ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата Парацетамол ЭКСТРА

Регистрационный номер:
Торговое название препарата: Парацетамол ЭКСТРА
Международное непатентованное название или группировочное название: парацетамол+аскорбиновая кислота
Лекарственная форма: порошок для приготовления раствора для приема внутрь (апельсиновый, вишневый, карамельный)

Состав
Пакетик содержит:
активные вещества - Парацетамола – 0,5 г; Аскорбиновой кислоты – 0,15 г
вспомогательные вещества: кислота лимонная, декстрин, ароматизатор (апельсин или вишня, или карамель), сахароза (сахар), аспартам, краситель («солнечный закат желтый» или «азорубин», или «хинолиновый желтый»)

Описание
Гранулированный порошок оранжевого или малинового, или желтого цвета с характерным слабым запахом (апельсина, вишни, карамели).
Водный раствор содержимого одного пакетика в 100 мл воды с температурой 40 - 45°С – слегка мутный раствор оранжевого или малинового, или желтого цвета с характерным слабым запахом (апельсина, вишни, карамели).

Фармакотерапевтическая группа: Анальгезирующее средство комбинированное (анальгезирующее ненаркотическое средство + витамин)
Код АТХ: N02BE51

Фармакологические свойства
Фармакодинамика
Парацетамол обладает обезболивающим и жаропонижающим действием. Препарат блокирует циклооксигеназу 1 и 2 преимущественно в центральной нервной системе (ЦНС), воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на циклооксигеназу, что объясняет практически полное отсутствие у него противовоспалительного эффекта. Препарат не оказывает отрицательного воздействия на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды) и слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта (ЖКТ), вследствие отсутствия влияния на синтез простагландинов в периферических тканях. Препарат в виде теплого напитка удобен в применении у пациентов с воспалительными заболеваниями ротоглотки, так как прием препаратов в

54013

твердых лекарственных формах затруднен. Возможность образования метгемоглобина маловероятна.

Аскорбиновая кислота (витамин С) не образуется в организме человека, поступает только с пищей.

Физиологические функции: является кофактором некоторых реакций гидроксилирования и амидирования - переносит электроны на ферменты, снабжая их восстановительным эквивалентом. Участвует в реакциях гидроксилирования пролиновых и лизиновых остатков проколлагена с образованием гидроксипролина и гидроксилизина (пострансляционная модификация коллагена), окислении боковых цепей лизина в белках с образованием гидрокситриметиллизина (в процессе синтеза картинита), окислении фолиевой кислоты до фолиновой, метаболизме лекарственных средств в микросомах печени и гидроксилировании дофамина с образованием норадреналина.

Повышает активность амидирующих ферментов, участвующих в процессинге окситоцина, антидиуретического гормона и холицистокинина. Участвует в стероидогенезе в надпочечниках.

Основная роль на тканевом уровне - участие в синтезе коллагена, протеогликанов и др. органических компонентов межклеточного вещества зубов, костей и эндотелия капилляров.

Фармакокинетика.

Парацетамол. Абсорбция – высокая. Время, необходимое для достижения максимальной концентрации ($ТС_{max}$) - 0,5-2 ч; максимальная концентрация ($С_{max}$) - 5-20 мкг/мл. Связь с белками плазмы - 15%. Проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ). Объем распределения варьирует от 0,8 до 1,36 л/кг массы тела. Менее 1% от принятой кормящей матерью дозы парацетамола проникает в грудное молоко. Терапевтически эффективная концентрация парацетамола в плазме достигается при его назначении в дозе 10-15 мг/кг. Метаболизируется в печени по трем основным путям: конъюгация с глюкуронидами, конъюгация с сульфатами, окисление микросомальными ферментами печени. В последнем случае образуются токсичные промежуточные метаболиты, которые впоследствии конъюгируют с глутатионом, а затем с цистеином и меркаптуровой кислотой. Основными изоферментами цитохрома Р450 для данного пути метаболизма являются изофермент CYP2E1 (преимущественно), CYP1A2 и CYP3A4 (второстепенная роль). При дефиците глутатиона эти метаболиты 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 метаболиты парацетамола (глюкурониды, сульфаты и конъюгаты с

54013

глутатионом) обладают низкой фармакологической (в т.ч. токсической) активностью.

Период полувыведения (T1/2) - 1-4 ч. Выводится почками в виде метаболитов, преимущественно конъюгатов, только 3% в неизмененном виде. У пожилых пациентов снижается клиренс препарата и увеличивается T1/2.

Аскорбиновая кислота Связь с белками плазмы - 25%.

Концентрация аскорбиновой кислоты в плазме в норме составляет приблизительно 10-20 мкг/мл. Легко проникает в лейкоциты, тромбоциты, а затем - во все ткани; наибольшая концентрация достигается в железистых органах, лейкоцитах, печени и хрусталике глаза; проникает через плаценту. Концентрация аскорбиновой кислоты в лейкоцитах и тромбоцитах выше, чем в эритроцитах и в плазме. При дефицитных состояниях концентрация в лейкоцитах снижается позднее и более медленно и рассматривается как лучший критерий оценки дефицита, чем концентрация в плазме.

Метаболизируется преимущественно в печени в дезоксиаскорбиновую и далее в щавелевоуксусную и аскорбат-2-сульфат.

Выводится почками, через кишечник, с потом, грудным молоком в неизмененном виде и в виде метаболитов.

При назначении высоких доз скорость выведения резко усиливается. Курение и употребление этанола ускоряют разрушение аскорбиновой кислоты (превращение в неактивные метаболиты), резко снижая запасы в организме.

Выводится при гемодиализе.

Показания к применению

Парацетамол ЭКСТРА применяют в качестве:

- жаропонижающего средства при инфекционно-воспалительных заболеваниях (ОРВИ, в т.ч. грипп);
- обезболивающего средства при легком и умеренно выраженном болевом синдроме (головной, зубной боли) невоспалительного происхождения, при невралгии, боли в мышцах и суставах, альгодисменорее.

Противопоказания

Тяжелые заболевания почек, печени, в том числе почечная и/или печеночная недостаточность; дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в фазе обострения), желудочно-кишечные кровотечения; фенилкетонурия; детский возраст до 6 лет; непереносимость фруктозы, глюкозо-галактозная мальабсорбция, сахаразо-изомальтозная недостаточность; беременность (I-III триместры), период лактации.

С осторожностью

Эрозивно-язвенные поражения желудочно-кишечного тракта (в анамнезе), врожденные гипербилирубинемии (синдромы Жильбера, Дубина-Джонсона и Ротора).

54013

Заболевания крови (тромбоцитопения, лейкопения, агранулоцитоз), сидеробластная анемия, талассемия.
Дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, гемохроматоз, гипероксалурия, мочекаменная болезнь.
Бронхиальная астма. Сахарный диабет. Алкоголизм.

Применение при беременности и лактации

Данных по исследованиям эффективности и безопасности комбинации парацетамола и аскорбиновой кислоты у беременных и кормящих нет. Таким образом оценить возможное соотношение риска и пользы не представляется возможным, в связи с чем не рекомендуется применение препарата у данных категорий пациентов.

Способ применения и дозы

Внутрь. Для приготовления раствора содержимое пакетика растворить в необходимом количестве кипяченой воды. Употреблять в теплом виде. Детям от 6 до 12 лет по 1 пакетику, не более 3 пакетиков в сутки; старше 12 лет (с массой тела более 50 кг) по 1 пакетику, не более 4 пакетиков в сутки. Взрослым принимать по 1 пакетику 3-4 раза/сутки с интервалом между приемами 4-8 часов.

Побочные эффекты

Парацетамол.
Со стороны пищеварительной системы: редко – тошнота, очень редко – рвота, диарея, боль в эпигастральной области, желтуха, панкреатит и повышение активности «печеночных» ферментов. Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, кожный зуд, крапивница, ангионевротический отек).
Со стороны органов кроветворения и лимфатической системы: очень редко - анемия, лейкопения.
Прочие: слабость.
Аскорбиновая кислота.
Аллергические реакции: кожная сыпь, гиперемия кожи.
Лабораторные показатели: тромбоцитоз, гиперпротромбинемия, эритропения, нейтрофильный лейкоцитоз, гипокалиемия, глюкозурия.

Передозировка

Симптомы (обусловлены парацетамолом): в течение первых 24 ч после приема – бледность кожных покровов, тошнота, рвота; анорексия, абдоминальная боль; нарушение метаболизма глюкозы, метаболический ацидоз. Симптомы нарушения функции печени могут появиться через 12-48 ч после передозировки. При тяжелой передозировке – печеночная недостаточность с прогрессирующей энцефалопатией, кома, смерть; острая почечная недостаточность с турбулярным некрозом (в т.ч. при отсутствии тяжелого поражения печени); аритмия, панкреатит. Гепатотоксический эффект у взрослых проявляется при приеме 10 г и более. Редко печеночная недостаточность развивается молниеносно и может осложняться почечной недостаточностью (тубулярный некроз).

54013

Лечение: введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона - метионина – в течение 8-9 ч после передозировки и ацетилцистеина – в течение 8 ч.

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 приема.

Симптомы (обусловлены аскорбиновой кислотой): диарея, тошнота, раздражение слизистой оболочки ЖКТ, метеоризм, абдоминальная боль спастического характера, учащенное мочеиспускание, нефролитиаз, бессонница, раздражительность, гипогликемия.

Лечение: симптоматическое, форсированный диурез.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

При одновременном приеме других лекарственных средств с Парацетамол ЭКСТРА следует проконсультироваться с врачом.

Парацетамол снижает эффективность урикозурических препаратов.

При длительном и регулярном применении парацетамол потенцирует действие варфарина и других производных кумарина и повышает риск кровотечений.

Одновременный прием колестирамина приводит к уменьшению всасывания парацетамола (и ослаблению эффектов парацетамола).

Метоклопрамид и домперидон повышают всасывание парацетамола.

Одновременное применение парацетамола и нестероидных противовоспалительных препаратов (метамизол натрия, ацетилсалициловая кислота, ибупрофен и т.п.) повышает риск развития «анальгетической» нефропатии и почечного папиллярного некроза, терминальной стадии почечной недостаточности.

Одновременное применение парацетамола и хлорамфеникола может сопровождаться увеличением T1/2 хлорамфеникола до 5 раз.

Индукторы микросомальных ферментов печени (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов, что обуславливает возможность развития тяжелых интоксикаций даже при небольших передозировках.

Салициламид увеличивает T1/2 парацетамола, что приводит к накоплению парацетамола и, соответственно, повышенному образованию его токсических метаболитов.

Одновременное применение парацетамола и этанола может усилить гепатотоксичность парацетамола, а также способствовать развитию острого панкреатита.

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

54013

Не следует одновременно применять другие лекарственные средства, содержащие парацетамол, а также другие ненаркотические анальгетики. Одновременное использование других лекарственных средств должно быть согласовано с врачом.

Аскорбиновая кислота повышает концентрацию в крови бензилпенициллина и тетрациклинов; в дозе 1 г/сут повышает биодоступность этинилэстрадиола (в т.ч. входящего в состав пероральных контрацептивов); улучшает всасывание в кишечнике препаратов Fe (переводит трехвалентное железо в двухвалентное); может повышать выведение железа при одновременном применении с дефероксамином; снижает эффективность гепарина и непрямых антикоагулянтов.

Ацетилсалициловая кислота, пероральные контрацептивы, свежие соки и щелочное питье снижают всасывание и усвоение аскорбиновой кислоты.

При одновременном применении с ацетилсалициловой кислотой повышается выведение с мочой аскорбиновой кислоты и снижается выведение ацетилсалициловой кислоты.

Ацетилсалициловая кислота снижает абсорбцию аскорбиновой кислоты примерно на 30%.

Аскорбиновая кислота увеличивает риск развития кристаллурии при лечении салицилатами и сульфаниламидами короткого действия, замедляет выведение почками кислот, увеличивает выведение лекарственных средств, имеющих щелочную реакцию (в т.ч. алкалоидов), снижает концентрацию в крови пероральных контрацептивов.

Лекарственные средства хинолинового ряда, $CaCl_2$, салицилаты, ГКС при длительном применении истощают запасы аскорбиновой кислоты.

При одновременном применении аскорбиновая кислота уменьшает хронотропное действие изопреналина.

При длительном применении или применении в высоких дозах аскорбиновая кислота может препятствовать взаимодействию дисульфирама и этанола; в высоких дозах повышает выведение мексилетина почками.

Барбитураты и примидон повышают выведение аскорбиновой кислоты с мочой.

Аскорбиновая кислота уменьшает терапевтическое действие антипсихотических лекарственных средств (нейролептиков) - производных фенотиазина, канальцевую реабсорбцию амфетамина и трициклических антидепрессантов.

Особые указания

Нельзя превышать рекомендованные дозы препарата Парацетамол ЭКСТРА.

При гипертермии, продолжающейся более 3 дней, и болевом синдроме более 5 дней требуется консультация врача.

После 5 дней применения препарата Парацетамол ЭКСТРА необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Парацетамол искажает показатели лабораторных исследований при количественном определении концентрации глюкозы и мочевой кислоты в

54013

плазме. Во избежание токсического поражения печени парацетамол не следует сочетать с приемом напитков, содержащих алкоголь, а также принимать лицам, склонным к злоупотреблению алкоголем.

Существуют данные о том, что частое применение препаратов, содержащих парацетамол, приводит к утяжелению симптомов бронхиальной астмы.

Препарат Парацетамол ЭКСТРА содержат сахарозу, поэтому препарат не рекомендуется использовать пациентам с врожденной непереносимостью фруктозы, синдромом мальабсорбции глюкозы-галактозы или дефицитом сахаразы-изомальтазы.

Препарат содержит сахар. Содержимое 1 пакетика Парацетамол ЭКСТРА соответствует 3,9 г сахара. Не следует назначать больным сахарным диабетом.

Влияние на способность управление автотранспортом и другими техническими средствами

Нет данных о влиянии препарата Парацетамол ЭКСТРА на способность управления автотранспортом и другими техническими средствами.

Форма выпуска

Порошок для приготовления раствора для приема внутрь (апельсиновый, вишневый, карамельный) 500 мг+150 мг.

По 5 г в пакетики термосвариваемые из материала пленочного комбинированного или из материала комбинированного многослойного или из фольги кашированной упаковочной.

По 5, 10, 20, 30, 40 или 50 пакетиков с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года.

Не использовать после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек

Без рецепта.

Производитель/организация, принимающая претензии

ЗАО «Фармацевтическое предприятие «Оболенское»

142279, Московская область, Серпуховской р-он, п. Оболенск, корп. 7-8.

Тел./факс (4967) 36-01-07.

Директор ЗАО «Фамацевтическое предприятие «Оболенское»

ЗАО "ОБОЛЕНСКОЕ" ЗАКРЫТОЕ АКЦИОНЕРНОЕ ОБЩЕСТВО ФАРМАЦЕВТИЧЕСКОЕ "ОБОЛЕНСКОЕ" ОГРН 1025007748 ПРЕДПРИЯТИЕ ИНН 5077009710

В.И. Волчков

РОСЗДРАВНАДЗОРА
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА 7
0 0 0 0 0 0 0 0 7