

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НОВОКАЇН

(NOVOCAIN)

Склад:

діюча речовина: новокаїн (прокаїну гідрохлорид);

1 мл розчину містить новокаїну (прокаїну гідрохлорид) 5 мг;

допоміжна речовина: вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна рідина.

Фармакотерапевтична група. Препарати для місцевої анестезії.

Код АТХ N01B A02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Місцевоанестезуючий засіб з помірною активністю і великою терапевтичною широтою. Механізм анестезуючої дії пов'язаний із блокадою натрієвих каналів, гальмуванням калієвого току, конкуренцією з кальцієм, зниженням поверхневого натягу фосфоліпідного шару мембран, пригніченням окисно-відновних процесів та генерації імпульсів. При надходженні в кров зменшує утворення ацетилхоліну, знижує збудливість периферичних холінореактивних систем, проявляє блокуючу дію на вегетативні ганглії, зменшує спазми гладкої мускулатури, знижує збудливість серцевого м'яза і моторних зон кори головного мозку.

Фармакокінетика.

При парентеральному введенні добре всмоктується. Ступінь абсорбції залежить від місця і шляху введення (особливо від васкуляризації і швидкості кровотоку у місці введення) та підсумкової дози (кількості і концентрації). Швидко гідролізується

естеразами та холінестеразами плазми крові і тканин з утворенням двох основних фармакологічно активних метаболітів: діетиламіноетанолу (має помірну судинорозширювальну дію) і пара-амінобензойної кислоти (є конкурентним антагоністом сульфаніламідних хіміотерапевтичних лікарських засобів і може послабити їхню протимікробну дію). Період напіввиведення становить 30-50 секунд, у неонатальному періоді – 54-114 секунд. Виділяється переважно нирками у вигляді метаболітів (80 %); у незмінену вигляді виводиться не більше 2 %.

Погано абсорбується слизовими оболонками.

Клінічні характеристики.

Показання.

Місцева та інфільтраційна анестезія, лікувальні блокади.

Протипоказання.

Підвищена індивідуальна чутливість до препарату.

Міастенія, артеріальна гіпотензія, гнійний процес у місці введення, термінові хірургічні втручання, що супроводжуються гострою крововтратою, виражені фіброзні зміни в тканинах (для анестезії методом повзучого інфільтрату).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Препарат зменшує вплив *антихолінестеразних засобів* на нервово-м'язову передачу. Можлива перехресна сенсibilізація. *Антихолінестеразні препарати* підвищують токсичність прокаїну (пригнічують його гідроліз).

Внутрішньовенне введення новокаїну потенціює дію *засобів для наркозу*.

Новокаїн знижує ефективність *сульфаніламідних препаратів*, оскільки його метаболіт (параамінобензойна кислота) є конкурентним антагоністом.

Пролонгує нервово-м'язову блокаду, спричинену *суксаметонієм* (оскільки обидва препарати гідролізуються холінестеразою плазми).

Застосування одночасно з *інгібіторами МАО (фуразолідом, прокарбазином, селегіліном)* підвищує ризик розвитку артеріальної гіпотензії.

Потенціює дію *прямих антикоагулянтів*.

Особливості застосування.

Препарат з обережністю застосовувати хворим з обтяженим алергологічним анамнезом, при станах, що супроводжуються зниженням печінкового кровотоку, прогресуванні серцево-судинної недостатності (зазвичай внаслідок розвитку блокад серця, порушенні ритму серця, особливо брадикардиях і шоку), запальних захворюваннях, дефіциті псевдохолінестерази, нирковій недостатності, у пацієнтів літнього віку (від 65 років), тяжкохворих, ослаблених хворих, при вагітності, у період пологів та годування груддю.

При застосуванні препарату потрібний контроль функції серцево-судинної, дихальної і центральної нервової систем.

Для зменшення і усунення побічних реакцій необхідно застосовувати антигістамінні засоби та кортикостероїди.

Для поверхневої анестезії прокаїн мало придатний через слабку здатність проникати через неушкоджені слизові оболонки.

При проведенні місцевої анестезії, при застосуванні однієї і тієї ж самої загальної дози токсичність прокаїну тим вища, чим більш концентрованим є розчин. У зв'язку з цим зі збільшенням концентрації розчину загальну дозу рекомендується зменшити або розбавити розчин препарату до меншої концентрації (стерильним ізотонічним розчином натрію хлориду).

Для зниження системної дії, токсичності та пролонгації ефекту при місцевій анестезії прокаїн застосовують у комбінації з вазоконстрикторами (0,1 % розчин епінефрину гідрохлориду з розрахунку 1 крапля на 2-5 мл розчину).

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування у період вагітності можливе за умови доброї переносимості.

У період годування груддю застосування препарату можливе після попередньої ретельної оцінки очікуваної користі терапії для матері і потенційного ризику для немовляти.

При застосуванні під час пологів можливий розвиток брадикардії, апное, судом у новонародженого.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або

іншими механізмами.

У період лікування необхідно дотримуватись обережності при керуванні транспортними засобами і заняттях іншими потенційно небезпечними видами діяльності, що потребують підвищеної концентрації уваги і швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози.

При місцевій анестезії доза препарату залежить від концентрації, характеру оперативного втручання, способу введення, стану та віку хворого. При паранефральній блокаді у навколониркову клітковину дорослим вводити 50-70 мл 0,5 % (5 мг/мл) розчину новокаїну. Для інфільтраційної анестезії встановлені наступні найвищі дози (для дорослих): перша разова доза на початку операції – 0,75 г (150 мл 0,5 % розчину новокаїну). Надалі протягом кожної години операції – не більше 2 г (400 мл 0,5 % розчину новокаїну).

Діти.

Досвід застосування дітям відсутній.

Передозування.

Симптоми: блідість шкірних покривів і слизових оболонок, запаморочення, нудота, блювання, підвищена нервова збудливість, «холодний» піт, тахікардія, зниження артеріального тиску майже до колапсу, тремор, судоми, апное, метгемоглобінемія, пригнічення дихання, раптовий серцево-судинний колапс.

Дія на центральну нервову систему проявляється відчуттям страху, галюцинаціями, судомами, руховим збудженням.

Лікування: у випадках передозування введення препарату слід негайно припинити. При проведенні місцевої анестезії місце введення можна обколоти адреналіном. Загальні реанімаційні заходи, що включають інгаляції кисню, при необхідності – проведення штучної вентиляції легенів. Якщо судоми тривають понад 15-20 секунд, їх купірують внутрішньовенним введенням тіопенталу (100-150 мг) або діазепаму (5-20 мг). При артеріальній гіпотонії та/або депресії міокарда внутрішньовенно вводити ефедрин (15-30 мг), у тяжких випадках – проводити дезінтоксикаційну і симптоматичну терапію.

У випадку розвитку інтоксикації після ін'єкції новокаїну у м'язи ноги або руки рекомендується термінове накладення джгута для зниження подальшого надходження препарату в загальний кровообіг.

Побічні реакції.

Новокаїн зазвичай добре переноситься, однак іноді можливі наступні побічні реакції.

Неврологічні розлади: головний біль, запаморочення, сонливість, слабкість, рухове занепокоєння, втрата свідомості, судоми, тризм, тремор, зорові і слухові порушення, ністагм, синдром кінського хвоста (параліч ніг, парестезії), параліч дихальних м'язів, блок моторний і чуттєвий, повернення болю, стійка анестезія.

З боку серцево-судинної системи: підвищення або зниження артеріального тиску, периферична вазодилатація, колапс, брадикардія, аритмії, біль у грудній клітці.

З боку сечовидільної системи: мимовільне сечовипускання.

З боку шлунково-кишкового тракту: нудота, блювання, мимовільна дефекація.

З боку системи крові та лімфатичної системи: метгемоглобінемія.

З боку імунної системи: алергічні реакції, у тому числі з боку шкіри – свербіж, висипання, дерматит, лущення шкіри, гіперемія; інші анафілактичні реакції (у т. ч. ангіоневротичний набряк, анафілактичний шок), кропив'янка (на шкірі і слизових оболонках).

Інші: гіпотермія, зміни у місці введення.

Термін придатності.

3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 5 мл в ампулі, по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці, по 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ПАТ «Галичфарм».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 79024, м. Львів, вул. Опришківська, 6/8.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

НОВОКАИН

(NOVOCAIN)

Состав:

действующее вещество: новокаин (прокаина гидрохлорид);

1 мл раствора содержит новокаина (прокаина гидрохлорид) 5 мг;

вспомогательные вещества: вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Препараты для местной анестезии.

Код АТХ N01B A02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Местноанестезирующее средство с умеренной активностью и большой терапевтической широтой. Механизм анестезирующего действия связан с блокадой натриевых каналов, торможением калиевого тока, конкуренцией с кальцием,

снижением поверхностного натяжения фосфолипидного слоя мембран, угнетением окислительно-восстановительных процессов и генерации импульсов. При поступлении в кровь уменьшает образование ацетилхолина, снижает возбудимость периферических холинореактивных систем, проявляет блокирующее действие на вегетативные ганглии, уменьшает спазмы гладкой мускулатуры, снижает возбудимость сердечной мышцы и моторных зон коры головного мозга.

Фармакокинетика.

При парентеральном введении хорошо всасывается. Степень абсорбции зависит от места и пути введения (особенно от васкуляризации и скорости кровотока в месте введения) и итоговой дозы (количества и концентрации). Быстро гидролизуется эстеразами и холинэстеразами плазмы крови и тканей с образованием двух основных фармакологически активных метаболитов: диэтиламиноэтанола (имеет умеренное сосудорасширяющее действие) и парааминобензойной кислоты (является конкурентным антагонистом сульфаниламидных химиотерапевтических лекарственных средств и может ослабить их противомикробное действие). Период полувыведения составляет 30-50 секунд, в неонатальном периоде – 54-114 секунд.

Выделяется преимущественно почками в виде метаболитов (80 %); в неизмененном виде выводится не более 2 %.

Плохо абсорбируется слизистыми оболочками.

Клинические характеристики.

Показания.

Местная и инфильтрационная анестезия, лечебные блокады.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к препарату.

Миастения, артериальная гипотензия, гнойный процесс в месте введения, срочные хирургические вмешательства, сопровождающиеся острой кровопотерей, выраженные фиброзные изменения в тканях (для анестезии методом ползучего инфильтрата).

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Препарат уменьшает влияние *антихолинэстеразных средств* на нервно-мышечную передачу. Возможна перекрестная сенсibilизация. *Антихолинэстеразные препараты* повышают токсичность прокаина (угнетают его гидролиз).

Внутривенное введение новокаина потенцирует действие *средств для наркоза*.

Новокаин снижает эффективность *сульфаниламидных препаратов*, поскольку его метаболит (парааминобензойная кислота) является конкурентным антагонистом.

Пролонгирует нервно-мышечную блокаду, обусловленную *суксаметонием* (поскольку оба препарата гидролизуются холинэстеразой плазмы).

Применение одновременно с *ингибиторами МАО (фуразолидоном, прокарбазином, селегилином)* повышает риск развития артериальной гипотензии.

Потенцирует действие *прямых антикоагулянтов*.

Особенности применения.

Препарат с осторожностью вводить больным с отягощенным аллергологическим анамнезом, при состояниях, сопровождающихся снижением печеночного кровотока, прогрессировании сердечно-сосудистой недостаточности (обычно вследствие развития сердечных блокад, нарушениях ритма сердца, особенно брадикардиях и шоке), воспалительных заболеваниях, дефиците псевдохолинэстеразы, почечной недостаточности, у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет), тяжелобольных, ослабленных больных, при беременности, в период родов и кормления грудью.

При применении препарата требуется контроль функции сердечно-сосудистой, дыхательной и центральной нервной систем.

Для уменьшения и устранения побочных реакций необходимо применять антигистаминные средства и кортикостероиды.

Для поверхностной анестезии прокаин мало пригоден из-за слабой способности проникать через неповрежденные слизистые оболочки.

При проведении местной анестезии, при применении одной и той же общей дозы токсичность прокаина тем выше, чем более концентрированным является раствор. В связи с этим с увеличением концентрации раствора общую дозу рекомендуется уменьшить или разбавить раствор препарата до меньшей концентрации (стерильным изотоническим раствором натрия хлорида).

Для снижения системного действия, токсичности и пролонгации эффекта при местной анестезии прокаин применять в комбинации с вазоконстрикторами (0,1 % раствор эpineфрина гидрохлорида из расчета 1 капля на 2-5 мл раствора).

Применение в период беременности или кормления грудью.

Применение в период беременности возможно при условии хорошей переносимости. В период кормления грудью применение препарата возможно после предварительной тщательной оценки ожидаемой пользы терапии для матери и потенциального риска для младенца.

При применении во время родов возможно развитие брадикардии, апноэ, судорог у

новорожденного.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и скорости психомоторных реакций.

Способ применения и дозы.

При местной анестезии доза препарата зависит от концентрации, характера оперативного вмешательства, способа введения, состояния и возраста больного. При паранефральной блокаде в околопочечную клетчатку взрослым вводить 50-70 мл 0,5 % (5 мг/мл) раствора новокаина. Для инфильтрационной анестезии установлены следующие высшие дозы (для взрослых): первая разовая доза в начале операции – 0,75 г (150 мл 0,5 % раствора новокаина). В дальнейшем в течение каждого часа операции – не более 2 г (400 мл 0,5 % раствора новокаина).

Дети.

Опыт применения детям отсутствует.

Передозировка.

Симптомы: бледность кожных покровов и слизистых оболочек, головокружение, тошнота, рвота, повышенная нервная возбудимость, «холодный» пот, тахикардия, снижение артериального давления почти до коллапса, тремор, судороги, апноэ, метгемоглобинемия, угнетение дыхания, внезапный сердечно-сосудистый коллапс.

Воздействие на центральную нервную систему проявляется чувством страха, галлюцинациями, судорогами, двигательным возбуждением.

Лечение: в случаях передозировки введение препарата следует немедленно прекратить. При проведении местной анестезии место введения можно обколоть адреналином. Общие реанимационные мероприятия, включающие ингаляции кислорода, при необходимости – проведение искусственной вентиляции легких. Если судороги продолжаются более

15-20 секунд, их купируют внутривенным введением тиопентала (100-150 мг) или диазепама (5-20 мг). При артериальной гипотонии и/или депрессии миокарда внутривенно вводят эфедрин

(15-30 мг), в тяжелых случаях – проводить дезинтоксикационную и симптоматическую терапию.

В случае развития интоксикации после инъекции новокаина в мышцы ноги или руки рекомендуется срочное наложение жгута для снижения дальнейшего поступления препарата в общий кровоток.

Побочные реакции.

Новокаин обычно хорошо переносится, однако иногда возможны следующие побочные реакции.

Неврологические расстройства: головная боль, головокружение, сонливость, слабость, двигательное беспокойство, потеря сознания, судороги, тризм, тремор, зрительные и слуховые нарушения, нистагм, синдром конского хвоста (паралич ног, парестезии), паралич дыхательных мышц, блок моторный и чувствительный, возвращение боли, стойкая анестезия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение или снижение артериального давления, периферическая вазодилатация, коллапс, брадикардия, аритмия, боль в грудной клетке.

Со стороны мочевыделительной системы: непроизвольное мочеиспускание.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, непроизвольная дефекация.

Со стороны системы крови и лимфатической системы: метгемоглобинемия.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, в том числе со стороны кожи – зуд, сыпь, дерматит, шелушение кожи, гиперемия; другие анафилактические реакции (в т. ч. ангионевротический отек, анафилактический шок), крапивница (на коже и слизистых оболочках).

Другие: гипотермия, изменения в месте введения.

Срок годности.

3 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Упаковка. По 5 мл в ампуле, по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 2 контурных ячейковых упаковки в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель.

ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 79024, г. Львов, вул. Опрышковская, 6/8.