Спазмалгон Эффект



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

◊ ***Таблетки, покрытые пленочной оболочкой*** зеленого цвета, двояковыпуклые, продолговатые, с риской с одной стороны.

	1 таб.
парацетамол	325 мг
напроксен	100 мг
кофеин (безводный)	50 мг
дротаверина гидрохлорид	40 мг
фенирамина малеат	10 мг

Вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая - 118.6 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный - 30 мг, гипролоза - 20 мг, кроскармеллоза натрия - 60 мг, лимонная кислота - 10 мг, динатрия эдетат - 0.4 мг, аскорбиновая кислота - 20 мг, тальк - 12 мг, магния стеарат - 4 мг.

Состав пленочной оболочки: опадрай fx зеленый 65 F210000 - 30 мг (поливиниловый спирт - 14.1 мг, тальк - 6.588 мг, макрогол - 3.99 мг, перламутровый пигмент* - 3 мг, полисорбат-80 - 0.81 мг, титана диоксид - 0.75 мг, алюминиевый лак на основе красителя индигокармин - 0.507 мг, алюминиевый лак на основе красителя хинолиновый желтый - 0.255 мг).
* Перламутровый пигмент состоит из слюды и содержит 69-75% алюмосиликата калия (E555) и 25-31% титана диоксида (E171).

10 шт. - блистеры (1) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (3) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированный препарат, оказывает анальгезирующее, противовоспалительное, спазмолитическое, жаропонижающее действие.

Парацетамол - ненаркотический анальгетик, оказывает жаропонижающее и обезболивающее действие, обусловленное блокадой ЦОГ в ЦНС и воздействием на центры боли и терморегуляции.

Напроксен - НПВП, оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, связанное с неселективным подавлением активности ЦОГ, регулирующей синтез простагландинов.

Кофеин вызывает расширение кровеносных сосудов скелетных мышц, сердца, почек; повышает умственную и

физическую работоспособность, способствует устранению утомления и сонливости; увеличивает проницаемость гистогематических барьеров и повышает биодоступность ненаркотических анальгетиков, способствуя тем самым усилению терапевтического эффекта. Оказывает тонизирующее действие на сосуды головного мозга.

Дротаверин оказывает миотропное спазмолитическое действие, обусловленное ингибированием фосфодиэстеразы IV, действует на гладкие мышцы ЖКТ, желчевыводящих путей, мочеполовой системы, сосудов.

Фенирамин - блокатор гистаминовых H_1-рецепторов. Оказывает спазмолитическое и слабое седативное действие, уменьшает явления экссудации, а также усиливает анальгезирующее действие парацетамола и напроксена.

Фармакокинетика

Парацетамол

Характеризуется высокой и быстрой абсорбцией из ЖКТ, преимущественно в тонком кишечнике. C_{max} в плазме крови достигается через 0.5-1.5 ч после приема внутрь и составляет 5-20 мкг/мл. Степень связывания с белками плазмы незначительная - 15%. Парацетамол равномерно распределяется и проникает через ГЭБ, а также в большинство тканей организма. Кажущийся V_d составляет 0.95 л/кг. Метаболизируется в печени (90-95%): 80% вступает в реакции конъюгации с глюкуроновой кислотой и сульфатами с образованием неактивных метаболитов; 17% подвергается гидроксилированию с образованием 8 активных метаболитов, которые конъюгируют с глутатионом с образованием неактивных метаболитов. При недостатке глутатиона эти метаболиты могут блокировать ферментные системы гепатоцитов и вызывать их некроз. В метаболизме препарата также участвует изофермент CYP2E1. $T_{1/2}$ - 1.5-2.5 ч. Выводится почками в виде метаболитов, преимущественно конъюгатов, только 3% - в неизмененном виде. У пожилых пациентов снижается клиренс препарата и увеличивается $T_{1/2}$.

Напроксен

Абсорбция из ЖКТ напроксена быстрая и полная. Биодоступность - 95%. Прием пищи практически не влияет ни на полноту, ни на скорость всасывания. Время достижения C_{max} - 1-2 ч. Связывание с белками плазмы - более 99%. C_{ss} достигается к приему 4-5 доз препарата (2-3 дня). Метаболизируется в печени до диметилнапроксена с участием изофермента CYP2C9. $T_{1/2}$ - 12-15 ч. Клиренс - 0.13 мл/мин/кг. Выводится почками (98%), 10% из которых - в неизмененном виде; с желчью выводится 0.5-2.5% принятой дозы. При почечной недостаточности возможна кумуляция метаболитов.

Кофеин

Кофеин, входящий в состав препарата, почти полностью и быстро всасывается, C_{max} в плазме крови достигается через 1 ч. Быстро проходит через ГЭБ и плацентарный барьер, поступает в грудное молоко, выводится (в т.ч. в виде метаболитов) в основном почками около 65-80%. Основные метаболиты - 1-метилксантин, 1-метилмочевая кислота и ацетилированные производные урацила, небольшое количество кофеина превращается в теофиллин и теобромин. $T_{1/2}$ - 3.5 ч.

Дротаверин

При приеме внутрь абсорбция высокая и быстрая. Биодоступность - 100%. После пресистемного метаболизма в системный кровоток поступает 65% принятой дозы дротаверина. Время достижения C_{max} в крови - 45-60 мин. Связывание с белками плазмы - 95-97%, преимущественно с альбумином, гамма- и бета-глобулинами, а также ЛПВП. Равномерно распределяется в тканях, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через ГЭБ. Дротаверин и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер. $T_{1/2}$ - 8-10 ч. Почти полностью метаболизируется в печени путем О-дезэтилирования. Метаболиты быстро конъюгируют с глюкуроновой кислотой. Главный метаболит - 4-дезэтилдротаверин, другие метаболиты - 6-дезэтилдротаверин и 4'-дезэтилдротавералдин. $T_{1/2}$ - 8-10 ч. За 72 ч практически полностью выводится из организма. В основном (более 50% дротаверина) выводится почками, преимущественно в виде метаболитов, в меньшей степени (около 30%) - с желчью. Неизмененный дротаверин в моче не обнаруживается.

Фенирамин

C_{max} фенирамина в плазме крови достигается примерно через 1-2.5 ч. $T_{1/2}$ - 16-19 ч. 70-83% принятой дозы выводится из организма через почки в виде метаболитов или в неизмененном виде.

Показания к применению:

Болевой синдром различного генеза, в т.ч. боли в суставах, мышцах, радикулит, альгодисменорея, невралгия, зубная боль, головная боль (в т.ч. обусловленная спазмом сосудов головного мозга); болевой синдром, связанный со спазмом гладкой мускулатуры, в т.ч. при хроническом холецистите, желчекаменной болезни, постхолецистэктомическом синдроме, почечной колике; посттравматический и послеоперационный болевой синдром, в т.ч. сопровождающийся воспалением; простудные заболевания, сопровождающиеся лихорадочным синдромом (в качестве симптоматической терапии).

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Болевой синдром
- Боли в суставах
- Воспаление
- Головная боль
- Зубная боль
- Лихорадка
- Невралгия
- Неврит
- Постхолецистэктомический синдром
- Почечная колика
- Радикулит
- Спазмы
- Холера
- Холецистит

Противопоказания:

Эрозивно-язвенные поражения ЖКТ (в фазе обострения); желудочно-кишечное кровотечение; полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости ацетилсалициловой кислоты или других НПВП (в т.ч. в анамнезе); тяжелая печеночная недостаточность; тяжелая почечная недостаточность; угнетение костномозгового кроветворения; состояние после проведения аортокоронарного шунтирования; тяжелые органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в т.ч. острый инфаркт миокарда); пароксизмальная тахикардия; частая желудочковая экстрасистолия; тяжелая артериальная гипертензия; гиперкалиемия; беременность, период лактации; детский и подростковый возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к компонентам препарата.

С осторожностью: у пациентов с цереброваскулярными заболеваниями, сахарным диабетом, заболеваниями периферических артерий, язвенными поражениями ЖКТ в анамнезе, при почечной и печеночной недостаточности легкой или средней степени тяжести, вирусном гепатите, алкогольном поражении печени, доброкачественной гипербилирубинемии (синдромы Жильбера, Дубина-Джонсона и Ротора), эпилепсии, склонности к судорожным припадкам, дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, у пациентов пожилого возраста.

Способ применения и дозы:

Препарат принимают внутрь по 1 таб. 1-3 раза/сут. Максимальная суточная доза - 4 таб.

Длительность лечения составляет не более 3 дней в качестве жаропонижающего средства и не более 5 дней - в качестве обезболивающего. Продолжение лечения препаратом возможно только после консультации с врачом.

Не следует превышать указанные дозы препарата.

Побочное действие:

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек.

Со стороны системы кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз, анемия, метгемоглобинемия.

Со стороны нервной системы: возбуждение, тревожность, усиление рефлексов, тремор, головная боль, нарушения сна, головокружение, снижение концентрации внимания.

Со стороны органа слуха: снижение слуха, шум в ушах.

Со стороны органа зрения: повышение внутриглазного давления у пациентов с закрытоугольной глаукомой.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения, аритмии, повышение АД.

Со стороны пищеварительной системы: эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, тошнота, рвота, дискомфорт в эпигастрии, боли в животе, запор, нарушение функции печени.

Со стороны мочевыделительной системы: нарушение функции почек.

Прочие: дерматит, тахипноэ.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении препарата с *барбитуратами, трициклическими антидепрессантами, рифампицином, этанолом* увеличивается риск гепатотоксического действия (данных комбинаций следует избегать).

Парацетамол

Парацетамол усиливает действие антикоагулянтов непрямого действия и снижает эффективность урикозурических препаратов.

Длительное применение барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

При одновременном применении парацетамола с этанолом (напитки и лекарственные препараты, содержащие алкоголь) повышается риск возникновения острого панкреатита.

Ингибиторы микросомалъного окисления (в т.ч. циметидин) снижают риск гепатотоксического действия парацетамола.

Дифлунисал повышает плазменную концентрацию парацетамола на 50%, что повышает риск развития гепатотоксичности.

Напроксен

Напроксен способен вызывать уменьшение диуретического эффекта фуросемида.

Усиливает эффект непрямых антикоагулянтов.

Повышает токсичность сульфаниламидов и метотрексата.

Снижает выведение лития и повышает его концентрацию в плазме крови.

Кофеин

При совместном применении кофеина и барбитуратов, примидона, противосудорожных средств (производные гидантоина, особенно фенитоин) возможно усиление метаболизма и увеличение клиренса кофеина.

При одновременном приеме кофеина и циметидина, пероральных контрацептивных средств, дисульфирама, ципрофлоксацина, норфлоксацина возможно снижение метаболизма кофеина в печени (замедление его выведения и увеличение концентрации в крови).

Одновременное употребление кофеинсодержащих напитков и других средств, стимулирующих ЦНС, может приводить к чрезмерной стимуляции ЦНС.

Дротаверин

При одновременном применении дротаверин может ослабить противопаркинсонический эффект леводопы.

Фенирамин

При одновременном применении фенирамина с транквилизаторами, снотворными средствами, ингибиторами МАО, этанолом возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует избегать одновременного применения препарата с другими средствами, содержащими парацетамол и/или другие НПВП, в т.ч. со средствами для облегчения симптомов простуды, гриппа и заложенности носа.

При применении препарата более 5-7 дней следует контролировать показатели периферической крови и функциональное состояние печени.

Парацетамол искажает результаты лабораторных исследований содержания глюкозы и мочевой кислоты в плазме крови.

При необходимости определения 17-кетостероидов препарат следует отменить за 48 ч до исследования.

Следует учитывать, что напроксен увеличивает время кровотечения.

Влияние кофеина на ЦНС зависит от типа нервной системы и может проявляться как возбуждением, так и торможением высшей нервной деятельности.

В период лечения пациент должен избегать употребления алкоголя.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В отдельных случаях возможно снижение концентрации внимания и скорости психомоторных реакций, поэтому в период лечения пациент должен соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Источник: http://drugs.thead.ru/Spazmalgon_Effekt