

Charakterystyka środka farmaceutycznego

1. NAZWA HANDLOWA ŚRODKA FARMACEUTYCZNEGO

Tolargin® 300 mg + 40 mg + 0,8 mg, czopki doodbytnicze

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY SUBSTANCJI CZYNNEJ

1 czopek zawiera:

300 mg *Metamizolum natricum* (metamizol sodowy)

40 mg *Papaverini hydrochloridum* (papaweryny chlorowodorek)

0,8 mg *Atropini methonitras* (atropiny metyloazotan)

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

czopki doodbytnicze

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Stany skurczowe mięśni gładkich w obrębie przewodu pokarmowego (kolka wątrobowe, nerkowa, skurcze żołądka lub jelit) oraz zespół napięcia przedmiesiączkowego i bolesne miesiączkowanie.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Doodbytniczo.

Przeciętnie stosuje się 1 do 2 czopków na dobę.

4.3. Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na którykolwiek ze składników preparatu
- jaskra
- zaburzenia rytmu serca, tachykardia
- przerost gruczołu krokowego
- megacolon
- miastenia
- uropatia z niedrożnością dróg moczowych
- atonia jelit
- zmiany w obrazie morfologicznym krwi (agranulocytoza, leukopenia, niedokrwistość)
- ostra porfiria wątrobowe
- ciąża i okres karmienia piersią

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej
00-952 Warszawa
ul. Młodowa 15

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Lek należy stosować ostrożnie u pacjentów:

- z niewydolnością wątroby lub nerek
- z niewydolnością krążenia
- z refluksem żołądkowo - przełykowym, achalazją przełyku, zwężeniem odźwiernika, chorobą wrzodową żołądka i dwunastnicy
- w podeszłym wieku (ze względu na zwiększone ryzyko wystąpienia zaparć, zatrzymania moczu oraz zaburzeń ze strony ośrodkowego układu nerwowego)
- z niedoborem dehydrogenazy glukozy-6-fosforanowej
- z nadczynnością tarczycy

W przypadku utrzymywania się dolegliwości dłużej niż 24 godziny należy skontaktować się z lekarzem.

4.5. Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Lek może zmieniać wyniki badań laboratoryjnych:

- enzymów wątrobowych
- bilirubiny

Nasila działanie innych leków przeciwcholinergicznym, leków przeciwzakrzepowych, pochodnych kumaryny, doustnych leków przeciwcukrzycowych, fenytoiny, sulfonamidów przeciwbakteryjnych.

Nasila działania niepożądane metotreksatu.

Zmniejsza działanie lewodopy.

Jednoczesne stosowanie z chloropromazyną może wywołać ciężką hipotermię.

4.6. Ciąża i laktacja

Kategoria X.

Papaweryna u szczurów nie wywoływała działania teratogennego. U ludzi nie przeprowadzono odpowiednio kontrolowanych badań.

Nie wiadomo, czy przechodzi do mleka matki.

Atropina nie działa teratogenicznie u myszy.

Przechodzi do mleka matki. Może hamować laktację.

Metamizol w badaniach *in vitro* wykazuje właściwości cytotoksyczne.

Wykazuje działanie rakotwórcze u gryzoni oraz mutagenne u bakterii.

Nie odnotowano działania rakotwórczego u ludzi.

Nie dopuszcza się stosowania leku w ciąży.

Nie należy stosować leku w okresie karmienia piersią.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługi urządzeń mechanicznych w ruchu

Lek powoduje upośledzenie sprawności psychofizycznej, zdolności prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługi urządzeń mechanicznych w ruchu.

4.8. Działania niepożądane

- zaburzenia żołądkowo - jelitowe, nudności, wymioty, zaparcia, suchość błon śluzowych;
- zatrzymanie moczu;
- niedokrwistość, agranulocytoza, leukopenia, trombocytopenia, aplazja szpiku (u osób wrażliwych może wystąpić nawet po jednorazowym podaniu);
- bóle i zawroty głowy, zaburzenia widzenia oraz mowy, złe samopoczucie, dezorientacja, senność, omamy;
- podwyższenie ciśnienia śródgałkowego;
- uszkodzenie wątroby i nerek;
- nadmierna potliwość;
- niedociśnienie ortostatyczne, zaburzenia rytmu serca, tachykardia, bradykardia;
- skórne reakcje uczuleniowe, zapalenie spojówek;
- eozynofilia;
- zaostrzenie porfirii

4.9. Przedawkowanie

Ze względu na postać farmaceutyczną mało prawdopodobne.

Objawy związane z przedawkowaniem papaweryny zawartej w preparacie:

nudności, wymioty, zaburzenia czynności ośrodkowego układu nerwowego, drgawki, zaburzenia widzenia, osłabienie, zawroty głowy, tachykardia.

Średnia doustna dawka śmiertelna u szczurów wynosi 360 mg/kg.

Objawy związane z przedawkowaniem atropiny zawartej w preparacie:

zaburzenia widzenia, dezorientacja, trudności w oddychaniu, zawroty głowy, senność, suchość błon śluzowych, omamy, osłabienie, drgawki, drażliwość, tachykardia.

Leczenie:

podawanie dożylnie fizostygminy lub neostygminy, w razie konieczności krótko działające barbiturany lub benzodiazepiny, względnie inne leczenie objawowe.

Objawy związane z przedawkowaniem metamizolu zawartego w preparacie: niedokrwistość, agranulocytoza, leukopenia, trombocytopenia, aplazja szpiku (u osób wrażliwych może wystąpić nawet po jednorazowym podaniu); uszkodzenie wątroby i nerek, zaburzenia żołądkowo – jelitowe, bóle i zawroty głowy, odczyny alergiczne. W przedawkowaniu, jako leczniczy zabieg opisywano - diurezę forsowaną.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

Grupa farmakoterapeutyczna wg kodu ATC: nie podany przez WHO

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Papaweryna - alkaloid występujący w opium. Działa bezpośrednio rozkurczająco na mięśnie gładkie, w tym mięśnie gładkie naczyń, układu oddechowego, pokarmowego i moczowego (działanie częściowo związane z hamowaniem fosfodiesterazy).

Atropina - antagonist receptorów muskarynowych M_1 , M_2 , M_3 . Wywiera działanie na zakończenia nerwowe mięśni gładkich, gruczołów wydzielania zewnętrznego i ośrodkowy układ nerwowy.

Metamizol działa przeciwzapalnie, przeciwbólowo i przeciwgorączkowo.

Należy do grupy pochodnych pirazonu. Hamuje aktywność cyklooksygenazy, zmniejszając syntezę prostaglandyn.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Atropina - po wchłonięciu z przewodu pokarmowego ulega oksydacji i koniugacji do nieaktywnych metabolitów w wątrobie, z czego ok. 2% ulega hydrolizie do tropiny i jej pochodnych. Prawie cała dawka jest wydalana przez nerki, w ok. 30 % w postaci niezmienionej.

Przenika przez barierę krew - mózg, barierę łożyskową, w niewielkim stopniu do mleka matki.

Papaweryna - po wchłonięciu do krwioobiegu ulega demetylacji i sprzęganiu z kwasem glukuronowym lub siarczanami. Z białkami wiąże się w ok. 90% . Ponad 50% dawki jest wydalone przez nerki, z czego mniej niż 1% w postaci niezmienionej. Pozostała część dawki jest wydalana z żółcią.

Metamizol - w przewodzie pokarmowym ulega hydrolizie do 4-metyloaminoantypiryny.

Następnie pod wpływem enzymów wątrobowych podlega przemianie do 4-aminoantypiryny i 4-formyloaminoantypiryny .

4-aminoantypiryna ulega acetylacji do 4-acetyloaminoantypiryny.

W/w związki słabo wiążą się z białkami osocza i w 65% do 70% wydalone są przez nerki.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie.

Papaweryna: średnia doustna dawka śmiertelna u szczurów wynosi 360 mg/ kg.

U szczurów nie wywoływała efektu teratogennego.

Atropina nie działa teratogenicznie u myszy.

Metamizol w badaniach *in vitro* wykazuje właściwości cytotoksyczne.

U gryzoni wykazuje działanie rakotwórcze oraz mutagenne u bakterii.

6. SZCZEGÓŁOWE DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Skład i wykaz substancji pomocniczych

Lecytyna sojowa

Tuszcz obojętny (Witepsol H-15)

6.2. Niezgodności

nie występują

MINISTERSTWO ZDROWIA
Departament Polityki Lekowej
00-952 Warszawa
ul. Młodowa 15

6.3. Okres trwałości

5 lat

6.4. Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

Przechowywać w temperaturze do 25°C.

Przechowywać w miejscu niedostępnym dla dzieci.

6.5. Rodzaj i zawartość pojemnika

10 czopków (2 listki po 5 czopków), listki z folii PVC/PE, tekturowe pudełko.

6.6. Instrukcja dotycząca użytkowania leku

nie dotyczy

7. WYTWÓRCA POSIADAJĄCY ŚWIADECTWO REJESTRACJI

GlaxoSmithKline Pharmaceuticals Spółka Akcyjna

ul. Grunwaldzka 189

60 – 322 Poznań

8. NUMER ŚWIADECTWA REJESTRACJI

Zezwolenie Nr 987

Certyfikat Rejestracyjny Nr 987

Świadectwo Rejestracji Nr – R/1500

9. DATA PIERWSZEGO WPISU DO REJESTRU I PRZEDŁUŻENIA OKRESU WPISU DO REJESTRU

Zezwolenie Nr 987 z 04.01.1971r

Certyfikat Rejestracyjny Nr 987 z 28.09.1990, aneksy z 18.04.1996, 23.02.1998, 21.05.1998

Świadectwo Rejestracji Nr – R/1500 z 17.05.1999, aneksy z 09.06.2000, 20.07.2001,
31.08.2001

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI ŚRODKA FARMACEUTYCZNEGO

GŁÓWNY SPECJALISTA
ds. Rejestracji

Zdzisława Bruner-Woźnicka
Zdzisława Bruner-Woźnicka

MINISTERSTWO ZDROWIA
ZATWIERDZA

dn. *11.04* 20 *03* r.