

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ

МНН или группировочное название: дротаверин + кофеин + напроксен + парацетамол + фенирамин

Лекарственная форма: таблетки, покрытые пленочной оболочкой

Состав

1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит:

действующие вещества: парацетамол 325,0 мг, напроксен 100,0 мг, кофеин 50,0 мг, дротаверина гидрохлорид 40,0 мг, фенирамина малеат 10,0 мг;

вспомогательные вещества: целлюлоза микрокристаллическая 118,6 мг, крахмал кукурузный прежелатинизированный 30,0 мг, гипролоза 20,0 мг, кроскармеллоза натрия 60,0 мг, лимонная кислота 10,0 мг, динатрия эдетат 0,4 мг, аскорбиновая кислота 20,0 мг, тальк 12,0 мг, магния стеарат 4,0 мг;

пленочная оболочка: Опадрай fx зеленый 65 F210000 30,0 мг (поливиниловый спирт 14,100 мг, тальк 6,588 мг, макрогол 3,990 мг, перламутровый пигмент* 3,000 мг, полисорбат-80 0,810 мг, титана диоксид 0,750 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).

ОПИСАНИЕ

Продолговатые, двояковыпуклые таблетки, покрытые пленочной оболочкой, зеленого цвета с риской с одной стороны.

ФАРМАКОТЕРАПЕВТИЧЕСКАЯ ГРУППА

Анальгезирующее средство (анальгезирующее ненаркотическое средство + нестероидный противовоспалительный препарат + психостимулирующее средство + спазмолитическое средство + Н₁-гистаминовых рецепторов блокатор)

Код АТХ: N02BE71

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

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

Парацетамол – ненаркотический анальгетик, оказывает жаропонижающее и обезболивающее действие, обусловленное блокадой циклооксигеназы (ЦОГ) в центральной нервной системе (ЦНС) и воздействием на центры боли и терморегуляции.

Напроксен – нестероидный противовоспалительный препарат (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 желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), желчевыводящих путей, мочеполовой системы, сосудов.

Фенирамин – Н₁-гистаминовых рецепторов блокатор. Оказывает спазмолитическое и легкое 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. Время достижения максимальной концентрации в плазме крови (Т_{С_{max}}) – 0,5-1,5 часа после приема внутрь. Максимальная концентрация в плазме крови (С_{max}) – 5-20 мкг/мл. Связь с белками плазмы незначительная – 15%. Парацетамол равномерно

распределяется и проникает через гематоэнцефалический барьер, а также в большинство тканей организма. Предполагаемый объем распределения 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 уже неактивных метаболитов. При недостатке глутатиона эти метаболиты могут блокировать ферментные системы гепатоцитов и вызывать их некроз. В метаболизме препарата также участвует изофермент CYP2E1. Период полувыведения ($T_{1/2}$) – 1,5-2,5 часа. 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. TC_{max} - 1-2 часа. Связывание с белками плазмы – более 99%. Равновесная концентрация достигается к приему 4-5 доз препарата (2-3 дня). Метаболизируется в печени до диметилнапроксена с участием изофермента CYP2C9. $T_{1/2}$ - 12-15 часов. 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, максимальная концентрация в плазме крови достигается через 1 час. Быстро проходит через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, 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 часа.

Дротаверин

При пероральном приеме абсорбция дротаверина высокая и быстрая. Биодоступность – 100%. После пресистемного метаболизма в системный кровоток поступает 65% принятой дозы дротаверина. Время достижения C_{max} в крови – 45-60 минут. Связывание с белками плазмы – 95-97%, преимущественно с альбумином, гамма- и бета-глобулинами, а также липопротеинами высокой плотности. Равномерно распределяется в тканях, проникает в гладкомышечные клетки. Не проникает через гематоэнцефалический барьер. Дротаверин

и/или его метаболиты могут незначительно проникать через плацентарный барьер. $T_{1/2}$ - 8-10 часов. 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 часов. За 72 часа 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

Максимальная концентрация фенирамина в плазме крови достигается примерно через 1-2,5 часа. $T_{1/2}$ - 16-19 часов. 70-83% принятой дозы выводится из организма через почки в виде метаболитов или в неизмененном виде.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ

- болевой синдром различного генеза, включая боли в суставах, мышцах; при радикулите, альгодисменорее (менструальных болях), невралгиях, зубной боли, головной боли (в том числе при головной боли, обусловленной спазмом сосудов головного мозга);
- болевой синдром, связанный со спазмом гладкой мускулатуры, в том числе при хроническом холецистите, желчекаменной болезни, постхолецистэктомическом синдроме, почечной колике;
- посттравматический и послеоперационный болевой синдром, в том числе сопровождающийся воспалением;
- простудные заболевания, сопровождающиеся лихорадочным синдромом (в качестве симптоматической терапии).

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- повышенная чувствительность к компонентам препарата;
- 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 том числе в анамнезе);
- тяжелая печеночная недостаточность;

- тяжелая почечная недостаточность;
- угнетение костномозгового кроветворения;
- состояние после проведения аортокоронарного шунтирования;
- тяжелые органические заболевания сердечно-сосудистой системы (в том числе острый инфаркт миокарда);
- пароксизмальная тахикардия;
- частая желудочковая экстрасистолия;
- тяжелая артериальная гипертензия;
- гиперкалиемия;
- беременность и период грудного вскармливания;
- детский и подростковый возраст до 18 лет.

С ОСТОРОЖНОСТЬЮ

С осторожностью следует применять препарат 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, при склонности к судорожным припадкам, дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, у пациентов пожилого возраста.

При наличии любого из перечисленных заболеваний/состояний пациент перед применением препарата должен обратиться за консультацией к врачу.

ПРИМЕНЕНИЕ ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ И В ПЕРИОД ГРУДНОГО ВСКАРМЛИВАНИЯ

Противопоказано применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания.

СПОСОБ ПРИМЕНЕНИЯ И ДОЗЫ

Препарат принимают *внутри* по 1 таблетке 1-3 раза в день. Максимальная суточная доза - 4 таблетки.

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 органов кроветворения: тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз, анемия, метгемоглобинемия.

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

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение сердцебиения, аритмии, повышение артериального давления (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.

Со стороны органов чувств: снижение слуха, шум в ушах, повышение внутриглазного давления у пациентов с закрытоугольной глаукомой.

Прочие: дерматит, тахипноэ (учащение дыхания).

Если любые указанные побочные эффекты усугубляются, или пациент отмечает какие-либо другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, он должен сообщить об этом врачу.

ПЕРЕДОЗИРОВКА

Симптомы: бледность кожных покровов, анорексия (отсутствие аппетита), боль в животе, тошнота, рвота, желудочно-кишечное кровотечение, возбуждение, двигательное беспокойство, спутанность сознания, тахикардия, аритмия, гипертермия (повышение температуры тела), учащенное мочеиспускание, головная боль, тремор или мышечные подергивания; эпилептические припадки, повышение активности «печеночных» трансаминаз, гепатонекроз, увеличение протромбинового времени.

Симптомы нарушения функции печени могут появиться через 12-48 ч после передозировки. При тяжелой передозировке развивается печеночная недостаточность с прогрессирующей энцефалопатией, кома, смерть; острая почечная недостаточность с тубулярным некрозом;

аритмия, панкреатит. При подозрении на передозировку необходимо немедленно обратиться за медицинской помощью к врачу.

Лечение: промывание желудка с последующим приемом активированного угля. Специфическим антидотом при отравлении парацетамолом является ацетилцистеин. Введение ацетилцистеина актуально в течение 8 ч после приема парацетамола. При желудочно-кишечном кровотечении необходимо введение антацидных средств и промывание желудка ледяным 0,9% раствором хлорида натрия; поддержание вентиляции легких и оксигенации; при эпилептических припадках - внутривенное введение диазепама; поддержание баланса жидкости и солей в организме.

ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ С ДРУГИМИ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ ПРЕПАРАТАМИ

При одновременном приеме препарата СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ с *барбитуратами, трициклическими антидепрессантами, рифампицином, алкогольсодержащими напитками* увеличивается риск гепатотоксического действия (данных комбинаций следует избегать).

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 микросомального окисления (в том числе циметидин) снижают риск гепатотоксического действия парацетамола.

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

Напроксен способен вызывать уменьшение диуретического эффекта *фуросемида*, усиление эффекта *непрямых антикоагулянтов*, повышает токсичность *сульфаниламидов* и *метотрексата*, снижает выведение *лития* и повышает его концентрацию в плазме крови.

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* - 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.

При одновременном применении дротаверин может ослабить противопаркинсонический эффект *леводопы*.

При одновременном применении фенирамина с *транквилизаторами, снотворными средствами, ингибиторами моноаминоксидазы, алкоголем* возможно усиление угнетающего влияния на ЦНС.

ОСОБЫЕ УКАЗАНИЯ

Следует избегать одновременного применения препарата СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ с другими средствами, содержащими парацетамол и/или другие НПВП, в том числе со средствами для облегчения симптомов «простуды», гриппа и заложенности носа.

При применении препарата СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ 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 СПАЗМАЛГОН® ЭФФЕКТ 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 УПРАВЛЕНИЯ ТРАНСПОРТНЫМИ СРЕДСТВАМИ И 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.

ФОРМА ВЫПУСКА

Таблетки, покрытые пленочной оболочкой. По 10 таблеток в блистер из трехслойной

ПВХ/ПВДХ/ПВХ пленки или двухслойной ПВХ/ПВДХ пленки и алюминиевой фольги. По 1, 2 или 3 блистера вместе с инструкцией по применению в картонной пачке.

УСЛОВИЯ ХРАНЕНИЯ

При температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте!

СРОК ГОДНОСТИ

2 года. Не применять по истечении срока годности.

УСЛОВИЯ ОТПУСКА

Отпускается без рецепта.

ПРОИЗВОДИТЕЛЬ

«Балканфарма-Дупница» АД, ул. Самоковское шоссе 3, Дупница 2600, Болгария.

Претензии потребителей направлять по адресу

ООО «Актавис»

119017, г. Москва, ул. Б. Ордынка, д. 40, стр. 4

Тел.: (495) 644-44-14

Факс: (495) 644-44-24

Менеджер по регистрации ООО «Актавис»



Ноина С. В.