

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 1-6979/05.03.07

634/25.02.03 *Меню*

1. Наименование на лекарствения продукт
NALOXON
НАЛОКСОН

2. Количествен и качествен състав на активното вещество
Naloxone hydrochloride 0,40mg/ 1ml
(като безводна сол)

3. Лекарствена форма
Инжекционен разтвор

4. Клинични данни

4.1. Показания

- Отравяния, предозирание на опиоидни вещества или подозирани такива
- Постоперативно за неутрализиране депресивния ефект върху ЦНС от опиоидни съединения, прилагани по време на анестезия
- За преодоляване дихателната депресия при новородени, вследствие от прилагане опиоидни аналгетици на родилката.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозата и начинът на приложение зависят от състоянието на болния, както и от типа и количеството опиоидно вещество, предизвикало отравянето.

Отравяне с опиоидни вещества

Възрастни

Първоначално се инжектират венозно, мускулно или подкожно 0,4 mg (при състояния, заплашващи живота се прилага венозно). В случай на нужда, дозата се прилага на всеки 3-5 минути, до възстановяване съзнанието и равномерното дишане. Ако след прилагане на 10 mg не настъпи, макар и временно, подобрение и връщане на съзнанието, диагнозата "предозирание на опиоидни вещества" е под съмнение.

При подозирана зависимост- редуциране на дозата поради възможни прояви на абстиненция (0.1- 0.2 mg)

В мотивирани случаи, при отравяне с опиоидни вещества с дълъг период на полуелиминиране, за да се задържи ефектът на налоксона да се инжектира мускулно.

Мускулно да се инжектира бавно в продължение на 2-3 минути.

Интравенозна инфузия

Налоксон може да бъде разтворен за интравенозна инфузия в нормален физиологичен разтвор или 5% -ен разтвор на декстроза. Прибавянето на 2mg Налоксон към 500 ml разтворител осигуряват концентрация 0,4 mg/ml



Разтворите трябва да бъдат използвани до 24 часа. Дозите се определят съгласно нуждите на пациента

Налоксон не трябва да се смесва с продукти, съдържащи бисулфити, метабисулфити, аниони с дълга верига или високо молекулно тегло, както и с алкални разтвори.

Никакъв лекарствен продукт или химичен агент да не се смесва с Налоксон, освен ако ефектът им върху физико-химичната му стабилност не е предварително установен.

Деца

Първоначалната доза е 0,005-0,01 mg/ kg телесно тегло i.v. или i.m. В случай на нужда може да се повтори.

Извеждане от състояние на анестезия с опиоидни вещества

Възрастни

Венозно 0,1-0,2 mg (1,5-3.0 micrograms /kg телесно тегло).

Деца

Венозно 0,005-0,01 mg /kg телесно тегло.

В случай на нужда, дозата 0,1 mg може да се повтаря всеки 2 минути, докато болният започне да диша самостоятелно и дойде в съзнание.

В мотивирани случаи, при отравяне с опиоидни вещества с дълъг период на полуелиминирание, за да се задържи ефектът на налоксона да се инжектира мускулно.

Новородени

В случай на апнея, преди инжектиране на продукта да се провери проходимостта на дихателните пътища.

При новородени с дихателна депресия (след инжектиране на наркотични аналгетични средства на майката) да се приложат венозно, мускулно или подкожно 0,01 mg/kg телесно тегло. В случай на нужда, дозата може да се повтори.

Възможно е и с профилактична цел да се инжектират мускулно на детето веднага след раждането 200 micrograms налоксон (60 micrograms / kg телесно тегло).

4.3.Противопоказания

Регистрирана свръхчувствителност към налоксон или някое от помощните вещества.

4.4. Специални противопоказания и специални предупреждения за употреба

- При зависими от опиоидни вещества, налоксон да се инжектира внимателно, поради възможни прояви на абстиненция.
- Не е отбелязана еднозначна връзка между прилагането на налоксон и появата на хипотензия, повишаване артериалното кръвно налягане, нарушения на сърдечния ритъм и остър белодробен оток. Независимо от това, да се прилага внимателно на сърдечноболни и пациенти, получаващи кардиотоксични лекарствени продукти.



- Пациентите трябва да се наблюдават за евентуално възобновяване на симптомите на интоксикация при предозиране с опиоиди с по-продължителен ефект.
- Необходимо е повишено внимание при наличие на бъбречни и чернодробни увреждания. Наблюдавана е повишена плазмена концентрация до 6 пъти при пациенти с чернодробна цироза без клинична изява на НЛР.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Налоксон неутрализира аналгетичния и нежеланите ефекти на опиоидните аналгетици и може да индуцира прояви на отнемане при физически зависими пациенти.

4.6. Бременност и кърмене

Бременност

Изследванията, направени върху животни, не показват вредно въздействие върху плода. Няма наблюдения върху бременни жени. При тях продуктът може да се прилага само в случай , когато според лекаря, ползата за майката превишава потенциалната опасност за плода.

Кърмене

Не е известно, дали налоксон преминава в кърмата.

Да се прилага с внимание при кърмачки.

4.7. Влияние върху способността за шофиране и работа с машини

Да не се управляват транспортни средства.

Да не се обслужва механично оборудване.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Възможно е гадене, повръщане, прекомерно потене, камерна тахикардия, фибрилации и други ритъмни нарушения, сърдечен арест, повишаване/понижаване артериалното кръвно налягане, психомоторна възбуда, тремор, гърчове, задух, белодробен оток, които могат да доведат до смъртен изход. Симптоми на синдрома на остра абстиненция, резултат от твърде бързото неутрализиране влиянието на морфиновите производни: телесни болки, треска, потене, ринорея, кихане, прозяване, слабост, тръпки или треперене, нервност, безпокойство и раздразнителност, диария, гадене и повръщане, коремни спазми, повишено кръвно налягане, тахикардия .

4.9. Предозиране

Описани са случаи, в които дори 5 g опиоидно вещество не предизвикват симптоми на предозиране. Но при инжектиране на прекалено голяма доза е наблюдавано прилошаване, повръщане и хипервентилация, нарушение на паметта. Появилите се симптоми изискват консервативно лечение (ако това е възможно, в условията на интензивна терапия).

5. Фармакологични свойства

АТС: V 03 AB



5.1. Фармакодинамични свойства

Налоксон е синтетично производно на Охуморphone, конкурентен антагонист на опиоидните μ , κ , σ -рецептори, в по-малка степен блокира и δ , ϵ -рецепторите. Най-силно въздействие има върху μ -рецепторите. Продуктът е единственият представител от групата на т.нар. "чисти антагонисти на опиоидните рецептори". Благодарение на силното си сходство с тях, измества наркотичните вещества и преодолява симптомите на предозиране.

Налоксон не проявява никаква вътрешна активност, т.е. няма никакви допълнителни агонистични свойства (като напр. налорфин и левалорфан). Продуктът неутрализира действието на по-широка група наркотични средства, а именно не само на чистите агонисти (напр. морфин), но също и на агонистите на опиоидните рецептори (напр. пентазоцин). Благодарение на това, че не проявява никаква вътрешна активност, не действа депресивно върху дихателните органи, не упражнява болкоуспокояващо действие.

Налоксон неутрализира действието на морфина, хероина, кодеина, дихидрокодеина, петидина, метадона, пентазоцина, фентанила и апоморфина. Налоксон преодолява централните и периферните токсични симптоми, т.е. дихателната депресия, свиването на зениците, забавеното изпражнение на стомаха, дисфорията, комата и гърчовете. Преодолява и аналгетичния ефект на тези съединения.

Налоксон е приложим в борбата с разстройствата на дихателните функции при отравяния с опиоидни вещества.

Налоксон в дози, дори няколко пъти надвишаващи терапевтичните, не предизвиква дисфория и психосоматични симптоми, а приложението му не създава опасност за поява на зависимост.

5.2. Фармакокинетични свойства

Продуктът се абсорбира бързо от храносмилателния тракт, но силният ефект от първото преминаване през черния дроб прави този път на приемане неподходящ. Венозно, проявява действието си след 30 до 120 секунди и го запазва в продължение на 20-45 минути. Инжектиран мускулно или подкожно, започва да действа след 2-3 минути, но -в продължение на 150-180 минути. Средният период на полуелиминиране от плазмата е 1-1,5 часа; при новородени - 3 часа.

Налоксон се метаболизира в черния дроб, главно чрез глюкуронизиране. Метаболитите се отделят с урината. Не е изследвано влиянието на бъбречната и чернодробна недостатъчност върху фармакокинетиката на продукта. Наблюдавана е до 6 пъти повишена плазмена концентрация при пациенти с чернодробна цироза. Налоксон преминава през плацентата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Изследванията върху мишки, инжектирани с доза, надхвърляща 50 пъти човешката, показват, че налоксон не влияе на плодовитостта и развитието на плода.

Не са провеждани контролирани изследвания върху бременни.

Не са провеждани контролирани изследвания за мутагенност и канцерогенност.

6. Фармацевтични данни



6.1. Списък на помощните вещества и техните количества

Sodium chloride	8,55 mg
Hydrochloride acid	ad pH 3,3
Water for injections and stabil.	ad 1 ml

6.2. Несъвместимости

Не са известни физическа и химически несъвместимости.

6.3. Срок на годност

4 години

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява под 25° С.

Да се пази от светлина.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

Да не се прилага след изтичане срока на годност.

6.5. Данни за опаковката

Ампули, 1ml x 5 в блистери от PVC фолио. Блистерите се опаковат по два в картонена кутия с всички необходими означения и информационна листовка.

6.6. Препоръки при употреба

Налоксон има по-краткотрайно действие от опиоидните вещества и е възможен рецидив при дихателна депресия. Предвид на това, е необходимо наблюдение на пациента в продължение на няколко часа.

7. Име и адрес на производителя и притежателя на регистрацията

Warsaw Pharmaceutical Works Polfa SA

22/24 ul. Karolkowa

01-207 Warsaw

Poland

8. Регистрационен N

9. Дата на първо разрешение за употреба

10. Дата на актуализация на текста

