

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ТИОПЕНТАЛ, лиофилизат для раствора для инъекций по 0,5 г или 1,0 г.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

2.1 Общее описание

Тиопентал натрия (тиопентал натрия и натрия карбонат)

2.2 Качественный и количественный состав

действующее вещество: 1 флакон содержит тиопентала натрия (тиопентала натрия и натрия карбонат) 0,5 г или 1,0 г.

Полный список вспомогательных веществ см. в пункте 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Лиофилизат для раствора для инъекций.

Основные физико-химические свойства: сухая пористая масса светло-желтого или желтовато-зеленого цвета со специфическим запахом. Гигроскопическая.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

Тиопентал натрия используется для индукции общей анестезии, а также в качестве дополнительного средства для базисного наркоза (с последующим использованием анальгетиков и миорелаксантов).

В качестве дополнительного средства для купирования судорожных состояний различной этиологии, в т.ч. вызванных применением средств для местной анестезии.

Для снижения внутричерепного давления у пациентов с повышенным внутричерепным давлением, если обеспечивается контролируемая вентиляция легких.

4.2 Режим дозирования и способ применения

Внутривенное введение.

Тиопентал натрия 500 мг для инъекций обычно вводится внутривенно в виде 2,5% раствора (500 мг в 20 мл). Иногда его можно вводить в виде 5% -ного раствора (500 мг в 10 мл).

Препарат для внутривенных инъекций следует использовать после восстановления лиофилизата водой для инъекций, как правило, до получения 2,5% раствора.

Применение в анестезии

Обычная доза для индукции анестезии составляет от 100 до 150 мг, вводится в течение 10-15 секунд. При необходимости повторная доза от 100 до 150 мг может быть введена через одну минуту. Рекомендации по фиксированной дозировке для внутривенной инъекции не могут быть даны, так как дозировка должна быть тщательно скорректирована в зависимости от ответа пациента. Следует учитывать такие факторы, как возраст, пол и вес пациента. Тиопентал натрия достигает эффективных концентраций в ткани мозга в течение 30 секунд, а анестезия обычно наступает в течение одной минуты после внутривенного введения.

Взрослые

100–150 мг внутривенно в течение 10–15 секунд, обычно в виде 2,5% раствора.

Повторная доза от 100 до 150 мг может быть введена через одну минуту.

Внутривенную инъекцию следует вводить медленно и титровать в зависимости от реакции пациента, чтобы минимизировать риск угнетения дыхания или возможность передозировки. Средняя доза для взрослого с массой тела 70 кг составляет примерно от 200 до 300 мг (от 8 до 12 мл 2,5% раствора). Максимальная доза – 500 мг.

Дети

2–7 мг/кг массы тела, внутривенно в течение 10–15 секунд, обычно в виде 2,5% раствора. Повторная доза от 2 до 7 мг/кг может быть введена через одну минуту. Доза составляет от 2 до 7 мг/кг в зависимости от ответа пациента. Доза для детей не должна превышать 7 мг/кг.

Пациенты пожилого возраста.

Рекомендуются уменьшенные дозы для взрослых.

Применение для купирования судорожных состояний

От 75 до 125 мг (от 3 до 5 мл 2,5% раствора) следует ввести как можно скорее после начала судорог. Могут потребоваться повторные дозы для контроля судорог, вызванных применением местного анестетика. Для купирования судорожных состояний также могут быть использованы другие схемы лечения, такие как внутривенное или ректальное применение диазепама.

Применение неврологическим пациентам для снижения внутричерепного давления.

Интермиттирующие болюсные инъекции от 1,5 до 3 мг/кг массы тела могут применяться для снижения повышения внутричерепного давления, если обеспечивается контролируемая вентиляция легких.

4.3 Противопоказания

Тиопентал натрия противопоказан при обструкции дыхательных путей, диспноэ, острой астме, тяжелом шоке и миотонической дистрофии, резком выраженном нарушении кровообращения, болезни Аддисона, коллапсе, лихорадочных состояниях. При приступах острой перемежающейся порфирии (в анамнезе больного или у его ближайших родственников прием любых барбитуратов противопоказан.

Также следует проявлять осторожность при тяжелых сердечно-сосудистых заболеваниях, тяжелых респираторных заболеваниях и гипертензии различной этиологии.

Пациенты с реакциями гиперчувствительности к барбитуратам.

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

Следует учитывать, что достижение и поддержание наркоза требуемой глубины и длительности зависит и от количества препарата, и от индивидуальной чувствительности к нему больного. Следует учитывать, что препарат вызывает кардиодепрессию: уменьшает ударный объем, сердечный выброс и артериальное давление. С целью предотвращения реакций, связанных с повышением тонуса блуждающего нерва, больному перед наркозом следует проводить премедикацию атропином или метацином. Рекомендовано с осторожностью применять тиопентал натрия при нарушении сократительной функции миокарда.

Не рекомендуется использование тиопентала натрия в качестве единственного средства для наркоза при интубационном наркозе, поскольку присутствует риск возникновения спазма гортани и кашля.

Тиопентал натрия вызывает угнетение дыхания и снижение сердечного выброса, а также может спровоцировать острую недостаточность кровообращения у пациентов с сердечно-сосудистыми заболеваниями, особенно с констриктивным перикардитом.

Когда требуется особая осторожность

С особой осторожностью рекомендовано применение тиопентала натрия пациентам при: гиповолемии, сильном кровотечении, ожогах, сердечно-сосудистых заболеваниях, миастении, недостаточности коры надпочечников (даже при контроле уровня кортизона), кахексии, повышенном внутричерепном давлении, повышенном уровне мочевины крови.

Требуется снижение дозы

Сниженные дозы рекомендуются при шоке, обезвоживании, тяжелой анемии, гиперкалиемии, токсемии, нарушениях обмена веществ, например: тиреотоксикоз, микседема и диабет.

Использование при заболеваниях печени и почек

Тиопентал натрия метаболизируется в основном в печени, поэтому необходимо уменьшить дозу для пациентов с печеночной недостаточностью.

Барбитураты следует использовать с осторожностью при тяжелой почечной недостаточности. Снижение дозы необходимо также при применении препарата пожилым людям и пациентам, которым для премедикации использовали наркотические анальгетики.

Было показано, что тиопентал натрия взаимодействует с сульфафуразолом. Для достижения адекватной анестезии могут потребоваться сниженные начальные дозы, но также могут потребоваться повторные дозы для поддержания анестезии.

Для пациентов, которые продолжительное время принимают препараты, такие как аспирин, пероральные антикоагулянты, ингибиторы МАО и препараты лития, необходима коррекция дозы или прекращение терапии вышеуказанными препаратами до плановой операции.

Пациентам с сахарным диабетом или гипертонией необходима коррекция доз базовой терапии до проведения анестезии.

Увеличение дозы.

Увеличение дозы необходимо для пациентов, которые в анамнезе имеют привыкание или зависимость к алкоголю или наркотическим веществам. В таких случаях рекомендуется дополнительное использование анальгетиков.

Экстравазация

Экстравазация вызывает местный некроз тканей и сильную боль. Проявление экстравазации рекомендовано купировать с помощью холода или местной инъекции гидрокортизона. 5% -ный гипертонический раствор может вызывать боль при инъекции и тромбоз флебит.

Случайное внутриартериальное введение

Случайное внутриартериальное введение тиопентала натрия вызывает сильный артериальный спазм и сильную жгучую боль вокруг места инъекции. В случае случайной внутриартериальной инъекции тиопентала иглу следует оставить на месте, чтобы можно было сделать инъекцию спазмолитического средства, такого как папаверин или прилокаина гидрохлорид. Также можно начать антикоагулянтную терапию, чтобы снизить риск тромбоза.

Применение неврологическим больным с повышенным внутричерепным давлением

Применение Тиопентала было связано с сообщениями о тяжелой или рефрактерной гипокалиемии во время инфузии; После прекращения инфузии тиопентала может развиться тяжелая рикошетная гиперкалиемия. При прекращении терапии тиопенталом следует учитывать возможность повторной гиперкалиемии.

Тиопентал натрия содержит натрий (до 59 мг во флаконах по 0,5 г и до 118 мг во флаконах по 1,0 г), этот факт необходимо учитывать пациентам, которые находятся на гипонатриевой диете.

4.5 Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Тиопентал натрия взаимодействует с сульфафуразолом

Следует отметить, что тиопентал будет взаимодействовать с бета-адреноблокаторами и антагонистами кальция, вызывая падение артериального давления.

Ингибиторы АПФ: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с ингибиторами АПФ.

Блокаторы адренергических нейронов: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с блокаторами адренергических нейронов.

Альфа-адреноблокаторы: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с альфа-адреноблокаторами.

Анальгетики: предварительное лечение аспирином усиливает анестезию тиопенталом натрия. Опиоидные анальгетики могут усиливать респираторный депрессивный эффект барбитуратных анестетиков, поэтому может потребоваться уменьшение дозы анестетика. Обезболивающий эффект петидина может быть уменьшен тиопенталом натрия.

Антагонисты рецепторов ангиотензина-II: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с антагонистами рецепторов ангиотензина-II.

Антибактериальные средства: Общие анестетики могут усиливать гепатотоксичность изониазида; эффекты тиопентала натрия усилены сульфаниламидами; Реакции, подобные гиперчувствительности, могут возникать при введении общих анестетиков с ванкомицином внутривенно.

Антидепрессанты: повышенный риск аритмий и гипотонии при применении общих анестетиков с трициклическими антидепрессантами. Гипотония и гипертония наблюдались при приеме ингибиторов МАО.

Нейролептики: у пациентов, получающих фенотиазиновые нейролептики, может наблюдаться усиление гипотензии. Некоторые фенотиазины, особенно прометазин, могут также увеличивать частоту возбуждающих явлений, вызываемых барбитуратовыми анестетиками; циклизин может иметь аналогичный эффект. Седативные свойства также могут усиливаться тиопенталом натрия.

Бензодиазепины: мидазолам усиливает анестезирующие эффекты тиопентала натрия.

Диазоксид: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с диазоксидом.

Диуретики: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с диуретиками.

Лекарства со стороны желудочно-кишечного тракта: метоклопрамид и дроперидол снижают дозу тиопентала натрия, необходимую для индукции анестезии.

Метилдопа: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с метилдопой.

Моксонидин: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с моксонидином.

Нитраты: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с нитратами.

Пробенецид: предварительное лечение пробенецидом усиливает анестезию тиопенталом натрия.

Сосудорасширяющие гипотензивные средства: усиление гипотензивного эффекта при применении общих анестетиков с гидралазином, миноксидилом или нитропруссидом.

Использование анестетиков с другими депрессантами ЦНС, такими как те, которые используются для премедикации, может оказывать синергетическое действие на ЦНС, и в некоторых случаях следует использовать меньшую дозу общего анестетика. Сообщалось о брадикардии, возникающей во время индукции анестезии тиопенталом, у пациентов, также получавших фентанил.

Травяные препараты: данные на животных показывают, что валериана и зверобой могут продлить действие тиопентала натрия.

Алкоголь: действие алкоголя может усиливаться в период после лечения тиопенталом натрия (как минимум в течение первых 24 часов).

4.6 Фертильность, беременность и лактация

Грудное вскармливание

Тиопентал натрия легко проникает через плацентарный барьер, а также попадает в грудное молоко. Поэтому следует временно приостановить грудное вскармливание или сцеживать грудное молоко до индукции анестезии.

Беременность

Было доказано, что тиопентал натрия можно использовать без побочных эффектов во время беременности, хотя общая доза не должна превышать 250 мг. Однако при рассмотрении вопроса об использовании тиопентала натрия, врач должен использовать препарат только тогда, когда ожидаемая польза превышает любые потенциальные риски.

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и потенциально опасными механизмами

Послеоперационные головокружения, дезориентация и седативный эффект могут наблюдаться длительное время после применения Тиопентала, поэтому следует воздерживаться от управления автотранспортом или выполнения работы, требующей усиленного внимания и скорости психомоторных реакций, особенно в первые 24-36 часов после применения препарата.

4.8 Нежелательные реакции

Во время процедуры индукции может возникнуть спазм гортани вместе с кашлем или чиханием. По этой причине не рекомендуется использовать только тиопентал натрия для пероральной эндоскопии.

Падение артериального давления часто наблюдается при первом назначении тиопентала натрия.

Хотя частота, установленная в контролируемых клинических испытаниях, недоступна для тиопентала натрия, известно, что у пациентов после общей анестезии относительно часто встречаются следующие симптомы: сонливость; тошнота с рвотой или без нее; снижение аппетита; недомогание; усталость; головокружение; головная боль, делирий у пожилых пациентов.

Чрезмерные дозы связаны с переохлаждением и серьезной церебральной недостаточностью.

В рамках системно-органного класса побочные реакции перечислены по частоте с использованием следующих условных обозначений: очень часто ($\geq 1 / 10$); общие (от $\geq 1 / 100$ до $< 1/10$); нечасто (от $\geq 1 / 1000$ до $< 1/100$); редко (от $\geq 1 / 10,000$ до $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10\ 000$) и неизвестно (не может быть оценено на основе имеющихся данных).

Системно-органный класс	Побочная реакция	Частота
Нарушение иммунной системы	Гиперчувствительность, анафилактические и анафилактоидные реакции, анафилактический шок. Есть информация о развитии гемолитической анемии и почечной недостаточности, ассоциированной с ростом антител к тиопенталу.	Неизвестно
Нарушения обмена веществ и питания	Снижение аппетита, анорексия, гипокалиемия, гиперкалиемия,	Неизвестно

Психиатрические расстройства	Делирий, состояние спутанности сознания	Неизвестно
Нарушения со стороны нервной системы	Церебральная недостаточность, амнезия, головокружение, сонливость, головная боль, гипертонус мышц,	Неизвестно
Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы:	Аритмия, тахикардия, сердечная недостаточность, снижение сократительной способности миокарда, артериальная гипотензия, циркуляторный коллапс	Неизвестно
Нарушения со стороны органов дыхания, грудной клетки и средостения.	Бронхоспазм, угнетение дыхания, ларингоспазм, кашель, чихание, апноэ.	Неизвестно
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Тошнота, рвота гиперсаливация	Неизвестно
Со стороны кожи и подкожной клетчатки	сыпь, крапивница, зуд, отек Квинке, гиперемия кожи	Неизвестно
Общие расстройства и расстройства в месте введения.	Недомогание, утомляемость, озноб, гипотермия, экстравазация. В случае экстравазации барбитуратами (проникновении препарата в окружающие мягкие ткани при внутривенном введении) существует риск возникновения некроза и сильной боли. При введении 5 % раствора возможно развитие тромбофлебита. При случайном внутриартериальном введении тиопентала натрия развивается сильный артериальный спазм и интенсивная жгучая боль вокруг места инъекции (см. раздел «Особенности применения»).	Неизвестно
Исследования	Снижение сердечного выброса, гипотензия	Неизвестно

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации ЛП с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» ЛП. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях ЛП через национальную систему сообщения о нежелательных реакциях.

4.9 Передозировка

При передозировке отмечается угнетение дыхания вплоть до апноэ, ларингоспазм, артериальная гипотензия, коллапс, тахикардия, остановка сердца, отек легких; постнаркотический делирий.

Лечение: вводить специфический антагонист – бемеград. При остановке дыхания применять искусственную вентиляцию легких, 100 % кислород; при ларингоспазме – миорелаксанты и 100 % кислород под давлением; при артериальной гипотензии – плазмозамещающие растворы, гипертензивные препараты.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Средства для общей анестезии. Барбитураты, монопрепараты.

Код АТХ N01A F03

Тиопентал натрия представляет собой замещенный барбитурат короткого действия, который более растворим в липидах, чем другие группы барбитуратов. Препарат обратимо угнетает активность всех возбудимых тканей. Обычно, общая анестезия достигается с помощью тиопентала натрия без значительного воздействия на периферические ткани, вследствие чувствительности ЦНС к тиопенталу.

Тиопентал натрия действует на ЦНС, угнетая ретикулярную формацию среднего мозга. Барбитураты оказывают разное влияние на синаптическую передачу, в основном ГАМК зависимую. Автономные ганглии периферической нервной системы также угнетаются.

5.2 Фармакокинетические свойства

После внутривенного введения период введения в наркоз наступает в течение 30 секунд и продолжается в течение 20-30 минут после введения однократной дозы. Быстрое поглощение происходит в наиболее васкуляризованных областях мозга с последующим перераспределением в другие ткани.

Тиопентал натрия прочно связывается с белками плазмы, что ухудшает выведение почками. Выводится из организма в виде неактивных метаболитов. Таким образом, тиопентал натрия, обладая короткой продолжительностью действия, может иметь длительный период выведения.

5.3. Данные доклинической безопасности

Нет других доклинических данных, актуальных для врача, помимо тех, которые уже включены в другие разделы ОХЛП.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Отсутствуют.

6.2. Несовместимость

Раствор Тиопентала нельзя смешивать в одном шприце с антибиотиками (амикацин, бензилпенициллин, цефепим), транквилизаторами, миорелаксантами (суксаметоний, тубокурарин), анальгетиками, эфедрином, аскорбиновой кислотой, дипиридамом,

хлорпромазином, кетамином, петидином, морфином, прометазином, а также кислотами и солями кислот.

6.3 Срок годности

2 года

Не применять по истечении срока годности.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

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

Хранить в недоступном для детей месте.

6.5 Форма выпуска и упаковка

По 0,5 г или 1,0 г во флаконах. По 40 флаконов в коробке.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним.

Любой неиспользованный лекарственный препарат или отходы должны быть утилизированы в соответствии местным требованиям.

6.7 Условия отпуска из аптек

По рецепту

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ПАО «Киевмедпрепарат», Украина, 01032, г. Киев, ул. Саксаганского, 139.

тел/факс: +38-044-490-75-22

E-mail: office@arterium.ua

7.1. ПРЕДСТАВИТЕЛЬ ДЕРЖАТЕЛЯ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

№16034

№16035

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата последнего подтверждения регистрации (перерегистрации):

17.10.2016

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА