

Но-Шпалгин



Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#)

[Госреестр](#) [Википедия](#)

[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)^{англ}

Форма выпуска:

Таблетки светло-желтые, с вкраплениями более светлого и более темного цвета, удлиненной формы, с делительной риской на обеих сторонах.

	1 таб.
парацетамол	500 мг
дротаверина гидрохлорид	40 мг
кодеина фосфат (в форме гемигидрата)	8 мг

Вспомогательные вещества: поливидон, краситель железа оксид желтый (E172), магния стеарат, аскорбиновая кислота, кросповидон, тальк, крахмал кукурузный, целлюлоза микрокристаллическая, крахмал прежелатинизированный.

6 шт. - блистеры из алюминия (2) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Спазмоанальгетик.

Парацетамол оказывает анальгезирующее и жаропонижающее действие главным образом за счет ингибирования синтеза простагландинов в ЦНС и в меньшей степени - в периферических тканях.

Дротаверин - производное изохинолина, оказывает спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру. В его механизме действия главным является ингибирование фермента ФДЭ4 с последующим повышением концентрации цАМФ, которое приводит к инаktivации киназы легких цепей миозина (КЛЦМ), вследствие этого происходит расслабление гладкой мускулатуры, независимо от типа вегетативной иннервации.

Кодеин - противокашлевое средство центрального действия. Обладает как собственным анальгезирующим действием, так и способностью усиливать анальгезирующее действие парацетамола. Эти эффекты кодеина осуществляются путем возбуждения опиоидных μ - и κ -рецепторов в ЦНС и периферических тканях, участвующих в передаче болевых импульсов. Это приводит к стимуляции антиноцицептивной системы и снижению возбудимости болевых центров.

Фармакокинетика

Парацетамол

Всасывание

После приема внутрь быстро и полностью абсорбируется из тонкой кишки. С

C_{\max} в плазме крови достигается через

30-90 мин

Распределение

Парацетамол слабо связывается с белками плазмы и эритроцитами. Его распределение является быстрым и равномерным.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ парацетамола из плазмы составляет 2 ч. Парацетамол метаболизируется в печени, его метаболиты выводятся почками путем клубочковой фильтрации. Около 85% принятой дозы выводится в форме глюкуронидов, 2% - в форме сульфатов, 3% - в неизменном виде. Примерно 10% принятой дозы обезвреживается в печени путем конъюгации с глутатионом.

Кодеин

Всасывание

После приема внутрь быстро абсорбируется из ЖКТ. C_{\max} в плазме крови достигается через 1 ч

Распределение

Кодеин умеренно связывается с белками плазмы и быстро распределяется, накапливаясь в почках, легких, печени и скелетных мышцах, в то время как ткани головного мозга не способны накапливать кодеин. Кодеин проникает через плацентарный барьер и экскретируется в грудное молоко.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ кодеина из плазмы составляет 2.5-3.5 ч. В печени кодеин быстро превращается в морфин и норкодеин. Кодеин и его метаболиты выводятся почками, главным образом в форме глюкуронидов. В течение 24 ч с мочой выделяется 86% принятой дозы.

Дротаверин

Всасывание

Дротаверин после приема внутрь быстро и полностью всасывается. C_{\max} в плазме крови достигается через 45-60 мин.

Распределение

Поступивший в системный кровоток дротаверин на 95-98% связывается с белками плазмы, преимущественно с альбуминами, α - и β -глобулинами.

Дротаверин проникает через плацентарный барьер.

Метаболизм и выведение

$T_{1/2}$ дротаверина из плазмы составляет 2.4 ч, биологический $T_{1/2}$ - 8-10 ч. Метаболизм дротаверина осуществляется в печени. Более 50% принятой дозы выводится с мочой, 30% - с калом.

Комбинация парацетамол + дротаверин + кодеин

Изучение фармакокинетики комбинации парацетамол + дротаверин + кодеин показало, что C_{ss} активных веществ препарата устанавливается на 6-й день при применении 1 раз/сут и на 3-й день - при применении 2 раза/сут.

Как при однократном, так и при курсовом приеме препарата кодеин не оказывает влияния на фармакокинетику парацетамола и дротаверина, а парацетамол не влияет на фармакокинетику кодеина. Дротаверин и парацетамол не взаимодействуют на уровне связывания с белками плазмы. В исследованиях *in vitro* показано, что парацетамол (в терапевтическом диапазоне доз) неспецифически угнетает метаболизм дротаверина, что увеличивает $T_{1/2}$ последнего в 2-7 раз, поэтому возможно, что *in vivo* он также может угнетать метаболизм дротаверина.

Комбинация парацетамол + дротаверин + кодеин увеличивает значения AUC_{0-24} и C_{\max} дротаверина, которые находятся в интервале 463.4-830.2 нг·ч/л и 132-171 нг/мл соответственно, то есть применение комбинации увеличивает относительную биодоступность дротаверина. Аналогичное явление было показано также и для парацетамола. Эта комбинация увеличивает значения AUC_{0-24} парацетамола и значительно снижает его клиренс. Значения C_{\max} , AUC_{0-24} и клиренса парацетамола находились в интервале 5495-6752 нг/мл, 21760.8-26524.7 нг·ч/л, 365-418 мл/мин соответственно. Это может обеспечивать более выраженное обезболивающее действие с несколько большей продолжительностью.

Показания к применению:

— головная боль различного генеза, включая головную боль напряжения (острые и хронические формы), сосудистого генеза, а также головная боль в результате переутомления или после острого стресса.

Относится к болезням:

- [Головная боль](#)

Противопоказания:

- тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность;
- тяжелая сердечная недостаточность (снижение сердечного выброса);
- AV-блокада II-III степени;
- дыхательная недостаточность;
- обострение бронхиальной астмы;
- хронический алкоголизм и наркомания;
- состояние после черепно-мозговой травмы;
- внутричерепная гипертензия;
- заболевания крови (тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз);
- дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы;
- лечение ингибиторами МАО и период до 14 дней после его окончания;
- детский возраст до 6 лет;
- беременность;
- период лактации (грудного вскармливания);
- лечение другими препаратами, содержащими парацетамол;
- головная боль, вызванная приемом лекарственных средств (анальгетиков, эрготамина);
- токсическая диспепсия, диарея на фоне псевдомембранозного колита, обусловленного применением цефалоспоринов, линкозамидов, пенициллинов (из-за содержания в составе препарата кодеина);
- острое угнетение дыхательного центра (связи с наличием в составе препарата кодеина);
- повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С *осторожностью* следует применять препарат при синдроме Жильбера (конституционной гипербилирубинемии) и других доброкачественных гипербилирубинемиях; у пациентов пожилого возраста, у пациентов с нарушениями функции печени и/или почек легкой и средней степени тяжести; у пациентов с артериальной гипотензией (возможность усиления артериальной гипотензии из-за наличия в составе препарата дротаверина); у пациентов, получающих длительную антикоагулянтную терапию (возможен только кратковременный прием препарата, т.к. при длительном приеме парацетамола у таких пациентов увеличивается риск развития кровотечения).

Способ применения и дозы:

Препарат предназначен для приема внутрь. Для достижения быстрого обезболивающего действия рекомендуется принимать препарат натощак (до еды или через 2 ч после еды) и запивать 1 стаканом воды.

Взрослые и дети старше 12 лет: при головной боли однократная доза составляет 1-2 таб., при необходимости препарат в этой дозе можно принимать повторно каждые 8 ч.

При коротком (не более 3 дней) курсе лечения максимальная суточная доза составляет 6 таб., а при длительном лечении (более 3 дней) суточная доза не должна превышать 4 таб.

Дети в возрасте от 6 до 12 лет: однократная доза составляет 0.5-1 таб., препарат в этой дозе можно принимать повторно каждые 10-12 ч. Максимальная суточная доза составляет 2 таб.

Пациентам пожилого возраста при отсутствии серьезных функции печени и почек рекомендуется принимать препарат в обычной дозе, предназначенной для взрослых.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто ($\geq 10\%$), часто ($\geq 1\% - < 10\%$), нечасто ($\geq 0.1\% - < 1\%$), редко ($0.01\% - 0.1\%$), очень редко ($< 0.01\%$).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко - снижение АД, сердцебиение.

Со стороны нервной системы: редко - головная боль, головокружение, сонливость.

Со стороны пищеварительной системы: редко - тошнота, запор, панкреатит (из-за содержания в составе препарата кодеина).

Со стороны печени и желчевыводящих путей: при приеме препарата в высоких дозах, особенно длительно, возможно токсическое поражение печени, а при приеме препарата в очень высоких дозах (превышающих рекомендованные дозы) может развиваться опасное для жизни поражение печени (необратимый некроз печеночной ткани).

Со стороны системы кроветворения: редко - нарушения кроветворения (агранулоцитоз, тромбоцитопения).

Дерматологические реакции: у пациентов с повышенной чувствительностью возможны сыпь, гиперемия кожи.

Аллергические реакции: очень редко - системные аллергические реакции, в т.ч. бронхоспазм, сенная лихорадка, отек слизистой оболочки носа; преходящая метгемоглобинемия.

Со стороны мочевыделительной системы: при длительном приеме в высоких дозах возможно снижение функции почек.

Передозировка:

Симптомы: основными симптомами передозировки кодеина являются тошнота, рвота, недостаточность кровообращения, холодный липкий пот, спутанность сознания, головокружение, сонливость, снижение АД, нервозность, усталость, брадикардия, резкая слабость, угнетение дыхания, гипотермия, тревожность, миоз, судороги, в тяжелых случаях - потеря сознания, остановка дыхания, кома.

После передозировки парацетамола состояние пациентов в течение 3 дней может оставаться удовлетворительным, т.к. симптомы поражения печени появляются позже. Изменения, развивающиеся в клетках печени в результате передозировки, вызываются накоплением очень токсичных промежуточных продуктов метаболизма парацетамола. Ранними признаками поражения печени являются: бледность кожных покровов, тошнота, рвота, анорексия, повышенное потоотделение и слабость. При тяжелой передозировке развивается печеночная недостаточность с прогрессирующей энцефалопатией, кома, смерть; острая почечная недостаточность с тубулярным некрозом (в т.ч. при отсутствии тяжелого поражения печени); аритмия; панкреатит. Гепатотоксический эффект у взрослых развивается при приеме 10 г парацетамола и более.

При передозировке дротаверина возможно нарушение AV-проводимости, снижение возбудимости сердечной мышцы, возможны остановка сердца и паралич дыхательного центра.

Лечение: рекомендуется промывание желудка и применение солевых слабительных. Лечение должно быть направлено на поддержание жизненно важных функций организма, в случае угнетения дыхания может потребоваться проведение ИВЛ, ингаляция кислорода, введение налоксона, а при признаках поражения печени - применение антидота парацетамола - ацетилцистеина (донатор SH-групп) и метионина (предшественника глутатиона).

Применение при беременности и кормлении грудью:

В настоящее время недостаточно данных по применению препарата при беременности и в период грудного вскармливания.

Но-шпалгин противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Лекарственное взаимодействие, обусловленное дротаверином

Как и при применении других ингибиторов ФДЭ, таких как папаверин, возможно уменьшение эффектов леводопы, т.е. у пациентов возможно усиление тремора и ригидности.

Лекарственное взаимодействие, обусловленное парацетамолом

При одновременном применении с препаратами, способными индуцировать печеночные ферменты (салициламид, барбитураты, противоэпилептические средства, трициклические антидепрессанты, алкоголь, рифампицин) возможно повышение концентрации токсических метаболитов парацетамола.

При одновременном применении увеличивается $T_{1/2}$ и усиливается токсичность хлорамфеникола.

При одновременном приеме с доксорубицином увеличивается риск поражения печени.

При одновременном приеме снижается эффективности урокозурических средств.

Метоклопрамидом и домперидон усиливают абсорбцию парацетамола.

Колестирамин уменьшает абсорбцию парацетамола.

При длительном применении препарата на фоне лечения непрямыми антикоагулянтами повышается протромбиновое время и риск развития кровотечений.

Парацетамол в высоких дозах препятствует действию инсулина.

Парацетамол способен увеличивать абсорбцию ионов железа (Fe^{2+}).

Лекарственное взаимодействие, обусловленное кодеином

Лекарственные средства, обладающие угнетающим действием на ЦНС (снотворные средства, средства для наркоза, опиоидные анальгетики, седативные средства, анксиолитики, трициклические антидепрессанты и антипсихотические средства) усиливают угнетающее действие кодеина на ЦНС.

Кодеин способен усиливать эффекты алкоголя на ЦНС.

При одновременном применении циклизина с агонистами опиоидных рецепторов, включая кодеин, возможно нивелирование гемодинамических эффектов опиоидов.

Циметидин и другие блокаторы гистаминовых H_2 -рецепторов способны замедлять метаболизм некоторых агонистов опиоидных рецепторов, в связи с чем при их одновременном приеме возможно усиление действия кодеина.

За счет своего влияния на ЖКТ агонисты опиоидных рецепторов способны замедлять всасывание мексилетина.

Агонисты опиоидных рецепторов оказывают эффекты, противоположные эффектам цизаприда, метоклопрамида, домперидона.

Ритонавир и возможно другие ингибиторы ВИЧ-протеазы способны увеличивать AUC некоторых агонистов опиоидных рецепторов.

Особые указания и меры предосторожности:

Применение препарата более 3 дней возможно только под контролем врача.

При применении препарата более 3 дней и/или в высоких дозах необходимо контролировать количество лейкоцитов и тромбоцитов, а также сывороточные концентрации креатинина и печеночных ферментов. Клинические и лабораторные симптомы гепатотоксического эффекта начинают проявляться в течение 48-72 ч после приема препарата в высоких дозах.

Для быстрого купирования боли не рекомендуется принимать препарат во время приема пищи.

Не следует превышать рекомендованную дозу.

При умеренной или средней степени тяжести почечной и печеночной недостаточности дозу следует устанавливать индивидуально в зависимости от тяжести нарушений функций этих органов.

У пациентов, получающих непрямые антикоагулянты, Но-шпалгин рекомендуется только для кратковременного обезболивания, т.к. при его длительном приеме возрастает риск развития кровотечения.

В связи с присутствием в составе препарата дротаверина следует соблюдать особую осторожность при его применении у пациентов с артериальной гипотензией.

В связи с содержанием в составе препарата кодеина, Но-шпалгин следует применять под медицинским наблюдением

Но-Шпалгин

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

из-за возможности развития кодеиновой зависимости.

При отмене препарата после длительного применения возможно развитие симптомов отмены (возбуждение, бессонница).

При приеме препарата употребление алкогольных напитков запрещается.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Пациенты должны быть проинструктированы о том, что в случае появления головокружения или сонливости после приема препарата следует избегать занятий потенциально опасными видами деятельности, таких как управление автотранспортом или работа с механизмами.

При нарушениях функции почек

Противопоказано применение при тяжелой почечной недостаточности.

При нарушениях функции печени

Противопоказано применение при тяжелой печеночной недостаточности.

Применение в детском возрасте

Препарат противопоказан: детский возраст до 6 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 30°C. Срок годности – 3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: <http://drugs.thead.ru/No-Shpalgin>