

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

ETOLAC®/ЕТОЛАК® 200 mg филм-обложени таблети

Димитар
16/12/2010

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

1 филм-обложена таблета содржи 200 mg етодолак.
За целосна листа на ексципиенти, видете го делот 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

* филм-обложена таблета
Кафеава, округла биконвексна таблета со делбена линија на едната страна.

4. КЛИНИЧКИ ОСОБЕНИТОСТИ

4.1 Терапевтски индикации

Етодолак е индициран за акутно и долготрајно лекување на:

- воспалителни и дегенеративни заболувања на остеоартикуларниот систем (ревматоиден артритис, остеоартритис, анкилозен спондилитис, остеоартроза, артритис при системски заболувања на сврзното ткиво, вонзглобен ревматизам);
- ослободување од блага или умерено тешка болка при спортски повреди, постоперативна болка, дентална болка итн.

4.2 Дозирање и начин на примена

Возрасни:

Препорашачана доза е 400-600 mg дневно поделено во две или три поединечни дози или како еднократна дневна доза.

Постари лица:

Дозата на етодолак кај постари лица не е потребно да се приспособи; сепак, употребата треба да биде со претпазливост бидејќи постарите лица се поосетливи на несаканите дејства.

Деца:

Не се препорачува употреба на етодолак кај деца под 6 годинишна возраст бидејќи неговата безбедност и ефикасност не е доволно испитана.

4.3 Контраиндикации

Преосетливост на етодолак, аспирин или други нестероидни антиинфламаторни лекови (НСАИЛ);

Активен гастричен и дуоденален улкус;

10/2010



Димитар

Гастроинтестинални крвавења;
Бременост и доене;
Уртикарија;
Бронхијална астма.

4.4 Посебни предупредувања и мерки на претпазливост

Кај пациентите кои употребуваат долготрајно НСАИЛ можат да јават сериозни гастроинтестинални несакани ефекти, вклучувајќи: улцерации, крвавења или перфорација. Доколку се појави било каков симптом на гастроинтестинално крварење, потребно е веднаш да се престане со земање на лекот.

Како и при примена на другите НСАИЛ, потребна е претпазливост кај пациенти со бубрежна, срцева или хепатална инсуфициенција бидејќи може да дојде до влошување на бубрежната функција. Дозата треба да биде пониска и потребно е мониторирање на бубрежната функција.

Потребна е редовна контрола на хепаталната и бубрежната функција, како и на хематолошките параметри кај пациентите кои долготрајно употребуваат етолак.

Претпазливост е потребна кај пациенти со историја за бронхијална астма или кои имаат бронхијална астма, бидејќи е познато дека етолак предизвикува бронхоспазам кај истите.

Етолак треба да се употребува со претпазливост и кај пациенти со ретенција на течности, хипертензија или срцева слабост.

Пациентите кои се на долготрајна терапија со етолак особено постарите, треба да се мониторираат за потенцијалните несакани дејства и доколку е потребно дозата да се приспособи кај истите.

Сите лекови кои ја инхибираат синтезата на простагландините, како и етодолакот можат да интерферираат со функцијата на тромбоцитите. Кај пациентите кои може да бидат засегнати потребно е редовно мониторирање.

Важни информации за составните делови на Етолак

Етолак содржи лактоза. Етолак не треба да се употребува кај пациентите со ретка херидитарна интолеранција на галактоза, Ларр-лактоза инсуфициенција или глукоза-галактоза малапсорпција.

4.5 Интеракции со други медицински производи и други форми на интеракција

Варфарин – Продолжување на протромбинското време може да се јави при истовремена администрација на етолак (НСАИЛ) со варфарин, доведувајќи до зголемен ризик од крварење.

Циклоспорин, Дигоксин, Литиум, Метотрексат – Зголемување на концентрацијата на истите во плазмата. Зголемена е нефротоксичноста асоцирана со циклоспорин.

Бидејќи етолак екстензивно се врзува за плазматските протеини, потребно е модифицирање на дозите на другите лекови кои исто така се врзуваат за протеините.

Билирубинските тестови може да бидат лажно позитивни, поради присуство на фенолни метаболити во урината.

Потребна е претпазливост кај пациентите кои примаат некои од следниве лекови:

Антихипертензивни: намален е антихипертензивниот ефект;

Мифепристон: НСАИЛ не треба да се употребуваат од 8 до 12 дена по престанок на терапијата со мифепристон, бидејќи може да го редуцираат ефектот на истиот.

Да се избегнува употреба на два или повеќе НСАИЛ истовремено.



 2

Кинолонски антибиотици: зголемен е ризикот од развој на конвулзии кај пациентите кои истовремено примаат НСАИЛ и кинолони.

4.6 Бременост и лактација

Етодолак не треба да се употребува за време на бременоста поради немање на адекватни и добро-контролирани студии кај бремени жени. Во студиите за тератогеност кај животни, лековите кои ја инхибираат синтезата на простагландините предизвикале дисточија, одложено породување и интерферираше со затварањето на ductus arteriosus. Етолак не треба да се употребува за време на бременоста.

Не е позната безбедноста на етолак за време на доењето, поради тоа неговата употреба за време на доењето треба да се одбегнува.

4.7 Влијание врз способноста за возење или управување со машини

Нема.

4.8. Несакани дејства

Несаканите дејства се класифицирани според органските системи.

Нарушувања на крвните клетки и на лимфниот систем: тромбоцитопенија, неутропенија, агранулоцитоза, анемија.

Нарушувања на имунолошкиот систем: анафилактична реакција, фотосензитивност, Стивенс-Џонсонов синдром, ангионевротски едем.

Нарушувања на нервниот систем: депресија, главоболка, вртоглавица, инсомнија, конфузија, парестезија, тремор, слабост, нервоза.

Нарушувања на сетилото за вид: нејасен вид.

Нарушувања на увото и на лабиринтот: тинитус.

Срцеви нарушувања: палпитации, зашеметеност.

Васкуларни нарушувања: васкулитис.

Нарушувања на респираторниот систем, тораксот и на медијастинумот: диспнеа.

Нарушувања на гастроинтестиналниот систем: гадење, повраќање, диспепсија, епигастрична болка, стоматитис, гастритис, колитис, болка во абдомен, констипација, флатуленција, хематемеза, мелена, ГИТ улцерации, дијареа, индигестија, жгаравица, ректално крварење.

Хепатобилијарни нарушувања: абнормалности во хепаталната функција, жолтица, билирубинурија.

Нарушувања на кожата и на поткожните ткива: исип, пруритус, уртикарија.

Нарушувања на бубрезите и уринарниот систем: дизурија, често уринирање (<1%), интерстицијален нефритис, нефритичен синдром, бубрежна слабост.

Општи нарушувања: едем, астенија, замор, треска и грозница.

4.9 Предозирање

Симптомите кои го следат предозирањето со НСАИЛ обично се гадење, повраќање, епигастрична болка, летаргија и сонливост, кои главно се реверзибилни со супортивна терапија. Гастроинтестинални крвавења можат да се појават исто така, по масивни предозирања. Хипертензија, акутна ренална слабост и респираторна депресија можат да се јават ретко.



Пациентите треба да се лекуваат со симптоматска и супортивна терапија. Не постојат специфични антидоти. Цревната деконтаминација е индицирана кај пациенти во рок од 4 часа по ингестијата, со симптоми или по големи предозирања (5 до 10 пати поголеми од вообичаената доза). Тогаш е индицирана лаважа на желудник или употреба на активен јаглен (60 до 100 g кај возрасни, 1 до 2 g/kg кај деца). Форсирана диуреза, алкализирање на урината, хемодијализа или хемоперфузија веројатно не се корисни заради високото врзување за плазма протеините на етодолак.

5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

Фармако-терапевтска група: нестероиден антиинфламатор и антиревматик,
АТС код: M01AB08

5.1 Фармакодинамски својства

Етодолак е нестероиден антиинфламаторен лек (НСАИЛ) со антиинфламаторни, аналгетски и антипиретички својства. Механизмот на дејство е преку инхибиција на ензимот цикло-оксигеназа, кој е инволвиран во простагландинската синтеза.

5.2 Фармакокинетски својства

Етодолак брзо и добро се ресорбира даден орално и се врзува околу 99% за плазма протеините. Се метаболизира во црниот дроб во различни метаболити кои главно се лачат преку урината. Лекот подлежи на ентерохепатична циркулација кај луѓето; неговиот плазматски полуживот е околу 7 часа.

Етодолак е рацемска мешавина од (-)R- и (+) S-етодолак. Како и другите НСАИЛ, кај животни се демонстрирало дека (+) S-формата е биолошки активна. Двата енантиомери се стабилни и ин виво нема конверзија на (-)R во (+)S.

Апсорпција

Етодолак добро се ресорбира и има релативна биорасположивост од 80% до 100%. Етодолак после орално внесување не подлежи сигнификантно на first pass метаболизам. Средните максимални плазма концентрации се движат околу 14 ± 4 до 37 ± 9 mcg/ml по 200 mg до 600 mg единечна доза и се постигнуваат за 80 ± 30 минути. Дозата пропорционално базирана на AUC е линеарна, следена после дози до 600 mg секои 12 часа. Пик концентрациите се дозно пропорционални за двата, вкупниот и слободниот етодолак, следејќи дози до 400 mg секои 12 часа, но следејќи доза од 600 mg, пикот е околу 20% повисок отколку предвидениот врз основа на пониските дози.

Ефектот на храната клинички е сигнификантен. Пик концентрациите се редуцирани за 50% и времето за достигнување на истите е зголемено за околу 1,4 до 3,8 часа.

Степенот на апсорпција на етодолак не е намален кога етодолак се дава заедно со антациди. Истовременото администрирање со антациди ги намалува пик концентрациите за околу 15% до 20%, но без промена на времето до достигнување на истите.



Дистрибуција

Во опсег на терапевтските дози, етодолак е повеќе од 99% врзан за плазма протеините. Слободната фракција е помалку од 1% и е независна од вкупните концентрации на етодолак надвор од испитуваниот опсег на дози. Полуживото на дистрибуција е 0,71 часа. Етодолак има јасен стеадс-стате волумен на дистрибуција околу 0,362 l/kg. Етодолак покажува 2-компаратментна фармакокинетика; Волуменот на дистрибуција за централниот компартмент е 132 ml/kg.

Метаболизам

Етодолак е широко метаболизиран во црниот дроб, со ренална елиминација на етодолак и неговите метаболити како примарен начин на екскреција. Лекот се метаболизира во неколку неактивни метаболити: глукуронид метаболит, хидроксилан метаболит и хидроксилан глукуронат метаболит.

Елиминација

Полуживотот на елиминација е 6 до 7 часа, а средниот плазма клиренс за етодолак по орално внесување е 47 ± 16 ml/h/kg. Реналната екскреција е околу 72% од внесената доза во опсег како следи: етодолак непроменет 1%, етодолак глукуронид 13%, хидроксилан метаболит 5%, хидроксилан глукуронид метаболит 20%, неидентификувани метаболити 33%. Фекалната екскреција опфаќа 16% од дозата. Не е познато дали се екскретира во мајчиното млеко.

5.3 Предклинички податоци за безбедноста на медицинскиот производ

Во студиите за акутна токсичност LD₅₀ биле многу високи 883 mg/kg и 1.141 mg/kg за машки и женски глвци; 1.000 mg/kg и 1.012 mg/kg за машки и женски заморчиња и 78 mg/kg и 191 mg/kg за машки односно женски стаорци.

Немало никакви промени во студиите за хронична токсичност каде се употребува 2,6 mg/kg до 10 mg/kg етодолак кај стаорци во временски период од 6 месеци или 10 mg/kg за време од 1 година кај кучиња.

Канцерогени дејства на етодолак не се забележани кај глвци и стаорци кои примале орални дози од 15 mg/kg /дневно или помалку за период од 2 години односно 18 месеци. Етодолак не покажал мутагено дејство во ин витро тестовите со S. Typhimurium и во лимфома клетките на глвци, како и во ин виво микронуклеински тест кај глвци. Сепак, податоците од ин витро тестот на хумани периферни лимфоцити покажал зголемување на бројот на пукнатини споредено со контролата; други разлики не биле забележани.

Етодолак не покажал оштетување на фертилноста кај машки и женски стаорци со орални дози до 16 mg/kg. Сепак, редуцирана имплантација на оплодените јајца се покажала во групата со 8 mg/kg.



6. ФАРМАЦЕВТСКИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Листа на ексципиенти

микрокристална целулоза;
лактоза монохидрична;
колоидален анхидричен силициумов диоксид;
талк;
натриум скробен гликолат;
магнезиум стеарат;
повидон;
хипромелоза;
макрогол;
железен оксид црвен;
титаниум диоксид.

6.2 Инкомпатибилност

Не е применливо.

6.3 Рок на траење

Пет (5) години.

6.4 Начин на чување

Да се чува на температура под 25 °C.

6.5 Пакување

Таблетите се пакуваат во кафеаво шише од неутрално стакло, затворени со алуминиумско капаче со полиетиленска влошка.

Кутија со 1 стаклено шише со 20 филм-обложени таблети по 200 mg.

6.6 Инструкции за употреба

Нема посебни барања.

Неискористениот лек или отпадните материјали треба да се отстранат во согласност со законските барања

7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

АЛКАЛОИД АД - Скопје
бул. Александар Македонски 12,
1000 Скопје, Република Македонија
тел.: + 389 2 31 04 000
факс: + 389 2 31 04 021
www.alkaloid.com.mk



8. БРОЈ И ДАТУМ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ
9. ДАТУМ НА ПРВАТА РЕГИСТРАЦИЈА/ОБНОВА НА РЕГИСТРАЦИЈАТА
10. ДАТУМ НА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

10/2010

