

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име

Thiopental 1 g флакони

2. Количествен и качествен състав

Активни съставки

Thiopental 1 g:

1 флакон съдържа:

Thiopental sodium for injection 1000 mg

3. Лекарствена форма

Флакони

4. Клинични данни

4.1. Показания

- Кратковременна анестезия
- Въвеждаща анестезия
- Контрол на конвулсивните състояния (напр. тези проявяващи се по време или след инхалационна анестезия)
- Като помощно средство в психиатрията при психоанализ и синтез.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозата на тиопенталът налага значителни вариации. Дозата на медикаментът винаги е в зависимост от ефекта, ето защо използването на представените по-долу данни по принцип са препоръчителни.

По принцип необходимата доза е пропорционална на теглото на пациента. При въвеждаща анестезия обикновено дозата е 2-5 mg/kg. За да се оцени правилно индивидуалната чувствителност към тиопентала, полезно е да се проследяват реакциите на пациента при въвеждане на тест доза (25-75 mg при възрастни) в продължение на 60 секунди, преди въвеждането на по-високата доза.

Анестезия

За въвеждане, по принцип 200-400 mg.

За повторно инжектиране 3-5 mg/kg, венозно в продължение на 10-15 секунди до настъпване на желаната дълбока анестезия.

При кратковременни операции 400-800 mg.

Максималната доза не трябва да надхвърля 1000 mg (поради риск от кумулация!).

При деца

На възраст до 5 години 2-7 mg/kg, венозно.

При конвулсии

75-125 mg.

При гърчове вторично към локалните анестетици се инжектира 125-250 mg в продължение на 10 минути.

Като помощно средство в психиатрията при психоанализ и синтез.

Инжектират се бавно 100 mg/min. Накарайте пациентите бавно да броят обратно от 100 към 1. Преустановете прилагането на тиопентала точно когато пациентите заспават. Пациентите трябва да са в полусън и да могат да отговарят на въпросите.

При пациенти със синдроми на шок, дехидратация, тежка анемия, хиперкалиемия, токсемия, микседема и други метаболитни нарушения, така също и при тези със заболяване на бъбреците и черния дроб и при пациенти в напреднала възраст дозата на тиопенталът трябва да се намали.

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-3966/24.02.02	
609/05-06.01	



При пациенти с тежка форма на алкохолна или лекарствена зависимост, анестезията може да бъде затруднена, при използване на тиопентал самостоятелно и в тези случаи е необходимо използване на допълнителни анестетици.

При пълни пациенти, при премедикирани пациенти и при пациенти подлагани на анестезия през предходните 36 часа по-ниски дози от тиопентал могат да бъдат достатъчни за постигане на подходяща анестезия.

Начин на приложение:
Стриктно само венозно.

4.3 Противопоказания

Свръхчувствителност към тиопентал или други барбитурати.

Остра интоксикация с алкохол, сънотворни, аналгетици или психотропни лекарствени средства.

Миастения гравис, респираторна недостатъчност или ваготония, астма, тежки пристъпи на задух, тежка миокардиопатия, сърдечна аритмия, тежък шок, тежко увреждане на паренхимата на черния дроб, тежко нарушение на черния дроб или бъбреците, тежко метаболитно разстройство.

Необходимо е специално внимание при пациенти в напреднала възраст и при пациенти с кардиоваскуларни заболявания, бронхиална астма, адренекортикална недостатъчност, хиповолемия, сепсис и при дистрофия на мускулите.

4.4 Специални предупреждения за безопасност при употреба.

Тиопенталът трябва да се прилага само от добре обучен и владеещ техниките на анестезията персонал.

Тъй като съществува риск от подтискане на дишането, който може да се причини от бързо инжектиране или висока доза винаги трябва да е на разположение апаратура за обдишване. Дихателните пътища трябва да бъдат свободни и добре проходими (разположение, интубация).

Неправилното интраартериално инжектиране на тиопентал предизвиква незабавен артериален спазъм и може да причини тромбоза с гангрена.

Това налага спешни мерки напр. блокада на брахиалния плексус, инжектиране на прокаин интраартериално и едновременно прилагане на антикоагулантна терапия.

При паравенозно инжектиране в повечето случаи реакциите на тъканите са много леки и не налагат лечение. Болка и втвърдяване на мястото на инжектиране се лекуват чрез топли компреси, инжектиране на прокаин, физиологичен разтвор и/или препарати съдържащи хиалуронидаза.

4.5 Лекарствени взаимодействия

Взаимно потенциране на ефекта се наблюдава при едновременно използване на тиопентал с алкохол, антихистаминови препарати и други средства подтискащи ЦНС.

Барбитуратите са ензимни индуктори и намаляват ефикасността на лекарствата, които се метаболизират от микрозомните ензими в черния дроб (напр. стероидни хормони, хормонални контрацептиви, антикоагулантите от групата на дикумарола, гризеофулвин, фенилбутазон, феназон, фенитоин).

Фенотиазините (като хлорпромазина) и резерпина усилват брадикардния и хипотензивен ефект на тиопентала. Хипотензивният ефект на тиопентала се усилва от други антихипертензивни средства (напр. диуретици).

Действието на тиопенталът се потенцира от валпоровата киселина, а продължителността му се удължава от триаилципромина. Тиопенталът усилва токсичността на метотрексата.

Причиненото от тиопентал подтискане в циркулацията се потенцира от други лекарствени средства с основен или вторичен подтискат циркулацията ефект.

Аминофилинът може да забави действието на тиопентала.

Инжекционни разтвори, които помътняват при прибавяне на тиопентал не трябва да се инжектират.

4.6 Бременност и кърмене

Тиопенталът преминава през плацентата. Той не оказва влияние върху тонуса на матката при бременни.

Максималната концентрация на тиопентал в пъпната връв се постига 2-3 минути след венозно прилагане.

В случай, че тиопентала се използва в гинекологичната хирургия, той може да причини подтискане на ЦНС при новородените.

През време на бременност подборът на пациентите трябва да се основава на строги критерии, а прилаганата доза трябва да бъде минимизирана. Общата доза не трябва да надхвърля 250 mg.

При кърмещи жени концентрацията на тиопентала в кърмата е ниска, дори при прилагане на по-голяма доза.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Тъй като тиопенталът повлиява психомоторните функции за около 24 часа, той не трябва да се прилага при поликлинични условия на пациенти без придружител. През този период от време пациентите не трябва да шофират или да работят с машини.



4.8 Нежелани лекарствени реакции

При въвеждане (в частност след бързо инжектиране) може да се наблюдава кашляне, кихане, хълцане, ларингоспазъм и бронхоспазъм.

Бързото въвеждане или предозиране води до централно подтискане на дишането и апнея.

Подтискане на дейността на сърцето е също в зависимост от скоростта на инжектиране. Може да се наблюдава покачване на сърдечния ритъм, намаляване силата на сърцето и снижаване на кръвното налягане. Винаги непосредствено след инжектиране се наблюдава рефлекторна свръхвъзбудимост. По време на операции в цервикалната област това може да доведе до спиране на сърцето. В тези случаи е показана премедикация с атропин.

Рядко се наблюдават алергични реакции вариращи от незначителни прояви до анафилактичен шок, подтискане на дишането или циркулацията и аритмия на сърцето.

В някои случаи се съобщава за имунохемолитична анемия с увреждане на бъбреците и парализа на радиалния нерв.

По време на възстановяване и след анестезия понякога се наблюдава мускулен спазъм, тръпки, хипотермия, продължителна сънливост, обърканост и амнезия.

Повръщане след операция се наблюдава рядко.

Венозното инжектиране на разтвори с високи концентрации на препарата могат да предизвикат тромбоза. Дори и при правилно венозно инжектиране на разтвори със стандартна концентрация на препарата могат да предизвикат болка на мястото на инжектиране.

4.9 Предозиране

Острата интоксикация с тиопентал се характеризира с рязко спадане на кръвното налягане, което може да премине в шок. Подтискането на миокарда може да доведе до развитие на белодробен оток. Температурата на тялото рязко спада и дишането може да спре.

Лечение на интоксикацията

Възстановяване на нормалната температура на тялото; при спиране на дишането- изкуствено дишане. Отделянето на тиопентала от организма може да се ускори чрез засилване на диурезата, перитонеална и хемодиализа.

5 Фармакологични данни

5.1 Фармакодинамични свойства

Тиопенталът е наркотик от групата на барбитуратите с много кратко действие за венозна употреба. Той не премахва болката и нощтептивните рефлексии. По-точно аналгетичният му ефект се дължи на неговата наркотична активност. Релаксацията на мускулите не се наблюдава преди настъпване на дълбока анестезия. Един от механизмите му на действие също е намаляване на вътречерепното налягане.

Механизмът на действие на тиопентала на молекулярно ниво все още не е достатъчно изяснен. Действието му като анестетик е свързано с намаляване на невронната възбудимост. Основното място на действието му е таламусът, където се подтиква възходящата част на ретикуларната активизираща система и по този начин импулсите не достигат до кората на мозъка. Намаляване на вътречерепното налягане следва да се разглежда като следствие от анестетичното действие на препарата. Действието на тиопентала е свързано с намаляване на притока на кръв в мозъка и обема на кръвта в мозъка като резултат от повишаване на цереброваскуларната устойчивост.

5.2 Фармакокинетични свойства

Загуба на чувствителност се постига за не повече от 30-40 секунди след венозно прилагане на необходимата за наркоза доза. Състоянието на анестезия може да се задълбочи през следващите 40 секунди. Анастетичното действие продължава от 5 до 10 минути и се последва от постанестетичен сън с продължителност от 10-30 минути. Оптималната продължителност на анестезията е между 5 и 8 минути.

С белтъците от плазмата препаратът се свързва 84 %. В началото медикаментът прониква в органите главно от кръвта (мозъка, сърцето, черен дроб, бял дроб), след което бързо се разпределя в мускулите. Равновесие между концентрацията в плазмата и в мускулите се постига за 15-30 минути след инжектиране. Продължителността на анестезията зависи главно от преминаването на препарата от мозъка в мускулите. Тъй като мастните тъкани са по-слабо оросени равновесието между концентрацията в плазмата и мастната тъкан се постига след 1,5-2,5 часа.

Препаратът се метаболизира главно в черния дроб. Само една малка част от приложената доза се метаболизира в бъбреците и в мозъка. В продължение на 1 час 10-15 % от приложената доза на препарата се метаболизира. Между 3 и 5 % от приложената доза от препарата се метаболизира чрез десулфуриране до фенобарбитал, който също притежава анестетично действие.



Бавното отделяне на тиопентала от мастните тъкани е количествено ограничен. Еднократни дози приложени венозно се елиминират при полуживот от 3-8 часа. Поради преразпределянето на препарата по същество анестезията е продължителна и анестезията се задълбочава след многократно инжектиране.

5.3 Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност:

При изследванията за остра токсичност (LD50 mg/kg) след венозно прилагане на мишки и кучета беше съответно 78 и 36. При морски свинчета след интраперитонеално прилагане беше 47-57 и на зайци след венозно, орално и ректално прилагане съответно 35, 600 и 110. При плъхове след венозно, интраперитонеално, орално и ректално прилагане съответно 61, 115-130, 158 и 102.

Хронична токсичност:

Проведени бяха изследвания за токсичност върху 12 кучета след венозно прилагане на доза от 25 mg/kg. От тях 4 получаваха дозата три пъти седмично, а пет един път дневно в продължение на 30-40 дни. Черноробните биопсии вземани от опитните животни през интервали от две седмици показаха мастна дегенерация на хепатоцитите, по специално в областта на централната вена. При едно от опитните животни, което умря, беше наблюдавана типична картина на мастна дегенерация на черния дроб.

6. Фармацевтични данни

6.1 Списък на помощните вещества.

Не се съдържат

6.2 Физико-химични несъвместимости

Тиопентал е химически несъвместим с разтвори с ниска стойност на pH и с оксиданти. Несъвместим е също и с амикацин, пеницилини, цефалоспорици, кодеин, ефедрин, морфин, фенотиазин, суксаметоний и тубокурарин.

6.3 Срок на годност

Thiopental 1 g флакони 48 месеци

6.4 Условия за съхранение

Да се съхранява при температура под 25° C, да се пази от пряка светлина.

6.5 Данни за опаковката

Thiopental 1 g флакони: болнични опаковки.

6.6 Инструкции за употреба

Препоръчва се да се използват 2,5 - 5 % разтвори в Water for injections. Водните разтвори с концентрация 3,4 % са изотонични.

Препоръки при изчисляване на концентрациите за клинична употреба:

Необходима концентрация в %	Концентрация в mg/ml	Необходимо количество Thiopental в g	Water for injection в ml
2,5	25	0,5	20
3,0	30	0,5	16 ² / ₃
4,0	40	0,5	12 ¹ / ₂
5,0	50	0,5	10
2,5	25	1,0	40
3,0	30	1,0	33 ¹ / ₃
4,0	40	1,0	25
5,0	50	1,0	

Разтворите не съдържат консерванти и са предназначени за незабавна употреба.



Да се използват само прясно приготвени и бистри разтвори. Да не се инжектират мътни разтвори или разтвори съдържащи ненапълно разтворена субстанция.
Пациентите винаги да са премедикирани с парасимпатиколитици (атропин, при необходимост венозно), дори и при операции с кратка продължителност.

7. Притежател на регистрацията

Biochemie GmbH
10 Biochemiestrasse
A-6250 Kundl/Tyrol
Tel.: 00435338200
Fax: 00435338200460

8. Първа регистрация

Австрия
Thiopental 1 г флакони: 7.427/27.06.1991

9. Дата на редакция на текста

Юли 1997

10:41:51
12/1/2000

