

АЛГОРЕНС

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

Торговое название: Алгоренс.

Международное непатентованное наименование: парацетамол.

Лекарственная форма: раствор для инфузий.

Состав: каждые 100 мл содержит:

Парацетамол ВР 1000 мг;

Вода для инъекций ВР q.s.

Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее ненаркотическое средство.

Код АТХ: N02BE01.

Фармакологическое действие:

Фармакодинамика:

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 практическое полное отсутствие противовоспалительного эффекта.

Отсутствие блокирующего влияния на синтез Pg в периферических тканях обуславливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка Na⁺ и воды) и слизистую оболочку ЖКТ.

Фармакокинетика:

Всасывание и распределение:

Стаж в плазме крови достигается через 15 мин и составляет 15-30 мкг/мл. V_d составляет 1 л/кг. Проникает через гематоэнцефалический барьер. Парацетамол слабо связывается с белками плазмы.

Метаболизм и выведение:

Парацетамол биотрансформируется в печени с образованием глюкуроноидов и сульфатов, при этом небольшая часть (около 4%) метаболизируется с участием изоферментов системы цитохрома P450 с образованием промежуточного метаболита (N-ацетилбензохинонимина), который в нормальных условиях быстро обезвреживается восстановленным глутатионом и выводится с мочой после связывания с цистеином и меркаптопуриновой кислотой. Однако при массивной интоксикации количество этого токсичного метаболита возрастает.

T_{1/2} составляет 2,7 ч, общий клиренс 18 л/ч.

Парацетамол выводится главным образом с мочой; при этом 90% принятой дозы выводится почками в течение 24 ч в основном в виде глюкуронида (60-80%) и сульфата (20-30%), менее 5% выводится в неизменном виде.

Фармакокинетика в особых клинических случаях:

T_{1/2} у детей – 1,5-2 ч, у новорожденных – 3-5 ч.

При выраженной почечной недостаточности (КК 10-30 мл/мин) выведение парацетамола несколько замедляется, а T_{1/2} составляет 2-5,3 ч. Скорость выведения глюкуронида и сульфата у пациентов с выраженной почечной недостаточностью в 3 раза ниже, чем у здоровых пациентов.

Показания к применению:

— болевой синдром умеренной интенсивности, особенно после хирургических вмешательств;

— лихорадочный синдром на фоне инфекционно-воспалительных заболеваний.

Препарат показан для быстрого снятия боли и лихорадочного синдрома (в т.ч. при невозможности приема парацетамола внутрь).

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к парацетамолу или пропарацетамолу гидрохлориду (пролекарство парацетамола) или любому другому компоненту препарата;

— выраженные нарушения функции печени;

— детский возраст до 1 года.

С *осторожностью* препарат назначают при почечной недостаточности тяжелой степени (КК менее 30 мл/мин), доброкачественной гипербилирубинемии (в т.ч. при синдроме Жильбера), при вирусном гепатите, больным хроническим алкоголизмом (в т.ч. при алкогольном поражении печени), лицам пожилого возраста, при дефиците глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы.

Способ применения и дозы:

Препарат применяют в виде в/в инфузии в течение 15 мин.

Подросткам старше 12 лет и взрослым с массой тела от 35 до 50 кг лекарство назначают из расчета 15 мг/кг парацетамола на введение (т.е. 1,5 мл раствора на 1 кг массы тела). Максимальная суточная доза не должна превышать 60 мг/кг.

Подросткам старше 12 лет и взрослым с массой тела более 50 кг максимальная разовая доза составляет 1 г парацетамола, т.е. 1 флакон (100 мл). Максимальная суточная доза - 4 г.

Минимальный интервал между введениями должен составлять 4 ч.

У пациентов с нарушениями функции печени или почек, с синдромом Жильбера и у лиц пожилого возраста интервал между введениями препарата должен составлять не менее 8 ч и суточная доза должна быть уменьшена.

Препарат, содержащийся в открытом и в неиспользованном полностью флаконе, должен быть уничтожен. Допускается дополнительное разведение препарата 0,9% раствором натрия хлорида максимально в десять раз. Приготовленный таким образом раствор следует использовать в течение 1 ч после его приготовления (включая время инфузии).

Побочные эффекты:

Классификация частоты развития побочных эффектов, рекомендуемая Всемирной организацией здравоохранения (ВОЗ):

очень часто ≥ 1/10; *часто* от ≥ 1/100 до < 1/10; *нечасто* от ≥ 1/1000 до < 1/100; *редко* от ≥ 1/10000 до < 1/1000; *очень редко* < 1/10000; *частота неизвестна* не может быть оценена на основе имеющихся данных.

Со стороны кожных покровов: Очень редко: покраснение кожи, зуд, сыпь на коже и слизистых (обычно эритематозная или уртикарная).

Со стороны печени и желчевыводящих путей: Редко: повышение активности "печеночных" ферментов, как правило, без развития желтухи.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: Редко: понижение артериального давления; Очень редко: тахикардия.

Со стороны органов кроветворения: Очень редко: тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения.

Общего характера: Редко: недомогание.

Указанные ниже побочные эффекты также отмечались при пострегистрационном применении препарата, однако их частота не установлена:

Аллергические реакции: реакции гиперчувствительности, анафилактический шок, анафилаксия, отек Квинке.

Со стороны кожных покровов: острый генерализованный экзантематозный пустилез (AGEP), синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз.

Со стороны печени и желчевыводящих путей: молниеносный гепатит, некроз печени, печеночная недостаточность, повышение активности "печеночных" ферментов.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота.

Местные реакции: болезненность и чувство жжения в месте введения препарата.

Если любые из указанных в инструкции побочных эффектов усугубляются, или Вы заметили любые другие побочные эффекты, не указанные в инструкции, сообщите об этом врачу.

Передозировка:

Клиническая картина острой передозировки развивается в первые 24 ч после приема парацетамола в высокой дозе. Симптомы хронической передозировки проявляются через 2-4 суток после повышения дозы препарата.

Симптомы острой передозировки: диарея, снижение аппетита, тошнота, рвота, дискомфорт и/или боль в животе, бледность кожных покровов. При одномоментном введении парацетамола взрослым в дозе 7,5 г и более, а детям - более 140 мг/кг возникает цитолиз гепатоцитов с полным и необратимым некрозом печени, развитием печеночной недостаточности, метаболического ацидоза и энцефалопатии, которые могут привести к коме и летальному исходу. Через 12,8 ч после введения парацетамола отмечается повышение активности печеночных трансаминаз, ЛДГ и уровня билирубина и снижение уровня протромбина.

Симптомы хронической передозировки: развивается гепатотоксический эффект, характеризующийся общими симптомами (боль, слабость, адинамия, повышенное потоотделение) и специфическими, характеризующими поражение печени. В результате может развиваться гепатонекроз. Гепатотоксический эффект парацетамола может осложняться развитием печеночной энцефалопатии (нарушения мышления, угнетение ЦНС, агитация и ступор), возникновением судорог, угнетением дыхания, комой, отеком мозга, нарушением свертываемости крови, развитием ДВС-синдрома, гипогликемией, метаболическим ацидозом, аритмией, коллапсом. Редко нарушение функции печени развивается молниеносно и может осложняться почечной недостаточностью (тубулярный некроз).

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 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 часа. 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:

Пробенецид почти в два раза снижает клиренс парацетамола, ингибируя процесс его конъюгации с глюкуроновой кислотой. При одновременном применении следует рассмотреть вопрос о снижении дозы парацетамола.

Индукторы микросомальных ферментов печени (например, этанол, барбитураты, изониазид, рифампицин, антикоагулянты, зидовудин, амоксициллин + клавулановая кислота, фенитоин) увеличивают продукцию гидроксильрованных активных метаболитов, что обуславливает возможность развития тяжелых интоксикаций при небольших передозировках.

Фенитоин снижает эффективность парацетамола и увеличивает риск развития гепатотоксичности. Пациентам, принимающим фенитоин, следует избегать применения парацетамола в высоких дозах и/или в течение длительного времени.

Необходимо контролировать состояние таких пациентов на предмет развития признаков гепатотоксичности.

Этанол способствует развитию острого панкреатита.

Ингибиторы микросомальных ферментов печени (в т.ч. циметидин) снижают риск гепатотоксического действия.

Длительное применение барбитуратов снижает эффективность парацетамола.

Длительное совместное 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 кумаринов, включая варфарин, 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 очень серьезных поражений печени возрастает при превышении рекомендованных доз (в том числе при одновременном применении препарата Алгоренс и других препаратов, содержащих парацетамол и пропарацетамол), а также у пациентов с хроническим алкоголизмом. Клинические симптомы и признаки поражения печени (включая молниеносный гепатит, печеночная недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит) обычно наблюдаются через 2 дня после приема препарата и достигают максимума, обычно, через 4-6 дней.

При приеме препарата Алгоренс могут развиваться серьезные кожные реакции, такие как острый генерализованный экзантематозный пустилез (AGEP), синдром Стивенса-Джонсона, токсический эпидермальный некролиз, которые могут приводить к летальному исходу. Пациенты должны быть проинформированы о признаках серьезных кожных реакций.

Прием препарата должен быть прекращен при первых проявлениях кожных реакций или любых иных признаках гиперчувствительности.

Во избежание риска передозировки не рекомендовать одновременный прием препарата Алгоренс и других препаратов, содержащих парацетамол или пропарацетамол (как отпускаемых по рецепту врача, так и безрецептурных).

Искажает результаты количественного определения содержания мочевой кислоты в плазме.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами:

Парацетамол не влияет на способность управлять транспортными средствами механизмами, требующими повышенной концентрации внимания.

Форма выпуска:

Раствор для инфузии 100 мл в пластиковом флаконе. 1 флакон в картонной упаковке вместе с инструкцией по применению.

Условия хранения:

Хранить в сухом, защищенном от света месте, при температуре не выше 25°С. Хранить в недоступном для детей месте. Не замораживать.

Срок годности:

Указано на упаковке. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска:

По рецепту врача.



Произведено для:
BELINDA Laboratories
Лондон, Великобритания
Производитель:
Абарис Хелскеа Пвт. Лтд.,
Индия