

Acepar Caplets

Leaflet Siz: A6

Acepar® Caplets

Composition

Each caplet contains: Aceclofenac BP 100 mg, Paracetamol BP 500 mg

Description

ACEPAR® is a fixed dose combination of Aceclofenac and Paracetamol. Aceclofenac belongs to a group of Non Steroidal Anti-inflammatory Drugs (NSAIDs) used to treat various painful inflammatory conditions. Aceclofenac has an outstanding anti-inflammatory profile mediated primarily through inhibition of cyclooxygenase (COX) activity and suppression of PGE2 synthesis. Paracetamol is a safe and effective analgesic-antipyretic agent with minimal effect on cardiovascular, respiratory and GI system. Paracetamol or acetaminophen is the deethylated active metabolite of phenacetin. Chemically, Paracetamol is N-acetyl-p-aminophenol.

Pharmacology

Aceclofenac relieves pain and inflammation through a variety of mechanisms and in addition exerts stimulatory effects on cartilage matrix synthesis. *Anti-inflammatory activity:* The anti-inflammatory effects of Aceclofenac have been shown in both acute and chronic inflammation. It inhibits various mediators of pain and inflammation including:

-PGE2 via cyclooxygenase inhibition (COX-1 & COX-2) after intracellular metabolism to 4' hydroxy-aceclofenac and diclofenac in human rheumatoid synovial cells and other inflammatory cells.

-IL-1β, IL-6 and tumor necrosis factor in human osteoarthritic synovial cells and human articular chondrocytes.

-Reactive oxygen species (which plays a role in joint damage) has also been observed in patients with osteoarthritis of knee.

-Expression of cell adhesion molecules (which is implicated in cell migration and inflammation) has also been shown in human neutrophils.

Stimulatory effects on cartilage matrix synthesis: Aceclofenac stimulates glycosaminoglycan synthesis in human osteoarthritic cartilage by inhibition of IL-1β and suppresses cartilage degeneration by inhibiting IL-1β mediated promatrix metalloproteinase production and proteoglycan release.

Paracetamol is a clinically proven analgesic and antipyretic agent with weak anti-inflammatory effect.

Analgesic action: The central analgesic action of Paracetamol resembles that of aspirin. It produces analgesia by raising pain threshold.

Antipyretic effect: The antipyretic effect of Paracetamol is attributed to its ability to inhibit COX in the brain where peroxide tone is low.

Recent evidence suggests inhibition of COX-3 (believed to be splice variant product of the COX-1 gene) could represent a primary central mechanism by which Paracetamol decreases pain and possibly fever.

Pharmacokinetics

Aceclofenac is well absorbed from gastrointestinal tract and peak plasma concentrations (Cmax) are reached 1-3 hours after an oral dose.

The drug is more than 99% bound to plasma proteins and the volume of distribution (Vd) is approximately 25 liters.

The presence of food reduced rate of absorption (increased tmax) but not the extent of absorption (Cmax or AUC).

In patients with knee pain and synovial fluid effusion, the plasma concentration of Aceclofenac was twice that in synovial fluid after multiple doses of the drug. Aceclofenac is metabolized mainly to 4' hydroxy-aceclofenac. The drug is eliminated primarily through renal excretion with 70-80% of administered dose found in urine as glucuronides and rest being excreted in faeces. The plasma elimination half life of Aceclofenac is approximately 4 hours. **Paracetamol** is rapidly and almost completely absorbed from gastrointestinal tract with peak plasma concentrations (Cmax) occurring about 10 to 60 minutes after oral administration. Plasma protein binding is negligible at usual therapeutic concentration but increases with increasing concentrations. Paracetamol is relatively uniformly distributed throughout most body fluids. The plasma half life (t1/2) 2-3 hours and the effect after oral dose lasts for 3-5 hours. Paracetamol is metabolized predominantly in liver and excreted in the urine mainly as glucuronide and sulfate conjugate. Less than 5% is excreted unchanged.

Indications

ACEPAR® is indicated for relief of severe pain and inflammation in Osteoarthritis, Rheumatoid arthritis, Ankylosing spondylitis, Low back pain, Dental pain, Gynaecological pain and painful & Inflammatory conditions of ear, nose & throat.

Dosage

The recommended dose of ACEPAR® is 1 caplet twice daily. Generally, no dose adjustment is necessary in elderly patients and those with mild renal impairment. Safety and efficacy has not been established in children.

Adverse Effects

Most of the adverse events are minor and reversible with treatment discontinuation. The majority of side effects are related to gastrointestinal system (dyspepsia, abdominal pain, nausea and diarrhea), most frequent being dyspepsia, abdominal pain and rise in hepatic enzymes.

Other rare side-effects include dizziness, constipation, vomiting, ulcerative stomatitis, rash, dermatitis, headache, fatigue, allergic reactions, anemia, granulocytopenia, thrombocytopenia, neutropenia, oedema, palpitation, leg cramps, flushing, purpura, paraesthesia, tremors, gastrointestinal bleeding, gastrointestinal ulceration, pancreatitis, interstitial nephritis, depression, abnormal dreaming, somnolence, insomnia, vasculitis, hypoglycemia, rise in blood urea, serum creatinine and serum potassium. As with other NSAIDs, severe mucocutaneous skin reactions may occur.

Contraindications

ACEPAR® is contraindicated in the following situations:

Patients sensitive to Aceclofenac, Paracetamol or to any of the excipients of the product, patients in whom aspirin or other NSAIDs, precipitate attacks of bronchospasm, acute rhinitis or urticaria or patients hypersensitive to these drugs, patients with active or suspected peptic ulcer or gastrointestinal bleeding or bleeding disorders, patients with severe heart failure, hypertension, hepatic or renal insufficiency and third trimester of pregnancy

Precautions

ACEPAR® may cause dizziness. Driving or operating machinery are to be avoided. Individuals receiving long-term treatment should be regularly monitored for renal function tests, liver function tests and blood counts. It is to be used with caution in hepatic porphyria, coagulation disorders, history of peptic ulcers, ulcerative colitis, Crohn's disease, SLE, cerebrovascular bleeding, pregnancy and lactation. Caution should be exercised in patients with mild to moderate impairment of cardiac, hepatic or renal function and in elderly patients who are more likely to be suffering from these conditions. Caution is also required in patients on diuretic therapy or otherwise at risk of hypovolemia.

Drug Interaction

Drug interactions associated with Aceclofenac are similar to those observed with other NSAIDs. Aceclofenac may increase the plasma concentrations of lithium, digoxin and methotrexate. It may increase the activity of anticoagulants, inhibit the activity of diuretics, enhance cyclosporine neurotoxicity and precipitate convulsions when coadministered with quinolone antibiotics. Coadministration of Aceclofenac with other NSAIDs and corticosteroids are to be avoided due to increased incidence of side-effects. The risk of Paracetamol toxicity may be increased in patients receiving other potentially hepatotoxic drugs or drugs that induce hepatic microsomal enzymes. Coadministration of Paracetamol with rifampicin, isoniazid, chloramphenicol, anti-epileptic drugs and antiviral drugs is to be avoided. Metoclopramide may increase the absorption of Paracetamol whereas excretion and plasma concentration may be altered when coadministered with probenecid. Cholestyramine also reduces the absorption of Paracetamol.

Overdosage

Overdosage may cause nausea, vomiting, abdominal pain, dizziness, somnolence, headache, sweating, pancreatitis, hepatic failure and acute renal failure. Treatment includes gastric lavage, activated charcoal and other symptomatic measures as per medical advice.

Presentation

Blister pack containing 10 caplets, packed in 10's, 100's.

Storage

Store in cool dry place below 30°C out of direct sunlight.

Keep all medicines out of reach of children.

Manufactured by:



DAWA Limited, Plot No. 7879/8, Baba Dogo Road, Ruaraka
P. O. Box 16633 – 00620, Nairobi, Kenya.

Ref: Lf/DL/Acepar I/01

Date of issue: June 2010

Acepar® Caplets

Composition

Chaque caplet contient : Aceclofenac BP 100 mg, paracétamol BP 500 mg

Description

ACEPAR® est une combinaison de dose fixe de Aceclofenac et paracétamol. Aceclofenac appartient à un groupe de non stéroïdiens Médicaments anti-inflammatoires (AINS) utilisés pour traiter les différents douloureux inflammatoire conditions. Aceclofenac a un profil anti-inflammatoires remarquable médiatisée principalement par le biais d'inhibition de l'activité cyclooxygénase (COX) et de suppression de synthèse PGE2.

Paracétamol est un analgésique-Antipyrétique sécuritaire et efficace agent avec un effet minimal sur le système cardio-vasculaire, respiratoire et GI. Paracétamol ou l'acétaminophène est le métabolite actif deethylated de phénacétine. Chimiquement, paracétamol est N-acétyl-p-aminophénol.

Pharmacologie

Aceclofenac soulage la douleur et l'inflammation à travers une variété de mécanismes et, en outre, exerce stimulation des effets sur la synthèse de matrice de cartilage.

Activité anti-inflammatoire : les effets anti-inflammatoires de Aceclofenac II a été démontré dans l'inflammation aiguë et chronique.

Il inhibe divers médiateurs de la douleur et de l'inflammation, y compris :

-PGE2 via cyclooxygénase inhibition (COX-1 et COX-2) après le métabolisme intracellulaire de 4'-hydroxy-aceclofenac et Diclofenac dans les cellules synovial rhumatoid et d'autres cellules inflammatoires.

1B - IL-, IL-6 et tumeur facteur de nécrose dans les cellules synovial osteoarthritic et humaines articulaires Chondrocytes.

-Espèces de l'oxygène réactive (qui joue un rôle dans l'atteinte articulaire) a également été observée chez les patients arthrose du genou.

-Expression de la cellule a des molécules d'adhérence (qui est impliquée dans la cellule migration et l'inflammation) également été montré dans neutrophiles humaines.

Stimulation des effets sur synthèse de matrice de cartilage: Stimule la synthèse Glycosaminoglycane chez l'homme Aceclofenac cartilage osteoarthritic par inhibition de l'IL-1β et supprime les cartilages dégénérescence en inhibant IL-1β médiatisée Métalloprotéinase promatrix version de production et de proteoglycan. Paracétamol est un agent analgésiques et Antipyrétique cliniquement éprouvé avec faible effet anti-inflammatoire. Action analgésiques : semblable à l'action analgésiques centrale de paracétamol celui de l'aspirine. Elle produit analgésie en augmentant le seuil de douleur.

Effet Antipyrétique : l'effet Antipyrétique de paracétamol est attribuée, sa capacité à inhiber COX dans le cerveau où ton peroxyde est faible.

Ces dernières inhibition de la COX-3 (estimé à être épisser produit variante de la porte à croire le gène COX-1) pourrait représenter un mécanisme central principal par lequel Paracétamol diminue la douleur et éventuellement de la peste.

Pharmacocinétique

Aceclofenac est bien absorbée de tube digestif et des pics de concentration de plasma (Cmax) sont parvenus à 1-3 heures après la dose orale.

Le médicament est plus de 99 % liés aux protéines plasmatiques et le volume de distribution (VD) est d'environ 25 litres. La présence de aliments réduit le taux d'absorption (augmentation tmax), mais pas l'ampleur de la absorption (Cmax ou AUC). Chez les patients atteints de douleur au genou et le liquide synovial épanchement, la concentration plasmatique de Aceclofenac était deux fois plus que dans synovial fluide après plusieurs doses de la drogue. Aceclofenac est métabolisés principalement à 4'-hydroxy-aceclofenac. Le médicament est éliminé principalement par le biais de l'excrétion rénale avec 70 à 80 % de la dose administrée trouvés dans l'urine comme glucuronides et étant de repos excrété dans les fèces.

La vie de la moitié de l'élimination plasma de Aceclofenac est environ 4 heures. Paracétamol est rapidement et presque complètement absorbé du tube digestif avec pics de concentration de plasma (Cmax) qui se produisent environ 10 à 60 minutes après administration orale. Plasma la liaison de protéines est négligeable à concentration thérapeutique habituelle mais augmenté avec l'augmentation des concentrations.

Paracétamol est relativement uniformément répartie, tout au long de la plupart des liquides. Le plasma demi-vie (t1/2) 2 à 3 heures et le effet après que la dose orale dure 3 à 5 heures. Paracétamol est métabolisé, principalement dans le foie et excrétés dans l'urine principalement comme glucuronide et sulfate conjugué. Moins de 5 % est excrété inchangée.

Indications

ACEPAR® est indiqué pour le soulagement de graves douleur et de l'inflammation dans l'ostéoarthrose, l'arthrite rhumatoïde, ankylosing ankylosante, Low back douleurs, douleurs dentaires, douleur Gynaecological et douloureux & Conditions inflammatoires de l'oreille, nez-gorge.

Dosage

Le recommandée dose de ACEPAR® est 1 caplet deux fois par jour. En règle générale, aucun ajustement de la dose n'est nécessaire dans les patients âgés et ceux qui ont légère atteinte rénale. Sécurité et l'efficacité n'a pas été établie dans enfants.

Effets indésirables

La plupart de la les effets indésirables sont mineures et réversible avec abandon de traitement. La majorité des effets secondaires sont liées au système digestif (dyspepsie, douleurs abdominales, nausées et la diarrhée), plus fréquents étant dyspepsie, abdominale douleur et de la hausse des enzymes hépatiques. Autres effets indésirables rares incluent des étourdissements, la constipation, vomissements, stomatite rectocolite, éruptions cutanées, Dermatitis, maux de tête, la fatigue, des réactions allergiques, l'anémie, granulocytopenia, thrombocytopénie, Neutropénie, oedème, palpitation, crampes dans les jambes, vidange, purpura, paraesthesia, tremblements, hémorragie digestive, une ulcération gastro-intestinaux, le pancréatite, néphritis interstitielle, dépression, rêver anormale, somnolence, insomnie, Vasculite, hypoglycémie, augmentation urée de sang, de la créatinine sérique et sérum potassium. Comme avec d'autres AINS, réactions cutanées cutanéomuqueuses sévère peuvent se produire.

Contre-indications

ACEPAR® est contre-indiqué dans l'exemple suivant situations :

Sensibles aux patients Aceclofenac, paracétamol ou à l'une de l'excipient du produit, patients dans lesquels l'aspirine ou d'autres AINS, précipiter les attaques de bronchospasme, aiguë Rhinite ou Urticaire ou patients hypersensibles ces drogues, les patients présentant Active ou soupçonné l'ulcère gastro-duodénal ou des saignements gastro-intestinaux ou troubles, de la coagulation patients présentant une insuffisance cardiaque sévère, l'hypertension, hépatique ou rénale troisième trimestre de la grossesse et l'insuffisance

Précautions

ACEPAR® peut entraîner des vertiges. La conduite ou fonctionnement des machines sont à éviter. Personnes recevant à long terme traitement doit être contrôlée régulièrement pour les essais de la fonction rénale, foie les tests de fonction et chefs de sang. Il doit être utilisé avec prudence en porphyrie hépatique, troubles de coagulation, histoire de l'ulcère gastro-duodénal, de la rectocolite hémorragique, Crohn maladie, SLE, saignements vasculaire, grossesse et allaitement. Prudence devrait être exercé chez les patients atteints de légère à modérée atteinte cardiaque, hépatique ou la fonction rénale et chez les patients âgés qui sont plus susceptibles d'être atteints dans ces conditions. Mise en garde est également nécessaire chez les patients sous traitement diurétique ou autrement à risque de hypovolemia.

Drogue Interaction

Drogue interactions associées à Aceclofenac sont similaires à ceux observés avec autres AINS. Aceclofenac peut augmenter les concentrations plasmatiques de lithium, digoxine et méthotrexate. Elle peut augmenter l'activité des anticoagulants, inhiber l'activité de diurétiques, d'améliorer la cyclosporine néphrotoxicité et précipiter convulsions lorsque coadministré avec des antibiotiques quinolone. Coadministration de Aceclofenac avec d'autres AINS et les corticostéroïdes sont à éviter en raison de incidence accrue des effets secondaires. Le risque de toxicité du paracétamol peut être augmenté patients en recevant des autres potentiellement hépatotoxiques drogues ou médicaments qui entraînent des enzymes microsomal hépatiques. Coadministration de paracétamol avec rifampicine, isoniazid, chloramphénicol, anti-épileptique des drogues et antiviral drogue est à éviter. Metoclopramide peut augmenter l'absorption de Paracétamol que la concentration de l'excrétion et le plasma peut être modifié lorsque coadministré avec Probenécide. Cholestyramine réduit également l'absorption de Paracétamol.

Surdosage

Un surdosage peut provoquer des nausées, vomissements, douleurs abdominales, étourdissements, somnolence, maux de tête, transpiration, pancréatite, insuffisance hépatique et insuffisance rénale aiguë. Inclut le traitement lavage gastrique, de charbon et d'autres mesures symptomatiques par conseils médicaux.

Présentation

Blister Pack contenant 10 caplets, emballés dans des 10's, centaines.

Stockage

Stocker dans cool lieu ci-dessous à sec 30 ° C, de lumière directe du soleil.

Conserver tous les médicaments hors de portée des enfants.

Fabriqué par.



DAWA Limited, Plot No. 7879/8, Baba Dogo Road, Ruaraka
P. O. Box 16633 – 00620, Nairobi, Kenya.

Ref: LF/DL/Acepar V01

Date d'émission: June 2010