МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

Парацетамол Роутек

Регистрационный номер

Торговое название: Парацетамол Роутек

Международное непатентованное название: Парацетамол

Лекарственная форма: раствор для инфузий

Состав:

100 мл раствора содержит:

Активные вещества:

Парацетамол 1000 мг

Вспомогательные вещества: маннитол 5000 мг, натрия гидрофосфат 25 мг, натрия гидроксид до pH от 4,5 до 6,5, хлористоводородная кислота до pH от 4,5 до 6,5, вода для инъекций до 100 мл.

Описание: Прозрачный бесцветный или светло-желтый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее ненаркотическое средство.

Код АТХ: N02BE01

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

Фармакодинамика

Парацетамол обладает обезболивающим, жаропонижающим и слабым противовоспалительным действием.

Обезболивающее действие парацетамола наступает в течение 5–10 мин после начала инфузии и достигает максимума через 1 ч; длительность действия — 4–6 ч.

Жаропонижающее действие парацетамола наступает в течение 30 мин после начала инфузии; длительность действия 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 преимущественно в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные

75676

пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на циклооксигеназу, что объясняет практически полное отсутствие у него 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

При однократном и повторном введении парацетамола в течение 24-х часов в дозах до 2 г его фармакокинетика носит линейный характер.

Максимальная концентрация парацетамола в плазме крови достигается через 15 мин после внутривенной инфузии в дозе 1 г и составляет 30 мкг/мл. Объем распределения у взрослых составляет 1 л/кг. Парацетамол слабо связывается с белками плазмы. Проникает через гематоэнцефалический барьер; через 20 мин после внутривенной инфузии 1 г препарата в спинномозговой жидкости обнаруживается значительная концентрация парацетамола (около 1,5 мкмоль/мл).

У взрослых парацетамол метаболизируется в основном в печени с образованием глюкуронидов и сульфатов. Небольшая часть (4 %) парацетамола метаболизируется цитохромом Р450 с образованием активного промежуточного метаболита (N-ацетилбензохинонимина), 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. Парацетамол выводится, главным образом, с мочой; 90 % принятой дозы выводится почками в течение 24 ч, в основном в виде глюкуронида (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, 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

75676

одинакова.

Показания к применению

Препарат применяют в случае, когда клинической необходимостью из соображений срочности оправдано внутривенное применение и/или отсутствует возможность использования другого пути введения при следующих синдромах:

- Болевой синдром слабой и умеренной интенсивности (особенно после хирургических вмешательств);
- Лихорадочный синдром на фоне инфекционно-воспалительных заболеваний;

Противопоказания

Гиперчувствительность к парацетамолу или пропацетамолу гидрохлориду (пролекарство парацетамола) или любому другому компоненту препарата.

Тяжелые нарушения функции печени.

Период новорожденности (до 1 месяца).

С осторожностью

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

Если у Вас одно из перечисленных заболеваний, перед приемом препарата обязательно проконсультируйтесь с врачом.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Препарат следует применять во время беременности только, если ожидаемая польза превышает возможный риск для матери и плода.

Парацетамол в небольшом количестве попадает в грудное молоко. При грудном вскармливании ребенок в течение дня получает около 1-2% от дозы препарата, полученной матерью. Препарат следует применять во время грудного вскармливания только, если ожидаемая польза превышает возможный риск для матери и ребенка.

Способ применения и дозы

Внутривенная однократная инфузия в течение 15 минут.

Препарат нельзя смешивать в одном флаконе для инфузий с другими лекарственными препаратами.

Инфузию следует проводить немедленно после вскрытия флакона; неиспользованный остаток препарата уничтожают.

75676

Допускается дополнительное разведение 0,9% раствором хлорида натрия или 5 % раствором глюкозы, дополнительно на 1/10 часть первоначального объема. Разведенный раствор следует использовать в течение часа после приготовления, включая время инфузии. Перед началом инфузии флакон с разведенным препаратом следует внимательно осмотреть на предмет отсутствия видимых механических частиц и изменения цвета раствора.

Подростки (старше 11 лет) и взрослые с массой тела более 50 кг

По 1 г парацетамола на инфузию, т.е. 1 флакон (100 мл) до 4 раз в сутки. Максимальная суточная доза не должна превышать 4 г. Минимальный интервал между введениями должен составлять 4 часа.

Дети с массой тела более 33 кг (приблизительно 11 лет), подростки и взрослые с массой тела до 50 кг

По 15 мг/кг парацетамола на инфузию, т.е. 1,5 мл/кг до 4 раз в сутки.

Максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг/кг массы тела (или не более 3 г).

Минимальный интервал между введениями должен составлять 4 часа.

Дети с массой тела от 10 кг до 33 кг (приблизительно от 1 года до 11 лет)

По 15 мг/кг парацетамола на инфузию, то есть 1.5 мл раствора на кг, до 4 раз в сутки. Максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг/кг (или не более 2 г). Минимальный интервал между введениями должен составлять 4 часа.

Дети с массой тела до 10 кг (от 1 мес. до 1 года)

По 7,5 мг/кг парацетамола на инфузию, то есть 0.75 мл раствора на кг, до 4 раз в сутки. Максимальная суточная доза не должна превышать 30 мг/кг. Минимальный интервал между введениями должен составлять 4 часа.

При тяжелых нарушениях функции почек (клиренс креатинина < 30 мл/мин) интервал между введениями препарата должен составлять не менее 6 часов.

При нарушениях функции печени у взрослых и у пациентов с хроническим алкоголизмом, нарушениями питания или обезвоживанием суточная доза не должна превышать 3 г.

Коррекции дозировки для пожилых пациентов не требуется.

Побочные эффекты

Частота побочных эффектов 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 редкие < 0,01 %.

Со стороны кожных покровов:

очень редко — покраснение кожи, зуд, сыпь на коже и слизистых (обычно эритематозная или уртикарная).

Со стороны печени и желчно-выводящих путей:

редко — повышение активности «печеночных» ферментов, как правило, без развития желтухи.

частота не установлена — молниеносный гепатит, некроз печени, печеночная недостаточность, повышение активности «печеночных» ферментов.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:

редко — артериальная гипотензия (снижение артериального давления);

очень редко — тахикардия.

Со стороны органов кроветворения:

очень редко — анемия, тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения

Общего характера:

редко — недомогание.

очень редко — анафилактический шок.

Аллергические реакции: частота не установлена — реакции гиперчувствительности, анафилактический шок, анафилаксия, отек Квинке

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

частота не установлена — тошнота, рвота.

Передозировка

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 которой могут развиться 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 полным и необратимым некрозом печени, развитием

75676

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 N-ацетилцистеина — в течение 10 ч после передозировки.
- 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 введения.
- Симптоматическое лечение.
- Печеночные тесты следует проводить в начале лечения и затем — каждые 24 ч.

В большинстве случаев активность печеночных трансаминаз 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 два 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 обусловливает возможность развития тяжелых интоксикаций при небольших передозировках.

Этанол способствует развитию острого панкреатита.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени (в т.ч. 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.

Одновременное применение парацетамола в виде инфузий (4 г/сутки, не менее 4 суток) и непрямых антикоагулянтов может приводить к незначительному изменению международного нормализованного отношения (МНО). Следует контролировать МНО во время лечения и в течение недели после прекращения инфузий парацетамола.

Особые указания

Рекомендуется перевод пациента на пероральный прием обезболивающих препаратов, как только появляется такая возможность.

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.

Искажает результаты количественного определения содержания мочевой кислоты в плазме.

Влияние на способность к управлению автомобилем и работу с механизмами

Препарат применяется в условиях стационара.

Форма выпуска

Раствор для инфузий 1%

По 100 мл препарата во флакон из полиэтилена. Каждый флакон вместе с инструкцией по применению в пачку картонную.

Условия хранения

В защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности

2 года.

Не использовать препарат после даты окончания срока годности, указанной на упаковке.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель

«Скан Биотек Лимитед», Индия, Бхопал, Е-4/300, Арера Колони Экстеншн, 462016.

Претензии потребителей направлять по адресу:

ООО «АРС», Россия,

127560, г.Москва, ул. Плещеева, д.14а

Представитель фирмы М. Ю. Тихонов