Ропивакаин Каби



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, 2 мг/мл. По 10 или 20 мл в ампулы полипропиленовые. По 1 амп. могут помещать в контурную ячейковую упаковку из поликарбоната/ПЭ.

По 5 амп. в контурной ячейковой упаковке или без нее помещают в пачку картонную.

По 100 или 200 мл в полимерной упаковке типа «Фрифлекс®», состоящей из первичного (внутреннего) контейнера с препаратом и защитного наружного мешка. Первичный контейнер снабжен двумя портами.

По 5 мешков помещают в пачку картонную.

Раствор для инъекций, 5 мг/мл. По 10 мл в ампулы полипропиленовые. По 1 амп. могут помещать в контурную ячейковую упаковку изполикарбоната/ПЭ.

По 5 амп. в контурной ячейковой упаковке или без нее помещают в пачку картонную.

Раствор для инъекций, 7,5 мг/мл, 10 мг/мл. По 10 или 20 мл в ампулы полипропиленовые. По 1 амп. могут помещать в контурную ячейковую упаковку из поликарбоната/ПЭ.

По 5 амп. в контурной ячейковой упаковке или без нее помещают в пачку картонную.

Состав:

Раствор для инъекций	1 мл
Состав см. таблицу 1	

Таблица 1

Компонент	Ропивакаин Каби, раствор для инъекций

	2 мг/мл	5 мг/мл	7,5 мг/мл	10 мг/мл
Активное вещество				
Ропивакаина гидрохлорид*	2 мг	5 мг	7,5 мг	10 мг
Вспомогательные вещества				
Натрия хлорид	8,62 мг	8,06 мг	7,59 мг	7,12 мг
Хлористоводородная кислота	q.s. до pH 4–6			
Натрия гидроксид	q.s. до pH 4–6			
Вода для инъекций	до 1 мл			

*В виде ропивакаина гидрохлорида моногидрата в соответствии с результатами анализа серии, используемой в производстве.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакологическое действие — местноанестезирующее.

Фармакодинамика

Местный анестетик амидного типа длительного действия, являющийся чистым энантиомером. Обладает как анестезирующим, так и обезболивающим действием. Обратимо блокируя потенциалзависимые Na^+-каналы, препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению импульсов по нервным волокнам. Высокие концентрации препарата применяются для местной анестезии при хирургических вмешательствах. Попадая в системный кровоток в низких концентрациях, может вызвать сенсорный блок (анальгезию) с минимальным и непрогрессирующим моторным блоком, попадая в избыточных количествах, оказывает угнетающее действие на ЦНС и миокард (снижает его возбудимость, автоматизм и проводимость). На длительность и интенсивность блокады, вызванной ропивакаином, эпинефрин практически не влияет.

Признаки токсичности со стороны ЦНС предшествуют признакам токсичности со стороны сердечно-сосудистой системы, т.к. наблюдаются при более низких концентрациях препарата в плазме. Ропивакаин имеет широкий терапевтический диапазон (диапазон между дозами, оказывающими терапевтическое и токсическое действие). В исследованиях in vivo на животных показано, что ропивакаин оказывает меньшее токсическое действие на миокард по сравнению с бупивакаином. Непрямые сердечно-сосудистые эффекты (артериальная гипотензия, брадикардия) могут возникать после эпидуральпого введения ропивакаина и обусловлены возникающей симпатической блокадой.

Начало и длительность анестезии препаратом Ропивакаин Каби зависят от концентрации и места введения препарата.

Фармакокинетика

Концентрация ропивакаина в плазме зависит от дозы, пути введения и степени васкуляризации области инъекции. Фармакокинетика - линейная, C_{max} пропорциональна введенной дозе. После эпидурального введения ропивакаин полностью абсорбируется в кровь. Абсорбция носит двухфазный характер, $T_{1/2}$ для каждой из фаз составляет, соответственно, 14 мин и 4 ч. Замедление элиминации ропивакаина определяется медленной абсорбцией, что объясняет более длительный $T_{1/2}$ после эпидурального введения по сравнению с в/в введением. Общий плазменный клиренс ропивакаина - 440 мл/мин, плазменный клиренс несвязанного вещества - 8 л/мин, почечный клиренс - 1 мл/мин, V_d в равновесном состоянии - 47 л, показатель печеночной экстракции около 0.4, $T_{1/2}$ - 1.8 ч. Ропивакаин интенсивно связывается с белками плазмы крови (главным образом с альфа1-кислыми гликопротеинами), несвязанная фракция ропивакаина составляет около 6%. Длительное эпидуралыюе введение ропивакаина после хирургических операций приводит к повышению концентрации препарата в плазме, что обусловлено увеличением концентрации кислых гликопротеинов в крови, при этом концентрация несвязанной, фармакологически активной формы ропивакаина в плазме меняется в гораздо меньшей степени, чем общая концентрация ропивакаина.

Ропивакаин хорошо проникает через плацентарный барьер с быстрым достижением равновесия по несвязанной фракции. Связь с белками плазмы крови у плода меньше, чем у матери, что приводит к более низким концентрациям препарата в плазме плода по сравнению с обшей концентрацией препарата в плазме крови матери. Ропивакаин активно метаболизируется в организме, главным образом путем ароматического гндроксилирования. Основные метаболиты: 3-гидроксиропивакаин: 4-гидроксиропивакаин, N-дезалкилированные метаболиты и 4-гидроксидезалкилированный ропивакаин, 3-гидроксиропивакаин (конъюгированный и неконъюгированный) обнаруживается в плазме 3-гидрокси- и 4-гидроксиропивакаин обладают более слабым местноанестезирующим действием по сравнению с ропивакаином. После в/в введения 86% ропивакаина выводится с мочой (лишь 1% в неизмененном виде). Около 37% 3-гидроксиропивакаина, основного метаболита ропивакаина, выводится с мочой (в основном в конъюгированной форме).

1-3% ропивакаина выводится с мочой в виде метаболитов: 4-гидроксиропивакаина N-дезалкилированных метаболитов и 4-гидроксидезалкилированного ропивакаина. Нет данных о рацемизации ропивакаина in vivo.

Показания к применению:

В концентрации 7.5 мг/1 мл и 10 мг/1 мл Ропивакаин Каби применяют v взрослых и детей старше 12 лет по следующим показаниям:

Анестезия при хирургических вмешательствах:

— эпидуральная блокада при хирургических вмешательствах, включая кесарево сечение;

— блокада крупных нервов и нервных сплетений;

— блокада отдельных нервов и инфильтрационная анестезия.

Внутрисуставная инъекция при артроскопии коленного сустава.

В концентрации 2 мг/1 мл Ропивакаин Каби применяют по следующим показаниям:

Купирование острого болевого синдрома у взрослых и детей старше 12 лет.

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

— блокада отдельных нервов и инфильтрационная анестезия;

— продленная блокада периферических нервов путем инфузии или болюсных инъекций (при послеоперационной боли).

Купирование острого болевого синдрома у детей от 1 года до 12 лет (включительно):

— однократная и продленная блокада периферических нервов.

У новорожденных и детей до 12 летнего возраста (включительно);

— каудальная эпидуральная блокада;

— продленная эпидуральная инфузия.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Артрит
- Артроз
- Инфильтраты

Противопоказания:

— гиперчувствительность к действующему веществу, к любому из вспомогательных веществ или другим местным анестетикам амидного типа;

— также необходимо учитывать общие противопоказания для каждого конкретного вида анестезии, независимо от используемого анестетика;

— препарат Ропивакаин Каби противопоказан для в/в регионарной анестезии "большой" блокады у пациентов с гиповолемией и парацервикальной анестезии в акушерстве.

С осторожностью

Пожилые пациенты, пациенты в ослабленном состоянии или пациенты с тяжелыми сопутствующими заболеваниями, в т.ч. блокады внутрисердечной проводимости II и III степени (синоатриальная, атриовентрикулярная, внутрижелудочковая), прогрессирующие заболевания печени, тяжелая печеночная недостаточность, тяжелая хроническая почечная недостаточность, острая порфирия, при терапии гиповолемии, ослабленные пациенты, пожилой возраст, детский возраст, беременность и в период лактации.

Для данных групп пациентов предпочтительно применение регионарной анестезии. При проведении "больших" блокад с целью снижения риска развития тяжелых неблагоприятных явлений рекомендуется предварительно

стабилизировать состояние пациента, а также скорректировать дозу анестетика.

Следует соблюдать осторожность при инъекции местных анестетиков в области головы и шеи, в связи с возможной повышенной частотой развития серьезных нежелательных явлений.

Пациентам, находящимся на диете с ограничением натрия необходимо учитывать содержание натрия в препарате.

Способ применения и дозы:

Препарат применяется для периневрального введения (спинальной и проводниковой анестезии).

Ропивакаин Каби должен вводиться только специалистами, имеющими достаточный опыт проведения местной анестезии или под их наблюдением, при наличии оборудования и лекарственных препаратов для проведения реанимационных мероприятий.

Взрослые и **дети старше 12 лет**

В целом для анестезии при хирургических вмешательствах требуются более высокие дозы и более концентрированные растворы препарата, чем при использовании анестетика с целью обезболивания. Для анальгезии (например, эпидуральное введение для подавления острой боли) рекомендуются более низкие концентрации и дозы и обычно рекомендована доза 2 мг/1 мл. Для внутрисуставного введения рекомендована доза 7.5 мг/1 мл. Ропивакаин Каби 10 мг/1 мл рекомендуется для эпидуральной анестезии, когда полная моторная блокада является необходимой для операций.

Нижеследующие таблицы представляют собой руководство но подбору дозировки для более часто используемых блокад. Должна использоваться минимальная дозировка, достаточная для образования эффективной блокады. При принятии решения о выборе дозы, важен опыт клинического специалиста и знание физического состояния пациента.

Таблица 1. Рекомендации по дозированию препарат Ропивакаин Каби **для взрослых и детей старше 12 лет**

Приведенные в таблице 1 дозировки считаются достаточными для проведения успешной блокады и должны служить руководством для применения у взрослых пациентов, т.к. существуют индивидуальные отклонения во времени проведения блокады и ее продолжительности. Значения в колонке "Доза" отражают ожидаемый диапазон усредненных необходимых доз.

Рекомендации по дозированию препарата Ропивакаин Каби **для взрослых и детей старше 12 лет:**

	Концентрация препарата(мг/мл)	Объем раствора (мл)	Доза (мг)	Начало действия (мин)	Длительность действия (ч)
Анестезин при хирургических вмешательствах:					
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[1]	10-20	3-5
Эпндуральпая анестезия па грудном уровне					
Послеоперационная обезболивающая блокада и хирургические вмешательства	7.5	5-15	38-113	10-20	н/д[2]
Блокада крупных нервных сплетений					
Например, блокада плечевого сплетения*	7.5	30-40	225-300	10-25	6-10
Проводниковая и инфильтрационная анестезия	7.5	1-30	7.5-225	1-15	2-6
Купирование острого болевого синдрома					
Эпидуральное введение на поясничном уровне					
Болюс	2.0	10-20	20-40	10-15	0.5-1.5
Периодическое введение (например, при обезболивании родов)	2.0	10-15 (минимальный интервал 30 мин)	20-30		
Продленная инфузия для:					
обезболивание родов	2.0	6-10 мл/ч	12-20 мг/ч	н/д	н/д
послеоперационного обезболивания	2.0	6-14 мл/ч	12-28 мг/ч	н/д	н/д
Блокада периферических нервов					
Например, блокада	2.0	5-10 мл/ч	10-20 мг/ч	н/д	н/д

бедренного нерва или межлестничная блокада (продленные инфузии или повторные инъекции)					
Эпидуральное введение на грудном уровне					
Продленная инфузия (например, для пос леоперационного обезболивания)	2.0	6-14 мл/ч	12-28 мг/ч	н/д	н/д
Проводниковая блокада и инфильтрационная анестезия	2.0	1-100 мл/ч	2-200	1-5	2-6
Внутрисуставное введение					
Артроскопия коленного сустава**	7.5	20	150***	н/д	2-6

* Дозировка для проводниковой анестезии должна уточняться в соответствии с местом применения и состоянием пациента. Лестничная и надключичная блокады плечевого сплетения могут приводить к более высокой частоте появления побочных реакции, независимо от применяемого местного анестетика.

** Сообщалось о случаях хондролиза при послеоперационной продленной внутрисуставной инфузии местных анестетиков. Ропивакаин Каби не следует применять для длительного внутрисуставного введения.

*** Если Ропнвакаин Каби дополнительно применялся для других видов анестезии, максимальная доза не должна превышать 225 мг.

[1] - Должно использоваться пошаговое дозирование, начальная доза около 100 мг (97.55 мг=13 мл, 105 мг=14 мл) и вводиться в течение 3-5 мин. Две дополнительные дозы, суммарно дополнительно 50 мг, могут быть введены при необходимости.

[2] - Н/д = не действительно.

Для ознакомления с факторами, влияющими на метод выполнения отдельных блокад, и с требованиями, предъявляемыми к конкретным группам пациентов, следует использовать стандартные руководства.

Для предотвращения попадания анестетика в сосудистое русло следует обязательно проводить аспирационную пробу до введения и в процессе введения препарата. При необходимости введения большой дозы препарата, рекомендуется введение испытательной дозы 3-5 мл лидокаина с эпинефрином. Случайное внутрисосудистое введение распознается по временному увеличению ЧСС, а случайное интратекальное введение - по признакам спинального блока. В случае возникновения токсических симптомов, введение препарата следует немедленно прекратить.

Аспирацию необходимо проводить до введения и во время введения основной дозе, которую необходимо вводить медленно либо пошагово, на уровне 25-50 мг/мин, внимательно наблюдая за жизненными функциями пациента и поддерживая с ним вербальный контакт.

Однократное введение препарата Ропивакаин Каби при эпидуральной блокаде для проведения хирургического вмешательства в дозе до 250 мг обычно хорошо переносится пациентами.

При блокаде плечевого сплетения с помощью 40 мл препарата Ропивакаин Каби 7.5 мг/1 мл максимальные плазменные концентрации ропивакаина у некоторых пациентов могут достигать значения, характеризующегося легкими симптомами токсичности со стороны ЦНС. Поэтому применение дозы выше 40 мл препарата Ропивакаин Каби 7.5 мг/1 мл (300 мг ропивакаина) не рекомендовано.

При использовании длительной блокады либо путем непрерывной инфузии, либо путем повторяющегося болюсного введения, должны приниматься во внимание риски достижения токсической концентрации в плазме или возникновение местного повреждения нерва. Введение ропнвакаина в течение 24 ч в дозе до 800 мг суммарно при хирургических вмешательствах и для послеоперационного обезболивания, а также продленная эпидуральная инфузия после операции со скоростью до 28 мг/ч в течении 72 ч хорошо переносится взрослыми пациентами.

Для купирования послеоперационной боли рекомендуется следующий метод: если эпидуральный катетер не был установлен при оперативном вмешательстве, после его установки выполняется эпидуральная блокада болюсной инъекцией препарата Ропивакаин Каби 7.5 мг/1 мл. Анальгезия поддерживается инфузией препарата Ропивакаин Каби 2 мг/1 мл. В большинстве случаев для купирования послеоперационной боли от умеренной до выраженной, инфузия со скоростью 6-14 мл/ч (12-28 мг/ч) обеспечивает адекватную анальгезию с минимальной не прогрессирующей моторной блокадой (при использовании данной методики наблюдалось значительное снижение потребности в опиоидных анальгетиках). Для послеоперационного обезболивания Ропивакаин Каби 2 мг/1 мл можно вводить непрерывно в виде эпидуральной инфузии в течение 72 ч без фентанила или в комбинации с ним (1-4

мкг/мл). При применении препарата Ропивакаин Каби 2 мг/1 мл (6-14 мл/ч) обеспечивалось адекватное обезболивание у большинства пациентов.

Комбинация препарата Ропивакаин Каби и фентанила приводила к улучшению обезболивания, вызывая при этом побочные эффекты, присущие наркотическим анальгетикам.

Использование концентрации препарата Ропивакаин Каби свыше 7.5 мг/1 мл при кесаревом сечении не изучено.

Почечная недостаточность

Как правило, при введении однократной дозы либо краткосрочной терапии пациентов с нарушением функции ночек, изменение дозы не требуется.

Печеночная недостаточность

Ропивакаин метаболизируется в печени и, вследствие этого, должен с осторожностью применяться у пациентов с серьезными заболеваниями печени. Повторяющиеся дозы возможно, необходимо снижать вследствие задержки выведения.

Пациенты, страдающие гиповолемией

У пациентов, страдающих гиповолемией, по любой причине может развиться острая и тяжелая гипотензия во время эпидуральной анестезии, независимо от использования местного анестетика.

Таблица 2. Рекомендации по дозированию препарата Ропивакаин Каби **для детей от 0 до 12 лет**

Концентрация	мг/мл	Объём мг/кг	Доза мг/кг
Купирование острого болевою синдрома (пред- и послеоперационное обезболивание)			
Каудалыюе эпидуралыюе введение	2.0	1	2
Блокады ниже T_{12}. у детей с массой тела до 25 кг			
Продленная эпндуральиая иифузия у детей с массой тела до 25 кг			
Возраст от 0 до 6 месяцев			
Болюспое введение[a]	2.0	0.5-1	1-2
Инфузия до 72 ч	2.0	0.1 мл/кг/ч	0.2 мл/кг/ч
Возраст от 6 до 12 месяцев			
Болюспое введение[a]	2.0	0.5-1	1-2
Инфузия до 72 ч	2.0	0.2 мл/кг/ч	0.4 мл/кг/ч
Возраст от 1 до 12 лет включительно			
Болюспое введение[б]	2.0	1	2
Инфузия до 72 ч	2.0	0.2 мл/кг/ч	0.4 мл/кг/ч

[a] - Меньшие дозы из предлагаемого интервала дозирования рекомендуются для торакальной и эпидуральной блокад, тогда как большие - для люмбальных и каудальных эпидуральных блокад.

[б] - Рекомендуется для люмбальных эпидуральных блокад. Обоснованным является снижение болюсной дозы в случае анальгезии на грудном уровне.

Дозировки в таблице 2 должны считаться руководством к использованию препарата в педиатрической практике. В тоже время существует индивидуальная вариабельность скорости развития блока и его длительности. У детей с повышенной массой тела часто требуется постепенное снижение дозы препарата, и в качестве основы необходимо считать идеальную массу тела пациента. Для факторов, влияющих на специфические методики блокады и индивидуальные требования пациентов, необходимо учитывать данные, приведенные в стандартных руководствах. Объем для однократной каудальной блокады и объем для эпидуральных болюсных дозировок не должен превышать 25 мл у любого пациента.

Перед инъекцией и в процессе ее проведения рекомендуется осторожная аспирация с целью предотвращения интраваскулярной инъекции. Во время введения препарата необходимо внимательно следить за жизненными функциями пациента. В случае возникновения токсических симптомов инфузия должна быть немедленно остановлена. Однократная каудальная эпидуральная инъекция ропивакаина в дозе 2 мг/1 мл (из расчета 2 мг/кг, объем раствора 1 мл/кг) формирует адекватную послеоперационную анальгезию ниже уровня $T_{1/2}$ у большинства пациентов.

Дети старше 4 лет хорошо переносят дозы 3 мг/кг. Объем вводимого раствора для эпидуральпого введения на каудальном уровне может быть изменен с целью достижения различной распространенности сенсорного блока, что описано в специализированных руководствах.

Независимо от типа анестезии, рекомендуется болюсное введение рассчитанной дозы препарата.

Применение препарата в концентрации выше 5 мг/1 мл, а также интратекальное применение препарата Ропивакаин

Каби у детей не исследовалось.

Независимо от способа введения, применение ропивакаина не исследовалось у недоношенных детей.

Инструкции по применению раствора

Раствор не содержит консервантов и предназначен только для однократного применения.

Подлежит немедленному использованию после вскрытия ампулы или мешка "Фрифлекс", неиспользованный остаток препарата уничтожают.

Перед использованием лекарственный препарат необходимо внимательно осмотреть.

Раствор для инъекции пригоден только в том случае, если он является прозрачным, видимые механические частицы отсутствуют, а емкость не повреждена.

Любое количество раствора, оставшегося в контейнере после использования, должно быть уничтожено. Невскрытый контейнер с раствором не должен быть автоклавирован. Невскрытая блистерная упаковка обеспечивает стерильность внешней поверхности емкости и предпочтительна для использования в условиях, требующих стерильности.

Побочное действие:

Нежелательные реакции на препарат Ропивакаин Каби сходны с реакциями на другие местные анестетики амидного типа. Побочные реакции необходимо отличать от физиологических эффектов самой блокады, например, гипотензии и брадикардии во время субдуральной анестезии, или эффектов, связанных с техникой введения препарата (например, спинная гематома, местное повреждение нерва, головная боль после субдуральной пункции, менингит и эпидуральный абсцесс).

Побочные эффекты, присущие местным анестетикам

Со стороны центральной и периферической нервной системы

Возможны нейропатия и нарушение функции спинного мозга (синдром передней спинномозговой артерии, арахноидит, синдром конского хвоста), обычно связаны с техникой проведения регионарной анестезии, а не с действием препарата.

В результате случайного интратекального введения дозы, превышающей рекомендованную может произойти полный спинальный блок. Возможны серьезные осложнения при системной передозировке и непреднамеренном внутрисосудистом введении препарата (см. раздел "Передозировка").

Острая системная токсичность

Ропивакаин Каби может вызывать острые системные токсические реакции при использовании высоких доз или при быстром повышении его концентрации в крови при случайном внутрисосудистом введении препарата либо его передозировке (см. раздел "Фармакологические свойства" и "Передозировка").

Наиболее часто встречающиеся побочные эффекты

Сообщалось о различных побочных эффектах препарата, подавляющее большинство которых было связано не с воздействием используемого анестетика, а с техникой проведения регионарной анестезии.

Наиболее часто (>1%) отмечались следующие побочные эффекты, которые были расценены, как имеющие клиническое значение вне зависимости от того была ли установлена причинно-следственная связь с использованием анестетика: снижение АД*, тошнота, брадикардия, рвота, парестезия, повышение температуры тела, головная боль, задержка мочеиспускания, головокружение, озноб, повышение АД, тахикардия, гипостезия, беспокойство.

Частота возникновения нежелательных эффектов представлена следующим образом: очень часто - >1/10; часто - >1/100 до <1/10; нечасто - >1/1000 до <1/100; редко - >1/10 000 до <1/1 000; очень редко - <1/10 000; неизвестно - не может быть установлено на основании имеющихся данных.

Нарушения со стороны нервной системы: часто - головная боль, парестезия, головокружение; нечасто - беспокойство, симптомы токсического действия на ЦНС (судороги, большие судорожные припадки, парестезии в околоротовой зоне, онемение языка, гиперакузия, шум в ушах, нарушения зрения, дизартрия, мышечные подергивания, тремор)*, гипестезия.

Нарушения со стороны сердца: очень часто - снижение АД (гипотензия); часто - брадикардия, тахикардия, повышение АД; нечасто - обморок; редко - остановка сердца, аритмии.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: нечасто - одышка, затрудненное дыхание.

Желудочно-кишечные нарушения: очень часто - тошнота; часто - рвота.

Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей: часто - задержка мочеиспускания.

Общие расстройства и нарушения вместе введении: часто - боль в спине, гипертермия, ознобы; нечасто - гипотермия; редко - аллергические реакции (анафилактические реакции. ангионевротический отек и крапивница).

* Данные симптомы обычно связаны со случайным впутрисосудистым введением, передозировкой или быстрой абсорбцией.

[a] - Гипотензия у детей встречается часто (>1/100).

[б] - Рвота у детей встречается очень часто (>1/10).

Передозировка:

Острая системная токсичность

При случайном внутрисосудистом введении при проведении блокад нервных сплетений или других периферических блокад наблюдались случаи возникновения судорог. В случае неправильного введения эпидуральной дозы анестетика интратекально возможно возникновение полного спинального блока.

Случайное внутрисосудистос введение анестетика может вызвать немедленную токсическую реакцию.

При передозировке во время проведения регионарной анестезии симптомы системной токсической реакции появляются в отсроченном порядке через 15-60 мин после инъекции из-за медленного повышения концентрации местного анестетика в плазме крови.

Системная токсичность, в первую очередь, проявляется симптомами со стороны ЦНС и сердечно-сосудистой системы (ССС). Данные реакции вызываются высокими концентрациями местного анестетика в крови, которые могут возникнуть вследствие (случайного) внутрисосудистого введения, передозировки или исключительно высокой адсорбции из сильно васкуляризированных областей.

Реакции со стороны ЦНС схожи для всех местных анестетиков амидного типа, в то время как реакции со стороны сердечно-сосудистой системы в большей степени зависят от введенного препарата и его дозы.

Центральная нервная система

Проявления системной токсичности со стороны ЦНС развиваются постепенно: сначала появляются расстройства зрения, онемение вокруг рта, онемение языка, гиперакузия. звон в ушах, головокружение. Дизартрия, тремор и мышечные подергивания являются более серьёзными проявлениями системной токсичности и могут предшествовать появлению генерализованных судорог (эти признаки не должны приниматься за невротическое поведение пациента), При прогрессировании интоксикации может наблюдаться потеря сознания, приступы судорог продолжительностью от нескольких секунд до нескольких минут, сопровождающиеся нарушением дыхания, быстрым развитием гипоксии и гиперкапнии из-за повышенной мышечной активности и неадекватной вентиляции. В тяжелых случаях может даже наступить остановка дыхания. Возникающие ацидоз, гиперкалиемия, гипокальциемия усиливают токсические эффекты анестетика.

Впоследствии, из-за перераспределения анестетика из ЦНС и его последующего метаболизма и экскреции, происходит достаточно быстрое восстановление функций, если только не была введена большая доза препарата.

Сердечно-сосудистая система

Расстройства со стороны сердечно-сосудистой системы являются признаками более серьезных осложнений. Снижение АД, брадикардпя. аритмия и, в ряде случаев, даже остановка сердца могут возникать вследствие высокой системной концентрации местных анестетиков. В редких случаях остановка сердца не сопровождается предшествующей симптоматикой со стороны ЦНС. В исследованиях на добровольцах в/в инфузия ропивакаина приводила к угнетению проводимости и сократительной способности сердечной мышцы. Симптомам со стороны сердечно-сосудистой системы обычно предшествуют проявления токсичности со стороны ЦНС, которые можно не заметить, если больной находится под действием седативных средств (бензодиазепины или барбитураты) или под общей анестезией.

У детей ранние признаки системной токсичности местных анестетиков иногда сложнее выявить вследствие затруднений, испытываемых детьми при описании симптомов, или в случае применения регионарной анестезии в сочетании с общей анестезией.

Лечение острой токсичности

При появлении первых признаков острой системной токсичности следует немедленно прекратить введение препарата.

При появлении судорог и симптомов угнетения ЦНС больному требуется адекватное лечение, целью которого является поддержание оксигенации, купирование судорог, поддержание деятельности сердечно-сосудистой системы. Следует обеспечить оксигенацию кислородом, а при необходимости - переход на искусственную вентиляцию легких. Если спустя 15-20 секунд судороги не прекращаются, следует применять противосудорожные средства: тиопентал натрия 1-3 мг/кг в/в (обеспечивает быстрое купирование судорог) или диазепам 0.1 мг/кг в/в (действие развивается медленнее по сравнению с действием тиопентала натрия). Суксаметоний 1 мг/кг быстро купирует судороги, но при его использовании требуется интубация и искусственная вентиляция легких.

При угнетении деятельности сердечно-сосудистой системы (снижение АД, брадикардия) необходимо в/в введение 5-10 мг эфедрина, при необходимости через 2-3 мин введение повторить. При развитии циркуляторной недостаточности или остановке сердца следует немедленно начать стандартные реанимационные мероприятия. Жизненно важно поддерживать оптимальную оксигенацию, вентиляцию и циркуляцию крови, а также корректировать ацидоз. При остановке сердца могут потребоваться более длительные реанимационные мероприятия.

При терапии системной токсичности у детей необходимо корректировать дозы соответственно возрасту и массе тела пациента.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Не выявлено прямого или опосредованного неблагоприятного влияния на течение беременности, развитие эмбриона/плода, роды и постнатальное развитие. Ропивакаин Каби можно применять во время беременности, только если возможная польза от этого оправдывает возможный риск для плода.

В настоящее время отсутствуют клинические данные касательно экскреции ропивакаина с грудным молоком у кормящих матерей. Исходя из экспериментальных данных, доза препарата, получаемая новорожденным, приблизительно составляет 4% от дозы, введенной матери (т.е. общая доза ропивакаина, воздействующая на ребенка при грудном вскармливании, значительно меньше дозы, которая может быть получена новорожденным при введении анестетика матери при родах). При необходимости применения препарата в период грудного кормления следует рассматривать соотношение потенциальной пользы для матери и возможного риска для младенца.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Одновременное применение препарата Ропивакаин Каби с местными анестетиками, препаратами структурно сходными с местными анестетиками амидного типа или лекарственными средствами, угнетающими ЦНС может усиливать токсические эффекты препаратов.

Пациенты, принимающие антиаритмическис препараты III класса (например, амиодарон), должны находиться под постоянным медицинским наблюдением и ЭКГ-мониторингом, т.к. могут возникнуть побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы.

In vivo при одновременном применении флувоксамина, мощного избирательного ингибитора изофермента CYP1A2, плазменный клиренс ропивакаина гидрохлорида снижался на 77%. Таким образом, сильные ингибиторы изофермента CYP1A2, такие как флувоксамин и эноксацин, при совместном применении с препаратом Ропивакаин Каби, могут взаимодействовать с ропивакаина гидрохлоридом. Длительного назначения ропивакаина гидрохлорида следует избегать у больных получающих лечение сильными ингибиторами изофермента CYP1A2.

In vivo при одновременном применении кетоконазола, мощного избирательного ингибитора изофермента CYP3A4, плазменный клиренс ропивакаина гидрохлорида снижался на 15%. Однако ингибирование данного изофермента вряд ли будет клинически значимо.

In vitro ропивакаина гидрохлорид является конкурентным ингибитором изофермента CYP2D6, в то же время ингибирование данного изофермента не достигается при применяемых в практике концентрациях препарата в плазме.

В щелочных растворах ропивакаина гидрохлорид может выпадать в осадок, поскольку он слабо растворим при pH>6.0.

Раствор Ропивакаина Каби в пластиковых инфузионных мешках по своим химическим и физическим свойствам совместим со следующими лекарственными препаратами:

Концентрация Ропивакаина Каби: 1-2 мг/1 мл	
Добавляемый раствор	**Концентрация**
Фентанил	1.0-10.0 мкг/мл
Морфин	20.0-100.0 мкг/мл

Несмотря на тот факт, что полученные смеси сохраняют химическую и физическую стабильность в течение 30 дней при температуре не выше 30°C, исходя из данных по микробиологической чистоте, следует использовать полученные смеси растворов немедленно после приготовления.

Особые указания и меры предосторожности:

Анестезия должна проводиться опытными специалистами, в специально оборудованных помещениях. Обязательно наличие оборудования и лекарственных препаратов для проведения реанимационных мероприятий. Пациенту, до начала проведения проводниковых блокад, должен быть введен внутривенный катетер.

Специалист должен быть знаком с мерами предосторожности и иметь соответствующий опыт диагностики и лечения возможных побочных эффектов, системной токсичности и других осложнений, таких как необратимое субарахноидальное введение, что может вызвать выраженную спинномозговую блокаду с апноэ и гипотензией. Судороги чаше возникают после блокады плечевого сплетения и эпидуральной блокады. Вероятнее всего, это может быть результатом случайного внутрисосудистого введения или быстрого всасывания в месте введения. Блокады основных периферических нервов могут привести к введению значительного объема местного анестетика в богатую сосудами область, часто близко к крупным сосудам, где может быть повышенный риск внутрисосудистого введения и/или быстрого системного всасывания, что может привести к высокой концентрации препарата в плазме. Некоторые местные анестетические процедуры, такие как инъекции в области головы и шеи могут быть связаны с повышенной частотой серьезных побочных реакций, независимо от применяемого анестетика. Необходимо соблюдать осторожность с целью предотвращения инъекции в область воспаления.

Пожилые и ослабленные пациенты, пациенты с блокадой внутрисердечной проводимости II и III степени, пациенты с тяжелой почечной недостаточностью требуют особого внимания, однако таким пациентам часто показана местная анестезия.

Имеются единичные сообщения о фактах остановки сердца при применении ропивакаина для эпидуральной анестезии или блокаде периферического нерва, особенно после случайного интраваскулярного введения пожилым пациентам и пациентам, страдающим сопутствующим заболеванием сердца.

В некоторых случаях реанимационные мероприятия могут быть затруднительны. При остановке сердечной деятельности, эффективные реанимационные мероприятия могут потребовать длительного времени.

Ропивакаин Каби метаболизируется в печени и, вследствие этого, должен с осторожностью применяться у пациентов с заболеваниями печени: повторяющиеся дозы, возможно необходимо снижать вследствие задержки выведения.

Обычно нет необходимости корректировать дозировку у пациентов с почечной и печеночной недостаточностью при однократной либо краткосрочной терапии. Однако ацидоз и снижение концентрации протеинов плазмы, часто наблюдаемые у пациентов с хронической почечной недостаточностью, могут увеличивать риск системной интоксикации.

Спинальная анестезия может приводить к снижению АД и брадикардии. Введение сосудосуживающих препаратов или увеличение объема циркулирующей крови может уменьшить риск развития подобных побочных эффектов.

Следует своевременно корректировать артериальную гипотензию путем введения 5-10 мг эфедрина, при необходимости введение можно повторить. Пациенты, принимающие антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон), должны находиться под постоянным медицинским наблюдением и ЭКГ-мониторингом, т.к. могут возникнуть побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы.

Следует избегать длительного применения ропивакаина пациентами, параллельно принимающими сильные ингибиторы изофермента CYP1A2, таких как флювоксамин и эноксацин.

Должна приниматься во внимание возможная перекрестная гиперчувствительность с другими анестетиками амидного типа - в расчет следует принимать тип местного анестетика.

Пациентам, находящимся на диете с ограничением натрия, необходимо принимать во внимание содержание натрия в препарате.

Применение препарата в концентрации выше 5 мг/1 мл, а также интратекальное применение препарата Ропивакаин Каби у детей не исследовалось.

Применение препарата у новорожденных требует учета возможной незрелости органов и физиологических функций новорожденных. Клиренс несвязанной фракции ропивакаина и пипелоксолидина (ППК) зависит от массы тела и возраста ребенка в первые годы жизни.

Влияние возраста выражается в развитии и зрелости функции печени, клиренс достигает максимального значения в возрасте около 1-3 лет. $T_{1/2}$ ропивакаина составляет 5-6 ч у новорожденных и детей в возрасте 1 месяца по сравнению с 3 ч у детей более старшего возраста.

В связи с недостаточным развитием функций печени системная экспозиция ропивакаина выше у новорожденных, умеренно выше - у детей от 1 до 6 месяцев по сравнению с детьми более старшего возраста.

Значительные отличия в концентрациях ропивакаина в плазме крови новорожденных, выявленные в клинических исследованиях, позволяют предполагать повышенный риск возникновения системной токсичности в этой группе

пациентов, особенно при продленной эпидуральной инфузии.

Рекомендованные дозы для новорожденных основаны на ограниченных клинических данных.

При использовании препарата Ропивакаин Каби у новорожденных необходимо мониторирование системной токсичности (контроль признаков токсичности со стороны ЦНС, ЭКГ, контроль оксигенации крови) и местной нейротоксичности, которые следует продолжать после завершения инфузии из-за медленного выведения препарата у новорожденных.

Применение препарата в концентрации выше 5 мг/1 мл, а также интратекальное применение препарата Ропивакаин Каби у детей не исследовалось.

Раствор Ропивакаина Каби для инъекций может обладать порфириногенными свойствами и может применяться у пациентов с диагнозом острая порфирия только в случаях, если нет более безопасной альтернативы. В случае повышенной чувствительности пациентов должны быть приняты необходимые меры предосторожности.

Сообщалось о случаях хондролиза при послеоперационной продленной внутрисуставной инфузии местных анестетиков. В большинстве описанных случаев проводилась иифузия в плечевой сустав. Причинно-следственная связь с приемом анестетика не установлена.

Ропивакаин не следует применять при продленной внутрисуставной инфузии.

Сведения о возможном влиянии лекарственного препарата для медицинского применения на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Необходимо воздержаться от потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций, т.к. временно нарушаются двигательные функции, координация движений и скорость реакции.

Условия хранения:

Препарат следует хранить в недоступном для детей месте при температуре не выше 25°С. Не замораживать! Срок годности ампул полипропиленовых - 3 года, контейнера (мешок) "Фрифлекс" - 2 года..

Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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