Парацетамол



Код АТХ:

- N02BE01

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Парацетамол

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Таблетки 6, 10 шт. - блистеры, контурная безъячейковая упаковка.

Суппозитории ректальные для детей 5 шт. - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Сироп 50 мл, 100 мл - флакон темного стекла (1) - пачки картонные.

Состав:

Одна таблетка содержит

Активное вещество: парацетамол 200 мг/500 мг

Вспомогательные вещества: крахмал картофельный, поливинилпирролидон низкомолекулярный, кальция стерат, аэросил.

Суппозиторий ректальный для детей содержит

Активное вещество: парацетамол 100 мг

Вспомогательные вещества: твердая жировая основа до получения суппозитория массой 1,25 г.

5 мл сиропа содержат

Активное вещество: парацетамол 120 мг

Вспомогательные вещества: пропиленгликоль, глицерин, спирт этиловый 96 %, сорбитол, метилпарагидроксибензоат, пропилпарагидроксибензоат, ароматизатор пищевой “Малина”, понсо 4R, вода очищенная.

Описание:

Таблетки: белого или белого с кремоватым оттенком цвета, с плоской поверхностью и фаской.

Суппозитории ректальные для детей: от белого до белого с кремоватым или белого с желтоватым оттенком цвета, торпедообразной формы.

Сироп: прозрачная вязкая жидкость розового цвета со сладким вкусом и характерным запахом малины.

Фармакотерапевтическая группа:

- Ненаркотические анальгетики, включая нестероидные и другие противовоспалительные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Таблетки

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

Суппозитории ректальные для детей

Ненаркотический анальгетик, блокирует ЦОГ1 и ЦОГ2 преимущественно в ЦНС, воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на ЦОГ, что объясняет практически полное отсутствие противовоспалительного эффекта. Отсутствие блокирующего влияния на синтез Pg в периферических тканях обусловливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка Na+ и воды) и слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта.

Сироп

Обладает аналгетическим, жаропонижающим и слабым противовоспалительным действием. Механизм действия связан с ингибированием синтеза простагландинов и влиянием на центр терморегуляции в гипоталамусе.

Фармакокинетика

Таблетки

Быстро и практически полностью всасывается в пищеварительном канале. Биодоступность при приеме внутрь - 100%.
Максимальная концентрация в плазме определяется через 30-60 мин после приема внутрь. После однократного приема обнаруживается в течение 5 ч. Хорошо проникает в ткани. Около 25% введенного парацетамола связывается с белками плазмы. До 80% принятой дозы метаболизируется в печени путем глюкуронидирования и сульфатирования, только 3% выделяется с мочой в неизмененном виде.
Период полувыведения - 2-4 ч у здоровых и 8-12 ч у больных с заболеваниями печени.

Суппозитории ректальные для детей

Абсорбция - высокая, TC_{max} - 0.5-2 ч; C_{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 метаболиты, 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 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 том числе недоношенных) и маленьких детей - сульфатирование. Конъюгированные метаболиты парацетамола (глюкурониды, сульфаты и конъюгаты с глутатионом) обладают низкой фармакологической (в том числе токсической) активностью.

$T_{1/2}$ - 1-4 ч. Выводится почками в виде метаболитов, преимущественно конъюгатов, только 3% в неизмененном виде.

Сироп

После приема внутрь парацетамол быстро всасывается из ЖКТ, преимущественно в тонкой кишке, в основном путем пассивного транспорта. После однократного приема в дозе 500 мг максимальная концентрация 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. Хорошо 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 увеличении дозы. Сульфатный и глюкуронидные метаболиты не связываются с белками плазмы даже в относительно высоких концентрациях. Парацетамол метаболизируется преимущественно в печени путем конъюгации с глюкуронидами, 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 накапливаться при передозировке парацетамола и вызывать повреждения тканей. У взрослых большая часть парацетамола связывается с глюкуроновой кислотой и в меньшем количестве - с серной кислотой. Эти конъюгированные метаболиты не обладают биологической активностью. У недоношенных детей, новорожденных и на первом году жизни преобладает сульфатный метаболит. Период полувыведения составляет 1 -3 ч. У больных циррозом печени период полувыведения несколько больше. Почечный клиренс парацетамола составляет 5%. Препарат выводится с мочой главным образом в виде глюкуронидных и сульфатных конъюгатов. Менее 5% выводится в виде неизмененного парацетамола.

Показания к применению:

Таблетки и сироп:

— болевой синдром малой и средней интенсивности различного генеза (головная и зубная боли, невралгии, боль в мышцах, боль при прорезывании зубов, при травмах, ожогах, фарингите)

— лихорадка при инфекционно-воспалительных заболеваниях.

Суппозитории ректальные для детей:

— жаропонижающее средство при острых респираторных заболеваниях, гриппе, детских инфекциях, поствакциональных реакциях и других состояниях, сопровождающихся повышением температуры тела;

— болеутоляющее средство при болевом синдроме слабой и умеренной интенсивности, в том числе: головной и зубной боли, боли в мышцах, невралгии, боли при травмах и ожогах.

Относится к болезням:

- Головная боль
- Грипп
- Зубная боль
- Лихорадка
- Невралгия
- Ожоги
- Фарингит

Противопоказания:

Гиперчувствительность, период новорожденности (до 1 мес.).

С осторожностью. Почечная и печеночная недостаточность, доброкачественные гипербилирубинемии (в том числе синдром Жильбера), вирусный гепатит, заболевания крови (лейкопения, тромбоцитопения), ранний грудной возраст (до 3 мес.).

Способ применения и дозы:

Таблетки

Внутрь разовая доза для взрослых 0,5 г, максимальная разовая доза - 1 г. Кратность назначения до 4 раз в сутки. Максимальная суточная доза 4 г. Продолжительность курса лечения 5-7 дней. Разовые дозы для детей: от 3 до 12 месяцев - 0,024-0,12 г, 1-6 лет - по 0,12-0,24 г, 6-12 лет - 0,24 г. Кратность назначения - 4 раза в сутки, интервал между каждым приемом - не менее 4 ч. Максимальная продолжительность лечения - 3 дня.

Суппозитории ректальные для детей

Ректально. Кратность приема 2-4 раза в сут; интервал - не менее 4 ч. Доза зависит от возраста и массы тела ребенка. Средняя разовая доза составляет 10-12 мг/кг массы тела. Максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 60 мг/кг массы тела.

В зависимости от возраста рекомендуют следующие разовые дозы:

от 6 до 12 месяцев – 0.5-1 суппозиторий (50-100 мг);

от 1 года до 3 лет - 1-1.5 суппозитория (100-150 мг);

от 3 до 5 лет – 1.5-2 суппозитория по (150-200 мг);

от 5 до 10 лет – 2.5-3.5 суппозитория (250-350 мг);

от 10 до 12 лет – 3.5-5 суппозиториев (350-500 мг).

Не принимать препарат более 3 дней в качестве жаропонижающего средства и 5 дней в качестве обезболивающего средства без назначения врача! У детей младше 3-х месяцев может применяться при повышенной температуре, вызванной вакцинацией (прививкой). По всем другим показаниям, Парацетамол у детей младше 3-х месяцев применяется только по назначению врача.

Сироп

Препарат назначают внутрь.

В зависимости от возраста рекомендуют следующие разовые дозы:

от 6 месяцев до 1 года – по 60 – 120 мг парацетамола (1/2 - 1 чайная ложка сиропа);

от 1 года до 3 лет – по 120 – 180 мг парацетамола (1 -1,5 чайной ложки сиропа);

от 3 до 6 лет – по 180 – 240 мг парацетамола (1,5 - 2 чайные ложки сиропа);

от 6 до 12 лет - по 240 – 360 мг парацетамола (2 - 3 чайные ложки сиропа);

старше 12 лет – по 360 – 600 мг парацетамола (3 - 5 чайных ложек сиропа).

Кратность приема – 3-4 раза в сутки с интервалом между каждым приемом не менее 4 ч. Максимальная продолжительность лечения – 3 дня.

Побочное действие:

Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, отёк Квинке.

Со стороны системы кроветворения: анемия, тромбоцитопеническая пурпура, метгемоглобинемия, агранулоцитоз.

Прочие: тошнота, боли в эпигастрии, гепатотоксическое действие.

Передозировка:

Симптомы: в течение первых 24 ч после приема желудочно-кишечные расстройства (диарея, потеря аппетита, тошнота, рвота, спазмы, боль в желудке), Симптомы нарушения функции печени могут появиться через 12-48 ч после передозировки (выраженность некроза прямо зависит от степени передозировки) - повышение активности «печеночных» трансаминаз, увеличение протромбинового времени; развернутая клиническая картина поражения печени проявляется через 1-6 дней. При тяжелой передозировке - печеночная недостаточность с прогрессирующей энцефалопатией. Редко нарушение функции печени развивается молниеносно и может осложняться почечной недостаточностью (тубулярный некроз).

Лечение: введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона-метионина в течение 8-9 ч после передозировки и N-ацетилцистеина - до 12 ч. Необходимость в проведении дополнительных терапевтических мероприятий (дальнейшее ведение метионина, внутривенное введение N - ацетилцистеина) определяется в

зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его приема.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Применение препарата в период беременности возможно только по назначению врача.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Стимуляторы микросомального окисления в печени (фенитоин, этанол, барбитураты, флумецинол, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) увеличивают продукцию гидроксилированных активных метаболитов, что обусловливает возможность развития гепатотоксического действия при небольших передозировках. Ингибиторы микросомального окисления (в т.ч. циметидин) снижают риск гепатотоксического действия. При приеме вместе с салицилатами нефротоксическое действие парацетамола возрастает. Сочетание с хлорамфениколом приводит к повышению токсических свойств последнего. Усиливает действие антикоагулянтов непрямого действия и снижает эффективность урикозурических препаратов.

Особые указания и меры предосторожности:

Следует избегать одновременного применения парацетамола с другими парацетамолсодержащими препаратами, поскольку это может вызвать передозировку парацетамола. При применении препарата более 5-7 дней следует контролировать показатели периферической крови и функциональное состояние печени. Парацетамол искажает результаты лабораторных исследований содержания глюкозы и мочевой кислоты в плазме крови.

Условия хранения:

Таблетки и суппозитории следует хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 15°С.

Сироп следует хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°С.

Срок годности:

Таблетки, сироп - 3 года. Суппозитории - 2 года.

Условия отпуска в аптеке:

Без рецепта.

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