

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НІКОТИНОВА КИСЛОТА-ДАРНИЦЯ

(NICOTINIC ACID-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: nicotinic acid;

1 мл розчину містить нікотинової кислоти 10 мг;

допоміжні речовини: натрію гідрокарбонат, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина.

Фармакотерапевтична група. Периферичні вазодилататори. Нікотинова кислота та її похідні. Код АТХ C04A C01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Нікотинова кислота (вітамін РР) і її амід є простетичною групою ферментів - кодегідази І (дифосфопіридиннуклеотиду - НАД) і кодегідази ІІ (трифосфопіридиннуклеотиду - НАДФ), які здійснюють перенесення водню в окисно-відновних реакціях, а також перенесення фосфату.

Беручи участь в обміні речовин, тканинному диханні, процесах синтезу, нікотинова кислота нормалізує вміст ліпопротеїдів і тригліцеридів у крові.

Має вазодилатуючий вплив на рівні преартеріол та артеріол (у т. ч. головного мозку), чим поліпшує мікроциркуляцію.

Чинить слабку антикоагулянтну дію (підвищує фібринолітичну активність крові), має дезінтоксикаційні властивості завдяки посиленню дезінтоксикаційної функції печінки та нирок.

Ліквідує дефіцит вітаміну РР, є специфічним протипелагричним засобом.

Фармакокінетика.

Нікотинова кислота швидко всмоктується з місця введення при парентеральному застосуванні. Рівномірно розподіляється по всіх органах і тканинах. Інактивується головним чином шляхом метилування та меншою мірою – шляхом кон'югації. Продукти біотрансформації екскретуються із сечею. Нікотинова кислота може виявлятися в сечі в активній формі, якщо в організм надходить підвищена її кількість.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування пелагри (авітаміноз вітаміну PP).

Ішемічні порушення мозкового кровообігу. Спазм судин кінцівок (облітеруючий ендартеріїт, хвороба Рейно). Спазм судин нирок.

Рани, виразки, що тривалий час не загоюються. Ускладнення цукрового діабету (діабетична полінейропатія, мікроангіопатія).

Гіпоацидний гастрит, ентероколіт, коліт. Захворювання печінки (гострі та хронічні гепатити).

Неврит лицьового нерва.

Інтоксикації різного генезу: професійні, алкогольні, медикаментозні (похідними аніліну, барбітуратами, протитуберкульозними засобами, сульфаніламидами).

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу. Виразкова хвороба шлунка та дванадцятипалої кишки (у стадії загострення), подагра, гіперурикемія, тяжка печінкова недостатність (у т. ч. цироз), тяжкі форми артеріальної гіпертензії та атеросклерозу (внутрішньовенне введення), декомпенсований цукровий діабет, нещодавній інфаркт міокарда, раптове зниження периферичного судинного опору в анамнезі.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Пероральні протизапальні засоби та ізоніазид знижують перетворення триптофану у нікотинову кислоту і таким чином можуть підвищувати потребу в нікотиновій кислоті.

Нікотинова кислота знижує ефективність та токсичність *пробенециду, неоміцину, барбітуратів, протитуберкульозних засобів, сульфаніламідів.*

Антибіотики можуть посилювати почервоніння шкіри, спричинене нікотиновою кислотою.

Ацетилсаліцилова кислота знижує ефект почервоніння шкіри, що виникає під дією нікотинової кислоти.

Ципрофібрат не рекомендується комбінувати з нікотиновою кислотою.

Ловастатин, правастатин через підвищення ризику розвитку побічних реакцій не рекомендується комбінувати з нікотиною кислотою. Є повідомлення про випадки рабдоміолізу при застосуванні нікотинової кислоти з *ловастатином*.

Необхідно дотримуватися обережності при комбінації з *гіпотензивними засобами* (можливе посилення гіпотензивної дії), *антикоагулянтами, ацетилсаліциловою кислотою* (через ризик розвитку геморагій).

Лікарський засіб потенціює дію *фібринолітичних засобів, спазмолітиків та серцевих глікозидів*, токсичну дію *алкоголю* на печінку.

Особливості застосування.

Оскільки тривале застосування може призвести до жирової дистрофії печінки, для профілактики останньої в дієту хворих слід включати багаті метіоніном продукти або призначати метіонін, ліпоєву кислоту. У процесі лікування необхідно контролювати функцію печінки. У разі появи підвищеної чутливості до лікарського засобу (за винятком випадків застосування як судинорозширювального засобу) його можна замінити на нікотинамід.

З обережністю лікарський засіб застосовувати при гіперацидному гастриті, виразковій хворобі шлунка та дванадцятипалої кишки (поза стадією загострення), геморагіях, глаукомі, нирковій недостатності, артеріальній гіпотензії помірного ступеня, зловживанні алкоголем, нестабільній стенокардії (пацієнтам, які приймають нітрати, антагоністи кальцієвих каналів, β -блокатори).

Застосування лікарського засобу може призвести до збільшення потреби в інсуліні в пацієнтів, хворих на цукровий діабет. Недоцільно застосовувати для корекції дисліпідемії хворим на цукровий діабет.

Необхідно регулярно проводити моніторинг рівня глюкози у зв'язку з можливим зниженням толерантності до глюкози, а також рівня сечової кислоти в сироватці крові через можливе підвищення внаслідок тривалої терапії.

Важлива інформація про допоміжні речовини.

Цей лікарський засіб містить менше 1 ммоль (23 мг)/дозу натрію, тобто практично вільний від натрію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Лікарський засіб протипоказаний у період вагітності. При необхідності застосування лікарського засобу слід припинити годування груддю.

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

Дослідження щодо впливу лікарського засобу на швидкість реакції не проводилися, однак, якщо під час лікування препаратом спостерігаються запаморочення і сонливість, слід

утримуватися від роботи зі складними механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Призначати дорослим та дітям віком від 15 років внутрішньовенно (повільно), внутрішньом'язово і підшкірно (внутрішньом'язові та підшкірні ін'єкції болючі).

Для внутрішньовенного струминного введення разову дозу лікарського засобу розвести у 10 мл 0,9 % розчину натрію хлориду, вводити не менш ніж за 5 хвилин (не більше 2 мг нікотинової кислоти за 1 хвилину).

Для внутрішньовенного краплинного введення разову дозу лікарського засобу розвести в 100–200 мл 0,9 % розчину натрію хлориду, швидкість введення – 30–40 крапель за хвилину.

Пелагра. Призначати внутрішньовенно або внутрішньом'язово по 10 мг (1 мл) 1–2 рази на добу. Курс лікування – 10–15 днів.

Ішемічні порушення мозкового кровообігу. Внутрішньовенно (повільно) вводити 10 мг (1 мл).

Інші показання. Призначати підшкірно або внутрішньом'язово по 10 мг (1 мл) 1 раз на день протягом 10–15 днів. Можливе додавання в інфузійний розчин: 10 мг (1 мл) нікотинової кислоти на 100–200 мл інфузійного розчину.

Вищі дози при внутрішньовенному введенні: разова – 100 мг (10 мл), добова – 300 мг (30 мл).

Діти.

Лікарський засіб призначати дітям віком від 15 років.

Передозування.

Симптоми: посилення побічних ефектів з боку серцево-судинної системи – артеріальна гіпотензія, головний біль, можлива втрата свідомості, запаморочення, відчуття припливу.

Лікування: відміна лікарського засобу, дезінтоксикаційна терапія, симптоматичне лікування. Специфічний антидот відсутній.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: запаморочення, парестезії, головний біль.

З боку серцево-судинної системи: відчуття припливу, що може супроводжуватись задишкою, тахікардією, серцебиттям, підвищеним потовиділенням, ознобом, набряками, відчуттям поколювання і печіння; аритмії; при швидкому внутрішньовенному введенні – значне зниження

артеріального тиску, ортостатична гіпотензія, колапс.

З боку шкіри та підшкірної клітковини: гіперемія шкіри обличчя і верхньої половини тулуба з відчуттям поколювання і печіння, сухість шкіри і слизової оболонки очей, рідко – набряк сітківки очей, дуже рідко у пацієнтів з ішемічною хворобою серця – акантоз. Ці симптоми нестійкі і зникають після відміни лікарського засобу. Реакції гіперчутливості, в тому числі з боку органів дихання, кропив'янка, свербіж, висипання.

Загальні розлади та реакції у місці введення: болісність, припухлість у місці підшкірних і внутрішньом'язових ін'єкцій.

При тривалому застосуванні у великих дозах – гіперурикемія, зниження толерантності до глюкози, порушення функції печінки, жирова дистрофія печінки, жовтяниця, підвищення рівнів аспартатамінотрансферази, лактатдегідрогенази, лужної фосфатази, сечової кислоти, гіпофосфатемія, зниження кількості тромбоцитів, подовження протромбінового часу, гіперпігментація, гіперкератоз, судоми, діарея, нудота, блювання, анорексія, загострення виразки шлунка, амбліопія, безсоння, міалгія, зниження артеріального тиску, риніт, затуманення зору, набряк повік, міопатія, ексфоліативний дерматит.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу є важливою процедурою. Це дозволяє продовжувати моніторинг співвідношення «користь/ризик» для відповідного лікарського засобу. Медичним працівникам необхідно повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції через національну систему повідомлень.

Термін придатності. 5 років.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморожувати.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Не слід змішувати з розчинами тіаміну хлориду (відбувається руйнування тіаміну), піридоксину гідрохлориду, ціанокобаламіну, еуфіліну, саліцилатів, тетрацикліну, симпатоміметиків, гідрокортизону.

Упаковка.

По 1 мл в ампулі; по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

НИКОТИНОВАЯ КИСЛОТА-ДАРНИЦА

(NICOTINIC ACID-DARNITSA)

Состав:

действующее вещество: nicotinic acid;

1 мл раствора содержит никотиновой кислоты 10 мг;

вспомогательные вещества: натрия гидрокарбонат, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Периферические вазодилататоры. Никотиновая кислота и ее производные. Код АТХ C04A C01.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Никотиновая кислота (витамин РР) и ее амид являются простетической группой ферментов -кодегидразы I (дифосфопиридиннуклеотида - НАД) и кодегидразы II (трифосфопиридиннуклеотида - НАДФ), которые осуществляют перенесение водорода в окислительно-восстановительных реакциях, а также перенос фосфата.

Участвуя в обмене веществ, тканевом дыхании, процессах синтеза, никотиновая кислота нормализует содержание липопротеидов и триглицеридов в крови.

Имеет вазодилатирующее влияние на уровне преартериол и артериол (в т. ч. головного мозга), чем улучшает микроциркуляцию.

Оказывает слабое антикоагулянтное действие (повышает фибринолитическую активность крови), имеет дезинтоксикационные свойства благодаря усилению дезинтоксикационной функции печени и почек.

Ликвидирует дефицит витамина РР, является специфическим противопеллагрическим средством.

Фармакокинетика.

Никотиновая кислота быстро всасывается с места введения при парентеральном применении. Равномерно распределяется по всем органам и тканям. Инактивируется главным образом путем метилирования и в меньшей мере - путем конъюгации. Продукты биотрансформации экскретируются с мочой. Никотиновая кислота может проявляться в моче в активной форме, если в организм поступает повышенное ее количество.

Клинические характеристики.

Показания.

Лечение пеллагры (авитаминоз витамина РР).

Ишемические нарушения мозгового кровообращения. Спазм сосудов конечностей (облитерирующий эндартериит, болезнь Рейно). Спазм сосудов почек.

Длительно не заживающие раны, язвы. Осложнения сахарного диабета (диабетическая полинейропатия, микроангиопатия).

Гипоацидный гастрит, энтероколит, колит. Заболевания печени (острые и хронические гепатиты).

Неврит лицевого нерва.

Инттоксикации различного генеза: профессиональные, алкогольные, медикаментозные (производными анилина, барбитуратами, противотуберкулезными средствами, сульфаниламидами).

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к компонентам лекарственного средства. Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки (в стадии обострения), подагра, гиперурикемия, тяжелая печеночная недостаточность (в т. ч. цирроз), тяжелые формы артериальной гипертензии и атеросклероза (внутривенное введение), декомпенсированный сахарный диабет, недавний инфаркт миокарда, внезапное снижение периферического сосудистого сопротивления в анамнезе.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Пероральные противозачаточные средства и изониазид снижают превращение триптофана в никотиновую кислоту и таким образом могут повышать потребность в никотиновой кислоте.

Никотиновая кислота снижает эффективность и токсичность *пробенецида, неомидина, барбитуратов, противотуберкулезных средств, сульфаниламидов.*

Антибиотики могут усиливать покраснение кожи, вызванное никотиновой кислотой.

Ацетилсалициловая кислота снижает эффект покраснения кожи, возникающий под действием никотиновой кислоты.

Ципрофibrate не рекомендуется комбинировать с никотиновой кислотой.

Ловастатин, правастатин ввиду повышения риска развития побочных реакций не рекомендуется комбинировать с никотиновой кислотой. Имеются сообщения о случаях рабдомиолиза при применении никотиновой кислоты с *ловастатином*.

Необходимо соблюдать осторожность при комбинации с *гипотензивными средствами* (возможно усиление гипотензивного действия), *антикоагулянтами, ацетилсалициловой кислотой* (ввиду риска развития геморрагий).

Лекарственное средство потенцирует действие *фибринолитических средств, спазмолитиков и сердечных гликозидов*, токсическое действие *алкоголя* на печень.

Особенности применения.

Поскольку длительное применение может привести к жировой дистрофии печени, для профилактики последней в диету больных следует включать богатые метионином продукты или назначать метионин, липоевую кислоту. В процессе лечения необходимо контролировать функцию печени. При появлении повышенной чувствительности к лекарственному средству (за исключением случаев применения как сосудорасширяющего средства) его можно заменить на никотинамид.

С осторожностью лекарственное средство применять при гиперацидном гастрите, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки (вне стадии обострения), геморрагиях,

глаукоме, почечной недостаточности, артериальной гипотензии умеренной степени, злоупотреблении алкоголем, нестабильной стенокардии (пациентам, которые принимают нитраты, антагонисты кальциевых каналов, β -блокаторы).

Применение лекарственного средства может привести к увеличению потребности в инсулине у пациентов, больных сахарным диабетом. Нецелесообразно применять для коррекции дислипидемии больным сахарным диабетом.

Необходимо регулярно проводить мониторинг уровня глюкозы в связи с возможным снижением толерантности к глюкозе, а также уровня мочевой кислоты в сыворотке крови ввиду возможного повышения в результате длительной терапии.

Важная информация о вспомогательных веществах.

Это лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг)/дозу натрия, то есть практически свободно от натрия.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Лекарственное средство противопоказано в период беременности. При необходимости применения лекарственного средства следует прекратить кормление грудью.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Исследования относительно влияния лекарственного средства на скорость реакции не проводились, однако, если во время лечения препаратом наблюдаются головокружение и сонливость, следует воздержаться от работы со сложными механизмами.

Способ применения и дозы.

Назначать взрослым и детям с 15 лет внутривенно (медленно), внутримышечно и подкожно (внутримышечные и подкожные инъекции болезненны).

Для внутривенного струйного введения разовую дозу лекарственного средства развести в 10 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, вводить не менее чем за 5 минут (не больше 2 мг никотиновой кислоты за 1 минуту).

Для внутривенного капельного введения разовую дозу лекарственного средства развести в 100–200 мл 0,9 % раствора натрия хлорида, скорость введения – 30–40 капель в минуту.

Пеллагра. Назначать внутривенно или внутримышечно по 10 мг (1 мл) 1–2 раза в сутки. Курс лечения – 10–15 дней.

Ишемические нарушения мозгового кровообращения. Внутривенно (медленно) вводить 10 мг (1 мл).

Другие показания. Назначать подкожно или внутримышечно по 10 мг (1 мл) 1 раз в день в

течение 10–15 дней. Возможно добавление в инфузионный раствор: 10 мг (1 мл) никотиновой кислоты на 100–200 мл инфузионного раствора.

Высшие дозы при внутривенном введении: разовая – 100 мг (10 мл), суточная – 300 мг (30 мл).

Дети.

Лекарственное средство назначать детям с 15 лет.

Передозировка.

Симптомы: усиление побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы – артериальная гипотензия, головная боль, возможна потеря сознания, головокружение, ощущение прилива.

Лечение: отмена лекарственного средства, дезинтоксикационная терапия, симптоматическое лечение. Специфический антидот отсутствует.

Побочные реакции.

Со стороны нервной системы: головокружение, парестезии, головная боль.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: ощущение прилива, что может сопровождаться одышкой, тахикардией, сердцебиением, повышенным потоотделением, ознобом, отеками, чувством покалывания и жжения; аритмии; при быстром внутривенном введении – значительное снижение артериального давления, ортостатическая гипотензия, коллапс.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки: гиперемия кожи лица и верхней половины туловища с ощущением покалывания и жжения, сухость кожи и слизистой оболочки глаз, редко – отек сетчатки глаз, очень редко у пациентов с ишемической болезнью сердца – акантоз. Эти симптомы неустойчивы и исчезают после отмены лекарственного средства. Реакции гиперчувствительности, в том числе со стороны органов дыхания, крапивница, зуд, высыпания.

Общие нарушения и реакции в месте введения: болезненность, припухлость в месте подкожных и внутримышечных инъекций.

При длительном применении в больших дозах – гиперурикемия, снижение толерантности к глюкозе, нарушения функции печени, жировая дистрофия печени, желтуха, повышение уровней аспартатаминотрансферазы, лактатдегидрогеназы, щелочной фосфатазы, мочевой кислоты, гипофосфатемия, снижение количества тромбоцитов, удлинение протромбинового времени, гиперпигментация, гиперкератоз, судороги, диарея, тошнота, рвота, анорексия, обострение язвы желудка, амблиопия, бессонница, миалгия, снижение артериального давления, ринит, затуманивание зрения, отек век, миопатия, эксфолиативный дерматит.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях.

Сообщения о подозреваемых побочных реакциях после регистрации лекарственного средства является важной процедурой. Это позволяет продолжать мониторинг соотношения «польза/риск» для соответствующего лекарственного средства. Медицинским работникам необходимо сообщать о любых подозреваемых побочных реакциях через национальную систему сообщений.

Срок годности. 5 лет.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Не следует смешивать с растворами тиамин хлорида (происходит разрушение тиамин), пиридоксин гидрохлорида, цианокобаламина, эуфиллин, салицилатов, тетрациклинов, симпатомиметиков, гидрокортизон.

Упаковка.

По 1 мл в ампуле; по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и адрес места осуществления его деятельности.

Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.