

RIASSUNTO DELLE CARATTERISTICHE DEL PRODOTTO

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

Saridon compresse

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Una compressa contiene: paracetamolo mg 250, propifenazone mg 150, caffeina mg 25.

Per gli eccipienti, vedere 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICA

Compresse .

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

Trattamento sintomatico di stati dolorosi acuti (mal di testa; mal di denti; nevralgie; dolori mestruali) e di stati febbrili.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

Adulti: 1-2 compresse, fino a 4 compresse nelle 24 ore, con un abbondante sorso d'acqua. Non superare le dosi consigliate: in particolare i pazienti anziani dovrebbero attenersi ai dosaggi minimi sopraindicati.

Non utilizzare per più di 7 giorni senza il consiglio del medico.

4.3 Controindicazioni

- Ipersensibilità ai principi attivi , ad altre sostanze strettamente correlate dal punto di vista chimico e /o ad uno qualsiasi degli eccipienti.
- Emopatie quali granulocitopenia e porfirie intermittenti.
- I prodotti a base di paracetamolo sono controindicati nei pazienti con manifesta insufficienza della glucosio-6-fosfato deidrogenasi ed in quelli affetti da grave anemia emolitica.
- Grave insufficienza epatocellulare.
- Grave insufficienza renale.
- Per la presenza di caffeina, il prodotto non va somministrato ai bambini al di sotto dei 12 anni.
- Gravidanza e allattamento.

4.4 Speciali avvertenze e precauzioni per l'uso

L'assunzione delle preparazioni analgesiche orali deve avvenire a stomaco pieno.

Non somministrare il prodotto per oltre 7 giorni consecutivi senza consultare il medico.

Dosi elevate o prolungate del prodotto possono provocare un'epatopatia ad alto rischio e alterazioni a carico del rene e del sangue anche gravi.

Nei rari casi di reazioni allergiche la somministrazione del prodotto va sospesa.

Una particolare cautela è necessaria in pazienti con asma, rinite cronica od orticaria cronica. Sono stati riportati isolati casi di attacchi d'asma e shock anafilattico associati all'assunzione di farmaci

contenenti propilfenazone e paracetamolo in soggetti suscettibili. L'assunzione erranea di quantità superiori a quelle consigliate può provocare convulsioni.

Qualora durante il trattamento comparissero ripresa della febbre, angina, alterazioni della cute o delle mucose, sospendere la terapia e consultare il medico.

Somministrare con cautela nei soggetti con insufficienza renale o epatica, Sindrome di Gilbert o disfunzioni ematopoietiche.

Nel corso di terapia con anticoagulanti orali si consiglia di ridurre le dosi.

L'utilizzo di Saridon deve essere attentamente monitorato da un medico in caso di ulcere gastriche o duodenali e ipertiroidismo. Durante il trattamento con paracetamolo prima di assumere qualsiasi altro farmaco controllare che non contenga lo stesso principio attivo, poiché se il paracetamolo è assunto in dosi elevate si possono verificare gravi reazioni avverse.

Invitare il paziente a contattare il medico prima di associare qualsiasi altro farmaco.

Vedere anche la sezione 4.5.

4.5 Interazioni con altri medicinali ed altre forme d'interazione

Il prodotto può interagire con alcool; in caso di abuso di alcol l'assorbimento di paracetamolo, anche a bassi dosaggi, può provocare danno epatico.

Il prodotto può interagire con alcuni ipoglicemizzanti (acetoesamide, clorpropamide, tolbutamide), anticoagulanti (Warfarin), fenitoina.

In soggetti predisposti possono manifestarsi reazioni di ipersensibilità.

Il probenecid causa la riduzione della clearance del paracetamolo di almeno 2 volte attraverso l'inibizione della sua coniugazione con l'acido glucuronico. In caso di trattamento concomitante con probenecid si deve considerare una riduzione del dosaggio del paracetamolo.

Metoclopramide e domperidone possono accelerare la velocità di assorbimento del paracetamolo, mentre l'assorbimento viene ridotto dalla colestilamina.

La somministrazione concomitante di cloramfenicolo può indurre un prolungamento dell'emivita del paracetamolo, con il rischio di elevarne la tossicità.

E' sconsigliabile l'uso del prodotto se il paziente e' in trattamento con antinfiammatori.

Usare con estrema cautela e sotto stretto controllo durante il trattamento cronico con farmaci che possono determinare l'induzione delle monoossigenasi epatiche o in caso di esposizione a sostanze che possono avere tale effetto (per esempio rifampicina, cimetidina, antiepilettici quali glutetimide, fenobarbital, carbamazepina).

La somministrazione di paracetamolo può interferire con la determinazione della uricemia (mediante il metodo dell'acido fosfotungstico) e con quella della glicemia (mediante il metodo della glucosio-ossidasi-perossidasi). L'uso concomitante di paracetamolo e AZT (zidovudina) aumenta la tendenza ad una riduzione nella conta dei leucociti (neutropenia). Il prodotto, quindi, non deve essere assunto in associazione ad AZT (zidovudina) eccetto su prescrizione medica.

L'Associazione di paracetamolo con cloramfenicolo può prolungare l'emivita di quest' ultimo e quindi, potenzialmente, aumentarne la tossicità .

La contemporanea somministrazione di Fans od oppioidi determina un potenziamento reciproco dell'effetto analgesico.

Il paracetamolo aumenta l'AUC dell'etinilestradiolo del 22%.

Il paracetamolo può ridurre la concentrazione plasmatica della lamotrigina.

4.6 Gravidanza ed allattamento

Gravidanza

L'inibizione della sintesi di prostaglandine può interessare negativamente la gravidanza e/o lo sviluppo embrio/fetale. Risultati di studi epidemiologici suggeriscono un aumentato rischio di aborto, di malformazione cardiaca e di gastroschisi dopo l'uso di un inibitore della sintesi delle

prostaglandine nelle prime fasi della gravidanza. Il rischio assoluto di malformazioni cardiache aumentava da meno dell'1%, fino a circa l'1,5%. E' stato ritenuto che il rischio aumenta con la dose e la durata della terapia. Negli animali, la somministrazione di inibitori della sintesi di prostaglandine ha mostrato di provocare un aumento della perdita di pre e post- impianto e di mortalità embrione-fetale. Inoltre, un aumento di incidenza di varie malformazioni, inclusa quella cardiovascolare, è stato riportato in animali a cui erano stati somministrati inibitori di sintesi delle prostaglandine, durante il periodo organogenetico.

Durante il terzo trimestre di gravidanza, tutti gli inibitori della sintesi di prostaglandine possono esporre il feto a:

- tossicità cardiopolmonare (con chiusura prematura del dotto arterioso e ipertensione polmonare);
- disfunzione renale, che può progredire in insufficienza renale con oligo-idroamnios;

la madre e il neonato, alla fine della gravidanza, a:

- possibile prolungamento del tempo di sanguinamento, ed effetto antiaggregante che può occorrere anche a dosi molto basse;
- inibizione delle contrazioni uterine risultanti in ritardo o prolungamento del travaglio.

Si sconsiglia l'utilizzo del Saridon in caso di presunta gravidanza.

Allattamento:

Il medicinale è controindicato nell'allattamento.

4.7 Effetti sulla capacità di guidare veicoli e di usare macchinari

A causa della possibile insorgenza di vertigini, Saridon può compromettere la capacità di guidare veicoli e di usare macchinari.

4.8 Effetti indesiderati

Alterazioni della cute e del tessuto sottocutaneo

Con l'uso di paracetamolo sono state segnalate reazioni cutanee di vario tipo e gravità inclusi casi di eritema multiforme, Sindrome di Steven-Johnson e necrolisi epidermica.

Alterazioni del sistema immunitario.

Sono state segnalate reazioni di ipersensibilità quali ad esempio dispnea, angioedema, prurito, eritema, orticaria, cianosi, sudorazione, nausea, ipotensione, asma, edema della laringe, reazioni anafilattoidi shock anafilattico.

Inoltre, sono stati segnalati i seguenti effetti indesiderati:

Alterazioni del sangue e del sistema linfatico:

trombocitopenia, leucopenia, anemia, agranulocitosi.

Alterazioni del sistema epato-biliare

Alterazioni della funzionalità epatica ed epatiti.

Alterazioni renali e delle vie urinarie:

Insufficienza renale acuta, nefrite interstiziale, ematuria, anuria.

Alterazioni dell'apparato gastrointestinale:

Reazioni gastrointestinali.

Alterazioni dell'apparato uditivo e vestibolare:

Vertigini.

4.9 Sovradosaggio

In caso di iperdosaggio il paracetamolo può provocare citolisi epatica che può evolvere verso la necrosi massiva e irreversibile. Per la presenza di caffeina, sempre per dosi elevate, si può verificare iperstimolazione con eccitazione, insonnia, tremore muscolare, nausea, vomito, aumento della diuresi, tachicardia, extrasistolia, scotoma. E' stato descritto danno renale conseguente a necrosi tubulare.

5. PROPRIETÀ FARMACOLOGICHE

5.1 Proprietà farmacodinamiche

Categoria farmacoterapeutica: analgesico ed antipiretico; paracetamolo , associazioni esclusi gli psicolettici.

codice ATC: N02BE51

Il Saridon presenta proprietà analgesiche e antipiretiche.

La sua spiccata efficacia terapeutica è dovuta anche all'equilibrato sinergismo dei suoi componenti.

Il paracetamolo è una sostanza dotata di proprietà analgesiche ed antipiretiche che vengono attribuite ad un effetto diretto sui centri del dolore e della termoregolazione probabilmente tramite l'inibizione della Pg-sintetasi. Il propifenazone, appartenente alla classe dei pirazolici, possiede attività analgesica, antinfiammatoria ed antipiretica.

Effetto analgesico può essere sia centrale che periferico, e ci sono evidenze che il propifenazone agisca a livello centrale sul centro ipotalamico che regola la temperatura.

L'effetto analgesico ed antipiretico si manifesta rapidamente, perdura alcune ore e regredisce lentamente.

5.2 Proprietà farmacocinetiche

Propifenazone

Assorbimento

Il propifenazone è facilmente assorbito e presenta concentrazioni plasmatiche più prolungate se somministrato contemporaneamente alla caffeina.

La biodisponibilità orale è pari al 90%.

Le concentrazioni plasmatiche a picco vengono raggiunte dopo circa 0.5-0.6 ore dalla somministrazione.

Distribuzione

Il legame alle proteine plasmatiche è pari a circa il 10 %. Il propifenazone ha un volume di distribuzione 0.4 L /kg .

Metabolismo

Il propifenazone subisce un significativo metabolismo epatico. A livello epatico si ha prima la demetilazione con formazione di N- 2 demetil –propifenazone e successivamente la glucuronazione con formazione del principale metabolita attivo N-2-demetil propifenazone enol-glucuronide. Il metabolismo di primo passaggio elimina approssimativamente il 25% della dose.

Eliminazione

L'eliminazione avviene prevalentemente per via renale con un tempo di emivita compreso tra 2.1-2.4 ore.

Una percentuale di farmaco è escreto come propifenazone immutato e piccole quantità di altri metaboliti sono escrete con le urine.

Paracetamolo

Assorbimento

In seguito alla somministrazione orale, il paracetamolo viene assorbito rapidamente (il picco di massimo livello plasmatico si raggiunge in 30-90 minuti) e completamente.

Distribuzione

Nell'organismo il paracetamolo diffonde ampiamente nei fluidi corporei e supera la barriera emato-encefalica, raggiungendo nel liquor-celebrospinale concentrazioni pari a circa il 40 % di quelle plasmatiche.

La percentuale di paracetamolo legato alle proteine plasmatiche è minima, ma può aumentare in seguito ad iperdosaggio.

Metabolismo

Il metabolismo si sviluppa quasi completamente a livello epatico, principalmente per glucoronazione (42-60% di una dose) e solfatazione (33-52%). Meno del 10% di una dose è coniugata a cistina (3-4%) o sottoposta a idrossilazione e acetilazione (fino a 4%). Il metabolita intermedio idrossilato N-acetilparabenzochinone imina (NAPQI), altamente reattivo, è formato dal CYP 2E1 (in minore misura dai CYP 1A2 e 3A4). Generalmente NAPQI è neutralizzato negli epatociti dal glutatione ridotto ed i suoi prodotti di trasformazione, inattivi (acido mercapturico e coniugati cistinici), sono rapidamente escreti con l'urina.

Eliminazione

L'eliminazione si completa entro le 24 ore ed avviene prevalentemente per via urinaria sia come sostanza immodificata sia sottoforma di metaboliti coniugati (glucuronati e solfati). .

L'iperdosaggio di paracetamolo può tuttavia determinare un accumulo intracellulare di NAPQI sufficiente a eccedere la capacità riducente del glutatione; il composto può quindi legarsi irreversibilmente ai gruppi sulfidrilici delle proteine, condizionando necrosi epatocellulare (tipicamente centrolobulare). I metaboliti glucuronati e solfati di paracetamolo sono relativamente instabili e possono in parte riconvertirsi nel composto parentale.

In presenza di un'adeguata funzionalità renale vengono rapidamente escreti con l'urina per diffusione glomerulare e secrezione tubolare, insieme a una piccola quota di paracetamolo immodificato (circa il 3% di una dose orale). Il pH urinario non influenza il processo.

Caffeina

La caffeina viene facilmente assorbita, metabolizzata pressoché completamente ed escreta poi attraverso l'emuntorio renale. Il tempo di dimezzamento plasmatico viene indicato nell'uomo in circa 3.5 ore.

5.3 Dati preclinici di sicurezza

La tossicità acuta nel ratto con somministrazione orale di 0,5-1-2 mg/kg si è rivelata molto modesta, mentre la tossicità subcronica con dosi pro-kg die 10-20-40 volte maggiori di quelle massime usate in terapia nell'uomo, ha evidenziato la comparsa di gravi effetti tossici solo nel gruppo di animali trattati con la dose massima.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Elenco degli eccipienti

Cellulosa microgranulare, povidone, amido, ipromellosa, talco, magnesio stearato, silice precipitata.

6.2 Incompatibilità

Non sono note, ad oggi, incompatibilità specifiche.

6.3 Periodo di validità

Scadenza della confezione integra correttamente conservata: 3 anni.

6.4 Precauzioni particolari per la conservazione

