

## **Состав**

*действующее вещество:* парацетамол;

1 суппозиторий ректальный содержит 80 мг парацетамола;

*вспомогательные вещества:* твердый жир.

## **Лекарственная форма**

Суппозитории ректальные.

*Основные физико-химические свойства:* белые гладкие и глянцевые суппозитории.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Анальгетики и антипиретики. Код АТХ N02B E01.

## **Фармакодинамика**

Оказывает анальгезирующее, жаропонижающее и слабое противовоспалительное действие. Механизм действия обусловлен угнетением синтеза простагландинов и преимущественным влиянием на центр терморегуляции в гипоталамусе.

## **Фармакокинетика**

Всасывания парацетамола при ректальном введении более медленным, чем при пероральном применении, однако оно является более полным. Максимальная концентрация в плазме крови достигается в течение 2-3 часов после введения.

Парацетамол быстро распределяется во всех тканях. Концентрации в крови, слюне и плазме сопоставимы между собой. Связывание с белками плазмы слабое.

Парацетамол метаболизируется в печени с образованием неактивных соединений с глюкуроновой кислотой и сульфатами.

Минимальный путь метаболизма, катализируемой цитохромом P450, приводит к образованию промежуточного реагента (N-ацетилбензохинонимину), который при нормальном применении быстро детоксифицируется восстановленного глутатиона и выводится с мочой после конъюгации с цистеином и

меркаптопуриновой кислотой. Однако при массивном отравлении количество этого токсичного метаболита повышается.

Выводится в основном с мочой. 90% принятой дозы парацетамола выводится почками в течение 24 часов, в основном в форме конъюгатов с глюкуроновой кислотой (от 60 до 80%) и сульфатных конъюгатов (от 20 до 30%).

Менее 5% вещества выводится в неизмененном виде.

Период полувыведения составляет от 4 до 5 часов.

При серьезной почечной недостаточности (клиренс креатинина ниже 10 мл/мин) выведение парацетамола и его метаболитов замедляется.

### **Показания**

Симптоматическое лечение заболеваний, сопровождающихся болью слабой и умеренной интенсивности и/или повышением температуры тела.

### **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к парацетамолу или другим компонентам препарата.

Возраст до 1 месяца (масса тела ребенка до 4 кг).

Тяжелые нарушения функции почек и/или печени, гепатоцеллюлярная недостаточность, врожденная гипербилирубинемия, дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, алкоголизм, заболевания крови, выраженная анемия, лейкопения.

Воспаление слизистой оболочки прямой кишки и нарушение функции ануса, ректальное кровотечение.

Не использовать при диарее.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

При приеме максимальных доз парацетамола (4 г/сут) в течение как минимум 4 дней существует риск усиления эффекта перорального антикоагулянта и повышенный риск кровотечения. Следует контролировать МНО (международное нормализованное отношение) через равные промежутки времени. При необходимости дозу приема антикоагулянта следует откорректировать во время

лечения парацетамолом.

Скорость всасывания парацетамола может увеличиваться метоклопрамидом и домперидоном и уменьшаться холестирамином. Барбитураты уменьшают жаропонижающий эффект парацетамола. Противосудорожные препараты (включая фенитоин, барбитураты, карбамазепин), которые стимулируют активность микросомальных ферментов печени, могут усиливать токсическое воздействие парацетамола на печень вследствие повышения степени превращения препарата на гепатотоксические метаболиты. При одновременном применении парацетамола с гепатотоксическими средствами увеличивается гепатотоксическое влияние препарата на печень. Одновременное применение высоких доз парацетамола с изониазидом, рифампицином повышает риск развития гепатотоксического синдрома. Парацетамол снижает эффективность диуретиков. Не применять одновременно с алкоголем.

Высокие концентрации парацетамола могут влиять на лабораторные результаты определения глюкозы в крови оксидазы-пероксидазной методикой, мочевой кислоты при использовании метода с фосфорновольфрамовой кислотой.

### **Особенности применения**

Для детей с массой тела менее 37 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 80 мг/кг/сутки.

Для детей с массой тела от 38 кг до 50 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 3 г/сут.

Для детей с массой тела более 50 кг максимальная суточная доза парацетамола не должна превышать 4 г/сут.

При применении суппозиторий существует риск явлений местной токсичности, частота и интенсивность проявлений токсичности возрастает при длительном применении, в случае коротких интервалов между приемами и в случае увеличения дозы.

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

Препарат в данной лекарственной форме применяют только детям.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

Препарат в данной лекарственной форме применяют только детям.

Значительное количество данных о беременных женщин не указывает ни на пороки развития, ни на фето-/неонатальной токсичности. Эпидемиологические исследования развития нервной системы у детей, подвергшихся воздействию парацетамола в утробе матери, показывают неубедительные результаты. При клинической необходимости парацетамол можно применять во время беременности в низкой эффективной дозе в течение короткого срока и с наименьшей возможной частотой.

Традиционные исследования с использованием принятых в настоящее время стандартов для оценки токсичности для размножения и развития отсутствуют.

### **Способ применения и дозы**

Препарат следует применять под наблюдением врача, с особой осторожностью - детям в возрасте до 1 года.

Применять ректально.

Суппозитории не подлежат делению для получения необходимой дозировки. Если при проведении расчетов суточной дозы в соответствии с массой тела ребенка необходимо разовое дозировки, меньше содержимого одного суппозитория, то после консультации с врачом рекомендуется применять другие лекарственные формы парацетамола (например раствор оральный).

При лечении детей следует соблюдать режим расчета дозы в соответствии с массой тела ребенка и в зависимости от этого выбирать приемлемую лекарственную форму.

Примерный возраст детей, исходя из массы тела, приведены только как рекомендация.

Эфералган, суппозитории ректальные по 80 мг, предназначенный для детей с массой тела от 4 до 6 кг (в возрасте примерно от 1 до 4 месяцев). От 3 до 4 суппозитория в сутки с интервалом между приемами 6 часов, в зависимости от массы тела ребенка, из расчета 60 мг/кг/сут.

Образец расчета, когда масса тела ребенка - 4 кг:

4 кг x 60 мг  
----- = 3 (до трех суппозитория в сутки),  
80 мг

где:

60 мг - суточная доза парацетамола на 1 кг массы тела в сутки,

80 мг - количество парацетамола в одном суппозитории.

Рекомендуемая суточная доза парацетамола составляет около 60 мг/кг/сутки, которую следует разделить на 4 приема, то есть 15 мг/кг массы тела каждые 6 часов. При выраженной почечной недостаточности (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) интервал между приемами должен составлять не менее 8 часов.

Применение предусматривает введение ректально одного суппозитория, которое повторяют при необходимости с интервалом не менее 6 часов, но не более суточную дозу и количество 4 суппозитория в сутки.

Из-за риска местной токсичности не рекомендуется применение суппозитория более 4 раз в сутки, а продолжительность применения при ректальном способе введения должно быть малейшей.

## **Дети**

При лечении детей следует придерживаться режима дозирования в соответствии с массой тела ребенка и в зависимости от этого выбирать соответствующую лекарственную форму.

Эфералган, суппозитории ректальные по 80 мг, предназначенный для детей с массой тела от 4 до 6 кг (в возрасте примерно от 1 месяца до 4 месяцев).

## **Передозировка**

Чтобы избежать передозировки, не следует применять другие лекарственные средства, содержащие парацетамол.

Существует риск передозировки у маленьких детей (распространены медикаментозное передозировки и случайное отравление). Это может привести к летальному исходу.

Однократный прием в дозе 150 мг/кг массы тела может привести к гепатоцеллюлярную недостаточность, нарушения метаболизма глюкозы, метаболический ацидоз, кровоизлияния, гипогликемию, энцефалопатию, кому и привести к летальному исходу. При этом возрастает уровень печеночной трансаминазы, лактатдегидрогеназы и билирубина, в течение 12-48 часов снижается уровень протромбина. Острая почечная недостаточность с острым некрозом канальцев может проявляться сильной болью в области поясницы, гематурией, протеинурией и развиться даже при отсутствии тяжелого поражения печени. Отмечались также сердечная аритмия и панкреатит. При длительном применении препарата в больших дозах со стороны органов

кроветворения может развиваться апластическая анемия, панцитопения, агранулоцитоз, нейтропения, лейкопения, тромбоцитопения. При приеме больших доз со стороны ЦНС - головокружение, психомоторное возбуждение и нарушение ориентации; со стороны мочевыделительной системы - нефротоксичность (почечная колика, интерстициальный нефрит, папиллярный некроз) Со стороны пищеварительной системы - гепатонекроз. У пациентов с факторами риска (длительный прием карбамазепина, фенобарбитал, фенитоин, примидона, рифампицина, зверобоя или других препаратов, индуцируют печеночные ферменты, злоупотребление алкоголем, недостаточность глутатионовой системы, например неправильное питание, СПИД, голодание, муковисцидоз, кахексия) применение 5 г или более парацетамола может привести к поражению печени. Поражение печени может проявиться через 12-48 часов после передозировки. При передозировке пациента следует немедленно доставить в больницу, даже если отсутствуют ранние симптомы передозировки. Симптомы передозировки появляются в течение первых 24 часов: тошнота, рвота, снижение аппетита, бледность, боль в животе - и могут не отражать тяжести передозировки или риска поражения. Неотложные меры:

- немедленная госпитализация;
- определение уровня парацетамола в плазме крови;
- промывание желудка;
- введение антидота N-ацетилцистеина или метионина перорально в течение первых 10 часов;
- симптоматическая терапия.

## **Побочные реакции**

Очень редко:

*аллергические реакции:* анафилаксия, анафилактический шок, отек Квинке, эритема, крапивница, кожный зуд, сыпь на коже и слизистых оболочках, мультиформная экссудативная эритема, токсический эпидермальный некролиз

*со стороны органов кроветворения:* анемия, сульфгемоглобинемия и метгемоглобинемия (цианоз, одышка, боли в сердце), гемолитическая анемия, тромбоцитопения, лейкопения и нейтропения;

*со стороны дыхательной системы:* бронхоспазм у пациентов, чувствительных к аспирину и другим НПВП

*со стороны пищеварительной системы:* тошнота, боль в эпигастрии, нарушение функции печени, повышение активности печеночных ферментов, как правило, без развития желтухи, гепатонекроз (дозозависимый эффект)

*со стороны эндокринной системы:* гипогликемия, вплоть до гипогликемической комы.

Связанные с лекарственной форме: раздражение прямой кишки и анального отверстия.

При возникновении каких-либо нежелательных реакций следует прекратить применение препарата и обязательно обратиться к врачу.

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 30 °С в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

По 5 суппозиторияев в блистере, по 2 блистера в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

Без рецепта.

### **Производитель**

УПСА САС, Франция / UPSA SAS, France.

### **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

304, авеню Доктора Жана Брю, 47000 м. Ажан, Франция / 304, avenue du Docteur Jean Bru, 47000 Agen, France.

979, авеню де пирен, 47520 м. Ле Пассаж, Франция / 979, avenue des Pyrenees, 47520 Le Passage, France.

### **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).