

Contra-Schmerz® plus

WILD

AMZV

Zusammensetzung

Wirkstoffe: Acidum acetylsalicylicum, Coffeinum.

Hilfsstoffe: Aluminium oxidum hydricum, Saccharinum.

Galenische Form und Wirkstoffmenge pro Einheit

1 Tablette enthält: Acidum acetylsalicylicum 500 mg, Coffeinum 50 mg.

Indikationen/Anwendungsmöglichkeiten

Behandlung von leichten bis mässig starken, akuten Schmerzen (Kopfschmerzen, Zahnschmerzen, Schmerzen im Bereich von Gelenken und Bändern, Rückenschmerzen).

Dosierung/Anwendung

Erwachsene und Kinder über 12 Jahren: übliche Einzeldosis: 1–2 Tabletten.

Übliches Applikationsintervall: 4–8 Stunden.

Maximale Tagesdosis: entsprechend 3 g Acetylsalicylsäure oder 6 Tabletten.

Das Arzneimittel sollte mit viel Flüssigkeit (200–300 ml) möglichst nach einer Mahlzeit eingenommen werden.

Dieses Präparat ist nicht zur Anwendung bei Kindern unter 12 Jahren bestimmt.

Kontraindikationen

Überempfindlichkeit gegen Salicylate und/oder andere Entzündungshemmer (Antirheumatika).

Überempfindlichkeit gegen Xanthine.

Hämorrhagische Diathese.

Magen-Darm-Ulcera.

Schwere Leberfunktionsstörungen.

Schwere Niereninsuffizienz.

Letztes Trimenon der Schwangerschaft.

Warnhinweise und Vorsichtsmassnahmen

Vorsicht ist geboten bei

Nieren- und/oder Leberinsuffizienz.

Chronischen oder rezidivierenden Magen- oder Duodenalbeschwerden.

Asthma bronchiale oder allgemeiner Neigung zu Überempfindlichkeit.

Nasenschleimhautpolypen.

Genetisch bedingtem Glucose-6-Phosphat-Dehydrogenase-Mangel.

Gleichzeitiger Therapie mit gerinnungshemmenden Medikamenten.

Zuständen mit erhöhter Blutungsgefahr (z.B. Dysmenorrhoe, Verletzungen).

Der Patient bzw. die Patientin muss darauf aufmerksam gemacht werden, dass Schmerzmittel nicht ohne ärztliche Verordnung über längere Zeit regelmässig eingenommen werden dürfen. Längerdauernde Schmerzen bedürfen einer ärztlichen Abklärung.

Die langfristige Einnahme von Schmerzmitteln, insbesondere bei Kombination mehrerer schmerzstillender Wirkstoffe, kann zur dauerhaften Nierenschädigung mit dem Risiko eines Nierenversagens (Analgetika-Nephropathie) führen.

Aufgrund des arrhythmogenen Potentials von Coffein ist bei Patienten mit Arrhythmien und/oder Palpitationen besondere Vorsicht geboten.

Der Patient ist darauf hinzuweisen, dass bei chronischer Einnahme von Analgetika Kopfschmerzen auftreten können, die zu erneuter Einnahme und damit wiederum zum Unterhalt der Kopfschmerzen führen können (sogenanntes Analgetika-Kopfweg).

Bei Kindern unter 12 Jahren, bei denen Verdacht auf Grippe oder Windpocken besteht, sollte die Anwendung von Acetylsalicylsäure mit Vorsicht erfolgen (Reye-Syndrom). Ein Kausalzusammenhang dieses Syndroms mit der Einnahme von salicylathaltigen Arzneimitteln ist bisher allerdings nicht eindeutig erwiesen.

Contra-Schmerz plus ist nicht zur Anwendung bei Kindern unter 12 Jahren bestimmt.

Interaktionen

Acetylsalicylsäure

Verstärkung der Wirkung von Antikoagulantien, oralen Antidiabetika, Barbituraten, Lithium, Sulfonamiden und Trijodthyronin.

Erhöhung der Plasmakonzentration von Phenytoin und Valproat.

Verstärkung der Wirkung und Nebenwirkungen von allen nichtsteroidalen Antirheumatika.

Erhöhung der Methotrexat-Plasmakonzentration (Verstärkung der Nebenwirkungen von Methotrexat).

Abschwächung der Wirkung von Aldosteronantagonisten (z.B. Spironolacton), Schleifendiuretika, Urikosurika (z.B. Probenecid, Sulfinpyrazon).

Verlängerung der Plasmahalbwertszeit von Penicillinen.

Zusammen mit Kortikosteroiden steigt das Risiko von Magen-Darm-Blutungen.

Coffein

Reduzierung der Wirkung von Sedativa wie Barbiturate, Antihistaminika.

Verminderung der Ausscheidung von Theophyllin.

Synergistische Wirkung gegenüber den tachykarden Wirkungen von z.B. Sympathomimetika, Thyroxin.

Erhöhung der Ausscheidung von Lithium.

Erhöhung des Abhängigkeitspotentials von Substanzen vom Typ des Ephedrin.

Orale Kontrazeptiva, Cimetidin und Disulfiram vermindern den Coffein-Abbau in der Leber, Barbiturate und Rauchen beschleunigen ihn.

Die gleichzeitige Verabreichung von Gyrasehemmstoffen des Chinoloncarbonsäure-Typs kann die Elimination von Coffein und seinem Abbauprodukt Paraxanthin verzögern.

Schwangerschaft/Stillzeit

Es liegen keine hinreichenden Daten zur Anwendung bei Schwangeren und während der Stillzeit vor.

In tierexperimentellen Studien fand sich eine Reproduktionstoxizität (erhöhte Sterblichkeit, Wachstumsstörungen, Skelettanomalien, Salicylat-Intoxikationen).

Das potentielle Risiko für den Menschen ist nicht bekannt. Aufgrund bisheriger Erfahrungen scheint das Risiko bei normalen therapeutischen Dosen allerdings gering zu sein.

Im letzten Trimenon der Schwangerschaft kann die Einnahme von Salicylaten zu Wehenhemmung und Blutungen, zu einer Verlängerung der Gestationsdauer und vorzeitigem Verschluss des Ductus arteriosus führen.

Salicylate und Coffein gehen in die Muttermilch über. Die Salicylat-Konzentration in der Muttermilch ist gleich oder sogar höher als die mütterliche Plasmakonzentration. Bei den üblichen kurzzeitig angewandten Dosen (für Analgesie) sind keine bleibenden, nachteiligen Folgen für den Säugling zu erwarten. Während der Stillzeit kann das Befinden und Verhalten des Säuglings durch mit der Muttermilch aufgenommenes Coffein beeinträchtigt werden.

Während der ganzen Schwangerschaft und Stillzeit sollte das Arzneimittel nicht angewendet werden, es sei denn es ist klar notwendig (z.B. wenn keine sicheren Alternativen zur Verfügung stehen.)

Wirkung auf die Fahrtüchtigkeit und auf das Bedienen von Maschinen

Contra-Schmerz plus hat keinen Einfluss auf die Fahrtüchtigkeit oder die Fähigkeit, Maschinen zu bedienen.

Unerwünschte Wirkungen

Blut- und Lymphsystem

Verlängerte Blutungszeit.

Selten: Thrombozytopenie, Agranulozytose, Panzytopenie, Leukopenie, aplastische Anämie.

Stoffwechsel- und Ernährungsstörungen

Selten: Hypoglykämie, Eisenmangelanämie, Störungen des Säure-Basen-Haushaltes.

Nervensystem

Selten: Schlaflosigkeit, innere Unruhe, Kopfschmerzen, Verwirrheitszustände.

Augen

Selten: Sehstörungen.

Ohr und Innenohr

Selten: Schwindel, Tinnitus, Schwerhörigkeit.

Herz

Selten: Tachykardie.

Gefässe

Selten: Überempfindlichkeitsreaktionen in Form von angioneurotischem Ödem, Blutdruckabfall bis hin zum Schock.

Atmungsorgane

Gelegentlich: Auftreten von Asthma.

Selten: Überempfindlichkeitsreaktionen in Form von Rhinitis, Bronchospasmus.

Gastrointestinale Störungen

Häufig: Mikroblutungen (70%), Magenbeschwerden.

Gelegentlich: Dyspepsie, Übelkeit, Erbrechen, Diarrhöe.

Selten: Magen-Darm-Blutungen, Magen-Darm-Ulzerationen.

Leber und Galle

Selten: Leberfunktionsstörungen.

Haut

Selten: Überempfindlichkeitsreaktionen in Form von erythematösen/ekzematösen Hauterscheinungen, Urtikaria.

Selten: schwere Hautreaktionen bis hin zum Erythema exsudativum multiforme, Stevens-Johnson-Syndrom, toxisch epidermale Nekrolyse.

Niere und Harnwege

Selten: Nierenfunktionsstörungen.

Überdosierung

Im Vordergrund stehen die toxischen Reaktionen von Acetylsalicylsäure. Die erforderliche Behandlung richtet sich folglich nach dem Ausmass der Acetylsalicylsäure-Intoxikation.

Acetylsalicylsäure

Schwere Vergiftungserscheinungen können sich langsam, d.h. innert 12–24 Stunden nach Einnahme entwickeln. Nach oraler Einnahme einer Dosis bis 150 mg ASS/kg KG ist mit leichten, bei Dosen >300 mg/kg KG mit schweren Intoxikationen zu rechnen.

Symptome

Übelkeit, Erbrechen, Schwindel, Ohrensausen, Hörstörungen, Tremor, Verwirrheitszustände, Hyperthermie, Hyperventilation, Störungen des Säure-Basen-Gleichgewichts und der Elektrolyte, Exsikkose, Koma, Ateminsuffizienz.

Therapie

Angesichts der lebensbedrohenden Situation bei einer schweren Vergiftung müssen unverzüglich die notwendigen Massnahmen ergriffen werden: Verhinderung resp. Verminderung der Resorption, Magenspülung in Frühfällen (bis eine Stunde nach Einnahme), Aktivkohle repetitiv. Elektrolyte kontrollieren und korrigieren. Glukosezufuhr. Natriumbikarbonat zur Azidosekorrektur und zur Förderung der Ausscheidung (Urin-pH>8). Glycin: initial 8 g oral, dann alle 2 Stunden 4 g während 16 Stunden. Eventuell Hämo-perfusion oder Hämodialyse (Indikationen können im Schweizerischen Toxikologischen Informationszentrum erfragt werden.)

Coffein

Plasmakonzentrationen ab etwa 15–20 µg Coffein/ml können toxische Reaktionen bewirken.

Symptome

Magenschmerzen, Delirium, Schlaflosigkeit, Diurese, Dehydratation.

Therapie

Neben resorptionsverhindernden Massnahmen (Emesis, Lavage) richtet sich die Behandlung einer Überdosierung mit Coffein nach den Symptomen. Zentralnervöse Symptome und Krampfanfälle bei Überdosierung von Coffein können mit Benzodiazepinen, eine supraventrikuläre Tachykardie kann mit Beta-Blockern behandelt werden.

Eigenschaften/Wirkungen

ATC-Code: N02BA51

Wirkungsmechanismus der Acetylsalicylsäure

Acetylsalicylsäure (ASS) ist der Essig-Ester der Salicylsäure und gehört als Vertreter der Salicylate zur Arzneistoffgruppe der sauren nichtsteroidalen Analgetika/Antiphlogistika (NSAID).

Die periphere analgetische Wirkung kommt durch Hemmung der Cyclooxygenase zustande. Dadurch wird die Bildung der Prostaglandine gehemmt, die an der Entstehung von Schmerzen beteiligt sind.

Wirkungsmechanismus von Coffein

Coffein ist ein Xanthinderivat.

Es gibt Hinweise, dass es in Kombination mit ASS die analgetische Wirkung von ASS verstärkt. Der genaue Wirkungsmechanismus ist noch nicht geklärt.

Coffein induziert eine Konstriktion von cerebralen Blutgefässen. Coffein wirkt vorwiegend als Antagonist an Adenosinrezeptoren. Dadurch wird die hemmende Wirkung des Adenosins im ZNS vermindert.

Coffein selbst besitzt kein analgetisches Potential.

Pharmakokinetik

Absorption

Für Contra-Schmerz plus wurde nach einer oralen Einzeldosis von 500 mg Acetylsalicylsäure/50 mg Coffein eine maximale Plasmakonzentration von 4,89 µg/ml Acetylsalicylsäure (C_{max}) in 0,5 Std. (t_{max}), bzw. 26,7 µg/ml Salicylsäure (C_{max}) in 2 Std. (t_{max}) erreicht. Für Coffein wurde eine maximale Plasmakonzentration von 0,997 µg/ml (C_{max}) in 1 Std. (t_{max}) erreicht.

Distribution

Acetylsalicylsäure

Bei oraler Applikation wird Acetylsalicylsäure rasch und vollständig im Magen und oberen Dünndarm resorbiert. Die frei gesetzte Salicylsäure verteilt sich rasch auf alle Gewebe und Flüssigkeitsräume (Liquor, Synovial, Peritoneal). Besonders hohe Konzentrationen treten im entzündeten Gewebe auf. Das Verteilungsvolumen ist Dosis- und pH-abhängig und variiert zwischen 0,1 und 0,2 l/kg. Salicylat wird zu 80–90% an Plasmaeiweiss gebunden, zwar vorwiegend Albumin. Salicylsäure ist plazentagängig und geht in die Muttermilch über. Die absolute Bioverfügbarkeit von analgetisch/antipyretischen Dosen nach oraler Gabe beträgt 60–70%.

Coffein

Coffein verteilt sich im gesamten Organismus, passiert rasch die Blut-Hirn-Schranke sowie Plazentaschranke und tritt auch in die Muttermilch über. Die Coffeinkonzentration in der Muttermilch beträgt 60–90% der Plasmaspiegel. Das Verteilungsvolumen beträgt 0,6 l/kg. Die Bindung an Plasmaeiweiss ist gering (unter 50%) Oral verabreichtes Coffein ist praktisch vollständig bioverfügbar.

Metabolismus

Acetylsalicylsäure

Acetylsalicylsäure wird durch Esterasen in der Magenschleimhaut und in der Leber sehr rasch zu Salicylat abgebaut, sodass sie eine relative kurze Halbwertszeit von 0,56 Stunden aufweist. In der Leber wird das Salicylat weiter zur Salicylsäure (ca. 75%) und Glucuroniden biotransformiert.

Salicylsäure hat eine Halbwertszeit von 1,96 Stunden.

Coffein

Coffein weist eine Halbwertszeit von 3,6 Stunden auf.

Der Hauptmetabolit ist 1,7-Dimethylxanthin, weitere Abbauprodukte sind 1-Methylharnsäure, 1-Methylxanthin, 1,3-Dimethylharnsäure, 7-Methylxanthin und 5-Acetylamino-6-Formylamino-3-Methyluracil.

Infolge einer Enzyminduktion besitzen Raucher eine höhere Biotransformationskapazität als Nichtraucher. In der Schwangerschaft sowie bei Patienten mit alkoholbedingter Leberzirrhose wird Coffein langsamer eliminiert.

Coffein erhöht die Bioverfügbarkeit von Salicylsäure und verlängert ihre Halbwertszeit, aber Coffein hat keinen Einfluss auf die Pharmakokinetik der Acetylsalicylsäure.

Elimination

Acetylsalicylsäure

Salicylsäure und ihre Metaboliten werden hauptsächlich renal ausgeschieden, wobei der Anteil an freier Salicylsäure stark vom pH des Urins abhängt (ca. 5% im sauren und bis zu 85% im alkalischen Urin).

Coffein

Coffein und seine Metaboliten werden vorwiegend renal ausgeschieden, allerdings nur 1–5% der Dosis in unveränderter Form.

Präklinische Daten

–

Sonstige Hinweise

Inkompatibilitäten

Da keine Verträglichkeitsstudien durchgeführt wurden, darf dieses Arzneimittel nicht mit anderen Arzneimitteln gemischt werden.

Haltbarkeit

Das Medikament darf nur bis zu dem auf der Packung mit «EXP» bezeichneten Datum verwendet werden.

Besondere Lagerungshinweise

Bei Raumtemperatur (15–25 °C) an einem trockenen Ort aufbewahren.

In der Originalverpackung aufbewahren und den Behälter fest verschlossen halten.

Zulassungsnummer

55439 (Swissmedic).

Zulassungsinhaber

Dr. Wild & Co. AG, 4002 Basel.

Stand der Information

September 2003.

Der Text wurde behördlich genehmigt und vom verantwortlichen Unternehmen zur Publikation durch die Documed AG freigegeben. © Copyright 2008 by Documed AG, Basel. Die unberechtigte Nutzung und Weitergabe ist untersagt. [10.10.2007]