

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

НАЛБУФІН
(NALBUPHIN)

Склад:

діюча речовина: nalbuphine;

1 мл розчину містить налбуфіну гідрохлориду 10 мг;

допоміжні речовини: натрію цитрат, кислота лимонна безводна, натрію хлорид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий, безбарвний або майже безбарвний розчин.

Фармакотерапевтична група. Аналгетики. Опіоїди. Похідні морфінану.

Код АТХ N02A F02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Налбуфін – опіоїдний аналгетик групи агоністів-антагоністів опіатних рецепторів. Є агоністом каппа-рецепторів і антагоністом мю-рецепторів, порушує міжнейронну передачу больових імпульсів на різних рівнях центральної нервової системи (ЦНС), впливаючи на вищі відділи головного мозку. Гальмує умовні рефлекси, чинить седативну дію, спричиняє дисфорію, міоз, збуджує блювотний центр. Меншою мірою, ніж морфін, промедол, фентаніл, порушує дихальний центр і впливає на моторику шлунково-кишкового тракту. Застосування налбуфіну не призводить до значних змін у параметрах серцево-судинної системи та моторики шлунково-кишкового тракту. Налбуфін не показав спазматичної дії на рівні гладкої мускулатури. У разі застосування препарату в терапевтичних дозах пригнічення дихання є помірним і не збільшується при перевищенні дози 0,3 мг/кг (крайовий ефект). Не впливає на гемодинаміку. Ризик розвитку звикання і опіоїдної залежності при контрольованому застосуванні значно нижчий, ніж для опіоїдних антагоністів. При внутрішньовенному введенні ефект розвивається через кілька хвилин, при внутрішньом'язовому – через 10-15 хв.

Максимальний ефект досягається через 30-60 хв, тривалість дії – 3-6 годин.

Фармакокінетика.

Препарат чинить швидку знеболювальну дію. Час досягнення максимальної концентрації у плазмі крові при внутрішньом'язовому введенні – 0,5-1 година. Метаболізується у печінці. Виводиться у вигляді метаболітів із жовчю, у незначній кількості – із сечею. Проходить через плацентарний бар'єр, у період пологів може спричинити пригнічення дихання у новонародженого. Виділяється у грудне молоко. Період напіввиведення – 2,5-3 години.

Клінічні характеристики.

Показання.

Больовий синдром сильної та середньої інтенсивності; як додатковий засіб при проведенні анестезії, для зниження болю в перед- та післяопераційний період, знеболення під час пологів.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до налбуфіну гідрохлориду або до будь-якого з інгредієнтів препарату.

Пригнічення дихання або виражене пригнічення ЦНС, підвищений внутрішньочерепний тиск, травма голови, гостре алкогольне отруєння, алкогольний психоз, порушення функції печінки та нирок.

Не рекомендовано комбіноване застосування препарату з чистими агоністами морфіноміметиків.

Не рекомендовано застосовувати препарат без проведення відповідної діагностики при хірургічному черевному синдромі, оскільки налбуфін може маскувати його прояви.

Налбуфін не слід застосовувати жінкам у період годування груддю (за винятком випадків застосування під час пологів).

Особливі заходи безпеки.

Застосовувати Налбуфін як допоміжний засіб для проведення загальної анестезії повинен тільки спеціально підготовлений фахівець. Обов'язково повинні бути наготові засоби для надання невідкладної допомоги у разі виникнення пригнічення дихання, а саме: налоксон, обладнання для інтубації та штучної вентиляції легень.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Під пильним наглядом і у зменшених дозах слід застосовувати препарат на тлі дії засобів для наркозу, снодійних препаратів, анксіолітиків, антидепресантів та нейролептиків для

запобігання надмірному пригніченню ЦНС і дихального центру. Алкоголь також посилює пригнічувальну дію налбуфіну на ЦНС. Препарат не слід застосовувати разом з іншими наркотичними аналгетиками через небезпеку послаблення анальгезивної дії і можливість провокування синдрому відміни у пацієнтів із залежністю від опіоїдів.

Поєднання з похідними фенотіазину і препаратами пеніциліну може посилити нудоту та блювання.

Протипоказане сполучення

Алфентаніл, кодеїн, декстропроксифен, дигідрокодеїн, фентаніл, метадон, морфін, оксикодон, петидин, суфентаніл, трамадол – спостерігається зменшення знеболювального ефекту внаслідок блокування рецепторів із ризиком появи синдрому відміни.

Нерекомендоване сполучення

Алкоголь – підвищення седативного ефекту морфоаналгетиків. Погіршення уваги може бути небезпечним при керуванні транспортними засобами або роботі з іншими механізмами. Слід уникати вживання алкогольних напоїв і застосування лікарських засобів, що містять етанол.

Застосовувати з обережністю

З протикашльовими засобами або при замісній терапії бензодіазепінами, барбітуратами – зростає ризик пригнічення дихання, що може мати летальний наслідок у разі передозування; з морфіноаналгетиками, анксиолітиками, седативними антидепресантами (амітриптиліном, докsepіном, міансеріном, міртазапіном, триміпраміном), антигістамінними (H₁) засобами, снодійними, антигіпертензивними засобами центральної дії, нейролептиками, талідомідом, протидіарейними лікарськими засобами (лоперамід), баклофеном – посилюється пригнічення ЦНС. Лікарські засоби з антихолінергічною активністю, протидіарейні засоби, у т. ч. лоперамід, підвищують ризик розвитку запору аж до кишкової непрохідності, затримки сечі та пригнічення ЦНС. Посилює гіпотензивну дію засобів, які знижують артеріальний тиск, у т. ч. гангліоблокаторів, діуретиків. Знижує ефективність метоклопраміду. З обережністю слід застосовувати разом з інгібіторами MAO через можливе перезбудження або гальмування із розвитком гіпер- або гіпотензивних кризів (спочатку для оцінки ефекту взаємодії дозу необхідно зменшити до ¼ від рекомендованої).

Особливості застосування.

Налбуфін містить: 0,16 ммоль (або 3,67 мг) натрію на дозу 10 мг лікарського засобу і 0,32 ммоль (або 7,34 мг) натрію на дозу 20 мг, тобто майже вільний від натрію.

Не рекомендовано застосовувати препарат без проведення відповідної діагностики при хірургічному черевному синдромі, оскільки Налбуфін може маскувати його прояви.

Налбуфін має помірну здатність спричиняти пригнічення дихання, тому його застосування може спровокувати розвиток дихальної недостатності.

У пацієнтів, які страждають на наркоманію, препарат може спричиняти гострий напад абстиненції.

Можлива фізична та психічна залежність у період тривалого застосування сумісно з іншими

похідними морфіну. Раптове припинення тривалого застосування може спричинити синдром відміни.

Не рекомендується застосовувати Налбуфін в амбулаторних умовах через ризик виникнення денної сонливості.

Налбуфін слід з обережністю застосовувати жінкам із розкриттям шийки матки 4 см. У такому випадку слід уникати внутрішньовенного введення.

З обережністю потрібно застосовувати препарат за наявності таких факторів: літній вік, кахексія, печінкова та ниркова недостатність, дихальна недостатність (у тому числі при хронічному обструктивному захворюванні легень, уремії), передчасні пологи і вірогідна незрілість плода, жовчнокам'яна хвороба, тяжкі запальні захворювання кишечника, бронхіальна астма, аритмія, артеріальна гіпертензія, гіпотиреоз, гіперплазія передміхурової залози, стеноз сечовивідного каналу, схильність до суїциду, емоційна лабільність, ослаблений стан пацієнта.

У зв'язку з тим, що препарат метаболізується у печінці та виводиться нирками, слід ретельно зважувати необхідність застосування налбуфіну пацієнтам із печінковою та/або нирковою недостатністю, а у разі необхідності застосування – зменшити дози препарату та ретельно контролювати стан пацієнта.

При застосуванні налбуфіну пацієнтам, яким планується оперативне втручання з приводу хірургічної патології гепатобіліарної системи, слід мати на увазі високий ризик розвитку спазму сфінктера Одді.

У пацієнтів з опіатною залежністю можуть розвинутися симптоми відміни (абстинентний синдром) при застосуванні налбуфіну. У такому разі необхідно призначити морфін внутрішньовенно повільно з поступовим підвищенням дози до зникнення больового синдрому. Якщо перед призначенням налбуфіну пацієнт отримував морфін, меперидин, кодеїн або інший опіоїдний анагетик з подібною тривалістю активності, слід спочатку призначити 25 % від необхідної дози налбуфіну та спостерігати за пацієнтом через можливе виникнення синдрому відміни (спазми живота, нудота, блювання, слюзотеча, ринорея, тривожність, збудливість, гіпертермія або пілоерекція). Якщо симптоми відміни

не виникають, дозу налбуфіну потрібно поступово збільшувати через рекомендовані проміжки часу до настання необхідного рівня знеболювання.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Через відсутність досліджень препарат не можна застосовувати у період вагітності та годування груддю.

Вагітність

Дослідження, проведені на тваринах, не виявили жодних ознак тератогенного впливу. Через відсутність тератогенного ефекту у тварин вроджені вади розвитку у людини не очікуються. На даний час речовини, відповідальні за вади розвитку у людини, виявилися тератогенними щодо двох видів тварин під час належним чином проведених досліджень на тваринах.

У клінічній практиці наразі не існує достатньої кількості обґрунтованих даних для оцінки

можливого мальформативного ефекту налбуфіну у разі його застосування під час першого триместру вагітності.

Таким чином, як запобіжний засіб налбуфін у період вагітності краще не застосовувати.

Як і у разі застосування будь-якого лікарського засобу морфійного типу, тривале застосування препарату вагітній, особливо наприкінці вагітності, незалежно від дози може призвести до розвитку неонатального синдрому відміни. Застосування жінці високих доз лікарського засобу в кінці вагітності навіть при короткотривалому лікуванні може призвести до пригнічення дихання у дитини.

У разі застосування налбуфіну під час пологів у новонароджених спостерігалось пригнічення (навіть із затримкою) дихання. Таким чином, максимальна доза препарату не повинна перевищувати 20 мг для внутрішньом'язового введення. Слід розглянути можливість моніторингу стану новонароджених, зокрема функції дихання.

Слід уникати застосування налбуфіну під час вагітності високого ризику, зокрема, у разі передчасних пологів або народження двійні.

Період годування груддю

Налбуфін проникає у грудне молоко; були описані кілька випадків гіпотонії та зупинки дихання у грудних дітей після застосування матерями похідних морфіну в дозах, що перевищували терапевтичні дози.

Таким чином, годування груддю протипоказано у разі тривалого застосування цього лікарського засобу.

У рамках застосування препарату в акушерській практиці грудне вигодовування є можливим.

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

У період лікування слід утримуватися від керування автотранспортом або роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Дозування залежить від маси тіла пацієнта. Слід бути обережним, щоб уникнути помилок у дозуванні через плутанину між міліграмами (мг) та мілілітрами (мл), що може призвести до випадкового передозування (див. таблицю нижче).

Налбуфін призначають для внутрішньовенного та внутрішньом'язового введення.

Рекомендована доза для дорослих пацієнтів з масою тіла 70 кг становить 10-20 мг налбуфіну гідрохлориду, що еквівалентно 0,1-0,3 мг/кг маси тіла. Максимальна разова доза для дорослих не повинна перевищувати 20 мг.

Разову дозу препарату вводять за необхідності кожні 3-6 годин, максимальна добова доза

становить 160 мг. Дозу необхідно розраховувати відповідно до інтенсивності болю, фізичного стану пацієнта.

Таблиця дозування для дорослих пацієнтів

Доза на одне введення	Максимальна разова доза	Максимальний об'єм на одне введення	Максимальна добова доза	Максимальний об'єм добової дози
0,1-0,3 мг/кг	20 мг	2 мл**	160 мг	16 мл**

** Наведена інформація стосується препарату в лікарській формі розчину для ін'єкцій 10 мг/мл.

При інфаркті міокарда часто буває достатньо 20 мг препарату, які вводять повільно у вену. При відсутності чіткої позитивної динаміки больового синдрому – 20 мг повторно, через 30 хв.

При застосуванні Налбуфіну як допоміжного засобу для анестезії необхідні вищі дози, ніж для знеболення.

Для премедикації: 100-200 мкг/кг маси тіла. При проведенні внутрішньовенного наркозу: для введення в наркоз – 0,3-1 мг/кг за період 10-15 хв, для підтримання наркозу – 250-500 мкг/кг внутрішньовенно повільно кожні 30 хв.

При знеболюванні під час пологів препарат слід застосовувати у дозі 20 мг внутрішньом'язово.

З обережністю призначають препарат пацієнтам літнього віку, при загальному виснаженні, недостатній функції дихання. У такому разі слід розпочинати застосування з мінімально ефективних доз у зв'язку з більш частим виникненням побічних реакцій.

Діти.

Не застосовують.

Передозування.

При передозуванні виникають пригнічення дихання, періодичне дихання Чейна – Стокса; сонливість, дисфорія, зміна свідомості аж до коми; блідість шкіри, гіпотермія, міоз; зниження артеріального тиску, серцево-судинна недостатність; судоми; рабдоміоліз, що прогресує до ниркової недостатності.

При лікуванні передозування застосовують:

- на ранній стадії пацієнтам у свідомості – активоване вугілля внутрішньо;
- підтримуючу терапію (кисень, внутрішньовенне введення замісної рідини, засоби, що підвищують артеріальний тиск);

- внутрішньовенне введення налоксону (специфічний антидот).

Побічні реакції.

Під час застосування препарату можливе виникнення побічних реакцій.

У пацієнтів, які лікуються препаратом Налбуфін, найчастіше спостерігається сонливість.

З боку нервової системи:

запаморочення, загальна слабкість, головний біль, седація, диплопія, збудження, плаксивість, ворожість, нічні жахи, дзвін у вухах, парестезії, відчуття нереальності, судоми, ригідність м'язів, тремор, мимовільні м'язові скорочення, підвищення внутрішньочерепного тиску.

Психічні порушення:

звикання до препарату, психоміметичні реакції, невротичні реакції, сонливість, депресія, сплутаність свідомості, дисфорія, порушення мовлення, зміна настрою, неспокій, знервованість (невгамовність), галюцинації, ейфорія.

Можливість виникнення фізичної та психічної залежності, а також толерантності під час тривалого лікування така ж сама, як і для інших похідних морфіну.

З боку органів зору:

нечіткість або порушення зору, міоз.

З боку серцево-судинної системи:

підвищення або зниження артеріального тиску, ортостатична гіпотензія, брадикардія, тахікардія, відчуття серцебиття.

З боку травної системи:

сухість у роті, спазми в животі, коліки, запор, диспепсія, гіркий присмак, анорексія; симптоми подразнення шлунково-кишкового тракту, при запальних захворюваннях кишечника – паралітична кишкова непрохідність і токсичний мегаколон (запор, метеоризм, нудота, гастралгія, блювання).

З боку гепатобіліарної системи:

порушення функціональних показників печінки, спазм жовчовивідних шляхів.

Загальні порушення і реакції у місці введення препарату:

гіпотермія, зміни у місці введення, у тому числі болючість, набряк, почервоніння, печіння та відчуття тепла, припливи, підвищена пітливість.

З боку імунної системи:

анафілактичні реакції, шок, респіраторний дистрес-синдром, набряк Квінке, набряк

обличчя, чхання, бронхоспазм, набряк легень, шкірні висипання.

З боку дихальної системи:

пригнічення дихання, зменшення хвилинного об'єму дихання, диспное, астматичні напади.

З боку нирок та сечовивідних шляхів:

антидіуретичний ефект, спазм сечовивідних шляхів.

З боку репродуктивної системи та молочних залоз:

зниження лібідо або потенції.

З боку шкіри і підшкірної клітковини:

підвищена вологість шкіри, свербіж, кропив'янка, відчуття жару; іктеричність склер та жовтушність шкіри.

Інші:

зменшення діурезу, часті позиви до сечовипускання; гепатотоксичність (темна сеча, білий кал); медикаментозна залежність, синдром відміни (спастичний біль у животі, нудота, блювання, ринорея, слъозотеча, слабкість, відчуття тривожності, підвищення температури тіла).

Під час застосування препарату в акушерській практиці – пригнічення дихання у новонароджених, яке може бути довготривалим або із затримкою кровообігу.

Повідомлення про підозрювані небажані реакції

Повідомлення про підозрювані небажані реакції після реєстрації лікарського засобу мають важливе значення. Це дає змогу вести постійний моніторинг за співвідношенням користі/ризиків від застосування лікарського засобу. Спеціалісти галузі охорони здоров'я повідомляють про будь-які підозрювані небажані реакції за допомогою національної системи звітності.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

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

Несумісність.

Не слід змішувати в одному шприці з іншими ін'єкційними розчинами.

Налбуфін сумісний з 0,9 % розчином натрію хлориду, 5 % розчином глюкози і розчином

Хартмана.

Упаковка.

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

по 1 мл або 2 мл у попередньо наповненому шприці з голкою в тубусі, по 1 або 10 тубусів в коробці з картону.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ «Юрія-Фарм».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 18030, Черкаська обл., м. Черкаси, вул. Кобзарська, 108. Тел.: (044) 281-01-01.