

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

МИНЗДРАВ РОССИИ

ЛП 002211 - 30083

Внимательно прочтайте эту инструкцию перед тем, как начать прием/использование этого лекарства.

Это лекарство отпускается без рецепта. Для достижения оптимальных результатов его следует использовать, строго выполняя все рекомендации, изложенные в инструкции.

- Сохраните инструкцию, она может потребоваться вновь.
- Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу.
- Если Ваше состояние ухудшилось или улучшение не наступило через 3–5 дней, обратитесь к врачу.

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПАРАЦЕТАМОЛ

Регистрационный номер:

Торговое название препарата: Парацетамол

Международное непатентованное название: парацетамол

Лекарственная форма

Суппозитории ректальные

Состав

Один суппозиторий содержит:

Активное вещество: парацетамол — 250 мг или 500 мг.

Вспомогательные вещества: витепсол Н-15 — 500 мг или 1000 мг, витепсол В-35 — 500 мг или 1000 мг соответственно.

Описание

Суппозитории белого или белого с кремоватым или желтоватым оттенком цвета, торпедообразной формы.

Фармакотерапевтическая группа

Аналгезирующее ненаркотическое средство.

Код АТХ

N02BE01

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Парацетамол обладает обезболивающим, жаропонижающим и слабым противовоспалительным действием.

Длительность обезболивающего действия — 4–6 ч, жаропонижающего не менее 6 ч.

Точный механизм обезболивающего и жаропонижающего действия парацетамола не установлен. По-видимому, он включает в себя центральный и периферический компоненты.

Известно, что парацетамол блокирует циклооксигеназу I и II типа преимущественно в центральной нервной системе, воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на циклооксигеназу, что объясняет практически полное отсутствие значимого противовоспалительного эффекта. Отсутствие влияния на синтез простагландинов в периферических тканях обуславливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды) и слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта.

Фармакокинетика

Всасывание. Абсорбция при ректальном введении происходит медленнее, чем при приеме парацетамола внутрь. Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 2–3 ч.

Распределение. Объем распределения у взрослых составляет 1 л/кг. Парацетамол слабо связывается с белками плазмы крови. Проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизм. У взрослых парацетамол метаболизируется в основном в печени с образованием глукuronидов и сульфатов. Небольшая часть (4 %) парацетамола метаболизируется цитохромом P450 с образованием активного промежуточного метаболита (*N*-ацетилбензодихинонимина), который в нормальных условиях быстро обезвреживается восстановленным глутатионом и выводится с мочой после связывания с цистеином и меркаптуровой кислотой. Однако при массивной передозировке количество этого токсичного метаболита возрастает. Период полувыведения у взрослых составляет 2,7 ч, у детей — 1,5–2 ч, общий клиренс — 18 л/ч.

Выведение. Парацетамол выводится, главным образом, с мочой; 90 % принятой дозы выводится почками в течение 24 ч, в основном в виде глукuronида (60–80 %) и сульфата (20–30 %). Менее 5 % выводится в неизмененном виде. При тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина < 10–30 мл/мин) выведение парацетамола несколько замедляется, а период полувыведения составляет 2–5,3 ч.

Скорость выведения глюкуронида и сульфата у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью в 3 раза ниже, чем у здоровых добровольцев.

Фармакокинетика парацетамола у пожилых пациентов не изменяется; у детей отличается только период полувыведения из плазмы крови, который несколько короче по сравнению со взрослыми (1,5–2 ч). Кроме того, у детей до 10 лет парацетамол в большей степени выводится в виде сульфата, а не глюкуронида, что характерно для взрослых пациентов. При этом общая экскреция парацетамола и его метаболитов у пациентов всех возрастных групп одинакова.

Показания к применению

- в качестве жаропонижающего средства при лихорадке;
- в качестве болеутоляющего средства при боли легкой и средней интенсивности.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к парацетамолу или другим компонентам препарата;
- тяжелые нарушения функции печени;
- детский возраст до 4 лет;
- воспаление прямой кишки, кровотечения из прямой кишки.

С осторожностью

Тяжелая почечная недостаточность (клиренс креатинина < 30 мл/мин), доброкачественные гипербилирубинемии (в том числе синдром Жильбера, вирусный гепатит, алкогольное поражение печени), хронический алкоголизм, хроническое недоедание, анорексия, булиния, кахексия, гиповолемия, обезвоживание, пожилой возраст, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

Способ применения и дозы

Ректально (в прямую кишку). После самопроизвольного опорожнения кишечника или очистительной клизмы суппозиторий освобождают от контурной ячейковой упаковки и вводят в прямую кишку.

Продолжительность курса лечения парацетамолом без консультации врача — не более 3 дней в качестве жаропонижающего средства, не более 5 дней в качестве обезболивающего средства.

Режим дозирования у взрослых и детей 10 лет и старше

По одному суппозиторию с дозировкой 500 мг по 2–4 раза в сутки; максимальная разовая доза — 1 г; максимальная суточная доза — 4 г.

Режим дозирования у детей младше 10 лет

Доза парацетамола рассчитывается в зависимости от возраста и массы тела, в соответствии с таблицей. Рекомендуемая разовая доза составляет 15 мг/кг массы тела каждые 6 ч. Максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 60 мг/кг массы тела ребенка.

Вследствие риска местной токсичности (на прямую кишку) рекомендуется не вводить суппозитории чаще 4 раз в сутки. Необходимо стремиться к минимальной продолжительности лечения.

Возраст	Масса тела	Разовая доза
4–9 лет	15–24 кг	1 суппозиторий по 250 мг

Побочное действие

Если любые из указанных в инструкции нежелательных явлений усугубляются, или Вы заметили любые другие нежелательные явления, не указанные в инструкции, *сообщите об этом врачу*.

Частота нежелательных реакций приведена в соответствии со следующей шкалой: очень часто (> 10 %); часто (> 1 % и < 10 %); нечасто (> 0,1 % и < 1 %); редко (> 0,01 % и < 0,1 %); очень редко (< 0,01 %).

Со стороны кожных покровов: очень редко — покраснение кожи, зуд, сыпь на коже и слизистых (обычно эритематозная или уртикарная).

Со стороны печени и желчевыводящих путей: редко — повышение активности «печеночных» ферментов, как правило, без развития желтухи.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: редко — снижение артериального давления; очень редко — тахикардия.

Со стороны органов кроветворения: очень редко — тромбоцитопения.

Общего характера: редко — недомогание.

Указанные ниже нежелательные реакции также отмечались при пострегистрационном применении препарата, однако их частота не установлена:

Аллергические реакции: реакции гиперчувствительности, анафилактический шок, анафилаксия, отек Квинке.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: молниеносный гепатит, некроз печени, печеночная недостаточность.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота.

Передозировка

При передозировке (превышение дозы 1 г в сутки у детей 4–9 лет, превышение дозы 3 г в сутки у детей 10–18 лет, превышение дозы 4 г в сутки у взрослых) необходимо немедленно обратиться за медицинской помощью.

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 которых могут развиваться молниеносный гепатит, печеночная недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит, в указанных выше случаях — иногда с летальным исходом.

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

Симптомы: 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 полными 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 «печеночных» трансаминаз, 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.

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 — в течение 10 ч после передозировки.
- Необходимость в проведении дополнительных терапевтических мероприятий (дальнейшее введение метионина, в/в введение ацетилцистеина) определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его введения.
- Симптоматическое лечение.
- Печеночные тесты следует проводить в начале лечения и затем — каждые 24 ч.

В большинстве случаев активность печеночных трансминаз нормализуется в течение 1–2 недель. В очень тяжелых случаях может потребоваться пересадка печени.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Фенитоин снижает активность парацетамола и увеличивает риск развития гепатотоксичности. Пациентам, принимающим фенитоин, следует избегать применения парацетамола в высоких дозах.

Пробенецид почти в 2 раза снижает клиренс парацетамола, ингибируя процесс его конъюгации с глюкуроновой кислотой. При одновременном назначении следует рассмотреть вопрос о снижении дозы парацетамола.

Индукторы микросомальных ферментов печени (например, этанол, барбитураты, изониазид, рифампицин, антикоагулянты, зидовудин, амоксициллин + клавулановая кислота) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов, что обуславливает возможность развития тяжелых интоксикаций при небольших передозировках.

Этанол способствует развитию острого панкреатита.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени (в том числе циметидин) снижают риск гепатотоксического действия.

Длительное применение барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

Длительное одновременное применение парацетамола и других нестероидных противовоспалительных препаратов (салициламид) повышает риск развития анальгетической нефропатии и почечного папиллярного некроза, наступления терминальной стадии почечной недостаточности.

Одновременное длительное применение парацетамола в высоких дозах и салицилатов повышает риск развития рака почки или мочевого пузыря. Салициламид увеличивает период полувыведения парацетамола.

Особые указания

Риск развития повреждений печени возрастает при превышении рекомендованных доз (в том числе при одновременном применении препарата Парацетамол и других препаратов, содержащих парацетамол), а также у пациентов с хроническим алкоголизмом.

Не следует применять препарат у пациентов с диареей.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и работу с механизмами

Сведения о влиянии на способность к управлению транспортными средствами и работу с механизмами отсутствуют.

Форма выпуска

Суппозитории ректальные по 250 мг и 500 мг.

По 5 или 6 суппозиториев (для дозировки 250 мг), или по 5 суппозиториев (для дозировки 500 мг) в контурную ячейковую упаковку.

По 2 контурные ячейковые упаковки по 5 суппозиториев или 1 контурную ячейковую упаковку по 6 суппозиториев вместе с инструкцией по медицинскому применению препарата помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить в сухом месте при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Без рецепта.

При уничтожении неиспользованных упаковок препарата специальных мер предосторожностей не требуется.

Производитель/организация, принимающая претензии потребителей:

ЗАО «Фармпроект», Россия,

192236, г. Санкт-Петербург, ул. Софийская, д. 14, лит. А.

Тел./факс: +7 (812) 331 93 10

Генеральный директор

ЗАО «Фармпроект»,

кандидат фарм. наук



С.С.Саакян