Маркаин Спинал Хэви



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Бупивакаин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Форма выпуска:

Раствор для инъекций	**1 мл**	**1 амп.**
бупивакаина гидрохлорид	5 мг	20 мг

4 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (1) - коробки картонные.

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Бупивакаин - местный анестетик амидного типа. При интратекальном введении эффект наступает быстро, а его продолжительность варьирует от средней до длительной. Длительность эффекта зависит от дозы.

Раствор препарата гипербарический и на его распространение в субарахноидальном пространстве влияет сила тяжести. Небольшой объем распределения в интратекальном пространстве приводит к меньшей средней концентрации и уменьшению длительности эффекта препарата по сравнению с изобарическим раствором. Растворы, не содержащие декстрозу, дают менее предсказуемый уровень блокады.

Относительная плотность при температуре 20°C составляет 1.026 (что соответствует 1.021 при температуре 37°C). pH раствора составляет 4.0-6.0.

Бупивакаинобратимо угнетает проведение импульсов по нервному волокну за счет блокирования прохождения ионов натрия через клеточную мембрану.

Фармакокинетика

Бупивакаин имест показатель pKa-8.2 коэффициент разделения 346 (при 25°C в среде н-октанол/фосфатный буфер pH 7.4).

Бупивакаин полностью абсорбируется из субарахноидалыюго пространства; абсорбция носит двухфазный характер, период полувыведения для двух фаз составляет соответственно 50 и 408 минут. Медленная элиминация бупивакаина определяется наличием медленной фазы абсорбции, что объясняет более длительный $T_{1/2}$ после субарахноидалыюго введения по сравнению с внутривенным введением. Концентрация бупивакаина в плазме крови после интратекальной блокады ниже по сравнению с другими видами регионарной анестезии, так как для интратекальной анестезии требуются меньшие дозы препарата. В целом, увеличение максимальной концентрации препарата в плазме крови составляет около 0.4 мкг/мл на каждые введенные 100 мг препарата. Это означает, что доза 20 мг

создает концентрацию в плазме крови приблизительно 0.1 мкг/мл.

После внутривенного введения общий плазменный клиренс бупивакаина составляет 0.58 л/мин, объем распределения в равновесном состоянии 73 л, конечный $T_{1/2}$ 2.7 ч, промежуточный показатель печеночной экстракции около 0.38 после в/в введения. Бупивакаин, главным образом, связывается с α1-кислыми гликопротеипами плазмы (связывание с белками плазмы - 96%). Клиренс бупивакаина практически полностью обусловлен метаболизмом препарата в печени и больше зависит от активности ферментных систем печени, чем от перфузии печени.

Бупивакаин проникает через плацентарный барьер с быстрым достижением равновесия по несвязанной фракции. Степень связывания с белками плазмы в кровотоке плода ниже, чем у матери, что приводит к более низким концентрациям препарата в плазме плода по сравнению с обшей концентрацией препарата в плазме крови матери.

Бупивакаин проникает в грудное молоко в количествах, не представляющих опасности для ребенка.

Бупивакаин подвергается метаболизму в печени, главным образом, путем ароматического гидроксилироваиня до 4-гидрокси-бупивакаина и N-дсалкилирования до РРХ. Обе реакции происходят с участием ферментов цнтохрома Р4503А4. Около 1% бупивакаина экскретируется с мочой в неизменном виде в течение суток после введения, и приблизительно 5% в виде РРХ. Концентрация РРХ и 4-гидрокси-бупнвакаина в плазме во время и после продленного введения бупивакаина низкая по отношению к введенной дозе препарата.

Показания к применению:

Интратекальная анестезия (субарахноидальная, спинальная) при хирургических и акушерских вмешательствах:

— хирургические операции на нижних отделах брюшной полости (включая кесарево сечение), на нижних конечностях (включая тазобедренный сустав);

— при урологических операциях длительностью 1.5-3 ч (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Относится к болезням:

- Анестезия

Противопоказания:

— гиперчувствительность к любому из компонентов препарата или к другим местным анестетикам амидного типа.

Следует принять во внимание общие противопоказания к проведению интратекальной анестезии:

— острые заболевания центральной нервной системы (ЦНС), такие как менингит, полиомиелит, внутричерепное кровоизлияние, а также новообразования ЦНС;

— сужение спинального канала и заболевания позвоночника в фазе обострения (спондилит, опухоль) или недавняя травма (перелом) позвоночника;

— септицемия;

— перниционзная анемия с подострой комбинированной дегенерацией спинного мозга;

— гнойничковое поражение кожи в месте предполагаемой пункции или граничащее с местом пункции;

— кардиогенный или гиповолемический шок;

— нарушение свертываемости крови или сопутствующая антикоагулянтная терапия.

С осторожностью: ослабленным пожилым пациентам или пациентам с тяжелыми сопутствующими заболеваниями, такими как атриовентрикулярная блокада II и III степени, тяжелая печеночная или почечная недостаточность, однако регионарная анестезия является более предпочтительной именно для данных групп пациентов. Пациенты, принимающие антиаритмические препарата III класса (например, амнодарон), нуждаются в тщательном наблюдении и мониторировании ЭКГ из-за возможности развития нежелательных явлений со стороны сердечно-сосудистой системы (см. раздел «Взаимодействие с другими препаратами»).

Существует повышенный риск высокой или полной спинальной блокады у пожилых пациентов и у пациенток на поздних сроках беременности. Поэтому у таких пациентов рекомендуется применять уменьшенные дозы препарата (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Необходимо соблюдать осторожность при проведении интратекальной анестезии у пациентов с неврологическимим заболеваниями, такими как рассеянный склероз, гемиплегия, параплегия и нервно-мышечные расстройства, хотя не

доказано, что интратекальная анестезия приводит к ухудшению состояния при данных заболеваниях. Перед проведением интратекальной анестезине таких случаях необходимо убедиться, что потенциальная польза для пациента превышает возможный риск.

Бупивакаин должен использоваться с осторожностью у пациентов, получающих другие местные анестетики или препараты, структурно сходные с местными анестетиками амидного типа, такими как антиаритмические препараты (например, лидокаин, мексилстин), из-за возможности развития аддитивного токсического эффекта.

Способ применения и дозы:

Интратекально

Взрослые

Приведенные рекомендации являются ориентировочными для среднего взрослого.

При подборе дозы препарата следует основываться на клиническом опыте с учетом физического состояния пациента. Необходимо использовать наименьшую требуемую дозу для адекватной анестезии. Продолжительность анестезии зависит от дозы, в то время как распространение препарата по сегментам предсказать сложно, особенно при применении изобарического (простого) раствора.

Рекомендуемые дозы для препарата Маркаин Спинал Хэви

Уровень анестезии	Доза мл мг		Начало действия, мин	Длительность действия, ч
Показания: урологические операции.	1.5-3	7.5-15	5-8	2-3
Показания: операции на нижних конечностях, в том числе бедре, в нижних отделах брюшной полости (включая кесарево сечение)	2-4	10-20	5-8	1.5-3

Рекомендуемая область введения - ниже L3.

У пожилых пациентов и пациенток на поздних сроках беременности рекомендуется использовать уменьшенную дозу препарата.

Дети (с весом до 40 кг)

Маркаин Спинал Хэви может применяться у детей. Разница между детьми и взрослыми состоит в том, что у новорожденных и младенцев объем спинномозговой жидкости относительно большой, поэтому им требуется более высокая доза в расчете на кг массы тела чем взрослым, для достижения такого же уровня блокады как у взрослых.

Рекомендуемые дозы Маркаина Спинал Хэви у детей

Масса тела, кг	Доза, мг/кг
<5	0.4-0.5
5-15	0.3-0.4
15-40	0.25-0.3

Побочное действие:

Побочные реакции на Маркаин Спинал Хэви аналогичны побочным реакциям, возникающим при интратекальном введении других местных анестетиков длительного действия. Побочные реакции, вызванные самим препаратом, трудно отличить от физиологических проявлений блокады нервов (например, артериальная гипотензия,

брадикардия, временная задержка мочи), реакций, вызванных непосредственно (например, спинальная гематома) или косвенно (например, менингит, эпидуральный абсцесс) введением иглы, или реакций, связанных с утечкой спиномозговой жидкости (например, постпункционная головная боль).

Очень частые (>1/10)	*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* артериальная гипотензия, брадикардия *Со стороны ЖКТ:* тошнота
Частые (>1/100, <1/10)	*Со стороны нервной системы:* постпункционная головная боль *Со стороны ЖКТ:* рвота *Со стороны мочеполовой системы:* задержка мочи, недержание мочи
Менее частые (>1/1000, <1/100)	*Со стороны нервной системы:* парестезия, парез, дизестезия *Со стороны опорно-двигательной системы:* мышечная слабость, боль в поясничной области
Редкие (<1/1000)	*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* остановка сердца *Со стороны нервной системы:* тотальный спинальный блок, параплегия, паралич, нейропатия, арахноидит *Со стороны дыхательной системы:* угнетение дыхания *Общие:* аллергические реакции, в наиболее тяжелых случаях - анафилактический шок.

Передозировка:

Острая системная токсичность

Применение Маркаппа Спинал Хэви в соответствии с рекомендациями не приводит к такой концентрации препарата в плазме, при которой могут возникнуть системные токсические проявления. Однако при использовании Маркаина Спинал Хэви в комбинации с другими местными анестетиками может развиться острая системная токсичность за счет
суммирования токсических эффектов.

Подобно другим местным анестетикам, бупивакаин может вызывать острые токсические реакции со стороны центральной нервной и сердечно-сосудистой систем, если его использование для местной анестезии приводит к высокой концентрации препарата в крови. Особенно это может проявиться в случае непреднамеренного внутрисосудистого введения. На фоне высокой концентрации бупивакаина в плазме были зафиксированы случаи возникновения желудочковой аритмии, фибрилляции желудочков, внезапного сердечнососудистого коллапса и смерти. Однако дозы, обычно используемые для интратекальной анестезии, не приводят к высокой системной концентрации препарата.

Со стороны ЦНС

При применении бупивакаина интоксикация проявляется постепенно в виде признаков и симптомов нарушения функции центральной нервной системы с нарастающей степенью тяжести. Начальными проявлениями интоксикации являются: парестезия вокруг рта, головокружение, онемение языка, патологически повышенное восприятие обычных звуков и шум в ушах. Нарушение функции зрения и тремор являются более серьезными признаками и предшествуют развитию генерализованных судорог. Эти явления не следует ошибочно расценивать как невротическое поведение. Вслед за ними возможна потеря сознания и развитие больших судорожных припадков, которые могут длиться от нескольких секунд до нескольких минут. Вследствие повышенной мышечной активности, нарушения нормального процесса дыхания после начала судорог быстро появляются гипоксия и гиперкапния. В тяжелых случаях может развиваться апноэ. Ацидоз усиливает токсический эффект местных анестетиков.

Данные явления проходят за счет перераспределения местного анестетика из центральной нервной системы и метаболизма препарата. Купирование токсических явлений может наступать быстро, если только анестетик не был введен в очень большом количестве.

Лечение острой системной токсичности

При появлении первых признаков острой системной токсичности или тотального спинального блока следует немедленно прекратить введение препарата и проводить симптоматическую терапию сердечно-сосудистых и неврологических (судороги, угнетение ЦНС) нарушений.

В случае остановки сердца следует немедленно прибегнуть к сердечно-легочной реанимации. Жизненно важно поддерживать вентиляцию легких, кровообращение и адекватную оксигенацию, а также проводить коррекцию

ацидоза.

При угнетении деятельности сердечно-сосудистой системы (артериальная гипотензия, брадикардия) необходимо внутривенное введение 5-10 мг эфедрина, которое при необходимости можно повторить через 2-3 мин. Детям следует вводить дозу эфедрина в соответствие с их возрастом и весом.

При появлении судорог следует проводить терапию, направленную на поддержание деятельности сердечно-сосудистой системы, обеспеченно адекватной оксигенации купирование судорог. При необходимости следует обеспечить подачу кислорода и искусственную вентиляцию легких (с помощью мешка Амбу или интубации трахеи). Если в течение 15-20 секунд судороги не прекращаются самостоятельно, следует использовать противосудорожные средства: тиопентал натрия 1-3 мг/кг в/в обеспечивает быстрое купирование судорог, можно использовать 0.1 мг/кг диазепама в/в (действие развивается более медленно по сравнению с действием тиопентала). Длительные судороги могут препятствовать вентиляции и оксигенации. В таких случаях для быстрого купирования судорог можно прибегнуть к интубации трахеи и введению миорелаксанта (например, сукцинилхолин 1 мг/кг).

Применение при беременности и кормлении грудью:

Беременность

Бупивакаин применялся у большого количества беременных женщин и женщин детородного возраста. Влияния препарата на репродуктивную функцию или повышение частоты пороков развития отмечено не было (см. раздел «Фармакокинетика»). У пациенток на поздних сроках беременности рекомендуется использовать уменьшенные дозы препарата (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Лактация

Бупивакаин проникает в грудное молоко в количествах, не представляющих опасности для ребенка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Бупивакаин должен использоваться с осторожностью у пациентов, получающих другие местные анестетики или препараты, которые сходны по структуре с местными анестетиками амидного типа, такими как антиаритмические препараты (например, лидокаин, мексилетин), из-за возможности развития аддитивного токсического эффекта. Совместное применение бупивакаина с антиаритмическими препаратами класса III (например, амиодароном) отдельно не изучалось, однако рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном назначении этих препаратов (см. также раздел «Особые указания»).

При обработке места инъекции местного анестетика дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции виде болезненности и отека.

При совместном применении с препаратами, угнетающими ЦНС, местные анестетики усиливают угнетение ЦНС.

Ингибиторы моноаминооксидазы или трициклические антидепрессанты совместно с бупивакаином повышают риск развития выраженного повышения артериального давления. Сочетание бупивакина с общей ингаляционной анестезией галотаном увеличивается риск развития аритмии.

Несовместимость

Не рекомендуется смешивать растворы для интратекальной анестезии с другими препаратами.

Особые указания и меры предосторожности:

Интратекальная анестезия должна проводиться только под контролем опытного специалиста в соответствующим образом оборудованной операционной.

Лекарственные препараты и медицинское оборудование для реанимационных мероприятий должны быть подготовлены к использованию. До начала интратекальной анестезии должен быть обеспечен венозный доступ, например в виде венозного катетера.

Персонал, проводящий анестезию, должен быть соответствующим образом подготовлен и обучен диагностике и лечению возможных побочных эффектов, системных токсических реакций или других возможных осложнений (см. раздел «Передозировка»).

Подобно другим местным анестетикам, бупивакаин может вызывать острые токсические реакции со стороны центральной нервной и сердечно-сосудистой систем, если его использование для местной анестезии приводит к высокой концентрации препарата в крови. Особенно это может проявиться в случае непреднамеренного внутрисосудистого введения. На фоне высокой концентрации бупивакаина в плазме были зафиксированы случаи

возникновения желудочковой аритмии, фибрилляции желудочков, внезапного сердечнососудистого коллапса и смерти. Однако дозы, обычно используемые для интратекальной анестезии, не приводят к высокой системной концентрации препарата.

Редкая, но в тоже время серьезная побочная реакция, которая может развиться при спинальной анестезии, - это высокая или полная спинальная блокада, приводящая к угнетению деятельности сердечно-сосудистой и дыхательной систем. Расстройства со стороны сердечно-сосудистой системы вызваны обширной симпатической блокадой, которая может привести к гипотензии, брадикардии и даже остановке сердца. Блокада иннервации дыхательных мышц, в том числе диафрагмы, вызывает нарушение дыхания. У пациентов с гиповолемией во время интратекальной анестезии может развиться выраженная артериальная гипотензия независимо от используемого местного анестетика. Артериальная гипотензия, которая обычно возникает у взрослых после интратекальной блокады, редко отмечается у детей в возрасте до 8 лет.

Повреждение нервных окончаний является редким осложнением интратекальной анестезии и может привести к парестезии, анестезии, мышечной слабости и параплегии. Изредка эти нарушения носят постоянный характер.

Маркаин Спинал Хэви не содержит консервантов, ампула предназначена для однократного использования. Остатки раствора должны выбрасываться.

Поскольку в состав препарата Маркаин Спинал Хэви входит декстроза, при автоклавировании возможна карамелизация, в связи с чем, не рекомендуется повторная стерилизация.

При нарушениях функции почек

С осторожностью: тяжелая почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

С осторожностью: тяжелая печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью: ослабленные пожилые пациенты. Существует повышенный риск высокой или полной спинальной блокады у пожилых пациентов. Поэтому у таких пациентов рекомендуется применять уменьшенные дозы препарата (см. раздел «Способ применения и дозы»).

Условия хранения:

Хранить при температуре 2-25°С. Не замораживать. Хранить в местах, недоступных для детей.

Срок годности:

3 года.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

Источник: http://drugs.thead.ru/Markain_Spinal_Hevi