

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

*Внимательно прочитайте эту инструкцию перед тем, как начать прием этого лекарства.*

- *Сохраните инструкцию, она может потребоваться вновь.*
- *Если у Вас возникли вопросы, обратитесь к врачу.*
- *Это лекарство назначено лично Вам, и его не следует передавать другим лицам, поскольку оно может причинить им вред даже при наличии тех же симптомов, что и у Вас.*

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

**БУПРАНАЛ®**

**Регистрационный номер:** P N002817/01

**Торговое наименование препарата:** Бупранал®

**Международное непатентованное наименование:** бупренорфин (buprenorphinum)

**Химическое наименование:** (6R,7R,14S)-17-(Циклопропил-метил)-7,8-дигидро-7-[(1S)-1-гидрокси-1,2,2-триметил-пропил]-6-О-метил-6,14-этанол-17-норморфина гидрохлорид

Лекарственная форма: раствор для инъекций

**Состав.**

1 мл раствора содержит:

Действующее вещество:

бупренорфина гидрохлорид - 0,324 мг,  
в пересчете на бупренорфин - 0,300 мг,

Вспомогательные вещества:

декстрозы моногидрат  
(в пересчете на безводную) - 50,000 мг,  
вода для инъекций - до 1 мл.

**Описание:**

**Прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.**

**Фармакотерапевтическая группа:** Анальгезирующее наркотическое средство: опиоидных рецепторов агонист-антагонист.

*Относится к Списку II «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».*

**Код АТХ:** [N02AE01]

**Фармакологические свойства**

**Фармакодинамика**

Наркотический анальгетик, частичный (частичный) агонист мю-опиоидных рецепторов, прочно с ними связывающийся, и частичный антагонист каппа-опиоидных рецепторов. По фармакологическому эффекту превышает морфин (0,3 мг бупренорфина эквивалентно 10 мг морфина). Активирует антиноцицептивную систему и, таким образом, нарушает межнейронную передачу болевых импульсов на различных уровнях центральной нервной системы, а также изменяет эмоциональную окраску боли, воздействуя на высшие отделы головного мозга. Имеет низкий наркотический потенциал.

Тормозит условные рефлексы, вызывает эйфорию, обладает умеренным снотворным действием, центральным противокашлевым эффектом, возбуждает рвотный центр, по способности угнетать дыхание равен морфину, вызывает сужение зрачка за счет активации глазодвигательного нерва, повышает тонус центра блуждающего нерва, бронхов и гладкомышечных сфинктеров внутренних органов (кишечника, желчевыводящих путей, мочевого пузыря), ослабляет перистальтику кишечника, тормозит секреторную активность желез желудочно-кишечного тракта. В плане развития лекарственной зависимости при длительном применении менее опасен, чем морфин.

Начало действия после внутривенного введения - 15 мин, после внутримышечного - 30 минут. Максимальное действие развивается через 1-2 ч. Длительность анальгезирующего действия - 6-8 ч (больше, чем у морфина).

### **Фармакокинетика**

С белками плазмы крови связывается 96 % бупренорфина (преимущественно с альфа- и бета-глобулинами). Равномерно распределяется в тканях, проникает через гематоэнцефалический барьер.

Метаболизируется в печени путем N-деалкилирования при участии изофермента CYP3A4 с образованием фармакологически активного метаболита - норбупренорфина. Часть неизмененного бупренорфина, а также активного метаболита подвергается глюкуронированию. Период полувыведения - 3-6 часов.

Выводится с желчью 69 % (33 % - в неизмененном виде, 5 % - в виде глюкуронида; 21 % - в виде норбупренорфина и 2 % - в виде его глюкуронида) и почками 30 % (1 % - в неизмененном виде и 9,4 % - в виде глюкуронида; 2,7 % - в виде норбупренорфина и 11 % - в виде его глюкуронида).

### **Показания к применению**

Применяется как обезболивающее средство при выраженном болевом синдроме травматического происхождения, ожогах, в предоперационном, операционном и послеоперационном периодах, при инфаркте миокарда, тяжелых приступах стенокардии, болях при злокачественных образованиях и других состояниях, сопровождающихся сильными болями.

### **Противопоказания**

- повышенная чувствительность к препарату,
- лекарственная зависимость, в том числе опиоидная зависимость,
- состояния, сопровождающиеся угнетением дыхания или выраженным угнетением центральной нервной системы,
- судорожные состояния,
- черепно-мозговая травма,
- острая алкогольная интоксикация,
- бронхиальная астма, астматический статус,
- легочно-сердечная недостаточность,
- нарушения ритма сердца (пароксизмальная тахикардия наджелудочковая, желудочковая, фибрилляция и трепетание предсердий, фибрилляция и трепетание желудочков, экстрасистолы),
- паралитический илеус,
- острые хирургические заболевания органов брюшной полости до установления диагноза,
- возраст до 18 лет,
- не следует применять препарат Бупранал® на фоне лечения ингибиторами моноаминоксидазы и еще в течение 14 дней после их отмены.

#### С осторожностью

- дыхательная недостаточность,
- печеночная и/или почечная недостаточность,
- микседема,
- гипотиреоз,
- надпочечниковая недостаточность,
- угнетение центральной нервной системы,
- токсический психоз,
- гиперплазия предстательной железы,
- стриктуры уретры,
- алкоголизм,
- пожилой и старческий возраст.

#### **Применение при беременности и в период грудного вскармливания**

Противопоказано применение препарата Бупранал® при беременности и в период грудного вскармливания.

#### **Способ применения и дозы**

Препарат Бупранал® 0,3 мг/мл в шприц-тюбиках вводят внутримышечно, в ампулах внутримышечно или внутривенно медленно по 1-2 мл. При необходимости повторно препарат вводят через каждые 6-8 часов. Высшая суточная доза - 2,4 мг.

Под тщательным наблюдением и в уменьшенных дозах Бупранал® следует применять на фоне действия средств для общей анестезии, снотворных препаратов, анксиолитиков, антидепрессантов и нейролептиков во избежание чрезмерного угнетения центральной нервной системы и подавления активности дыхательного центра.

Дозу препарата необходимо уменьшить у пациентов старшего возраста, при гиповолемических состояниях, при риске хирургической патологии, при одновременном использовании седативных средств и других наркотических анальгетиков.

Продолжительность лечения и дозировки определяются врачом индивидуально для каждого пациента в зависимости от типа, причин и особенностей болевого синдрома.

### **Побочное действие**

*Со стороны нервной системы:* седация, головокружение, головная боль, спутанность сознания, заторможенность, эйфория, слабость, нервозность, депрессия, возбуждение, тревога, сонливость, замедление скорости психических и двигательных реакций.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* снижение артериального давления, повышение артериального давления, тахикардия, брадикардия.

*Со стороны дыхательной системы:* гиповентиляция, одышка, угнетение дыхательного центра.

*Со стороны желудочно-кишечного тракта:* тошнота, рвота, сухость во рту, запор.

*Со стороны мочеполовой системы:* задержка мочеиспускания, снижение эрекции.

*Аллергические реакции:* кожная сыпь, зуд.

*Прочие:* потливость, миоз, диплопия, чувство жара, озноб.

При длительном применении препарата Бупранал® возможно развитие привыкания (ослабление обезболивающего действия) и опиоидной зависимости.

### **Передозировка**

Симптомы: тошнота, рвота, сонливость, выраженный миоз (при значительной гипоксии - мидриаз), снижение артериального давления, гипотермия, угнетение дыхания (вплоть до его остановки), ступор, кома.

Лечение: налоксон в дозе 0,4-2 мг. Если применение в указанной дозе не приносит ожидаемого эффекта, введение в той же дозе повторяют через 2-3 мин. Введение налоксона, даже в больших дозах, не всегда приводит к восстановлению адекватного дыхания, в связи с этим, проводят мероприятия, направленные на поддержание адекватной легочной вентиляции и деятельности сердечно-сосудистой системы. При необходимости проводят симптоматическую терапию.

### **Взаимодействие с другими лекарственными средствами**

Усиливает угнетающее влияние на центральную нервную систему и дыхание других наркотических анальгетиков, средств для общей анестезии, снотворных, седативных, антипсихотических, блокаторов Н<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов с центральным компонентом

действия, анксиолитиков, антидепрессантов, этанола, ингибиторов моноаминоксидазы. Одновременное применение с ингибиторами моноаминоксидазы противопоказано.

Налоксон предупреждает угнетающее действие препарата Бупранал® на дыхание, но не всегда эффективно устраняет уже развившийся эффект, даже в высоких дозах.

Препарат не следует комбинировать с наркотическими анальгетиками из группы агонистов (морфин, тримеперидин, фентанил) и агонистов-антагонистов (налбуфин, буторфанол) опиоидных рецепторов из-за опасности ослабления анальгезии и возможности провоцирования синдрома «отмены» у пациентов с опиоидной зависимостью.

Может вызвать абстинентный синдром у пациентов с лекарственной зависимостью к полным агонистам мю-опиоидных рецепторов (морфин, героин, тримеперидин, фентанил).

Ингибиторы изофермента CYP3A4 (ритонавир, флуконазол и другие) увеличивают активность бупренорфина. Индукторы изофермента CYP3A4 (кетоконазол, лоперамид и другие) снижают фармакологическую активность препарата.

### **Особые указания**

Для обезболивания при родах не применяют из-за низкой эффективности налоксона в случае угнетения дыхания у новорожденного.

Не рекомендуется применять при непродолжительных (менее 2 ч) хирургических вмешательствах.

В период лечения следует воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Следует соблюдать осторожность при назначении препарата пациентам с черепно-мозговой травмой, сопровождающейся ликворной гипертензией; с повышенным внутричерепным давлением; с нарушением функции дыхания; с выраженной легочной недостаточностью; нарушениями функции печени и почек; микседемой или гипотиреозом; недостаточностью надпочечников; депрессией центральной нервной системы. Индивидуальный подбор дозы необходим также и у пациентов с гипертрофией простаты, стриктурой уретры.

### **Форма выпуска**

Раствор для инъекций 0,3 мг/мл в ампулах по 1 мл. По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой; 1 или 2 контурные ячейковые упаковки с инструкцией по применению, скарификатором или ножом ампульным в пачку из картона.

20, 50 или 100 контурных ячейковых упаковок, с инструкциями по применению (по количеству контурных ячейковых упаковок), скарификаторами или ножами ампульными в коробки из картона или ящики из гофрированного картона (для стационаров).

При упаковке ампул с насечками, кольцами, точками надлома скарификаторы или ножи ампульные не вкладывают.

Раствор для инъекций 0,3 мг/мл в шприц-тюбиках по 1 мл (см<sup>3</sup>). По 20, 50, 100 шприц-тюбиков с инструкцией по применению препарата и инструкцией по использованию шприц-тюбика в коробку из картона (для комплектации аптек военнослужащих Вооруженных сил, МЧС, МВД).

#### **Условия хранения**

Список II «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, в защищенном от света месте при температуре не выше 15 °С для препарата в шприц-тюбиках.

Хранить в местах, недоступных для детей.

#### **Срок годности**

4 года (для препарата в ампулах).

2 года (для препарата в шприц-тюбиках).

Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

#### **Условия отпуска**

Препарат в ампулах отпускают по рецепту с ограничениями, предусмотренными для наркотических препаратов.

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

**Владелец регистрационного удостоверения/организация, принимающая претензии:**

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»,

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

Тел./факс (495) 678-00-50/911-42-10.

<http://www.endopharm.ru>.

**Наименование, адрес производителя лекарственного препарата и адрес места производства лекарственного препарата:**

Федеральное государственное унитарное предприятие «Московский эндокринный завод»,

109052, Россия, г. Москва, ул. Новохоловская, 25, стр. 1, стр. 2.