Бупраксон

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Форма выпуска, описание и состав

Таблетки сублингвальные круглые, двояковыпуклые, белого цвета.

	1 таб.
бупренорфина гидрохлорид	0.216 мг
налоксона гидрохлорид	0.222 мг

Вспомогательные вещества: лактозы моногидрат - 27.729 мг, маннитол (маннит) - 18 мг, крахмал картофельный - 9 мг, повидон (поливинилпирролидон низкомолекулярный медицинский) - 1.233 мг, кросповидон (полипласдон XL - 10) - 1.8 мг, лимонной кислоты моногидрат (или лимонная кислота в пересчете на лимонной кислоты моногидрат) - 0.6 мг, магния стеарат - 0.6 мг, кремния диоксид коллоидный (аэросил) - 0.6 мг.

10 шт. - упаковки контурные ячейковые (1) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (2) - пачки картонные.
10 шт. - упаковки контурные ячейковые (100) - коробки картонные (для стационаров).
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (200) - коробки картонные (для стационаров).
10 шт. - упаковки ячейковые контурные (400) - коробки картонные (для стационаров).

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Комбинированное лекарственное средство. При сублингвальном применении фармакологическое действие определяется входящим в состав препарата бупренорфином.

Бупренорфин - опиоидный анальгетик, полусинтетическое производное тебаина. Относится к частичным агонистам подтипа μ-опиоидных рецепторов и частичным антагонистам к-опиоидных рецепторов. По выраженности анальгезирующего действия в эквивалентных дозах аналогичен морфину. Как частичный агонист опиоидных рецепторов угнетает дыхание, влияет на гладкую мускулатуру, хотя и в меньшей степени, чем морфин и другие опиаты, имеет меньший по сравнению с ними потенциал развития физической зависимости. В то же время, активация р-опиоидных рецепторов определяет определенный аддиктивный потенциал бупренорфина.

Налоксон - антагонист опиоидных рецепторов. Эффективно устраняет или ослабляет эффекты опиатов и опиоидов. Восстанавливает дыхание, уменьшает седативное и эйфоризирующее действие. Может вызывать синдром отмены опиатов при их предварительном введении с целью обезболивания или у наркозависимых людей, использующих опиоидные анальгетики. Фармакологическое действие развивается только при парентеральном (в/в, в/м, п/к) применении. При сублингвальном пути введения практически не попадает в системный кровоток и не оказывает эффекта.

Фармакодинамические эффекты отсутствуют. Налоксон практически не проявляет фармакологической активности

при приеме внутрь, отношение эффективности налоксона при пероральном и парентеральном введении составляет 1:50.

Начало действия бупренорфина после сублингвального применения данной комбинации наступает через 30 мин. Максимальное действие наблюдается через 3 ч. Длительность анальгезирующего действия - 5 ч.

Фармакокинетика

Бупренорфин

При сублингвальном приеме бупренорфин хорошо всасывается. Системная биодоступность составляет 50-55%. C_{max} в плазме крови после приема 400 мкг бупренорфина достигается через 2 ч и составляет в среднем 1.13 нг/мл. Бупренорфин хорошо проникает через ГЭБ. Связывание с белками плазмы крови, в первую очередь с α- и β-глобулинами составляет 96%. V_d бупренорфина составляет 2.5 л, что указывает на его активный захват органами организма. Бупренорфин подвергается метаболизму в печени путем N-дезалкилирования с образованием норбупренорфина с участием изофермента CYP3A4, с последующим глюкуронированием, с образованием конъюгатов с глюкуроновой кислотой. Основной метаболит - норбупренорфин не обладает существенной анальгезирующей активностью и также подвергается глюкуронированию.

$T_{1/2}$ бупренорфина из плазмы крови составляет 24-42 ч. Выводится в виде метаболитов почками - 30% и с желчью - 69%; в неизмененном виде - около 1%.

Налоксон

При сублингвальном приеме налоксон практически не всасывается. Системная биодоступность составляет менее 5%. Концентрация в плазме крови не являются клинически значимыми. Связывание с белками плазмы крови, главным образом, с альбумином, составляет 45%.

Всосавшиеся незначительные количества налоксона, входящего в состав данной комбинации, не создают терапевтических концентраций в плазме крови и не оказывают влияния на эффекты и метаболизм бупренорфина. Налоксон быстро метаболизируется в печени, подвергаясь прямой глюкуронизации до налоксон-3-глюкуронида, а также N-дезалкилированию и восстановлению (по 6-оксогруппе). $T_{1/2}$ налоксона составляет 2-12 ч. Метаболиты выводятся преимущественно почками.

Показания к применению:

Послеоперационный болевой синдром (сильной и средней интенсивности), болевой синдром, обусловленный травмами и ожогами, при проведении диагностических процедур.

Относится к болезням:

- Болевой синдром
- Травмы

Противопоказания:

Состояния, которые могут повлечь за собой нарушение дыхания либо уже сопровождаются угнетением дыхательного центра или выраженным угнетением ЦНС; одновременное применение с ингибиторами МАО, как в течение всего периода применения ингибиторов МАО, так и в течение 14 дней после их отмены; стоматит и мукозит, язвенно-некротические и воспалительные поражения слизистой оболочки полости рта; лекарственная зависимость, в т.ч. опиоидная; судорожные состояния; черепно-мозговая травма; острая алкогольная интоксикация; бронхиальная астма, астматический статус; легочно-сердечная недостаточность; нарушения ритма сердца (наджелудочковая и желудочковая пароксизмальная тахикардия, фибрилляция и трепетание предсердий, фибрилляция и трепетание желудочков, экстрасистолия); паралитический илеус; острые хирургические заболевания органов брюшной полости до установления диагноза; применение при беременности и в период грудного вскармливания; возраст до 18 лет; повышенная чувствительность к бупренорфину, налоксону.

С осторожностью

Дыхательная недостаточность; печеночная и/или почечная недостаточность; микседема; гипотиреоз, надпочечниковая недостаточность; угнетение ЦНС; токсический психоз; гиперплазия предстательной железы; стриктуры уретры; алкоголизм; пожилой и старческий возраст.

Способ применения и дозы:

Для сублингвального применения. 1-2 разовые дозы применяют каждые 6-8 часов. В сутки -не более 8 разовых доз.

Дозу необходимо уменьшать у пациентов пожилого возраста, при гиповолемических состояниях, при риске хирургической патологии, при одновременном применении седативных средств и других наркотических анальгетиков.
Данную комбинацию в уменьшенных дозах следует применять на фоне действия средств для общей анестезии, снотворных препаратов, анксиолитиков, антидепрессантов и нейролептиков во избежание чрезмерного угнетения ЦНС и подавления активности дыхательного центра.

Побочное действие:

Определение частоты побочных реакций: очень часто (≥1/10); часто (≥1/100, <1/10), нечасто (≥1/1000, <1/100), редко (≥1/10 000, <1/1000); очень редко (<1/10 000); неизвестно (невозможно оценить на основании имеющихся данных).

Побочные эффекты данной комбинации определяются входящим в ее состав бупренорфином.

Аллергические реакции: редко - сыпь, крапивница.

Со стороны нервной системы: очень часто - седативный эффект; часто - слабость, головокружение, головная боль; редко - шум в ушах, спутанность сознания, сонливость, слабость/утомляемость, заторможенность, замедление скорости психических и двигательных реакций, невнятная речь, парестезия, эйфория, нервозность, депрессия, психоз. При длительном применении возможно развитие привыкания и опиоидной зависимости.

Со стороны кожных покровов: редко - цианоз, зуд.

Со стороны мочевыделительной системы: редко - задержка мочеиспускания.

Со стороны обмена веществ: редко - потливость.

Со стороны пищеварительной системы: часто - тошнота; редко - рвота, сухость во рту, запор.

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

Со стороны органов чувств: часто - миоз, нечеткость зрения, диплопия; очень редко - конъюнктивит.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто - повышение АД, редко - тахикардия, брадикардия, озноб/ощущение холода, "приливы" крови.

В случае передозировки: за счет действия бупренорфина возможны тошнота, рвота, седативный эффект, сонливость, миоз, угнетение дыхания.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказано применение при беременности и в период грудного вскармливания.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Потенцирует действие *нейролептиков, бензодиазепинов, фенотиазинов,* а также других *транквилизаторов; анксиолитиков, седативных, снотворных средств, общих анестетиков, антигистаминных препаратов, этанола.*

При сочетании с *ингибиторами МАО* может развиться злокачественная гипертермия, судороги, кома, артериальная гипертензия.

При сочетании с *полными агонистами опиоидов* возможно развитие синдрома отмены опиоидов.

При применении с *вальпроевой кислотой/вальпроатом натрия* возрастает угнетающее действие на ЦНС.

При приеме *других анальгетиков* может повышаться давление цереброспинальной жидкости, поэтому данную комбинацию следует применять с осторожностью в случаях, когда давление цереброспинальной жидкости может быть увеличено, т.к. бупренорфин может приводить к миозу и изменению уровня сознания.

Препараты, ингибирующие активность изофермента CYP3A4 (в т.ч. кетоконазол, макролиды, эритромицин) или ингибиторы ВИЧ-протеазы (ритонавир) могут усилить эффекты и длительность действия бупренорфина, что потребует коррекции дозы одного или обоих препаратов.

При совместном приеме с *индукторами изофермента CYP3A4 (в т.ч. фенобарбитал, карбамазепин, фенитоин, рифампицин)* концентрация бупренорфина в плазме крови может снижаться. Поскольку взаимодействие бупренорфина со всеми индукторами изофермента CYP3A4 не изучалось, рекомендуется контролировать состояние пациентов, получавших данную комбинацию, на наличие признаков и симптомов синдрома отмены.

Зверобой продырявленный, как индуктор изофермента CYP3A4, способен снижать концентрацию бупренорфина в плазме крови.

Этанол усиливает угнетение ЦНС бупренорфином. В период лечения необходимо отказаться от употребления алкоголя.

Особые указания и меры предосторожности:

Налоксон включен в данную комбинацию с целью увеличения наркологической безопасности при использовании последнего. В случае немедицинского применения лекарственных препаратов, содержащих данную комбинацию (в связи с наличием составе наркотического анальгетика), налоксон будет блокировать эффекты бупренорфина и не приведет к действию, достижение которого преследуется при злоупотреблении бупренорфином. У лиц с физической зависимостью к опиоидам это может привести к развитию синдрома отмены.

Бупренорфин метаболизируется в печени. У пациентов с нарушением функции печени интенсивность и длительность действия бупренорфина могут изменяться. Применение данной комбинации у таких пациентов следует проводить под контролем врача.

Никотин снижает фармакологическую активность данной комбинации.

В случае случайного или преднамеренного приема у детей может возникнуть угнетение дыхание, которое может повлечь за собой летальный исход.

Влияние на способность к управлению транспортными средствами и механизмами

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

Источник: http://drugs.thead.ru/Buprakson