

этанолом, дефицит глутатиона, нарушение пищеварения, муковисцидоз, ВИЧ-инфекция, голодание, кахексия).

Симптомы:

Клиническая картина острой передозировки развивается в течение 24 ч после приема парацетамола.

Появляются желудочно-кишечные расстройства (тошнота, рвота, снижение аппетита, ощущение дискомфорта в брюшной полости и (или) абдоминальная боль), бледность кожных покровов. При одномоментном введении взрослым 7,5 г и более или детям более 140 мг/кг происходит цитолиз гепатоцитов с полным и необратимым некрозом печени, развитием печеночной недостаточности, метаболического ацидоза и энцефалопатии, которые могут привести к коме и летальному исходу. Через 12-48 ч после введения парацетамола отмечается повышение активности микросомальных ферментов печени, лактатдегидрогеназы, концентрации билирубина и снижение содержания протромбина.

Клинические симптомы повреждения печени проявляются через 2 суток после передозировки препарата и достигают максимума на 4—6 день.

При передозировке возможна интоксикация, особенно у пожилых пациентов, детей, пациентов с заболеваниями печени (вызванных хроническим алкоголизмом), у пациентов с нарушениями питания, а также у пациентов, принимающих индукторы микросомальных ферментов печени, при этом может развиться молниеносный гепатит, печеночная недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит, иногда с летальным исходом.

Лечение: Немедленная госпитализация.

Определение количественного содержания парацетамола в плазме крови перед началом лечения в как можно более ранние сроки после передозировки. Введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона — метионина и ацетилцистеина — наиболее эффективно в первые 8 часов. Необходимость в проведении дополнительных терапевтических мероприятий (дальнейшее введение метионина, внутривенное введение ацетилцистеина) определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его применения. Симптоматическое лечение.

Лабораторные исследования активности микросомальных ферментов печени следует проводить в начале лечения и затем — каждые 24 ч. В большинстве случаев активность микросомальных ферментов печени нормализуется в течение 1—2 недель. В очень тяжелых случаях может потребоваться пересадка печени.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами***Индукторы микросомальных ферментов печени***

Индукторы микросомальных ферментов печени или потенциально гепатотоксичные вещества (например, алкоголь, рифампицин, изониазид, снотворные и противозипептические средства, включая фенobarбитал, фенитоин, карбамазепин и другие) повышают токсичность парацетамола, могут привести к поражению печени даже при нетоксичных дозах парацетамола, поэтому следует контролировать функцию печени.

Фенитоин снижает эффективность парацетамола, следовательно, пациентам, принимающим фенитоин, следует избегать частого применения парацетамола, особенно в высоких дозах.

Урикозурические лекарственные средства

Парацетамол снижает эффективность урикозурических лекарственных средств.

Хлорамфеникол

Парацетамол может увеличивать риск повышенной концентрации хлорамфеникола.

Зидовудин

Парацетамол может увеличивать риск развития нейтропении, в связи с чем, следует контролировать гематологические показатели. Одновременное применение возможно лишь после консультации врача.

Пробенецид

Пробенецид уменьшает почти в два раза клиренс парацетамола, что требует снижения дозы парацетамола.

Непрямые антикоагулянты

Множократный прием парацетамола в течение более чем 4 дней увеличивает антикоагулянтный эффект. Следует проводить мониторинг международного нормализованного отношения (МНО) во время и после окончания одновременного применения парацетамола (особенно в высоких дозах и/или в течение продолжительного времени) и производных кумарина. Нерегулярный прием парацетамола не оказывает значимого влияния.

Пропантелин и другие препараты, замедляющие эвакуацию из желудка

Пропантелин и другие препараты, замедляющие эвакуацию из желудка, снижают скорость всасывания парацетамола, что может отсрочить или уменьшить наступление эффекта.

Метоклопрамид и домперидон

Метоклопрамид и домперидон увеличивает скорость всасывания парацетамола и, соответственно начало обезболивающего и жаропонижающего действия.

Юридический адрес: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Песочная, д. 11.
Адрес производства, в том числе для переписки и приёма претензий: 445351, Россия, Самарская обл., г. Жигулевск, ул. Гидростроителей, д. 6.
Тел./факс: (84862) 3-41-09
E-mail: ozon@ozon-pharm.ru
www.ozonpharm.ru

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПАРАЦЕТАМОЛ

Регистрационный номер: ЛП-004242

Торговое наименование препарата: Парацетамол

Международное непатентованное наименование (МНН): парацетамол

Лекарственная форма: таблетки

Состав на одну таблетку 200 мг:

Действующее вещество: парацетамол — 200,0 мг.
Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) — 14,8 мг, повидон-К25 — 14,4 мг, кроскармеллоза натрия — 9,6 мг, магния стеарат — 1,2 мг.

Состав на одну таблетку 500 мг:

Действующее вещество: парацетамол — 500,0 мг.
Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат (сахар молочный) — 37,0 мг, повидон-К25 — 36,0 мг, кроскармеллоза натрия — 24,0 мг, магния стеарат — 3,0 мг.

Описание: круглые плоскоцилиндрические таблетки белого или почти белого цвета с фаской и риской.

Фармакотерапевтическая группа: анальгетическое ненаркотическое средство.

Код АТХ: N02BE01

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

Парацетамол обладает анальгезирующим, жаропонижающим и крайне слабым противовоспалительным действием, что связано с его влиянием на центр терморегуляции в гипоталамусе и слабовыраженной способностью ингибировать синтез простагландинов в периферических тканях. Отсутствие блокирующего влияния на синтез простагландинов в периферических тканях обуславливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка ионов натрия и воды) и слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта.

Фармакокинетика

Абсорбция высокая, препарат быстро и практически полностью всасывается из желудочно-кишечного тракта. Связь с белками плазмы около 15%. Пик концентрации в плазме достигается через 30-60 минут. Проникает через гематоэнцефалический барьер. Менее 1% от принятой кормящей матерью дозы парацетамола проникает в грудное молоко. Терапевтическая эффективная концентрация парацетамола в плазме достигается при его назначении в дозе 10-15 мг/кг.

Метаболизируется в печени (90-95%): 80% вступает в реакции конъюгации с образованием неактивных глюкуронидов и сульфатов; 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 участвуют изоферменты CYP2E1, CYP1A2 и в меньшей степени изофермент CYP3A4. Период полувыведения — 1–4 ч. Выводится почками в виде метаболитов, преимущественно конъюгатов, менее 5% в неизменном виде. У пожилых пациентов снижается клиренс препарата и увеличивается период полувыведения.

Дополнительными путями метаболизма являются гидроксילирование до 3-гидроксипарацетамола и метоксилирование до 3-метоксипарацетамола, которые впоследствии конъюгируют с глюкуронидами или сульфатами.

У взрослых преобладает глюкуронирование, у новорожденных (в т.ч. недоношенных) и маленьких детей — сульфатирование. Конъюгированные метаболиты парацетамола (глюкурониды, сульфаты и конъюгаты с глутатионом) обладают низкой фармакологической (в т.ч. токсической) активностью.

Показания к применению

Жаропонижающее средство при острых респираторных заболеваниях и других инфекционно-воспалительных заболеваниях, сопровождающихся повышением температуры тела.

Обезболивающее средство при болевом синдроме слабой и умеренной выраженности: артралгия, миалгия, невралгия, мигрень, зубная и головная боль, альгодисменорея, боль при травмах и ожогах.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к парацетамолу или любому другому ингредиенту препарата;
- дефицит лактазы, непереносимость лактозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция;
- детский возраст до 3 лет (для данной лекарственной формы).

С осторожностью

Почечная и печеночная недостаточность, доброкачественные гипербилирубинемии (в т.ч. синдром Жильбера), дегидратация, гиповолемия, анорексия, булимия и кахексия (недостаточный запас глутатиона в печени), вирусный гепатит, алкогольное поражение печени, алкоголизм, беременность, период лактации, пожилой возраст.

В этих случаях перед приемом препарата следует проконсультироваться с врачом.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Парацетамол проникает через плацентарный барьер. В исследованиях на животных и у людей не было выявлено какого-либо риска при применении препарата в период беременности или отрицательного воздействия парацетамола на развитие эмбриона и плода. Парацетамол может использоваться во время беременности, однако целесообразно использовать минимальные эффективные дозы и максимально короткий курсом.

В небольших количествах проникает в грудное молоко. В исследованиях не было установлено отрицательного воздействия парацетамола на организм ребенка при грудном вскармливании.

Способ применения и дозы

Внутрь, с большим количеством жидкости, через 1-2 ч после приёма пищи (приём сразу после еды приводит к задержке наступления действия).

Взрослым и детям старше 12 лет (масса тела более 40 кг) разовая доза — 500 мг; максимальная разовая доза — 1 г. Кратность назначения — до 4 раз в сутки. Максимальная суточная доза — 4 г. У детей старше 12 лет рекомендуется соблюдать интервал между приемом препарата не менее 6 часов.

Детям средняя разовая доза зависит от массы тела ребенка и составляет 15 мг/кг 4 раза в сутки каждые 6 часов. Максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг/кг в сутки.

Максимальная суточная доза для детей старше 3-6 лет — 1000 мг, 6-9 лет — 1500 мг, 9-12 лет — 2000 мг. Кратность назначения — 3-4 раза в сутки.

Максимальная продолжительность лечения без консультации врача — 3 дня (при приёме в качестве жаропонижающего лекарственного средства) и 5 дней (в качестве анальгезирующего).

У пациентов с хроническими или декомпенсированными заболеваниями печени, с печеночной недостаточностью, хроническим алкоголизмом, у истощенных пациентов и при обезвоживании суточная доза не должна превышать 3 г. У пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина <10 мл/мин), рекомендуется применять препарат с интервалом не менее 8 часов.

Побочное действие

Частота нежелательных лекарственных реакций классифицирована в соответствии с рекомендациями Всемирной организации здравоохранения. Системно-органные классы по MedDRA
Часто: ≥1/100 до <1/10
Нечасто: ≥1/1000 до <1/100
Редко: ≥1/10 000 до <1/10000
Очень редко: <1/10000.
Частота неизвестна: невозможно оценить на основании имеющихся данных.

Со стороны органов пищеварения: редко — боль в животе, тошнота, рвота.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: редко — повышение активности печеночных ферментов; частота неизвестна — печеночная недостаточность, гепатиты, некроз печени.

Со стороны органов кроветворения: очень редко — анемия, тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз; частота неизвестна — сульфогемоглобинемия, метгемоглобинемия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко — снижение или увеличение протромбинового индекса, снижение артериального давления.

Со стороны иммунной системы: редко — аллергические реакции (в т.ч. кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек); очень редко — острый генерализованный экзантематозный пустилез, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), бронхоспазм (анальгетическая бронхиальная астма) у предрасположенных лиц.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: частота неизвестна — головокружение, психомоторное возбуждение, дезориентация (при приеме высоких доз).

Со стороны кожных покровов: частота неизвестна — экзантема.

Прочие: частота неизвестна — увеличение креатинина (в основном вторично, по отношению к гепаторенальному синдрому).

При появлении побочных реакций прекратите прием препарата и обратитесь к врачу.

Передозировка

Повреждение печени у взрослых возможно при приеме 10 г или более парацетамола, прием внутрь 5 г или более парацетамола может привести к повреждению печени при наличии факторов риска (длительное лечение карбамазепином, фенobarбиталом, фенитоином, примидоном, рифампицином, зверобоем продырявленным или другими препаратами, которые являются индукторами микросомальных ферментов печени; злоупотребление

