

## **ІНСТРУКЦІЯ для медичного застосування препарату**

### **ЕФЕРАЛГАН**

#### **Склад лікарського засобу:**

*діюча речовина:* парацетамол;

1 супозиторій ректальний містить 80 мг або 150 мг, або 300 мг парацетамолу;

*допоміжні речовини:* твердий жир.

#### **Лікарська форма.** Супозиторії ректальні.

Білі гладкі та глянцеві супозиторії.

#### **Назва і місцезнаходження виробника.**

Брістол – Майєрс Сквібб, Франція/Bristol-Myers Squibb, France.

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

47520 Франція, м. Ле Пасаж, авеню де Пірене, 979/47520 France, Le Passage, avenue des Pyrenees, 979.

#### **Фармакотерапевтична група.** Аналгетики та антипіретики. Код АТС N02B E01.

Чинить аналгетичну, жарознижувальну та слабку протизапальну дію. Механізм дії зумовлений пригніченням синтезу простагландинів та переважним впливом на центр терморегуляції у гіпоталамусі.

Всмоктування парацетамолу при ректальному введенні є більш повільним, ніж при оральному застосуванні, однак воно є більш повним. Пікові концентрації у плазмі крові досягаються протягом 2–3 годин після введення.

Парацетамол швидко розподіляється у всіх тканинах. Концентрації у крові, слині та плазмі є порівнюваними між собою. Зв'язування з білками плазми слабе.

Парацетамол метаболізується переважно у печінці з утворенням неактивних сполук із глюкуроною кислотою та сульфатами.

Мінімальний шлях метаболізму, що каталізується цитохромом P450, призводить до утворення проміжного реагенту (N-ацетилбензохіноніміну), який при нормальному застосуванні швидко детоксифікується відновленим глутатіоном та виводиться у сечу після кон'югації з цистеїном та меркаптопуриною кислотою. Однак при масивному отруєнні кількість цього токсичного метаболіту підвищується.

Виводиться в основному з сечею. 90 % прийнятої дози парацетамолу виводиться нирками протягом 24 годин, в основному у формі глюкуронідних кон'югатів (від 60 % до 80 %) і сульфатних кон'югатів (від 20 % до 30 %).

Менше 5 % речовини виводиться у незміненому вигляді.

Період напіввиведення становить від 4 до 5 годин.

При серйозній нирковій недостатності (кліренс креатиніну нижче 10 мл/хв) виведення парацетамолу та його метаболітів уповільнюється.

#### **Показання для застосування.**

Симптоматичне лікування захворювань, що супроводжуються болем слабкої та помірної інтенсивності та/або підвищенням температури тіла.

#### **Протипоказання.**

Підвищена чутливість до парацетамолу або до інших компонентів препарату.

Дитячий вік до 1 місяця (маса тіла дитини до 4 кг).

Тяжкі порушення функції нирок або/та печінки, вроджена гіпербілірубінемія, дефіцит глюкозо-6-фосфатдегідрогенази, алкоголізм, захворювання крові, виражена анемія, лейкопенія.

Запалення слизової оболонки прямої кишки та порушення функції ануса.

Не застосовувати препарат при діарейі.

### **Належні заходи безпеки при застосуванні.**

Не давати препарат дітям разом з іншими засобами, що містять парацетамол.

При лікуванні парацетамолом у дозі 60 мг/кг/добу супутнє застосування іншого антипіретика виправдане лише у разі неефективності парацетамолу. Не слід перевищувати рекомендованих доз.

Не застосовувати препарат при діарейі.

Якщо гіпертермія продовжується понад 3 доби лікування препаратом або стан здоров'я погіршився, необхідно звернутися до лікаря.

### **Особливі застереження.**

*Застосування у період вагітності або годування груддю.*

Препарат у даній лікарській формі застосовують тільки дітям.

*Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами.*

Препарат у даній лікарській формі застосовують тільки дітям.

### **Діти.**

При лікуванні у дітей слід дотримуватись режиму дозування відповідно до маси тіла дитини, та залежно від цього необхідно вибирати відповідну лікарську форму.

Ефералган, супозиторії ректальні по 80 мг призначений для дітей з масою тіла від 4 до 6 кг (віком приблизно від 1 місяця до 4 місяців).

Ефералган, супозиторії ректальні по 150 мг призначений для дітей з масою тіла від 8 до 12 кг (віком приблизно від 6 місяців до 2 років).

Ефералган, супозиторії ректальні по 300 мг призначений для дітей з масою тіла від 15 до 24 кг (віком приблизно від 4 до 9 років).

### **Спосіб застосування та дози.**

Препарат слід застосовувати під ретельним наглядом лікаря, з особливою обережністю дітям віком до 1 року.

Застосовувати ректально. Супозиторії не підлягають розподілу для отримання необхідного дозування. Якщо при проведенні розрахунків добової дози відповідно до маси тіла дитини необхідне разове дозування менше вмісту одного супозиторія, то після консультації з лікарем рекомендується застосовувати інші лікарські форми парацетамолу (наприклад розчин оральний).

При лікуванні у дітей слід дотримуватись режиму розрахунку дози відповідно до маси тіла дитини, а залежно від цього необхідно вибирати підходящу лікарську форму. Приблизний вік дітей, виходячи з маси тіла, наведено тільки як рекомендація.

Ефералган, супозиторії ректальні по 80 мг призначений для дітей з масою тіла від 4 до 6 кг (віком приблизно від 1 до 4 місяців). Від 3 до 4 супозиторіїв в день з інтервалом між введеннями 6 годин, залежно від маси тіла дитини з розрахунку 60 мг/кг/добу. Зразок розрахунку, коли маса тіла дитини – 4 кг:

$$\frac{4 \text{ кг} \times 60 \text{ мг}}{80 \text{ мг}} = 3 \text{ (до трьох супозиторіїв на добу),}$$

де:

60 мг – добова доза парацетамолу на 1 кг маси тіла дитини на добу,

80 мг – кількість парацетамолу в одному супозиторії.

Ефералган, супозиторії ректальні по 150 мг призначений для дітей з масою тіла від 8 до 12 кг (віком приблизно від 6 місяців до 2 років). Від 3 до 4 супозиторіїв в день з інтервалом між введеннями 6 годин, залежно від маси тіла дитини з розрахунку 60 мг/кг/добу.

Зразок розрахунку, коли маса тіла дитини – 10 кг:

$$\frac{10 \text{ кг} \times 60 \text{ мг}}{150 \text{ мг}} = 4 \text{ (до чотирьох супозиторіїв на добу),}$$

де:

60 мг – добова доза парацетамолу на 1 кг маси тіла дитини на добу,

150 мг – кількість парацетамолу в одному супозиторії.

Ефералган, супозиторії ректальні по 300 мг призначений для дітей з масою тіла від 15 до 24 кг (віком приблизно від 4 до 9 років).

Зразок розрахунку, коли маса тіла дитини – 20 кг:

$$\frac{20 \text{ кг} \times 60 \text{ мг}}{300 \text{ мг}} = 4 \text{ (до чотирьох супозиторіїв на добу),}$$

де:

60 мг – добова доза парацетамолу на 1 кг маси тіла дитини на добу,

300 мг – кількість парацетамолу в одному супозиторії.

Рекомендована добова доза парацетамолу становить близько 60 мг/кг маси тіла/добу, яку слід розподілити на 4 прийоми, тобто 15 мг/кг маси тіла кожні 6 годин. При вираженій нирковій недостатності (кліренс креатиніну менше 10 мл/хв) інтервал між прийомами має становити не менше 8 годин.

Застосування передбачає введення ректально одного супозиторія 80 мг або 150 мг або 300 мг, яке повторюють при необхідності з інтервалом не менше 6 годин, але не перевищуючи добову дозу та кількість 4 супозиторіїв на добу.

Через ризик місцевої токсичності не рекомендується застосування супозиторіїв більше 4 разів на день, а тривалість застосування при ректальному способі введення має бути щонайменшою.

### **Передозування.**

Щоб уникнути передозування, не слід застосовувати інші лікарські засоби, що містять парацетамол.

Існує ризик передозування у маленьких дітей (поширені медикаментозне передозування і випадкове отруєння). Це може призвести до летального наслідку.

У дітей з масою тіла менше 37 кг максимальна добова доза парацетамолу не має перевищувати 80 мг/кг маси тіла/добу.

У дітей з масою тіла від 38 кг до 50 кг максимальна добова доза парацетамолу не має перевищувати 3 г/добу.

У дітей з масою тіла понад 50 кг максимальна добова доза парацетамолу не має перевищувати 4 г/добу.

При одноразовому прийомі у дозі 150 мг/кг маси тіла дитини може спричинити гепатоцелюлярну недостатність, порушення метаболізму глюкози, метаболічний ацидоз, крововиливи, гіпоглікемію, енцефалопатію, кому та летальний наслідок. При цьому зростає рівень печінкової трансамінази, лактатдегідрогенази та білірубіну, протягом 12-48 годин знижується рівень протромбіну. Гостра ниркова недостатність із гострим некрозом каналців може проявлятися сильним болем у ділянці попереку, гематурією, протеїнурією і розвинутих навіть у разі відсутності тяжкого ураження печінки. Відзначалась також серцева аритмія і панкреатит. При тривалому застосуванні препарату у великих дозах з боку органів кровотворення може розвинутих апластична анемія, панцитопенія, агранулоцитоз, нейтропенія, лейкопенія, тромбоцитопенія. При прийомі великих доз з боку ЦНС – запаморочення, психомоторне збудження і порушення орієнтації; з боку сечовидільної системи – нефротоксичність (ниркова коліка, інтєртиціальний нефрит, папілярний некроз); з боку системи травлення – гепатонекроз. У пацієнтів з факторами ризику (тривалий прийом карбамазепіну, фенобарбітону, фенітоїну, примідону, рифампіцину, звіробою або інших препаратів, що індують печінкові ферменти; зловживання алкоголем; недостатність глутатіонової системи, наприклад неправильне харчування, СНІД, голодування, муковісцидоз, кахексія) застосування 5 г або більше парацетамолу може призвести до ураження печінки. Ураження печінки може стати явним через 12-48 годин після передозування. При передозуванні пацієнта слід негайно доставити в лікарню, навіть якщо відсутні ранні симптоми передозування. Симптоми передозування з'являються протягом перших 24 годин: нудота, блювання, зниження апетиту, блідість, біль у животі, або можуть не відображати тяжкості передозування чи ризику ураження. Невідкладні заходи:

- негайна госпіталізація;
- визначення рівня парацетамолу у плазмі крові;
- промивання шлунка;
- введення антитоту N-ацетилцистеїну внутрішньовенно або метіоніну перорально протягом перших 10 годин;
- симптоматична терапія.

### **Побічні ефекти.**

Дуже рідко:

*алергічні реакції:* анафілаксія, анафілактичний шок, набряк Квінке, еритема, кропив'янка, шкірний свербіж, висип на шкірі та слизових оболонках, мультиформна ексудативна еритема, токсичний епідермальний некроліз;

*з боку органів кровотворення:* анемія, сульфгемоглобінемія і метгемоглобінемія (ціаноз, задишка, болі в серці), гемолітична анемія, тромбоцитопенія, лейкопенія і нейтропенія;

*з боку дихальної системи:* бронхоспазм у пацієнтів, чутливих до аспірину та до інших НПЗЗ;

*з боку системи травлення:* нудота, біль в епігастрії, порушення функції печінки, підвищення активності печінкових ферментів, як правило, без розвитку жовтяниці, гепатонекроз (дозозалежний ефект);

*з боку ендокринної системи:* гіпоглікемія, аж до гіпоглікемічної коми.

Пов'язані з лікарською формою: подразнення прямої кишки та анального отвору.

При виникненні будь-яких небажаних реакцій слід припинити застосування препарату та обов'язково звернутися до лікаря.

### **Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.**

При прийомі максимальних доз парацетамолу (4 г/добу) протягом як мінімум 4 днів існує ризик посилення ефекту перорального антикоагулянту і підвищений ризик

кровотечі. Слід контролювати МНВ (Міжнародне нормалізоване відношення) через рівні проміжки часу. При необхідності дозу перорального антикоагулянту слід відкорегувати під час лікування парацетамолом.

Швидкість всмоктування парацетамолу може збільшуватись метоклопрамідом та домперідоном і зменшуватись холестираміном. Барбітурати знижують жарознижувальний ефект парацетамолу. Антисудомні препарати (включаючи фенітоїн, барбітурати, карбамазепін), які стимулюють активність мікосомальних ферментів печінки, можуть посилювати токсичний вплив парацетамолу на печінку внаслідок підвищення ступеня перетворення препарату на гепатотоксичні метаболіти. При одночасному застосуванні парацетамолу з гепатотоксичними засобами збільшується гепатотоксичний вплив препарату на печінку. Одночасне застосування високих доз парацетамолу з ізоніазидом, рифампіцином підвищує ризик розвитку гепатотоксичного синдрому. Парацетамол знижує ефективність діуретиків. Не застосовувати одночасно з алкоголем.

Високі концентрації парацетамолу можуть впливати на лабораторні результати визначення глюкози у крові оксидазо-пероксидазним методом, сечової кислоти при використанні методу з фосфорновольфрамовою кислотою.

**Термін придатності.** 3 роки.

**Умови зберігання.**

Зберігати при температурі не вище 30 °С у недоступному для дітей місці.

**Упаковка.**

По 5 супозиторіїв у блістері, по 2 блістери у картонній коробці.

**Категорія відпуску.** Без рецепта.