

Общая характеристика лекарственного средства.

1. Название лекарства Парацетамол

✓✓

2. Количественный и качественный состав

Активное вещество: Парацетамол - 500 мг;

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный - 25,45 мг; кислота стеариновая - 4,35 мг; патока крахмальная - 17,50 мг; желатин - 2,70 мг.

3. Лекарственная форма Таблетки

4. Клинические характеристики

4.1. Терапевтические показания

Умеренно или слабо выраженный болевой синдром (головная, зубная, мигренозная боль, невралгия, миалгия).

Повышенная температура тела при простудных и других инфекционно-воспалительных заболеваниях.

4.2. Способы применения и дозы

Применяют внутрь с большим количеством жидкости по 0,5 г-1 г 2-3 раза в сутки с интервалами не менее 4 часов. Максимальная разовая доза для взрослых и детей старше 15 лет составляет 1 г, суточная - 4 г. У пациентов с нарушениями функции печени или почек, с синдромом Жильбера и у пожилых больных интервал между приемами препарата должен составлять не менее 8 часов и суточная доза должна быть уменьшена.

Детям назначают 10-15 мг/кг массы тела 3-4 раза в сутки (не более 3-х дней).

Продолжительность приема не более 5 дней при назначении в качестве обезболивающего средства и 3-х дней в качестве жаропонижающего средства.

4.3. Противопоказания

- Повышенная чувствительность к парацетамолу.

- Детский возраст до 8 лет.

С осторожностью – почечная и печеночная недостаточность, доброкачественные гипербилирубинемии (в т.ч. синдром Жильбера, вирусный гепатит, алкогольное поражение печени), алкоголизм, беременность, период лактации, пожилой возраст, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

4.4. Специальные предупреждения и особые меры предосторожности

С осторожностью и под контролем врача следует применять препарат больным с нарушенной функцией печени или почек, одновременно с другими противовоспалительными и обезболивающими средствами, а также с антикоагулянтами и препаратами, влияющими на центральную нервную систему. При приеме метоклопрамида, домперидона или холестирамина также необходимо проконсультироваться с врачом.

Искажает показатели лабораторных исследований при количественном определении содержания мочевой кислоты в плазме.

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

Риск развития повреждений печени возрастает у больных с алкогольным гепатозом.

При продолжительном применении препарата необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

4.5. Взаимодействия

Стимуляторы микросомального окисления в печени (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов, что обуславливает возможность развития тяжелых интоксикаций при небольших передозировках. Этanol способствует развитию острого панкреатита. Ингибиторы микросомального окисления (в т.ч. циметидин) снижают риск гепатотоксического действия.

Снижает эффективность урикозурических препаратов.

4.6. Применение во время беременности и кормления грудью

Применять препарат при беременности и период грудного вскармливания с осторожностью.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

Не установлено.

4.8. Побочные действия

-Тошнота, рвота, боль в эпигастрии, аллергические реакции (кожная сыпь, зуд, крапивница, отек Квинке).

-Редко - анемия, лейкопения, тромбоцитопения, агранулоцитоз.

-При длительном применении в больших дозах – гепатотокическое действие, гемолитическая анемия, апластическая анемия, метгемоглобинемия, панцитопения.

-Нефротоксичность (почечная колика, пиурия, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз).

4.9. Передозировка

Симптомы: бледность кожных покровов, анорексия, тошнота, рвота: гепатонекроз (выраженность некроза прямо зависит от степени передозировки). Токсическое действие препарата у взрослых возможно после приема свыше 10-15 г парацетамола: повышение активности «печеночных» трансаминаз, увеличение протромбинового времени, развернутая клиническая картина поражения печени проявляется через 1-6 дней. Редко нарушение функции печени развивается молниеносно и может осложниться почечной недостаточностью (тубулярный некроз).

Лечение: прекратить прием препарата, сделать промывание желудка, принять активированный уголь. Дальнейшие терапевтические мероприятия следует проводить в условиях лечебного учреждения: введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона-метионина через 8-9 ч. после передозировки и N-ацетилцистеина - через 12 ч. Необходимость в проведении дополнительных терапевтических мероприятий

(дальнейшее введение метионина, в/в введение N-ацетилцистеина) определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его приема.

5.Фармакологические свойства

5.1. Фармакодинамика

Парацетамол блокирует циклооксигеназу I и II только в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции (в воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на циклооксигеназу), что объясняет практически полное отсутствие противовоспалительного эффекта. Отсутствие влияния на синтез простагландинов в периферических тканях обусловливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды) и слизистую ЖКТ. Возможность образования метгемоглобина – маловероятна.

5.2. Фармакокинетика

Абсорбция - высокая, Т_{Cmax} - 0.5-2 ч; С_{max} - 5-20 мкг/мл. Связь с белками плазмы - 15%. Проникает через ГЭБ. Менее 1% от принятой кормящей матерью дозы парацетамола проникает в грудное молоко.

Метаболизируется в печени по трем основным путям: конъюгация с глюкуронидами, конъюгация с сульфатами, окисление микросомальными ферментами печени. В последнем случае образуются токсичные промежуточные метabolиты, которые впоследствии конъюгируют с глутатионом, а затем с цистеином и меркаптуровой кислотой. Основными изоферментами цитохрома P450 для данного пути метаболизма являются изофермент CYP2E1 (преимущественно), CYP1A2 и CYP3A4 (второстепенная роль). При дефиците глутатиона эти метabolиты могут вызывать повреждение и некроз гепатоцитов.

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 метabolиты парацетамола (глюкурониды, сульфаты и конъюгаты с глутатионом) обладают низкой фармакологической (в т.ч. токсической) активностью.

T_{1/2} - 1-4 ч. Выводится почками в виде метabolитов, преимущественно конъюгатов, только 3% в неизмененном виде. У пожилых пациентов снижается клиренс препарата и увеличивается T_{1/2}.

5.3. Предклинические данные по безопасности

Отсутствуют.

6.Фармацевтические характеристики

6.1.Вспомогательные вещества

Крахмал картофельный; кислота стеариновая; патока крахмальная; желатин.

6.2. Несовместимость

Совместим.

6.3.Срок хранения

3 года.

6.4.Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре от 10°C до 25°C.

6.5.Тип и вместимость упаковки

По 10 таблеток в контурную ячейковую или безъячейковую упаковку.

6.6. Особые инструкции по применению и обращению с препаратом

Указано в инструкции по медицинскому применению препарата.

7.Производитель (название, страна, адрес)

ОАО «Ирбитский химико-фармацевтический завод»

623856, Россия, Свердловская обл., г. Ирбит, ул. К. Маркса, 124

8.Владелец торговой лицензии (название, страна, адрес)

ОАО «Ирбитский химико-фармацевтический завод»

623856, Россия, Свердловская обл., г. Ирбит, ул. Кирова, 172

9.Дата последнего пересмотра документации

18.11.2008