Тиопентал натрия



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Тиопентал натрия

Полезные ссылки:

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

Форма выпуска:

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в введения в виде порошка белого или почти белого, или от желтовато-белого до бледно-зеленовато-желтого цвета, гигроскопичный.

	1 фл.
тиопентал натрий	1 г

Флаконы объемом 20 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (5) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (10) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (50) - пачки картонные.

Лиофилизат для приготовления раствора для в/в введения в виде порошка белого или почти белого, или от желтовато-белого до бледно-зеленовато-желтого цвета, гигроскопичный.

	1 фл.
тиопентал натрий	500 мг

Флаконы объемом 10 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (5) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (10) - пачки картонные.
Флаконы объемом 10 мл (50) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (1) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (5) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (10) - пачки картонные.
Флаконы объемом 20 мл (50) - пачки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Относится к списку сильнодействующих веществ (список №1).

Средство для неингаляционной общей анестезии ультракороткого действия, производное тиобарбитуровой кислоты. Обладает выраженной снотворной, и слабыми миорелаксирующей и анальгезирующей активностью. Замедляет время открытия ГАМК-зависимых каналов на постсинаптической мембране нейронов головного мозга, удлиняет время входа ионов хлора внутрь нервной клетки и вызывает гиперполяризацию мембраны. Подавляет возбуждающее действие аминокислот (аспартата и глутамата). В больших дозах, непосредственно активируя ГАМК-рецепторы, оказывает ГАМК-стимулирующее действие. Обладает противосудорожной активностью, повышая порог возбудимости

нейронов и блокируя проведение и распространение судорожного импульса в головном мозге. Способствует миорелаксации, подавляя полисинаптические рефлексы и замедляя проведение по вставочным нейронам спинного мозга. Снижает интенсивность метаболических процессов в головном мозге. Оказывает снотворное действие, которое проявляется ускорением процесса засыпания и изменением структуры сна. Угнетает (дозозависимо) дыхательный центр и уменьшает его чувствительность к углекислому газу. Оказывает (дозозависимо) кардиодепрессивное действие: уменьшает ударный и минутный объемы крови, артериальное давление. Увеличивает емкость венозного русла, снижает печеночный кровоток и скорость клубочковой фильтрации. Оказывает возбуждающее влияние на n.vagus и может вызывать ларингоспазм, обильную секрецию слизи. После внутривенного введения общая анестезия развивается через 30-40 сек; после ректального - через 8-10 мин, характеризуется кратковременностью (после введения однократной дозы общая анестезия продолжается 10-30 мин) и пробуждением с некоторой сонливостью и ретроградной амнезией. При выходе из общей анестезии анальгезирующее действие прекращается одновременно с пробуждением больного.

Фармакокинетика

При внутривенном введении быстро проникает в головной мозг, скелетные мышцы, почки, печень и жировую ткань. Время наступления C_{max} - в течение 30 сек (мозг), 15-30 мин (мышцы). В жировых депо концентрация препарата в 6-12 раз выше, чем в плазме крови. V_d-1.7-2.5 л/кг, во время беременности - 4.1 л/кг, у пациентов с ожирением - 7.9 л/кг. Связь с белками плазмы - 76-86 %. Проникает через плацентарный барьер и выделяется с грудным молоком.

Метаболизируется в основном в печени, с образованием неактивных метаболитов, 3-5 % от дозы десульфируется до пентобарбитала, незначительная часть инактивируется в почках и головном мозге.

$T_{1/2}$ в фазе распределения - 5-9 мин, в фазе элиминации - 3-8 ч (возможно удлинение до 10-12 ч; во время беременности - до 26.1 ч, у пациентов с ожирением - до 27.5 ч), у детей - 6.1 ч. Клиренс - 1.6-4.3 мл/кг/мин, во время беременности - 286 мл/мин. Выводится преимущественно почками путем клубочковой фильтрации. При повторном введении кумулируется (связано с накоплением в жировой ткани).

Показания к применению:

— общая анестезия при кратковременных хирургических вмешательствах, вводная и базисная общая анестезия (с последующим использованием анальгетиков и миорелаксантов);

— большие эпилептические припадки (grand mal), эпилептический статус;

— профилактика гипоксии мозга (при искусственном кровообращении, нейрохирургических операциях).

Относится к болезням:

- Анестезия

Противопоказания:

— гиперчувствительность;

— порфирия, включая острую перемежающуюся (в т.ч. в анамнезе у больного или его ближайших родственников);

— интоксикация этанолом, наркотическими анальгетиками, снотворными и лекарственными средствами для общей анестезии;

— шок;

— астматический статус;

— злокачественная гипертония;

— период лактации.

С осторожностью: хронические обструктивные заболевания легких, бронхиальная астма, выраженные нарушения сократительной функции миокарда, выраженная сердечно-сосудистая недостаточность, артериальная гипотония, коллапс, гиповолемия, чрезмерная премедикация, печеночная и/или почечная недостаточность, болезнь Аддисона, микседема, сахарный диабет, анемия, миастения, миотония, мышечная дистрофия, кахексия, лихорадочный синдром, воспалительные заболевания носоглотки, ожирение, беременность, детский возраст.

Способ применения и дозы:

Внутривенно медленно (во избежание коллапса), у взрослых используют 2-2.5% растворы (реже 5% раствор - используется методика фракционного введения); детям и ослабленным больным пожилого возраста - 1% раствор.

Растворы готовят непосредственно перед употреблением на воде для инъекций.

Приготовленный раствор должен быть абсолютно прозрачным. При быстром введении растворов с концентрацией менее 2% возможно развитие гемолиза. Перед введением проводят премедикацию атропином или метацином.

Взрослым для *введения в общую анестезию*: пробная доза - 25-75 мг, с последующим наблюдением в течение 60 сек перед введением основной дозы. Вводная общая анестезия - 200-400 мг (по 50-100 мг с интервалом 30-40 сек до достижения желаемого эффекта или однократно из расчета 3-5 мг/кг). Для *поддержания анестезии* - 50-100 мг.

Для *купирования судорог* - 75-125 мг в/в в течение 10 мин; при развитии судорог при местной анестезии -125-250 мг в течение 10 мин.

При *гипоксии мозга* за 1 мин вводят 1.5-3.5 мг/кг до временной остановки кровообращения.

При **нарушениях функции почек** (КК менее 10 мл/мин) - 75% средней дозы.

Высшая разовая доза препарата для взрослых в/в - 1 г (50 мл 2% раствора).

Вводить раствор в/в следует медленно, со скоростью не более 1 мл/мин. Вначале обычно вводят 1-2 мл, а через 20-30 сек - остальное количество.

Детям - в/в струйно, медленно в течение 3-5 мин, однократно из расчета 3-5 мг/кг. Перед проведением ингаляционной анестезии без предшествующей премедикации у новорожденных - 3-4 мг/кг, 1-12 мес - 5-8 мг/кг, 1-12 лет - 5-6 мг/кг; для общей анестезии у детей с массой тела 30-50 кг - 4-5 мг/кг. Поддерживающая доза - 25-50 мг. У **детей со снижением функции почек (КК менее 10 мл/мин)** - 75% средней дозы. Применение препарата для базисной анестезии особенно показано у детей с повышенной нервной возбудимостью и у больных с тиреотоксикозом.

Побочное действие:

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД, аритмия, тахикардия, коллапс.

Со стороны дыхательной системы: кашель, чиханье, гиперсекреция бронхиальной слизи, ларингоспазм, бронхоспазм, гиповентиляция легких, диспноэ, угнетение дыхательного центра, апноэ.

Со стороны нервной системы : головная боль, мышечные подергивания, эпилептические припадки, повышение тонуса n.vagus, головокружение, заторможенность, атаксия, антероградная амнезия, сонливость в послеоперационном периоде, тревога, особенно при болях в послеоперационном периоде; редко - послеоперационный делириозный психоз.

Со стороны пищеварительной системы: гиперсаливация, тошнота, рвота, боль в животе в послеоперационном периоде.

Аллергические реакции: гиперемия кожи, сыпь, кожный зуд, крапивница, ринит, анафилактический шок, редко - гемолитическая анемия с нарушением функции почек (боли в пояснице, ногах и желудке, тошнота, рвота, потеря аппетита, необычная слабость, жар, бледность кожных покровов).

Прочие: икота.

Местные реакции: при в/в введении - болезненность в месте введения, - тромбофлебит (введение растворов с высокой концентрацией препарата), спазм сосуда и тромбоз в месте инъекции, раздражение тканей в месте инъекции (гиперемия и шелушение кожи), некроз; поражение нервов, подходящих к месту инъекции.

Передозировка:

Симптомы: угнетение ЦНС, судороги, мышечная гиперреактивность, угнетение дыхания вплоть до апноэ, ларингоспазм, водно-электролитные нарушения, выраженное снижение артериального давления, снижение общего периферического сосудистого сопротивления (токсическое действие при передозировке начинается с первых секунд), тахикардия; постнаркозный делирий. При очень высокой дозе: отек легких, циркуляторный коллапс, остановка сердца.

Лечение: антидот - бемегрид. При остановке дыхания - искусственная вентиляция легких, 100 % кислород; при ларингоспазме - миорелаксанты и 100% кислород под давлением; при коллапсе или выраженном снижении АД - плазмозамещающие растворы, введение вазопрессорных лекарственных средств и/или препаратов с положительным инотропным действием. При судорогах - в/в введение диазепама; при их неэффективности - ИВЛ и миорелаксанты.

Применение при беременности и кормлении грудью:

У беременных женщин применять препарат только в случае, если предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

Препарат противопоказан в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Совместное применение с этанолом и лекарственными средствами, угнетающими центральную нервную систему, приводит к взаимному усилению фармакологического действия (как к значительному угнетению центральной нервной системы, функции дыхания, усилению гипотензивного эффекта, так и степени анестезии); с магния сульфатом - усиление угнетающего действия на центральную нервную систему; с гангиоблокаторами, диуретиками и др. гипотензивными лекарственными средствами - усиление гипотензивного действия; метотрексатом - усиление токсического действия последнего.

Снижает действие непрямых антикоагулянтов (производных кумарина), гризеофульвина, контрацептивов, ГКС.

Усиливает эффект лекарственных средств, способствующих развитию гипотермии. Проявляет антагонизм с бемегридом.

Кетамин повышает риск снижения артериального давления и подавления дыхания, удлиняет время восстановления функций после выхода из общей анестезии.

Лекарственные средства, блокирующие канальцевую секрецию (пробенецид) и H_1-гистаминоблокаторы усиливают эффект; аминофиллин, аналептики, некоторые антидепрессанты - ослабляют.

Диазоксид повышает риск снижения артериального давления.

Фармацевтически несовместим с антибиотиками (амикацин, бензилпенициллин, цефапирин), анксиолитическими лекарственными средствами (транквилизаторами), миорелаксантами (суксаметоний, тубокурарин), наркотическими анальгетиками (кодеин, морфин), эфедрином, эпинефрином, аскорбиновой кислотой, дипиридамолом, хлорпромазином, кетамином, атропином, скополамином и тубокурарина хлоридом (не следует смешивать в одном шприце и вводить через одну иглу с кислыми растворами).

Особые указания и меры предосторожности:

Применять только в условиях специализированного отделения анестезиологами-реаниматологами, при наличии средств для поддержания сердечной деятельности и обеспечения проходимости дыхательных путей, искусственной вентиляции легких. Следует учитывать, что достижение и поддержание общей анестезии требуемой глубины и длительности зависит и от количества препарата, и от индивидуальной чувствительности к нему больного.

При воспалительных заболеваниях верхних дыхательных путей показано обеспечение проходимости верхних дыхательных путей, вплоть до интубации трахеи.

Непреднамеренное внутриартериальное введение вызывает мгновенный спазм сосуда, сопровождающийся нарушением кровообращения дистальнее места инъекции (возможен тромбоз основного сосуда с последующим развитием некроза, гангрены). Первый признак его у больных, находящихся в сознании: жалобы на ощущение жжения, распространяющееся по ходу артерии; у пациентов в состоянии общей анестезии первые симптомы - транзиторное побледнение, пятнистый цианоз или темная окраска кожи.

Лечение: прекратить введение; ввести внутриартериально в место поражения раствор гепарина с последующей антикоагулянтной терапией; раствор глюкокортикостероида с последующей системной терапией; провести симпатическую блокаду или блокаду плечевого нервного сплетения (внутриартериальное введение проката).

При химическом раздражении тканей (связано с высоким значением pH раствора (10-11) в случае попадания раствора под кожу, с целью быстрого рассасывания инфильтрата вводят местный анестетик и проводят согревание (активация местного кровообращения). Признак экстравазации - подкожное набухание.

В случае внутривенного струйного введения детям младше 18 лет необходим тщательный контроль состояния пациента с целью своевременного выявления симптомов угнетения дыхания, гемолиза, снижения артериального давления, экстравазаций.

Анестезирующий эффект ненадежен у лиц, злоупотребляющих алкоголем.

Следует уменьшить дозу у больных, принимающих дигоксин, диуретики; у больных, которые в премедикации получали морфин, а также после введения атропина, диазепама.

Премедикация - любым из общепринятых лекарственных средств, за исключением производных фенотиазина.

При продолжительной анестезии, когда снотворный эффект, вызванный тиопенталом натрия поддерживается внутривенным применением анестетиков длительного действия и/или ингаляционных анестетиков, в связи с опасностью кумулятивного эффекта доза тиопентала натрия не должна превышать 1 г.

Можно применять в сочетании с миорелаксантами при условии проведения искусственной вентиляции легких.

Тиопентал натрия не влияет на тонус беременной матки. После в/в введения максимальная концентрация в пупочном канатике отмечается через 2-3 мин. Максимально допустимая доза - 250 мг. При использовании в акушерско-гинекологической хирургии может вызывать угнетение ЦНС у новорожденных.

При нарушениях функции почек

При нарушений функции почек (клиренс креатинина менее 10 мл/мин) - 75% средней дозы.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: печеночная недостаточность.

Применение в детском возрасте

С осторожностью применять в детском возрасте.

Детям - в/в струйно, медленно в течение 3-5 мин, однократно из расчета 3-5 мг/кг. Перед проведением ингаляционной анестезии без предшествующей премедикации у новорожденных - 3-4 мг/кг, 1-12 мес - 5-8 мг/кг, 1-12 лет - 5-6 мг/кг; для общей анестезии у детей с массой тела 30-50 кг - 4-5 мг/кг. Поддерживающая доза - 25-50 мг. У детей со снижением функции почек (КК менее 10 мл/мин) - 75% средней дозы. Применение препарата для базисной анестезии особенно показано у детей с повышенной нервной возбудимостью

Условия хранения:

Список № 1 СДВ. В сухом, защищенном от света, недоступном для детей, месте, при температуре не выше 25°С.

Срок годности 2 г . Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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