

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства
Новокаин, раствор для инъекций 2,5 мг/мл и 5 мг/мл
(в контейнерах полимерных)

Регистрационное удостоверение:

Название лекарственного средства: Новокаин, раствор для инъекций 2,5 мг/мл и 5 мг/мл

Международное непатентованное название: Procaine

Химическое название: β-Диэтиламиноэтилового эфира *пара*-аминобензойной кислоты гидрохлорид

Общая характеристика. Лекарственное средство представляет собой прозрачный бесцветный раствор

Состав лекарственного средства.

	2,5 мг/мл			5 мг/мл		
	100 мл	250 мл	500 мл	100 мл	250 мл	500 мл
<u>Действующие вещества:</u>						
Прокаина гидрохлорид (новокаин)	0,25 г	0,625 г	1,25 г	0,5 г	1,25 г	2,5 г
<u>Вспомогательные вещества:</u>						
0,1 М раствор хлористоводородной кислоты				до pH 3,8-4,5		
Вода для инъекций	до 100 мл	до 250 мл	до 500 мл	до 100 мл	до 250 мл	до 500 мл

Форма выпуска: Раствор для инъекций

Фармакотерапевтическая группа: Средства для местной анестезии. Сложные эфиры аминокислоты

Код АТХ. N01BA02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика. Местноанестезирующее средство с умеренной анестезирующей активностью и большой широтой терапевтического действия. Являясь слабым основанием, блоки-

рует Na^+ каналы, препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению импульсов по нервным волокнам. Изменяет потенциал действия в мембранах нервных клеток без выраженного влияния на потенциал покоя. Подавляет проведение не только болевых, но и импульсов другой модальности.

При всасывании и непосредственном внутрисосудистом введении снижает возбудимость периферических холинергических рецепторов, уменьшает образование и высвобождение ацетилхолина из преганглионарных окончаний (обладает некоторым ганглиоблокирующим действием), устраняет спазм гладкой мускулатуры, уменьшает возбудимость миокарда и моторных зон коры головного мозга. Устраняет нисходящие тормозные влияния ретикулярной формации ствола мозга. Угнетает полисинаптические рефлексy. Обладает короткой анестезирующей активностью (продолжительность инфильтрационной анестезии составляет 0,5-1 ч).

Фармакокинетика. Подвергается полной системной абсорбции. Степень абсорбции зависит от места (особенно от степени васкуляризации и скорости кровотока в области введения), пути введения и итоговой дозы (количества и концентрации). Быстро гидролизуется эстеразами плазмы и печени с образованием двух основных фармакологически активных метаболитов: диэтиламиноэтонола (обладает умеренным сосудорасширяющим действием) и парааминобензойной кислоты (является конкурентным антагонистом сульфаниламидных химиотерапевтических препаратов и может ослабить их противомикробное действие). Период полувыведения составляет 30-50 секунд. Выводится преимущественно почками в виде метаболитов, в неизменном виде – не более 2 %.

Показания к применению. Инфильтрационная анестезия и лечебные блокады.

Способ применения и дозы

Способ введения: Раствор новокаина медленно вводят в ткани для обезболивания, при этом необходимо избегать случайного внутривенного введения.

Дозировка: Концентрация, количество и способ введения новокаина применяется в зависимости от показаний и назначений врача. Новокаин должен использоваться в самой низкой дозе, которая приводит к эффекту анестезии, чтобы избежать чрезмерно высокой концентрации в плазме, что может привести к побочным эффектам.

Для инфильтрационной анестезии применяют 2,5 мг/мл - 5 мг/мл растворы; для анестезии по методу Вишневского (тугая ползучая инфильтрация) – 1,25 мг/мл - 2,5 мг/мл растворы.

Для уменьшения всасывания и удлинения действия лекарственного средства при местной анестезии к раствору новокаина дополнительно добавляют 0,1 % раствор эпинефрина – по 1 капле на 2-5-10 мл раствора новокаина.

При паранефральной блокаде (по А. В. Вишневскому) в околопочечную клетчатку вводят 50-80 мл 5 мг/мл раствора новокаина или 100-150 мл 2,5 мг/мл раствора, а при вагосимпатической блокаде – 30-100 мл 2,5 мг/мл раствора.

Для инфильтрационной анестезии установлены следующие высшие дозы (для взрослых): первая разовая доза в начале операции – не более 1,25 г 2,5 мг/мл раствора (т. е. 500 мл) и 0,75 г 5 мг/мл раствора (т. е. 150 мл).

При применении инфильтрационной анестезии в области головы, шеи или гениталий, рекомендуется не превышать максимальную однократную дозу 200 мг новокаина (80 мл 2,5 мг/мл раствора или 40 мл 5 мг/мл раствора) в течение 2 часов. У пожилых и ослабленных пациентов при применении новокаина в области головы и шеи (в анатомической близости от сосудов головного мозга) рекомендуется более низкая дозировка.

Противопоказания

- повышенная чувствительность к активному веществу или любому из вспомогательных веществ;
- повышенная чувствительность к местным анестетикам типа эфира, возможность перекрестных аллергических реакций на производные п-аминобензойной кислоты (парабены) и сульфаниламиды;
- миастения гравис;

- дефицит холинэстеразы и псевдохолинэстеразы;
- одновременное лечение сульфаниламидами и ингибиторами холинэстеразы;
- тяжелые формы брадикардии, АВ-блокада II и III степени и другие нарушения проводимости;
- декомпенсированная сердечная недостаточность;
- выраженная артериальная гипотензия;
- гнойно-воспалительные процессы, рубцовые изменения ткани на месте введения.

Новокаин не предназначен для внутриартериального и внутривенного введения, эпидуральной или спинальной анестезии.

Дети. Лекарственное средство не применяется у детей.

Меры предосторожности

Инфильтрационная анестезия и проведение лечебных блокад должны выполняться квалифицированным специалистом, владеющим методами проведения анестезии и в условиях немедленного (при необходимости) доступа к реанимационному оборудованию (аппарат ИВЛ, дефибриллятор) и лекарственными средствами, применяемыми при шоке (плазмозаменители, адреналин, преднизолон, диазепам, атропин и т.д.).

Особая осторожность требуется при применении новокаина следующим категориям пациентов:

- пациентам с нарушением свертывания крови. Следует отметить, что во время лечения ингибиторами свертывания крови (антикоагулянтами, такие как гепарин), НПВП или плазмозаменителей можно ожидать повышенную склонность к кровотечениям. Кроме того, инъекция может привести к серьезным кровотечениям вследствие случайного повреждения сосуда. Дополнительно необходимо провести анализы на время свертывания крови, активированное частичное тромбопластиновое время (АЧТВ), тромбин и количество тромбоцитов.
- пациентам, принимающим антиаритмические препараты. В ряде случаев необходим ЭКГ-мониторинг у пациентов, принимающих антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон);
- пациентам с частичной или полной блокадой проводящей системы сердца, в связи с тем, что местные анестетики могут подавлять проведение возбуждения через атрио-вентрикулярное соединение;
- пациентам с почечной или печеночной дисфункцией (в связи с риском кумуляции);
- пожилым и ослабленным пациентам.

Перед проведением местной анестезии рекомендуется обеспечить условия для инфузионной терапии. Существующая гиповолемия должна быть устранена. Используемая доза анестетика должна быть минимальной, обеспечивающей обезболивающий эффект.

Рекомендуется выяснить возможный аллергологический анамнез в отношении новокаина и других местных анестетиков.

У пациентов с известной аллергией на новокаин одновременно может встречаться аллергия на другие местные анестетики группы сложных эфиров и родственные соединения, в том числе, на сульфаниламиды, пероральные противодиабетические средства (групповая парааллергия). При известной аллергии на сульфаниламиды не исключена перекрестная аллергия на новокаин.

У пациентов с дефицитом псевдохолинэстеразы или со значительно сниженной активностью фермента происходит усиление токсических симптомов при применении новокаина.

Для предупреждения побочных реакций сначала следует провести пробу на переносимость.

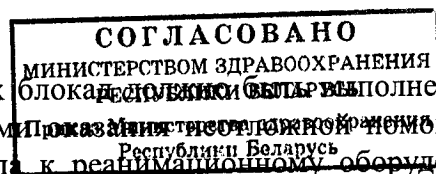
О непереносимости свидетельствуют отек и покраснение места инъекций. При положительной реакции новокаин не применять!

Рекомендуется избегать внутрисосудистого введения раствора новокаина.

Не вводить в область очага воспаления.

При использовании в области головы и шеи, существует повышенный риск токсичности и передозировки.

При обнаружении первых признаков побочных эффектов введение новокаина должно быть немедленно остановлено.



Побочное действие. Значительные дозозависимые побочные эффекты развиваются, преимущественно, со стороны ЦНС и сердечно-сосудистой системы. Они, как правило, являются результатом ошибок при применении (неправильно выбранной концентрации), превышения максимальной дозы, случайного внутрисосудистого введения, ускоренной резорбции (например, в обильно кровоснабжающихся тканях), у пациентов с печеночной или почечной недостаточностью с нарушением метаболизма и элиминации новокаина.

Падение артериального давления может быть первым признаком относительной передозировки вследствие угнетения деятельности сердца.

Токсическое действие на ЦНС проявляется рядом симптомов, таких как тошнота, рвота, беспокойство, тремор, спутанность сознания, нечеткость зрения, сонливость, звон в ушах, расстройство речи, подергивание мышц с развитием судорог, кома и центральный паралич дыхания.

При тяжелых формах интоксикации местными анестетиками продромальный период может быть очень коротким или отсутствовать, а пациент быстро входит в коматозное состояние.

При перечислении следующих побочных эффектов частота проявления определяется следующим образом:

Очень часто ($>1/10$)

Часто ($<1/100, <1/10$)

Иногда ($>1/1000, <1/100$)

Редко ($>1/10000, <1/1000$)

Очень редко ($<1/10000$)

Неизвестно (на основе имеющихся данных не может быть оценено):

Со стороны иммунной системы:

Редко аллергические реакции (крапивница, отек гортани, бронхоспазм, в крайних случаях, анафилактический шок).

Со стороны нервной системы:

Парестезии, головокружение, сонливость.

Признаки и симптомы токсичности ЦНС (судороги, парестезия круговой мышцы рта, онемение языка, гиперacusия, нарушения зрения, тремор, шум в ушах, дизартрия, угнетение ЦНС).

Со стороны сердца:

Брадикардия, тахикардия.

Остановка сердца, сердечные аритмии.

Со стороны сосудов:

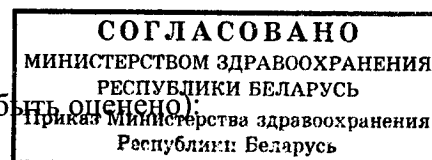
Гипотония, гипертония.

Со стороны органов грудной клетки и средостения:

Угнетение дыхания, одышка (см. расстройства иммунной системы)

Со стороны желудочно-кишечного тракта:

Тошнота, рвота.



Передозировка

Симптомы передозировки

В низких дозах новокаин действует как стимулятор центральной нервной системы, в высоких дозах приводит к депрессии функций ЦНС. Интоксикация новокаином гидрохлоридом протекает в 2 фазы:

1. Стимуляция

- ЦНС: парестезии век, чувство онемения языка, беспокойство, бред, судороги (тонико-клонические).

- Сердечно-сосудистая система: увеличение сердечного выброса, повышение артериального давления, покраснение кожи.

2. Депрессия

- ЦНС: кома, остановка дыхания.

- Сердечно-сосудистая система: отсутствие пульса, бледность кожных покровов, остановка сердца.

У пациентов на первой стадии интоксикации местными анестетиками проявляются симптомы возбуждения. Они беспокойны, жалуются на головокружение, нарушения зрения, слуха, покалывание и парестезию, особенно в области языка и губ. Парестезия языка, озноб и мышечные судороги являются предвестниками надвигающихся генерализованных судорог. Плазменные концентрации новокаина, не достигающие порога инициации судорог, также часто приводят к сонливости и седации пациента. На первой стадии интоксикации развиваются тонико-клонические судороги. При прогрессирующей интоксикации ЦНС развивается дисфункция ствола головного мозга с угнетением дыхания, симптомами комы, которая может привести к смерти.

Падение артериального давления часто является первым признаком токсического действия на сердечно-сосудистую систему. Гипотензия, в основном, обусловлена угнетением или блокадой сердечной проводимости. Однако токсическое воздействие на сердечно-сосудистую систему имеет клинически относительно небольшое значение.

В случае случайно выполненной общей спинальной анестезии, интоксикация проявляется начальными признаками беспокойства, затем сонливости, которая может перейти в бессознательное состояние и остановку дыхания.

Лечение передозировки:

В случае появления симптомов токсического действия новокаина на ЦНС или сердечно-сосудистую систему необходимо:

- немедленное прекращение введения новокаина;
- обеспечение проходимости дыхательных путей;
- при необходимости, ингаляция кислорода или искусственное дыхание;
- тщательный мониторинг артериального давления, частота пульса и диаметра зрачков;
- в случае острого и угрожающего падения артериального давления, пациента переводят в т.н. «противошоковое» положение (лежа горизонтально, с расположением головы ниже уровня ног), вводят внутривенно медленно бета-адренергические средства (адреналин). Кроме того, вводят кристаллоидные растворы для восполнения объема;
- при повышении тонуса блуждающего нерва с развитием брадикардии вводят атропин (0,5 мг до 1,0 мг внутривенно);
- в случае подозрения на остановку сердца, необходимо выполнять соответствующие реанимационные мероприятия;
- при развитии судорог вводят диазепам (около 0,1 мг/кг внутривенно).

Аналептики центрального действия противопоказаны при интоксикации местными анестетиками!

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Беременность. При беременности и в период родов лекарственное средство следует применять только в случае, когда польза для матери превышает потенциальный риск для плода или новорожденного.

Период грудного вскармливания. Применение в период грудного вскармливания возможно в случаях, когда ожидаемая польза для матери превышает риск для ребенка.

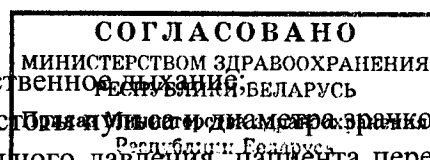
Влияние на способность управлять транспортными средствами и механизмами

В период лечения необходимо воздерживаться от вождения автотранспорта и занятий потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие формы взаимодействия. Антибактериальная активность сульфаниламидов уменьшается.

Ингибиторы холинэстеразы (например, физостигмин) и ацетазоламид могут ингибировать деградацию новокаина и повысить его эффективность.

Сосудосуживающие средства удлиняют действие местных анестетиков. Эффект недеполяризующих миорелаксантов удлиняется.



При одновременном применении с другими антиаритмическими средствами, бета-блокаторы и блокаторы кальциевых каналов усиливают тормозящее действие на АВ-соединение и внутрисердечное распространение стимула и силу сокращения.

Применение одновременно с ингибиторами МАО повышает риск развития артериальной гипотензии.

Антикоагулянты (ардепарин натрия, далтепарин натрия, данапароид натрия, эноксапарин натрия, гепарин, варфарин) повышают риск развития кровотечений. При одновременном применении новокаина с антикоагулянтами рекомендуется контролировать следующие показатели гемостаза – АЧТВ и протромбиновый индекс (или МНО). Эти исследования должны проводиться у больных из группы риска, а также в случае применения низкомолекулярных гепаринов (профилактическое лечение с ингибитором свертывания крови (гепарином) в низкой дозе). При возможности нужно прекратить антикоагулянтную терапию как можно раньше.

При обработке места инъекции местного анестетика антисептическими растворами, содержащими соли тяжелых металлов, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Новокаин не следует смешивать с другими лекарственными средствами.

Условия хранения. Хранить в защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 2 года. Не использовать по истечении срока годности.

Условия отпуска. По рецепту врача.

Упаковка.

По 100 мл, 250 мл или 500 мл в контейнеры полимерные. Каждый полимерный контейнер помещают в пакет из полиэтилена высокого давления или пленки полипропиленовой двухосноориентированной пищевой и укладывают вместе с инструкциями по медицинскому применению в количестве, соответствующем числу контейнеров полимерных, в ящики из картона гофрированного: 100 мл по 100 упаковок, 250 мл по 55 упаковок, 500 мл по 30 упаковок.

Информация о производителе

Белорусско-голландское совместное предприятие общество с ограниченной ответственностью «Фармлэнд», Республика Беларусь
222603, Минская область, г. Несвиж, ул. Ленинская, 124-3
Тел./факс 8(017)3733190, тел. 8(01770)63939

