit

nudności, wymioty, skurcze w obrębie jamy brzusznej, uczucie palenia za mostkiem, brak łaknienia, biegunka, podrażnienie błony śluzowej żołądka i dwunastnicy (nadżerki i owrzodzenia), suchość w jamie ustnej.

Nie obserwowano wyraźnego związku między stosowaniem salicylamidu i krwawieniem z przewodu pokarmowego.

Zaburzenia układu nerwowego

zawroty głowy, senność, bóle głowy.

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

zaczerwienienie twarzy, wysypka, nadmierna potliwość.

Produkt należy stosować ostrożnie u pacjentów, u których kwas acetylosalicylowy lub inne niesteroidowe leki przeciwzapalne wywoływały wysypkę, obrzęk naczynioruchowy, skurcz oskrzeli, nieżyt nosa lub wstrząs. Choć nie dowiedziono, że salicylamid wywołuje wszystkie działania niepożądane charakterystyczne dla salicylanów, to ze względu na podobieństwo budowy i działania farmakologicznego istnieje możliwość ich wystąpienia.

Kwas askorbowy zmniejsza pH moczu, co ułatwia wytrącanie się moczanów, cystyny lub szczawianów.

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

02-222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

e-mail: ndl@urpl.gov.pl

4.9 Przedawkowanie

W badaniach na zwierzętach wykazano, że toksyczność salicylamidu i salicylanów jest podobna.

Dawka śmiertelna salicylamidu wynosi 0,5-5 g/kg mc.

Po przedawkowaniu salicylamidu może wystąpić depresja ośrodkowego układu nerwowego, hipotensja, zatrzymanie oddechu, kwasica metaboliczna lub hipoprotrombinemia.

W przypadku ostrego zatrucia należy opróżnić żołądek przez wywołanie wymiotów lub płukanie żołądka. Następnie podać węgiel aktywowany oraz zastosować leczenie objawowe, którego podstawą jest uzupełnienie płynów.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: salicylamid w połączeniach z innymi lekami z wyjątkiem leków psychotropowych, kod ATC: N02BA55

Salicylamid jest amidem kwasu salicylowego, należy do niesteroidowych leków przeciwzapalnych (NLPZ). Salicylamid wykazuje porównywalne do innych salicylanów działanie przeciwbólowe, przeciwgorączkowe i przeciwzapalne. W porównaniu z kwasem acetylosalicylowym działa silniej przeciwbólowo, natomiast wykazuje słabsze działanie przeciwzapalne i przeciwgorączkowe.

Mechanizm działania salicylamidu polega na hamowaniu syntezy prostaglandyn na skutek zahamowania cyklooksygenazy kwasu arachidonowego.

Salicylany działają przeciwbólowo obwodowo, przez blokowanie wytwarzania impulsów bólowych i w ośrodkowym układzie nerwowym, prawdopodobnie w podwzgórzu. Przeważać może działanie obwodowe. Obejmuje prawdopodobnie hamowanie wytwarzania prostaglandyn, a także hamowanie wytwarzania i (lub) działania innych substancji, które uczulają receptory bólowe na stymulację mechaniczną lub chemiczną.

Mechanizm działania przeciwzapalnego nie został określony. Salicylany mogą działać przeciwzapalnie obwodowo, prawdopodobnie przez hamowanie syntezy prostaglandyn, a możliwe jest, że przez hamowanie wytwarzania i (lub) działania innych mediatorów odpowiedzi w procesie zapalnym.

Działanie przeciwgorączkowe może być skutkiem działania na ośrodek regulacji temperatury w podwzgórzu, rozszerzenia obwodowych naczyń krwionośnych i zwiększenia przepływu krwi w naczyniach skórnych co powoduje utratę ciepła. Działanie w ośrodkowym układzie nerwowym może obejmować hamowanie wytwarzania prostaglandyn w podwzgórzu.

W badaniach na zwierzętach, salicylamid działał hipotensyjnie, prawdopodobnie poprzez rozszerzenie obwodowych naczyń krwionośnych i działanie hamujące na ośrodkowy układ nerwowy.

Rutozyd jest związkiem flawonoidowym o budowie polifenolowej. Wzmacnia on ściany naczyń krwionośnych zmniejszając ich przepuszczalność i łamliwość. Wykazuje także działanie przeciwzapalne (przede wszystkim poprzez wpływ na procesy peroksydacji w ustroju), działanie przeciwwirusowe i immunostymulujące. Wpływa stabilizująco na działanie witaminy C oraz wykazuje działanie antyoksydacyjne po jednoczesnym podaniu z kwasem askorbowym (jako antyoksydant chroni witaminę C przed utlenieniem i dlatego witamina ta dłużej działa). Rutozyd zwiększa również wchłanianie kwasu askorbowego.

Kwas askorbowy (witamina C) odgrywa istotną rolę w procesach oksydacyjno-redukcyjnych zachodzących w ustroju. W wielu badaniach potwierdzono, że kwas askorbowy wpływa na procesy związane z odpornością ustroju, a także wykazuje wielokierunkowe działanie przeciwzapalne i działanie przeciwwirusowe (wpływa na proces wewnątrzkomórkowej replikacji wirusów). Wykazano także, że po podaniu kwasu askorbowego wzrasta poziom interferonu, co uzasadnia wskazanie do stosowania tych związków w infekcjach wirusowych i bakteryjnych. Ponadto witamina C bierze udział w procesach uszczelniania naczyń włosowatych oraz w aktywacji trombiny (przyspiesza krzepnięcie krwi). Jest również niezbędna do syntezy kolagenu i substancji międzykomórkowej. Kwas askorbowy bierze też udział pośrednio w procesach metabolicznych fenylalaniny, tyrozyny, kwasu foliowego, noradrenaliny, histaminy, żelaza, a także lipidów, białek i karnityny. Jest niezbędny do hydroksylacji hormonów kory nadnerczy.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Salicylamid po podaniu doustnym szybko i prawie całkowicie wchłania się z przewodu pokarmowego. W dawce zwykle stosowanej jest prawie całkowicie metabolizowany do nieaktywnych metabolitów, już podczas procesu wchłaniania i w wyniku efektu pierwszego przejścia przez wątrobę.

Tylko śladowe ilości leku w postaci niezmienionej są wykrywane w osoczu.

W badaniach na zdrowych, dorosłych ochotnikach otrzymujących salicylamid w dawkach pojedynczych 650 mg, 1,3 g, 1,95 g, 2,6 g doustnie, maksymalne stężenie niezmienionego salicylamidu w surowicy uzyskano w czasie 20-60 minut i wynosiło przeciętnie, odpowiednio mniej niż 1 µg/ml, 2 µg/ml, 4 µg/ml i 7 µg/ml.

U pacjentów z marskością wątroby, C_{max} salicylamidu było większe niż u zdrowych osobników, ponieważ w marskości wątroby, zdolność metabolizowania leku jest mniejsza, w czasie pierwszego przejścia przez wątrobę.

Kwas askorbowy łatwo wchłania się po podaniu doustnym; w mniejszym stopniu u pacjentów z biegunką lub ze schorzeniami przewodu pokarmowego. Przy podaży kwasu askorbowego w ilości

30-180 mg, czyli ilości dostarczanej w normalnej diecie, wchłania się 70-85% podanej ilości. Po zwiększeniu dawki ilość wchłaniania kwasu askorbowego spada proporcjonalnie do przyjętej dawki i po podaniu 12 g/dobę wchłania się tylko 16% tej ilości.

Dystrybucja

Salicylamid szybko przenika do wielu tkanek, takich jak: mięśnie, wątroba i mózg. Nie wiadomo do tej pory, czy salicylamid i jego metabolity przenikają przez barierę łożyskową lub do mleka kobiecego. *In vitro* w 40-55% wiąże się z białkami surowicy w stężeniu 20-500 µg/ml.

Kwas askorbowy, podobnie jak salicylamid rozmieszcza się szybko w tkankach.

Największe stężenia występują w wątrobie, leukocytach, trombocytach i w soczewce oka.

Około 25% kwasu askorbowego wiąże się z białkami osocza.

Przenika on przez barierę łożyskową i do mleka kobiecego. Stężenie w krwi pępowinowej jest 2 do 4 razy większe niż w krwi matki.

Metabolizm

Salicylamid podlega efektowi pierwszego przejścia w wątrobie. Podstawowe metabolity to formy sprzężone z kwasem siarkowym i glukuronowym oraz gentyzamid i jego glukuronid.

Kwas askorbowy jest metabolizowany w wątrobie i w pewnym stopniu w nerkach do nieaktywnych metabolitów: siarczanu i szczawianu kwasu askorbowego.

Stwierdzono, że kwas askorbowy po podaniu wysokich dawek ulega szybkiemu metabolizmowi, a końcowym produktem jest dwutlenek węgla wydalany z wydychanym powietrzem.

Metabolizm rutozydu rozpoczyna się w jelicie cienkim i w okrężnicy pod wpływem mikroflory jelitowej. Czynnym metabolitem rutozydu jest kwercetyna.

Eliminacja

Okres półtrwania salicylamidu i jego metabolitów u zdrowych osób dorosłych wynosi 1,2 godziny (w oparciu o testy wydalania w moczu).

Salicylamid i jego metabolity są szybko wydalane z moczem.

U osób z prawidłową czynnością wątroby i nerek 90-100% pojedynczej dawki leku podanego doustnie wydalane jest z moczem w czasie doby. Po zażyciu, przez osoby dorosłe, salicylamidu w dawce 150 mg do 1 g, około 40-70% tej dawki wydalane jest z moczem w postaci glukuronianów, 25-50% w postaci siarczanów, 5-10% jako glukuronian gentyzamid i mniej niż 5% w postaci niezmienionej.

Kwas askorbowy jest wydalany z moczem w formie nieaktywnych metabolitów oraz jako związek niezmieniony.

Próg nerkowy dla kwasu askorbowego wynosi około 14 µg/ml. Po osiągnięciu progu nerkowego kwas askorbowy wydalany jest z moczem w postaci niezmienionej.

Rutozyd jest wydalany z moczem w formie szeregu metabolitów, a także część związku, która nie uległa metabolizmowi prawdopodobnie wydalana jest z kałem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Mutagenność

W przeprowadzonych badaniach nie stwierdzono działania mutagennego salicylamidu ani kwasu askorbowego. Istnieją dane wskazujące, że rutozyd w niektórych badaniach wykazywał działanie mutagenne, natomiast większość danych wskazuje, że jest to związek o działaniu antymutagennym.

Karcynogenność

Salicylamid, podobnie jak inne pochodne kwasu salicylowego, nie wykazuje działania rakotwórczego. Wyniki badań wskazują, że także kwas askorbowy i rutozyd nie działają karcynogenicznie. Natomiast istnieje wiele prac, których wyniki potwierdzają działanie przeciwnowotworowe kwasu askorbowego i rutozydu.

Teratogenność

W badaniach na zwierzętach salicylamid wykazywał wpływ na procesy reprodukcji. U chomików po podaniu salicylamidu ciężarnym samicom zaobserwowano zmiany degeneracyjne zarodków oraz zniekształcenia płodów (niepełne wykształcenie czaszki, krwiaki podskórne, obrzęki ciała, przepuklina pępkowa, bielactwo uogólnione). U szczurów po podaniu salicylamidu ciężarnym samicom również odnotowano zmiany teratogenne. Dotyczyły one między innymi: zewnętrznych zmian płodów w obrębie kończyn, zmiany kształtu ogona lub jego brak, lordoza, zniekształcenie w obrębie odcinka lędźwiowego kręgosłupa, zmiany kształtu żeber czy zrośnięcie jelit.

Kwas askorbowy i rutozyd nie wywoływały zmian świadczących o działaniu toksycznym na procesy reprodukcji, a wręcz przeciwnie - wykazują działanie ochronne.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Rdzeń:

Skrobia ziemniaczana

Żelatyna

Talk

Woda oczyszczona

Otoczka:

Sacharoza

Talk

Guma arabska

Żółcień chinolinowa (E104)

Wosk Carnauba

Woda oczyszczona

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie obserwowano.

6.3 Okres ważności

2 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w suchym miejscu, w temperaturze do 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry z folii Aluminium/PCV. W opakowaniu zewnętrznym, wykonanym z litografowanego kartonu znajduje się 6, 10, 20 lub 40 tabletek drażowanych.

Nie wszystkie wielkości opakowania muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Zakłady Farmaceutyczne POLPHARMA SA
ul. Pelplińska 19
83-200 Starogard Gdański

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Pozwolenie nr R/0340

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 21.03.1983 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 27.01.2014 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

01.07.2015 r.

*ChPL zgodna z Zawiadomieniami Prezesa URPLW MiPB
nr UR.DZL.ZLN.4020.01215.2015.MW.2 i UR.DZL.ZLN.4020.01215.2015.MW.2 z dn. 01.07.2015 r.*