

RAVIMI OMADUSTE KOKKUVÕTE

1. RAVIMPREPARAADI NIMETUS

Upstinon, 324 mg kihisevad tabletid

2. KVALITATIIVNE JA KVANTITATIIVNE KOOSTIS

Üks tablett sisaldab 324 mg atsetüülsalitsüülhapet.

INN. *Acidum acetylsalicylicum*

Teadaolevat toimet omav abiaine:

Üks tablett sisaldab 559 mg naatriumi.

Abiainete täielik loetelu vt lõik 6.1.

3. RAVIMVORM

Kihisev tablett.

Valge ümmargune kihisev tablett

4. KLIINILISED ANDMED

4.1 Näidustused

Täiskasvanutel, noorukitel ja lastel alates 9 aasta vanusest:

Valu. Palavik.

4.2 Annustamine ja manustamisviis

Annustamine

Täiskasvanud (üle 16-aastased):

tavaline annus on 1...3 tabletti ühekordse annusena, mida võib korrata 4...8 tunni järel. Maksimaalset ööpäevast annust 12 tabletti ei tohi ületada.

Lapsed ja noorukid (9- kuni 16-aastased): vt lõik 4.4

9- kuni 16-aastastele lastele tohib atsetüülsalitsüülhapet manustada ainult arsti loal. Annus on 1 tablett korraga kuni 3 korda ööpäevas.

Alla 9-aastastele lastele ei sobi Upstinoni kihisev tablett toimeaine suure sisalduse tõttu.

Manustamisviis

Tablett tuleb lahustada klaasitäies vees ja soovitatavalt manustada pärast sööki.

4.3 Vastunäidustused

- Äge peptiline haavand.
- Hemorraagiline diatees.
- Ülitundlikkus toimeaine, teiste salitsülaatide või lõigus 6.1 loetletud mis tahes abiaine(te) suhtes.
- Anamneesis salitsülaatide või sarnase toimega ainete (eriti mittesteroidsete põletikuvastaste ravimite) poolt esile kutsutud astma.

- Kombineeritud ravi metotreksaadiga annuses 15 mg nädalas või rohkem (vt lõik 4.5).
- Raseduse viimane trimester.

4.4 Erihoiatused ja ettevaatusabinõud kasutamisel

Ettevaatlik tuleb olla kui patsiendil on:

- samaaegne ravi antikoagulantidega;
- anamneesis seedetrakti haavand, kaasa arvatud krooniline või korduv haavandtõbi või seedetrakti verejooks;
- neerufunktsiooni häire;
- maksafunktsiooni häire;
- ülitundlikkus põletikuvastaste või antireumaatiliste ravimite või teiste allergeenide suhtes.

Atsetüülsalitsüülhapet ei ole soovitatav lastel ja alla 16-aastastel noorukitel kasutada palavikuga kulgevate viirusinfektsioonide (sh tuulerõuged, gripp) korral, kuna võib tekkida Reye' sündroom (esmanähuna kauakestev oksendamine, maksafunktsiooni häired, entsefalopaatia).

Atsetüülsalitsüülhape võib vallandada bronhospasmi või esile kutsuda astmahoogude või muude ülitundlikkusreaktsioonide tekke. Riskifaktorid on olemasolev bronhiaalastma, heinapalavik, ninapolüübid või krooniline hingamisteedehaigus. See kehtib ka patsientide puhul, kellel tekivad allergilised reaktsioonid (nt nahareaktsioonid, sügelus, urtikaaria) teiste ainete suhtes.

Trombotsüütide agregatsiooni inhibeeriva toime tõttu võib atsetüülsalitsüülhape luua eelsoodumuse verejooksu tekkeks kirurgiliste operatsioonide ajal või järgselt (kaasa arvatud väiksemad kirurgilised protseduurid, nt hambaekstraktsioon).

Väikestes annustes vähendab atsetüülsalitsüülhape kusihaape eritumist. See võib vallandada podagra patsientidel, kellel juba esinevad kusihaape eritumise häired.

Üks Upstinoni kihisev tablett sisaldab 559 mg naatriumi. Seda tuleb arvestada patsientidel, kellel on määratud madala naatriumi sisaldusega dieet või naatriumivaba dieet.

4.5 Koostoimed teiste ravimitega ja muud koostoimed

Vastunäidustatud kombinatsioonid

Metotreksaat annuses 15 mg nädalas või rohkem:

metotreksaadi hematoloogilise toksilisuse suurenemine (metotreksaadi renaalse kliirensi vähenemine põletikuvastaste ravimite toimele üldiselt ja metotreksaadi väljatõrjumine seosest plasmavalkudega salitsülaatide poolt) (vt lõik 4.3).

Kombinatsioonid, mille puhul on vajalik ettevaatusabinõude rakendamine

Metotreksaat annuses alla 15 mg nädalas:

metotreksaadi hematoloogilise toksilisuse suurenemine (metotreksaadi renaalse kliirensi vähenemine põletikuvastaste ravimite toimele üldiselt ja metotreksaadi väljatõrjumine seosest plasmavalkudega salitsülaatide poolt).

Antikoagulandid, nt kumariin, hepariin:

suurenenud verejooksuohu trombotsüütide funktsiooni pärssimise tõttu, mao- ja kaksteistsõrmiksoole limaskestast kahjustus ning suukaudsete antikoagulantide väljatõrjumine seosest plasmavalkudega.

Muud mittesteroidsed põletikuvastased ravimid koos salitsülaatide suurte annustega

(3 g/päevas):

haavandi ja seedetrakti verejooksu tekkeohu suurenemine sünergistliku toime tõttu.

Urikosuurilised ained, nagu bensbromaroon, probenetsiid:

urikosuurilise toime vähenemine (konkureeriv kusihaape tubulaarne eliminatsioon).

Digoksiin:

vähenenud eritumise tõttu neerude kaudu suureneb digoksiini plasmakontsentratsioon.

Diabeedivastased ravimid, nt insuliin, sulfonüüluurea preparaadid:

hüpoglükeemilise toime suurenemine atsetüülsalitsüülhappe suurte annuste toimet atsetüülsalitsüülhappe hüpoglükeemilise toime ja sulfonüüluurea väljatõrjumise tõttu seosest plasmavalkudega.

Trombolüütikumid/teised trombotsüütide funktsiooni pärssivad ained, nt tiklopidiin:

suurenenud verejooksuohu.

Diureetikumid kombinatsioonis atsetüülsalitsüülhappega annuses 3 g/päevas või rohkem:

glomerulaarfiltratsiooni vähenemine renaalsete prostaglandiinide vähenenud sünteesi tõttu.

Süsteemsed glükokortikosteroidid, välja arvatud hüdrokortisoon, mida kasutatakse asendusravina Addisoni tõve korral:

salitsülaatide sisalduse vähenemist veres ravi ajal glükokortikosteroididega ja salitsülaatide üleannustamise ohtu pärast ravi kompenseerib salitsülaatide suurenenud eritumine glükokortikosteroidide toimet.

Angiotensiini konverteeriva ensüümi (AKE) inhibiitorid:

annuste 3 g/päevas ja enam puhul glomerulaarfiltratsiooni vähenemine vasodilatorsete prostaglandiinide pärssimise tõttu. Lisaks antihüpertensiivse toime vähenemine.

Valproehape:

Valproehape suurenenud toksilisus väljatõrjumise tõttu seosest plasmavalkudega.

Alkohol:

atsetüülsalitsüülhappe ja alkoholi aditiivse toime tõttu suureneb seedetrakti limaskestast kahjustus ja pikeneb veritsusaeg.

4.6 Fertiilsus, rasedus ja imetamine

Rasedus

Raseduse viimasel trimestril on Upstinon vastunäidustatud (vt lõik 4.3).

Mitmes epidemioloogilises uuringus on salitsülaatide kasutamist esimesel kolmel raseduskuul seostatud väärarengute (suulaelõhe, südame väärarengud) tekke suurenenud ohuga. Tavaliste terapeutiliste annuste kasutamisel on see risk väike: prospektiivses uuringus, kus osales ligikaudu 32 000 ema-lapse paari, ei ilmnenud seost väärarengute esinemissageduse suurenemisega.

Salitsülaate tohib raseduse ajal kasutada ainult pärast hoolikat riski ja kasu suhte hindamist.

Salitsülaatide suurte annuste (>300 mg/päevas) kasutamine viimasel kolmel raseduskuul võib viia gestatsiooniaja pikenedamiseni, arterioosjuha enneaegse sulgumiseni ja emakakontraktsioonide pärssimiseni. Nii emal kui lapsel on täheldatud suurenenud eelsoodumust verejooksu tekkeks.

Atsetüülsalitsüülhappe suurte annuste (>300 mg/päevas) manustamine vahetult enne sünnitust võib põhjustada koljusiseste verevalumite teket, eriti enneaegsetel imikutel.

Imetamine

Salitsülaadid ja nende metaboliidid erituvad väikestes kogustes rinnapiima. Kuna seni ei ole täheldatud ravimi aeg-ajalt kasutamisel ebasoodsat mõju lapsele, ei ole tavaliselt vaja rinnaga toitmist katkestada. Ent ravimi regulaarsel või suurte annuste kasutamisel tuleb rinnaga toitmine varakult katkestada.

4.7 Toime reaktsioonikiirusele

Upstinon ei oma märkimisväärt toimet autojuhtimise ja masinate käsitsemise võimele.

4.8 Kõrvaltoimed

Seedetrakti häired

Kõhuvalu, kõrvetised, iiveldus, oksendamine.

Väljendunud (veriroe, veriokse) või varjatud seedetrakti verejooks, mis võib põhjustada rauavaegusaneemiat. Verejooksu esineb sagedamini suuremate annuste kasutamisel.

Seedetrakti haavand ja perforatsioon.

Üksikutel juhtudel on kirjeldatud maksafunktsiooni häireid (maksaensüümide aktiivsuse tõusu).

Kesknärvisüsteemi häired

Pearinglus ja tinnitus, mis tavaliselt viitavad üleannustamisele.

Hematoloogilised häired

Trombotsüütide agregatsiooni inhibeeriva toime tõttu võib atsetüülsalitsüülhappe põhjustada verejooksuohu suurenemist.

Ülitundlikkusreaktsioonid

Nt urtikaaria, nahareaktsioonid, anafülaktilised reaktsioonid, astma, Quincke ödeem.

Võimalikest kõrvaltoimetest teatamine

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

4.9 Üleannustamine

Mürgistuse oht on suurem eakatel patsientidel ja eriti väikestel lastel (terapeutiline üleannustamine või sage juhuslik mürgistus), kellel see võib lõppeda surmaga.

Sümptomid

Keskmise raskusega mürgistus:

üleannustamise korral ilmnevad sümptomid on tinnitus, kuulmise langus, peavalu, vertiigo ja segasus seisund, mis vajavad annuse vähendamist.

Raske mürgistus:

palavik, hüperventilatsioon, ketoos, respiratoorne alkaloos, metaboolne atsidoos, kooma, kardiovaskulaarne šokk, hingamispuudulikkus, raske hüpoglükeemia.

Ravi:

- kohene hospitaliseerimine;

- maoloputus, aktiveeritud söe manustamine, happe-leelistasakaalu kontroll;
- uriini leelistamine, et saavutada uriini pH 7,5...8, forsseeritud diureesi kaaluda juhul, kui salitsülaadi plasmakontsentratsioon on üle 500 mg/l (3,6 mmol/l) täiskasvanutel või 300 mg/l (2,2 mmol/l) lastel;
- hemodialüüsi võimalus raske mürgistuse korral;
- vedelikukaotuse asendamine;
- sümptomaatiline ravi.

5. FARMAKOLOOGILISED OMADUSED

5.1 Farmakodünaamilised omadused

Farmakoterapeutiline rühm: salitsüülhape ja selle derivaadid.

ATC-kood: N02BA01

Atsetüülsalitsüülhape kuulub happeliste mittesteroidsete põletikuvastaste ravimite rühma, millel on valuvaigistav, palavikku alandav ja põletikuvastane toime. Toimemehhanism põhineb prostaglandiinide sünteesis osalevate tsüklooksügenaaside pöördumatul inhibeerimisel.

Atsetüülsalitsüülhappe suukaudseid annuseid 0,3...1,0 g kasutatakse valu vaigistamiseks ja palaviku alandamiseks ning liiges- ja lihasvalu leevendamiseks.

Seda kasutatakse ka ägedate ja krooniliste põletikuliste haiguste puhul, nagu reumatoidartriit, osteoartriit ja anküloseeriv spondüliit. Nende haiguste korral kasutatakse üldjuhul suuri annuseid (4...8 g päevas), mis manustatakse väiksemateks annusteks jagatuna.

Atsetüülsalitsüülhape inhibeerib ka trombotsüütide agregatsiooni, blokeerides tromboksaan A₂ sünteesi trombotsüütides. Seetõttu kasutatakse seda mitmesugustel vaskulaarsetel näidustustel annustes 75...300 mg päevas.

5.2 Farmakokineetilised omadused

Imendumine

Pärast suukaudset manustamist imendub atsetüülsalitsüülhape seedetraktist kiiresti ja täielikult. Imendumise ajal ja järgselt muudetakse atsetüülsalitsüülhape aktiivseks põhimetaboliidiks salitsüülhappeks. Atsetüülsalitsüülhappe ja salitsüülhappe maksimaalne kontsentratsioon plasmas saabub vastavalt 10...20 minuti ja 0,3...2 tunni jooksul.

Jotumine

Nii atsetüülsalitsüülhape kui salitsüülhape seonduvad ulatuslikult plasmavalkudega ja jaotuvad kiiresti kõikidesse kehaosadesse. Salitsüülhape eritub rinnapiima ja läbib platsentaarbarjääri.

Metabolism

Salitsüülhappe metabolism toimub põhiliselt maksas; metaboliidid on salitsüluurhape, salitsüülfenoolglükuroniid, salitsüülatsüülglükuroniid, gentiishape ja gentisuurhape.

Eritumine

Salitsüülhappe eliminatsiooni kineetika on annusest sõltuv, kuna metabolismi piirab maksaensüümide võime/maht. Eliminatsiooni poolväärtusaeg on 2...3 tundi väikeste annuste puhul ning kuni ligikaudu 15 tundi suurte annuste puhul. Salitsüülhape ja tema metaboliidid erituvad põhiliselt neerude kaudu.

5.3 Prekliinilised ohutusandmed

Atsetüülsalitsüülhappe prekliiniline ohutusprofiil on hästi dokumenteeritud. Loomkatsetes põhjustasid salitsülaadid neerukahjustust; muid orgaanilisi kahjustusi ei ole leitud. Atsetüülsalitsüülhappe mutageenset ja kartsinogeenset toimet on piisavalt uuritud ning seda ei ole leitud.

6. FARMATSEUTILISED ANDMED

6.1 Abiainete loetelu

Naatriumvesinikkarbonaat,
Veevaba sidrunhape,
Merevaikhape,
Naatriumbensoaat,
Povidoon
Sidruni ja laimi maitseained.

6.2 Sobimatus

Ei ole teada.

6.3 Kõlblikkusaeg

3 aastat.

6.4 Säilitamise eritingimused

Hoida temperatuuril kuni 25 °C, niiskuse ja valguse eest kaitstult.

6.5 Pakendi iseloomustus ja sisu

Ribapakend polüetüleen-alumiiniumpaberist. Pakendis on 4, 6 või 10 kihisevat tabletti. Kõik pakendi suurused ei pruugi olla müügil.

6.6 Erihoiatused ravimpreparaadi hävitamiseks ja käsitlemiseks

Erinõuded puuduvad.

7. MÜÜGILOA HOIDJA

OÜ VITALE-XD
Vanapere tee 3, Pringi, Viimsi
74011 Harjumaa,
Eesti
Tel: 6546922
vitale@vitale.ee

8. MÜÜGILOA NUMBER

814213

9. ESMASE MÜÜGILOA VÄLJASTAMISE/MÜÜGILOA UUENDAMISE KUUPÄEV

26.04.2013

10. TEKSTI LÄBIVAATAMISE KUUPÄEV

Ravimiametis kinnitatud mais 2013