

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

SARIPHEZON 250 mg/150 mg/50 mg tablets
САРИФЕЗОН 250 mg/150 mg/50 mg таблетки

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всяка таблетка съдържа активни вещества парацетамол (paracetamol) 250 mg; пропифеназон (propyphenazone) 150 mg; кофеин (caffeine) 50 mg.
За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Таблетки

Бели или почти бели, кръгли, плоски таблетки с фасета и делителна черта от едната страна. Таблетката може да бъде разделена на две равни половини.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**4.1 Терапевтични показания**

- За повлияване на болки при главоболие, зъбобол, менструална и постоперативна болка.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Възрастни и деца над 16-годишна възраст: по 1-2 таблетки 1-3 пъти дневно.

Деца от 12 до 16-годишна възраст: по ½ -1 таблетка 1-3 пъти дневно.

Таблетките се приемат през устата с достатъчно количество течност.

Сарифезон не трябва да се приема за период, по-дълъг от 7 дни или в дози, по-високи от препоръчителните, освен по лекарско предписание.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активните вещества или към някое от помощните вещества на продукта;
- свръхчувствителност към пиразолони или подобни съединения (феназон, пропифеназон, аминофеназон) и метамизолсъдържащи продукти;
- свръхчувствителност към лекарствени продукти, съдържащи фенилбутазон
- свръхчувствителност към парацетамол, ацетилсалицилова киселина или доказана алергия към кофеин;
- остра чернодробна порфирия;
- хемолитична анемия с наследствен дефицит на глюкозо-6-фосфатдеhidрогеназа.
- деца под 12-годишна възраст.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

• Лекарственият продукт е необходимо да се прилага с особено внимание при следните състояния:

- увредена чернодробна функция (в случай на хронична злоупотреба с алкохол или при хепатит);
- синдром на *Gilbert* (флукуиращ доброкачествен иктер в резултат на хроничен трансферазен дефицит);



- увредена бъбречна функция;
- хематопоетична дисфункция.

В тези случаи може да се наложи корекция на дозата или интервала на дозиране.

- Както при другите болкоуспокояващи средства, Сарифезон не трябва да се употребява за продължителен период, освен по лекарско назначение.
- При продължително приемане на продукта е необходимо редвно контролиране на функцията на черния дроб, бъбреците и кръвната картина.
- Продължителният прием на лекарствени продукти за лечение на главоболие само по себе си може да доведе до хронично главоболие.
- Специално внимание е необходимо при пациенти с астма, хроничен ринит или хронична уртикария, особено при тези с повишена чувствителност към други противовъзпалителни лекарствени продукти.
- Има единични съобщения за пристъпи на астма и анафилактичен шок, свързани с използване на продукти, съдържащи пропифеназон и парацетамол при чувствителни пациенти.
- При приемане на Сарифезон не се препоръчва използване на други лекарствени продукти, съдържащи парацетамол и/или пиразолонови производни, включително метамизол.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

- Едновременното приложение на парацетамол с лекарствени продукти, ензимни индуктори като някои хипнотици, антиепилептични средства (фенобарбитал, финитоин, карбамазепин), рифампицин, алкохол може да увеличи риска от токсично увреждане на черния дроб, дори и при прилагане на терапевтични дози.
- При едновременно приложение с метоклопрамид може да се ускори резорбцията на парацетамол.
- Продължително непрекъснато приемане на парацетамол може да засили ефектите на кумариновите антикоагуланти при едновременното им приложение.
- Елиминационният полуживот на хлорамфеникол се удължава по пътя на компетитивното потискане на неговия метаболизъм при едновременно приложение със Сарифезон, в резултат на което се повишава риска от миелотоксично действие.
- Честотата на неутропения е по-висока при едновременно приложение на парацетамол и зидовудин. Затова комбинираното приложение трябва да става само след лекарско назначение.
- Кофеинът е антагонист на много седативни вещества като барбитурати, антихистамини и други. Кофеинът засилва тахикардията, провокирана от симпатикомиметици, тироксин и други.
- Перорални контрацептиви, циметидин и дисулфирам забавят метаболизма на кофеин, докато барбитуратите и тютюнопушенето го ускоряват.
- Едновременното приложение на Сарифезон с инхибитори на ДНК-гиразата (напр. ципрофлоксацин) може да удължи елиминирането на кофеин и неговия метаболит параксантин.
- Елиминирането на кофеин се забавя при едновременна употреба с теофилин.
- Кофеин повишава възможността за развитие на лекарствена зависимост към вещества като ефедрин.

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Поради липса на добре контролирани проучвания относно ефектите на комбинацията парацетамол и пропифеназон не се препоръчва употребата на Сарифезон по време на бременност, особено през първия триместър и по време на последните шест седмици от бременността.

Кърмене

Тъй като активните съставки на лекарствения продукт се излъчват в кърмата, приложението на Сарифезон не се препоръчва в периода на кърмене.



4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Сарифезон не оказва неблагоприятно влияние върху способността за шофиране и работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

В терапевтични дози Сарифезон е добре поносим, тъй като активните съставки са в ниски дози. Нежелани лекарствени реакции могат да възникнат много рядко или по време на лечение с високи дози.

Нежеланите реакции се класифицират по честота по следния начин: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ и $<1/10$), нечести ($\geq 1/1\ 000$ и $<1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ и $<1/1\ 000$) и много редки ($<1/10\ 000$), включително единични съобщения.

Нежелани реакции по системата орган-клас.

Нарушения на кръвта и лимфната система: изолирани случаи на левкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоза, панцитопения, свързани с парацетамол и пропифеназон;

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения: много редки – диспнея или астма;

Стомашно-чревни нарушения: коремни болки, запек;

Нарушения на бъбреците и пикочните пътища: интерстициален нефрит при предозиране;

Нарушения на кожата и подкожната тъкан: много редки - сърбеж, кожен обрив, еритем, уртикария;

Нарушения на имунната система: в изолирани случаи анафилактични реакции и анафилактичен шок;

Хепато-билиарни нарушения: при предозиране – чернодробна недостатъчност.

4.9 Предозиране

Симптоми

Симптомите на предозиране с парацетамол се проявяват до 24-48 часа и включват гадене, повръщане и болки в корема. Могат да се наблюдават прояви на чернодробна недостатъчност, възможно е развитие на чернодробна кома и енцефалопатии.

Има единични съобщения за остра бъбречна недостатъчност след предозиране с парацетамол.

Лечение

При съмнение за интоксикация е важно да се направи стомашна промивка с активен въглен в първите 6 часа, прилагат се симптоматични средства и специфичния антидот N-ацетилцистеин, по възможност в рамките на 12 часа след предозирането на парацетамол.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1 Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Аналгетици. Парацетамол, комбинации изключващи психолептици: АТС код: N02BE51

Сарифезон е комбиниран продукт, в състава на който влизат аналгетици - парацетамол и пропифеназон, а също така и психостимулатора кофеин. Парацетамол притежава аналгетично и антипиретично действие и слаба противовъзпалителна активност. Пропифеназон е производно на пиразолоната с изразени аналгетични, антипиретични и противовъзпалителни свойства. Механизмът на действие на тези компоненти е свързан с потискане синтезата на простагландините. Кофеин е стимулатор на ЦНС с аналептично действие. Той усилва регулира процесите на възбуждане в главния мозък, усилва положителните условия рефлексно повишава двигателната активност. Експериментално е установено, че кофеин повишава болката и потенцира аналгетичния ефект на аналгетиците. В резултат на съставителните действия на компонентите си Сарифезон притежава изразен и бързодействие.



антипиретичен ефект. Аналгетичният ефект на комбинацията започва до 30 минути след приема и има продължителност няколко часа.

5.2 Фармакокинетични свойства

Резорбция

Парацетамол се резорбира бързо и пълно след перорално приложение. Максимални плазмени концентрации се достигат след 30-90 минути. Пропифеназон се резорбира бързо и пълно. Максимални плазмени концентрации се достигат около 30 минути след перорален прием. Кофеин се резорбира бързо и почти напълно след перорално приложение.

Разпределение

Парацетамол се разпределя интензивно в течностите и тъканите на организма. Обемът на разпределение е около 0,95 l/kg. Концентрациите на парацетамол в кръвта и слюнката са близки, докато в цереброспиналната течност се намира около половината от плазменото ниво. С плазмените протеини се свързва по-малко от 10%. Парацетамол преминава през плацентарната бариера и се екскретира в кърмата. Пропифеназон се разпределя в целия организъм. Свързва се слабо с плазмените протеини (около 10%). Пропифеназон преминава плацентарната бариера и се екскретира в кърмата. Кофеин се свързва слабо с плазмените протеини (30-40%). Максималната концентрация се достига за 30-40 мин. Обемът на разпределение е около 0,5 l/kg. Кофеин преминава хемато-енцефалната и плацентарната бариера и се екскретира в кърмата.

Метаболизъм

Парацетамол се подлага на интензивен метаболизъм в черния дроб по два основни пътя - глюкурониране и сулфониране. Пропифеназон се метаболизира бавно в черния дроб, като се окислява, хидроксилува или се свързва в глюкурониди. Кофеин се метаболизира в микрозомите на хепатоцитите чрез деметилиране.

Екскреция

Времето на полуживот на парацетамол е 1,5-2 часа. Елиминира се чрез урината основно като глюкурониди (60-80%), сулфосвързана форма (20-30%) и в незначително количество като непроменен парацетамол (5%). Пропифеназон се елиминира за около 24 часа чрез бъбреците, главно под форма на глюкуронати или серни соли. Само около 1% се излъчва в непроменен вид. При случаи на чернодробна или бъбречна недостатъчност метаболизма или елиминирането на пропифеназон могат да се забавят. Времето на полуживот на кофеин е между 4 и 6 часа. Екскретира се чрез урината под формата на метаболити в 90-92% и непроменен – 8-10%.

5.3 Предклинични данни за безопасност

При изследване на острата токсичност на комбинирания продукт Сарифезон са установени следните стойности на LD₅₀ при пероралното му въвеждане: LD₅₀ = 3915 (2655 ÷ 5805) mg/kg на мъжки плъхове линия Wistar; LD₅₀ = 3015 (1845 ÷ 4950) mg/kg на женски плъхове линия Wistar. Не са установени данни за ембриотоксично, тератогенно и канцерогенно действие на Сарифезон.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Целулоза, микрокристална; повидон, кроскармелоза натрий, глицеролов дистеарат (енция), силициев диоксид за стоматологична употреба, талк, магнезиев стеарат.

6.2 Несъвместимости

Неприложимо.



6.3 Срок на годност

2 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от влага и светлина.

Да се съхранява под 25°C.

Съхранявайте на място, недостъпно за деца.

6.5 Данни за опаковката

По 10 таблетки в блистер от твърдо, оранжево, прозрачно PVC/алуминиево фолио; по 2 блистера в картонена кутия, заедно с листовка.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Per. № 20040474/20.10.2004

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

20.10.2004

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Февруари 2009

