

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

МЕТИЛЕРГОБРЕВІН
(METHYLERGOBREVIN)

Склад:

діюча речовина: метилергометрин;

1 мл розчину містить метилергометринну малеату 0,2 мг;

допоміжні речовини: кислота малеїнова, гліцин, натрію хлорид, тіосечовина, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозорий безбарвний розчин.

Фармакотерапевтична група. Засоби, що підвищують тонус та скоротливу активність міометрія. Код АТХ G02A B01.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Метилергобревін – напівсинтетичне похідне природного алкалоїду ріжків (ергометрину), підвищує тонус та скоротливу активність міометрія. Стимуляційна дія алкалоїдів ріжків на матку проявляється у вигляді інтенсивних скорочень. Вагітна матка, особливо наприкінці вагітності, надзвичайно чутлива до алкалоїдів ріжків. Низькі дози метилергометрину спричиняють інтенсивні ритмічні скорочення матки, які змінюються періодами релаксації. Високі дози цього препарату спричиняють скорочення разом з підвищенням базального тону. Метилергометрин спричиняє скорочення гладеньких м'язів кровоносних судин. Кровообіг через спіральні артерії знижений внаслідок скорочення гладеньких м'язів, а не через вплив лікарського препарату на кровоносні судини матки. Це може призводити до підвищення центрального венозного тиску, а також до підвищення артеріального тиску. Вплив метилергометрину на артеріальний тиск менший, ніж ергометрину.

У післяпологовий період метилергометрин може знижувати продукування пролактину та секрецію молока. Тривале застосування лікарського препарату спричиняє ерготизм (отруєння алкалоїдами ріжків). Метилергометрин посилює тонус матки, частоту та амплітуду її ритмічних скорочень. Його швидкий та тривалий вплив на тонус матки скорочує третій період пологів та зменшує втрати крові. Початок дії препарату настає швидко: негайно після внутрішньовенного введення, протягом 2-6 хв після внутрішньом'язового введення та через 5-10 хв після перорального прийому.

Фармакокінетика.

Терапевтична дія після внутрішньовенного введення проявляється негайно, після внутрішньом'язового введення – через 2-3 хв. Дія препарату триває 3 і більше годин після внутрішньом'язового застосування і до 2 годин – після внутрішньовенного застосування.

Зв'язування препарату з білками плазми становить 35 %. Об'єм розподілу \square 39,1-73,1 л, кліренс – 9,9-18,9 л/год. Препарат швидко розподіляється у клітинах організму – період напіврозподілу після внутрішньовенного застосування становить 1-3 хв. Метаболізується препарат у печінці. Метаболізм метилергометрину, хоча ще недостатньо досліджений, видається подібним до метаболізму ергометрину: він включає у себе гідроксилювання, глюкуронідацію та н-деметилування. Метилергометрин виводиться з організму з калом та сечею. Препарат проникає у грудне молоко.

Клінічні характеристики.

Показання.

Профілактика та лікування кровотечі, спричиненої атонією матки у післяпологовий період та після абортів; лікування субінволюції матки та, за умови ретельного акушерського нагляду, застосування для скорочення другого періоду пологів, з уведенням безпосередньо після появи передньої частини плеча дитини.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препарату та/або алкалоїдів ріжків; перший період пологів; другий період пологів до появи голівки плода; артеріальна гіпертензія; захворювання периферичних судин та серця (наприклад, нестійка або вазоспастична стенокардія); сепсис; токсемія.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Інгібітори СYP 3A4 (макролідні антибіотики та інгібітори протеази)

Були поодинокі повідомлення про побічну дію у зв'язку з одночасним застосуванням деяких препаратів алкалоїдів ріжків (дигідроерготамін та ерготамін) та активних інгібіторів СYP 3A4, що спричинило спазм судин, який призвів до ішемії головного мозку та/або ішемії кінцівок. Хоча не було ніяких повідомлень про подібну взаємодію з метилергометрином, не слід одночасно застосовувати активні інгібітори СYP 3A4 з метилергометрином. Приклади деяких найактивніших інгібіторів СYP 3A4 включають макролідні антибіотики (наприклад еритроміцин, тролеандоміцин, кларитроміцин), інгібітори протеази ВІЛ або оборотної транскриптази (наприклад ритонавір, індінавір, нелфінавір, делавірдин) або азольні фунгіциди (наприклад кетоконазол, ітраконазол, вориконазол). Менш активні інгібітори СYP 3A4 слід застосовувати з обережністю (саквінавір, нефазодон, флюконазол, грейпфрутовий сік, флуоксетин, флувоксамін, зілеутон та клотримазол). Цей перелік не є вичерпним і лікар повинен брати до уваги ефекти на СYP 3A4 інших агентів при одночасному застосуванні з метилергометрином.

Індуктори СYP 3A4

Препарати (наприклад невірапін, рифампіцин), які є сильними індукторами СYP 3A4, у більшості зменшують фармакологічну дію Метилергобревіну.

Бета-блокатори

Необхідно бути обережними при одночасному застосуванні Метилергобревіну з бета-блокаторами. Одночасне застосування з бета-блокаторами може підсилити судиннозвужувальну дію алкалоїдів ріжків.

Анестетики

Такі анестетики як галотан, метоксифлуран можуть зменшити пологостимулювальний ефект Метилергобревіну.

Гліцерил тринітрат та інші антиангінальні засоби

Метилергометрин малеат звужує судини і може очікувано зменшувати ефект гліцерил тринітрату та інших антиангінальних засобів.

Невідомі будь-які фармакокінетичні взаємодії з іншими ізоферментами цитохрому P450.

Необхідно бути обережними при одночасному застосуванні Метилергобревіну (метилергометрин малеату) з іншими судиннозвужувальними препаратами, алкалоїдами ріжків або простагландинами. Не рекомендується одночасне застосування Метилергобревіну та бромокриптину.

Для профілактики та лікування маткових кровотеч інколи необхідне одночасне застосування двох засобів, стимулюючих скорочення матки, таких як Метилергобревін та окситоцин.

Особливості застосування.

У випадку внутрішньовенного застосування Метилергобревін слід вводити повільно, щонайменше протягом 60 секунд, з одночасним ретельним контролем артеріального тиску, оскільки існує небезпека раптового підвищення артеріального тиску та важкого порушення мозкового кровообігу.

Забороняється артеріальне або періартеріальне введення препарату.

Метилергобревін з обережністю застосовувати у пацієнтів із захворюванням печінки та нирок.

Пацієнти із захворюваннями коронарних артерій чи з наявністю факторів ризику захворювань коронарних судин (наприклад куріння, ожиріння, діабет, наявність високого рівня холестерину) більш схильні до розвитку ішемії та інфаркту міокарду внаслідок метилергометрин-індукованого спазму.

Ампули необхідно ретельно оглянути перед застосуванням. У разі наявності осаду у розчині чи зміни кольору розчину препарат не можна застосовувати.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Не дозволяється призначати препарат у період вагітності через його дію на тонус матки. Не рекомендується призначати Метилергобревін у період годування груддю у зв'язку з тим, що препарат проникає у грудне молоко: потрібно вирішити питання про припинення годування груддю на період лікування.

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

У зв'язку з розвитком побічних реакцій з боку центральної нервової системи слід утримуватись від керування автотранспортом та роботи з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

– *Пологи*

Вводять 0,2 мг внутрішньом'язово або внутрішньовенно 0,1-0,2 мг (0,5-1 мл) Метилергобравіну після появи голівки та передньої частини плеча плода. Для пологів під наркозом рекомендується введення 0,2 мг (1 мл) Метилергобравіну. У випадку пологів з тазовим передлежанням плода ін'єкцію слід проводити безпосередньо після народження дитини, а у випадку багатоплідної вагітності – після народження останньої дитини. Якщо здійснення внутрішньовенної ін'єкції неможливе, то 0,2–0,4 мг (1-2 мл) лікарського препарату слід уводити шляхом внутрішньом'язової ін'єкції.

– *Кесарів розтин*

Вводять після народження плода: внутрішньовенно – 0,05-0,1 мг (евентуально 0,2 мг) або внутрішньом'язово – 0,2 мг (1 мл).

– *Атонія матки після пологів та аборт*

При атонічній матковій кровотечі призначати 0,2 мг (1 мл) внутрішньом'язово або 0,1 мг (0,5 мл).

– *Аборт*

Перед втручанням вводять внутрішньовенно 0,1-0,2 мг (0,5-1 мл) препарату. При спонтанних абортах (викиднях) показане внутрішньовенне введення 0,05-0,1 мг (0,25-0,5 мл).

– *Субінволюція матки*

При терапії субінволюції матки застосовувати 0,1-0,2 мг (0,5-1 мл) підшкірно або внутрішньом'язово до 3 разів на день. Не рекомендується продовжувати лікування більше 5-6 днів (для запобігання виникнення явищ ерготизму).

Діти.

Препарат не призначений для застосування дітям.

Передозування. Симптомами передозування є нудота, блювання, олігурія, абдомінальний біль, відчуття оніміння та поколювання у кінцівках, підвищення артеріального тиску, що супроводжується у тяжких випадках гіпотензією, пригніченням дихання, гіпотермією, головним болем, конвульсіями та комою. У випадку передозування проводити симптоматичне лікування і ретельно контролювати функції серцево-судинної та дихальної систем.

Побічні реакції

З боку імунної системи: анафілаксія.

Психічні розлади: галюцинації.

З боку нервової системи: головний біль, запаморочення; цереброваскулярні розлади, парестезія, судоми, спазми м'язів кінцівок, зміна смаку, інсульт.

З боку органів слуху та лабіринту: вертиго, шум у вухах.

З боку серця: відчуття серцебиття, брадикардія або тахікардія, біль у грудях, спазм коронарних судин, фібриляція шлуночків, шлуночкові тахікардія, стенокардія, атріовентрикулярна блокада, інфаркт міокарда.

З боку судинної системи: тимчасове підвищення артеріального тиску, спазм периферичних судин, гіпотензія.

Респіраторні, торакальні та медіастинальні порушення: закладеність носа, диспное, набряк легенів.

З боку травної системи: нудота, блювання, абдомінальний біль.

З боку шкіри та підшкірних тканин: висип, пітливість.

З боку нирок та сечовивідних шляхів: гематурія.

Загальні порушення та порушення у місці введення препарату: зміни в місці введення, включаючи тромбофлебіт.

З боку репродуктивної системи: апоплексія, інтоксикація водами.

Метилергобравін знижує секрецію молока.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Препарат не слід змішувати в одному шприці з іншими лікарськими засобами.

Упаковка. По 1 мл в ампулі; по 5 ампул у блістері, по 10 блістерів у картонній упаковці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. «Хемофарм» АД/«Hemofarm» AD.

Місцезнаходження.

Белградський шлях б/н, 26300, м. Вршац, Сербія/Beogradski put bb, 26300, Vrsac, Serbia.