

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

НАЛОКСОН-ЗН
(NALOXONE-ZN)

Склад:

діюча речовина: naloxone;

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

допоміжні речовини: натрію хлорид, кислота хлористоводнева розведена, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина.

Фармакотерапевтична група.

Антидоти. Код АТХ V03A B15.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

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

Введення налоксону запобігає, послабляє або усуває (залежно від дози та часу введення) ефекти опіоїдних аналгетиків, відновлює дихання, зменшує седативну дію та ейфорію, послабляє гіпотензивний ефект.

Налоксон усуває дію широкої групи наркотичних засобів як агоністів, так і агоністів-антагоністів опіатних рецепторів: морфіну, апоморфіну, героїну, кодеїну, дигідрокодеїну,

промедолу, метадону, пентазоцину, фентанілу, бупренорфіну.

Лікарський засіб усуває центральні та 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 опіоїдними засобами у поєднанні з барбітуратами, бензодіазепінами та алкоголем.

Налоксон провокує синдром відміни у хворих з опіоїдною залежністю.

Препарат не має анальгезуючої активності, не викликає дисфорії та психоміметичних симптомів, розвитку звикання і формування лікарської залежності.

Фармакокінетика.

При внутрішньовенному введенні дія препарату розпочинається вже через 0,5–2 хвилини, тривалість дії становить 20–40 хвилин. При внутрішньом'язовому або підшкірному введенні діє через 2–3 хвилини, 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 у печінці з утворенням глюкуронідів. Метаболіти виводяться з сечею. Вплив печінкової та ниркової недостатності не вивчений. Проникає через гематоенцефалічний і плацентарний бар'єри.

Клінічні характеристики.

Показання.

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

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів лікарського засобу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Налоксон-3Н усуває аналгетичну дію опіоїдних аналгетиків.

У пацієнтів з опіоїдною залежністю введення налоксону гідрохлориду може спричинити симптоми вираженої абстиненції (гіпертонію, порушення серцевого ритму, набряк легенів, зупинку серця). Препарат зменшує ефекти трамадолу і бупренорфіну, але дія його короткочасна. Вважається, що цей ефект є результатом аорчної кривої «доза – відповідь»

бупренорфіну зі зменшенням аналгезії при високих дозах.

При одночасному застосуванні Налоксон-3Н може зменшити антигіпертензивну дію клонідину.

При застосуванні стандартних доз препарат не відмінює ефекти барбітуратів і транквілізаторів.

Інформація про взаємодію з алкоголем неоднозначна. У пацієнтів з мультиінтоксикаціями у результаті дії опіоїдів та седативних засобів або алкоголю, залежно від причини інтоксикації, після введення налоксону гідрохлориду, можливо, буде спостерігатися менш швидкий результат усунення деяких ефектів мультиінтоксикації.

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

Особливості застосування.

Налоксон не ефективний при пригніченні дихання, спричиненому неопіоїдними наркотиками.

Тривалість дії деяких опіоїдних аналгетиків може перевищувати тривалість дії Налоксону-3Н, тому пацієнти мають перебувати під постійним медичним наглядом і в умовах, які дозволяють здійснювати штучну вентиляцію легенів та інші реанімаційні заходи.

Хворим з опіоїдною залежністю необхідно вводити препарат дуже обережно, оскільки можлива поява абстиненції. Були описані гіпертонія, порушення ритму серця, набряк легенів і зупинка серця. Це також стосується новонароджених, матері яких мали опіоїдну залежність.

Налоксону гідрохлорид може спричинити гіпотонію, гіпертонію, шлуночкову тахікардію, фібриляцію та набряк легенів. Ці несприятливі ефекти спостерігалися після операції найчастіше у пацієнтів, які мали серцево-судинні захворювання або які застосовували ліки, що спричиняють аналогічні серцево-судинні побічні ефекти. Хоча ніяких прямих причинно-наслідкових зв'язків не було виявлено, слід проявляти обережність при застосуванні Налоксону-3Н пацієнтам із захворюваннями серця або пацієнтам, які приймають кардіотоксичні речовини, що викликають шлуночкову тахікардію, фібриляцію і зупинку серця (наприклад, кокаїн, метамфетамін, циклічні антидепресанти, блокатори кальцієвих каналів, β-блокатори, дигоксин).

В експериментах на тваринах виявлено пригнічення фертильності та відсутність тератогенного ефекту.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Дослідження на тваринах виявили репродуктивну токсичність. Потенційний ризик для людини невідомий.

У період вагітності препарат призначати тільки тоді, коли очікувана користь для матері перевищує потенційний ризик для плода. Налоксону гідрохлорид може спричинити симптоми абстиненції у новонароджених малюків.

Невідомо, чи проникає налоксон у грудне молоко, тому при необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити або уникати годування груддю протягом 24 годин після застосування лікарського засобу.

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

Під час застосування Налоксону-3Н забороняється керувати транспортними засобами і працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Налоксон-3Н застосовувати внутрішньовенно струминно (ін'єкція), внутрішньовенно краплинно (інфузія), а також внутрішньом'язово. Дозу встановлює лікар індивідуально для кожного пацієнта. Внутрішньом'язові ін'єкції призначати у випадках, коли внутрішньовенне введення неможливе.

У гострих випадках слід надавати перевагу внутрішньовенному застосуванню лікарського засобу, 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 у межах від 45 хвилин до 4 годин.

Оскільки дія деяких опіоїдів (наприклад, декстропропоксифен, дигідрокодеїн, метадон) триває довше, ніж дія налоксону, пацієнти мають перебувати під постійним наглядом, а повторні введення препарату 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 у дозі 0,1–0,2 мг (приблизно 1,5–3 мкг на 1 кг маси тіла) зазвичай є достатньою. При необхідності додатково можна вводити 0,1 мг з інтервалом 2 хвилини до повного відновлення дихання і свідомості. Додаткове введення може бути необхідним через 1–2 години – 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-3Н 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 визначати

залежно від стану пацієнта, а також його реакції на внутрішньовенну ін'єкцію та інфузію. Слід розглянути можливість безперервної внутрішньовенної інфузії та при необхідності вжити заходи для підтримання дихання.

Діти

Початкова доза налоксону становить 0,01–0,02 мг на 1 кг маси тіла внутрішньовенно протягом 2–3 хвилин 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 хвилини. Налоксон-ЗН можна також вводити внутрішньом'язово (початкова доза – 0,4–2 мг), якщо внутрішньовенне введення неможливе. Якщо при введенні налоксону у 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 вводити 0,1 мг на 1 кг маси тіла. Залежно від стану пацієнта може бути показана внутрішньовенна інфузія. Якщо внутрішньовенне введення неможливе, Налоксон-ЗН вводять внутрішньом'язово у початковій дозі 0,01 мг на 1 кг маси тіла, розподіленій 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 хвилини. При неможливості внутрішньовенного введення Налоксон-ЗН вводять внутрішньом'язово у початковій дозі 0,01 мг на 1 кг маси тіла.

Пацієнти літнього віку

Пацієнтам літнього віку із серцево-судинними захворюваннями або пацієнтам, які отримували кардіологічні препарати, Налоксон-ЗН слід застосовувати з обережністю. Слід враховувати такі небажані ефекти Налоксону-ЗН, як тахікардія і фібриляція шлуночків у хворих після операції.

Розведення розчину

Для внутрішньовенної інфузії Налоксон-ЗН розводити 0,9 % розчином натрію хлориду або 5 % розчином глюкози. Вміст 5 ампул препарату (2 мг) слід розводити 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. Застосовувати тільки прозорий, безбарвний, без видимих частинок розчин.

Діти.

Застосовувати у педіатричній практиці за показаннями та у дозах, зазначених в інструкції.

Передозування.

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

Лікування: симптоматичне.

Для попередження передозування необхідно чітко дотримуватися рекомендованих доз препарату.

Побічні реакції.

При швидкому введенні Налоксону-ЗН можуть виникати різні побічні реакції.

З боку системи травлення: нудота, блювання, діарея, сухість у роті.

З боку серцево-судинної системи: аритмія, брадикардія, тахікардія, гіпотензія, артеріальна гіпертензія, фібриляція шлуночків, зупинка серця, асистолія.

З боку центральної нервової системи: тремтіння, судоми, запаморочення, головний біль, напруженість, гіпервентиляція.

Психічні розлади: зміни поведінки, включаючи насильницьку поведінку, нервозність, неспокій, збудження, дратівливість.

Алергічні реакції: риніт, задишка, шкірний висип, свербіж, кропив'янка, мультиформна еритема, ангіоневротичний набряк, анафілактичний шок.

Інші: посилення пітливості, післяопераційний біль, зміни у місці введення, включаючи подразнення стінки судин (при внутрішньовенному застосуванні), місцеве подразнення та запалення (при внутрішньом'язовому застосуванні).

Застосування Налоксону-ЗН у дозах, вищих за рекомендовані, може спричинити повернення болю в післяопераційний період і збудження, артеріальну гіпотензію або гіпертензію, шлуночкову тахікардію, фібриляцію шлуночків, набряк легенів, задишку.

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, гіпертензія, позіхання, слабкість; у новонароджених – судоми, діарея, гіпертермія, безперервний крик, гіперрефлексія, чхання, тремор, незвична роздратованість, блювання.

Застосування Налоксону-ЗН у терапевтичних дозах у хворих, в організмі яких не містяться опіоїди, як правило, не спричиняє побічних ефектів.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

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

Препарат призначений тільки для окремого застосування.

Упаковка.

По 1 мл в ампулі; по 10 ампул у коробці.

По 1 мл в ампулі; по 5 ампул у блістері; по 2 блістери у коробці.

По 1 мл в ампулі; по 10 ампул у блістері; по 1 блістеру у коробці.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

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

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 61002, Харківська обл., місто Харків, вулиця Куликівська, будинок 41.