

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
НАЛОКСОН-М
(NALOXONUM-M)

Склад:

діюча речовина: naloxone;

1 мл розчину містить 0,4 мг налоксону гідрохлориду у перерахуванні на 100 % речовину;

допоміжні речовини: натрію хлорид; 0,1 М розчин кислоти хлористоводневої; вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Фармакотерапевтична група.

Антидоти. Код АТС V03A B15.

Клінічні характеристики.**Показання.**

Передозування опіоїдів. Для усунення пригнічення дихального центру, викликаного опіоїдами; для відновлення дихання у новонароджених після введення породіллі опіоїдних аналгетиків; як діагностичний засіб у хворих з підозрою на опіоїдну залежність.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до препарату.

Спосіб застосування та дози.

Налоксон-М застосовують внутрішньовенно струминно (ін'єкція), внутрішньовенно краплинно (інфузія), а також внутрішньом'язово. Дозу встановлює лікар індивідуально для кожного пацієнта. Внутрішньом'язові ін'єкції призначають у випадках, коли внутрішньовенне введення неможливе.

У гострих випадках слід надавати перевагу внутрішньовенному застосуванню препарату, оскільки воно забезпечує найшвидший терапевтичний ефект. При введенні внутрішньом'язово ефект препарату проявляється пізніше, але триває довше (порівняно з внутрішньовенним застосуванням).

Тривалість дії налоксону залежить від введеної дози, шляху введення і коливається в межах від 45 хв до 4 годин.

Оскільки дія деяких опіоїдів (наприклад, декстропропоксифен, дигідрокодеїн, метадон) триває довше, ніж дія налоксону, пацієнти мають перебувати під безперервним наглядом, а повторні дози можна призначати тільки у разі необхідності.

Повне або часткове усунення пригнічення дихального центру, спричиненого опіатами.***Дорослі***

Дози визначає лікар індивідуально з метою нормалізації функції дихання при підтриманні адекватної аналгезії. Внутрішньовенна ін'єкція налоксону в дозі 0,1 - 0,2 мг (приблизно 1,5 - 3 мкг на 1 кг маси тіла) зазвичай є достатньою. За необхідності додатково можна вводити 0,1 мг з інтервалом 2 хв до повного відновлення дихання і свідомості. Додаткове введення може бути необхідним у період від 1 до 2 годин – залежно від типу дії активної речовини (короткочасний ефект або повільна дія), щодо якої налоксон є антагоністом, її застосованої кількості, тривалості та способу введення.

Альтернативно Налоксон-М можна застосовувати як внутрішньовенну інфузію. Тривалість дії деяких опіоїдів більша за тривалість дії налоксону, введеного внутрішньовенно болюсно. Тому якщо пригнічення дихального центру спричинене такими речовинами або є підозра на це, налоксон слід застосовувати у вигляді внутрішньовенної інфузії. Швидкість введення визначають залежно від стану пацієнта, а також його реакції на внутрішньовенну ін'єкцію та інфузію. Слід розглянути можливість безперервної внутрішньовенної інфузії та за необхідності вжити заходів для підтримання дихання.

Діти

Початкова доза налоксону становить 0,01 - 0,02 мг на 1 кг маси тіла внутрішньовенно протягом 2 - 3 хв до повного відновлення дихання і свідомості. Додаткові дози можна призначати з інтервалом 1 - 2 години залежно від реакції пацієнта, дози і тривалості дії опіатів, що застосовуються.

Гостре передозування опіатів

Дорослі

Початкова доза становить 0,4 - 2 мг внутрішньовенно. Якщо не настає відновлення дихання, введення слід повторити через 2 - 3 хв. Налоксон-М можна також вводити внутрішньом'язово (початкова доза – 0,4 - 2 мг), якщо внутрішньовенне введення неможливе. Якщо при введенні налоксону в дозі 10 мг стан пацієнта не покращився, можна зробити висновок, що пригнічення дихального центру спричинене іншими чинниками або іншими препаратами, а не опіоїдами.

Діти

Рекомендована початкова доза – 0,1 мг на 1 кг маси тіла внутрішньовенно. Якщо бажаного ефекту не досягнуто, додатково у вигляді ін'єкції вводять 0,1 мг на 1 кг маси тіла. Залежно від стану пацієнта може бути показана внутрішньовенна інфузія. Якщо внутрішньовенне введення неможливе, Налоксон-М вводять внутрішньом'язово в початковій дозі 0,01 мг на 1 кг маси тіла, розділений на кілька введень.

Відновлення дихання у новонароджених, матері яких отримували опіоїди

Звичайна доза – 0,01 мг на 1 кг маси тіла внутрішньовенно. Якщо при застосуванні цієї дози дихальна функція не відновлюється, введення можна повторити через 2 - 3 хв. При неможливості внутрішньовенного введення Налоксон-М вводять внутрішньом'язово в початковій дозі 0,01 мг на 1 кг маси тіла.

Пацієнти літнього віку

Пацієнтам літнього віку із серцево-судинними захворюваннями або які отримували кардіологічні препарати, Налоксон-М слід застосовувати з обережністю. Слід враховувати такі небажані ефекти, як тахікардія і фібриляція шлуночків у післяопераційних хворих під час призначення Налоксону-М.

Розведення розчину

Для внутрішньовенної інфузії Налоксон-М розводять 0,9 % розчином натрію хлориду або 5 % розчином глюкози. Вміст 5 ампул препарату (2 мг) розводять 500 мл одного із зазначених розчинників до отримання концентрації готового розчину 4 мкг/мл.

Перед застосуванням, а також після розведення необхідно перевірити розчин на прозорість. Застосовується тільки прозорий, безбарвний, без видимих частинок розчин.

Побічні реакції.

При швидкому введенні Налоксону-М можуть виникати різні реакції.

З боку травного тракту: нудота, блювання.

З боку серцево-судинної системи: тахікардія, артеріальна гіпертензія, зупинка серця.

З боку центральної нервової системи: тремтіння, судоми.

Алергічні реакції: шкірний висип, свербіж, кропив'янка, ангіоневротичний набряк.

Інші: посилення пітливості.

При застосуванні Налоксону-М у післяопераційному періоді в дозах, які перевищують мінімально необхідні, можливе зникнення анальгезії і збудження, артеріальна гіпотензія або гіпертензія, шлуночкова тахікардія, фібриляція шлуночків, набряк легенів.

Синдром «відміни» у пацієнтів з опіоїдною залежністю: невизначений біль, діарея, гіпертермія, ринорея, чхання, підвищена пітливість, нудота, блювання, знервованість, втомлюваність, дратівливість, тремор, спазми в епігастральній ділянці, тахікардія, слабкість; у новонароджених – судоми, діарея, гіпертермія, безперервний крик, гіперрефлексія, чхання, тремор, незвична роздратованість, блювання.

При застосуванні у терапевтичних дозах у хворих, в організмі яких не містяться опіоїди, Налоксон-

М, як правило, не спричиняє побічних ефектів.

Передозування.

Симптоми: нудота, блювання, артеріальна гіпертензія, шлуночкова тахікардія, фібриляція шлуночків, зупинка серця, набряк легенів.

Лікування: симптоматичне.

Для попередження передозування необхідно строго дотримуватися рекомендованих доз препарату.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

У період вагітності препарат призначають тільки тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода.

Не відомо, чи виділяється налоксон в грудне молоко, тому за необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Діти.

Синдром «відміни» у новонароджених – судоми, діарея, гіпертермія, безперервний крик, гіперрефлексія, чхання, тремор, незвична роздратованість, блювання.

Особливості застосування.

Тривалість дії деяких опіоїдних анагетиків може перевищувати тривалість дії Налоксону-М, тому пацієнти мають перебувати під постійним медичним наглядом і в умовах, які дозволяють проводити штучну вентиляцію легенів та інші реанімаційні заходи.

Хворим з опіоїдною залежністю необхідно вводити препарат дуже обережно, оскільки можлива поява абстиненції.

З обережністю необхідно застосовувати пацієнтам з кардіоваскулярними захворюваннями та пацієнтам, які приймають кардіотоксичні препарати, тому що можливе виникнення вентрикулярної тахікардії та фібриляції.

В експериментах на тваринах виявлено пригнічення фертильності і відсутності тератогенного ефекту.

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

Під час застосування Налоксону-М забороняється керувати транспортними засобами і працювати з іншими механізмами.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Налоксон-М усуває анагетичну дію опіоїдних анагетиків. Препарат зменшує ефекти бупренорфіну і трамадолу, але дія його короткочасна.

При одночасному застосуванні Налоксон-М може зменшити антигіпертензивну дію клофеліну.

Несумісний з розчинами лікарських засобів, що вміщують бісульфіти. Фармацевтично сумісний із 0,9 % розчином натрію хлориду, 5 % розчином декстрази, стерильною водою для ін'єкцій.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Налоксон є конкурентним антагоністом опіатних рецепторів і відноситься до групи так званих «чистих» антагоністів опіатних рецепторів. Блокує переважно μ -рецептори і завдяки значній спорідненості з цими рецепторами витісняє наркотичні анагетики з місць зв'язування, ліквідує таким чином симптоми передозування опіоїдів та усуває дію як ендогенних опіатних пептидів, так і екзогенних опіоїдних анагетиків; меншою мірою діє на інші опіатні рецептори.

Введення Налоксону запобігає, послаблює або усуває (залежно від дози і часу введення) ефекти опіоїдних анагетиків, відновлює дихання, зменшує седативну дію та ейфорію, послаблює гіпотензивний ефект.

Налоксон усуває дію широкої групи наркотичних засобів як агоністів, так і агоністів-антагоністів

опіатних рецепторів: морфіну, апоморфіну, героїну, кодеїну, дигідрокодеїну, промедолу, метадоу, пентазоцину, фентанілу, бупренорфіну.

Препарат усуває центральні і периферичні токсичні симптоми: пригнічення дихання, звуження зіниць, уповільнення випорожнення шлунка, дисфорію, кому та судоми, а також аналгетичний ефект наркотичних аналгетиків, крім того, він усуває токсичну дію великих доз алкоголю.

Налоксон ефективний також при розладах функції дихання при змішаних отруєннях, спричинених опіодними засобами у поєднанні з барбітуратами, бензодіазепінами та алкоголем.

Налоксон провокує синдром «відміни» у хворих з опіодною залежністю.

Препарат не володіє аналгезуючою активністю, не викликає дисфорії і психоміметичних симптомів, розвитку звикання і формування лікарської залежності.

Фармакокінетика. При внутрішньовенному введенні дія препарату розпочинається вже через 0,5 - 2 хв, тривалість дії становить 20 - 40 хв. При внутрішньом'язовому або підшкірному введенні діє через 2 - 3 хв, тривалість дії становить 2,5 - 3 години. Середній період напіврозпаду становить 1 - 1,5 години; у новонароджених він триваліший і становить 3 години. Налоксон метаболізується в печінці з утворенням глюкуронідів. Метаболіти виводяться з сечею. Вплив печінкової і ниркової недостатності не вивчено. Проходить через гематоенцефалічний і плацентарний бар'єри.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина.

Несумісність.

Препарат несумісний з розчинами лікарських засобів, що містять бісульфіти, мета-бісульфіти, довгий ланцюг або аніони високомолекулярної ваги, розчини з лужним рН. Не слід змішувати з іншими лікарськими засобами

Препарат призначений тільки для окремого застосування.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в сухому, захищеному від світла місці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка

10 ампул по 1 мл у картонній пачці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

Товариство з обмеженою відповідальністю «Харківське фармацевтичне підприємство «Здоров'я народу».

Місцезнаходження.

Україна, 61013, м. Харків, вул. Шевченка, 22.