Наропин



Код АТХ:

- N01BB09

Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Ропивакаин

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 прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	2 мг	20 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	2 мг	40 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	7.5 мг	75 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	7.5 мг	150 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	10 мг	100 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	10 мг	200 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 конт.**
ропивакаина гидрохлорид	2 мг	200 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

100 мл - контейнеры полипропиленовые.

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 конт.**
ропивакаина гидрохлорид	2 мг	400 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

200 мл - контейнеры полипропиленовые.

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	5 мг	100 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный.

	1 мл	**1 амп.**
ропивакаина гидрохлорид	5 мг	50 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, хлористоводородная кислота или натрия гидроксид (до pH 4-6), вода д/и.

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

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Местный анестетик амидного типа длительного действия. Обратимо блокирует вольтаж-зависимые натриевые каналы и, таким образом, препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению импульсов по нервным волокнам.

Продолжительность действия зависит от пути введения и дозы препарата.

Фармакокинетика

Всасывание

После введения ропивакаин полностью абсорбируется из эпидурального пространства. Абсорбция носит двухфазный характер. Концентрация ропивакаина в плазме крови зависит от дозы, пути введения и васкуляризации области инъекции. Фармакокинетика ропивакаина линейная, C_{max} пропорциональна вводимой дозе.

Распределение

pKa ропивакаина равно 8.1; коэффициент распределения - 141 (n-октанол/фосфатный буфер pH 7.4).

V_d составляет 47 л. Полученный в эксперименте средний показатель печеночной экстракции - 0.4. Ропивакаин связывается в плазме крови в основном с α_1-кислыми гликопротеинами, несвязанная фракция - около 6%.

Длительное эпидуральное введение ропивакаина приводит к повышению общего содержания ропивакаина в плазме крови, что обусловлено послеоперационным увеличением уровня α_1-кислых гликопротеинов в крови. При этом концентрация несвязанной, фармакологически активной, формы ропивакаина в плазме крови меняется в гораздо меньшей степени, чем общая концентрация.

Ропивакаин хорошо проходит через плацентарный барьер. Связывание с белками плазмы крови у плода ниже, чем у матери.

Метаболизм

Активно биотрансформируется в организме, главным образом путем гидроксилирования. Основной метаболит - 3-гидрокси-ропивакаин.

Выведение

$T_{1/2}$ имеет двухфазный характер и составляет 14 мин (α-фаза) и 4 ч (β-фаза). Общий плазменный клиренс - 440 мл/мин. После в/в введения около 86% дозы выводится с мочой, главным образом в виде метаболитов, и только около 1% дозы выводится с мочой в неизмененном виде. Около 37% 3-гидрокси-ропивакаина выводится с мочой в основном в конъюгированной форме.

Показания к применению:

Анестезия при хирургических вмешательствах:

— эпидуральная блокада при хирургических вмешательствах, включая кесарево сечение;

— блокада крупных нервов и нервных сплетений;

— блокада отдельных нервов и местная инфильтрационная анестезия.

Купирование острого болевого синдрома:

— длительная эпидуральная инфузия или периодическое болюсное введение, например для устранения послеоперационной боли или обезболивания родов;

— блокада отдельных нервов и местная инфильтрационная анестезия.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Инфильтраты

Противопоказания:

— повышенная чувствительность к местным анестетикам амидного типа.

Способ применения и дозы:

Перед проведением анестезии необходимо провести оценку общего и физического состояния больного для выбора

оптимальной дозы препарата.

Для взрослых дозы, рекомендуемые для наиболее распространенных блокад, приводятся в таблице. В целом для анестезии при хирургических вмешательствах (например, при эпидуральном введении) требуются более высокие дозы препарата и более концентрированные растворы; для обезболивания (например, эпидуральное введение для купирования острого болевого синдрома) рекомендуется использовать более низкие дозы и концентрации препарата.

Анестезия при хирургических вмешательствах

Концентрация препарата (мг/мл)	Объем раствора (мл)	Доза (мг)	Начало действия (мин)	Длительность действия (ч)
Эпидуральная анестезия на поясничном уровне:				
хирургические вмешательства				
7.5	15-25	113-188	10-20	3-5
10	15-20	150-200	10-20	4-6
кесарево сечение				
7.5	15-20	113-150	10-20	3-5
Эпидуральная анестезия на грудном уровне:				
например, послеоперационная обезболивающая блокада				
7.5	5-15	38-113	10-20	-
Блокада крупных нервных сплетений:				
например, блокада плечевого сплетения				
7.5	10-40	75-300	10-25	6-10
Проводниковая и инфильтрационная анестезия:				
7.5	1-30	7.5-225	1-15	2-6

Купирование острого болевого синдрома

Концентрация препарата (мг/мл)	Объем раствора (мл)	Доза (мг)	Начало действия (мин)	Длительность действия (ч)
Эпидуральное введение на поясничном уровне:				
болюсное введение				
2.0	10-20	20-40	10-15	0.5-1.5
многократное введение (например, для обезболивания родов), минимальный интервал - 30 мин				
2.0	10-15	20-30	-	-
продленная инфузия для обезболивания родов				
2.0	6-10 мл/ч	12-20 мг/ч	-	-
продленная инфузия для послеоперационного обезболивания				
2.0	6-14 мл/ч	12-28 мг/ч	-	-
Эпидуральное введение на грудном уровне:				
продленная инфузия (например, для послеоперационного обезболивания)				
2.0	6-14 мл/ч	12-28 мг/ч	-	-
Проводниковая блокада и инфильтрация:				
2.0	1-100	2-200	1-5	2-6

Дозы, указанные в таблице, считаются достаточными для выполнения надежной блокады у взрослых, однако табличные данные являются ориентировочными (т.к. существует индивидуальная вариабельность скорости развития блока и его длительности).

До введения и во время введения препарата (которое следует проводить медленно или путем увеличения последовательно вводимых доз со скоростью 25-50 мг/мин) для предотвращения попадания раствора в сосуд следует тщательно проводить аспирационную пробу. Случайное внутрисосудистое введение распознается по увеличению ЧСС, а случайное интратекальное введение по признакам спинальной блокады. При появлении симптомов интоксикации следует немедленно прекратить введение препарата. При эпидуральной блокаде во время операции однократное введение ропивакаина в дозе до 250 мг обычно хорошо переносится.

При проведении продолжительной блокады путем длительной инфузии или повторного болюсного введения следует учитывать возможность создания токсических концентраций анестетика в крови и местного повреждения нерва.

Установлено, что суммарная доза 800 мг ропивакаина, полученная в течение 24 ч, а также длительная эпидуральная инфузия со скоростью 28 мг/ч в течение 72 ч хорошо переносятся взрослыми.

Для *купирования послеоперационной боли* рекомендуется следующая схема применения препарата: если

эпидуральный катетер не был установлен при оперативном вмешательстве, то после его установки выполняется эпидуральная блокада Наропином (7.5 мг/мл). Анальгезия поддерживается инфузией Наропина (2 мг/мл). Инфузия со скоростью 6-14 мл/ч (12-28 мг/ч) обеспечивает адекватную анальгезию с незначительной и непрогрессирующей двигательной блокадой. Данная методика позволяет в значительной степени уменьшить потребность в опиоидных анальгетиках. В клинических исследованиях показано, что при послеоперационном обезболивании эпидуральная инфузия Наропина (2 мг/мл) без фентанила или в смеси с ним (1-4 мкг/мл) может проводиться непрерывно в течение 72 ч. В последнем случае следует учитывать появление эффектов, связанных со стимуляцией опиоидных рецепторов.

Использование Наропина в концентрации свыше 7.5 мг/мл при кесаревом сечении не документировано.

Побочное действие:

Аллергические реакции: кожные реакции, анафилактический шок.

Большинство побочных эффектов, возникающих при анестезии, связано не с воздействием используемого анестетика, а с техникой проведения регионарной анестезии. Наиболее часто (>1%) отмечались следующие неблагоприятные эффекты, которые были расценены как имеющие клиническое значение вне зависимости от того, была ли установлена причинно-следственная связь с использованием анестетика.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: артериальная гипертензия, артериальная гипотензия, брадикардия, тахикардия.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, парестезии.

Невропатия и нарушения функции спинного мозга (синдром передней спинальной артерии, арахноидит) обычно связаны с техникой проведения регионарной анестезии, а не с действием препарата.

Прочие: повышение температуры тела, озноб, задержка мочеиспускания.

Профиль побочных эффектов при применении Наропина аналогичен таковому при применении других местных анестетиков амидного типа. При правильном использовании препарата побочные эффекты встречаются весьма редко.

Передозировка:

Симптомы: случайное внутрисосудистое введение анестетика может вызвать симптомы интоксикации, проявляющиеся немедленно или в отсроченный период.

Попадание избыточных количеств препарата в системный кровоток оказывает угнетающее действие на ЦНС и миокард (снижает возбудимость и автоматизм, ухудшает проводимость).

Неврологические проявления носят дискретный характер. Сначала появляются расстройства зрения и слуха, дизартрия, повышение мышечного тонуса, мышечные подергивания. При прогрессировании интоксикации возможны потеря сознания, приступы судорог продолжительностью от нескольких секунд до нескольких минут, что сопровождается быстрым развитием гипоксии и гиперкапнии и нарушением дыхания, вплоть до его остановки в тяжелых случаях. Респираторный и метаболический ацидоз потенцируют токсические эффекты анестетика.

Впоследствии из-за перераспределения анестетика из ЦНС и его последующего метаболизма и экскреции происходит восстановление функций, которое может произойти достаточно быстро, если только препарат не был введен в высокой дозе.

Нарушения функции сердечно-сосудистой системы в виде артериальной гипотензии и аритмии обычно следуют за начальными проявлениями неврологических нарушений, если только больному не проводится общий наркоз или не было премедикации бензодиазепинами или барбитуратами.

Лечение: при появлении первых признаков системной интоксикации следует немедленно прекратить введение препарата. При судорогах следует поддерживать адекватное поступление кислорода с помощью мешка или маски. Если спустя 15-20 сек судороги не прекращаются, следует использовать противосудорожные средства (в/в 100-120 мг тиопентала или 5-10 мг диазепама; после интубации и начала ИВЛ можно вводить суксаметоний). При угнетении деятельности сердечно-сосудистой системы (артериальная гипотензия, брадикардия) необходимо ввести в/в эфедрин в дозе 5-10 мг, при необходимости через 2-3 мин повторить введение. При остановке сердца следует проводить стандартные реанимационные мероприятия. Необходимо поддерживать оптимальный газовый состав крови с одновременной коррекцией ацидоза.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Наропин можно применять при беременности только в том случае, если это оправдано клинической ситуацией. Однако в акушерстве использование препарата для анестезии или анальгезии хорошо обосновано.

Ропивакаин в небольшом количестве может проникать в грудное молоко, что следует учитывать при необходимости применения препарата в период лактации (грудного вскармливания).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении Наропина с другими местными анестетиками или препаратами, структурно схожими с местными анестетиками амидного типа, токсические эффекты могут суммироваться.

Фармацевтическое взаимодействие

Повышение pH раствора выше 6.0 может привести к образованию преципитата из-за плохой растворимости ропивакаина в этих условиях.

Особые указания и меры предосторожности:

Процедура регионарной анестезии должна проводиться опытными специалистами. Обязательно наличие оборудования и лекарственных препаратов для проведения реанимационных мероприятий. До начала выполнения больших блокад должны быть установлены в/в катетеры.

С осторожностью следует вводить препарат больным с тяжелыми сопутствующими заболеваниями (в т.ч. с частичной или полной блокадой сердца, прогрессирующим циррозом печени, значительным нарушением функции почек). Для снижения риска развития тяжелых побочных эффектов необходимо предварительное лечение сопутствующих заболеваний перед проведением больших блокад, а также коррекция используемой дозы анестетика. У больных с тяжелыми заболеваниями печени препарат следует применять с осторожностью; в некоторых случаях из-за нарушения элиминации может возникнуть необходимость уменьшения доз при повторных введениях препарата. Обычно у больных с нарушениями функции почек при однократном введении препарата или при кратковременной инфузии не требуется коррекции доз. Однако часто развивающиеся у больных с хронической почечной недостаточностью ацидоз и снижение концентрации белков в плазме крови могут повышать риск системного токсического действия препарата. В таких случаях дозы препарата должны быть снижены.

Использование в педиатрии

Не рекомендуется применять Наропин у **детей в возрасте до 12 лет** ввиду отсутствия достаточного количества клинических наблюдений.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

Применение Наропина может приводить к временному нарушению двигательных функций, координации движений и скорости психомоторных реакций.

Период времени, через который можно заниматься потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенного внимания, устанавливают индивидуально.

При нарушениях функции почек

С осторожностью следует вводить препарат больным со значительным нарушением функции почек.

При нарушениях функции печени

С осторожностью следует вводить препарат больным с тяжелыми прогрессирующим циррозом печени.

Применение в детском возрасте

Не рекомендуется применять Наропин у **детей в возрасте до 12 лет** ввиду отсутствия достаточного количества клинических наблюдений.

Условия хранения:

Список Б. Препарат следует хранить при температуре не выше 30°C; не замораживать. Срок годности препарата в пластиковых ампулах - 3 года, в пластиковых инфузионных мешках – 2 года.

Условия отпуска из аптек

Препарат отпускается по рецепту.

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