

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Эффералган, 80 мг; 150 мг; 300 мг суппозитории ректальные

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

2.1 Общее описание

Парацетамол

2.2 Качественный и количественный состав

Один суппозиторий содержит

активное вещество - парацетамол 80 мг, 150 мг или 300 мг соответственно
Вспомогательные вещества с известным действием: один суппозиторий содержит соевый лецитин (входит в состав твердого жира).

Полный список вспомогательных веществ см. в пункте 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Лекарственная форма.

Суппозитории белого цвета с гладкой и блестящей поверхностью.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

ЛП показан к применению у детей с 3 месяцев до 10 лет.

- симптоматическое лечение боли от легкой до умеренной интенсивности и/или лихорадочных состояний.

4.2 Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Рекомендуемая суточная доза парацетамола зависит от массы тела ребенка из расчета 60 мг/кг/день, разделенных на 4 приема.

Разовая доза – 15 мг/кг каждые 6 часов, приемы должны быть с равными интервалами, в том числе и ночью.

У детей следует соблюдать дозирование в соответствии с массой тела ребенка. Возраст и соответствующая ему масса тела приводятся ориентировочно.

Детям с массой тела от 4 до 10 кг (от 3 до 6 мес) вводят по 1 свече (80 мг) не более 4 раз в сутки через каждые 6 часов, не превышая 4 суппозитория в сутки.

Детям с массой тела от 10 до 14 кг (от 6-ти месяцев до 4 лет) вводят по 1 свече (150 мг) не более 4 раз в сутки через каждые 6 часов, не превышая 4 суппозитория в сутки.

Детям с массой тела от 14 до 24 кг (с 4-х лет до 10-ти лет) вводят по 1 свече (300 мг) не более 4 раз в сутки через каждые 6 часов, не превышая 4 суппозитория в сутки.

В случае диареи назначение суппозитория не рекомендуется.

Не следует применять более 4 свечей в сутки.

В случае тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин) интервал между двумя приемами должен быть как минимум 8 часов.

Из-за риска местной токсичности ректальное введение парацетамола должно быть как можно короче.

Для детей максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 80 мг/кг/день.

Особые группы пациентов

Пациенты с печеночной недостаточностью

У пациентов с активным или компенсированным хроническим заболеванием печени, особенно сопровождающимся гепатоцеллюлярной недостаточностью, у пациентов с хроническим алкоголизмом, хронической недостаточностью питания (недостаточным запасом глутатиона в печени), синдромом Жильбера (негемолитической семейной желтухой) и обезвоживанием доза парацетамола не должна превышать 60 мг/кг/сут.

Пациенты с почечной недостаточностью

При наличии почечной недостаточности, помимо обращения к врачу, рекомендуется уменьшить дозу и увеличить временной интервал между двумя применениями, см. таблицу ниже:

Клиренс креатинина	Интервал между применением
>10 мл/мин	6 часов
<10 мл/мин	8 часов

Суммарная доза парацетамола не должна превышать 60 мг/кг/день.

Особые клинические ситуации

При наличии следующих заболеваний необходимо назначать минимальную эффективную суточную дозу, не превышающую 60 мг/кг/сут:

- гепатоцеллюлярная недостаточность легкой и умеренной степени тяжести;
- синдром Жильбера (негемолитическая семейная желтуха);
- хронический алкоголизм;
- хроническая недостаточность питания;
- обезвоживание.

Способ применения

Ректально.

4.3 Противопоказания

- гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;

- гепатоцеллюлярная недостаточность или декомпенсированное заболевание печени в активной форме;
- недавние проктит, анусит или ректальное кровотечение в анамнезе;
- детский возраст до 3 месяцев.

В состав данного лекарственного препарата входит соевый лецитин, поэтому он противопоказан при наличии аллергии на арахис или сою.

Особые указания и меры предосторожности при применении

Во избежание риска передозировки следует проверить отсутствие парацетамола в составе других лекарственных средств. Не превышайте максимальные рекомендованные дозы.

Максимальные рекомендованные дозы:

- у детей с массой тела до 40 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 80 мг/кг/день;
- у детей с массой тела от 41 до 50 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 3 г/день;
- у взрослых и детей с массой тела более 50 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 4 г/день.

Для детей, получающих 60 мг/кг/день парацетамола, комбинация с другим жаропонижающим средством оправдана только в случае неэффективности.

В случае диареи назначение суппозиторий не рекомендуется.

При использовании суппозиторий существует риск местной токсичности, особенно при частом и длительном применении.

Парацетамол может вызывать серьезные кожные реакции, такие как острый генерализованный экзантематозный пустулез, синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, которые могут быть летальными. При первых признаках этих серьезных кожных реакций, а также при проявлении сыпи или других реакций повышенной чувствительности использование препарата следует прекратить.

Меры предосторожности при применении

Парацетамол следует назначать с осторожностью при наличии следующих состояний:

- гепатоцеллюлярная недостаточность легкой и умеренной степени тяжести;
- почечная недостаточность;
- синдром Жильбера (негемолитическая семейная желтуха);
- дефицит фермента глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы (который может вызвать гемолитическую анемию);
- хронический алкоголизм, злоупотребление алкоголем (3 или более порции алкоголя каждый день);
- анорексия, булимия или кахексия;
- хроническая недостаточность питания (недостаточный запас глутатиона в печени);
- обезвоживание, гиповолемия.

В случае выявления острого вирусного гепатита лечение необходимо прекратить.

4.5 Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Пероральные антикоагулянты

Парацетамол усиливает действие пероральных антикоагулянтов и увеличивает риск возникновения кровотечения в случае приема в максимальных дозах (4 г/день) в течение не менее 4 дней, поэтому необходим регулярный контроль протромбинового индекса.

При необходимости следует корректировать режим дозирования антикоагулянтов во время применения парацетамола и после его отмены.

Флуклоксациллин

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении парацетамола и флуклоксациллина в связи с повышением риска развития метаболического ацидоза с высокой анионной разницей, особенно у пациентов с фактором риска дефицита глутатиона, включая пациентов с тяжелой почечной недостаточностью, сепсисом, нарушением питания и хроническим алкоголизмом. Рекомендован тщательный мониторинг с целью выявления признаков метаболического ацидоза с высокой анионной разницей, включая определение 5-оксопролина в моче.

Влияние на результаты лабораторных тестов

Прием парацетамола может исказить результаты лабораторных анализов при определении содержания глюкозы в крови методом, основанным на реакции глюкозооксидазы-пероксидазы в случае аномально повышенной концентрации.

Прием парацетамола может исказить результаты лабораторных анализов при определении концентрации мочевины в крови методом с использованием фосфорновольфрамной кислоты.

4.6 Фертильность, беременность и лактация.

Беременность

Многочисленные исследования не подтвердили способность парацетамола вызывать пороки развития, ни фето/неонатальной токсичности. Эпидемиологические исследования развития нервной системы у детей, подвергшихся внутриутробному воздействию парацетамола, показали неубедительные результаты. Допускается прием парацетамола во время беременности, исходя из клинической необходимости, однако его следует применять в минимальной эффективной дозе, в кратчайшие сроки и с наименьшей возможной частотой.

Кормление грудью

После перорального приема парацетамол выделяется с грудным молоком в небольших количествах. Сообщалось о возникновении сыпи у детей, которые находились на грудном вскармливании. Этот лекарственный препарат допускается применять в период грудного вскармливания в терапевтических дозах.

Фертильность

Неприменимо.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и потенциально опасными механизмами

Не влияет.

4.8 Нежелательные реакции

Определение частоты побочных явлений проводится в соответствии со следующими критериями: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq$ от $1/100$ до $< 1/10$), нечасто ($\geq$ от $1/1000$ до $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), неизвестно (невозможно оценить на основании имеющихся данных)

Редко

- анафилактический шок;
- отек Квинке;
- эритема;
- крапивница и кожная сыпь;
- ректальные и анальные раздражения.

Очень редко

- серьезные кожные реакции (острый генерализованный экзантематозный пустулез, токсический эпидермальный некролиз и синдром Стивенса-Джонсона);
- тромбоцитопения, лейкопения и нейтропения;
- диарея;
- боли в области живота.

При появлении побочных реакций необходимо сразу прекратить прием этого лекарственного препарата и родственных препаратов.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации ЛП с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» ЛП. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях ЛП через национальную систему сообщения о нежелательных реакциях РК.

РГП на ПХВ «Национальный Центр экспертизы лекарственных средств и медицинских изделий» Комитет медицинского и фармацевтического контроля Министерства здравоохранения Республики Казахстан

<http://www.ndda.kz>

4.9 Передозировка

Риск тяжелого отравления может быть особенно высоким у лиц пожилого возраста, маленьких детей, у пациентов с печеночной недостаточностью, при хроническом алкоголизме, у пациентов с хронической недостаточностью питания и у пациентов, получающих фермент-индуцирующие препараты. В этих случаях отравление может быть летальным. Клинические симптомы поражения печени обычно наблюдаются через два дня и достигают максимума через 4–6 дней.

Симптомы: тошнота, рвота, анорексия, бледность, недомогание, потоотделение, боль в животе, обычно появляющиеся в первые сутки.

Однократный прием более 10 г парацетамола взрослым и однократный прием ребенком в дозе более 150 мг/кг массы тела может вызвать некроз гепатоцитов, приводящий к гепатоцеллюлярной недостаточности, метаболическому ацидозу, энцефалопатии и летальному исходу.

Через 12-48 часов после передозировки может отмечаться повышение уровня печеночных трансаминаз, лактатдегидрогеназы и билирубина, а также снижение уровня протромбина. Клинические симптомы поражения печени обычно проявляются через 1–2 дня и достигают максимума через 3–4 дня.

Лечение: при проявлении симптомов отравления немедленно обратитесь к врачу. Рекомендуется анализ крови на определение уровня парацетамола в плазме крови как можно быстрее, но не раньше, чем через 4 часа после приема; промывание желудка (в случае приема внутрь), прием антидота N-ацетилцистеина внутривенно или перорально в течение 10 часов после приема лекарственного средства, симптоматическое лечение. Печеночные тесты следует проводить в начале лечения и затем каждые 24 часа. В большинстве случаев активность печеночных трансаминаз нормализуется в течение 1–2 недель. Однако в очень тяжелых случаях может потребоваться пересадка печени.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: другие анальгетики и антипиретики, анилиды.

Код АТХ: N02BE01.

Механизм действия

Парацетамол обладает центральным и периферическим механизмом действия.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Абсорбция парацетамола при ректальном введении происходит медленнее, но более полно, чем при пероральном введении. Максимальные концентрации в плазме достигаются через 2-3 часа после приема.

Распределение

Парацетамол быстро распределяется во все ткани. Концентрации в крови, слюне и плазме являются сопоставимыми. Связывание с белками плазмы слабое.

Биотрансформация

Парацетамол в основном метаболизируется в печени. Существуют два основных пути метаболизма – с образованием конъюгатов с глюкуроновой кислотой и сульфатных конъюгатов. Последний путь быстро насыщается, если принятая доза парацетамола превышает терапевтическую. Минимальный путь метаболизма, катализируемый цитохромом P450, приводит к образованию промежуточного реагента (N-ацетилбензохинонимина), который при нормальном применении быстро детоксифицируется восстановленным глутатионом и выводится с мочой после конъюгации с цистеином и меркаптопуриновой кислотой. Однако при сильном отравлении уровень этого токсичного метаболита повышается.

Элиминация

Выводится в основном с мочой. 90% принятой дозы выводится почками в течение 24 часов, в основном в форме глюкуронидных конъюгатов (60-80%) и сульфатных конъюгатов (20-30%). Менее 5% выводится в неизмененном виде. Период полувыведения – 4-5 часов.

В случае тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин), выведение парацетамола и его метаболитов замедляется.

5.3. Данные доклинической безопасности

Традиционные исследования с использованием принятых в настоящее время стандартов для оценки действия токсичности на репродуктивность и развитие не проводились.

Традиционные доклинические исследования фармакологической безопасности, генотоксичности, токсичности многократных доз и возможного канцерогенного действия не выявили особого риска для человека при применении в терапевтических дозах.

При применении в гепатотоксических дозах парацетамол продемонстрировал генотоксический и канцерогенный потенциал (опухоли в печени и мочевом пузыре) у мышей и крыс. Однако считается, что эта генотоксическая и канцерогенная активность связана с изменениями метаболизма парацетамола при применении в высоких дозах или концентрациях и не представляет риск при клиническом использовании.

У крыс наблюдалось воздействие на фертильную функцию самцов (олигоспермия, не соответствующая норме подвижность сперматозоидов и снижение оплодотворяющей способности спермы) при применении в высоких дозах (500 и 1000 мг/кг массы тела в сутки).

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Твердый жир (включая соевый лецитин).

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3 Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в сухом, защищённом от света месте при температуре не выше 30 °C.

Хранить в недоступном для детей месте!

6.5 Форма выпуска и упаковка

По 5 суппозиторий в контурной ячейковой упаковке.

По 2 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкцией по медицинскому применению на казахском и русском языках помещают в картонную коробку.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним.

Отсутствуют.

6.7 Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

УПСА САС,

3 рю Жозеф Монье, 92500 Рюэй-Мальмэзон, Франция.

7.1. ПРЕДСТАВИТЕЛЬ ДЕРЖАТЕЛЯ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Претензии потребителей направлять по адресу:

Представительство Акционерного общества "Дельта Медикел Промоушнз АГ» (Швейцария),

050040, г. Алматы, Медеуский район, Казыбек Би 20А, офис 308.

Тел. +7 (771) 504 54 13

Электронная почта: quality@deltaswiss.eu

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

80 мг: РК-ЛС-5№005193

150 мг: РК-ЛС-5№005212

300 мг: РК-ЛС-5№005213

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: ДД месяц ГГГГ

Дата последнего подтверждения регистрации (перерегистрации):

80 мг: 26 декабря 2016

150 мг: 28 декабря 2016

300 мг: 28 декабря 2016

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата доступна на официальном сайте <http://www.ndda.kz>