

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ПАРАЦЕТАМОЛ

Регистрационный номер: ЛС-001364

Торговое наименование: Парацетамол

Международное непатентованное наименование: парацетамол

Химическое наименование: N-(4-гидроксифенил) ацетамид

Состав на одну таблетку

Действующее вещество: парацетамол – 500,0 мг;

вспомогательные вещества: крахмал картофельный – 24,3 мг, повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский) – 10,2 мг, стеариновая кислота – 5,3 мг, кроскармеллоза натрия (натрия кроскармеллоза) – 5,2 мг, тальк – 5,0 мг.

Описание: таблетки белого или белого с кремоватым оттенком цвета, плоскоцилиндрические с риской.

Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее ненаркотическое средство.

Код АТХ: [N02BE01]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Парацетамол обладает жаропонижающим и болеутоляющим действием. Ненаркотический анальгетик, блокирует циклооксигеназу (ЦОГ) I и II преимущественно в центральной нервной системе, воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на ЦОГ, что объясняет практически полное отсутствие противовоспалительного эффекта. Поскольку парацетамол обладает чрезвычайно малым влиянием на синтез простагландинов в периферических тканях, он не

изменяет водно-электролитный обмен и не вызывает повреждения слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта. Таким образом, парацетамол особенно подходит пациентам с заболеваниями желудочно-кишечного тракта в анамнезе (как, например, у пациентов с желудочно-кишечным кровотечением в анамнезе или у пациентов пожилого возраста) или пациентам, принимающим сопутствующие лекарственные препараты, когда ингибирование периферических простагландинов может быть нежелательным.

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 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 гидроксилирование 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 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;

-тяжелые нарушения функции печени или почек;

-детский возраст до 6 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), дефицит фермента глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, вирусный гепатит, алкогольное поражение печени, алкоголизм, беременность, период грудного вскармливания, 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 коротким курсом. В небольших количествах проникает в грудное молоко. В исследованиях не было установлено отрицательного воздействия

парацетамола на организм ребенка при грудном вскармливании, тем не менее необходимо применять с осторожностью.

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). Взрослые (включая пожилых) и дети старше 12 лет (масса тела более 40 кг) 500 мг - 1 г до 4 раз в сутки, если необходимо. Максимальная разовая доза - 1 г. Максимальная суточная доза - 4 г. Интервал между приемами - не менее 4 часов. Дети от 6 до 12 лет. Дозу рассчитывают, исходя из массы тела ребенка: максимальная разовая доза - 15 мг/кг массы тела 4 раза в сутки, максимальная суточная доза - 60 мг/кг массы тела. Интервал между приемами - не менее 4 часов. Детям в возрасте 6-9 лет (вес до 30 кг): разовая доза - 250 мг (1/2 таблетки); максимальная суточная доза - 1 г; в возрасте 9-12 лет (вес 30-40 кг): разовая доза - 250- 500 мг (1/2 таблетки - 1 таблетка), максимальная суточная доза - 2 г (4 таблетки).

У взрослых парацетамол не рекомендуется применять более 5 дней в качестве обезболивающего средства и более 3 дней в качестве жаропонижающего средства без назначения и наблюдения врача.

У детей парацетамол не рекомендуется применять более 3 дней без назначения и наблюдения врача. Не превышать указанную дозу.

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.

Не превышайте указанную дозу. Следует принимать наименьшую дозу, необходимую для достижения эффекта. Интервал между приемами должен составлять не менее 4 ч.

Препарат не должен приниматься одновременно с другими парацетамол-содержащими препаратами. Увеличение суточной дозы парацетамола или продолжительности лечения возможны только под наблюдением врача.

Побочное действие

В рекомендованных дозах парацетамол обычно хорошо переносится. 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 < 1/1000

Очень редко: < 1/10000.

Частота неизвестна: невозможно оценить на основании имеющихся данных.

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

часто: послеоперационные кровотечения.

очень редко: анемия, тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения, агранулоцитоз; гемолитическая анемия частота неизвестна: панцитопения, сульфогемоглобинемия, метгемоглобинемия.

Нарушения со стороны иммунной системы

редко: аллергические реакции (в т.ч. кожная сыпь, зуд, крапивница, ангионевротический отек).

очень редко: острый генерализованный экзантематозный пустулез синдром Стивенса- Джонсона, токсический эпидермальный некролиз (синдром Лайелла), анафилаксия.

Нарушения со стороны психики:

часто: бессонница, тревога.

Нарушения со стороны нервной системы

часто: головная боль частота неизвестна: дистония, головокружение, психомоторное возбуждение, дезориентация (при приеме высоких доз).

Нарушения со стороны органа зрения

часто: периорбитальный отек.

Нарушения со стороны сердца

часто: тахикардия, боль в груди.

Нарушения со стороны сосудов

часто: периферические отеки, гипертензия редко: снижение артериального давления.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

часто: диспноэ, патологическое дыхание, отек легких, гипоксия, плевральный выпот, хрипы, одышка, кашель.

очень редко: бронхоспазм (у пациентов с гиперчувствительностью к ацетилсалициловой кислоте и другим нестероидным противовоспалительным препаратам).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

часто: диарея, запор, диспепсия, вздутие живота.

редко: боль в животе, тошнота, рвота.

частота неизвестна: сухость во рту.

Нарушения со стороны печени и желчевыводящих путей

редко: повышение активности печеночных ферментов.

частота неизвестна: печеночная недостаточность, гепатиты, некроз печени.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

частота неизвестна: экзантема.

Нарушения со стороны костно-мышечной и соединительной ткани

часто: мышечные спазмы, тризм.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей

часто: олигурия.

частота неизвестна: почечная колика, неспецифическая бактериурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз.

Общие расстройства и нарушения в месте введения

часто: пирексия, чувство усталости

редко: общее недомогание/слабость.

Влияние на результаты лабораторных и инструментальных исследований

часто: гипокалиемия, гипергликемия.

редко: снижение или увеличение протромбинового индекса.

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

При возникновении любого из перечисленных побочных эффектов, прекратите прием парацетамола и немедленно 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, фенобарбиталом, фенитоином, примидоном, рифампицином, зверобоем продырявленным или другими препаратами, которые являются индукторами микросомальных ферментов печени; злоупотребление 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 развиваться молниеносный гепатит, печеночная недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит, иногда с летальным исходом.

Лечение: Немедленная госпитализация.

При подозрении на передозировку, даже при отсутствии выраженных первых симптомов, необходимо прекратить применение парацетамола и немедленно обратиться за врачебной помощью. Следует определить уровень парацетамола в плазме крови, но не ранее чем через 4 часа после передозировки (более ранние результаты недостоверны).

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. В течение 1 часа после передозировки рекомендуется промывание желудка и прием энтеросорбентов (активированный уголь и т.п.). В большинстве случаев активность микросомальных ферментов печени нормализуется в течение 1-2 недель. В очень тяжелых случаях может потребоваться пересадка печени. Введение ацетилцистеина в течение 24 часов после передозировки. Максимальное защитное действие обеспечивается в течение первых 8 часов после передозировки, со временем эффективность антидота резко падает. При необходимости вводят ацетилцистеин внутривенно. При отсутствии рвоты до поступления пациента в стационар возможно применение метионина. 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 приема. Лечение пациентов с серьезным нарушением функции печени через 24 часа после приема парацетамола должно проводиться совместно со специалистами токсикологического центра или специализированного отделения заболеваний печени.

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 средствами

Если Вы или ребенок уже получаете другие лекарственные препараты, до начала приема парацетамола необходимо обратиться за консультацией к врачу.

Индукторы микросомальных ферментов печени

Индукторы микросомальных ферментов печени или потенциально гепатотоксичные вещества (например, алкоголь, рифампицин, изониазид, снотворные и противосудорожные средства, включая фенобарбитал, 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

Множественный 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.

Барбитураты

Длительное применение барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

Этанол

Этанол способствует развитию острого панкреатита.

Нестероидные противовоспалительные препараты (НПВП)

Длительное совместное использование парацетамола и других НПВП повышает риск развития "анальгетической" нефропатии и почечного папиллярного некроза, наступления терминальной стадии почечной недостаточности.

Салицилаты

Одновременное длительное назначение парацетамола в высоких дозах и салицилатов повышает риск развития рака почки или мочевого пузыря.

Дифлунисал

Дифлунисал повышает плазменную концентрацию парацетамола на 50 % - риск развития гепатотоксичности.

Миелотоксичные препараты

Миелотоксичные препараты усиливают проявления гематотоксичности препарата.

Особые указания

При продолжающемся лихорадочном синдроме на фоне применения парацетамола более 3 дней и болевом синдроме более 5 дней, требуется консультация врача. Пациенты с дефицитом глутатиона подвержены передозировке, необходимо соблюдать меры предосторожности. Зарегистрированы случаи развития печеночной недостаточности и нарушений функции печени у пациентов с низким уровнем глутатиона, в частности, у крайне истощенных пациентов, страдающих анорексией, хроническим алкоголизмом или у пациентов с низким индексом массы тела.

Риск развития повреждений печени возрастает у пациентов с поражением печени при алкоголизме.

Прием парацетамола оказывает влияние на показатели лабораторных исследований при количественном определении глюкозы и мочевой кислоты в плазме.

Во время длительного лечения необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Парацетамол может вызывать серьезные кожные реакции, такие как синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, острый генерализованный экзантематозный пустулез, которые могут быть летальными. При первом проявлении сыпи или других реакций гиперчувствительности, применение препарата должно быть прекращено, следует немедленно обратиться к врачу. При обнаружении у пациента острого вирусного гепатита необходимо отменить прием препарата.

Дефицит глутатиона вследствие расстройства пищевого поведения, цистического фиброза, ВИЧ-инфекции, голодания, истощения обуславливает возможность развития тяжелого поражения печени при небольших передозировках парацетамола (5 г и более).

Во избежание токсического поражения печени парацетамол не следует сочетать с приемом алкогольных напитков, а также принимать лицам, склонным к хроническому потреблению алкоголя. Не принимать одновременно с другими препаратами, содержащими парацетамол.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и занятиями и механизмами

При применении Парацетамола в рекомендуемом диапазоне доз влияние на способность к управлению транспортными средствами занятие другими, потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций не установлено.

Форма выпуска

Таблетки 500 мг.

По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку.

1, 2, 3, 4 или 5 контурных ячейковых упаковок с инструкцией по медицинскому применению в пачку из картона.

Допускается контурные ячейковые упаковки с равным количеством инструкций по медицинскому применению помещать в групповую упаковку.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии потребителей

ОАО "Фармстандарт-Лексредства", Россия,
305022, Курская обл., г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18,
тел/факс: (4712) 34-03-13, www.pharmstd.ru

Производитель

ОАО "Фармстандарт-Лексредства", Россия,
Курская обл., г. Курск, ул. 2-я Агрегатная, 1а/18