

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

НОВОКАЇН-ДАРНИЦЯ
(NOVOCAIN-DARNITSA)

Склад:

діюча речовина: procaine;

1 мл розчину містить: новокаїну (прокаїну гідрохлориду) 5 мг;

допоміжні речовини: кислота хлористоводнева, 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 великим спектром терапевтичної дії. Механізм анестезуючої дії пов'язаний з 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 і тканин з утворенням двох основних фармакологічно активних метаболітів: діетиламіноетанолу (має помірну судинорозширювальну дію) і параамінобензойної кислоти (є конкурентним антагоністом сульфамідних 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 незміненому 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 у тканинах (для анестезії методом повзучого інфільтрату).

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

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

Застосування одночасно з *інгібіторами МАО* (фуразолідон, прокарбазин, селегілін) підвищує ризик розвитку артеріальної гіпотензії.

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

Метаболіт прокаїну (параамінобензойна кислота) є конкурентним антагоністом *сульфаніламідних препаратів* і може послабити їхню протимікробну дію.

Потенціює дію *прямих антикоагулянтів*.

Внутрішньовенне введення новокаїну потенціює дію *засобів для наркозу*.

Особливості застосування.

Для зменшення всмоктування і подовження дії розчинів новокаїну при місцевій анестезії до них слід додавати розчин адреналіну гідрохлориду (0,1 %) – по 1 краплі на 2 або 5, або 10 мл розчину новокаїну.

Для попередження побічних реакцій спочатку слід провести пробу на переносимість, про яку свідчать набряк і почервоніння місця ін'єкції. При позитивній реакції прокаїн не застосовувати.

При застосуванні препарату необхідно контролювати функції серцево-судинної, дихальної і центральної нервової систем. З обережністю призначати препарат при тяжких захворюваннях серця (блокади, порушення ритму, особливо брадикардія), печінки і нирок, обтяженому алергологічному анамнезі.

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

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

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування в 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 навколонишкову 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 – не більше 0,75 г (тобто 150 мл 0,5 % розчину новокаїну). Надалі протягом кожної години операції – не більше 2 г (тобто 400 мл 0,5 % розчину новокаїну).

Діти.

Дітям застосування заборонене.

Передозування.

Передозування можливе тільки при застосуванні препарату у високих дозах.

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. Проводити загальні реанімаційні заходи, що включають інгаляцію кисню, при необхідності – проведення штучної вентиляції легенів. Якщо судоми тривають понад 15-20 секунд, їх слід купірувати внутрішньовенним введенням тіопенталу (100-150 мг) або діазепаму (5-20 мг). При артеріальній гіпотензії і/або депресії міокарда внутрішньовенно вводити ефедрин (15-30 мг), у тяжких випадках – дезінтоксикаційна і симптоматична терапія.

При проведенні місцевої анестезії місце введення можна обколоти адреналіном. У випадку розвитку інтоксикації після ін'єкції новокаїну у м'язи ноги або руки слід терміново накласти джгут для зниження подальшого надходження препарату в загальний кровотік.

Побічні реакції.

Новокаїн зазвичай добре переноситься, однак іноді можливі такі побічні ефекти.

З боку центральної і периферичної нервової системи: 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 системи травлення: нудота, блювання, мимовільна дефекація.

З боку системи крові: метгемоглобінемія.

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

Зміни в місці введення: при обробці місця ін'єкції препарату дезінфікуючими розчинами, що містять важкі метали, підвищується ризик розвитку місцевої реакції у вигляді болючості і набряку.

Інші: гіпотермія.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморозувати.

Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 2 мл або по 5 мл в ампулі; по 10 ампул у коробці; по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.
Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства

НОВОКАИН-ДАРНИЦА
(NOVOCAIN-DARNITSA)

Состав:

действующее вещество: procaine;

1 мл раствора содержит: новокаина (прокаина гидрохлорида) 5 мг;

вспомогательные вещества: кислота хлористоводородная, 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 большим спектром терапевтического действия. 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, оказывает 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 гидролизруется эстеразами и холинэстеразами плазмы 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.

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

Применение одновременно с *ингибиторами МАО* (*фуразолидон, прокарбазин, селегилин*) повышает риск развития артериальной гипотензии.

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

Метаболит прокаина (ПАБК) является конкурентным антагонистом *сульфаниламидных препаратов* и может ослабить их противомикробное действие.

Потенцирует действие *прямых антикоагулянтов*.

Внутривенное введение новокаина потенцирует действие *средств для наркоза*.

Особенности применения.

Для уменьшения всасывания и удлинения действия растворов новокаина при местной анестезии к ним следует добавлять раствор адреналина гидрохлорида (0,1 %) – по 1 капле на 2 или 5, или 10 мл раствора новокаина.

Для предупреждения побочных реакций сначала следует провести пробу на переносимость, о которой свидетельствуют отек и покраснение места инъекции. При положительной реакции прокаин не применять.

При применении препарата необходимо контролировать функции сердечно-сосудистой, дыхательной и центральной нервной систем. С осторожностью назначать препарат при тяжелых заболеваниях сердца (блокады, нарушения ритма, особенно брадикардия), печени и почек, отягощенном аллергологическом анамнезе.

При проведении местной анестезии при применении одной и той же общей дозы токсичность прокаина тем выше, чем больше концентрация применяемого раствора. В связи с этим с увеличением концентрации раствора общую дозу необходимо уменьшить или разбавить раствор препарата до меньшей концентрации стерильным физиологическим раствором натрия хлорида.

Препарат применять с осторожностью при состояниях, сопровождающихся снижением печеночного кровотока, прогрессировании сердечно-сосудистой недостаточности (обычно вследствие развития блокад сердца и шока), воспалительных заболеваниях, дефиците псевдохолинэстеразы, почечной недостаточности, у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет), тяжелобольных, ослабленных больных, в период беременности или кормления грудью, в период родов.

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 – не более 0,75 г (то есть 150 мл 0,5 % раствора новокаина). В дальнейшем в течение каждого часа операции – не более 2 г (то есть 400 мл 0,5 % раствора новокаина).

Дети.

Детям применение запрещено.

Передозировка.

Передозировка возможна только при применении препарата в высоких дозах.

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. Проводить общие реанимационные мероприятия, включающие ингаляцию кислорода, при необходимости – проведение искусственной вентиляции легких. Если судороги продолжаются более 15-20 секунд, их следует купировать введением тиопентала (100-150 мг) или диазепама (5-20 мг). При артериальной гипотензии и/или депрессии миокарда внутривенно вводить эфедрин (15-30 мг), в тяжелых случаях – дезинтоксикационная и симптоматическая терапия.

При проведении местной анестезии место введения можно обколоть адреналином. В случае развития интоксикации после инъекции новокаина в мышцы ноги или руки надо быстро наложить жгут для снижения дальнейшего поступления препарата в общий кровоток.

Побочные реакции.

Новокаин обычно хорошо переносится, однако иногда возможны такие побочные эффекты.

Со стороны центральной и периферической нервной системы: 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 пищеварительной системы: тошнота, рвота, непроизвольная дефекация.

Со стороны крови: метгемоглобинемия.

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

Изменения в месте введения: при обработке места инъекции препарата дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Другие: гипотермия.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

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

Упаковка.

По 2 мл или по 5 мл в ампуле; по 10 ампул в коробке; по 5 ампул контурной ячейковой упаковке; по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.
Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.