

NALOXONE CLORIDRATO

RIASSUNTO DELLE CARATTERISTICHE DEL PRODOTTO

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

Naloxone cloridrato Galenica Senese adulti 0,4 mg/ml soluzione iniettabile.

Naloxone cloridrato Galenica Senese bambini 0,04 mg/2 ml soluzione iniettabile.

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Naloxone cloridrato Galenica Senese adulti 0,4 mg/ml soluzione iniettabile.

Una fiala contiene:

Principio attivo: Naloxone cloridrato biidrato 0,4 mg

Naloxone cloridrato Galenica Senese bambini 0,04 mg/2 ml soluzione iniettabile.

Una fiala contiene:

Principio attivo: Naloxone cloridrato biidrato 0,04 mg

Per l'elenco completo degli eccipienti, vedere paragrafo 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICA

Soluzione iniettabile.

Soluzione limpida, priva di particelle visibili.

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

Naloxone cloridrato Galenica Senese adulti 0,4 mg/ml

Antidoto nel trattamento delle intossicazioni acute da analgesici, narcotici.

Naloxone cloridrato Galenica Senese bambini 0,04 mg/2 ml

Depressione respiratoria del neonato causata da esposizione della madre a sostanze oppioidi prima del parto.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

Naloxone può essere somministrato per via endovenosa, sottocutanea o intramuscolare.

La somministrazione per via endovenosa, raccomandabile in situazioni di emergenza, determina una più rapida comparsa dell'attività farmacologica. Poiché la durata degli effetti farmacologici di alcuni stupefacenti potrebbe superare quella di naloxone, il paziente dovrebbe essere costantemente sorvegliato e, se necessario, la somministrazione del farmaco dovrebbe essere ripetuta.

Si raccomanda comunque di avviare sempre il paziente, il più presto possibile, ad un pronto soccorso attrezzato.

Nel caso in cui sia necessario diluire la soluzione contenuta nella fiala è possibile utilizzare sodio cloruro 0,9% (soluzione fisiologica) o glucosio 5%.

Adulti

Sovradosaggio da stupefacenti (noto o sospetto)

La dose iniziale di naloxone, somministrato per via endovenosa, intramuscolare o sottocutanea è 0,4 mg/ml. Nel caso in cui dopo somministrazione endovenosa non si determini un sufficiente miglioramento della funzione respiratoria, e' consigliabile ripetere la dose ad intervalli di 2-3 minuti. Uno scarso miglioramento dopo somministrazione di 2-3 dosi di NALOXONE, potrebbe essere causato da eventuali processi morbosi concomitanti o dalla presenza di farmaci non oppiacei.

Depressione post-operatoria da stupefacenti

Per ottenere un parziale o completo antagonismo degli effetti deprimenti degli oppiacei a seguito di interventi chirurgici, è necessaria una dose minore di naloxone. Questa deve essere comunque stabilita in relazione con la risposta del paziente. Naloxone deve essere somministrato per via endovenosa, a dosi crescenti comprese tra 0,1 e 0,2 mg, con intervalli di 2-3 minuti, fino ad ottenere un adeguato antagonismo degli effetti deprimenti indotti da stupefacenti. Entro 1-2 ore dalla prima somministrazione, può essere necessario ripetere la somministrazione di Naloxone, in relazione al tipo, alla quantità ed all'intervallo di tempo intercorso dall'ultima somministrazione di stupefacente. Dosi supplementari per via intramuscolare, determinano comunque un effetto più prolungato. Dosi eccessive di Naloxone possono determinare una significativa diminuzione dell'effetto analgesico indotto dallo stupefacente ed aumentare la pressione arteriosa. Analogamente un antagonismo troppo rapido potrebbe indurre nausea, vomito, sudorazione o tachicardia.

Bambini

Sovradosaggio da stupefacenti (noto o sospetto)

La dose iniziale è 0,01 mg/kg somministrata per via endovenosa intramuscolare o sottocutanea. La dose può essere ripetuta secondo le indicazioni relative alla somministrazione negli adulti.

4.3 Controindicazioni

Ipersensibilità al principio attivo o ad uno qualsiasi degli eccipienti.

4.4 Avvertenze speciali e precauzioni di impiego

I sintomi dell'intossicazione acuta da oppioidi sono rappresentati da depressione respiratoria, stato comatoso (precoma o coma vigile e nei casi più gravi di tipo profondo) miosi pupillare (assente in caso di assunzione contemporanea di sostanze ad effetto midriatico, nei casi di intossicazione acuta da petidina e negli stati terminali del coma).

La somministrazione di farmaci vasopressori e tecniche di rianimazione, quali il mantenimento della pervietà delle vie aeree, alla respirazione artificiale e il massaggio cardiaco, possono essere associate per contrastare l'avvelenamento acuto da stupefacenti. Naloxone non è efficace contro la depressione respiratoria dovuta a farmaci non oppiacei.

È necessario tenere in osservazione accuratamente il paziente dopo l'avvenuto risveglio fino a 3-6 ore in caso di intossicazione acuta da eroina e fino a 24-48 ore in caso di intossicazione acuta da metadone.

È possibile infatti che ricompaia depressione respiratoria e che il paziente ritorni in coma dopo somministrazione della prima dose efficace di naloxone, perché la durata dell'azione antagonista (20-30 minuti dopo somministrazione endovenosa; 2 ore e mezza-3 ore dopo somministrazione intramuscolare o sottocutanea) può essere inferiore a quella della sostanza oppiacea iniettata, di volta in volta variabile (eroina, morfina, metadone, pentazocina, ecc.).

Si può quindi rendere necessaria la somministrazione di ulteriori dosi di naloxone dopo la prima somministrazione efficace.

Dopo il primo intervento, si rende necessario, pertanto, trasferire il paziente in ambiente ospedaliero anche per il tempestivo trattamento.

Il naloxone deve essere somministrato con cautela nei pazienti cardiopatici o quelli in terapia con farmaci cardiotossici.

Il naloxone deve essere somministrato con cautela nei pazienti che, nelle ore precedenti, hanno avuto episodi di laringospasmo importante.

Il naloxone va usato nei neonati di madri che hanno ricevuto una sostanza oppioide entro 4 ore dal parto e solo come terapia aggiuntiva nei neonati che non hanno instaurato una respirazione indipendente in seguito a ventilazione.

Il naloxone non è efficace contro la depressione respiratoria dovuta a farmaci non oppiacei.

L'utilizzo del naloxone nei neonati di madri tossicodipendenti da oppiacei è sconsigliato, in quanto in questi pazienti il naloxone può precipitare la sindrome di astinenza e le convulsioni tipiche di questa condizione.

Informazioni importanti su alcuni eccipienti: nulla da segnalare.

4.5 Interazioni con altri medicinali ed altre forme di interazione

Il naloxone non deve essere somministrato contemporaneamente a clonidina: l'effetto ipotensivo e bradicardizzante della somministrazione cronica di clonidina può essere temporaneamente attenuato dalla somministrazione endovenosa di naloxone. Pertanto è necessario monitorare attentamente la pressione del sangue.

4.6 Gravidanza e allattamento

Non pertinente.

4.7 Effetti sulla capacità di guidare veicoli e sull'uso di macchinari

Non pertinente.

4.8 Effetti indesiderati

Di seguito sono riportati gli effetti indesiderati del naloxone organizzati secondo la classificazione sistemica organica MedDRA. Non sono disponibili dati sufficienti per stabilire la frequenza dei singoli effetti elencati.

Patologie cardiache

Si sono verificati casi di arresto cardiaco, ipertensione, ipotensione, fibrillazione e tachicardia ventricolare.

Patologie della cute e del tessuto sottocutaneo

Sudorazione, vampate di calore e arrossamento.

Patologie endocrine

Aumento dei livelli dell'ormone della crescita quando somministrato a dosi da 0,3 a 4 mg/kg.

Patologie gastrointestinali

Nausea, vomito, disfagia.

Patologie del sistema nervoso

Parestesia, convulsioni, tremori.

Deficit della memoria con dosi da 0,3 a 4 mg/kg.

Disturbi psichiatrici

Agitazione, allucinazioni.

Patologie renali e urinarie

Stimolo alla minzione.

Patologie respiratorie, toraciche e mediastiniche

Dispnea, ipossia, edema polmonare e depressione respiratoria.

Iperventilazione a dosi da 0,3 a 4 mg/kg.

4.9 Sovradosaggio

Non pertinente.

5. PROPRIETÀ FARMACOLOGICHE

5.1 Proprietà farmacodinamiche

Categoria farmacoterapeutica: antagonista oppioide, codice ATC: V03AB15

Il naloxone è una molecola di sintesi derivata dall'ossimorfone sostituito con un gruppo allilico a livello dell'atomo di azoto in posizione 17.

Il naloxone è un antagonista competitivo degli oppioidi a livello di tutti i siti recettoriali (μ, κ, σ). Al contrario degli altri antagonisti oppioidi, il naloxone è completamente privo di una qualsiasi azione agonista (antagonismo puro) e pertanto, in assenza di agenti oppioidi, non presenta alcun effetto tipico di questi ultimi come depressione respiratoria, sedazione, analgesia e miosi.

5.2 Proprietà farmacocinetiche

A seguito di somministrazione per via endovenosa, l'attività del naloxone generalmente è evidente dopo 2 minuti.

La comparsa dell'attività farmacologica è lievemente rallentata se il medicinale viene somministrato per via sottocutanea o intramuscolare. La durata dell'attività è dose-dipendente e correlata alla via di somministrazione; gli effetti farmacologici sono comunque più prolungati dopo somministrazione per via intramuscolare rispetto a quelli ottenibili per via endovenosa.

Distribuzione

Il naloxone ha una elevata liposolubilità e si distribuisce rapidamente nell'organismo. Si raggiungono elevate concentrazioni nell'encefalo, nel rene, nel polmone, nel cuore e nella muscolatura scheletrica.

Nei neonati o nei bambini prematuri, il volume di distribuzione va da 1,8 a 3,5 l/kg.

Metabolismo

Il naloxone è rapidamente metabolizzato nel fegato tramite coniugazione con acido glucuronico.

Escrezione

L'escrezione del naloxone avviene per via renale.

Emivita: 2,5-3,5 ore per i neonati.

Gli effetti sull'insufficienza epatica e renale sul metabolismo e la distribuzione del naloxone non sono stati studiati.

5.3 Dati preclinici di sicurezza

I dati preclinici hanno scarsa rilevanza clinica alla luce della vasta esperienza acquisita con l'uso del farmaco nell'uomo.

DL50 (mg/kg):

topo: i.v. = 150, i.p. = 80, s.c. = 286

ratto: i.v. = 109, s.c. = 640

La somministrazione s.c. per tre settimane di 10 mg/kg/die nel ratto non ha evidenziato effetti tossici.

Non sono state inoltre rilevate alterazioni della fertilità (nel ratto) o effetti teratogeni o embriotossici dopo iniezione s.c. di 2-10 mg/kg/die.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Elenco degli eccipienti

Acqua per preparazioni iniettabili

Acido cloridrico

6.2 Incompatibilità

Il naloxone non deve essere miscelato con soluzioni alcaline.

In particolare, il naloxone non deve essere somministrato per via endovenosa insieme a bisulfiti, metabisulfiti, anioni ad alto peso molecolare, anioni a lunga catena.

6.3 Periodo di validità

24 mesi dalla data di preparazione.

Dopo la prima apertura il medicinale deve essere usato immediatamente per un'unica ed interrotta somministrazione.

6.4 Precauzioni particolari per la conservazione

Conservare nella confezione originale per riparare il medicinale dalla luce.

La data di scadenza si riferisce al prodotto in confezionamento integro, correttamente conservato. Non usare oltre tale data.

6.5 Natura e contenuto del contenitore

Fiale in vetro tipo I da 1-2 ml, serigrafate, ermeticamente sigillate con saldatura della punta per fusione.

6.6 Precauzioni particolari per lo smaltimento e la manipolazione

Il medicinale non utilizzato ed i rifiuti derivati da tale medicinale devono essere smaltiti in conformità alla normativa locale vigente.

7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

Industria farmaceutica Galenica Senese S.r.l.

8. NUMERI DELLE AUTORIZZAZIONI ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

AIC	CONFEZIONE
029858026	Fiala da 1 ml 0,4 mg/ml
029858040	5 fiale da 1 ml 0,4 mg/ml
029858053	10 fiale da 1 ml 0,4 mg/ml
029858014	Fiala da 2 ml 0,04 mg/2 ml
029858038	5 fiale da 2 ml 0,04 mg/2 ml

9. DATA DELLA PRIMA AUTORIZZAZIONE/RINNOVO DELL'AUTORIZZAZIONE

Dicembre 1993/Dicembre 2003/Dicembre 2008.

10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO

Determinazione AIFA del 1 Dicembre 2011