

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
ДЕКСАМЕТАЗОН-ДАРНИЦЯ
(DEXAMETHASONE-DARNITSA)

Загальна характеристика:

міжнародна та хімічна назви: Dexamethasone, 9-фтор-11 β ,17,21-тригідрокси-16 α -метилпрегна-1,4-діен-3,20-діон динатрію 21-фосфат;

основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина;

склад: 1 мл розчину містить дексаметазону натрію фосфат 0,004 г;

допоміжні речовини: натрій фосфорнокислий двоаміщений, гліцерин, спирт бензиловий, динатрієва сіль етилендіамінтетраоцтової кислоти, вода для ін'єкцій.

Форма випуску. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група. Кортикостероїди для системного застосування. Глюкокортикоїди. Дексаметазон. Код АТС H02A B02.

Фармакологічні властивості. *Фармакодинаміка.* Дексаметазон-Дарниця – синтетичний глюкокортикостероїд, метильоване похідне фторпреднізолону. Дексаметазон при введенні в організм проникає усередину клітин, зв'язується з цитоплазматичними рецепторами, утворюючи комплекс, що у ядрі клітини стимулює синтез іРНК, внаслідок цього стимулюється утворення білків, у т.ч. ліпокартину. Ліпокартин пригнічує фосфоліпазу А₂, чим гальмує вивільнення арахідонової кислоти та утворення її ендоперекиснів. Знижується синтез простагландинів та лейкотриєнів, що регулюють запальну й алергічну реакції.

Впливає на усі види обміну. Зменшує кількість білка в плазмі крові (знижує вміст глобулінів) і підвищує коефіцієнт альбуміни/глобуліни. Підвищує синтез альбумінів у печінці та нирках, підсилює катаболізм білка в м'язовій тканині. Підвищує синтез тригліцеридів та вищих жирних кислот. Перерозподіляє жирові депо (обличчя, живіт, плечовий пояс), сприяє розвитку гіперхолістеринемії. Підвищує активність глюкозо-6-фосфатази, фосфоенолпіруват карбоксилази та амінотрансфатаз через що збільшується рівень глюкози в крові, підсилюється неоглюкогенез.

Виявляє протиалергічну дію, знижує кількість циркулюючих еозинофілів, знижує виділення медіаторів негайної алергії. Гальмує вивільнення цитокинів з лімфоцитів і макрофагів. За силою глюкокортикоїдної активності перевищує кортизол, гідрокортизол та преднізолон.

Фармакокінетика. При внутрішньом'язовому введенні швидко всмоктується у кров, де 60-70 % препарату зв'язується зі специфічним білком-переносником транскортином. У лікворі після внутрішньовенного введення максимальна концентрація дексаметазону спостерігається через 4 год. та становить 15-20 % від концентрації у плазмі крові. Легко проходить крізь гістогематичний бар'єр, включаючи гемоенцефалічний та плацентарний. Біотрансформується переважно у печінці до неактивних метаболітів (головним чином, за рахунок кон'югації з глюкуроною та сірковою кислотами). Загальний кліренс становить 3,7 мл/хв кг, період напіввиведення з крові (T_{1/2}) – 3,0-4,5 год. Близько 80 % препарату, що був введений, елімінується нирками у вигляді глюкуроніду упродовж 24 год.

При тяжких захворюваннях печінки, вагітності, період напіввиведення дексаметазону збільшується.

Показання для застосування. Шок різного генезу (анафілактичний, післятравматичний, післяопераційний, кардіогенний), набряк головного мозку (при пухлинній хворобі, черепно-мозковій травмі, нейрохірургічному втручанні, крововиливі у мозок, енцефаліті, менінгіті, променевою ураженні), гостра наднирковозалозна недостатність, первинна недостатність кори надниркових залоз (хвороба Адіссона), адреногенітальний синдром, захворювання суглобів (артрити різної етіології, плечолопатковий периартрит, епіконділіт, стиліодит, бурсит, тендовагініт, компресійна невропатія,

остеохондроз, остеоартроз), тяжкі алергічні реакції (набряк Квінке, бронхоспазм, гостра анафілактична реакція при переливанні сироватки, пірогенні реакції), гострий круп, гострі гемолітичні анемії, тромбоцитопенія, гостра лімфобластна лейкемія, агранулоцитоз.

Спосіб застосування та дози. Дорослим вводять внутрішньовенно та внутрішньом'язово 1-5 мл (відповідно 4-20 мг дексаметазону) 3-4 рази на добу. Максимальна добова доза – 20 мл (80 мг дексаметазону).

Дітям призначають внутрішньом'язово за розрахунком 0,04-0,16 мг/кг (0,01-0,04 мл/кг) кожні 12-24 год.

Режим дозування встановлюють індивідуально залежно від характеру та вираженості захворювання, а також стану хворого. Застосування препарату у високих дозах можливе упродовж не більше одного тижня, далі слід поступово зменшувати дозу препарату або переходити на пероральне застосування дексаметазону.

Побічна дія. *З боку ендокринної системи:* стероїдний діабет, порушення секреції статевих гормонів (порушення менструального циклу, гірсутизм, імпотенція), затримання росту дітей, вторинна недостатність кори надниркових залоз, синдром Іценко-Кушинга;

з боку травної системи: ерозивно-виразкові ураження шлунково-кишкового тракту, геморагічний панкреатит, атонія шлунково-кишкового тракту, підвищення апетиту, нудота, блювання;

з боку центральної нервової системи: запаморочення, головні болі, лабільність настрою, депресія, психози;

з боку серцево-судинної системи: затримка натрію та води, артеріальна гіпертензія, підвищення внутрішньочерепного та внутрішньоочного тиску, підвищення ризику тромбоемболії;

дерматологічні реакції: петехії, стрії, атрофія шкіри, екхімоз;

інші: остеопороз, імуносупресія, підвищення ризику виникнення або загострення грибкових, вірусних або бактеріальних інфекцій, пригнічення регенеративних та репаративних процесів, підвищене потовиділення, міопатія, глаукома, катаракта.

Протипоказання. Виразкове ураження шлунка та/або кишечника, виражений остеопороз, цукровий діабет, артеріальна гіпертензія, тяжка міопатія, гострі психози, гостра ниркова недостатність, глаукома, період до і після профілактичних щеплень (особливо противірусних), вірусні захворювання, системні мікози, активні форми туберкульозу, інфекційні ураження суглобів та навколосуглобових м'язів тканин, вагітність, період лактації, підвищена чутливість до компонентів препарату.

Передозування. При передозуванні спостерігається загострення симптомів, описаних у розділі «Побічна дія».

Лікування: припинення прийому препарату і симптоматична терапія, спрямована на підтримку життєво важливих функцій. Специфічного антидоту нема.

Особливості застосування. З особливою обережністю препарат застосовують при бактеріальній та амебній інфекціях, тромбоемболіях, серцевій та нирковій недостатності за умов одночасного проведення адекватного лікування основного захворювання. У пацієнтів, що мають в анамнезі психоз, препарат застосовують лише за життєвими показаннями. При гіпотиреозі та цирозі печінки дія препарату може підсилюватися. У період лікування дексаметазоном грудне вигодовування необхідно припинити.

Перед початком терапії дексаметазоном необхідно провести обстеження пацієнта і виключити наявність гастроінтестинальних виразок. Пацієнтам зі схильністю до цієї патології необхідно з профілактичною метою призначити препарати для лікування кислотозалежних захворювань. Проводити постійний контроль їх стану, включаючи рентгенологічне обстеження.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами. Одночасне застосування пероральних контрацептивів

підвищує період напіввиведення дексаметазону.

Дексаметазон підсилює ефект серцевих глікозидів за рахунок дефіциту кальцію, послаблює гіпоглікемізуючу дію протидіабетичних засобів і антикоагуляційний ефект похідних кумарину. Ріфампіцин, фенітоїн, барбітурати послаблюють, а естрогенвміщуючі пероральні контрацептиви підсилюють дію дексаметазону.

Одночасне застосування препарату із салуретиками призводить до підсиленого виведення калію, при сполученому прийомі з тіроліберином знижується рівень тиреотропного гормону у крові. При одночасному застосуванні з нестероїдними протизапальними засобами зростає небезпека виникнення гастропатії. Протималярійні засоби (хлорохін, гідроксихлорохін, мефлохін) у сполученні з дексаметазоном можуть підвищувати ризик розвитку міопатії, кардіоміопатії. Інгібітори ангіотензинперетворюючого ферменту при одночасному призначенні з дексаметазоном можуть змінювати склад периферичної крові. Спільне застосування з α - та β -адреноміметиками, Н-холіноблокаторами може призводити до підвищення внутрішньоочного тиску. Одночасне призначення з антигістамінними препаратами знижує ефективність дексаметазону.

Умови та термін зберігання. Зберігати в захищеному від світла місці при температурі не вище 15 °С до 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Термін придатності – 2 роки.

Умови відпуску. За рецептом.

Упаковка. По 1 мл в ампулах. По 5 або 10 ампул в коробці з картону. По 5 або 10 ампул в касеті, 1 касеті у пачці з картону.

Виробник. ЗАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

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