Луналдин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр Википедия
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	100 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	200 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	300 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	400 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	600 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Таблетки подъязычные	**1 мл**
фентанил	800 мкг

10 шт. - блистеры (1) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.
10 шт. - блистеры (2) из ПА/ПВХ/Ал/ПЭ/бумага - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Луналдин является эффективным быстродействующим μ-опиоидным анальгетиком короткого действия. Основными терапевтическими эффектами Луналдина являются обезболивающий и седативный. Анальгетическая активность Луналдина примерно в 100 раз выше, чем у морфина. Луналдин оказывает типичное для опиоидных анальгетиков действие на ЦНС, дыхательную и желудочно-кишечную системы, являющееся характерным для препаратов данного класса.

Было показано, что у онкологических пациентов с болью, получающих постоянные поддерживающие дозы опиоидов, фентанил значительно уменьшает интенсивность болевого приступа (через 15 минут после применения), по сравнению с плацебо, что существенно снижает потребность в экстренной обезболивающей терапии. Безопасность и эффективность фентанила оценивалась у пациентов, получавших препарат сразу при наступлении боли.

Профилактическое применение фентанила при прогнозируемых приступах боли в ходе клинических испытаний не изучалось. Луналдин, как и все агонисты μ-опиоидных рецепторов, вызывает дозозависимое угнетающее действие на дыхательный центр. Риск угнетения дыхания выше у лиц, ранее не получавших опиоиды, по сравнению с пациентами, испытывавшими ранее сильные боли и получавшими длительное лечение опиоидами.

Опиоиды обычно повышают тонус гладких мышц мочевыводящих путей, вызывая или увеличение частоты мочеиспускания, или затрудненное мочеиспускание. Опиоиды повышают тонус гладких мышц ЖКТ, уменьшают перистальтику кишечника, чем может быть обусловлено закрепляющее действие фентанила.

Фармакокинетика

Фентанил обладает выраженными липофильными свойствами, быстро абсорбируется через слизистую оболочку ротовой полости и немного медленнее -через ЖКТ. При пероральном применении подвергается выраженным эффектам «первого прохождения» через печень и ЖКТ.

Луналдин в виде подъязычных таблеток хорошо растворяется. Быстрая абсорбция фентанила происходит в течение около 30 минут после приема препарата. Биодоступность фентанила недостаточно изучена, но по оценке составляет около 70%. C_{max} фентанила составляют от 0.2 до 1.3 нг/мл (после введения 100 - 800 мкг препарата) и достигается в течение 22.5 - 240 минут.

Обезболивающее действие препарата связано с концентрацией действующего вещества в плазме крови. У пациентов, ранее не принимавших опиоиды, минимальные эффективные плазменные концентрации фентанила, вызывающие обезболивающее действие, составляют 0.3-1.2 нг/мл. Уровни концентрации 10-20 нг/мл - это концентрация фентанила в плазме крови при разных видах анестезии при хирургических операциях и уровни концентрации 10-20 нг/мл могут вызвать выраженное угнетение дыхания.

Примерно 80-85% фентанила связывается с белками плазмы, преимущественно α1-гликопротеином, и в меньшей степени - альбуминами и липопротеинами. Объем распределения фентанила в равновесном состоянии составляет 3-6 л/кг. Метаболизируется в печени, главным образом, с участием ферментов CYP3A4 до метаболитов. Основной метаболит фентанила - норфентанил, который не является активным.

Выводится почками (75% - в виде метаболитов и 10% - в неизмененном виде) и с желчью (9% - в виде метаболитов).

Общий клиренс фентанила составляет примерно 0.5 л/ч/кг. $T_{1/2}$ фентанила составляет около 7 часов (от 3 до 12.5 часов), а конечный $T_{1/2}$ - около 20 часов (от 11.5 до 25 часов).

Показано, что концентрация фентанила в плазме прямопропорциональна дозе препарата в диапазоне от 100 до 800 мкг.

Нарушение функции почек/печени

Нарушение функции печени или почек может вызывать повышение концентраций препарата в плазме. У пожилых, истощенных и ослабленных пациентов клиренс фентанила может быть сниженным, что является причиной увеличения конечного периода полувыведения вещества.

Показания к применению:

— лечение приступов боли у пациентов с хроническим болевым синдромом, вызванным онкологическим заболеванием, и получающих постоянную терапию опиоидами.

Относится к болезням:

- Болевой синдром

Противопоказания:

— из-за риска возникновения угрожающего жизни угнетения дыхания, использование Луналдина противопоказано пациентам, ранее не получавшим терапию опиоидами;

— состояния, характеризующиеся тяжелым угнетением дыхания или тяжелые обструктивные заболевания легких;

— возраст до 18 лет;

— повышенная чувствительность к активному веществу или к любому из вспомогательных веществ.

С осторожностью: применение всех опиоидов, включая Луналдин, связано с риском клинически значимого угнетения дыхания. Особую осторожность следует соблюдать при титровании дозы Луналдина у пациентов с хроническими обструктивными заболеваниями легких или другими состояниями, способствующими угнетению дыхания (например, миастения гравис), из-за риска дальнейшего угнетения дыхания, которое может привести к дыхательной

недостаточности. Луналдин следует применять с крайней осторожностью у пациентов, которые могут быть особенно восприимчивыми к проявлениям гиперкапнии: при повышенном внутричерепном давлении, нарушении сознания, коме или опухоли мозга. У пациентов с травмами головы клиническая картина может быть замаскирована применением опиоидов. В этих случаях опиоидные препараты следует применять только по абсолютным показаниям.

Установлено, что фентанил может вызывать брадикардию. Луналдин следует применять с осторожностью у пациентов с брадиаритмией.

Луналдин следует применять с осторожностью у пациентов с нарушением функции печени или почек, особенно на стадии титрования дозы. Применение Луналдина у пациентов с печеночной или почечной недостаточностью может увеличить биодоступность фентанила и уменьшить его системный клиренс, что может привести к его накоплению и усилению/увеличению продолжительности действия. Следует соблюдать осторожность при лечении пациентов с гиповолемией и артериальной гипотензией.

Применение Луналдина не изучалось у пациентов с повреждением или воспалением слизистой оболочки полости рта. У таких пациентов существует риск повышенного системного воздействия препарата, поэтому на этапе титрования дозы рекомендуется соблюдать особую осторожность.

Способ применения и дозы:

Луналдин следует назначать только пациентам, которые считаются толерантными к терапии опиоидами, применяемыми при постоянной боли, вызванной онкологическими заболеваниями. Пациенты считаются толерантными к опиоидам, если они принимают не менее 60 мг морфина в сутки перорально, 25 мкг фентанила в час чрескожно или эквивалентную анальгезирующую дозу другого опиоида в течение недели или более.

Подъязычные таблетки Луналдина помещают непосредственно под язык как можно глубже. Таблетки Луналдина не следует проглатывать, жевать и рассасывать; препарат должен полностью раствориться в подъязычной области. Пациентам рекомендуют не есть и не пить, пока подъязычная таблетка полностью не растворится.

Пациенты, испытывающие сухость во рту, перед приемом Луналдина могут использовать воду для увлажнения слизистой оболочки полости рта.

Титрование дозы

Оптимальная доза Луналдина определяется для каждого пациента индивидуально путем подбора с постепенным увеличением дозы. Для подбора дозы можно использовать таблетки с различным содержанием активного вещества. Исходная доза Луналдина должна составлять 100 мкг, в процессе титрования ее постепенно увеличивают по мере необходимости в диапазоне существующих доз. В период титрования дозы за пациентами следует проводить тщательное наблюдение до достижения оптимальной дозы, т. е. до достижения надлежащего обезболивающего действия.

Переход с других фентанил-содержащих препаратов, на Луналдин не следует проводить в соотношении 1:1 вследствие разных профилей абсорбции препаратов. Если пациенты переходят с других фентанил-содержащих препаратов, необходимо провести титрование дозы с использованием Луналдина.

Для подбора доз рекомендуется следующий режим, хотя во всех случаях лечащий врач должен учитывать клинические потребности пациента, возраст и сопутствующие заболевания.

Все пациенты должны начинать лечение с одной подъязычной таблетки 100 мкг. Если не достигается достаточного обезболивающего действия в течение 15-30 минут после приема одной подъязычной таблетки, можно принять вторую таблетку 100 мкг. Если после приема 2 таблеток по 100 мкг не достигается достаточного обезболивания, следует рассмотреть возможность увеличения дозы до следующей дозировки препарата при следующем эпизоде боли. Увеличение дозы следует проводить постепенно до достижения достаточного обезболивания. Титрование дозы следует начинать с приема одной подъязычной таблетки. Вторую дополнительную подъязычную таблетку следует принять через 15-30 минут, если не достигнуто достаточное обезболивание. Дозу дополнительной подъязычной таблетки следует увеличить со 100 до 200 мкг и затем до дозы 400 мкг и более. Это проиллюстрировано в приведенной ниже схеме. На этапе подбора дозы титрованием следует применять не более двух (2) подъязычных таблеток при одном эпизоде приступа боли.

Доза (мкг) первой подъязычной таблетки на эпизод приступа боли	Доза (мкг) дополнительной (второй) подъязычной таблетки, которую в случае необходимости следует принимать через 15-30 минут после первой таблетки
100	100
200	100
300	100
400	200
600	200

800	-

Если достаточное обезболивание достигается при более высокой дозе, но нежелательные эффекты признаются неприемлемыми, можно назначить прием промежуточной дозы (с использованием подъязычной таблетки 100 мкг). Дозы более 800 мкг в ходе клинических исследований не оценивались. Для минимизации риска нежелательных реакций, связанных с приемом опиоидных препаратов, и определения оптимальной дозы необходимо тщательное медицинское наблюдение за состоянием пациента в ходе титрования дозы.

Поддерживающее лечение

После определения оптимальной дозы, которая может быть более одной таблетки, пациентам проводят поддерживающее лечение с использованием подобранной дозы и ограничивают применение препарата максимум четырьмя дозами Луналдина в сутки.

Коррекция дозы

Если реакция (обезболивание или нежелательные реакции) на подобную дозу Луналдина существенно изменяется, может потребоваться коррекция дозы для поддержания оптимальной дозы. Если за сутки наблюдается более четырех эпизодов боли в течение более чем четырех дней подряд, следует скорректировать дозу

опиоидов пролонгированного действия, используемых для купирования постоянной боли. Если проведена замена опиоидного препарата пролонгированного действия или изменена его доза, следует провести повторный расчет и титрование дозы Луналдина для подбора пациенту оптимальной дозы.

Повторное титрование и подбор дозы обезболивающих препаратов необходимо проводить под наблюдением врача.

Прекращение лечения

В случае если пациент более не нуждается в приеме опиоидных препаратов, дозу Луналдина следует принять во внимание, прежде чем начать постепенное снижение дозы опиоидов для минимизации возможных эффектов «отмены». Если пациенты продолжают постоянно принимать опиоидные препараты для лечения хронической боли, но более не нуждаются в лечении приступов боли, прием Луналдина может быть немедленно прекращен.

Применение у детей и подростков

Луналдин не должен применяться у пациентов моложе 18 лет вследствие недостаточных данных по безопасности и эффективности.

Применение у пожилых пациентов

Титрование дозы следует проводить с особой осторожностью. У пациентов следует тщательно контролировать появление признаков токсичности фентанила.

Применение у пациентов с нарушением функции почек или печени

Пациенты с нарушением функций печени или почек должны тщательно наблюдаться на предмет проявления признаков токсичности фентанила на этапе титрования дозы Луналдина.

Побочное действие:

При применении Луналдина следует ожидать нежелательные реакции, типичные для опиоидов; интенсивность этих реакций, как правило, имеет тенденцию к снижению при продолжительном применении. Наиболее серьезными потенциальными нежелательными реакциями, связанными с применением опиоидов, являются угнетение дыхания (которое может привести к остановке дыхания), снижение артериального давления и шок.

Со стороны дыхательной системы: более часто - угнетение дыхания, гиповентиляция, вплоть до остановки дыхания.

Со стороны нервной системы и органов чувств: более часто - головная боль, сонливость; менее часто - угнетение ЦНС (в т.ч. после операции), парадоксальное возбуждение ЦНС, делирий, судороги, нечеткость зрительного восприятия, диплопия, яркие сновидения, потеря памяти; частота не установлена - спутанность сознания, эйфория, галлюцинации, головная боль, внутричерепная гипертензия.

Со стороны пищеварительной системы: более часто - тошнота, рвота; менее часто -метеоризм, спазм сфинктера Одди, замедление опорожнения желудка, запор, желчная колика (у больных имевших их в анамнезе).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: более часто - брадикардия, снижение артериального давления; менее часто - угнетение деятельности сердечно-сосудистой системы, вплоть до остановки сердца.

Со стороны мочевыводящей системы: спазм мочеточников, задержка мочи.

Аллергические реакции: менее часто - аллергический дерматит, ларингоспазм, озноб, кожный зуд, бронхоспазм.

Прочие: кратковременная ригидность мышц (в т.ч. грудных), усиленное потоотделение, лекарственная зависимость, синдром "отмены" (неясные боли, диарея, сердцебиение, ринит, чиханье, гусиная кожа, потливость, анорексия, тошнота, рвота, нервозность, усталость, раздражительность, дрожание, расширение зрачков, общая слабость), толерантность.

Передозировка:

Симптомы: головокружение, сонливость, нервозность, общая слабость, угнетение деятельности сердечно-сосудистой системы, снижение АД, брадикардия, липкий пот, миоз, ригидность мышц, угнетение дыхательного центра, брадипноэ, апноэ.

Лечение: введение специфического антагониста - налоксона; симптоматическая терапия (в т. ч., введение миорелаксантов, ИВЛ, при брадикардии - введение атропина, при выраженном снижении АД - восполнение объема циркулирующей крови).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Безопасность Луналдина в период беременности не установлена. Длительное лечение в период беременности может вызвать симптомы «отмены» у новорожденного. Луналдин не следует применять во время родов (включая кесарево сечение), поскольку он проникает через плаценту и может вызвать угнетение дыхания у плода или новорожденного.В период беременности Луналдин применять можно только в том случае, если потенциальная польза для матери превышает возможный риск для плода.

Луналдин поступает в грудное молоко и может оказывать седативное воздействие и угнетать дыхание у детей на грудном вскармливании. Луналдин может использоваться у кормящих женщин только в том случае, если польза от приема препарата существенно превышает потенциальный риск для матери и ребенка. На время приема препарата грудное вскармливание рекомендуется прекратить.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Динитрогена оксид усиливает мышечную ригидность; трициклические антидепрессанты, опиаты, седативные и снотворные лекарственные средства (ЛС), фенотиазины, анксиолитические ЛС (транквилизаторы), ЛС для общей анестезии, периферические миорелаксанты, антигистаминные ЛС, обладающие седативным эффектом, этанол и другие депримирующие ЛС повышают вероятность побочных эффектов (угнетения ЦНС, гиповентиляции, артериальной гипотензии, брадикардии, подавления дыхательного центра и других).

Усиливает эффект гипотензивных ЛС. Бета-адреноблокаторы могут снизить частоту и тяжесть гипертензивной реакции в кардиохирургии (в том числе при стернотомии), но увеличивают риск брадикардии.

Бупренорфин, налбуфин, пентазоцин, налоксон, налтрексон снижают анальгезирующий эффект фентанила и устраняют угнетающее его влияние на дыхательный центр.

Бензодиазепины удлиняют выход из нейролептанальгезии.

Необходимо уменьшить дозу фентанила при одновременном применении с инсулином, глюкокортикостероидами, гипотензивными ЛС. Ингибиторы МАО повышают риск тяжелых осложнений.

Миорелаксанты предотвращают или устраняют мышечную ригидность; миорелаксанты с м-холиноблокирующей активностью (в том числе панкурония бромид) снижают риск брадикардии и гипотензии (особенно на фоне применения бета-адреноблокаторов и других вазодилататоров) и могут увеличивать риск тахикардии и артериальной гипертензии; миорелаксанты, не обладающие м-холиноблокирующей активностью (в том числе суксаметоний) не снижают риск брадикардии и артериальной гипотензии (особенно на фоне отягощенного кардиологического анамнеза) и увеличивают риск тяжелых побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы.

Особые указания и меры предосторожности:

Из-за возможных серьезных побочных эффектов которые могут возникнуть при лечении такими опиодами как Луналдин, пациенты и лица осуществляющие за ними уход, должны полностью осозновать важность правильного приема Луналдина, а также знать, какие действия следует предпринять при появлении симптомов передозировки.

Перед началом лечения Луналдином, важно стабилизировать прием опиоидных препаратов пролонгированного действия, используемых для купирования постоянных болей.

При неоднократном применении опиоидных препаратов, таких как Луналдин, может развиться толерантность и физическая и/или психологическая зависимость. Случаи ятрогенной зависимости после терапевтического применения опиоидов крайне редки. Данные исследований фентанила свидетельствуют о снижении его клиренса, увеличении периода полувыведения и большей чувствительности к фентанилу у пожилых пациентов по сравнению с молодыми людьми. Следует непрерывно наблюдать за проявлениями признаков токсичности фентанила у пожилых, истощенных или ослабленных пациентов и, в случае необходимости, понижать дозу.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Луналдин может неблагоприятно влиять на способность выполнять потенциально опасные операции, такие как управление транспортным средством или использование механизмов.

Пациентам следует рекомендовать воздержаться от вождения автомобиля и управления механизмами, так как возможно возникновение головокружения, сонливости или появление нарушения зрения на фоне приема препарата Луналдин.

При нарушениях функции почек

Луналдин следует применять с осторожностью у пациентов с нарушением функции почек, особенно на стадии титрования дозы. Применение Луналдина у пациентов с почечной недостаточностью может увеличить биодоступность фентанила и уменьшить его системный клиренс, что может привести к его накоплению и усилению/увеличению продолжительности действия.

При нарушениях функции печени

Луналдин следует применять с осторожностью у пациентов с нарушением функции печени, особенно на стадии титрования дозы. Применение Луналдина у пациентов с печеночной недостаточностью может увеличить биодоступность фентанила и уменьшить его системный клиренс, что может привести к его накоплению и усилению/увеличению продолжительности действия.

Применение в пожилом возрасте

Титрование дозы следует проводить с особой осторожностью.

Данные исследований фентанила свидетельствуют о снижении его клиренса, увеличении периода полувыведения и большей чувствительности к фентанилу у пожилых пациентов по сравнению с молодыми людьми. Следует непрерывно наблюдать за проявлениями признаков токсичности фентанила у пожилых пациентов и, в случае необходимости, понижать дозу.

Применение в детском возрасте

Противопоказан детям до 18 лет.

Условия хранения:

При температуре не выше 25°С. Список II. В соответствии с Федеральным законом Российской Федерации «О наркотических средствах и психотропных веществах». Хранить в недоступном для детей месте!

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Lunaldin