

Состав

действующее вещество: bupivacaine hydrochloride;

1 мл бупивакаина гидрохлорида моногидрата 5,28 мг в пересчете на бупивакаина гидрохлорид 5 мг

вспомогательные вещества: глюкоза, моногидрат натрия гидроксид и / или кислота хлористоводородная, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачный, бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа

Препараты для местной анестезии.

Код АТХ N01B B01.

Фармакодинамика

Бупивакаин - местный анестетик длительного действия амидного типа.

Бупивакаин обратимо блокирует проведение импульсов по нервным волокнам, подавляя транспорт ионов натрия через мембрану нейронов. Подобные эффекты также могут наблюдаться на возбуждающих мембранах мозга и миокарда.

Маркаин Спинал Хэви предназначен для гипербарической спинномозговой анестезии. Относительная плотность раствора для инъекций составляет 1,026 при температуре 20 ° С (эквивалентно 1,021 при 37 ° С), и начальное распределение препарата в субарахноидальном пространстве в значительной степени зависит от силы тяжести.

При спинальном введении применяют низкую дозу, что приводит к относительно низкой концентрации и кратковременного действия.

Фармакокинетика

Бупивакаин является высокожиророзчинным с коэффициентом распределения масло / вода 27,5.

Бупивакаин демонстрирует полную двухфазную абсорбцию из субарахноидального пространства с периодами полувыведения двух фаз примерно 50 и 400 мин со значительными колебаниями. Фаза медленного абсорбции является фактором, ограничивающим вывода бупивакаина, и это объясняет, почему конечный период полувыведения длительнее после субарахноидального введения по сравнению с таковым после внутривенного применения.

Абсорбция с субарахноидального пространства относительно медленная, что вместе с небольшой дозой, необходимой для спинальной анестезии, приводит к относительно низкой максимальной плазменной концентрации (примерно 0,4 мг / л на каждые введенные 100 мг).

После введения общий клиренс бупивакаина составляет примерно 0,58 л / мин, объем распределения в равновесном состоянии - 73 л, конечный период полувыведения - 2,7 часа, а коэффициент печеночного выведения - 0,40. Бупивакаин практически полностью метаболизируется в печени путем ароматического гидроксирования до 4-гидроксибупивакаину и путем N-деалкилирования к пипеколилксилдину (РРХ), оба пути опосредуются цитохрома Р450 3А4. Таким образом, его клиренс зависит от перфузии печени и активности ферментов метаболизма. Бупивакаин через плацентарный барьер. Концентрация свободного бупивакаина одинакова у беременной и плода. Однако общая плазменная концентрация ниже у плода, который имеет низкую степень связывания с белками.

У детей фармакокинетика препарата подобна таковой у взрослых.

Показания

Маркаин Спинал Хэви показан взрослым и детям разного возраста для интратекальной (субарахноидальной) спинномозговой анестезии в хирургии (урологические операции и операции на нижних конечностях длительностью 2-3 часа, а также операции в абдоминальной хирургии длительностью 45-60 минут).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к активному веществу, местных анестетиков амидного ряда или к любому компоненту препарата.

Интратекально анестезия, независимо от применяемого местного анестетика, имеет свои противопоказания, которые включают:

- активные заболевания центральной нервной системы, такие как менингит, полиомиелит, внутричерепные кровоизлияния, подострая комбинированная дегенерация спинного мозга через пернициозной анемией и опухоли головного и спинного мозга;
- стеноз спинномозгового канала и заболевания в активной стадии (например спондилит, туберкулез, опухоли) или недавно перенесенные травмы (например перелом позвоночника)
- септицемия,
- гнойная инфекция кожи в месте или рядом с местом пункции поясничного отдела позвоночника;
- кардиогенный или гиповолемический шок
- нарушение свертывания крови или продолжения лечения антикоагулянтами.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий

Поскольку системные токсические эффекты являются аддитивными, бупивакаин следует применять с осторожностью пациентам, которые получают другие местные анестетики или препараты, которые по структуре подобные местным анестетиков амидного типа, например определенные антиаритмические препараты класса IC.

Специфические исследования взаимодействий между бупивакаином и антиаритмическими средствами класса III (например амиодарон) не проводились, поэтому в случае одновременного применения следует соблюдать осторожность (см. Также раздел «Особенности применения»).

Особенности применения

Следует помнить, что Интратекально анестезия иногда может привести к значительной блокады с параличом межреберных мышц и диафрагмы, особенно у беременных женщин.

Следует с осторожностью применять препарат пациентам с AV блокадой II или III степени, поскольку местные анестетики могут снижать ведущую способность миокарда. Пациенты пожилого возраста и пациенты с заболеваниями печени, тяжелыми нарушениями функции почек или с плохим общим состоянием тоже требуют особого внимания.

Пациенты, получающие антиаритмические лекарственные средства класса III (например амиодарон), должны находиться под тщательным наблюдением.

Кроме того, следует учитывать необходимость проведения ЭКГ-мониторинга, так как кардиологические эффекты препаратов могут быть аддитивными.

Проведение интратекальной анестезии может привести к развитию артериальной гипотензии и брадикардии. Риск таких эффектов можно снизить, например, введением сосудосуживающих лекарственных средств. Гипотензии следует лечить немедленно введением симпатомиметиков, применение которых повторяют по мере необходимости.

Как и все местные анестетики, бупивакаин в случае, когда применение препарата с целью проведения местной анестезии приводит к образованию высоких концентраций в крови, может привести к развитию острых токсических эффектов со стороны центральной нервной и сердечно-сосудистой систем. Это, в частности, касается случаев, развивающихся после случайного внутрисосудистого введения препарата или введение препарата в сильно васкуляризованный участок.

Случаи желудочковой аритмии, фибрилляции желудочков, внезапной сердечно-сосудистой недостаточности и смерти были зарегистрированы в связи с высокими системными концентрациями бупивакаина. Однако высокие системные концентрации препарата не ожидаются при дозах, которые обычно применяются для проведения интратекальной анестезии.

Редким, но серьезным побочным эффектом интратекальной анестезии является обширная или полная спинальная блокада, что приводит к угнетению функции сердечно-сосудистой и дыхательной систем. Угнетение сердечно-сосудистой системы, вызванное обширной блокадой симпатической нервной системы, может привести к гипотензии и брадикардии и даже к остановке сердца. Угнетение функции дыхательной системы может быть вызвано блокадой нервных волокон дыхательных мышц, включая диафрагму.

У пациентов пожилого возраста и пациенток, находящихся на поздних стадиях беременности, повышен риск развития обширной или полной спинномозговой блокады. Поэтому для этих пациентов дозу препарата следует уменьшить.

Неврологические травмы являются редким следствием интратекальной анестезии и могут привести к развитию парестезии, анестезии, моторной слабости и паралича. Считается, что интратекально анестезия не влияет отрицательно на неврологические расстройства, такие как множественный склероз, гемиплегия, параплегия и нейромышечные расстройства, но следует соблюдать осторожность.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами

В зависимости от дозы и способа применения бупивакаин может приводить к временному ухудшению двигательной активности и внимательности.

Применение в период беременности или кормления грудью

Беременность

Известных рисков для плода при применении во время беременности нет.

Следует отметить, что дозу препарата необходимо уменьшить для пациенток, находящихся на поздних сроках беременности (см. Также раздел «Особенности применения»).

Кормление грудью

Бупивакаин проникает в грудное молоко, но риск воздействия на ребенка при применении терапевтических доз препарата маловероятно.

Способ применения и дозы

Маркаин Спинал Хэви должны применять только врачи с опытом проведения регионарной анестезии или введение осуществлять под их контролем в малых дозах, дающих возможность достичь достаточной степени анестезии.

Рекомендуемые ниже дозы лекарственного средства следует рассматривать как руководство к применению препарата взрослым, коррекцию дозы следует выполнять индивидуально для каждого пациента.

Дозу препарата следует уменьшить для пациентов пожилого возраста и пациенток, находящихся на поздних стадиях беременности.

Таблица 1

Показания	Доза, мл	Доза, мг	Время до наступления эффекта, мин (приблизительно)	Продолжительность эффекта, ч (приблизительно)
-----------	----------	----------	--	---

Урологические хирургические вмешательства	1,5–3	7,5–15	5–8	2–3
Хирургические вмешательства на нижних конечностях, включая хирургические вмешательства на бедрах	2–4	10–20	5–8	2–3
Абдоминальные хирургические вмешательства (включая кесарево сечение)	2–4	10–20	5–8	3/4–1

Рекомендуемое место инъекции ниже L3.

На сегодня отсутствует клинический опыт применения доз выше 20 мг.

Спинальная введения препарата выполняют лишь после четкого определения субарахноидального пространства путем люмбальной пункции (пока через иглу для люмбальной пункции или при аспирации не будет получено прозрачную спинномозговую жидкость). В случае неэффективной анестезии новую попытку введения препарата следует делать только на другом уровне с меньшим объемом анестетика. Одной из причин недостаточного эффекта может быть неправильное распределение препарата в интратекальном пространстве. В таком случае достаточный эффект достигается при изменении положения тела пациента.

Новорожденные, младенцы и дети с массой тела до 40 кг

Маркаин Спинал Хэви можно применять в педиатрической практике.

Одно из отличий между детьми и взрослыми - это относительно высокий объем спинномозговой жидкости у младенцев и новорожденных, требует применения относительно большей дозы / кг массы тела для достижения того же уровня блокады по сравнению со взрослыми.

Процедуры регионарной анестезии у детей должны выполнять квалифицированные врачи, которые имеют надлежащий опыт проведения регионарной анестезии детям, а также опыт выполнения методики анестезии.

Дозы, указанные в таблице 2, следует рассматривать как руководящие при применении лекарственного средства в педиатрии. Наблюдались случаи индивидуальной изменчивости. Стандартные рекомендации по дозировке следует принимать во внимание при наличии факторов, влияющих на отдельно взятые методики проведения блокады, и для обеспечения индивидуальных требований пациентов.

Следует применять самые низкие необходимые для проведения адекватной анестезии дозы препарата.

Таблица 2

Рекомендации по дозировке препарата для новорожденных, младенцев и детей

Масса тела (кг)	Доза (мг / кг)
< 5	0,40–0,50
Від 5 до 15	0,30–0,40
Від 15 до 40	0,25–0,30

Дети

Маркаин Спинал Хэви можно применять в педиатрической практике. Более подробную информацию см. в разделе «Способ применения и дозы».

Передозировка

Острая системная токсичность

При применении высоких доз бупивакаина возможные токсические эффекты со стороны центральной нервной и сердечно-сосудистой систем, особенно при внутрисосудистом введении. Однако при спинальной анестезии применяется низкая доза, следовательно, риск передозировки маловероятно. В случае одновременного применения с другими местными анестетиками могут возникнуть системные токсические реакции, поскольку токсические эффекты являются аддитивными.

Лечение

В случае проведения тотальной спинальной блокады следует обеспечить достаточную вентиляцию легких (проходимость дыхательных путей пациента, обеспечение кислородом, интубация и ИВЛ, если это необходимо). При снижении артериального давления / брадикардии следует ввести сосудосуживающее средство (желательно с инотропным эффектом).

В случае возникновения признаков острой системной токсичности применения местных анестетиков следует немедленно прекратить. Лечение должно быть направлено на поддержание надлежащей вентиляции легких, оксигенации и кровообращения.

Всегда следует обеспечивать поступление кислорода и в случае необходимости проводить искусственную вентиляцию легких (возможно, с гипервентиляцией). В случае возникновения судорог применяют диазепам, а в случае брадикардии - атропин. В случае возникновения циркуляторного шока вводят жидкости, добутамин, а при необходимости - норадреналин (сначала 0,05 мкг / кг / мин, повышая дозу, если нужно, на 0,05 мкг / кг / мин каждые 10 мин), опираясь на результаты мониторинга гемодинамики в более тяжелых случаях. Также можно применять эфедрин. В случае остановки кровообращения могут быть показаны реанимационные мероприятия в течение нескольких часов. Следует корректировать любой ацидоз.

Побочные реакции

Побочные реакции, вызванные самым препаратом, трудно отличить от физиологических эффектов, связанных с блокадой нервных волокон (например, снижение артериального давления, брадикардия, временная задержка мочи), состояний, вызванных непосредственно процедурой (например, спинномозговая гематома) или косвенно иглоочной пункцией (например, менингит, эпидуральный абсцесс), или состояний, связанных с утечкой цереброспинальной жидкости (например, головная боль, развивается после пункции твердой мозговой оболочки).

По информации о симптомах и лечении острой системной токсичности см. раздел «Передозировка».

Таблица 3

Частота	Классы систем органов	побочные реакции
---------	-----------------------	------------------

<p>очень часто (> 1/10)</p>	<p>сердечные расстройства</p> <p>Со стороны желудочно-кишечного тракта</p>	<p>Артериальная гипотензия, брадикардия</p> <p>тошнота</p>
<p>Часточасто (> 1/100; <1/10)</p> <p>(> 1/100; <1/10)</p>	<p>Со стороны нервной системы</p> <p>Со стороны желудочно-кишечного тракта</p> <p>Со стороны почек и мочевыделительной системы</p>	<p>Головная боль, развивается после пункции твердой мозговой оболочки</p> <p>рвота</p> <p>Задержка мочи, недержание мочи</p>
<p>Нечасто (> 1/1000; <1/100)</p>	<p>Со стороны нервной системы</p> <p>Со стороны костно-мышечной системы, соединительной ткани и костей</p>	<p>Парестезии, парез, дизестезия</p> <p>Слабость мышц, боль в спине</p>

редко ($<1/1000$)	Сердечные расстройства	остановка сердца Аллергические реакции, анафилактический шок
	Со стороны иммунной системы	Полная непредсказуемая
	Со стороны нервной системы	спинномозговая блокада, параплегия, паралич, нейропатия,
	Со стороны дыхательной системы	арахноидит угнетение дыхания педиатрическая популяция

Нежелательные реакции на применение препарата у детей сходны с побочными эффектами у взрослых, однако у детей первые признаки токсичности местных анестетиков может быть трудно обнаружить, если блокаду проводят на фоне седации или общей анестезии.

Сообщение о подозреваемых побочные реакции

Сообщение о подозреваемых побочные реакции после регистрации лекарственного средства является важным. Это позволяет продолжать контроль за соотношением польза / риск лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать о любых подозреваемые побочные реакции через национальную систему сообщений.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 ° С. Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость. Добавлять к спинальным растворам другие вещества не рекомендуется.

Упаковка

По 4 мл в ампуле. По 5 ампул в контурной ячейковой упаковке. По 1 контурной ячейковой упаковке в картонной коробке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

Сенекс, Франция.

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

52 Ру Марсель является Жак Гоше, Фонтене-су-Буа, 94120, Франция.

Источник инструкции

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).