

## **Состав**

*действующее вещество:* парацетамол;

100 мл раствора содержат парацетамола 1000 мг;

*вспомогательные вещества:* маннит (Е 421) натрия фосфат, дигидрат; вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Раствор для инфузий.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный, от бесцветного до бледно-желтого цвета раствор.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Анальгетики и антипиретики. Код АТХ N02B E01.

## **Фармакодинамика**

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 обуславливает отсутствие у него отрицательного влияния на водно-солевой обмен (задержка натрия и воды).

## **Фармакокинетика**

Максимальная концентрация в плазме крови достигается через 15 мин; максимальная концентрация - 15-30 мкг / мл. Объем распределения составляет 1 л / кг. Парацетамол слабо связывается с белками плазмы. Проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизируется в печени с образованием глюкуронидов и сульфатов. Небольшая часть (4%) метаболизируется цитохромом P450 с образованием промежуточного метаболита (N-ацетилбензохинонимину), что в нормальных условиях быстро обезвреживается восстановленным глутатионом и выводится с мочой после связывания с цистеином и меркаптопуриновой кислотой. Однако

при массивном отравлении количество этого токсичного метаболита возрастает. Период полувыведения у взрослых - 2,7 часа, у детей - 1,5-2 часа, общий клиренс - 18 л / час. Парацетамол выводится с мочой; 90% принятой дозы выводится почками в течение 24 часов, в основном в виде глюкуронида (60-80%) и сульфата (20-30%). Менее 5% выводится в неизмененном виде. При тяжелой почечной недостаточности (клиренс креатинина ниже 10-30 мл / мин) выведение парацетамола несколько замедляется, а период полувыведения составляет 2-5,3 часа. Скорость вывода глюкуронида и сульфата у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью в 3 раза меньше, чем у здоровых добровольцев.

Фармакокинетика у детей почти не отличается от таковой у взрослых, за исключением короткого периода полувыведения крови (1,5-2 часа). В возрасте до 10 лет существенно снижена конъюгация с глюкуроновой кислотой и более повышена с сульфатами сравнению со взрослыми.

Фармакокинетические показатели у детей, связанные с возрастом (стандартизированный клиренс,  $*CL_{std}/F_{oral}$  (l.h<sup>-1</sup> 70 кг<sup>-1</sup>))

Возраст	Масса тела (кг)	$CL_{std}/F_{oral}$ (l.h <sup>-1</sup> 70 кг <sup>-1</sup> )
1 год	10	13,6
2 года	12	15,6
5 лет	20	16,3
8 лет	25	16,3

\* $CL_{std}$  - стандартизированный клиренс;

$F_{oral}$  - биодоступность при пероральном применении.

## Показания

*Взрослые:* кратковременное лечение болевого синдрома средней интенсивности, особенно в послеоперационном периоде, или кратковременное лечение лихорадки, когда необходимо исключительно внутривенный путь введения препарата.

Кратковременное лечение гипертермических реакций.

*Дети:* симптоматическое лечение боли и гипертермии у послеоперационных больных.

## **Противопоказания**

- Повышенная чувствительность к парацетамолу и 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.

*Пероральные антикоагулянты.* Одновременное применение парацетамола (4 г в сутки в течение 4 суток) с пероральными коагулянтами может привести к небольшим вариациям международного нормализованного отношения (МНО). Необходим мониторинг показателей МНО в течение одновременного применения препаратов, а также в течение недели после окончания лечения парацетамолом.

## **Особенности применения**

Во избежание риска возникновения передозировки не применять одновременно с лекарственными средствами, содержащими парацетамол.

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 глутатиона в печени)

- обезвоживания.

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

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

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

*Вспомогательные вещества.* Анапирон содержит менее 1 ммоль (23 мг) / дозу натрия, то есть практически свободный от натрия.

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

Не влияет.

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

Большое количество данных о беременных женщин свидетельствует об отсутствии пороков развития плода или фето / неонатальной токсичности. Эпидемиологические исследования по нейророзвитку у детей, внутриутробно подвергались воздействию парацетамола, показали неубедительные результаты. В случае клинической необходимости, парацетамол можно применять во время беременности однако его следует применять в низкой эффективной дозе, в течение как можно сжатые сроки и с наименьшей возможной частотой.

Парацетамол проникает в небольших количествах в грудное молоко. На время лечения следует прекратить кормление грудью.

### **Способ применения и дозы**

Анапирон применяют для быстрого снятия болевого и / или гипертермического синдрома, когда необходимо исключительно внутривенный путь введения препарата.

Продолжительность инфузии должна составлять 15 мин.

*Взрослые и дети с массой тела 50 кг и более.*

Максимальная разовая доза составляет 1 г парацетамола, то есть 1 контейнер (100 мл). Максимальная суточная доза - 4 г. Для пациентов с дополнительным фактором риска гепатотоксичности максимальная суточная доза составляет 3 г. Интервал между введением препарата должен составлять не менее 4 часов. Обычно применяют от 1 до 4 инфузий в течение первых суток от начала болевого синдрома (послеоперационный период), при необходимости продолжительность лечения можно увеличить, однако она не должна превышать 72 часов (3 суток) и общее количество 12 инфузий.

*Взрослые и дети с массой тела от 33 кг до 50 кг.*

По 15 мг / кг парацетамола на введение, то есть 1,5 мл / кг. Максимальная суточная доза - 60 мг / кг массы тела, но не более 3 г. Минимальный интервал между приемами должен составлять 4 часа. Продолжительность лечения обычно не превышает 4 инфузий в течение суток.

*Дети с массой тела от 10 кг до 33 кг.*

По 15 мг / кг парацетамола на введение, то есть 1,5 мл / кг. Максимальная суточная доза - 60 мг / кг массы тела, но не более 2 г. Минимальный интервал между приемами должен составлять 4 часа. Продолжительность лечения обычно не превышает 4 инфузий в течение суток.

При применении препарата детям перед началом инфузии из контейнера отбирают избыток препарата и оставляют объем раствора соответствует разовой дозе.

Интервал между введением препарата взрослым пациентам с почечной недостаточностью (клиренс креатинина  $\leq$  30 мл / мин) - 6 часов.

Продолжительность лечения не должна превышать 48 часов.

Для взрослых пациентов с гепатоцеллюлярной недостаточностью, хроническим алкоголизмом, хроническим нарушением питания (низким запасом печеночного глутатиона), дегидратацией максимальная суточная доза не должна превышать 3 г.

## **Дети**

Не назначают детям в возрасте до 1 года и с массой тела менее 10 кг.

*Применяют детям в возрасте от 1 года с массой тела более 10 кг только для симптоматического лечения боли и гипертермии у послеоперационных больных.*

## **Передозировка**

Риск токсического действия препарата возрастает у больных пожилого возраста, детей, пациентов с печеночной недостаточностью, в случае хронического алкоголизма, наличия алиментарной дистрофии и у лиц со сниженной ферментативной активностью. В указанных случаях передозировки может представлять угрозу для жизни пациента.

*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 – 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 (АСТ, АЛТ), лактатдегидрогеназы, билирубина и уменьшается уровень протромбина. Клинические симптомы повреждения печени проявляются после двух суток и достигают максимума после 4-6 дней.

*Лечение:* немедленная госпитализация больного. Введение донаторов SH-групп и предшественников синтеза глутатиона-метионина через 8-9 часов после передозировки и N-ацетилцистеина - через 12 часов. Необходимость в проведении дополнительных терапевтических мероприятий (дальнейшее введение метионина, внутривенное введение N-ацетилцистеина) определяется в зависимости от концентрации парацетамола в крови, а также от времени, прошедшего после его приема.

## **Побочные реакции**

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* недомогание, реакции гиперчувствительности, тахикардия.

*Со стороны печени:* повышение уровня печеночных трансаминаз.

*Со стороны крови:* тромбоцитопения, лейкопения, нейтропения.

*Общие:* боль и изжога в месте введения, недомогание, реакции гиперчувствительности, единичные случаи - анафилактический шок.

Сообщалось о единичных случаях возникновения простых или уртикарных высыпаний на коже.

## **Срок годности**

3 года.

**Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке в недоступном для детей месте при температуре не выше 25 ° С.

Неиспользованный препарат, что остается, должен быть уничтожен.

**Упаковка**

По 100 мл препарата в контейнере, по 1 контейнеру в картонной коробке.

**Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Евролайф Хелткеар ПБТ. Лтд. / Eurolife Healthcare Pvt. Ltd.

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

Хашра №520, Бхагванпур, трубку, Харидвар, Индия.

**Источник инструкции**

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