



УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
08.05.14 № 313
Регистрационное удостоверение
№ UA/1398/01/01

**ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата**

**НАЛОКСОН-М
(NALOXONE-M)**

Состав:

действующее вещество: naloxone;

1 мл раствора содержит налоксона гидрохлорида дигидрата в перерасчете на 100 % вещество 0,4 мг;
вспомогательные вещества: натрия хлорид, кислота хлористоводородная разбавленная, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа.

Антидоты. Код ATX V03A B15.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

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

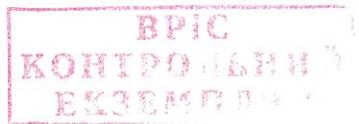
Введение налоксона предотвращает, ослабляет или устраниет (в зависимости от дозы и времени введения) эффекты опиоидных анальгетиков, восстанавливает дыхание, уменьшает седативное действие и эйфорию, ослабляет гипотензивный эффект.

Налоксон устраняет действие широкой группы наркотических средств как агонистов, так и агонистов-антагонистов опиатных 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 при расстройствах функции дыхания при смешанных отравлениях, вызванных опиоидными средствами в сочетании с барбитуратами,ベンзодиазепинами и алкоголем. Налоксон провоцирует синдром отмены у больных с опиоидной зависимостью.

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



Фармакокинетика.

При внутривенном введении действие препарата начинается уже через 0,5-2 минуты, продолжительность действия составляет 20-40 минут. При внутримышечном или подкожном введении действует через 2-3 минуты, продолжительность действия составляет 2,5-3 часа. Средний период полураспада составляет 1-1,5 часа; у новорожденных он более длительный и составляет 3 часа. Налоксон метаболизируется в печени с образованием глюкуронидов. Метаболиты выводятся с мочой. Влияние печеночной и почечной недостаточности не изучалось. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры.

Клинические характеристики.

Показания.

Передозировка опиоидов. Для устранения угнетения дыхательного центра, вызванного опиоидами; для восстановления дыхания у новорожденных после введения роженице опиоидных анальгетиков; как диагностическое средство у больных с подозрением на опиоидную зависимость.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к компонентам препарата.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Налоксон-М устраниет 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 трамадола и бупренорфина, но действие его кратковременное. Считается, что этот эффект является результатом арочной кривой «доза-ответ» бупренорфина с уменьшением анальгезии при высоких дозах.

При одновременном применении Налоксон-М может уменьшить антигипертензивное действие клонидина.

При применении стандартных доз препарат не отменяет эффекты барбитуратов и транквилизаторов. Информация о взаимодействии с алкоголем неоднозначна. У пациентов с мультиинтоксикациями в результате действия опиоидов и седативных средств или алкоголя, в зависимости от причины интоксикации, после введения налоксона гидрохлорида, возможно, будет наблюдаться менее быстрый эффект по устранению некоторых симптомов мультиинтоксикации.

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

Особенности применения.

Продолжительность действия некоторых опиоидных анальгетиков может превышать длительность действия Налоксона-М, поэтому пациенты должны находиться под постоянным медицинским наблюдением и в условиях, которые позволяют осуществлять искусственную вентиляцию легких и другие реанимационные мероприятия.

Больным с опиоидной зависимостью необходимо вводить препарат очень осторожно, поскольку возможно появление абстиненции. Были описаны гипертония, нарушения ритма сердца, отек легких и остановка сердца. Это также относится к новорожденным у таких пациентов.

Налоксона гидрохлорид может вызвать гипотонию, гипертонию, желудочковую тахикардию, фибрилляцию и отек легких. Эти неблагоприятные эффекты наблюдались после операции чаще всего у пациентов, которые имеют сердечно-сосудистые заболевания или которые использовали лекарства, вызывающие аналогичные сердечно-сосудистые побочные эффекты. Хотя никаких прямых причинно-следственных связей не было обнаружено, следует проявлять осторожность при использовании Налоксона-М для пациентов с заболеваниями сердца или пациентов, которые принимают кардиотоксические вещества, вызывающие желудочковую тахикардию, фибрилляцию и остановку сердца (например, кокаин, метамфетамин, циклические антидепрессанты, блокаторы кальциевых каналов, β -блокаторы, дигоксин).

В экспериментах на животных обнаружено угнетение фертильности и отсутствие тератогенного эффекта.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Исследования на животных выявили репродуктивную токсичность. Потенциальный риск для человека неизвестный.

В период беременности препарат назначать только тогда, когда ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода. Налоксона гидрохлорид может вызвать симптомы абстиненции у новорожденных.

Неизвестно, проникает ли наркотик в грудное молоко, поэтому при необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить или избегать кормления грудью в течение 24 часов после применения лекарственного средства.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Во время применения Налоксона-М запрещается управлять транспортными средствами и работать с другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Налоксон-М применять внутривенно струйно (инъекция), внутривенно капельно (инфузия), а также внутримышечно. Дозу устанавливает врач индивидуально для каждого пациента. Внутримышечные инъекции назначать в случаях, когда внутривенное введение невозможно.

В острых случаях следует отдавать предпочтение внутривенному применению препарата, поскольку оно обеспечивает самый быстрый терапевтический эффект. При введении внутримышечно эффект препарата проявляется позже, но длится дольше (по сравнению с внутривенным применением). Продолжительность действия наркотика зависит от введенной дозы, пути введения и колеблется в пределах от 45 минут до 4 часов.

Поскольку действие некоторых опиоидов (например, дексетропропоксилен, дигидрокодеин, метадон) длится дольше, чем действие наркотика, пациенты должны находиться под непрерывным наблюдением, а повторные введения препарата можно назначать только в случае необходимости.

Полное или частичное устранение угнетения дыхательного центра, вызванного опиатами

Взрослые

Дозы определяет врач индивидуально с целью нормализации функции дыхания при поддержке адекватной анальгезии. Внутривенная инъекция наркотика в дозе 0,1-0,2 мг (примерно 1,5-3 мкг на 1 кг массы тела) обычно является достаточной. При необходимости дополнительно можно вводить 0,1 мг с интервалом 2 минуты до полного восстановления дыхания и сознания. Дополнительное введение может быть необходимым в период от 1 до 2 часов – в зависимости от типа действия активного вещества (кратковременный эффект или медленное действие), по отношению к которому наркотик является антагонистом, его примененного количества, продолжительности и способа введения.

Альтернативно Налоксон-М можно применять как внутривенную инфузию. Продолжительность действия некоторых опиоидов больше, чем продолжительность действия наркотика, введенного внутривенно болюсно. Поэтому если угнетение дыхательного центра вызвано такими веществами или есть подозрение на это, наркотик следует применять в виде внутривенной инфузии. Скорость введения определять в зависимости от состояния пациента, а также его реакции на внутривенную инъекцию и инфузию. Следует рассмотреть возможность непрерывной внутривенной инфузии и при необходимости принять меры для поддержания дыхания.

Дети

Начальная доза наркотика составляет 0,01-0,02 мг на 1 кг массы тела внутривенно в течение 2-3 минут до полного восстановления дыхания и сознания. Дополнительные дозы можно назначать с интервалом 1-2 часа в зависимости от реакции пациента, дозы и продолжительности действия опиатов, которые применяются.

Острая передозировка опиатов

Взрослые

Начальная доза составляет 0,4-2 мг внутривенно. Если не наступает восстановление дыхания, введение следует повторить через 2-3 минуты. Налоксон-М 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

Рекомендуемая начальная доза – 0,1 мг на 1 кг массы тела внутривенно. Если желаемого эффекта не достигнуто, дополнительно в виде инъекции вводить 0,1 мг на 1 кг массы тела. В зависимости от состояния пациента может быть назначена внутривенная инфузия. Если внутривенное введение невозможно, Налоксон-М 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 минуты. При невозможности внутривенного введения Налоксон-М вводят внутримышечно в начальной дозе 0,01 мг на 1 кг массы тела.

Пациенты пожилого возраста

Пациентам пожилого возраста с сердечно-сосудистыми заболеваниями или пациентам, которые получали кардиологические препараты, Налоксон-М следует применять с осторожностью. Следует учитывать такие нежелательные эффекты, как тахикардия и фибрилляция желудочков у послеоперационных больных при назначении Налоксона-М.

Разведение раствора

Для внутривенной инфузии Налоксон-М разводить 0,9 % раствором натрия хлорида или 5 % раствором глюкозы. Содержание 5 ампул препарата (2 мг) следует разводить 500 мл одного из указанных растворителей до получения концентрации готового раствора 4 мкг/мл.

Перед применением, а также после разведения необходимо проверить раствор на прозрачность. Применять только прозрачный бесцветный, без видимых частиц раствор.

Дети.

Применять в педиатрической практике по показаниям и в дозах, указанных в инструкции.

Передозировка.

Симптомы: тошнота, рвота, артериальная гипертензия, желудочковая тахикардия, фибрилляция желудочков, остановка сердца, отек легких.

Лечение: симптоматическое.

Для предупреждения передозировки необходимо четко придерживаться рекомендуемых доз препарата.

Побочные реакции.

При быстром введении Налоксона-М могут возникать различные побочные реакции.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, диарея, сухость во рту.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, брадикардия, тахикардия, гипотензия, артериальная гипертензия, фибрилляция желудочков, остановка сердца.

Со стороны центральной нервной системы: дрожь, судороги, головокружение, головная боль, напряженность, гипервентиляция.

Аллергические реакции: ринит, одышка, кожная сыпь, зуд, крапивница, мультиформная эритема, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Другие: усиление потливости, послеоперационная боль, изменения в месте введения, включая раздражение стенки сосудов (при внутривенном применении), местное раздражение и воспаление (при внутримышечном применении).

Применение Налоксона-М в дозах, превышающих рекомендуемые, может вызвать возвращение боли в послеоперационный период и возбуждение, артериальную гипотензию или гипертензию, желудочковую тахикардию, фибрилляцию желудочков, отек легких.



Синдром «отмены» у пациентов с опиоидной зависимостью: неопределенная боль, диарея, гипертермия, ринорея, чихание, повышенная потливость, тошнота, рвота, нервозность, утомляемость, раздражительность, трепет, спазмы в эпигастральной области, тахикардия, слабость; у новорожденных – судороги, диарея, гипертермия, беспрерывный крик, гиперрефлексия, чихание, трепет, необычная раздражительность, рвота.

Применение в терапевтических дозах у больных, в организме которых не содержатся опиоиды, Налоксона-М, как правило, не вызывает побочных эффектов.

Срок годности.

3 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °C.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Препарат несовместим с растворами лекарственных средств, содержащих бисульфиты, метабисульфиты, длинную цепь или анионы высокомолекулярного веса, растворы с щелочным pH. Не следует смешивать с другими лекарственными средствами.

Препарат предназначен только для отдельного применения.

Упаковка.

По 1 мл в ампуле. По 10 ампул в коробке.

По 1 мл в ампуле. По 5 ампул в блистере, по 2 блистера в коробке.

Категория отпуска.

По рецепту.

Производитель.

ООО «Харьковское фармацевтическое предприятие «Здоровье народу».

Местонахождение производителя и его адрес места проведения деятельности.

Украина, 61002, г. Харьков, ул. Мельникова, 41.

Дата последнего пересмотра.



УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
08.05.14 № 313
Регистрационное удостоверение
№ UA/1398/01/01

ИЗМЕНЕНИЯ ВНЕСЕНЫ
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
06.10.14 № 705

Заявитель, страна: **ООО "Харьковское фармацевтическое
предприятие "Здоровье народу", Украина**

Производитель, страна: **ООО "Харьковское фармацевтическое
предприятия "Здоровье народу", Украина**

**ИЗМЕНЕНИЕ №1
К ИНСТРУКЦИИ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ**

**Налоксон-ЗН, раствор для инъекций 0,4 мг/мл по 1 мл в ампулах, № 10 в
коробке, № 10 (5x2) в блистерах**

<i>Предыдущая редакция</i>	<i>Новая редакция</i>
Налоксон-М	Налоксон-ЗН

Директор ООО "Харьковское
фармацевтическое предприятие
"Здоровье народу"

Подпись
Печать

О.А. Ловашниченко
«22» 07 2014 г.

ВРiС
КОНТРОЛЬНИЙ
УТВЕРЖДЕНО
ГХЗЕМПЛЯР

Приказ Министерства
здравоохранения Украины
08.05.14 № 313

Регистрационное удостоверение
№ UA/1398/01/01

ИЗМЕНЕНИЯ ВНЕСЕНЫ
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
21.01.2016 № 31

Заявитель, страна: ООО "Харьковское фармацевтическое предприятие
"Здоровье народу", Украина
Производитель, страна: ООО "Харьковское фармацевтическое предприятие
"Здоровье народу", Украина

**ИЗМЕНЕНИЕ №2
К ИНСТРУКЦИИ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ**

Налоксон-ЗН, раствор для инъекций 0,4 мг/мл по 1 мл в ампулах № 10 в коробке,
№10 (10x1), №10 (5x2) в блистерах

<i>Действующая редакция</i>	<i>Предлагаемая редакция</i>
Раздел «Упаковка» По 1 мл в ампуле; по 10 ампул в коробке. По 1 мл в ампуле; по 5 ампул в блистере; по 2 блистера в коробке.	Раздел «Упаковка» По 1 мл в ампуле; по 10 ампул в коробке. По 1 мл в ампуле; по 5 ампул в блистере; по 2 блистера в коробке. По 1 мл в ампуле; по 10 ампул в блистере; по 1 блистеру в коробке.

Директор
ООО "Харьковское
фармацевтическое предприятие
"Здоровье народу"

Подпись
Печать

О.О. Ловашниченко
"30 " 11 2015 г.