

ИНСТРУКЦИЯ ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ БЛОКАСТ

Торговое название препарата: Блокаст

Действующее вещество (МНН): ропивакаина гидрохлорид.

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

активное вещество: ропивакаина гидрохлорида - 2,0 мг; 5,0 мг; 7,5 мг; 10,0 мг.

вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций до 1 мл.

Описание: прозрачный, бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: Местноанестезирующее средство.

Код АТХ: N01BB09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Блокаст первый местный анестетик амидного типа длительного действия, являющийся чистым энантиомером. Обладает как местноанестезирующим, так и обезболивающим действием. Высокие дозы препарата применяются для местной анестезии при хирургических вмешательствах, низкие дозы препарата обеспечивают анальгезию (сенсорный блок) с минимальным и не прогрессирующим моторным блоком. На длительность и интенсивность блокады, вызванной Блокастом, добавление адреналина не влияет. Обратимо блокируя потенциал-зависимые натриевые каналы, препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению импульсов по нервным волокнам

Блокаст может оказывать влияние на другие возбудимые клеточные мембраны (например, в головном мозге и миокарде). Если избыточное количество местного анестетика достигает системного кровотока за короткий промежуток времени, возможно, проявление признаков системной токсичности. Признаки токсичности со стороны центральной нервной системы предшествуют признакам токсичности со стороны сердечно-сосудистой системы, так как наблюдаются при более низких концентрациях препарата в плазме крови. Блокаст приводит к таким же эффектам со стороны сердечно-сосудистой системы. Прямое действие местных анестетиков на сердце включает замедление проводимости, отрицательный инотропный эффект и, при выраженной передозировке, аритмии и остановку сердца. Внутривенное введение высоких доз Блокаста приводит к таким же эффектам на сердце.

Непрямые сердечно-сосудистые эффекты (снижение АД, брадикардия), которые могут возникать после эпидурального введения препарата, обусловлены возникающей симпатической блокадой.

Фармакокинетика

Абсорбция.

Концентрация препарата в плазме крови зависит от дозы, пути введения и степени васкуляризации области инъекции. Фармакокинетика Блокаста линейная, максимальная концентрация (С_{max}) пропорциональна введенной дозе. После эпидурального введения Блокаст полностью абсорбируется в кровь. Абсорбция носит двухфазный характер, период полувыведения (T_{1/2}) для двух фаз составляет соответственно 14 минут и 4 часа.

Замедление элиминации Блокаста определяется медленной абсорбцией, что объясняет более длительный T1/2 после эпидурального введения по сравнению с внутривенным введением.

Распределение.

Общий плазменный клиренс составляет 440 мл/мин, плазменный клиренс несвязанного вещества 8 л/мин, почечный клиренс 1 мл/мин, объем распределения в равновесном состоянии 47 л, показатель печеночной экстракции около 0,4, T1/2-1,8 часа.

Ропивакаина гидрохлорид интенсивно связывается с белками плазмы крови (главным образом с альфа₁-кислыми гликопротеинами), несвязанная фракция составляет около 6%. Длительная эпидуральная инфузия препарата приводит к повышению общего содержания его в плазме крови, что обусловлено увеличением уровня кислых гликопротеинов в крови после хирургических операций, при этом концентрация несвязанной, фармакологически активной формы препарата в плазме крови меняется в гораздо меньшей степени, чем общая концентрация.

Блокаст проникает через плацентарный барьер с быстрым достижением равновесия по несвязанной фракции. Степень связывания с белками плазмы у плода ниже, чем у матери, что влечет за собой более низкую общую концентрацию в плазме крови плода, по сравнению с общей концентрацией в плазме крови матери.

Метаболизм.

Блокаст активно метаболизируется в организме главным образом путем ароматического гидроксилирования. 3-гидроксиропивакаин (конъюгированный + неконъюгированный) обнаруживается в плазме крови.

Элиминация

После внутривенного введения 86% выводится с мочой и только около 1% от выделяемого с мочой препарата выводится в неизменном виде. Около 37% 3-гидроксиропивакаина, основного метаболита ропивакаина гидрохлорида, выводится с мочой как в связанном, так и в несвязанном виде. Экскреция с мочой PPX (N-депропилат ропивакаин – *ripresoloxylidide*) и других метаболитов составляет менее 3% всей дозы.

При эпидуральной инфузии основные метаболиты PPX и 3-гидроксиропивакаин выводятся с мочой. Общая концентрация PPX в плазме составляет около половины от общей концентрации препарата, однако, значение концентрации несвязанного PPX в 7-9 раз выше, чем концентрация несвязанного ропивакаина гидрохлорида при последующей непрерывной эпидуральной инфузии до 72 часов.

Фармакокинетика в особых клинических случаях.

Нарушение функции почек не оказывает существенного влияния на фармакокинетику Блокаста. Почечный клиренс PPX значимо коррелирует с клиренсом креатинина. Отсутствие корреляции между общей экспозицией, выраженной в AUC, и клиренсом креатинина указывает, что общий клиренс PPX включает внепочечную элиминацию в дополнение к почечной экскреции. У некоторых пациентов с нарушенной функцией почек может отмечаться повышение экспозиции PPX в результате низкого почечного клиренса. Из-за пониженной нейротоксичности PPX по сравнению с ропивакаина гидрохлоридом клинические последствия считаются незначительными при краткосрочном применении.

Показания к применению

В концентрации 2 мг/мл препарат Блокаст 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 лет (включительно):
- ✓ каудальная эпидуральная блокада;
- ✓ продленная эпидуральная инфузия.

В концентрации 5 мг/мл препарат Блокаст применяют по следующим показаниям:

- ✓ Анестезия при хирургических вмешательствах у взрослых и детей старше 12 лет: интратекальная блокада.
- ✓ Купирование острого болевого синдрома в педиатрии: - блокада периферических нервов у детей с 1 года до 12 лет включительно.

В концентрации 7,5 мг/мл и 10 мг/мл препарат Блокаст применяют у взрослых и детей старше 12 лет по следующим показаниям:

- ✓ 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.

Способ применения и дозы

Блокаст должен использоваться только специалистами, имеющими достаточный опыт проведения регионарной анестезии или под их наблюдением.

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. При использовании анестетика с целью обезболивания обычно рекомендована доза 2 мг/мл. Для внутрисуставного введения рекомендована доза 7,5 мг/мл. В дозе 10 мг/мл рекомендуется для эпидуральной анестезии, когда полная моторная блокада является необходимой для проведения операций.

Дозы, указанные в таблице 1, считаются достаточными для достижения надежной блокады и являются ориентировочными при использовании препарата у взрослых, т.к. существует индивидуальная вариабельность скорости развития блокады и его длительности.

Данные таблицы 1 является ориентировочным руководством по дозированию препарата для проведения наиболее часто используемых блокад. При подборе дозы препарата следует основываться на клиническом опыте с учетом физического состояния пациента.

Таблица 1

Рекомендации по дозированию препарата Блокаст для взрослых и детей старше 12 лет

Виды анестезии	Концентрация препарата, мг/мл	Объем раствора, мл	Доза, мг	Начало действия, мин	Длительность действия, ч
Анестезия 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	10–20	3–5
Эпидуральная анестезия на грудном уровне:					
Послеоперационная обезболивающая блокада и хирургические вмешательства	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 инфльтрационная 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:					
- обезболивания родов	2,0	6–10 мл/ч	12–20 мг/ч	-	-
- после операционного обезболивания	2,0	6–14 мл/ч	12–28 мг/ч	-	-
Блокада периферических нервов:					
Например, блокада бедренного нерва или межлестничная блокада (продленные инфузии или повторные инъекции)	2,0	5–10 мл/ч	10–20 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 инфльтрационная анестезия	2,0	1–100	2–200	1–5	2–6
Внутрисуставное введение					
Артроскопия коленного сустава**	7,5	20	150***	-	2–6

* Доза для блокады крупных нервных сплетений должна подбираться в соответствии с местом введения и состоянием пациента. Блокада плечевого сплетения межлестничным и надключичным доступом может быть сопряжена с высокой частотой серьезных побочных реакций вне зависимости от используемого местного анестетика.

** Сообщалось о случаях хондролитизиса при постоперационной продленной внутрисуставной инфузии местных анестетиков. Блокаст не следует применять для продленной внутрисуставной инфузии.

*** Если Блокаст дополнительно использовался для других видов анестезии, максимальная доза не должна превышать 225 мг.

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 сосуд следует обязательно проводить аспирационную пробу до введения и в процессе введения препарата. Если предполагается использовать препарат в высокой дозе, рекомендуется ввести пробную дозу — 3–5 мл лидокаина с эпинефрином. Случайное внутрисосудистое введение распознается по временному увеличению ЧСС, а случайное интратекальное введение — по признакам спинального блока. При появлении токсических симптомов следует немедленно прекратить введение препарата.

До введения и во время введения препарата Блокаст (которое следует проводить медленно или путем увеличения вводимых последовательно доз препарата со скоростью 25–50 мг/мин) необходимо тщательно контролировать жизненно важные функции пациента и поддерживать с ним вербальный контакт.

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

При блокаде плечевого сплетения с помощью 40 мл препарата Блокаст 7,5 мг/мл максимальные плазменные концентрации ропивакаина в плазме у некоторых пациентов могут достигать значения, характеризующегося легкими симптомами токсичности со стороны ЦНС. Поэтому применение дозы выше 40 мл препарата Блокаст 7,5 мг/мл (300 мг ропивакаина гидрохлорида) не рекомендовано.

При длительном проведении блокады путем продленной инфузии или повторного болюсного введения следует учитывать возможность создания токсических концентраций анестетика в крови и местного повреждения нерва. Введение ропивакаина гидрохлорида 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 течение 72 ч хорошо переносится взрослыми пациентами.

Для купирования послеоперационной боли рекомендуется следующая схема применения препарата: если эпидуральный катетер не был установлен при оперативном вмешательстве, после его установки выполняется эпидуральная блокада болюсной инъекцией препарата Блокаст (7,5 мг/мл). Анальгезия поддерживается инфузией препарата Блокаст (2 мг/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 двигательной блокадой (при использовании данной методики наблюдалось значительное снижение потребности в опиоидных анальгетиках).

Для послеоперационного обезболивания Блокаст (2 мг/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 Блокаст 2 мг/мл (6–14 мл/ч) обеспечивалось адекватное обезбоживание у большинства пациентов. Комбинация препарата Блокаст и фентанила приводила к улучшению обезбоживания, вызывая при этом побочные эффекты, присущие наркотическим анальгетикам.

Использование препарата Блокаст в концентрации выше 7,5 мг/мл при кесаревом сечении не изучено.

Таблица 2

Рекомендации по дозированию препарата Блокаст для детей до 12 лет

Показатели	Концентрация препарата, мг/мл	Объем раствора, мл/кг	Доза, мг/кг
Купирование острого болевого синдрома (пред- и постоперационное):			
<i>Каудальное эпидуральное введение:</i>			
Блокада в области ниже ThXII у детей с массой тела до 25 кг	2,0	1	2
Продленная эпидуральная инфузия у детей с массой тела до 25 кг			
Возраст от 0 до 6 мес			
Болюс*	2,0	0,5–1	1–2
Инфузия до 72 ч	2,0	0,1 мл/кг/ч	0,2 мг/кг/ч
Возраст от 6 до 12 мес			
Болюс*	2,0	0,5–1	1–2
Инфузия до 72 ч	2,0	0,2 мл/кг/ч	0,4 мг/кг/ч
Возраст от 1 до 12 лет включительно			
Болюс**	2,0	1	
Инфузия до 72 ч	2,0	0,2 мл/кг/ч	0,4 мг/кг/ч

* Меньшие дозы из предлагаемого интервала рекомендуются для эпидурального введения на грудном уровне, в то время как большие дозы рекомендованы для эпидурального введения на поясничном или каудальном уровнях.

** Рекомендуются для эпидурального введения на поясничном уровне. Обоснованным является снижение дозы болюса для эпидуральной анальгезии на грудном уровне.

Дозы, указанные в таблице 2, являются руководством к использованию препарата в педиатрической практике. В то же время существует индивидуальная вариабельность скорости развития блока и его длительности.

У детей с избыточной массой тела часто требуется постепенное снижение дозы препарата; при этом необходимо руководствоваться «идеальной» массой тела пациента. За справочной информацией о факторах, которые влияют на методы выполнения отдельных блокад и о требованиях, предъявляемых к конкретным группам пациентов, следует обращаться к специализированным руководствам. Объем раствора для каудального эпидурального введения и объем болюса для эпидурального введения не должны превышать 25 мл для любого пациента.

Для предотвращения непреднамеренного внутрисосудистого введения анестетика следует тщательно проводить аспирационную пробу до введения и в процессе введения препарата. Во время введения препарата необходимо тщательно контролировать жизненно важные функции пациента. При появлении токсических симптомов следует немедленно прекратить введение препарата. Однократное введение препарата в дозе 2 мг/мл (из расчета 2 мг/кг, объем раствора 1 мл/кг) для послеоперационной каудальной анальгезии обеспечивает адекватное обезболивание ниже уровня ThXII у большинства пациентов. Дети старше 4 лет хорошо переносят дозы до 3 мг/кг. Объем вводимого раствора для эпидурального 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/мл, а также интратекальное применение препарата Блокаст у детей не исследовалось. Применение препарата Блокаст у недоношенных детей не изучалось.

Инструкция по применению раствора.

Раствор не содержит консервантов и предназначен только для однократного применения. Любое количество раствора, подлежит немедленному использованию после вскрытия ампулы, недоиспользованный остаток препарата уничтожают. Перед использованием лекарственный препарат необходимо внимательно осмотреть. Раствор для инъекций пригоден только в том случае, если он является прозрачным, видимые механические частицы отсутствуют, емкость не повреждена. Не вскрытый контейнер с раствором не должен быть автоклавирован. Не вскрытая блистерная упаковка обеспечивает стерильность внешней поверхности контейнера и предпочтительна для использования в условиях, требующих стерильности. Ввиду отсутствия достаточного количества клинических наблюдений не рекомендуется применять Блокаст в дозировке 5 мг/мл у детей в возрасте до 1-го года

Побочное действие

Нежелательные реакции на Блокаст аналогичны реакциям на другие местные анестетики амидного типа. Их следует отличать от физиологических эффектов, возникающих из-за блокады симпатических нервов на фоне эпидуральной анестезии, таких как снижение АД, брадикардия или эффектов, связанных с техникой введения препарата, таких как местное повреждение нерва, менингит, постпункционная головная боль, эпидуральный абсцесс. Побочные эффекты, присущие местным анестетикам:

Со стороны центральной и периферической нервной системы. Возможны нейропатия и нарушение функции спинного мозга (синдром передней спинальной артерии, арахноидит, синдром конского хвоста), обычно связаны с техникой проведения регионарной анестезии, а не с действием препарата.

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

Острая системная токсичность. Блокаст 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 «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, гипестезия, беспокойство.

Частота возникновения нежелательных эффектов представлена следующим образом: очень часто (>1/100, <1/10); часто (>1/1000, <1/100); нечасто (>1/10000, <1/1000); редко (<1/10000), включая отдельные сообщения.

Очень часто

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение АД*.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота.

Часто

Со стороны нервной системы: парестезия, головокружение, головная боль.

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

Со стороны желудочно-кишечного тракта: рвота**.

Со стороны мочеполовой системы: задержка мочеиспускания.

Общие: боль в спине, озноб, повышение температуры тела.

Нечасто

Со стороны нервной системы: беспокойство, симптомы токсичности со стороны ЦНС (судороги, большие судорожные припадки, парестезии в околоушной зоне, дизартрия, онемение языка, нарушения зрения, звон в ушах, тремор, мышечные судороги), гипестезия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы:: обморок.

Со стороны дыхательной системы: одышка, затрудненное дыхание

Общие: гипотермия.

Редко

Со стороны сердечно-сосудистой системы: аритмия, остановка сердца.

Общие: аллергические реакции (анафилактические реакции, ангионевротический отек, крапивница).

* Снижение АД встречается у детей часто.

** Рвота встречается у детей очень часто.

Противопоказания

Гиперчувствительность к компонентам препарата; известная повышенная чувствительность к местным анестетикам амидного типа.

С осторожностью:

Не следует вводить препарат ослабленным пожилым пациентам или пациентам с тяжелыми сопутствующими заболеваниями, такими как блокады внутрисердечной проводимости II и III степеней (синоатриальная, атриовентрикулярная, внутрижелудочковая), прогрессирующие заболевания печени, тяжелая печеночная недостаточность, тяжелая хроническая почечная недостаточность, при терапии гиповолемического шока. Для данных групп пациентов регионарная анестезия часто является предпочтительной. При проведении "больших" блокад с целью снижения риска развития тяжелых неблагоприятных явлений рекомендуется предварительно оптимизировать 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 побочных эффектов.

При внутрисуставном введении препарата следует соблюдать осторожность при подозрении на наличие недавней обширной травмы сустава или хирургической операции со вскрытием обширных поверхностей сустава в связи возможностью усиления абсорбции препарата и более высокой концентрации препарата в плазме.

Особое внимание следует уделять при применении препарата у детей до 6 мес в связи с незрелостью органов и функций.

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

Лекарственное взаимодействие

Возможно суммирование токсических эффектов при одновременном назначении с другими местными анестетиками или препаратами структурно сходными с местными анестетиками амидного типа.

Взаимодействие Блокаста и антиаритмических препаратов класса III (например, амиодарона) специально не изучалось, но следует соблюдать осторожность при совместном назначении. Клиренс ропивакаина уменьшается на 77% при совместном назначении с флувоксамином, являющимся сильным конкурентным ингибитором изофермента CYP1A2. Повышение pH раствора выше 6.0 может привести к образованию преципитата из-за плохой растворимости препарата при данных условиях.

Особые указания

Анестезия должна проводиться опытными специалистами. Обязательно наличие оборудования и лекарственных препаратов для проведения реанимационных мероприятий. До начала выполнения больших блокад должен быть установлен внутривенно катетер.

Персонал, обеспечивающий выполнение анестезии, должен быть соответствующим образом подготовлен и знаком с диагностикой и лечением возможных побочных эффектов, системных токсических реакций и других возможных осложнений (см. раздел «Передозировка»). Осложнением непреднамеренного субарахноидального введения может являться спинальный блок с остановкой дыхания и снижением АД. Конвульсии развиваются чаще при блокаде плечевого сплетения и эпидуральной блокаде, вероятно, вследствие случайного внутрисосудистого введения или быстрой абсорбции в месте инъекции.

Выполнение блокад периферийных нервов может требовать введение большого объема местного анестетика в зоны с большим количеством сосудов, часто — вблизи крупных сосудов, что повышает риск внутрисосудистого введения и/или быстрого системного всасывания, что может привести к высокой концентрации препарата в плазме.

Некоторые процедуры, связанные с применением местных анестетиков, такие как инъекции в области головы и шеи, могут сопровождаться повышенной частотой развития серьезных побочных эффектов, вне зависимости от типа применяемого местного анестетика. Необходимо соблюдать осторожность для предотвращения инъекции в область воспаления.

Следует соблюдать осторожность при введении препарата пациентам с блокадой внутрисердечной проводимости II и III степеней, пациентам с тяжелой почечной недостаточностью, пожилым и ослабленным пациентам.

Имеются сообщения о редких случаях остановки сердца при применении препарата Блокаст для эпидуральной анестезии или блокады периферических нервов, особенно после случайного внутрисосудистого введения препарата, у пожилых пациентов и у пациентов с сопутствующими сердечно-сосудистыми заболеваниями.

В ряде случаев реанимационные мероприятия были затруднительны. Остановка сердца, как правило, требует более длительных реанимационных мероприятий.

Поскольку Блокаст метаболизируется в печени, следует проявлять осторожность при применении препарата у больных с тяжелыми заболеваниями печени; в некоторых случаях из-за замедленной элиминации может возникнуть необходимость уменьшения повторно вводимых доз анестетика.

Обычно у больных с почечной недостаточностью при введении препарата однократно или при использовании препарата в течение непродолжительного периода времени не требуется корректировать дозу. Однако ацидоз и снижение концентрации белков в плазме крови, часто развивающиеся у больных с хронической почечной недостаточностью, могут повышать риск системного токсического действия препарата (см. раздел «Способ применения и дозы»). Риск системной токсичности также повышен при применении препарата у пациентов с пониженной массой тела и пациентов с гиповолемическим шоком.

Эпидуральная анестезия может приводить к снижению АД и брадикардии. Введение сосудосуживающих препаратов или увеличение ОЦК может уменьшить риск развития подобных побочных эффектов. Следует своевременно корректировать снижение АД путем в/в введения 5–10 мг эфедрина, при необходимости повторного.

При внутрисуставном введении препарата следует соблюдать осторожность при подозрении на наличие недавней обширной травмы сустава или хирургической операции

со вскрытием обширных поверхностей сустава, в связи возможностью усиления абсорбции препарата и более высокой концентрации препарата в плазме.

Пациенты, получающие терапию антиаритмическими препаратами III класса (например, амиодароном), должны находиться под тщательным наблюдением, рекомендуется ЭКГ-мониторинг в связи с риском усиления сердечно-сосудистых эффектов.

Следует избегать длительного применения препарата Блокаст у пациентов, принимающих сильные ингибиторы изофермента CYP1A2 (такие как флувоксамин и эноксацин).

Следует учитывать возможность перекрестной гиперчувствительности при одновременном применении препарата Блокаст с другими местными анестетиками амидного типа.

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

Применение препарата у новорожденных требует учета возможной незрелости органов и физиологических функций новорожденных. Клиренс несвязанной фракции ропивакаина и пипелоксилидина (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. $T_{1/2}$ препарата составляет 5–6 ч у новорожденных и детей в возрасте 1 месяц по сравнению с 3 часами у детей более старшего возраста. В связи с недостаточным развитием функций печени, системная экспозиция выше у новорожденных, умеренно выше — у детей от 1 до 6 мес по сравнению с детьми более старшего возраста. Значительные отличия в концентрациях препарата 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 Блокаста 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/мл, а также интратекальное применение препарата Блокаст у детей не исследовалось.

Блокаст потенциально способен вызывать порфирию 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 хондролитизиса при постоперационной продленной внутрисуставной инфузии местных анестетиков. В большинстве описанных случаев, проводилась инфузия в плечевой сустав. Причинно-следственная связь с приемом анестетиков не установлена. Блокаст не следует применять для продленной внутрисуставной инфузии.

Применение при беременности и лактации

Беременность

Не выявлено влияния препарата на фертильность и репродуктивную функцию, а также тератогенного действия. Не проводились исследования по оценке возможного действия на развитие плода у женщин.

Блокаст можно применять при беременности только, в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода (в акушерстве использование препарата для анестезии или анальгезии хорошо обосновано).

Лактация

Не изучалось выделение Блокаста или его метаболитов с грудным молоком. Исходя из экспериментальных данных, доза препарата, получаемого новорожденным, предположительно составляет 4% от дозы, введенной матери (концентрация препарата в

молоке/ концентрация препарата в плазме). Общая доза, воздействующая на ребенка при грудном вскармливании, значительно меньше дозы, которая может попасть в плод при введении анестетика матери при родах.

При необходимости применения препарата в период грудного вскармливания следует рассмотреть соотношение потенциальной пользы для матери и возможного риска для младенца.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами.

Помимо анальгезирующего эффекта, Блокаст может оказывать слабое транзитное влияние на двигательную функцию, координацию и скорость реакции. Учитывая профиль побочных эффектов препарата, следует воздержаться от потенциально опасных видов деятельности, требующих повышенного внимания и быстроты психомоторных реакций

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 внутрисосудистое 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 ССС. Данные реакции вызываются высокими концентрациями местного анестетика в крови, которые могут возникнуть вследствие (случайного) внутрисосудистого введения, передозировки или исключительно высокой адсорбции из сильно васкуляризованных областей. Реакции со стороны ЦНС схожи для всех местных анестетиков амидного типа, в то время как реакции со стороны ССС 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, гиперacusия, звон в ушах, головокружение. Дизартрия, тремор и мышечные подергивания являются более серьезными 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 ССС являются признаками более серьезных осложнений. Снижение АД, брадикардия, 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 препарата приводила к угнетению проводимости и сократительной способности сердечной мышцы. Симптомам

со стороны ССС 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 ССС. Следует обеспечить оксигенацию кислородом, а при необходимости — переход на ИВЛ. Если спустя 15–20 с судороги не прекращаются, следует использовать 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 ИВЛ. При угнетении деятельности ССС (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.

Форма выпуска

Раствор для инъекций в ампулах из стекла и полиэтилена или полипропилена медицинского по 5 мл и 10 мл.

Условия хранения

Хранить в сухом, защищенном от света месте при температуре не выше 25°C. Не замораживать. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска из аптек

По рецепту врача.

Производитель

"Jurabek Laboratories" ООО СП

Республика Узбекистан, 100003, г. Ташкент, ул. Алмазар 165,

тел/факс: (99878) 150 03 03

Web: www.jurabek.uz