

## ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного препарата

### САФИСТОН®



**Регистрационный номер:** ЛП-002203

**Торговое название:** Сафистон®

(и далее по тексту инструкции по применению)

**Международное непатентованное название или группировочное название:**

Кофеин+Парацетамол+Пропифеназон

**Лекарственная форма:** таблетки

**Состав на одну таблетку:**

*Активные вещества:* кофеин – 50,0 мг, парацетамол – 250,0 мг, пропифеназон – 150,0 мг.

*Вспомогательные вещества:* целлюлоза микрокристаллическая – 100,0 мг, кроскармеллоза натрия – 8,0 мг, карбоксиметилкрахмал натрия – 44,8 мг, повидон (поливинилпирролидон) – 18,0 мг, кремния диоксид коллоидный – 3,2 мг, магния стеарат – 16,0 мг.

**Описание:** Круглые таблетки от белого до белого с бежевым оттенком цвета, с незначительной мраморностью, плоскоцилиндрической формы, с фаской с двух сторон и риской с одной стороны.

**Фармакотерапевтическая группа:**

Анальгезирующее средство комбинированное (НПВП+анальгезирующее ненаркотическое средство+психостимулирующее средство).

**Код АТХ:** N02BE51.

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Сафистон® представляет собой комбинированный препарат, действие которого определяется компонентами, входящими в его состав. Сочетание трех компонентов препарата приводит к взаимному усилению их фармакологического действия.

Парацетамол и пропифеназон обладают обезболивающим и жаропонижающим действием. Парацетамол – ненаркотический анальгетик. Блокирует циклооксигеназу (ЦОГ) только в центральной нервной системе (ЦНС), воздействуя на центры боли и терморегуляции (в воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на ЦОГ), что объясняет практически полное отсутствие противовоспалительного эффекта. Отсутствие влияния на синтез простагландинов (ПГ) в периферических тканях обуславливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды) и слизистую желудочно-кишечного тракта.

Пропифеназон является производным пиразолона. Механизм действия осуществляется путем ингибирования ЦОГ, участвующей в образовании простагландинов из арахидоновой кислоты.

Кофеин повышает рефлекторную возбудимость спинного мозга, возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры, расширяет кровеносные сосуды скелетных мышц, головного мозга, сердца, почек, снижает агрегацию тромбоцитов; уменьшает сонливость, чувство усталости. В данной комбинации кофеин в малой дозе практически не оказывает стимулирующего действия на центральную нервную систему, однако способствует регуляции тонуса сосудов мозга, уменьшает сонливость, усиливает болеутоляющее действие других компонентов препарата.

**Фармакокинетика**

Парацетамол

Абсорбция – высокая, связь с белками плазмы - 15 %, время достижения максимальной концентрации в плазме крови (Т<sub>Сmax</sub>) – 20-30 мин. Проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ). Менее 1 % от принятой кормящей матерью дозы проникает в грудное молоко. Терапевтическая эффективная концентрация парацетамола в плазме достигается при его назначении в дозе 10-15 мг/кг.

Метаболизируется в печени: 80 % вступает в реакцию конъюгации с глюкуроновой и серной

кислотами с образованием неактивных метаболитов; 17 % подвергается гидроксированию с образованием неактивных метаболитов, которые конъюгируют с глутатионом и образуют неактивные метаболиты. При недостатке глутадиона эти метаболиты могут блокировать ферментные системы гепатоцитов и вызывать их некроз. Период полувыведения - 2-3 ч. У пожилых пациентов снижается клиренс парацетамола и увеличивается период полувыведения. Выводится почками в неизменном виде 3 %.

Пропифеназон

Максимальная концентрация пропифеназона в плазме достигается через 30 мин. Метаболизируется в печени. Период полувыведения составляет 1-1,5 ч. Сочетание с парацетамолом увеличивает время его выведения на 40 %, что играет значительную роль, т.к. позволяет сократить число приемов препарата в течение суток. Выводится почками.

Кофеин

Время достижения максимальной концентрации – 1 ч; период полувыведения – 3,5 ч; 65-80 % кофеина выводится почками главным образом в виде 1-метилксатина, 1-метилмочевой кислоты и ацетилированных производных урацила, небольшое количество превращается в теофиллин и теобромин.

**Показания к применению**

Применяют для купирования болевого синдрома слабой и средней интенсивности различного генеза: головная боль, мигрень, зубная боль, артралгии, миалгии, альгодисменорея, а также в качестве жаропонижающего средства при лихорадочных состояниях на фоне инфекционно-воспалительных заболеваний (ОРВИ, в том числе грипп и т.п.).

**Противопоказания**

Повышенная чувствительность к компонентам препарата, тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность, дефицит фермента глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, угнетение костномозгового кроветворения (лейкопения, анемия, в т.ч. гемолитическая), острая гематопорфирия, полное или неполное сочетание бронхиальной астмы, рецидивирующего полипоза носа и околоносовых пазух и непереносимости нестероидных противовоспалительных препаратов (в том числе в анамнезе), состояния сопровождающиеся угнетением дыхания, внутричерепная гипертензия, острый инфаркт миокарда, ишемическая болезнь сердца, аритмии, артериальная гипертензия, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, глаукома, бессонница, беременность, период лактации у женщин, детский возраст до 12 лет.

**С осторожностью:** двобрачественные гипербилирубинемии (в т.ч. синдром Жильбера, Дубина-Джонсона, Ротора), пожилой возраст, алкоголизм, эпилепсия и склонность к судорожным припадкам.

**Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Применение препарата при беременности и в период грудного вскармливания противопоказано.

**Способ применения и дозы**

Назначают взрослым по 1-2 таблетки, детям 12-18 лет – 1 таблетку 1-3 раза в сутки, желательно через 1-2 часа после еды, запивая большим количеством жидкости. Максимальная разовая доза 2 таблетки. Суточная доза не должна превышать 6 таблеток.

Препарат не следует принимать более 5 дней как обезболивающее средство и не более 3 дней в качестве жаропонижающего средства без назначения и наблюдения врача. Увеличение суточной дозы или продолжительности лечения возможны только под наблюдением врача.

Не превышайте рекомендованную дозу.

**Побочные эффекты**

*Со стороны центральной нервной системы:* головокружение, бессонница.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* тошнота, рвота, тяжесть и неприятные ощущения в области желудка;

*Со стороны кроветворной системы:* тромбоцитопения, агранулоцитоз, гемолитическая анемия;

*Аллергические реакции:* кожная сыпь, зуд, крапивница, отек Квинке, мультиформная экссудативная эритема (в т.ч. синдром Стивенса-Джонсона), токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайела).

**Передозировка**

*Симптомы:* (обусловлены парацетамолом, проявляются после приема 10-15 г) бледность кожных покровов, снижение аппетита, тошнота, рвота, боли в эпигастральной области, гепатотоксическое и нефротоксическое действие, в тяжелых случаях - печеночная недостаточность, гепатонекроз, повышение активности «печеночных» трансаминаз, увеличение протромбинового времени, энцефалопатия и коматозное состояние.

*Лечение:* промывание желудка, назначение активированного угля, симптоматическая терапия, введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона – метионина через 8-9 часов после передозировки и N-ацетилцистеина через 12 часов.

Высокие дозы кофеина вызывают следующие *симптомы:* головная боль, тремор, раздражительность, гастралгия, ажитация, двигательное беспокойство, спутанность сознания, тахикардия, аритмия, гипертермия, учащенное мочеиспускание, головная боль, тошнота, звон в ушах, судороги (при острой передозировке - тонико-клонические).

*Лечение:* промывание желудка, прием активированного угля, слабительных средств, поддержание вентиляции легких и оксигенации, при судорогах внутривенно диазепам, фенобарбитал, поддержание водно-электролитного баланса.

**Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Эффективность препарата может снизиться при одновременном применении с холистерамином, холинолитиками, антидепрессантами, щелочными веществами. При одновременном применении Сафистон® с барбитуратами, противосудорожными препаратами, этанолом значительно повышается гепатотоксичное действие. Метоклопрамид ускоряет всасывание парацетамола. Под воздействием парацетамола период полувыведения хлорафеникола увеличивается в 5 раз. Одновременное применение парацетамола в высоких дозах повышает эффект антикоагулянтов. Миелотоксичные средства усиливают проявления гематотоксичности парацетамола.

Кофеин ускоряет всасывание эрготамина; снижает всасывание препаратов кальция; снижает эффект наркотических и снотворных средств, увеличивает выведение препаратов лития; ускоряет всасывание и усиливает действие сердечных гликозидов, повышает их токсичность. Одновременное применение кофеина с бета-адреноблокаторами может приводить к взаимному подавлению терапевтических эффектов, с бета-адреномиметиками к дополнительной стимуляции центральной нервной системы и другим токсическим эффектам. Кофеин может снижать клиренс теофиллина, и возможно других ксантинов, увеличивая возможность аддитивных фармакодинамических и других токсических эффектов. Ингибиторы моноаминоксидазы, фуразолидон, прокарабин, селегилин и большие дозы кофеина могут вызывать развитие опасных аритмий сердца или выраженное повышение артериального давления. Никотин увеличивает скорость выведения кофеина. Кофеин является антагонистом аденозина.

Пропифеназол может усиливать действие пероральных гиполипидемических средств, сульфаниламидных препаратов, антикоагулянтов, ulcerогенный эффект глюкокортикостероидов, снижает эффективность калийсберегающих диуретиков.

**Особые указания**

При длительном применении препарата (более 5 дней) необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени. Во время лечения следует отказаться от употребления алкоголясодержащих напитков (повышение риска желудочно-кишечного кровотечения). Чрезмерное употребление кофеинсодержащих продуктов (кофе, чай) на фоне лечения может вызвать симптомы передозировки. Прием препарата может затруднить установление диагноза при остром абдоминальном болевом синдроме.

**Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с техникой, требующей повышенной концентрации внимания**

В период приема препарата следует соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими видами деятельности, требующей повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

**Форма выпуска**

Таблетки.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной.

По 10, 20, 30, 40, 50, 60 или 100 таблеток в банки из полиэтилентерфталата для лекарственных средств или полипропиленовые для лекарственных средств, укупороенные крышками из полиэтилена высокого давления с контролем первого вскрытия, или крышками полипропиленовыми с системой «нажать-повернуть» или крышками из полиэтилена низкого давления с контролем первого вскрытия.

Одну банку или 1, 2, 3, 4, 5, 6 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по применению помещают в картонную упаковку (пачку).

**Условия хранения**

В оригинальной упаковке (контурная ячейковая упаковка или банка, вложенная в пачку) при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

**Срок годности**

3 года.

Не использовать после истечения срока годности.

**Условия отпуска**

Без рецепта.

**Производитель**

Держатель РУ: ООО «Атолл», Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6  
Производитель, ответственный за выпускающий контроль качества:

ООО «Озон», Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Все претензии потребителей следует направлять представителю держателя регистрационного удостоверения:

ООО «Озон»

445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.

Тел.: +79874599991, +79874599992

E-mail: ozon@ozon-pharm.ru