Состав

действующее вещество: парацетамол;

1 мл раствора содержит парацетамола 10 мг;

вспомогательные вещества: кислота лимонная моногидрат, натрия; сорбит (Е 420) натрия сульфит безводный (Е 221) вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инфузий.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный или слегка желтоватый раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Анальгетики и антипиретики. Код АТХ N02B E01.

Фармакодинамика

Взрослые

Инфулган (парацетамол) оказывает болеутоляющее и жаропонижающее действие. Парацетамол блокирует циклооксигеназу (ЦОГ) I и II только в центральной нервной системе, воздействуя на центры боли и терморегуляции. В воспаленных тканях клеточные пероксидазы нейтрализуют влияние парацетамола на ЦОГ, что объясняет практически полное отсутствие противовоспалительного эффекта. Отсутствие влияния на синтез простагландинов в периферических тканях обусловливает отсутствие у препарата отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды) и слизистую пищеварительного тракта.

Фармакокинетика

Инфулган обеспечивает облегчение боли через 5-10 минут после введения. Пик обезболивающего эффекта достигается в течение 1 часа, а продолжительность этого эффекта, как правило, составляет 4-6 часов.

Инфулган снижает температуру тела в течение 30 минут после введения, жаропонижающий эффект продолжается в течение не менее 6 часов.

Всасывание

После однократного применения до 2 г препарата и после повторного применения в течение 24 часов фармакокинетика парацетамола линейная.

Биодоступность после инфузии 500 мг и 1 г парацетамола такая же, как и после введения 1 г и 2 г пропацетамолу (содержащий 500 мг и 1 г парацетамола соответственно). Максимальная концентрация (Cmax) в плазме крови достигается в конце инфузии продолжительностью 15 минут 500 мг или 1 г парацетамола и составляет 15 мкг / мл или 30 мкг / мл соответственно.

Распределение

Объем распределения парацетамола составляет около 1 л / кг. Парацетамол слабо связывается с белками плазмы крови. После введения 1 г парацетамола значительный уровень концентрации (около 1,5 мкг / мл) был установлен в спинномозговой жидкости через 20 минут после инфузии.

Метаболизм

Парацетамол в значительной степени метаболизируется в печени, проходя два основных пути: конъюгация глюкуроновой кислоты и конъюгация серной кислоты. Последний путь быстро насыщается при дозах, превышающих терапевтические. Незначительная часть (менее 4%) метаболизируется цитохромом P450 с образованием промежуточного метаболита (N-ацетилбензохинонимину), который в нормальных условиях быстро нейтрализуется восстановленным глютатионом и выводится с мочой после связывания с цистеином и меркаптопуриновою кислотой. Однако при массивном отравлении количество этого токсичного метаболита возрастает.

Выведение

Метаболиты парацетамола выводятся главным образом с мочой. 90% принятой дозы выводится в течение 24 часов, преимущественно в виде глюкуронида (60-80%) и сульфата (20-30%). Менее 5% выводится в неизмененном виде. Период полувыведения составляет 2,7 часа, общий клиренс - 18 л / час.

Дети

Фармакокинетика парацетамола у детей практически не отличается от таковой у взрослых, за исключением короткого периода полувыведения крови (1,5-2 часа). У новорожденных период полувыведения длиннее, чем у младенцев - около 3,5 часа. По сравнению со взрослыми у детей до 10 лет существенно снижена конъюгация с глюкуроновой кислотой и повышенная - с сульфатами.

Таблица 1

Фармакокинетические величины в соответствии с возрастом (стандартизованый клиренс, * $CL_{std}/F_{перорал}$.(л.час$^{-1}$ 70 кг$^{-1}$))

Возраст	Масса тела (кг)	$CL_{std}/F_{пер}$ (л.час$^{-1}$ 70
40 недель возраста после зачатия	3,3	5,9
3 месяца постнатального возраста	6	8,8
6 месяцев постнатального возраста	7,5	11,1
1 год постнатального возраста	10	13,6
2 года постнатального возраста	12	15,6
5 лет постнатального возраста	20	16,3
8 лет постнатального возраста	25	16,3

*CL_{std} - оценка группы пациентов по CL (клиренса).

Особые группы пациентов

Пациенты с почечной недостаточностью

При тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина 10-30 мл / мин) выведение парацета-молла несколько замедленное, а период полувыведения составляет от 2 до 5,3 часа. Скорость вывода глюкуронидов и сульфатов у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью втрое медленнее, чем у здоровых добровольцев. Таким образом, пациентам с тяжелой почечной недостаточностью (клиренс креатинина ≤ 30 мл / мин) минимальный интервал между вводами следует увеличить до 6 часов.

Пожилые пациенты

Фармакокинетика и метаболизм парацетамола у пациентов пожилого возраста не изменены. Корректировка дозы не требуется.

Показания

Кратковременное лечение болевого синдрома средней интенсивности, особенно в послеоперационный период, и кратковременное лечение гипертермических реакций, когда внутривенное применение клинически обоснованным или другие способы применения неприемлемы.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к парацетамолу, пропацетамолу гидрохлорида (предшественнику парацетамола) или другим компонентам препарата. Тяжелая гепатоцеллюлярная недостаточность.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Пробенецид вдвое снижает клиренс парацетамола путем блокирования его связывания с глюкуроновой кислотой, поэтому при комбинированной терапии с пробенецидом дозу парацетамола нужно снизить.

Салицилаты могут увеличивать период полувыведения парацетамола из организма.

Индукторы микросомального окисления в печени (фенитоин, этанол, барбитураты, рифампицин, фенилбутазон, трициклические антидепрессанты) могут способствовать развитию тяжелых интоксикаций даже при небольшой передозировке.

Одновременное применение парацетамола (4 г в сутки в течение не менее 4 суток) с пероральными антикоагулянтами может привести к незначительным изменениям международного нормализованного отношения (МНО). В этом случае следует контролировать МНО во время лечения и в течение 1 недели после завершения лечения Инфулганом.

Особенности применения

Риск развития повреждений печени при лечении Инфулганом возрастает у больных с алкогольным гепатозом.

Применение Инфулган может негативно влиять на результаты лабораторных исследований при количественном определении содержания глюкозы и мочевой кислоты в плазме крови.

Во время длительного лечения необходим контроль картины периферической крови и функционального состояния печени.

Необходимо избегать ошибок в дозировке из-за путаницы между миллиграммами (мг) и миллилитрами (мл), что может привести к случайной передозировки и смерти.

Рекомендуется использовать пероральный парацетамол, если возможен такой способ применения.

Во избежание риска передозировки необходимо быть уверенным в том, что другие предназначены лекарственные средства не содержат парацетамол или пропацетамол.

Риск поражения печени возрастает при назначении Инфулган в дозах, превышающих рекомендованных. Клинические симптомы повреждения печени (в том числе молниеносный гепатит, печеночная недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит), как правило, впервые наблюдаются через два дня после применения препарата с достижением пика через 4-6 дней. Применение антидота должно быть назначено как можно быстрее.

С осторожностью применяют препарат при наличии у пациента:

- гепатоцеллюлярной недостаточности
- тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 30 мл / мин);
- хронического алкоголизма;
- алиментарного истощения (снижение резерва глютатиона в печени)
- обезвоживания.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

Не влияет.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Клинический опыт введения парацетамола ограничен. Однако эпидемиологические данные по терапевтических доз приема парацетамола указывают на отсутствие негативного влияния на беременность или на здоровье плода / новорожденного.

Проспективные данные о передозировке во время беременности не указывают на повышение риска пороков развития.

Репродуктивные исследования внутривенной формы парацетамола на животных не проводились. Исследование приема способа применения не продемонстрировали фетотоксического эффектов.

Однако Инфулган во время беременности следует применять только после тщательной оценки соотношения польза / риск, а при расчете дозировки и длительности лечения следует точно соблюдать инструкции.

Кормление грудью

После приема внутрь парацетамол выводится в грудное молоко в небольших количествах. Не было отмечено никаких побочных эффектов у детей при применении парацетамола в период кормления грудью.

Способ применения и дозы

Инфулган применяют внутривенно.

Для взрослых, подростков и детей с массой тела более 33 кг применяют раствор в бутылках по 100 мл.

Для детей с массой тела менее 33 кг применяют раствор в бутылках по 20 мл и 50 мл.

Дозировка зависит от массы тела пациента.

Таблица 2

Масса тела пациента	Одноразовая доза	Объем на один прием	Максимальный объем Инфулган (10 мг / мл) в один прием в соответствии с верхних границ массы тела для группы (мл) **	Максим суточн
≤ 10 кг *	7,5 мг/кг	0,75 мл/кг	7,5 мл	30 мг/к

> 10 кг – ≤ 33кг	15 мг/кг	1,5 мл/кг	49,5 мл	60 мг/к 2 г
> 33 кг – ≤ 50кг	15 мг/кг	1,5 мл/кг	75 мл	60 мг/к 3 г
> 50 кг, при наличии факторов риска развития гепатотоксичности	1 г	100 мл	100 мл	3 г
> 50 кг, при отсутствии факторов риска развития гепатотоксичности	1 г	100 мл	100 мл	4 г

* Недоношенные новорожденные: данные о безопасности и эффективности для недоношенных новорожденных отсутствуют.

** Пациенты с более низкой массой тела требуют меньших объемов.

Минимальный интервал между приемами должен составлять 4 часа. Курс лечения обычно не превышает 4 инфузий в течение суток.

Минимальный интервал между приемами у пациентов с почечной недостаточностью тяжелой степени должен составлять не менее 6 часов.

*** Максимальная суточная доза максимальная суточная доза предназначена для пациентов, не получающих другие лекарственные средства, содержащие парацетамол, и должно быть соответствующим образом скорректирована в случае приема таких препаратов.

Пациенты с почечной недостаточностью тяжелой степени

Назначая парацетамол пациентам с почечной недостаточностью тяжелой степени (клиренс креатинина ≤ 30 мл / мин), рекомендуется увеличить минимальный интервал между приемами до 6 часов.

Пациенты с гепатоцеллюлярной недостаточностью, хроническим алкоголизмом, пациенты, хронически недоедают (низкие запасы печеночного глутатиона), пациенты с дегидратацией

Максимальная суточная доза не должна превышать 3 г.

Раствор парацетамола применяется в виде 15-минутной инфузии.

Пациенты с массой тела ≤ 10 кг

Бутылку с Инфулганом не подвешивать для инфузии через небольшой объем лекарственного средства, необходимо применить.
Необходимый объем препарата набирают из бутылки с помощью шприца и применяют неразбавленным или разводят в 0,9% растворе натрия хлорида или 5% растворе глюкозы в соотношении одна часть препарата до девяти частей раствора для разведения и вводят пациенту в течение 15 минут.

Нужно использовать разбавленный раствор в течение 1 часа после его приготовления (включая время проведения инфузии).

Шприц 5 или 10 мл следует применять для измерения необходимой дозы в соответствии с массой ребенка. Однако эта доза не должна превышать 7,5 мл. Обязательно следуйте рекомендациям по дозировке.

Дети

Применяют с первых дней жизни. Не применяется недоношенным новорожденным.

Передозировка

Риск поражения печени (включая молниеносный гепатит, печеночную недостаточность, холестатический гепатит, цитолитический гепатит) возрастает у лиц пожилого возраста, маленьких детей, пациентов с заболеванием печени, в случаях хронического алкоголизма, при наличии алиментарной дистрофии и у лиц со сниженной ферментативной активностью. В указанных случаях передозировки может быть летальным.

Симптомы появляются в течение первых 24 часов и проявляются тошнотой, рвотой, анорексией, бледностью, болями в животе.

Передозировка у взрослых может быть при однократном введении в дозе 7,5 г и более, у детей - в дозе 140 мг / кг массы тела. При этом развивается цитолиз печени, печеночная недостаточность, метаболический ацидоз, энцефалопатия,

что может привести к коме и смерти пациента. В течение 12-48 часов возрастает уровень печеночных трансаминаз (аланинаминотранс-феразы, аспартатаминотрансферазы), лактатдегидрогеназы, билирубина и уменьшается уровень протромбина.

Клинические симптомы повреждения печени проявляются через двое суток и достигают максимума через 4-6 дней.

Неотложные меры:

- немедленная госпитализация;
- определение концентрации парацетамола в плазме крови как можно скорее после передозировки до начала лечения;
- внутривенное или пероральное применение антидота, N-ацетилцистеина (NAC), по возможности, не позднее чем через 10 часов после передозировки. NAC можно применять и позже, чем через 10 часов после передозировки, однако лечение должно длиться дольше;
- симптоматическое лечение.

Перед началом лечения необходимо провести печеночные пробы и повторять их каждые 24 часа. В большинстве случаев уровни печеночных трансаминаз возвращаются к нормальным показателям за одну-две недели с полным восстановлением функции печени. В отдельных случаях может потребоваться трансплантация печени.

Побочные реакции

Как и в случае применения других средств, содержащих парацетамол, побочные реакции возникали редко (> 1/10000 - <1/1000) или очень редко (<1/10000), см. табл. 3.

Таблица 3

Системы органов	Редко	Очень Редко
Общие расстройства	недомогание	Рреакции гиперчувствительности

Кардиальные нарушения	артериальная гипотензия	
Нарушения со стороны гепатобилиарной системы	Рост уровня печеночных трансаминаз	
Со стороны системы крови и лимфатической системы		Тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения

В клинических исследованиях сообщалось о частых побочных реакций у пациентов в месте введения (боль и жжение).

Очень редко наблюдались реакции повышенной чувствительности: от простого сыпи или крапивницы до анафилактического шока, что требовало прекращения лечения.

Также сообщалось о случаях эритемы, покраснение, зуд и тахикардии.

Срок годности

2 года. Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в недоступном для детей месте.

Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 ° С. Не замораживать.

Упаковка

По 20 мл в бутылке. По 1 бутылке в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ООО «Юрия-Фарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 18030, Черкасская обл., г. Черкассы, ул. Кобзарская, 108.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — Государственного реестра лекарственных средств Украины.