

НД РБ

9063 - 2021



ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
НАЛОКСОН

Торговое название препарата: Налоксон

Международное непатентованное название: налоксон

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

1 мл раствора содержит:

действующее вещество:

налоксона гидрохлорид – 0,4 мг

в виде налоксона гидрохлорида дигидрата;

вспомогательные вещества:

натрия хлорид – 8,6 мг, динатрия эдетат (динатриевая соль этилендиамин-тетрауксусной кислоты) – 0,3 мг, хлористоводородная кислота – до pH от 3,0 до 4,5, вода для инъекций – до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: Прочие лекарственные средства. Антидоты.

Код АТХ: V03AB15

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Налоксон является конкурентным антагонистом опиоидных рецепторов и относится к группе так называемых «чистых» антагонистов опиоидных рецепторов. Блокирует преимущественно μ -рецепторы и, благодаря значительному сродству с этими рецепторами, Налоксон вытесняет наркотические анальгетики с мест связывания, ликвидируя таким образом симптомы передозировки опиоидов, и устраняет действие как эндогенных опиоидных пептидов, так и экзогенных опиоидных анальгетиков; в меньшей степени влияет на другие опиоидные рецепторы.

9063 - 2021

Введение Налоксона предотвращает, ослабляет или устраняет (в зависимости от дозы и времени введения) эффекты опиоидных анальгетиков, восстанавливает дыхание, уменьшает седативное действие и эйфорию, ослабляет гипотензивный эффект.

Налоксон устраняет действие широкой группы наркотических средств как агонистов, так и агонистов-антагонистов опиоидных рецепторов: морфина, апоморфина, героина, кодеина, дигидрокодеина, промедола, метадона, пентазоцина, фентанила, бупренорфина.

Препарат устраняет центральные и периферические токсические симптомы: угнетение дыхания, сужение зрачков, замедление опорожнения желудка, дисфорию, кому и судороги, а также анальгетический эффект наркотических анальгетиков, кроме того, он устраняет токсическое действие больших доз алкоголя.

Налоксон эффективен также в борьбе с расстройствами функции дыхания при смешанных отравлениях, вызванных опиоидными средствами в соединении с барбитуратами, бензодиазепинами и алкоголем.

Налоксон провоцирует синдром отмены у больных с опиоидной зависимостью.

Препарат не обладает анальгезирующей активностью, не вызывает развития психомиметических симптомов, дисфории, привыкания и лекарственной зависимости.

При внутривенном введении действие препарата начинается уже через 0,5-2 мин, продолжительность действия составляет 20-40 мин. При внутримышечном введении действует через 2-3 мин, продолжительность действия составляет 2,5-3 часа.

Фармакокинетика

Распределение

После парентерального введения, налоксона гидрохлорид быстро распределяется в тканях и жидкостях, особенно в мозге, так как обладает значительной липофильностью. У взрослых людей объем распределения в стационарном состоянии составляет около 2 л/кг. Связывание с белками плазмы находится в

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

9063 - 2021

пределах от 32 до 45 %. Налоксона гидрохлорид легко проникает через плаценту, однако неизвестно, выделяется ли налоксона гидрохлорид с материнским молоком.

Биотрансформация

Налоксона гидрохлорид быстро метаболизируется в печени, главным образом, путем конъюгации с глюкуроновой кислотой и выводится с мочой.

Выведение

Налоксона гидрохлорид имеет короткий период полураспада – примерно 1-1,5 часа после парентерального введения. Период полувыведения для новорожденных составляет около 3 часов.

Показания к применению

Передозировка опиоидов.

При угнетении дыхательного центра, вызванного опиоидами.

Для восстановления дыхания у новорожденных после введения роженице опиоидных анальгетиков.

В качестве диагностического средства у больных с подозрением на опиоидную зависимость.

Противопоказания

Гиперчувствительность.

Меры предосторожности

Продолжительность действия некоторых опиоидных анальгетиков может превышать длительность действия налоксона, поэтому пациенты должны находиться под постоянным медицинским наблюдением и в условиях, позволяющих проводить искусственную вентиляцию легких и другие реанимационные мероприятия.

Больным с опиоидной зависимостью следует вводить препарат очень осторожно, так как возможно появление абстиненции (см. раздел «Побочное действие»).

С осторожностью необходимо применять у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями и у пациентов, которые применяют кардиотоксические препараты, так как возможно возникновение вентрикулярной тахикардии и фибрилляции.

<p style="text-align: center;">СОГЛАСОВАНО МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ Приказ Министерства здравоохранения Республики Беларусь</p>

Необходимо проявлять осторожность при применении налоксона в послеоперационный период (см. раздел «Побочное действие»).

При угнетении ЦНС неопиоидными веществами налоксон не эффективен.

В экспериментах на мышах и крысах определено угнетение фертильности и отсутствие тератогенного эффекта.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение во время беременности допустимо, если польза для матери превышает риск для плода. Неизвестно, выделяется ли налоксон с грудным молоком. Применение препарата в период грудного вскармливания возможно по абсолютным показаниям.

Влияние на способность управлять автомобилем или другими механизмами

При применении налоксона запрещается управлять транспортными средствами и работать с другими механизмами.

Способ применения и дозы

Налоксон применяют внутривенно струйно (инъекция), внутривенно капельно (инфузия), а также внутримышечно. Дозу устанавливает врач индивидуально для каждого пациента. Внутримышечные инъекции назначают в случае, когда внутривенное введение невозможно.

В острых случаях следует отдавать предпочтение внутривенному применению препарата, так как оно обеспечивает самый быстрый терапевтический эффект.

При внутримышечном введении эффект препарата проявляется позднее, но длится дольше (по сравнению с внутривенным применением).

Продолжительность действия налоксона зависит от введенной дозы, пути введения и колеблется в пределах от 45 мин до 4 ч.

Так как действие некоторых опиоидов (например, декстропропоксифен, дигидрокодеин, метадон) длится дольше, чем действие налоксона, пациенты должны находиться под непрерывным наблюдением, а повторные дозы можно назначать только в случае необходимости.

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Полное или частичное устранение угнетения дыхательного центра, вызванного опиоидами

СОГЛАСОВАНО
МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ
РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ
Приказ Министерства здравоохранения
Республики Беларусь

Взрослые

Дозы определяет врач индивидуально с целью нормализации функции дыхания при поддержке адекватной анальгезии. Внутривенная инъекция налоксона в дозе 0,1-0,2 мг (приблизительно 1,5-3 мкг на 1 кг массы тела) обычно является достаточной. При необходимости дополнительно можно вводить 0,1 мг с интервалом 2 мин до полного восстановления дыхания и сознания. Дополнительное введение может понадобиться в период от 1 до 2 ч – в зависимости от типа действия активного вещества (кратковременный эффект или замедленное действие), относительно которого налоксон является антагонистом, его применяемого количества, длительности и способа введения.

Альтернативно Налоксон можно применять как внутривенную инфузию.

Продолжительность действия некоторых опиоидов больше продолжительности действия налоксона, введенного внутривенно болюсно. Поэтому если угнетение дыхательного центра вызвано такими веществами или есть подозрение на это, налоксон следует применять в виде внутривенной инфузии. Скорость введения определяют в зависимости от состояния пациента, а также его реакции на внутривенную инъекцию и инфузию. Следует рассмотреть возможность непрерывной внутривенной инфузии и при необходимости применить меры для поддержания дыхания.

Дети

Начальная доза налоксона составляет 0,01-0,02 мг на 1 кг массы тела внутривенно в течение 2-3 мин до полного восстановления дыхания и сознания. Дополнительно дозы можно назначать с интервалом 1-2 ч в зависимости от реакции пациента, дозы и длительности действия применяемых опиоидов.

Диагностика или лечение при подозрении на острую передозировку опиоидов

Взрослые

Начальная доза составляет 0,4-2 мг внутривенно. Если дыхание не восстанавливается, введение следует повторить через 2-3 мин. Налоксон можно

также вводить внутримышечно (начальная доза – 0,4-2 мг), если внутривенное введение невозможно. Если при введении налоксона в дозе 10 мг состояние пациента не улучшилось, можно сделать вывод, что угнетение дыхательного центра вызвано другими факторами или другими препаратами, а не опиоидами.

Дети

Рекомендованная начальная доза – 0,01 мг на 1 кг массы тела внутривенно. Если желательный эффект не достигнут, дополнительно в виде инъекции вводят 0,1 мг на 1 кг массы тела. В зависимости от состояния пациента может быть показана внутривенная инфузия. Если внутривенное введение невозможно, Налоксон вводят внутримышечно в начальной дозе 0,01 мг на 1 кг массы тела, разделенной на несколько введений.

Восстановление дыхания у новорожденных, матери которых получали опиоиды

Обычная доза – 0,01 мг на 1 кг массы тела внутривенно. Если при применении этой дозы дыхательная функция не восстанавливается, введение можно повторить через 2-3 мин. При невозможности внутривенного введения Налоксон вводят внутримышечно в начальной дозе 0,01 мг на 1 кг массы тела.

Пациенты пожилого возраста

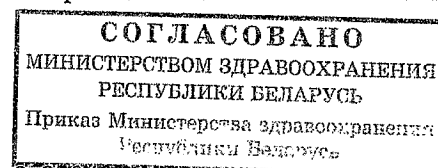
Пациенты пожилого возраста с сердечно-сосудистыми заболеваниями, или которые получали кардиологические препараты, Налоксон следует применять с осторожностью. Следует учитывать такие нежелательные эффекты, как тахикардия и фибрилляция желудочков у послеоперационных больных во время назначения Налоксона.

Разведение раствора

Для внутривенной инфузии Налоксон разводят 0,9 % раствором натрия хлорида или 5 % раствором глюкозы. Содержимое 5 ампул препарата (2 мг) разводят 500 мл в одном из перечисленных растворителей до получения концентрации готового раствора 4 мкг/мл.

Перед применением необходимо проверить раствор (также и после разведения) на прозрачность.

Применяется только прозрачный, бесцветный, без видимых частичек раствор.



Побочное действие

Оценка нежелательных эффектов основана на нижеследующих данных о частоте возникновения: «очень часто» ($\geq 1/10$), «часто» ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), «нечасто» ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), «редко» ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), «очень редко» ($< 1/10000$), неизвестно (не может быть оценена на основе имеющихся данных).

Со стороны иммунной системы

Очень редко: аллергические реакции (кожная сыпь, зуд, крапивница, ринит, одышка, отек Квинке), анафилактический шок.

Со стороны нервной системы

Часто: головокружение, головная боль.

Нечасто: тремор, повышение потоотделения.

Редко: дрожь, судороги.

Со стороны сердечно-сосудистой системы

Часто: тахикардия, гипотония, гипертония.

Нечасто: аритмия, брадикардия.

Очень редко: фибрилляция, остановка сердца.

Неблагоприятные сердечно-сосудистые побочные реакции наиболее часто отмечались у пациентов в послеоперационном периоде, которые страдают сердечно-сосудистыми заболеваниями или которые принимают другие препараты, оказывающие влияние на сердечно-сосудистую систему.

Со стороны органов грудной клетки и средостения

Нечасто: гипервентиляция.

Очень редко: отек легких.

Со стороны пищеварительной системы

Очень часто: тошнота.

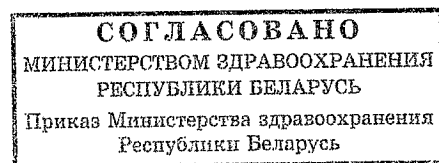
Часто: рвота.

Нечасто: диарея, сухость во рту.

Со стороны кожи и подкожной клетчатки

Очень редко: эритема.

Общие расстройства и нарушения в месте введения



Часто: послеоперационная боль.

Нечасто: раздражение сосудистой стенки (после внутривенного введения), местное раздражение и воспаление (после внутримышечного введения), усиление потоотделения.

При применении налоксона в послеоперационном периоде в дозах превышающих, минимально необходимые, возможно исчезновение анальгезии, возбуждение, артериальная гипотензия или гипертензия, желудочковая тахикардия, фибрилляция желудочков, отёк лёгких.

Синдром «отмены» у пациентов с опиоидной зависимостью: боли неясной локализации, диарея, гипертермия, ринорея, чихание, повышенная потливость, тошнота, рвота, нервозность, утомляемость, раздражительность, тремор, спазмы в эпигастральной области, тахикардия, слабость. У новорожденных – судороги, диарея, гипертермия, безудержный плач, гиперрефлексия, чихание, тремор, выраженная раздражительность, рвота.

При применении налоксона в терапевтических дозах у больных, не принимавших ранее опиоиды, побочные эффекты возникают значительно реже.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Налоксон устраняет анальгетическое действие опиоидных анальгетиков.

У пациентов с опиоидной зависимостью введение налоксона гидрохлорида может вызвать симптомы выраженной абстиненции (гипертонию, нарушение сердечного ритма, отек легких, остановку сердца).

Препарат уменьшает эффекты бупренорфина и трамадола, но действие его кратковременное. Считается, что этот эффект является результатом кривой «доза – эффект» бупренорфина с уменьшением анальгезии при высоких дозах.

При одновременном применении Налоксон может уменьшать антигипертензивное действие клонидина.

При применении стандартных доз, препарат не угнетает эффекты барбитуратов и транквилизаторов.

Информация о взаимодействии с алкоголем неоднозначна. У пациентов с мультиинтоксикацией в результате действия опиоидов и седативных средств или

9063 - 2021

алкоголя, в зависимости от причины интоксикации, после введения налоксона гидрохлорида, возможно более быстрое устранение некоторых эффектов интоксикации.

Несовместим с растворами лекарственных средств, которые содержат бисульфиты. Фармацевтически совместим с 0,9 % раствором натрия хлорида, 5 % раствором глюкозы, стерильной водой для инъекций.

Особые указания

Может применяться в качестве лекарственного средства для дифференциальной диагностики отравления наркотическими анальгетиками. При применении необходимо осуществлять постоянный врачебный надзор за пациентом.

Для пациентов, придерживающихся низкосолевой диеты, необходимо учитывать содержание натрия хлорида в препарате.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения 0,4 мг/мл в ампулах по 1 мл из бесцветного стекла первого гидролитического класса.

5 ампул в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или гибкой упаковки на основе фольги алюминиевой, или без фольги.

По 2 контурные ячейковые упаковки (с фольгой или без фольги) вместе с инструкцией по применению препарата, скарификатором или ножом ампульным в пачке из картона.

При упаковке ампул с надрезами (насечками) и точками или кольцами излома скарификаторы или ножи ампульные не вкладывают.

Условия хранения

Список А.

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

4 года.

СОГЛАСОВАНО МИНИСТЕРСТВОМ ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ Приказ Министерства здравоохранения Республики Беларусь
--

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту врача.

Производитель

ФГУП «Московский эндокринный завод»

Производство готовой лекарственной формы:

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 2

Выпускающий контроль качества:

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 1

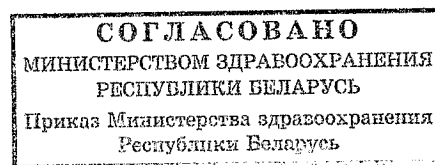
Наименование и адрес юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение/организация, принимающая претензии потребителей

ФГУП «Московский эндокринный завод»

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25

Тел./факс +7 (495) 678-00-50/911-42-10

<http://www.endopharm.ru>



Первый заместитель Генерального директора
ФГУП «Московский эндокринный завод»



Е.А. Ежова