Далерон



Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Анальгетик-антипиретик. Обладает анальгезирующим, жаропонижающим и слабым противовоспалительным действием. Механизм действия связан с ингибированием синтеза простагландинов, преимущественным влиянием на центр терморегуляции в гипоталамусе.

Фармакокинетика

После приема внутрь парацетамол быстро абсорбируется из ЖКТ, преимущественно в тонкой кишке, в основном путем пассивного транспорта. После однократного приема в дозе 500 мг C_{max} в плазме крови достигается через 10-60 мин и составляет около 6 мкг/мл, затем постепенно снижается и через 6 ч составляет 11-12 мкг/мл.

Широко распределяется в тканях и в основном в жидких средах организма, за исключением жировой ткани и спинномозговой жидкости.

Связывание с белками составляет менее 10% и незначительно увеличивается при передозировке. Сульфатный и глюкуронидный метаболиты не связываются с белками плазмы даже в относительно высоких концентрациях.

Парацетамол метаболизируется преимущественно в печени путем конъюгации с глюкуронидом, конъюгации с сульфатом и окисления при участии смешанных оксидаз печени и цитохрома Р450.

Гидроксилированный метаболит с негативным действием - N-ацетил-р-бензохинонимин, который образуется в очень небольших количествах в печени и почках под влиянием смешанных оксидаз и обычно детоксифицируется путем связывания с глютатионом, может накаливаться при передозировке парацетамола и вызывать повреждения тканей.

У взрослых большая часть парацетамола связывается с глюкуроновой кислотой и в меньшей степени - с серной кислотой. Эти конъюгированные метаболиты не обладают биологической активностью. У недоношенных детей, новорожденных и на первом году жизни преобладает сульфатный метаболит.

$T_{1/2}$ составляет 1-3 ч. У пациентов с циррозом печени $T_{1/2}$ несколько больше. Почечный клиренс парацетамола составляет 5%.

Выводится с мочой главным образом в виде глюкуронидных и сульфатных конъюгатов. Менее 5% выводится в виде неизмененного парацетамола.

Показания к применению:

Болевой синдром слабой и умеренной интенсивности различного генеза (в т.ч. головная боль, мигрень, зубная боль, невралгия, миалгия, альгодисменорея; боль при травмах, ожогах). Лихорадка при инфекционно-воспалительных

заболеваниях.

Относится к болезням:

- Альгодисменорея
- Головная боль
- Зубная боль
- Инфекции
- Миалгия
- Мигрень
- Невралгия
- Неврит
- Травмы

Противопоказания:

Хронический алкоголизм, повышенная чувствительность к парацетамолу.

Способ применения и дозы:

Внутрь или ректально у взрослых и подростков с массой тела более 60 кг применяют в разовой дозе 500 мг, кратность приема - до 4 раз/сут. Максимальная продолжительность лечения - 5-7 дней.

Максимальные дозы: разовая - 1 г, суточная - 4 г.

Разовые дозы для приема внутрь для детей в возрасте 6-12 лет - 250-500 мг, 1-5 лет - 120-250 мг, от 3 месяцев до 1 года - 60-120 мг, до 3 месяцев - 10 мг/кг. Разовые дозы при ректальном применении у детей в возрасте 6-12 лет - 250-500 мг, 1-5 лет - 125-250 мг.

Кратность применения - 4 раза/сут с интервалом не менее 4 ч. Максимальная продолжительность лечения - 3 дня.

Максимальная доза: 4 разовые дозы в сутки.

Побочное действие:

Со стороны пищеварительной системы: редко - диспептические явления, при длительном применении в высоких дозах - гепатотоксическое действие.

Со стороны системы кроветворения: редко - тромбоцитопения, лейкопения, панцитопения, нейтропения, агранулоцитоз.

Аллергические реакции: редко - кожная сыпь, зуд, крапивница.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Парацетамол проникает через плацентарный барьер. До настоящего времени не отмечено отрицательного воздействия парацетамола на плод у человека.

Парацетамол выделяется с грудным молоком: содержание в молоке составляет 0.04-0.23% дозы, принятой матерью.

При необходимости применения парацетамола при беременности и в период лактации (грудного вскармливания) следует тщательно взвесить ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода или ребенка.

В *экспериментальных исследованиях* не установлено эмбриотоксическое, тератогенное и мутагенное действие парацетамола.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с индукторами микросомальных ферментов печени, средствами, обладающими гепатотоксическим действием, возникает риск усиления гепатотоксического действия парацетамола.

При одновременном применении с антикоагулянтами возможно небольшое или умеренно выраженное повышение

протромбинового времени.

При одновременном применении с антихолинергическими средствами возможно уменьшение всасывания парацетамола.

При одновременном применении с пероральными контрацептивами ускоряется выведение парацетамола из организма и возможно уменьшение его анальгетического действия.

При одновременном применении с урикозурическими средствами снижается их эффективность.

При одновременном применении активированного угля снижается биодоступность парацетамола.

При одновременном применении с диазепамом возможно уменьшение экскреции диазепама.

Имеются сообщения о возможности усиления миелодепрессивного эффекта зидовудина при одновременном применении с парацетамолом. Описан случай тяжелого токсического поражения печени.

Описаны случаи проявлений токсического действия парацетамола при одновременном применении с изониазидом.

При одновременном применении с карбамазепином, фенитоином, фенобарбиталом, примидоном уменьшается эффективность парацетамола, что обусловлено повышением его метаболизма (процессов глюкуронизации и окисления) и выведения из организма. Описаны случаи гепатотоксичности при одновременном применении парацетамола и фенобарбитала.

При применении колестирамина в течение периода менее 1 ч после приема парацетамола возможно уменьшение абсорбции последнего.

При одновременном применении с ламотриджином умеренно повышается выведение ламотриджина из организма.

При одновременном применении с метоклопрамидом возможно увеличение абсорбции парацетамола и повышение его концентрации в плазме крови.

При одновременном применении с пробенецидом возможно уменьшение клиренса парацетамола; с рифампицином, сульфинпиразоном - возможно повышение клиренса парацетамола вследствие повышения его метаболизма в печени.

При одновременном применении с этинилэстрадиолом повышается всасывание парацетамола из кишечника.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции печени и почек, с доброкачественной гипербилирубинемией, а также у больных пожилого возраста.

При длительном применении парацетамола необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Применяется для лечения синдрома предменструального напряжения в комбинации с памабромом (диуретик, производное ксантина) и мепирамином (блокатор гистаминовых H_1-рецепторов).

При нарушениях функции почек

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью применяют у пациентов с нарушениями функции печени.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью применяют у больных пожилого возраста.

Применение в детском возрасте

Применение возможно согласно режиму дозирования.

Источник: http://drugs.thead.ru/Daleron