

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Спазмоблок 500 mg/5 mg прах за перорален разтвор в саше

Spasmobloc 500 mg/5 mg powder for oral solution in sachet

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение 1	
Към Рег. №	20220236
Разрешение №	
ВГ/МА/МР	67568 / 21-01-2025
Одобрение №	

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 саше съдържа:

Метамизол натрий монохидрат (Metamizole sodium monohydrate) 500 mg

Питофенон хидрохлорид (Pitofenone hydrochloride) 5 mg

Помощни вещества с известно действие: лактоза монохидрат 0,400 g в една доза.

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Прах за перорален разтвор в саше.

Външен вид – бял до почти бял прах с мирис на ягода.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

Спазмоблок е предназначен за симптоматично лечение на слабо или умерено изразен болков синдром, свързан със спазми на гладката мускулатура на вътрешните органи при възрастни и деца над 12 години:

- Стомашни и чревни колики;
- Холелитиаза и спастична дискинезия на жлъчните пътища;
- Бъбречни колики при нефро- или уретеролитиаза; възпалителни заболявания на пикочните пътища, протичащи с болка и дизурични смущения;
- Дисменорея.

Подходящ е за постигане на спазмоаналгезия преди или след инструментални изследвания и контрол на болката след малки хирургични процедури.



4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Дозата се определя от интензитета на болката и от индивидуалната чувствителност към действието на лекарствения продукт. Необходимо е да се избере най-ниската доза, при която се постига купиране на болката. Началото на аналгетичния ефект може да се очаква 30 до 60 минути след приложението.

Възрастни и юноши над 15 години

Еднократна доза 1 – 2 сашета. В зависимост от интензитета на болката и постигнатия противоболков контрол дозата може да бъде повторена след интервал от 6 – 8 часа. Максимална дневна доза 8 сашета (4000 mg метамизол и 40 mg питофенон).

Педиатрична популация

- Деца на възраст 12 – 15 години

Еднократна доза 1 саше. В зависимост от интензитета на болката и постигнатия противоболков контрол дозата може да бъде повторена след интервал от 6 – 8 часа. Максимална дневна доза 4 сашета (2000 mg метамизол и 20 mg питофенон).

- Деца на възраст 10 – 12 години

За приложение в тази възрастова група, има налични други подходящи лекарствени форми на Спазмоблок, с които може да осигури подходящо дозиране на лекарствения продукт.

- Деца на възраст под 10 години

Не е установена ефективността и безопасността на продукта в тази възрастова група.

Лица в старческа възраст и увредено общо състояние

Обичайно не се налага корекция на дозата. Тъй като скоростта на елиминиране на метаболитите на метамизол може да бъде забавена поради възрастово обусловено ограничение на бъбречната и чернодробна функция, многократните високи дози трябва да се избягват.

Лица с нарушена бъбречна и чернодробна функция

Обичайно не се налага коригиране на дозата. Тъй като скоростта на елиминиране е понижена при нарушена бъбречна и чернодробна функция, многократните високи дози трябва да се избягват. При краткосрочно приложение не е необходима редукция на дозата. Към момента няма достатъчно опит с продължителна употреба на метамизол при пациенти с тежко чернодробно и/или бъбречно увреждане.



При пациенти с остра бъбречна недостатъчност или сърдечна недостатъчност, дължаща се на циркулаторен колапс е необходимо намаление на дозата.

Начин на приложение

Този лекарствен продукт е предназначен за приложение през устата. Съдържанието на едно саше се разтваря в чаша с достатъчно количество вода, разбърква се добре до получаване на хомогенен разтвор, който се приема през устата, независимо от времето на хранене.

За постигане на спазмоаналгезия Спазмоблок се прилага 45 минути преди манипулацията.

Продължителност на приложение

Този лекарствен продукт е предназначен за краткосрочно приложение (обикновено 3 – 5 дни). Продължителността на приложение зависи от вида и тежестта на заболяването.

4.3. Противопоказания

- свръхчувствителност към активните вещества или някое от помощните вещества, изброени в т. 6.1;
- свръхчувствителност към други лекарства от групата на пиразолоните или пиразолодините (феназон, пропифенон, фенилбутазон, оксифеназон);
- анамнестични данни за реакции на свръхчувствителност към аналгетици, антипиретици или НСПВС;
- стомашно-чревна непроходимост и мегаколон;
- атония на жлъчния и пикочния мехур;
- тежки бъбречни и чернодробни заболявания;
- данни за агранулоцитоза, предизвикана от метамизол, други пиразолони или пиразолидини в анамнезата
- увредена функция на костния мозък или заболявания на хемопоетичната система
- нарушена миелоидна функция (напр. след лечение с цитостатици) или заболявания на хемопоетичната система;
- генетичен дефицит на глюкозо-6-фосфатдехидрогеназа (съществува риск от хемолиза);
- остра чернодробна порфирия (съществува риск от остър пристъп);
- бременност и в периода на кърмене (вж. точка 4.6)

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Агранулоцитоза

Лечението с метамизол може да предизвика агранулоцитоза, която може да доведе до фатален изход (вж. точка 4.8). Агранулоцитоза може да възникне дори когато при предишна употреба метамизол не е имало усложнения.



Предизвиканата от метамизол агранулоцитоза е идиосинкротична нежелана реакция. Не е зависима от дозата и може да възникне по всяко време в хода на лечението, дори малко след преустановяването на лечението.

На пациентите трябва да бъдат дадени указания да преустановят лечението и да потърсят незабавно лекарска помощ, ако се появят симптоми, предполагащи агранулоцитоза (напр. висока температура, втрисане, възпалено гърло и болезнени промени в лигавиците, особено в устата, носа и гърлото или в областта на гениталиите или ануса).

Ако метамизол се приема за висока температура, някои симптоми на развиваща се агранулоцитоза могат да останат незабелязани. Аналогично, при пациенти, които са на лечение с антибиотици, симптомите също могат да бъдат маскирани.

Ако се появят признаци и симптоми, предполагащи агранулоцитоза, трябва незабавно да се направи пълна кръвна картина (включително диференциално броене) и лечението трябва да се прекрати до излизането на резултатите. Ако диагнозата се потвърди, лечението не трябва да се възобновява (вж. точка 4.3).

Реакции от страна на имунната и хемопоеичната система

Приемът на метамизол може да предизвика, макар и в редки случаи, животозастрашаващи нежелани реакции, като анафилактичен шок и агранулоцитоза.

Преди приложението на продукта трябва да бъде снета подробна анамнеза, като при лицата с повишен риск от анафилактични и други имунологични реакции, свързани с приема на аналгетици или НСПВС, лекарството следва да се прилага при точна оценка на съотношението полза/риск.

При пациентите с анамнеза за анафилактични и други имунно обусловени реакции към метамизол (напр. агранулоцитоза и тромбоцитопения) трябва да се има пред вид повишения риск за развитие на такива след прием и на други пиразолони, пиразолидини или аналгетици от други групи.

Рискът от тежки анафилactoидни реакции е по-висок при:

- пациенти с астма, свързана с прием на аналгетици или при такива с известна непоносимост
- към аналгетици, проявяваща се с реакции от типа уртикария-ангиоедем;
- пациенти с бронхиална астма, особено придружена с риносинусит и назална полипоза;
- лица, страдащи от хронична уртикария;
- лица с непоносимост към оцветители (напр. тартразин), консерванти (напр. бензоати);
- лица с непоносимост към алкохол (анамнестични данни за поява на сълзотечение, кихане и интензивно зачервяване на лицето при консумация и на малки количества алкохолни напитки).

Такава непоносимост към алкохол може да бъде показател за предишен недиагностициран аналгетично свързан астма-синдром;

При пациенти с повишен риск от анафилактични реакции е необходимо строго мониториране на тези пациенти и евентуално осигуряване на мерки за спешна помощ.



Хипотония, циркулаторен колапс и други нарушения от страна на сърдечно-съдовата система

Метамизол може да предизвика хипотензивни реакции, които могат да бъдат и доза-зависими (вж. точка 4.8). Вероятността за тяхната поява е по-висока при парентерално приложение на метамизол. Предшестващата хипотония, дехидратация, хиперпирексия, нестабилна кръвна циркулация и начална циркулаторна недостатъчност (напр. множествена травма, сърдечен инфаркт) изискват повишено внимание и контролиране на състоянието, тъй като рискът от развитие на хипотензия след прием на метамизол в тези случаи е по-висок. За намаляване на риска от хипотензивни реакции е необходимо да влязат в съображение превантивни мерки, напр. стабилизиране на циркулацията.

Метамизол трябва да бъде използван внимателно и при контролиране на хемодинамичните показатели при пациентите, при които понижението на кръвното налягане трябва да бъде обезателно избегнато, напр. такива с тежки коронарни заболявания или високостепенна стеноза на мозъчните съдове.

Метамизол трябва да се прилага с внимание при пациенти със сърдечно-съдови заболявания като тежки ритъмни нарушения, ИБС, особено пресен миокарден инфаркт, застойна сърдечна недостатъчност (тези заболявания изискват периодичен лекарски контрол).

Лекарствено индуцирано чернодробно увреждане

Съобщени са случаи на остър хепатит, предимно от хепатоцелуларен тип, при пациенти, лекувани с метамизол, с начало от няколко дни до няколко месеца след започване на лечението. Признаците и симптомите включват повишени чернодробни ензими в серума със или без жълтеница, често в контекста на други реакции на свръхчувствителност към лекарството (напр. кожен обрив, кръвни дискразии, повишена температура и еозинофилия) или придружени от характеристики на автоимунен хепатит. Повечето пациенти са се възстановили при прекратяване на лечението с метамизол; въпреки това в отделни случаи има съобщения за прогресия до остра чернодробна недостатъчност, налагаща чернодробна трансплантация.

Механизмът на индуцираното от метамизол чернодробно увреждане не е изяснен напълно, но данните показват имуно-алергичен механизъм.

Пациентите трябва да бъдат инструктирани да се свържат със своя лекар в случай на поява на симптоми, предполагащи чернодробно увреждане. При такива пациенти употребата на метамизол трябва да се преустанови и да се оцени чернодробната функция.

Метамизол не трябва да се въвежда повторно при пациенти с епизод на чернодробно увреждане по време на лечение с метамизол, при които не е установена друга причина за чернодробното увреждане.



Други

Съобщавани са случаи на животозастрашаващи кожни реакции като Stevens-Johnson синдром (SJS) и токсична епидермална некролиза (TEN) при употреба на метамизол. Ако се развият признаци и симптоми като прогресивен обрив, често съчетан с мехури или лигавични лезии, лечението с метамизол трябва да се спре и повече да не се възобновява. Пациентите трябва да бъдат запознати с признаците и симптомите на кожни реакции и да бъдат проследявани за такива при продължително лечение.

Лекарственият продукт трябва да се прилага с внимание при обструктивни заболявания на гастроинтестиналния тракт (ахалазия, пилорна стеноза), ГЕРБ, чревна атония, паралитичен илеус, както и при пациенти с миастения гравис, закритоъгълна глаукома, ХОББ и бронхиална астма.

Продуктът се прилага след внимателна оценка от специалист на съотношението полза/риск при пациенти с увредена бъбречна и чернодробна функция (при възрастни пациенти екскрецията на метамизол от организма може да бъде забавена).

При редовно приемане на обезболяващи продукти, особено такива съдържащи различни лекарствени комбинации, може да настъпи увреждане на бъбреците, в някои случаи до развитие на бъбречна недостатъчност (т.н. аналгетична нефропатия). Продължителното прилагане на продукта при болни с бъбречни увреждания изисква внимание.

Възможно е да се появи или да се влоши налично главоболие след продължително лечение (повече от > 3 месеца) при използване на аналгетици през ден или по-често. Това главоболие не трябва да се лекува с увеличаване на дозата, а е необходимо лечението да се прекрати след консултация с лекар.

При прием на метамизол във високи дози, урината може да се оцвети в червено, поради повишена екскреция на рубазонова киселина.

При лечение с този продукт е необходимо да се има пред вид, че е възможно повлияване на психофизиологичното състояние на пациентите при едновременно приложение с алкохол и лекарства, потискащи функцията на ЦНС.

Този лекарствен продукт съдържа лактоза, поради което пациенти с редки наследствени проблеми на непоносимост към галактоза, пълнен лактазен дефицит или глюкозо-галактозна малабсорбция не трябва да приемат това лекарство.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Рискът от развитие на реакции на свръхчувствителност е по-висок при едновременен прием с други аналгетици и антипиретици, НСПВС и лекарства, съдържащи ацетилсалицилова киселина.

Метамизол може да взаимодейства и да доведе до промяна в ефекта на каптоприл и триамтерен.

Може да повиши литиевата токсичност, поради повишаване на литиевите нива в кръвта.



Съществува риск от потискане на хемопоезата при едновременно приложени с други лекарства с хемотоксично действие, напр. такива съдържащи злато, противоракови продукти, метотрексат, хлорамфеникол и др.

Метамизол може да понижи плазмените концентрации на циклоспорин, поради което кръвните нива на последния трябва да бъдат проследявани с оглед избягване на компрометиране на резултата от органна трансплантация.

Метамизол може да доведе до повишаване активността на кумариновите антикоагуланти и нискомолекулния хепарин и до удължаване времето на кървене, което налага мониториране на лабораторните показатели на коагулацията.

Едновременната употреба с хлорпромазин може да доведе до риск от тежка хипотермия.

Консумацията на алкохол по време на лечение с метамизол трябва да бъде ограничавана.

Метамизол може да доведе до повишаване плазмените концентрации на хлороквин.

Аналгетичното действие на метамизол се потенцира от невролептици и транквилизатори, седативни средства и транквилизатори. Трицикличните антидепресанти, оралните контрацептиви и алопуринол потенцират ефектите на метамизол, поради забавяне на неговата биотрансформация. Неговите ефекти могат да бъдат намалени от индуктори на микрозомалните чернодробни ензими като барбитурати, фенилбутазон, глутетимид и др.

Метамизол може да понижи ефекта върху тромбоцитната агрегация на ниска доза ацетилсалицилова киселина при едновременна употреба. Следователно тази комбинация трябва да се прилага внимателно при пациенти, приемащи ацетилсалицилова киселина за кардиопротекция.

Едновременната употреба на метамизол с перорални антидиабетни средства от групата на сулфонилурейните производни увеличава риск от хипогликемия. Следователно, нивата на кръвната захар трябва да се наблюдават по-често и при необходимост да се намали дозата на антидиабетните средства.

Храната може да доведе до незначими промени в кинетиката на активния метаболит на метамизола (4-метиламиноанпирин, 4-МАО), които не са клинично значими.

Фармакокинетично взаимодействие – индуциране на лекарство-метаболизиращи ензими:

Метамизол може да индуцира лекарство-метаболизиращи ензими, включително CYP2B6 и CYP3A4.

Едновременното приложение на метамизол с бупропион, ефавиренц, метадон, валпроат, циклоспорин, такролимус или сертралин може да доведе до намаляване на плазмените концентрации на тези лекарства с потенциално намаляване на клиничната ефикасност. Поради това се препоръчва повишено внимание при едновременно приложение на метамизол; клиничният отговор и/или концентрациите на лекарствата трябва да се проследяват по подходящ начин.



При лица, приемали метамизол, са докладвани ефекти върху лабораторни методи на изследване, основани на принципа на Триндеровата реакция или Триндер-подобните реакции (т.е. измерване на серумните нива на креатинина, триглицеридите, HDL, холестерол и пикочна киселина).

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Фертилитет

Няма данни за нарушения на фертилитета.

Бременност

Липсват достатъчно данни, относно приложението на метамизол и питофенон по време на бременност. Известно е, че метамизол преминава плацентарната бариера.

Въз основа на публикувани данни при бременни жени с експозиция на метамизол през първи триместър, не са установени тератогенни или ембриотоксични ефекти. В отделни случаи, когато не съществуват други възможности за лечение, прилагането на единични дози метамизол може да се допусне през първи и втори триместър.

Приложението на метамизол по време на трети триместър на бременността се свързва с фетотоксичност (увреждане на бъбреците и стесняване на дуктус артериозус), поради което приложението на метамизол в този период на бременността е противопоказано (вж. точка 4.3). Поради отсъствието на данни от контролирани клинични изпитвания при хора, метамизол и питофенон не трябва да се прилагат през целия периода на бременността (вж. точка 4.3).

Кърмене

Метаболитите на метамизол преминават в майчиното мляко, като създават концентрации надвишаващи тези в плазмата. Лекарственият продукт не трябва да се прилага в периода на кърмене, поради това, че не може да се изключи риск за кърмачето (вж. точка 4.3).

В случай на еднократно приложение на метамизол, на майките се препоръчва да събират и изхвърлят кърмата в продължение на 48 часа след приема.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Приложението на Спазмоблок в обичайните терапевтични дози не повлиява способността за шофиране и работа с машини.

Пред вид някои от възможните нежелани лекарствени реакции (замайване, сънливост, главоболие) продължителният прием може да доведе до намаляване на способността за концентрация и вниманието, поради което при поява на подобна симптоматика е необходимо преустановяване на шофирането и дейностите, свързани с управление на машини.



4.8. Нежелани лекарствени реакции

Следната терминология е била използвана при класифицирането на нежеланите реакции по отношение на тяхната честота: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ to $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1,000$ to $< 1/100$), редки ($\geq 1/10,000$ до $< 1/1,000$), много редки ($< 1/10,000$), с неизвестна честота (честотата не може да бъде определена от наличните данни).

MeDRA SOC/честота	Нежелана лекарствена реакция
Нарушения на кръвта и лимфната система Редки	Левкопения
Много редки	Агранулоцитоза, тромбоцитопения, хемолитична анемия Обикновено се касае за имунологично обусловени реакции. Те могат да се развият и при пациенти, при които при предишно използване на метамизол не са наблюдавани подобни усложнения. Рискът нараства в отделни случаи при прием на метамизол над 7 дни. Незабавното прекратяване приема на лекарството е задължително в тези случаи и не следва да бъде отлагано до получаване на резултатите от лабораторните изследвания от гледна точка избягване на неочаквано влошаване на общото състояние.
Нарушения на имунната система Редки	Анафилактични и анафилактоидни реакции
Много редки	Аналгетична астмар ангиоедем, диспнея, бронхоспазъм, астматичен пристъп, аритмия, хипотония
С неизвестна честота	Анафилактичен шок
Нарушения на кожата и подкожната тъкан Нечести	Обрив, сърбеж
Редки	Макулопапулозен екзантем, уртикария, сърбеж, еритема, пурпура
Много редки	Синдром на Steven's-Johnson, синдром на Lyell (токсична епидермална некролиза)
С неизвестна честота	Прекомерно изпотяване
Сърдечни нарушения Нечести	Хипотония



	Значима, в някои случаи критична, хипотензивна реакция може да се наблюдава при пациенти с изразена хиперпирексия, без клинични признаци на свръхчувствителност
С неизвестна честота	Палпитации
Нарушения на бъбреците и пикочните пътища Много редки	Остри нарушения на бъбречната функция (протеинурия, олигурия, анурия до остра бъбречна недостатъчност), остър интерстициален нефрит
Хепатобилиарни нарушения С неизвестна честота	Лекарствено индуцирано чернодробно увреждане, включително остър хепатит, жълтеница, повишени чернодробни ензими (вж. точка 4.4)
Нарушения на нервната система С неизвестна честота	Сънливост, главоболие
Нарушения на ухото и лабиринта С неизвестна честота	Замаяност
Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения Много редки	Бронхоспазъм
Стомашно-чревни нарушения С неизвестна честота	Диспепсия, гадене, повръщане, запек
Общи нарушения и ефекти на мястото на приложение С неизвестна честота	Умора, оцветяване на урината в червено (предизвикано обикновено от наличието на ниски концентрации от безвредния метаболит рубазонова киселина)

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез:



Изпълнителна агенция по лекарствата
ул. „Дамян Груев“ № 8
1303 София
тел.: + 359 2 8903417
уебсайт: www.bda.bg

4.9. Предозиране

Симптоми

При предозиране клиничната картина се владее от симптомите на интоксикация с метамизол, която се проявява с гастро-интестинални симптоми - гадене, повръщане, епигастрална и коремна болка, нарушения на бъбречната функция до остра бъбречна недостатъчност, прояви от страна на ЦНС (световъртеж, сънливост, дезориентация, гърчове или кома), хипотония до циркулаторен шок, тахикардия.

Терапевтични мерки

Не е известен специфичен антидот. Прилагат се симптоматични средства, вкл. бета-антагонисти с оглед избягване на кардиотоксични ефекти, както и такива целящи намаляване на резорбцията (прием на медицински въглен) и ускоряване на елиминирането на метамизол от организма (хемодиализа, хемоперфузия, хемофилтрация).

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Спазмолитични продукти, синтетични антихолинергици в комбинация с аналгетици

ATC код: A03DA02

Механизъм на действие

Метамизол предизвиква аналгезия основно от периферен тип, като потиска синтеза на ендогенни алгогени. Повлиява прага на възбудимост в таламуса и провеждането на болкови екстеро- и интероцептивни импулси в ЦНС. Потиска биосинтезата на простагландините, инхибирайки циклооксигеназата. Счита се, че централно-аналгетичното му действие се дължи на инхибирането на аденилатциклазата или блокиране на инфлукса на калциеви йони в ноцицепторите. Има данни, че той усилва отделянето на β -ендорфини, атакува процесите на окислителното фосфорилиране в митохондриите, потиска продукцията на хистамин, серотонин, брадикинин и други биологично активни вещества.



Питофенон оказва директен миорелаксиращ гладката мускулатура ефект. Питофенон оказва папавериноподобно действие. Неговата спазмолитична активност е резултат на миотропно действие основно върху съдовата и извънсъдова гладка мускулатура.

Фармакодинамични ефекти

Метамизол оказва изразен и продължителен аналгетичен и антипиретичен ефект. Тези ефекти настъпват бързо след приложението и показват зависимост от размера на приложената доза. Оказва спазмолитично действие, което е лишено от нежелани холинергични ефекти.

Питофенон понижава тонуса и намалява съкратителната активност на гладката мускулатура, с което освен спазмолитично оказва и известно вазодилатиращо действие. Действа директно върху гладкомускулните клетки, без да повлиява невро-мускулния апарат за разлика от атропин и другите подобни вещества. Не оказва ефект върху ЦНС поради слабата си липорастворимост.

Спазмолитичното действие на комбинирания лекарствен продукт е резултат основно на действието на питофенон върху гладката мускулатура на органите на стомашно-чревния тракт и отделителната система. Към тези ефекти адитивно действие има и известната спазмолитична активност на метамизол.

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

След перорално приложение, метамизол се резорбира бързо и пълно, като веднага напълно се хидролизира до фармакологично активния метаболит 4-метил-амино-антипирин (МАО), бионаличността на който е почти 90%. Едновременното приложение с храна няма релевантен ефект върху скоростта и степента на резорбция.

Данните в достъпната медицинска литература по отношение процесите на резорбция на питофенон са оскъдни. Известно е, че резорбцията се осъществява в горните отдели на гастро-интестиналния тракт и е непълна. Профилът на плазмената концентрация има бифазен характер.

Разпределение

Степента на свързване с плазмените протеини за четирите метаболита на метамизол е както следва: 4-метил-амино-антипирин (МАО) - 57,6%, 4-амино-антипирин (АО) - 47,9%, 4-формил-амино-антипирин (ФАО) - 17,8%, 4-ацетил-амино-антипирин (ААО) - 14,2%.

Питофенон търпи процес на значителна йонизация и има слаба липорастворимост, което предопределя невисоката степен на проникване през кръвно-мозъчната бариера.



Биотрансформация

Клиничната ефективност се дължи основно на МАА, който впоследствие се метаболизира в черния дроб до ФАА и АА. АА от своя страна се подлага на ацетиране в резултат на което се образува ААА.

Питофенон се метаболизира в черния дроб основно по пътя на хидролизата и окислението.

Елиминиране

Всичките четири метаболита на метамизол се намират в цереброспиналната течност и се екскретират с майчиното мляко. Метаболитите се излъчват основно с урината, като за ФАА и ААА този показател е около 60%.

Приблизително 90% от метаболизирания питофенон се отделя с урината и около 10% с фекалиите като непроменено съединение. Има данни, че плазменият полуживот е около 10 часа.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Метамизол принадлежи към веществата с ниска токсичност. Данните от изследвания, проведени за определяне на неговата подостра и хронична токсичност, с неколкостранно по-високи дози от тези прилагани в терапевтичната практика, показват, че метамизол не води до промяна в поведението на опитните животни, както и до някои клинично-лабораторните и морфологични промени.

Метамизол, приложен в експериментални условия и в дози, близки до терапевтичните при хора, не проявява ембриотоксично и тератогенно действие.

Няма данни от експериментални и други изпитвания за тератогенно и карциногенно действие на питофенон.

Няма данни за потенциране на токсичните ефекти между метамизол и питофенон.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Макрогол 6000

Манитол

Лактоза монохидрат

Натриев цикламат

Захарин натрий

Аромат на ягода (смес на ароматни вещества и глюкоза)

Силицев диоксид, колоиден безводен

6.2. Несъвместимости

Не са известни.



6.3. Срок на годност

3 години.

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 25°C.

6.5. Данни за опаковката

Прах за перорален разтвор 1.2 g в саше от хартия/алуминий/полиетилен.

Една опаковка съдържа 10 броя сашета.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Не са известни.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Адифарм ЕАД

бул. Симеоновско шосе № 130

1700 София

България

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Reg № 20220236

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешаване: 16.08.2022

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Декември 2024

