

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО
ПРЕПАРАТА
ФЕНТАНИЛ

Регистрационный номер: P N000266/01

Торговое наименование: Фентанил

Международное непатентованное наименование: фентанил

Лекарственная форма: раствор для внутривенного и внутримышечного введения

Состав

1 мл раствора содержит:

Действующее вещество:

Фентанил – 0,05 мг

Вспомогательные вещества: лимонной кислоты моногидрат (или лимонная кислота в пересчете на лимонной кислоты моногидрат) – 0,034 мг, вода для инъекций – до 1 мл

Описание: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: анальгезирующее наркотическое средство.

Относится к Списку II «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации»

Код АТХ: N01AH01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Фентанил – опиоидный анальгетик короткого действия. Подобно морфину и тримеперидину, фентанил является агонистом, главным образом, μ -опиоидных рецепторов. Активирует эндогенную антиноцицептивную систему и таким образом нарушает межнейронную передачу болевых импульсов на различных уровнях центральной нервной системы (ЦНС), а также изменяет эмоциональную окраску боли.

По фармакологическим свойствам фентанил близок к морфину: повышает порог болевой чувствительности при болевых стимулах различной модальности, тормозит условные рефлексы, обладает угнетающим действием на ЦНС, подавляет активность дыхательного центра.

Отличается от морфина большей активностью (по анальгезирующему действию в 100 раз превосходит морфин), меньшей продолжительностью действия и более выраженной способностью угнетать дыхательный центр.

При парентеральном введении оказывает быстрое обезболивающее действие. При внутривенном введении максимальный эффект развивается через 1-3 минуты и сохраняется в течение 15-20 минут; при внутримышечном введении максимальный эффект развивается через 3-10 минут, продолжительность действия составляет 1-2 часа.

Фармакокинетика

Для достижения среднего уровня обезболивания концентрация фентанила должна достигать 15-20 нг/мл. Связь с белками плазмы – 79-87 %. Клиренс составляет 400-500 мл/мин, период полувыведения – 10-30 минут, объем распределения – 60-80 л. Быстро перераспределяется из крови и мозга в мышцы и жировую ткань. Метаболизируется в печени (N-дезалкилирование и гидроксילирование), почках, кишечнике и надпочечниках. Выводится почками (75 % – в виде метаболитов и 10 % – в неизменном виде) и с желчью (9 % – в виде метаболитов). Проникает через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ), плаценту и в грудное молоко.

Показания к применению

Болевой синдром сильной и средней интенсивности: послеоперационная боль, стенокардия, инфаркт миокарда, боль у онкологических пациентов.

Премедикация перед хирургическими операциями. Как дополнительное обезболивающее средство при операциях под местной анестезией. Послеоперационная анестезия. Нейролептанальгезия (в комбинации с дроперидолом).

Противопоказания

повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата;

нарушения сознания;

опухоли головного мозга;

брадиаритмия;

артериальная гипотензия;

печеночная и/или почечная недостаточность;

дыхательная недостаточность (пневмония, ателектаз и инфаркт легкого, бронхиальная астма, склонность к бронхоспазму);

внутричерепная гипертензия;

тяжелое угнетение дыхательного центра;

острые хирургические заболевания органов брюшной полости до установления диагноза;

операции кесарева сечения и другие акушерские операции в стадии до извлечения плода (угроза угнетения дыхания новорожденного);

выраженная легочная гипертензия;

экстрапирамидные расстройства;

детский возраст до 1 года.

С осторожностью

пожилой возраст;

пациенты, в анамнезе которых имеется указание на опиоидную зависимость;

печеночная и/или почечная колика;

артериальная гипотензия;

одновременное применение инсулина, глюкокортикостероидов и гипотензивных препаратов;

черепно-мозговая травма;

гипотиреоз;

миастения Гравис;

ослабленные пациенты;

гиперплазия предстательной железы;

стриктуры мочеиспускательного канала;

алкоголизм;

суицидальная наклонность;

гипертермия;

прием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО), а также менее 14 дней после окончания их приема;

в период применения фентанила у женщин детородного возраста следует использовать надежные методы контрацепции;

надпочечниковая недостаточность;

при длительном применении препарата возникает риск снижения уровня половых гормонов.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применение при беременности возможно только в том случае, когда предполагаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода.

При необходимости назначения препарата в период лактации следует прекратить грудное вскармливание.

Способ применения и дозы

Для премедикации фентанил вводят внутримышечно за 30 минут до операции в дозе 50-100 мкг.

Для осуществления вводной анестезии препарат вводят внутривенно в дозе 100-200 мкг.

Для поддержания адекватного уровня анальгезии через каждые 10-30 минут вводят 50-150 мкг фентанила (в комбинации с дроперидолом).

Если миорелаксанты не используются и нейролептанальгезия проводится с сохранением спонтанного дыхания (при непродолжительных, внеполостных операциях), после нейролептика фентанил вводят в дозе 50 мкг в расчете на 10-20 кг массы тела, контролируя при этом спонтанное дыхание и сохраняя готовность к интубации и проведению искусственной вентиляции легких (ИВЛ).

В более высоких дозах (50-100 мкг/кг) фентанил применяют только при операциях на открытом сердце.

Как дополнительное обезболивающее средство при операциях под местной анестезией фентанил (часто с нейролептиками) вводят внутримышечно или внутривенно в дозе 25-50 мкг. При необходимости инъекции повторяют каждые 20-30 минут.

Для купирования острых болей фентанил вводят внутримышечно или внутривенно по 25-100 мкг отдельно или в комбинации с нейролептиками.

Детям только внутривенно. При спонтанном дыхании начальная доза – 3-5 мкг/кг, повторная (дополнительная) – 1 мкг/кг; при вспомогательной ИВЛ начальная доза – 15 мкг/кг, повторная (дополнительная) – 1-3 мкг/кг.

Побочное действие

Нарушения со стороны иммунной системы: аллергические реакции различной выраженности.

Нарушения со стороны нервной системы: головная боль, угнетение или парадоксальное возбуждение ЦНС, судороги, повышение внутричерепного давления.

Нарушения со стороны органа зрения: нечеткость зрительного восприятия, диплопия.

Нарушения со стороны сердца: брадикардия (вплоть до остановки сердца).

Нарушения со стороны сосудов: снижение артериального давления (АД).

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: бронхоспазм, ларингоспазм, угнетение дыхания вплоть до остановки (большие дозы).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, запор, желчная колика (у пациентов, имевших их в анамнезе), метеоризм, спазм сфинктера Одди.

Нарушения со стороны скелетно-мышечной и соединительной ткани: кратковременная ригидность мышц (в т.ч. грудных).

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: задержка мочи.

Общие расстройства и нарушения в месте введения: усиленное потоотделение, лекарственная зависимость, толерантность, «синдром отмены».

Передозировка

Симптомы: брадипноэ, апноэ, ригидность мышц, угнетение дыхательного центра, снижение АД, брадикардия.

Лечение: прекращение введения препарата, поддержание адекватной легочной вентиляции. Внутривенное введение антагониста опиоидных рецепторов – налоксона в дозе от 0,4 мг до 2 мг; при отсутствии эффекта через 2-3 минуты введение налоксона повторяют. Возможно использование налорфина: 5-10 мг внутримышечно или внутривенно через каждые 15 минут до суммарной дозы 40 мг.

Следует учитывать возможность развития «синдрома отмены» при введении налоксона или налорфина пациентам с зависимостью к морфину или фентанилу; в таких случаях дозы антагонистов следует увеличивать постепенно.

Симптоматическая и поддерживающая терапия: введение миорелаксантов, при брадикардии – введение 0,5-1 мл 1 % раствора атропина.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Этанол и блокаторы H₁-гистаминовых рецепторов, обладающие седативным эффектом, повышают вероятность развития побочных эффектов.

Усиливает эффект гипотензивных препаратов. □-адренобло-каторы могут снизить частоту и тяжесть гипертензивной реакции в кардиохирургии (в т.ч. при стернотомии), но увеличивают риск брадикардии.

Бензодиазепины удлиняют выход из нейролептанальгезии.

Ингибиторы MAO повышают риск тяжелых осложнений.

Миорелаксанты предотвращают или устраняют мышечную ригидность; миорелаксанты с м-холиноблокирующей активностью (в т.ч. панкурония бромид) снижают риск брадикардии и снижения артериального давления (особенно на фоне применения □-адреноблокаторов и др. вазодилататоров) и могут увеличивать риск тахикардии и повышения артериального давления; миорелаксанты, не обладающие м-холиноблокирующей активностью (в т.ч. суксаметоний) не снижают риск брадикардии и снижения артериального давления (особенно на фоне отягощенного кардиологического анамнеза) и увеличивают риск тяжелых побочных эффектов со стороны сердечно-сосудистой системы.

Фентанил следует применять с осторожностью на фоне действия средств для общей анестезии, снотворных препаратов и нейролептиков во избежание чрезмерного угнетения ЦНС и подавления активности дыхательного центра. Трициклические антидепрессанты также повышают риск подавления дыхательного центра. Динитрогена оксид (закись азота) усиливает мышечную ригидность.

Фентанил не следует комбинировать с наркотическими анальгетиками из группы частичных агонистов (бупренорфин) и агонистов-антагонистов опиоидных рецепторов (налбуфин, буторфанол, трамадол) из-за опасности ослабления анальгезии.

При проведении сопутствующего лечения препаратами инсулина, гипотензивными средствами и глюкокортикостероидами фентанил следует применять в уменьшенных дозах.

Обезболивающее действие и побочные эффекты агонистов опиоидных рецепторов (морфина, тримеперидина) в терапевтическом диапазоне доз суммируются с эффектами фентанила.

Одновременное применение с противомигренозными лекарственными средствами (суматриптан, золмитриптан, элетриптан) и антидепрессантами может привести к развитию серотонинового синдрома.

Особые указания

Фентанил должен применяться только высококвалифицированным персоналом в условиях специализированного стационара.

В послеоперационном периоде за пациентом необходимо установить тщательное наблюдение. У пациентов со сниженной массой тела, при длительных операциях или в случае частого повторного применения фентанила возможно увеличение длительности его действия.

При применении фентанила, как и в случае других опиоидов, возможно развитие редкого, но серьезного состояния, связанного с недостаточной выработкой надпочечниками кортизола. Необходимо пристальное наблюдение пациентов при появлении симптомов недостаточности надпочечников: тошнота, рвота, потеря аппетита, усталость, слабость, головокружение, снижение артериального давления. При подозрении на развитие недостаточности надпочечников необходимо проведение соответствующих диагностических тестов. При подтверждении диагноза показано лечение препаратами кортикостероидов, а также снижение дозы и постепенная отмена фентанила (если применимо).

При длительном применении фентанила, как и в случае других опиоидов, может наблюдаться снижение уровня половых гормонов. Пациенты могут отмечать снижение либидо, эректильную дисфункцию, аменорею, бесплодие.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Во время лечения не рекомендуется управлять транспортными средствами и заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для внутривенного и внутримышечного введения, 50 мкг/мл.

По 1 или 2 мл в ампулы из бесцветного стекла первого гидролитического класса.

По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой печатной лакированной или гибкой упаковки на основе алюминиевой фольги.

По 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению препарата, скарификатором или ножом ампульным помещают в пачку из картона.

По 20, 50 или 100 контурных ячейковых упаковок вместе с равным количеством инструкций по применению, соответственно, скарификаторами или ножами ампульными в коробки из картона или в ящики из гофрированного картона.

При упаковке ампул с надрезами (насечками) и кольцами или точками излома ножи или скарификаторы ампульные не вкладывают.

Лекарственный препарат во всех заявленных видах упаковки выпускается только для стационаров.

Условия хранения

Список II «Перечня наркотических средств, психотропных веществ и их прекурсоров, подлежащих контролю в Российской Федерации».

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Срок годности

4 года.

Не применять после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Препарат выпускается только для стационаров. Через розничную аптечную сеть не реализуется.

Производитель:

Федеральное государственное унитарное предприятие

«Московский эндокринный завод»

Юридический адрес: 109052, г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25

Производство готовой лекарственной формы:

1. г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 2

2. г. Москва, шоссе Энтузиастов, д. 23, корп. 2А

Выпускающий контроль качества:

1. г. Москва, ул. Новохоловская, д. 25, стр. 1

2. г. Москва, шоссе Энтузиастов, д. 23, корп. 2А

Владелец регистрационного удостоверения/наименование, адрес организации, принимающей претензии потребителя:

Федеральное государственное унитарное предприятие

«Московский эндокринный завод»

Россия, 109052, г. Москва, ул. Новохохловская, д. 25

Тел./факс: (495) 678-00-50/911-42-10

<http://www.endopharm.ru>