

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
БУТОРФАНОЛ

Регистрационный номер: ЛСР-001743/09

Торговое наименование: Буторфанол

Международное непатентованное наименование: буторфанол

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

1 мл раствора содержит:

Действующее вещество:

буторфанола тартрат (в пересчете на сухое вещество) – 2,00 мг

Вспомогательные вещества:

лимонной кислоты моногидрат (или лимонная кислота в пересчете на лимонной кислоты моногидрат) – 3,30 мг, натрия цитрата дигидрат (эквивалентный 6,40 мг натрия цитрата пентасесквигидрата) – 5,27 мг, натрия хлорид – 6,30 мг, динатрия эдетат (динатриевая соль этилендиаминтетрауксусной кислоты) – 0,50 мг, вода для инъекций – до 1 мл

Описание: прозрачная или слегка опалесцирующая бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее опиоидное средство: опиоидных рецепторов агонист-антагонист.

Психотропное вещество, внесенное в Список III «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».

Код АТХ: N02AF01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Опиоидный анальгетик из группы смешанных агонистов-антагонистов опиоидных рецепторов (стимулирует κ- и δ-рецепторы, блокирует μ-рецепторы). По выраженности анальгезирующего действия сходен с морфином. После внутривенного введения действие наступает сразу, максимальный эффект – через несколько минут; после внутримышечного

введения эффект наступает через 10-15 минут, максимальная активность – через 30-60 минут, длительность действия – 3-4 часа. В меньшей степени, чем морфин, угнетает дыхание, обладает более низким наркотическим потенциалом. Оказывает противокашлевое и седативное действие, стимулирует рвотный центр, вызывает сужение зрачков, повышает артериальное давление, конечное диастолическое давление в левом желудочке, и общее периферическое сосудистое сопротивление.

Фармакокинетика

Абсорбция из места внутримышечной инъекции высокая. Максимальная концентрация в плазме через 20-40 минут; связь с белками плазмы – 80 %. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, выделяется с грудным молоком (концентрация в грудном молоке матери после внутримышечного введения 2 мг 4 раза в сутки – 4 мкг/л). Метаболизируется в печени, выводится почками, преимущественно в виде метаболитов – 70-80 % (5 % в неизменном виде), через кишечник – 15 %. Период полувыведения у молодых пациентов – 4,7 часов, у пожилых – 6,6 часов, у пациентов с почечной недостаточностью – 10,5 часов.

Показания к применению

Болевой синдром различного генеза средней и сильной степени выраженности, резистентный к ненаркотическим анальгетикам; премедикация перед общей анестезией; в качестве компонента внутривенной общей анестезии; обезболивание родов.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к буторфанолу или другим компонентам препарата;
- беременность (кроме подготовки к родам и болевого синдрома при родах);
- период лактации;
- детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

*Если у Вас одно из перечисленных заболеваний, перед приемом препарата **обязательно** проконсультируйтесь с врачом.*

- опиоидная зависимость (в том числе в анамнезе);
- внутричерепная гипертензия;
- черепно-мозговая травма;
- дыхательная недостаточность;
- печеночная и/или почечная недостаточность;
- бронхиальная астма;

- пожилой возраст (старше 65 лет);
- хроническая сердечная недостаточность;
- острый инфаркт миокарда;
- нарушения ритма сердца;
- артериальная гипертензия;
- надпочечниковая недостаточность;
- при длительном применении препарата возникает риск снижения уровня половых гормонов.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Применение при беременности (кроме подготовки к родам и болевого синдрома непосредственно при родах) противопоказано. Во время родов допустимо введение роженицам со сроком беременности не менее 37 недель (при отсутствии у плода признаков внутриутробной патологии), не чаще чем 1 раз в 4 часа, последняя инъекция должна быть сделана не менее чем за 4 часа до родоразрешения.

Грудное вскармливание

Применение буторфанолола в период грудного вскармливания противопоказано.

Фертильность

При длительном применении буторфанолола, как и в случае других опиоидов, может наблюдаться снижение уровня половых гормонов, и, как следствие, бесплодие.

Способ применения и дозы

При болевом синдроме 1 мг внутривенно или 2 мг внутримышечно через каждые 3-4 часа (или по мере необходимости). У пожилых пациентов и у пациентов с печеночной и/или почечной недостаточностью доза снижается в 2 раза, а интервал между инъекциями увеличивается до 6 часов.

Для премедикации назначают 2 мг внутримышечно за 60-90 минут перед операцией или 2 мг внутривенно непосредственно перед операцией.

При проведении общей анестезии – 2 мг перед введением тиопентала, затем анестезию поддерживают повторными внутривенными введениями 0,5-1 мг. Общая доза, требуемая для проведения анестезии – 4-12,5 мг.

Во время родов вводят 1-2 мг внутривенно или внутримышечно роженицам со сроком беременности не менее 37 недель (при отсутствии у плода признаков внутриутробной патологии) не чаще чем 1 раз в 4 часа, последняя инъекция должна быть сделана не менее чем за 4 часа до родоразрешения.

Побочное действие

Нежелательные явления сгруппированы в соответствии с классификацией органов и систем органов MedDRA, в пределах каждой группы перечислены в порядке уменьшения значимости.

Частота возникновения побочных эффектов определялась в соответствии с классификацией Всемирной Организации Здравоохранения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$), редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (не может быть оценена на основании имеющихся данных).

В ходе проведения предрегистрационных клинических исследований были проанализированы данные 1658 пациентов. В большинстве случаев тип и частота побочных эффектов при применении буторфанола были аналогичны побочным эффектам, наблюдаемым при применении других опиоидных анальгетиков.

Описанные ниже побочные эффекты основаны на данных краткосрочных и долгосрочных клинических исследований у пациентов, получавших буторфанол в виде инъекций.

Наиболее часто сообщаемыми побочными эффектами во всех клинических исследованиях были сонливость (43 %), головокружение (19 %), тошнота и/или рвота (13 %).

В клинических исследованиях также сообщалось о следующих нежелательных явлениях с частотой 1 % или более («часто») и, вероятно, связанных с использованием буторфанола:

Нарушения со стороны нервной системы: беспокойство, спутанность сознания, головокружение, эйфория, бессонница, нервозность, парестезия, сонливость, тремор.

Нарушения со стороны органа зрения: затуманенное зрение.

Нарушения со стороны слуха и лабиринтные нарушения: боль в ушах, шум в ушах.

Нарушения со стороны сердца: учащенное сердцебиение.

Нарушение со стороны сосудов: расширение сосудов.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: кашель, одышка.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: анорексия, запор, сухость во рту, тошнота и/или рвота, боль в животе, дисгевзия.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: потливость, зуд.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: астения/вялость, головная боль, ощущение жара.

Следующие побочные эффекты были зарегистрированы в клинических исследованиях с частотой менее 1 % («нечасто») и, вероятно, связанных с использованием буторфанола:

Нарушения со стороны нервной системы: необычные сновидения, возбуждение, дисфория, галлюцинации, враждебность, синдром «отмены».

Нарушения со стороны сердца: гипотензия.

Нарушения со стороны сосудов: обморок.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: сыпь/крапивница.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: нарушение мочеиспускания.

О следующих нежелательных явлениях сообщалось с частотой менее 1 % («нечасто»), при обстоятельствах, когда связь между этими событиями и введением буторфанола неизвестна. Они перечислены в качестве предупреждающей информации в связи с их клинической значимостью:

Нарушения со стороны нервной системы: депрессия.

Нарушения со стороны сердца: боль в груди, тахикардия.

Нарушения со стороны сосудов: повышение артериального давления.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: поверхностное дыхание.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: отеки.

В ходе проведения пострегистрационных клинических исследований сообщалось о следующих побочных реакциях. Поскольку эти реакции регистрируются добровольно в популяции неопределенного размера, не всегда возможно достоверно оценить их частоту или установить причинно-следственную связь с применением препарата.

Серотониновый синдром: сообщалось о случаях серотонинового синдрома при одновременном применении опиоидов с серотонинергическими препаратами.

Надпочечниковая недостаточность: сообщалось о случаях развития недостаточности надпочечников при применении опиоидных препаратов, чаще всего после более чем одного месяца применения.

Снижение уровня половых гормонов: сообщалось о случаях дефицита андрогенов при длительном применении опиоидных препаратов.

Передозировка

Симптомы: угнетение дыхания, сердечно-сосудистая недостаточность, угнетение сознания (вплоть до комы).

Лечение: поддержание адекватной легочной вентиляции, показателей системной гемодинамики, температуры тела. При необходимости – применение налоксона (специфический антагонист опиоидов).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Усиливает действие *лекарственных средств, угнетающих центральную нервную систему (барбитураты, анксиолитики, антипсихотические лекарственные средства, блокаторы H1-гистаминовых рецепторов, этанол)*. Фармацевтически несовместим с *диазепамом, барбитуратами*.

Средства с антихолинергической активностью, противодиарейные препараты (в т.ч. лоперамид) повышают риск возникновения запора вплоть до кишечной непроходимости, задержки мочи и угнетения центральной нервной системы.

Усиливает гипотензивный эффект *препаратов, снижающих артериальное давление (в т.ч. ганглиоблокаторов, диуретиков)*.

Бупренорфин (в т.ч. предшествующая терапия) снижает эффект опиоидных анальгетиков.

Снижает эффект *метоклопрамида*.

С осторожностью следует применять одновременно с *ингибиторами моноаминоксидазы* из-за возможного перевозбуждения или торможения нервной системы с возникновением гипер- или гипотензивных кризов (в начале терапии для оценки эффекта взаимодействия дозу буторфанола следует снизить до 1/4 от рекомендуемой).

Налоксон снижает эффект опиоидных анальгетиков, а также вызванные ими угнетение дыхания и центральной нервной системы.

Одновременное применение с *противомигренозными лекарственными средствами (суматриптан, золмитриптан, элетриптан)* и *антидепрессантами* может привести к развитию серотонинового синдрома.

Особые указания

У пациентов с наркотической зависимостью перед началом лечения следует принять меры, направленные на полное выведение наркотического вещества из организма.

Во время лечения не следует употреблять этанол.

В период подготовки к родам назначают при условии тщательного врачебного контроля.

При применении буторфанола, как и в случае других опиоидов, возможно развитие редкого, но серьезного состояния, связанного с недостаточной выработкой надпочечниками кортизола. Необходимо пристальное наблюдение пациентов при появлении симптомов недостаточности надпочечников: тошнота, рвота, потеря аппетита, усталость, слабость, головокружение, снижение артериального давления. При подозрении на развитие недостаточности надпочечников необходимо проведение соответствующих диагностических тестов. При подтверждении диагноза показано лечение препаратами

кортикостероидов, а также снижение дозы и постепенная отмена буторфанола (если применимо).

При длительном применении буторфанола, как и в случае других опиоидов, может наблюдаться снижение уровня половых гормонов. Пациенты могут отмечать снижение либидо, эректильную дисфункцию, аменорею, бесплодие.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Во время лечения следует воздержаться от управления транспортными средствами и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания, быстроты психических и двигательных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения, 2 мг/мл.

По 1 мл в ампулы нейтрального стекла.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги.

По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки с инструкцией по применению и ножом или скарификатором ампульным в пачку из картона.

По 20, 50 или 100 контурных ячейковых упаковок с фольгой с 20, 50 или 100 инструкциями по применению, соответственно, ножами или скарификаторами ампульными помещают в коробки из картона или в ящики из гофрированного картона (для стационара).

При упаковке ампул с надрезами (насечками) и точками или кольцами излома ножи или скарификаторы ампульные не вкладывают.

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения, 2 мг/мл.

По 1 мл (см)³ в шприц-тюбики из полиэтилена.

По 1, 2 или 5 шприц-тюбиков с инструкцией по применению препарата и инструкцией по применению шприц-тюбика помещают в пачку из картона.

По 20, 50 или 100 шприц-тюбиков с инструкцией по применению препарата и инструкцией по применению шприц-тюбика укладывают вниз колпачками в коробку из картона (для медицинских служб ВС, МЧС, МВД, ФМБА Российской Федерации).

Условия хранения

В соответствии с правилами хранения психотропных веществ, внесенных в Список III «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С для препарата в ампулах.
Не допускать замораживание.

В защищенном от света месте при температуре от 8 до 15 °С для препарата в шприц-тюбиках.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года (для препарата в ампулах).

2 года (для препарата в шприц-тюбиках).

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Препарат в ампулах отпускают по рецепту.

Препарат в шприц-тюбиках не подлежит реализации через аптечную сеть.

Производитель:

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

Юридический адрес: 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25

Производство готовой лекарственной формы:

г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 2

Выпускающий контроль качества:

г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 1

Владелец регистрационного удостоверения/наименование, адрес организации, принимающей претензии потребителя:

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25

Тел./факс: (495) 678-00-50/911-42-10

<http://www.endopharm.ru>

Начальник управления по внедрению
и регистрации лекарственных препаратов
ФГУП «Московский эндокринный завод»



Е.П. Самойлова