

ЗАТВЕРДЖЕНО

Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
30.04.2015 №257
Реєстраційне посвідчення
№ UA/3916/01/02
UA/3916/01/01

ЗМІНИ ВНЕСЕНО

Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
29.03.2017 № 341

Склад:

діюча речовина: 1 флакон містить тіопенталу натрію
0,5 г або 1,0 г.

Лікарська форма. Ліофілізат для розчину для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: суха пориста
маса світло-жовтого або жовтувато-зеленого кольору
зі специфічним запахом. Гіроскопічна.

Фармакотерапевтична група. Засоби для загальної
анестезії. Барбітурати, монопрепарати.

Код АТХ N01A F03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Тіопентал натрію належить до засобів для неінгаляційного наркозу. Під дією препарату подовжується період відкриття ГАМК(γ -аміномасляна кислота)-залежних каналів на постсинаптичних мембранах нейронів головного мозку, час входу іонів хлору всередину нервової клітини та виникає гіперполяризація мембран. Пригнічує збуджувальну дію амінокислот (аспарату та глутамату). У великих дозах, безпосередньо активуючи ГАМК-рецептори, проявляє ГАМК-міметичну дію. Проявляє протисудомну активність – підвищуючи поріг збудливості нейронів та блокуючи проведення та поширення судомного імпульсу головним мозком. Сприяє міорелаксації, пригнічуючи полісинаптичні рефлексії, та сповільнює проведення по вставних нейронах спинного мозку. Уповільнює метаболічні процеси у головному мозку, утилізацію мозком глюкози та кисню. Має снодійну дію, яка проявляється у прискоренні процесу засинання та змінням структури сну. Пригнічує дихальний центр та зменшує його чутливість до вуглекислого газу. Здійснює негативний інотропний ефект: зменшує ударний об'єм, серцевий викид та артеріальний тиск. Збільшує сміність венозної системи, знижує печінковий кровотік та швидкість клубочкової фільтрації.

Фармакокінетика.

При внутрішньовенному введенні швидко проникає у головний мозок, скелетні м'язи, нирки, печінку та жирову тканину. У жирових депо концентрація препарату вище за плазменну у 6-12 разів. З білками плазми крові зв'язується на 80-86 %. Проникає крізь плацентарний бар'єр та екскретується у грудне молоко. В основному біотрансформації підлягає у печінці з утворенням неактивних метаболітів, незначна частина інактивується у нирках та головному мозку. Період напіввиведення становить 10-12 годин. Виводиться переважно нирками. При правильному дозуванні препарату період введення у наркоз відбувається легко і швидко – 40 секунд. Хірургічна стадія наркозу характеризується зменшенням або зникненням сухожилкових та рогіткових рефлексів, невеликим

звуженням (або нормальними розмірами) зіниць, нерухомістю або «плаваючим» станом очних яблук, розслабленням мускулатури глотки із западанням язика, зменшенням глибини дихання та зниженням артеріального тиску. Довготривалість наркозу після внутрішньовенного введення становить у середньому 20 хвилин. При виході з наркозу анальгезуюча дія тіопенталу натрію припиняється з пробудженням хворого. Має кумулюючу дію при повторних введеннях.

Клінічні характеристики.

Показання.

Індукційний наркоз.

У якості додаткового засобу для базисного наркозу (з подальшим використанням анальгетиків та міорелаксантів).

У якості додаткового засобу для купірування судомних станів різної етіології, у т.ч. зумовлених використанням засобів для місцевої анестезії.

Для зниження внутрішньочерепного тиску у пацієнтів з підвищеним внутрішньочерепним тиском під час проведення штучної вентиляції легень.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до тіопенталу та/або до інших барбітуратів, напади гострої переміжної порфірії (в анемнезі хворого або у його близьких родичів), загострення астми, гостро виражене порушення кровообігу, хвороба Аддісона, колапс, термінальна стадія шоку, гарячкові стани.

Слід проявляти обережність пацієнтам із тяжкими захворюваннями серцево-судинної системи, тяжкими бронхолегеневими захворюваннями і при гіпертензії різної етіології.

Барбітурати протипоказані при диспное або обструкції дихальних шляхів, наприклад, при гострій важкій астмі, або коли не можна гарантувати підтримання прохідності дихальних шляхів.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Тіопентал підвищує ефект гіпотензивних та гіпотермічних засобів. Препарат потенціює пригнічувальний вплив на центральну нервову систему седативних та снодійних засобів, кетаміну, нейролептиків, сульфату магнію, етанолу. Активність препарату підвищується H_1 -адреноблокаторами та пробенезидом; знижується – аналептиками та деякими антидепресантами, амінофіліном. Отже, слід з обережністю застосовувати Тіопентал із вищезазначеними препаратами.

При одночасному застосуванні тіопенталу натрію з сульфофуразолом показано зниження початкової дози та у необхідності підтримання анестезії повторними дозами.

При одночасному застосуванні засобів для загальної анестезії з такими препаратами як β -блокатори та блокатори кальцієвих каналів, інгібітори АПФ, α -адреноблокатори, антагоністи ангіотензину II, фенотіазин, діазоксид, діуретики, метилдопа, моксонідин, нітрати, периферичні вазодилатори (гідралазін, міноксидил, нітропрусид) можливе потенціювання їх гіпотензивної дії.

Анальгетики.

Є дані про підвищення активності тіопенталу натрію при попередньому застосуванні аспірину. У зв'язку з можливістю пригнічення дихання слід з обережністю застосовувати тіопентал натрію у поєднанні з наркотичними анальгетиками. Тіопентал натрію може зменшити знеболювальну дію петидину.

Антибактеріальні препарати.

Є дані про те, що засоби для загальної анестезії можуть потенціювати гепатотоксичність ізоніазиду, підвищення чутливості і побічні реакції можуть виникнути також при одночасному застосуванні тіопенталу натрію та внутрішньовенному введенні ванкоміцину.

Антидепресанти.

При одночасному застосуванні з трициклічними антидепресантами підвищується ризик виникнення аритмії і гіпотонії. При одночасному застосуванні тіопенталу натрію з інгібіторами MAO існує ризик розвитку гіпотонії і гіпертензії.

Антипсихотичні препарати.

Тіопентал натрію може посилювати седативні властивості деяких фенотіазинів, особливо прометазину.

Бензодіазепіни.

Мідазолам потенціює анестезуючу дію тіопенталу натрію.

При одночасному застосуванні тіопенталу натрію з метоклопрамідом і дроперидолом необхідно зменшити дозу тіопенталу натрію.

При одночасному застосуванні інших препаратів, що пригнічують ЦНС, для премедикації, можливий синергізм їх дії, тому в деяких випадках необхідно використовувати менші дози препаратів для загальної анестезії.

Є дані про виникнення брадикардії при індукції анестезії тіопенталом натрію в поєднанні з фентанілом.

Особливості застосування.

Слід враховувати, що досягнення та підтримка наркозу потрібної глибини та тривалості залежить і від кількості препарату, і від індивідуальної чутливості до нього хворого. Слід враховувати, що препарат спричиняє кардіодепресію: зменшує ударний об'єм, серцевий викид і артеріальний тиск. З метою запобігання реакцій, пов'язаних з підвищенням тону блукаючого нерва, хворому перед наркозом слід проводити премедикацію атропіном або метацином.

Рекомендовано з обережністю застосовувати тіопентал натрію при порушенні скорочувальної функції міокарда.

Не рекомендується використання тіопенталу натрію в якості єдиного засобу для наркозу при інтубаційному наркозі, оскільки присутній ризик виникнення спазму гортані і кашлю. Тіопентал натрію спричиняє пригнічення дихання у хворих з серцево-судинними захворюваннями, застосування тіопенталу натрію може спричинити гостру недостатність кровообігу.

З особливою обережністю рекомендоване застосування тіопенталу натрію пацієнтам при: гіповолемії, сильній кровотечі, опіках, серцево-судинних захворюваннях, міастенії, недостатності кори надниркових залоз (навіть при контролі рівня кортизону), кахексії, підвищеному внутрішньочерепному тиску, підвищеному рівню сечовини крові.

Необхідно зменшити дозу при шоці, зневодненні, тяжкій анемії, гіперкаліємії, токсемії, тиреотоксикозі, мікседемі і діабеті.

Використання при печінковій та нирковій недостатності.

Тіопентал натрію метаболізується в основному в печінці, тому необхідно зменшити дозу для пацієнтів з печінковою недостатністю.

Барбітурати слід використовувати з обережністю при тяжкій нирковій недостатності. Зниження дози необхідно також при застосуванні препарату у людей літнього віку і пацієнтам, у яких для премедикації використовували наркотичні анальгетики.

Для пацієнтів, які тривало приймають такі препарати, як аспірин, пероральні антикоагулянти, інгібітори MAO і препарати літію, необхідна корекція дози або припинення терапії вивказаними препаратами до планової операції.

Пацієнтам з цукровим діабетом або гіпертонією необхідна корекція доз базової терапії до проведення анестезії.

Збільшення дози.

Збільшення дози необхідно для пацієнтів, які в анамнезі мають звикання або залежність до алкоголю чи наркотичних речовин. У таких випадках рекомендується додаткове використання анальгетиків.

Екстравазація.

Прояв екстравазації рекомендовано купірувати за допомогою холоду або місцевої ін'єкції гідрокортизону.

Випадкове внутрішньоартеріальне введення.

У разі випадкового внутрішньоартеріального введення тіопенталу натрію голка повинна залишатися на місці для введення спазмолітичних препаратів, таких як папаверин або прилокаїну гідрохлорид. У таких випадках також рекомендовано застосовувати антикоагулянтну терапію з метою зниження ризику виникнення тромбозу.

Застосування неврологічним хворим з підвищеним внутрішньочерепним тиском.

Існують ризики виникнення рефрактерної гіпокаліємії під час проведення і після припинення інфузії тіопенталу натрію, дані ризики мають бути враховані після завершення інфузії тіопенталу натрію.

Тіопентал натрію містить натрій (до 59 мг у флаконах по 0,5 г і до 118 мг у флаконах по 1,0 г), даний факт необхідно враховувати пацієнтам, які перебувають на гіпонатрієвій дієті.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Тіопентал натрію легко проникає через плацентарний бар'єр, а також виявляється в грудному молоці. Тому годування груддю має бути тимчасово припинене або грудне молоко повинно бути зціджено перед застосуванням ввідного наркозу. Доведено, що тіопентал натрію можна застосовувати без виникнення побічних реакцій у період вагітності, але при цьому загальна доза не повинна перевищувати 250 мг. Тіопентал в період вагітності можна призначати, тільки якщо очікувана користь перевищує потенційний ризик.

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

Післяопераційні запаморочення, дезорієнтація та седативний ефект можуть спостерігатися тривалий час після застосування Тіопенталу, тому слід утримуватися від керування автотранспортом або виконання роботи, що вимагає посиленої уваги та швидкості психомоторних реакцій, особливо у перші 24-36 годин після застосування препарату.

Спосіб застосування та дози.

Застосування Тіопенталу можливе тільки в умовах стаціонару.

Виятково для внутрішньовенного введення, повільно.

Внутрішньовенні ін'єкції.

Готувати розчин тільки безпосередньо перед вживанням на стерильній воді для ін'єкцій. Розчини повинні бути абсолютно прозорими.

Не слід вводити мутний розчин або розчин з неповністю розчиненим вмістом флакона. Тіопентал застосовують у вигляді розчину 25 мг/мл. В окремих випадках Тіопентал можна застосовувати у вигляді розчину 50 мг/мл.

Застосування в анестезії.

Доза препарату завжди визначається ефектом, тому наведені нижче дані використовуються тільки в якості загального керівництва. В цілому необхідна доза пропорційна до маси тіла хворого.

Для ввідного наркозу, як правило, використовувати дозу 100-150 мг Тіопенталу, яку вводять внутріш-

ньовенно повільно за 10-15 секунд. При необхідності можливе повторне введення дози 100-150 мг через 1 хвилину.

Доза препарату повинна бути ретельно відкоригована залежно від відповіді пацієнта, щоб звести до мінімуму ризик пригнічення дихання або можливість передозування, при цьому слід враховувати також такі чинники як вік, стать і вага пацієнта. Тіопентал натрію досягає ефективної концентрації у тканині мозку протягом 30 секунд, і анестезія зазвичай настає протягом 1 хвилини після внутрішньовенного введення.

Дорослі.

Середня доза для дорослого з масою тіла 70 кг становить 200-300 мг (8-12 мл розчину 25 мг/мл), максимальна доза становить 500 мг.

Діти.

Середня доза розчину Тіопенталу 25 мг/мл становить 2-7 мг/кг маси тіла, вводиться внутрішньовенно повільно за 10-15 секунд. При необхідності можливе повторне введення дози 2-7 мг/кг маси тіла через 1 хвилину. Доза препарату повинна бути ретельно відкоригована залежно від відповіді пацієнта. Максимальна доза Тіопенталу не повинна перевищувати 7 мг/кг.

Пацієнти літнього віку.

Рекомендуються зменшені дози для дорослих.

Застосування для купірування судомних станів.

Середня доза становить 75-125 мг (3-5 мл розчину 25 мг/мл). Препарат необхідно ввести якомога шкiше після початку судом. Повторне введення препарату може знадобитися з метою купірування судомних станів, спричинених застосуванням засобів для місцевої анестезії.

Для купірування судомних станів також можуть бути використані інші схеми лікування, такі як внутрішньовенне або ректальне застосування діазепаму.

Застосування неврологічним пацієнтам для зниження внутрішньочерепного тиску. Використовуються інтентуєчі болюсні ін'єкції препарату в дозі 1,5-3 мг/кг маси тіла з метою зниження підвищеного внутрішньочерепного тиску при проведенні штучної вентиляції легень.

Діти.

Препарат застосовувати з перших днів життя (див. розділ «Спосіб застосування та дози»).

Передозування.

При передозуванні відзначається пригнічення дихання аж до апное, ларингоспазм, артеріальна гіпотензія, колапс, тахікардія, зупинка серця, набряк легень; післянаркозний делірій.

Лікування: вводити специфічний антагоніст – бемегрид. При зупинці дихання застосовувати штучну вентиляцію легень, 100 % кисень; при ларингоспазмі – міорелаксанти та 100 % кисень під тиском; при артеріальній гіпотензії – плазмозамінні розчини, гіпертензивні препарати.

Побічні реакції.

Під час індукції тіопенталом, як і під час застосування будь-яких барбітуратів, можуть виникати кашель та чихання.

З боку імунної системи: алергічні реакції, включаючи шкірні висипання, кропив'янку, свербіж, набряк Квінке, гіперемію шкіри, озноб, анафілактичний шок. Є інформація щодо розвитку гемолітичної анемії та ниркової недостатності, асоційованої з ростом анти-тіл до тіопенталу.

З боку травної системи: гіперсалівація, нудота, блювання.

З боку обміну речовин та харчування: можливі аноксія, гіпо- та/або гіперкаліємія.

З боку центральної та периферичної нервової системи: гіпертонус м'язів, сонливість, головний біль, сплутаність свідомості, амнезія, запаморочення.

Психичні розлади: можливий делірій у пацієнтів літнього віку.

З боку дихальної системи: пригнічення або зупинка дихання, ларингоспазм, бронхоспазм.

З боку серцево-судинної системи: артеріальна гіпотензія, тахікардія, аритмія, серцева недостатність, зниження скоротливості здатності міокарда.

Інші: нездужання, підвищена втомлюваність.

Місцеві реакції: у випадку екстравазації барбітуратами (проникнення препарату у навколишні м'які тканини при внутрішньовенному введенні) існує ризик виникнення некрозу і сильного болю. При введенні 5 % розчину можливий розвиток тромбофлебіту. При випадковому внутрішньоартеріальному введенні тіопенталу натрію розвивається сильний артеріальний спазм та інтенсивний печучий біль навколо місця ін'єкції (див. розділ «Особливості застосування»).

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання.

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

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Розчин Тіопенталу не можна змішувати в одному шприці з антибіотиками (амікацин, бензилпеніцилін, цефалірін), транквілізаторами, міорелаксантами (суксаметоній, тубокурарин), анальгетиками, ефедрином, аскорбіновою кислотою, дипіридамолом, хлорпромазином, кетаміном, петидином, морфіном, прометазином, а також кислотами та солями кислот.

Упаковка.

По 0,5 г або 1,0 г у флаконах.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139.

Дата останнього перегляду. 29.03.2017.