

## [Налоксон](#)



### Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- [Налоксон](#)

### Полезные ссылки:

[Цена в Яндексe](#) [Горздрав](#) [Столички](#) [Апрель](#)  
[Госреестр](#)<sup>МНН</sup> [Википедия](#)<sup>МНН</sup>  
[РЛС VIDAL](#) [Mail.Ru](#) [Drugs.com](#)<sup>англ</sup>

### Форма выпуска:

**Раствор для инъекций** бесцветный, прозрачный.

	<b>1 мл</b>
наллоксона гидрохлорид (в форме налоксона гидрохлорида дигидрата)	400 мкг

*Вспомогательные вещества:* натрия хлорид - 8.55 мг, хлористоводородная кислота (до pH 3-5), вода д/и (до 1 мл).

1 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - поддоны из ПВХ (2) - пачки картонные.

### Фармакологические свойства:

#### **Фармакодинамика**

Налоксон является специфическим антагонистом опиоидных рецепторов. Конкурендно связывается с основными типами опиоидных рецепторов и предупреждает или устраняет центральное (в т.ч. угнетение дыхания) и периферическое действие как эндогенных опиоидных пептидов, так и экзогенных опиоидов (опиоидных анальгетиков и их суррогатов).

Влияет также на допаминергическую и GABA-ергическую системы головного мозга. Восстанавливает дыхание, уменьшает седативное действие и эйфорию, ослабляет гипотензивный эффект.

На психотомиметические эффекты и дистрофию, вызванные опиоидными анальгетиками группы агонистов-антагонистов (пентазоцин, бутофанол), Налоксон выраженного действия не оказывает. Малоэффективен как антагонист трамадола. Полностью не устраняет эффекты бупренорфина.

Налоксон провоцирует синдром отмены у больных с лекарственной зависимостью к опиоидам. Не вызывает привыкания и лекарственной зависимости.

При в/в введении эффект развивается в течение первых 2 минут, при в/м и п/к введении - через 2-5 мин и достигает максимума через 5-15 минут. Продолжительность действия составляет от 20-45 минут после в/в введения и 2.5-3 ч после в/м и п/к введения.

#### **Фармакокинетика**

*Распределение и метаболизм*

Проникает через ГЭБ и плацентарный барьер.

Налоксон подвергается метаболизму в печени с образованием преимущественно глюкуронидов.

#### *Выведение*

$T_{1/2}$  - около 1 ч (30-80 мин). У взрослых  $T_{1/2}$  - около  $64 \pm 12$  мин; у новорожденных (после инъекции в пупочную вену) - около  $3.1 \pm 0.5$  ч; у недоношенных детей - около  $51.8 \pm 9.2$  мин.

Выводится через почки. В течение 72 ч выводится 70% введенной дозы.

## **Показания к применению:**

— острое отравление (передозировка) опиоидными анальгетиками (морфин, тримперидин, фентанил) и другими препаратами, в механизме токсического действия которых имеется опиоидный компонент (опиодные суррогаты, метадон, пентазоцин, бупренорфин, буторфанол, налбуфин и другие) в сочетании с другими реанимационными мероприятиями;

— послеоперационное применение: ускорение выхода из общей анестезии, перед окончанием управляемого дыхания (препарат применяется лишь в случае, если в ходе операции использовались наркотические анальгетики);

— для восстановления дыхания у новорожденных после введения роженице опиоидных анальгетиков;

— в качестве диагностического средства у пациентов с подозрением на опиоидную зависимость (налксоновая проба).

## **Относится к болезням:**

- [Анестезия](#)

## **Противопоказания:**

— повышенная чувствительность к налоксону.

## **Способ применения и дозы:**

Скорость введения Налоксона следует подбирать индивидуально, в зависимости от реакции пациента на применение налоксона и введенные ранее разовые дозы.

Налоксон применяют в/в, в/м или п/к.

В случае инфузионного применения раствор Налоксона разбавляют в 0.9% растворе натрия хлорида или в 5% растворе декстрозы следующим образом: 2 мг (5 мл раствора, содержащего 400 мкг/мл налоксона) добавляют к 500 мл инфузионной среды.

Полученный после разбавления раствор содержит 4 мкг налоксона в 1 мл. Раствор готовят непосредственно перед применением.

Доза Налоксона и способ применения зависят от состояния пациента, вида и количества принятого им опиоида.

*Острое отравление (передозировка) опиоидными анальгетиками*

### **Взрослые**

Первоначальная разовая доза составляет 400-2000 мкг, которую вводят в/в медленно (в течение 2-3 мин). При необходимости дозу можно повторно ввести через 2-3 мин, вплоть до восстановления сознания и равномерного дыхания. Если после введения суммарной дозы 10 мг не произошло восстановления сознания и дыхания, следует предполагать другую (неопиоидную) причину отравления.

Налоксон возможно также применять в/м или п/к. При угрожающих состояниях жизни предпочтителен в/в путь введения.

### **Дети**

Первоначальная разовая доза составляет 10 мкг/кг, которую вводят в/в медленно (в течение 2-3 мин). В случае

необходимости через 2-3 мин можно ввести дополнительную дозу 100 мкг/кг.

Если невозможно применить налоксон в/в, его вводят в/м или п/к дробными дозами с интервалом 2-3 мин. При в/м введении эффект препарата проявляется медленнее. Однократно можно вводить дозу около 200 мкг (т.е. около 60 мкг/кг), получая более продолжительное действие.

*Послеоперационное применение: для ускорения выхода из общей анестезии (если в ходе операции использовались наркотические анальгетики)*

### **Взрослые**

В/в вводят препарат в дозе 100-200 мкг (1.5-3 мкг/кг) через каждые 2-3 мин до появления адекватной легочной вентиляции и пробуждения больного, но без отчетливых болевых ощущений и дискомфорта. Доза, превышающая минимально необходимую, может вызвать прекращение анальгезии и повышение АД, а также другие симптомы: тошноту, рвоту, повышение потоотделения, дисциркуляторный криз. В некоторых случаях, особенно после приема опиоидных анальгетиков с продолжительным временем действия, необходимо в/м введение дополнительной дозы налоксона в течение 1-2 ч. Препарат также вводят с помощью в/в инфузии.

### **Дети**

В/в вводят препарат в дозе 10 мкг/кг. При необходимости можно ввести дополнительную дозу 100 мкг/кг.

Если невозможно применить налоксон в/в, его вводят в/м или п/к дробными дозами с интервалом 2-3 мин. При в/м введении эффект препарата проявляется медленнее. Однократно можно вводить дозу около 200 мкг (т.е. около 60 мкг/кг), получая более продолжительное действие. Препарат также вводят с помощью в/в инфузии.

*Восстановление дыхания у новорожденных после введения роженице опиоидных анальгетиков*

### **Новорожденные**

Перед введением препарата необходимо удостовериться в проходимости дыхательных путей новорожденного.

Препарат вводят в/в, в/м или п/к в дозе 10 мкг/кг. При необходимости дозу можно повторить через 2-3 мин.

После рождения ребенка ему можно однократно в целях профилактики ввести в/м 200 мкг (т.е. около 60 мкг/кг) налоксона.

*В качестве диагностического средства у больных с подозрением на наркотическую (опиоидную) зависимость*

В/в введение дозы 0.5 мкг/кг позволяет решить, не вызвано ли угнетение дыхания или затруднение мочеиспускания опиоидами. Затем дозу налоксона можно повысить, избегая слишком больших доз. Большие дозы снимают всякое действие опиоида, в т.ч. и обезболивающее, а также приводят к возбуждению систем симпатической системы и системы кровообращения.

## **Побочное действие:**

*При использовании препарата в послеоперационный период:* снижение или повышение АД, желудочковая тахикардия и фибрилляция желудочков, удушье, отек легких, остановка сердца. Указанные эффекты иногда приводят к летальному исходу, коме и энцефалопатии. При использовании доз препарата, превышающих минимально необходимые, возможно исчезновение анальгезии и психомоторное возбуждение.

В случае внезапной отмены опиоидов могут появиться тошнота, рвота, потливость, тахикардия, повышение АД, дрожь, судороги, желудочковая тахикардия и фибрилляция желудочков, отек легких и остановка сердечной деятельности, что может привести к летальному исходу.

*Синдром отмены у пациентов с опиоидной зависимостью:* тошнота, рвота, диарея, слабость, тахикардия, повышение АД, лихорадка, ринит (насморк), чиханье, "гусиная кожа" (пилоэрекция), потливость, зевота, нервозность, беспокойство, раздражительность, дрожь, спазмы в эпигастральной области, боли неясной локализации; у новорожденных - судороги, безудержный плач, гиперрефлексия.

## **Передозировка:**

Случаев острой передозировки при приеме Налоксона не отмечено.

Однако при введении препарата в высоких дозах (4 мг/кг и выше) может наблюдаться тошнота, рвота, озноб, гипервентиляция, судороги, выраженное повышение или снижение АД и/или брадикардия.

При появлении данных симптомов рекомендуется консервативное лечение (в условиях интенсивной терапии).

## Налоксон

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

Дозы 2 мг/кг могут вызывать когнитивные нарушения и поведенческие симптомы, в т.ч. раздражительность, беспокойство, напряжение, подозрительность, подавленность, трудности с концентрацией внимания и отсутствие аппетита. Поведенческие симптомы могут продолжаться 2-3 дня.

Также могут наблюдаться соматические симптомы, такие как головокружение, потливость, тошнота и боли в желудке, ощущение тяжести.

Лечение симптоматическое.

## Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности и в период грудного вскармливания ребенка препарат следует применять только в случаях острой необходимости.

## Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Препарат уменьшает гипотензивное действие клонидина.

Снижает эффект опиоидных анальгетиков (в т.ч. буторфанола, налбуфина, пентазоцина, фентанила, ремифентанила) и ускоряет появление синдрома отмены.

Метогекситал (производное барбитуровой кислоты короткого действия) блокирует острое начало абстиненции, вызванной Налоксоном у лиц с наркотической зависимостью.

Налоксон не следует применять в/в вместе с другими препаратами.

Несовместим с растворами лекарственных средств, содержащих бисульфиты.

Фармацевтически совместим с раствором натрия хлорида 0.9%, раствором декстрозы 5%, стерильной водой для инъекций.

## Особые указания и меры предосторожности:

При применении Налоксона следует обеспечить возможность кислородной терапии и реанимационных мероприятий, а также доступ к оборудованию, позволяющему проводить сердечно-легочную реанимацию.

Следует соблюдать осторожность при применении Налоксона у пациентов с заболеваниями сердца, легких, нарушениями функции печени и/или почек, при беременности, лактации, в детском возрасте, у лиц с установленной или подозреваемой физической зависимостью от опиоидов, а также у новорожденных, матери которых указали в анамнезе зависимость от опиоидов (внезапная и полная отмена наркотического действия может вызвать острый синдром отмены).

Осторожно применять Налоксон при лечении угнетения дыхания, вызванного применением бупренорфина, т.к. ответ на применение препарата может быть неполным. В таком случае следует применить ИВЛ. Т.к. продолжительность действия Налоксона короче продолжительности действия опиоидов, имеется риск снижения дыхательной активности.

Внезапная отмена действия опиоидов после хирургического вмешательства может вызвать тошноту, рвоту, потливость, дрожь, тахикардию и другие симптомы.

*Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами*

При применении препарата запрещается управлять транспортными средствами и другими движущимися механическими устройствами.

### **При нарушениях функции почек**

Следует соблюдать осторожность при применении Налоксона у пациентов с нарушениями функции почек.

### **При нарушениях функции печени**

Следует соблюдать осторожность при применении Налоксона у пациентов с нарушениями функции печени.

### **Применение в детском возрасте**

Возможно применение по показаниям и в дозах, учитывающих возраст ребенка.

## **Налоксон**

Фармакологическая база данных (<http://drugs.thead.ru>)

---

Следует соблюдать осторожность при применении Налоксона в детском возрасте, а также у новорожденных, матери которых указали в анамнезе зависимость от опиоидов (внезапная и полная отмена наркотического действия может вызвать острый синдром отмены).

### **Условия хранения:**

Препарат следует хранить в защищенном от света, недоступном для детей месте при температуре не выше 25°C.

### **Срок годности:**

4 года.

### **Условия отпуска в аптеке:**

По рецепту.

**Источник:** <http://drugs.thead.ru/Nalokson>