

EKİPENTAL İV ENJEKTABL TOZ İÇEREN FLAKON 1 g/40 ml

FORMÜLÜ

Her flakon 1 g steril tiyopental sodyum içerir.

FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLERİ

Farmakodinamik özellikler

Tiyopental genel anestezi oluşturmak için intravenöz yolla kullanılan çok kısa-etkili bir barbitürattır. Ağrı hissini ve nosiseptif refleksleri azaltmaz. Oluşturduğu analjezik etki daha çok narkotik özellikleri ile ilgilidir. Derin anestezi oluşmasından önce adale relaksasyonu meydana gelmez. İntrakranial basınç azalması da ilacın özellikleri arasındadır.

Tiyopentalin etki mekanizması tam olarak anlaşılamamıştır. Anestezik etkisi nöronal eksitasyonda bir azalmanın sonucudur. Başlıca etki yeri, sinyalleri serebral kortekse iletemeyecek şekilde retiküler aktive edici sistemin deprese edildiği talamustadır. Kafa içi basıncındaki azalma ilacın anestezik etkisinin bir yan ürünü olarak ortaya çıkar. Tiyopental kullanımında serebrovasküler dirençte artış sonucu serebral kan akışında ve serebral kan hacminde bir azalma meydana gelir.

Farmakokinetik özellikler

Bir narkotik İV dozundan 30-40 saniye sonra bilinç kaybolur. Anestezinin derinliği 40 saniye içinde artabilir. Oluşan anestezik etki 5-10 dakika devam eder. Bundan sonra 10-30 dakikalık bir anestezi sonrası uyku periyodu başlar. Faydalı anestezi süresi 5-8 dakika arasındadır.

İlacın %84'ü plazma proteinlerine bağlanır. İlaç başlangıçta yüksek kan akışı olan organlara (beyin, kalp, karaciğer ve akciğerler) girer; sonra süratle adalelere tekrar dağılır. Plazma ve adale konsantrasyonları arasındaki bu dengeye enjeksiyondan 15-30 dakika sonra ulaşılır. Anestezinin uzunluğu beyinden adaleye bu tekrar dağılım ile tayin edilir. Adipoz dokular zayıf olarak kanlandığından plazma ve yağlı doku konsantrasyonları arasındaki denge 1.5-2.5 saat sonra oluşur.

Metabolizma esas olarak hepatiktir. Dozun sadece küçük bir kısmı böbreklerde ve beyinde metabolize edilir. 1 saat içinde aktif ilacın %10-15 kadarı metabolize olur. %3-5 kadarı ise yine anestezik etkisi olan pentobarbitale dönüşür.

Yağlı dokulardan yavaş uzaklaşması tiyopentalin eliminasyonunda hız limitleyici adımdır. Tek intravenöz dozlar 3-8 saatlik bir yarı ömürde elimine edilmektedir.

Tekrarlayan enjeksiyonlardan sonra ilacın tekrar dağılımı nedeniyle anestezi önemli ölçüde uzar ve anestezinin derinliği artar.

ENDİKASYONLARI

- Kısa süreli anestezi için,
- Anestezi indüksiyonu için,
- Konvülsif durumların kontrolünde (mesela inhalasyon anestezisi sırasında ve sonrasında görülen),
- Psikiyatride narkotik-yardımlı psikoanaliz ve sentezde kullanılır.

KONTRENDİKASYONLARI

- Tiyopentale ve diğer barbitüratlara aşırı duyarlılığı olan kişilerde kontrendikedir.
- Alkol, uyku ilaçları, analjezikler veya psikoaktif ilaçlar ile akut intoksikasyon riski vardır.
- Myastenia gravis, solunum yetmezliği veya vagotoni, status asthmaticus, şiddetli dispne, akut hepatik porfiri, şiddetli hepatik veya renal yetmezlik, şiddetli metabolik disfonksiyon olan kişilerde kullanılmaz.
- Yaşlı hastalarda ve kardiyovasküler hastalığı, adrenokortikal yetmezliği, hipovolemisi, sepsis ve adale distrofisi olan hastalarda dikkatli olunmalıdır.

UYARILAR / ÖNLEMLER

Tiyopental sadece intravenöz anestezi tekniklerinde deneyimli kişiler tarafından uygulanmalıdır. İntravenöz dışında başka bir yoldan enjekte edilmemelidir.

Bağımlılık yapabilir.

Hızlı enjeksiyon veya yüksek dozlar ile meydana gelebilen solunum depresyonu riski nedeniyle acil ventilasyon için ekipman el altında tutulmalıdır. Solunum yolları mutlak şekilde açık tutulmalıdır.

Hızlı enjeksiyondan sonra, anestezinin indüksiyonu sırasında öksürük, aksırma, hıçkık, larengospazm ve bronkospazm görülebilir. Kardiyak aktivitede depresyon da yine enjeksiyon hızının bir fonksiyonudur. Kalp atım hızında artış veya kardiyak çıkışta ve kan basıncında azalma olabilir. Enjeksiyondan kısa bir süre sonra refleks hipersensibilite genellikle görülür. Servikal bölgedeki operasyonlar sırasında bu durum kardiyak arrest ile sonuçlanabilir. Bu nedenle atropin ile premedikasyon yapılması gerekir.

İntraarteriyel tiyopental enjeksiyonları hemen arteriyel spazmlar ile sonuçlanır ve gangren ile birlikte tromboza neden olabilir. Bu durumlarda acil müdahale gerekir (mesela brakial pleksus blokajı, intraarteriyel prokain enjeksiyonu ve aynı zamanda antikoagülasyon).

Perivenöz enjeksiyonlar genel olarak müdahale gerektirmeyen daha az şiddetli doku reaksiyonlarına yol açar. Enjeksiyon yerinde ağrı ve sertleşme için sıcak kompresler, serum fizyolojik içinde prokain enjeksiyonları ve/veya hiyalüronidaz preparatları kullanılmalıdır.

Araç ve makine yeteneği üzerine etkisi

Tiyopental psikomotor fonksiyonları 24 saat kadar bir süre boyunca etkilediğinden hastane dışında olup yardımcısız kişilere uygulanmamalıdır. Bu süre içinde kişi araba ya da başka makineleri kullanmamalıdır.

Hamilelerde kullanımı

Tiyopentalin plasenta bariyerini geçtiği bilinmektedir. Gebelerde uterus tonusunu etkilemez. İntravenöz uygulamayı takiben 2-3 dakikada göbek kordonu konsantrasyonları en yüksektir. Jinekolojik cerrahide kullanılacak olursa tiyopental yenidoğanlarda MSS depresyonuna neden olabilir.

Hamilelik kategorisi: C'dir. Tiyopental ile hayvanlarda üreme çalışmaları yapılmamıştır. Hamile bir kadına uygulandığı zaman fetal zarara neden olup olmayacağı veya üreme kapasitesini etkileyip etkilemeyeceği de bilinmemektedir. Gerçekten gerekli olduğu durumlarda hamilelerde tiyopental kullanımında uygulanan doz en azda tutulmalıdır. Toplam 250 mg'lık bir doz aşılmamalıdır.

Emziren anneler kullanımı

Yüksek dozlar kullanılmış olsa bile anne sütü konsantrasyonları düşüktür.

YAN ETKİLER / ADVERS ETKİLER

Solunum: Laringospasm, solunum depresyonu, apne (özellikle hızlı İV enjeksiyon ile)

Kalp-damar sistemi: bradikardi, hipotansiyon, senkop

Merkezi sinir sistemi: uykulu hal, letarji, MSS eksitasyonu veya depresyonu, muhakeme yetmezliği, başağrısı, konfüzyon, ajitasyon, hiperkinezi, ataksi, uykusuzluk, kabus görme, halüsinasyon görme, anksiyete, halsizlik

Dermatolojik: Ciltte kızarıklık, ekzfoliyatif dermatit, Stevens-Johnson sendromu

Gastro-intestinal sistem: bulantı, kusma, kabızlık

Hematolojik: agranulositoz, trombositopeni, megaloplastik anemi

Renal etki: oligoüri

Lokal etki: enjeksiyon yerinde ağrı, İV kullanımda tromboflebit

Diğer: istenmeyen arter içine enjeksiyon ile gangren

BEKLENMEYEN BİR ETKİ GÖRÜLDÜĞÜNDE DOKTORUNUZA BAŞVURUNUZ.

İLAÇ ETKİLEŞMELERİ VE DİĞER ETKİLEŞMELER

Tiyopental alkol, antistaminikler ve diğer santral sinir sistemi depresanları ile birlikte kullanılırsa birbirlerinin etkilerini artırır.

Barbitüratlar mikrozomal karaciğer enzimleri ile metabolize olan ilaçların (mesela steroid hormonlar,

hormonal kontraseptifler, dikumarol antikoagülanlar, griseofulvin, fenazon, fenitoin v.s.) etkinliğini enzim indüksiyonu ile azaltırlar.

Fenotiyazinler (klorpromazin gibi) ve reserpin, tiyopentalin bradikardik ve hipotansif etkilerini artırır. Tiyopentalin hipotansif etkisi diğer antihipertansif ilaçlarla (mesela diüretikler) potansiyalize olur.

Tiyopentalin etkisi valproik asit ile artar; etki süresi ise tranilsipromin ile uzar. Tiyopental metotraksatın toksisitesini artırır.

Tiyopentalin neden olduğu dolaşım depresyonu, primer ve sekonder dolaşım depresanı olarak etki gösteren diğer ilaçlar ile potansiyalize olur.

Aminofilin tiyopentalin etkisini tersine çevirir.

Tiyopental ilavesi ile bulanıklaşan enjeksiyonluk çözeltiler enjektelerde edilmemelidir.

Geçimsizlikleri: Tiyopental düşük pH'lı çözeltiler ve oksidanlarla kimyasal olarak geçimsizdir.

Diğer geçimsiz olduğu ilaçlar: Amikasin, penisilinler, sefalosporinler, kodein, efedrin, morfin, fenotiazin, süksametonum ve tübokürarin.

KULLANIM ŞEKLİ VE DOZU

Sadece intravenöz yolla kullanım içindir.

Genel olarak enjeksiyonluk suda %2.5-5 konsantrasyondaki çözeltileri tavsiye edilir.

%3.4'lük çözeltileri izotoniktir.

Klinik kullanım için konsantrasyonları hesaplama kılavuzu

İstenilen konsantrasyon (%)	Konsantrasyon (mg/mL)	Gerekli miktarlar	
		Tiyopental (g)	Enjeksiyonluk su (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	20

Koruyucu içermediğinden solüsyonları hazırlandıktan hemen sonra kullanılmalıdır.

Sadece taze hazırlanmış, berrak çözeltiler kullanılmalıdır. Bulanık veya tam çözünmenin sağlanmadığı çözeltiler kullanılmaz.

Kısa operasyonlar için bile hastalara bir parasempatolitik ile (atropin; gerekirse, İV yolla) premedikasyon yapılır.

Dozaj

Gerekli olan tiyopental dozu bireye bağılı olarak deęişir. Aşağıda verilen doz bilgisi bir rehber olarak kullanılarak, solunum depresyonu ve aşırı doza yol açmamak için gerekli tedbirleri alarak ve dikkatle, ilaç etki görülünceye kadar verilir. Genelde, gerekli olan doz hastanın vücut ağırlığı ile orantılıdır. İndüksiyon için mutlak doz 2-5 mg/kg'dır. Tiyopental bireysel duyarlılığı doğru olarak deęerlendirmek için; daha yüksek dozları enjekte etmeden önce hastada bir test dozunun (yetişkinlerde 25-75 mg) etkisini 60 sn süre ile gözlemek yararlıdır.

Anestezi

İndüksiyon için genel olarak 200-400 mg.

Mükerrer enjeksiyonlar için anestezide istenilen derinlik elde edilinceye kadar 10-15 sn. boyunca İV yolla 3-5 mg/kg.

Kısa süreli operasyonlar için 400-800 mg.

1000 mg'lık maksimal doz aşılmamalıdır (birikim riskü).

Çocuklar için doz genel olarak İV yolla 2-7 mg/kg.

Konvülsif durumlar

75-125 mg.

Lokal anesteziklerle sekonder konvülsiyonlar için 10 dakika boyunca enjekte edilen 125-250 mg.

Narkotik yardımcı psikoanaliz ve sentez

Yavaş enjeksiyon ile 100 mg/dak. Hastanın 100'den başlayarak geriye doğru yavaş yavaş sayması beklenir. Hastalar uyumaya başlamadan hemen önce tiyopental verilmesi kesilir. Hasta yarı uyanık olmalıdır ve sorulara cevap verebilmelidir.

Böbrek ve karaciğer hastalığı olanlarda, ilerlemiş yaşta olanlarda, şok sendromu, dehidrasyon, şiddetli anemi, hiperkalemi, toksemi, miksödem ve diğer metabolik koşullarda olan hastalarda tiyopental dozu azaltılmalıdır.

İleri derecede alkol veya ilaç bağımlılığı olan hastalarda tek başına tiyopental ile anestezi elde etmek zor olabilir; ilave anesteziklerin kullanımı gerekebilir.

Obez hastalarda, premedike hastalarda, son 36 saat içinde anestezi uygulanmış olan hastalarda yeterli anestezi için daha düşük tiyopental dozları kafi gelebilir.

DOZ AŞIMI VE TEDAVİSİ

Akut tiyopental intoksikasyonu şoka kadar ilerleyebilen kan basıncında bir düşme ile karakterizedir. Miyokardiyal depresyon pulmoner ödeme yol açabilir. Vücut sıcaklığı düşer ve nefes alma yavaşlayabilir.

Doz aşımı tedavisi: Normal vücut sıcaklığına dönüş sağlanır. Eğer solunum yavaşlamışsa suni solunum başlatılır. Zorlu diürez, peritonal diyaliz veya hemodiyaliz ile tiyopental eliminasyonu hızlandırılabilir.

SAKLAMA KOŞULU

25°C'nin altında oda sıcaklığında saklayınız. Işıktan koruyunuz.

Doktora danışmadan kullanılmamalıdır.

Çocukların göremeyeceği, erişemeyeceği yerlerde ve ambalajında saklayınız.

TİCARİ TAKDİM ŞEKLİ VE AMBALAJ MUHTEVASI

1 g tiyopental sodyum içeren 1 adet flakon

PIYASADA BULUNAN DİĞER FARMASÖTİK DOZAJ ŞEKİLLERİ

EKİPENTAL 0.5 g İV Enjektabl Toz İçeren Flakon, 1 flakon

RUHSAT TARİHİ VE NUMARASI

14.07.2006 - 120/30

RUHSAT SAHİBİ

TÜM-EKİP İLAÇ A.Ş. Y.Dudullu-İSTANBUL

İMALATÇI

SANDOZ GmbH Langkampfen/AVUSTURYA

Reçete ile satılır.