Стадол



Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Раствор для инъекций	**1 мл**
буторфанола тартрат	2 мг

1 мл - ампулы (5) - упаковки контурные пластиковые (1) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Буторфанол действует как агонист каппа-опиоидных рецепторов и как смешанный агонист-антагонист мю-опиоидных рецепторов, изменяя на уровне ЦНС восприятия болевых ощущений.

Буторфанола тартрат обладает активностью антагониста опиоидов, которая приблизительно эквивалентна активности налорфина, в 30 раз превышает активность пентазоцина и составляет 1/40 активности налоксона. Клинические исследования продемонстрировали, что по степени подавления дыхания в/в введение 2 мг буторфанола сравнимо с 10 мг морфина; при введении 4 мг буторфанола заметного уровня этого эффекта не отмечается, однако продолжительность эффекта зависит от введенной дозы.

Подавление функции дыхания, вызываемое буторфанолом, снимается налоксоном.

В/в введение буторфанола тартрата и пентазоцина вызывают сходные изменения гемодинамики: повышение давления в легочной артерии, легочного давления заклинивания, конечного диастолического давления в левом желудочке, системного артериального давления и легочного сосудистого сопротивления. Буторфанол, как и другие смешанные агонисты-антагонисты с высоким сродством к каппа-рецепторам, может вызывать в ряде случаев неприятные психомиметические эффекты.

Время наступления обезболивающего эффекта буторфанола зависит от способа его введения: в пределах нескольких минут после в/в введения и в течение 10-15 мин после в/м инъекции. Максимальное анальгетическое действие наступает в пределах 1-2 ч.

Продолжительность обезболивания зависит от характера боли и от пути введения препарата, однако обычно составляет 3-4 ч при в/м и при в/в способах введения.

Фармакокинетика

Буторфанол быстро всасывается после в/м инъекции. После введения 1 мг C_{max} буторфанола в плазме крови достигаются через 20-40 мин.

Средние фармакокинетические показатели препарата Стадол 2 мг/мл в различных возрастных группах

Показатель	Молодые (20-40 лет)	Пожилые (старше 65 лет)
AUC (∞) [б)] (ч×нг/мл)	7.24(1,57)[в)] (4.40-9.77)[г)]	8.71 (2.02) (4.76-13.03)
Время полувыведения (ч)	4.56(1,67) (2.06-8.70)	5.61 (1.36) (3.25-8.79)
Объем распределения[а)] (л)	487(155) (305-901)	552(124) (305-737)
Общий клиренс (л/ч)	99 (23) (70-154)	82(21) (52-143)
а) Молодые (n=24) в возрасте от 20 до 40 лет и пожилые (n=24) старше 65 лет. б) Площадь под кривой зависимости концентрации в плазме от времени после введения дозы 1 мг. в) Среднее (1С.О.) г) (Интервал наблюдавшихся значений) д) Получено из данных по внутривенному введению		

Связывание буторфанола с белками сыворотки не зависит от его концентрации в дозовом интервале, используемом в клинической практике (до 7 мг/мл) и составляет приблизительно 80%. Препарат проходит через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры и обнаруживается в женском молоке.

Буторфанол подвергается глубокому метаболизму в печени и выделяется из организма в форме окисленных и связанных метаболитов. Менее 5% введенного в/в препарата выделяется с мочой в виде неизмененного исходного вещества.

Буторфанол выделяется из организма с мочой и калом. Основным метаболитом буторфанола, присутствующим в моче, является гидроксибуторфанол (49% введенной дозы). С мочой также выделяются небольшие количества нор-буторфанола (менее 5%).

Показания к применению:

— умеренные и сильные боли, включая боли послеоперационного периода, при мигрени и при зубной хирургии;

— для премедикации перед хирургической операцией или наркозом в качестве дополнения к сбалансированной анестезии, а также для обезболивания родов.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Мигрень

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к буторфанолу или любому другому компоненту препарата.

Способ применения и дозы:

Действие препарата Стадол, как и действие других сильнодействующих анальгетиков, наступает быстро, поэтому подбор дозы препарата должен проводиться индивидуально в зависимости от клинического ответа.

При обезболивании

При в/м введении обычная рекомендуемая доза составляет 2 мг однократно в том случае, если при появлении сонливости или головокружения больной имеет возможность находиться в положении лежа. При необходимости такую дозу препарата можно повторять с интервалом 3 или 4 ч. В зависимости от тяжести болей лечение эффективно в интервале доз от 1 до 4 мг каждые 3-4 ч.

При в/в введении обычная рекомендуемая доза составляет 1 мг однократно с интервалом 3 или 4 ч по необходимости. В зависимости от тяжести болевого синдрома лечение эффективно в интервале доз от 0.5 до 2 мг каждые 3-4 ч.

При анестезии

Введение перед операцией/наркозом. Доза препарата должна подбираться индивидуально. Обычная доза составляет 2 мг в/м за 60-90 мин доначала проведения хирургической операции.

При проведении сбалансированной анестезии обычная доза препарата составляет 2 мг в/в незадолго до начала

наркоза и/или по 0.5 мг в/в по ходу операции. При таком дробном введении общая доза может быть увеличена до 0.06 мг/кг (4 мг/70 кг) в зависимости от ранее введенных седативных, анальгетических или снотворных препаратов.

Общая доза препарата Стадол может варьировать, однако больным лишь в редких случаях требуется введение менее 4 мг или более 12.5 мг препарата (обычно от 0.6 до 0.8 мг/кг).

Роды

Беременным женщинам с нормальным сроком вынашивания плода в начале родовой деятельности можно ввести 1-2 мг препарата в/в или в/в и повторно ту же дозу через 4 ч. При родах или если роды ожидаются в пределах 4 ч, следует применять другие средства обезболивания. Препарат следует применять с осторожностью при преждевременных родах.

Больным с **нарушенной функцией печени или почек (КК менее 30 мл/мин)** может потребоваться корректировка дозы.

Исходная доза препарата **престарелым больным** составляет половину обычной дозы.

Побочное действие:

Практически во всех случаях характер и частота побочных эффектов, наблюдавшихся после введения препарата различными способами, соответствуют тем, которые обычно наблюдаются при применении опиоидных аналгетиков. Причем о каких-либо эффектах неожиданной или необычной токсичности не сообщалось.

Во всех клинических исследованиях по изучению применения препарата Стадол раствора для инъекций или Стадол назальный спрей наиболее частыми побочными эффектами были сонливость (40%), тошнота и/или рвота (7.9%), потливость/влажность (6%).

Частые побочные эффекты (у 1-10% больных)

Ниже перечислены симптомы, которые наблюдались у 1-10% больных, и считались связанными или возможно связанными с применением препарата Стадол при в/в или в/м способе введения.

Общее состояние: астения/сонливость, головные боли, ощущение жара.

Желудочно-кишечный тракт: сухость во рту.

Нервная система: спутанность сознания, ощущение легкости/ эйфория, головокружение.

Сердечно-сосудистая система: повышение/понижение АД.

Редкие побочные эффекты (менее 1% больных)

Ниже перечислены симптомы, отмечавшиеся менее чем у 1% больных во время клинических исследований или в результате применения препарата, и считались связанными или возможно связанными с применением препарата Стадол.

Сердечно-сосудистая система: тахикардия, сильное сердцебиение.

Нервная система: сновидения, волнение, депрессия, тревога, ощущение спокойствия, дизартрия, дисфория, галлюцинации, парез, ощущение холода, эйфория, нервозность.

Зрение: диплопия.

Кожа и кожные структуры: сыпь/крапивница.

Костно-мышечная система: миалгия.

Дыхательная система: замедленное дыхание, обструкция дыхательных путей, поверхностное дыхание.

Злоупотребление препаратом и зависимость

Хотя анальгетики, относящиеся к классу смешанных агонистов/антагонистов опиоидов, обладают гораздо меньшим потенциалом в плане развития привыкания по сравнению с морфином, сообщалось о случаях злоупотребления всеми этими препаратами. Следует соблюдать особую осторожность при назначении препарата Стадол эмоционально неустойчивыми больными, а также больным, в истории болезни которых отмечено злоупотребление лекарственными препаратами.

Передозировка:

Клинические проявления при передозировках препарата такие же, как и при передозировках опиоидных препаратов. Наиболее серьезными из них являются гиповентиляция легких, а также сердечно-сосудистая недостаточность и/или кома.

При передозировке препаратом наблюдаются симптомы угнетения дыхания, сердечно-сосудистой недостаточности (особенно у предрасположенных больных), подавления ЦНС.

Случаи фатальной передозировки, связанные с применением препарата, отмечались крайне редко. Причем влияния буторфанола тартрата на исход передозировки, применявшегося обычно в сочетании с другими лекарственными средствами, установлено не было.

Специфическими мерами лечения при подозрении на передозировку препарата Стадол являются немедленное создание достаточной вентиляции дыхательных путей, после чего (при необходимости) назначается антагонист опиоидов, например налоксон (внутривенно).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Хорошо контролированных исследований препарата у женщин со сроком беременности до 37 недель не проводилось.

После в/в или в/в введения препарат в малых концентрациях обнаруживается в женском молоке. Однако клиническое значение этого факта не было всесторонне проанализировано.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение препарата Стадол и препаратов, обладающих подавляющим действием на ЦНС (в т.ч. барбитураты, транквилизаторы и антигистаминные препараты), а также алкоголя, может приводить к усилению этого эффекта.

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении препарата и ингибиторов МАО.

Применение при сбалансированной анестезии

Совокупное действие в подавлении функции дыхания всех препаратов, применяемых при общей анестезии и вводимых в/в, может приводить к снижению вентиляции легких или одышке. Поэтому при сбалансированной анестезии Стадол должен применяться только в особых случаях и в качестве дополнительного препарата, а также при поддержке функции дыхания больного.

Введение перед операцией или перед наркозом

Следует соблюдать осторожность при введении препарата Стадол у больных гипертензией.

Особые указания и меры предосторожности:

Зависимость от наркотических препаратов

Стадол не рекомендуется применять у больных с зависимостью от наркотиков. Являясь антагонистом опиоидов препарат может вызывать синдром отмены опиоидов. Перед началом применения препарата Стадол такие больные должны пройти специальный курс лечения.

Следует соблюдать осторожность при применении препарата Стадол у больных, которые в недавнем прошлом неоднократно принимали наркотические анальгетики, поскольку оценить устойчивость больных к действию опиоидов достаточно трудно.

Злоупотребление препаратом и зависимость

Известны отдельные случаи злоупотребления и привыкания к буторфанола тартрату и относится к лечению хронических болезненных состояний у амбулаторных больных. Большинство случаев возникновения зависимости связано с применением препарата в виде назального спрея, а не инъекционного раствора. В целом, больные, находящиеся на лечении опиоидами в течение длительного срока, подвергаются большому риску попасть в зависимость от препарата Стадол.

Алкоголь

Во время лечения препаратом Стадол употреблять алкоголь не следует. Одновременное применение препарата Стадол с алкоголем и препаратами, обладающими подавляющим действием на ЦНС (в т.ч., барбитураты, транквилизаторы и антигистаминные препараты) может усиливать этот эффект.

Черепно-мозговые травмы и внутричерепное давление

Как и другие опиоиды, Стадол у больных с черепно-мозговой травмой может повышать уровень двуокиси углерода в организме, повышать давление спинномозговой жидкости, сужать зрачок и вызывать психические нарушения и таким образом маскировать динамику клинической картины черепно-мозговой травмы.

Подавление функции дыхания

Препараты класса смешанных агонистов/антагонистов опиоидных рецепторов могут подавлять функцию дыхания особенно у больных, которые применяют препараты, влияющие на ЦНС, или страдают заболеваниями ЦНС, или нарушениями функции дыхания.

Заболевания печени и почек

Стадол следует применять с осторожностью у больных с заболеваниями печени, хотя лабораторные исследования не выявили каких-либо отклонений в анализах при применении препарата. При нарушениях функции почек и печени необходимо внести изменения в схему приема препарата.

Полупериод выведения препарата из организма увеличен у больных со значениями КК менее 30 мл/мин (10.5 ч по сравнению с 5.8 ч у здоровых людей). Тяжелые нарушения функции печени могут способствовать развитию более серьезных побочных эффектов и повышению клинической активности препарата.

Влияние на сердечно-сосудистую систему

Стадол повышает уровень сердечной деятельности, особенно в легочном круге кровообращения, поэтому при остром инфаркте миокарда, при нарушенной функции желудочка или при коронарной недостаточности препарат следует назначать больным только в случаях, когда ожидаемые положительные результаты значительно преобладают над возможным риском.

После введения препарата тяжелая гипертония отмечалась лишь в редких случаях. При развитии гипертензии применение препарата следует прекратить и провести лечение антигипертензивными препаратами. Сообщалось также об эффективности применения налоксона у больных при отсутствии у них зависимости от опиоидов.

Роды и родоразрешение

Сообщалось о случаях развития дистресс-респираторного синдрома/асфиксии у новорожденных, связанных с введением препарата менее чем за 2 ч до родов, а также с многократным введением в сочетании с другими анальгетиками или седативными препаратами или при преждевременных родах.

Гериатрические больные

Помимо несколько сниженного выведения препарата из организма, пожилые больные могут быть более чувствительными к его побочным эффектам, в частности к появлению головокружения.

Применение у детей/подростков

Стадол не рекомендуется применять у больных в возрасте до 18 лет.

Способность управлять транспортными средствами, машинами и механизмами

Сонливость и головокружение, связанные с применением препарата Стадол, могут нарушать способность управлять транспортными средствами, машинами и механизмами.

При нарушениях функции почек

Полупериод выведения препарата из организма увеличен у больных со значениями КК менее 30 мл/мин (10.5 ч по сравнению с 5.8 ч уздоровых людей).

При нарушениях функции печени

Стадол следует применять с осторожностью у больных с заболеваниями печени, хотя лабораторные исследования не выявили каких-либо отклонений в анализах при применении препарата. При нарушениях функции почек и печени необходимо внести изменения в схему приема препарата.

Применение в пожилом возрасте

Помимо несколько сниженного выведения препарата из организма, пожилые больные могут быть более чувствительными к его побочным эффектам, в частности к появлению головокружения.

Применение в детском возрасте

Стадол не рекомендуется применять у больных в возрасте до 18 лет.

Условия хранения:

Препарат следует хранить при комнатной температуре, в недоступном для детей месте. Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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