

БЕКТЕМ

Кыргыз Республикасынын
Саламаттык сактоо министрлигинин
алдындагы Дары каражаттары жана
медициналык буюмдар
департаментинин директорунун
орун басары
Кысанов Т.А. 
«20» март 2024-ж.

**ДАРЫ КАРАЖАТЫН МЕДИЦИНАДА КОЛДОНУУ БОЮНЧА
НУСКАМА**

**ЛОНГОКАИН
(LONGOKAIN)**

Соодадагы аталышы
ЛОНГОКАИН
(LONGOKAIN)

Эл аралык патенттелбеген аталышы
Bupivacaine

Курамы

1 мл эритме төмөнкүлөрдү камтыйт:
таасир берүүчү зат: бупивакаин гидрохлориди 5 мг;
көмөкчү заттар: натрий хлорид; инъекциялар үчүн суу.

Дарынын түрү

Инъекциялар үчүн эритме.

Сүрөттөмөсү

Тунук түссүз же бир аз саргыч эритме.

Фармадарылык тобу

Жергиликтүү анестезиялар үчүн препараттар. Амиддер. Бупивакаин.
АТХ коду: N01BB01

Фармакологиялык касиеттери

Фармакодинамикасы

Лонгокаин бупивакаинди камтыйт – анестезиялык жана анальгезиялык таасири менен амиддик типтеги узак таасир берген жергиликтүү анестетик. Жогорку дозаны колдонууда хирургиялык анестезияга жетет, анда төмөн дозалар сенсордук бөгөттөөгө (аналгезиялар) алып келет, ал азыраак айкын мотордук бөгөт менен коштолот.

Бупивакаиндин жергиликтүү ооруксуздандырган таасиринин башталышы жана узактыгы препараттын куюлган жеринен жана дозасынан көз каранды. Бупивакаин, башка жергиликтүү анестетиктер сыяктуу, кайрадан калыбына келе тургандай нерв булаларынын импульстарын бөгөттөйт, нерв мембраналары аркылуу иондордун натрийинин ташылуусун басат. Нерв мембраналарында натрий каналдары жергиликтүү анестетиктин молекуласын бекитүү үчүн рецепторлорду камтыйт.

Мындай таасирлер мээнин дүүлүккөн мембраналарында жана миокардада байкалышы мүмкүн. Ошол учурда препараттын ашыкча өлчөмү системалык кан айланууга жетет, токсиндүүлүктүн симптомдору жана белгилери пайда болушу мүмкүн, борбордук нерв системасынан жана жүрөк-кан тамыр системасынан пайда болот.

Борбордук нерв системасына токсиндүү таасирдин тийгизген белгилери («Кыйыр таасирлер» бөлүмүн караңыз), эреже катары, жүрөк-кан тамыр таасирине негиз болот, анткени борбордук нерв системасына токсиндүү таасирдин тийгизген белгилери кан плазмасында препарат төмөнүрөөк концентрацияларда байкалат. Жергиликтүү анестетиктердин түз жүрөк таасирлери жай өткөрүмдүүлүктү, терс инотропизм жана жүрөктүн токтошун өзүнө камтыйт. Кыйыр жүрөк-кан тамыр таасирлери (артериялык гипотензия, брадикардия) эпидуралдык бөгөттөн кийин өрчүүсү мүмкүн, коштоочу симпатикалык бөгөттүн деңгээлине көз каранды болот.

Фармакокинетикасы

Бупивакаиндин рКа нын көлөмү 8,2 түзөт, ал эми бөлүштүрүү коэффициенти 346 түзөт (рН 7,4гү 25 °С n-октанол/фосфаттык буфер). Метаболиттер бупивакаинге караганда азыраак болгон фармакологиялык активдүүлүккө ээ.

Кан плазмасындагы бупивакаиндин концентрациясы дозадан, куюу жолунан жана инъекция ордундагы васкуляризациядан көз каранды.

Бупивакаин эпидуралдык аймакта толугу менен абсорбцияланат, жарым-жартылай бөлүнүп чыгуунун кийинки эки фазалык модели менен: жарым-жартылай бөлүнүп чыгуунун баштапкы мезгили 7 минутаны түзөт, кийинкиси – 6 саатты түзөт. Жай абсорбция бупивакаиндин бөлүнүп чыгуу ылдамдыгын чектөөчү фактор болуп саналат жана жарым-жартылай бөлүнүп чыгуунун терминалдык мезгили эпидуралдык колдонуудан кийин кан тамыр ичине куйгандагыга караганда чоң болуп саналаарын түшүндүрөт.

Бупивакаиндин жалпы клиренси 0,58 л/мин түзөт, тең салмак абалда бөлүштүрүү көлөмү – 73 л түзөт, жарым-жартылай бөлүнүп чыгуунун терминалдык мезгили – 2,7 саатты түзөт жана ортодогу боор экстракциясынын ортодогу коэффициенти – 0,38 дарыны кан тамырга куйгандан кийин. Плазма белоктору менен байланышуусу болжол менен 96 % түзөт, байланышуу көбүнчө α_1 -кычкыл-гликопротеини менен жүрөт. Бупивакаиндин клиренси толугу менен боордун метаболизминен көз каранды жана боор перфузиясына караганда жеке боор ферменттеринин активдүүлүгүнө тиешелүү болгон өзгөрүүлөргө өтө сезгич келет.

Педиатриялык популяция

Дарынын фармакокинетикасы чоңдордо кандай болсо балдарда да ошондой.

Кан плазмасындагы дарынын жалпы концентрациясынын жогорулоосу узак убакытка созулган эпидуралдык инфузияны жүргүзүү учурунда байкалган. Бул операциядан кийинки α_1 -кычкыл гликопротеиндин деңгээлинин жогорулашы менен байланыштуу. Байланышпаган, тагыраагы фармакологиялык жактан активдүү болгон дарынын концентрациясы операцияга чейин жана операциядан кийин да болушу мүмкүн.

Бупивакаин бала тонунун бөгөтү аркылуу өтөт жана байланышпаган дарынын концентрациясына карата тең салмак абалга тез жетет. Бирок жалпы плазмалык концентрация кан плазмасынын белоктору менен байланышуусу өтө төмөн деңгээлди ээлеген энелерге караганда түйүлдүктө төмөн болот.

Бупивакаин боордо кеңири метаболизденет, көбүнчө жыпар жыттуу гидроксилерлөө жолунан 4-гидроксипупивакаинге чейин жана N-деалкилирлөөдөн РРХ га чейин, жада калса эки жол тең Р450 3А4 цитохрому менен коштолгон. Бупивакаиндин 1 % га жакыны 24 сааттын ичинде заара менен өзгөрүлбөгөн түрдө чыгарылат жана 5 % га жакыны – РРХ түрүндө. РРХ жана 4-гидроксипупивакаиндин кан плазмасындагы концентрациясы бупивакаинди куюу учурунда жана узак убакыт куйгандан кийин дары каражатынын баштапкы концентрациясына салыштырмалуу төмөн болуп кала берет.

Коопсуздугу боюнча клиникага чейинки маалыматтар

Бупивакаин гидрохлорид жакшы сыноодон өткөн активдүү зат болуп саналат.

Колдонууга көрсөтмөлөр

Лонгокаин, 0,5 % эритмени тери аркылуу болгон инфильтрация, перифериялык (ардын) нервдик бөгөттөрдү жана борбордук нервдик (ердин) (каудалдык же эпидуралдык) бөгөттөр (дүн) аркылуу жергиликтүү анестезияны жүргүзүү үчүн колдонуу керек, демек, качан узакка созулган анестезияны жүргүзүү зарыл болгон учурларда ушундай колдонот. Сенсордук нервдик бөгөт мотордук бөгөткө караганда өтө айкын болгондуктан, Лонгокаин өзгөчө ооруну жеңилдетүүдө таасирдүү болот, мисалы төрөт учурларында.

Каршы көрсөтмөлөр

Таасир берүүчү затка же препараттын бардык бөлүктөрүнө, амид тобундагы жергиликтүү анестетиктерге жогорку сезгичтик.

Бупивакаинди кан тамыр регинардык анестезиясы үчүн колдонууга болбойт (Биер бөгөтү).

Эпидуралдык анестезия жергиликтүү анестетикти колдонууга карабастан өзүнүн каршы көрсөтмөлөрү болот, алар өзүнө кийинкилерди камтыйт:

- менингит, полиомиелит, баш-сөөк ичиндеги кан куюлуу, пернициоздук анемиянын натыйжасындагы жүлүндүн бир аз курч аралаш дегенерациясы жана баш менен жүлүн шишимиктери сыяктуу активдүү стадиядагы борбордук нерв системасынын оорулары;
- омурткалардын туберкулёзу;
- жериндеги же люмбалдык пункцияны жүргүзгөн жердин жанындагы теринин ириңдүү инфекциясы;
- кардиогендик жана гиповолемиялык эстен тануу;
- кандын уюшунун бузулуусу же кезектеги антикоагулянттар менен дарылоо.

Башка дары каражаттары менен өз ара таасири жана өз ара таасирлердин башка түрлөрү

Жергиликтүү анестетиктерди же амиддик анестетиктер менен түзүлүшү окшош болгон препараттарды, мисалы кээ бир лидокаин же мексилетин сыяктуу антиаритмиялык каражаттарды колдонгон бейтаптарга бупивакаинди этияттык менен белгилөө керек, себеби аддитивдик токсиндүү коркунуч жогорулайт. Бупивакаиндин III класстагы антиаритмиялык каражаттар менен болгон (мисалы, амиодарон менен) өз ара таасирлеринин спецификалык изилдөөлөрү жүргүзүлгөн эмес, бирок бул дарыларды белгилөө зарыл болгон учурда этияттыкты сактоо керек («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз).

Өзгөчө көрсөтмөлөр

Бупивакаинди эпидуралдык анестезия же перифериялык нервдердин бөгөтү үчүн колдонууда жүрөктүн токтоп калуусу тууралуу маалыматтар бар. Кээ бир учурларда жандандыруу оор болгон жана бейтап тарабынан оң жоопко жетүүгө чейин узакка созулган жандандыруу иш чараларын жүргүзүү талап кылынган. Ошого карабастан кээ бир учурларда анык адекваттык даярдыкка жана тиешелүү дарылоого карабастан жандандыруу мүмкүн эмес болгон.

Бардык жергиликтүү анестетиктер сыяктуу эле, дарыны жергиликтүү анестезияны жүргүзүү максатында колдонуу учурунда бупивакаин кандагы анестетиктердин концентрациясынын жогорку пайда болуусуна алып келет, борбордук нерв жана жүрөк-кан тамыр системаларына курч токсиндүү таасирди пайда кылышы мүмкүн. Мындай бузулуу препаратты капыстан кан тамыр ичине куйгандын натыйжасында же катуу васкуляцияланган жерге куйганда пайда болушу мүмкүн. Ашказан аритмиясы, ашказан фибрилляциясы, күтүүсүз жүрөк-кан тамыр жетишсиздиги жана бупивакаиндин жогорку системалык концентрациясы менен байланышкан өлүмдөр тууралуу маалыматтар түшкөн.

Ылайык келген жандандыруучу жабдуулар жергиликтүү жана жалпы анестезия жүргүзүлүп жаткан ар бир учурда жетиштүү болуш керек. Жооптуу дарыгер дарыны кан тамыр ичине куюудан алыс болуу үчүн сактык иштеринин зарыл чараларын кабыл алышы керек («Колдонуу жолу жана дозалары» бөлүмүн караңыз). Ар бир бөгөттүк анестезияны баштоодон мурда дары каражаттарынын кан тамырга куюу үчүн, жандандыруучу иштерди жүргүзүү максатында жеткиликтүүлүктү камсыз кылуу зарыл. Дарыгерлер процедураларды жүргүзүү үчүн даярдоонун ылайыктуу жана жетиштүү деңгээлин алуулары керек жана диагностика же кыйыр таасирлерди дарылоо менен, же токсиндүүлүктүн системасы менен, же башка татаалдануулар менен таанышып чыгышы керек («Ашыкча дозалоо» жана «Кыйыр таасирлер» бөлүмдөрүн караңыз).

Чоң перифериялык нервдердин бөгөттөрү катуу васкуляризацияланган аймактарда, көбүнчө өтө чоң кан тамырларга жакын болгон жергиликтүү анестетиканын чоң көлөмүн колдонууну талап кылышы мүмкүн. Мындай учурларда ички кан тамыр инъекциясы же системалык абсорбция коркунучу бар, дарынын кан плазмасындагы жогорку концентрацияларына алып келиши мүмкүн. Ашыкча дозалоо же дарыны капыстан кан тамырга куюу токсиндүү реакциялардын өрчүшүнө алып келиши мүмкүн.

Бупивакаин гидрохлорид жай топтолгондуктан дозаны кайталап куюу кандагы дарынын деңгээлинин олуттуу жогорулоосуна алып келиши мүмкүн. Дарынын көтөрүмдүүлүгү бейтаптын абалы менен чогуу өзгөрөт.

Бирок регионардык анестезия көбүнчө анестезия жүргүзүү үчүн оптималдуу ыкма болуп саналат, коркунучтуу кыйыр таасирлердин өрчүү коркунучун азайтуу үчүн кээ бир бейтаптар өзгөчө көңүлдү талап кылышат:

- улгайып калган бейтаптарга жана ден соолугунун жалпы начарлоосу бар бейтаптарга алардын физикалык абалына туура келе турган дарынын дозасын азайтуу зарыл;
 - жүрөктүн бир аз же толук бөгөтү бар бейтаптарга – жергиликтүү анестетиктер миокарда өткөрүмдүүлүгүн кысышы мүмкүн болгондуктан;
 - боордун өрчүүчү оорусу же татаал бөйрөк дисфункциясы бар бейтаптарга;
 - кош бойлуулуктун акыркы стадиясындагы бейтаптарга;
 - III класстагы антиаритмиялык каражаттарды (амиодарон) кабыл алган бейтаптар кызматкердин кылдат көзөмөлүндө болуш керек жана дарынын кардиологиялык таасирлери аддитивдик болгондуктан ЭКГ-көзөмөлдү жүргүзүү керек.
- Эфирдик түрдөгү (прокаин, тетракаин, бензокаин жана башка) жергиликтүү анестетиктерге аллергиялык реакциялары бар бейтаптар бупивакаин сыяктуу амиддик түрдөгү дарыларга болгон кайчылаш сезгичтикти көрсөткөн эмес.
- Жергиликтүү анестезия менен байланышкан кээ бир процедуралар кабыл алынып жаткан жергиликтүү анестетикке карабастан олуттуу жагымсыз реакциялардын өрчүүсүнө алып келиши мүмкүн.
- Жүрөк-кан тамыр бузулуулары бар бейтаптарга эпидуралдык анестезия үчүн жергиликтүү анестетиктерди кабыл алууда этияттыкты сактоо керек, мындай бейтаптар AV-өткөрүмдүүлүгү менен байланышкан функционалдык өзгөрүүлөрдү компенсациялоо мүмкүндүгүн азыраак ээлешет, бул дары каражаттардын таасиринен пайда болгон.
 - Борбордук невралдык бөгөттөрдү жүргүзүүнүн жыйынтыгында өрчүгөн физиологиялык таасирлер артериялык гипотензия бар болгондо көбүрөөк билинет. Гиповолемиясы бар бейтаптарга эпидуралдык анестезияны жүргүзүү учурунда кандай болбосун капыстан болгон же татаал артериялык гипотензия өрчүшү мүмкүн. Ошондуктан гиповолемиясы дарыланбаган жана веноздук агымдын олуттуу бузулуусу бар бейтаптарда эпидуралдык анестезияны жүргүзүүдөн алыс болуу керек же этияттык менен колдонуу керек.
 - Абдан сейрек учурларда ретробульбардык инъекциялар баш-сөөк субарахноидалдык аймагына жетиши мүмкүн жана көрүүнү убактылуу жоготууну, жүрөк-кан тамыр жетишсиздигин, апноэ жана калтыроолорду пайда кылышы мүмкүн ж.б.
 - Жергиликтүү анестетиктердин ретро- жана бульбардын айланасындагы инъекциясы көз булчуңдарынын туруктуу дисфункциясынын өрчүшү үчүн белгилүү коркунучту пайда кылышы мүмкүн. Негизги себептери нервдердин мертинген жабыркоосу жана булчуңдарга жана нервдерге куюлган жергиликтүү анестетиктердин жергиликтүү токсиндүү таасирлери болуп саналат. Мындай ткандык реакциялардын оордугу жараттын деңгээлинен, жергиликтүү анестетиктин концентрациялары жана ткандарга жергиликтүү анестетиктердин узакка созулган таасиринен көз каранды. Ушул себептен, башка бардык жергиликтүү анестетиктер менен болгон учурдагыдай эле таасирдүү концентрациянын жана жергиликтүү анестетиктин эң төмөн дозасын колдонуу керек.
 - Кан тамыр ичкертүүчү дарылар ткандардын реакцияларын күчөтүшү мүмкүн, ошондуктан аларды көрсөтмөлөр учурунда гана колдонуу керек.

- Жергиликтүү анестетиктердин эң төмөн дозаларын ретробульбардык, стоматологиялык бөгөттөрдү жана жылдыз сымал түйүндүн бөгөтү менен моюн жана баш аймагына капыстан кан тамыр ичине куюу системалык токсиндүүлүктүн өрчүшүнө алып келиши мүмкүн.

- Парацервикалдык бөгөт акушерликте колдонулуучу анестезиянын башка түрлөрүнө караганда түйүлдүккө көбүрөөк жагымсыз таасир көрсөтүшү мүмкүн. Бупивакаиндин системалык токсиндүүлүгү болгондуктан, парацервикалдык бөгөт үчүн колдонууда этияттыкты сактоо керек.

- Каттоодон кийинки мезгилде хирургиялык кийлигишүүлөрдөн кийин жергиликтүү анестетиктердин узак убакытка созулган ички кан тамыр инфузиясын алган бейтаптарда хондроллиз учурлары тууралуу маалымдашкан. Көпчүлүк учурларда хондролиздин ийин муунун жабыркаткандыгы тууралуу маалымдашкан. Көптөгөн этиологиялык факторлорду жана таасир берүү механизминде тиешелүү илимий адабияттагы маалыматтардын карама-каршылыгын эске алуу менен себеп-изилдөө байланышы аныкталган эмес. Узакка созулган ички кан тамыр инфузия Лонгокаин дарысын колдонуу үчүн аныкталган көрсөтмө болуп саналбайт.

Бардык жергиликтүү анестетиктерди колдонуу менен болгон эпидуралдык анестезия артериялык гипотензия жана брадикардияны пайда кылышы мүмкүн, алдын алуу керек жана ылайыктуу чараларды көрүү керек. Мындай таасирлердин коркунучу азайышы мүмкүн, мисалы, кан тамыр ичкертүүчү дары каражаттарын куюу менен. Артериялык гипотензия кан тамырга симпатомиметикалык түрдө дарыланыш керек, зарыл болгондо кайталап куюу менен. Татаал артериялык гипотензия кан агуу жана ооруксуздандыруунун натыйжасында гиповолемиянын же массивдүү асцити бар бейтаптардагы аорта-жыныстык окклюзиянын жыйынтыгында, ич көндөйүнүн чоң шишиктери же кош бойлуулуктун акыркы мезгилдеринде пайда болушу мүмкүн. Жүрөк декомпенсациясы бар бейтаптарда олуттуу артериялык гипотензиядан алыс болуу керек.

Гиповолемиясы бар бейтаптарга эпидуралдык анестезияны жүргүзүү учурунда кандай болбосун капысынан же татаал артериялык гипотензия өрчүшү мүмкүн.

Эпидуралдык анестезия кабырга арасындагы булчуңдардын кыймылсыздыгын пайда кылышы мүмкүн, ал эми плевралдык суу толуу бар бейтаптар дем алуу жетишсиздиги менен жабыркашы мүмкүн. Септицемия операциядан кийинки мезгилдеги интраспиналдык абсцесстин пайда болуу коркунучун жогорулатышы мүмкүн.

Бупивакаинди муун ичине инъекция түрүндө куюуда жакын арада муун ичинде чоң жарат алгандыгына күмөн жаралса же муунда хирургиялык процедуралардын учурунда пайда болгон чоң ачык катмарлар бар болсо, этият болуу сунушталат, бул сиңирүүнү тездетиши мүмкүн жана кан плазмасындагы жогорку концентрациялардын пайда болуусуна алып келиши мүмкүн.

Препарат төмөнкүлөрдү камтыйт:

0,137 ммоль (же 3,147 мг) натрийди 1 мл;

0,685 ммоль (же 15,74 мг) натрийди 5 мл дозага. Натрий-көзөмөлдөнгөн диетадагы бейтаптарда бул нерсени эске алуу керек.

Кош бойлуу жана бала эмизүү мезгилинде колдонуу

Кош бойлуулук

Кош бойлуулук агымына болгон жагымсыз таасирлер тууралуу далилдер жок. Бупивакаинди кош бойлуу мезгилинде чоң дозаларда колдонууда келемиштердин укум-тукумга жашоосу төмөндөгөнүнүн жана дарынын коёндордо эмбриологиялык таасиринин далилдери бар. Лонгокаинди кош бойлуулуктун биринчи мезгилинде колдонууга болбойт, пайда коркунучтан жогору болгон учурларды кошпогондо.

Парацервикалдык бөгөттү жүргүзүү учурунда түйүлдүктө жергиликтүү анестетиктердин колдонуунун натыйжасында өрчүй турган кыйыр таасирлердин пайда болуусунун жогорку коркунучу бар (брадикардия сыяктуу). Мындай таасирлер анестетиктин түйүлдүккө жетүүчү жогорку концентрацияларына шартталышы мүмкүн («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз).

Бала эмизүү

Бупивакаин эмчек сүтүнө кирет, бирок аз өлчөмдө, дарыны дарылык дозаларда колдонууда балага таасир берүү коркунучу жок.

Авто унааны же башка механизмдерди башкаруу реакцияларынын ылдамдыгына таасир берүү жөндөмү

Бупивакаин унаа каражаттарын же механизмдерди башкаруу жөндөмдүүлүгүнө бир аз таасирин тийгизет.

Анестетиктердин түз таасиринен башка, жергиликтүү анестетиктер психологиялык функцияларга жана кыймыл багытына, керек болсо борбордук нерв системасына ачык токсиндүү таасири жок болгон учурда дагы бир аз эле таасир көрсөтөт, ошондой эле кыймыл активдүүлүгүнүн жана көңүл коюучулуктун убактылуу начарлоосуна алып келиши мүмкүн.

Колдонуу жолу жана дозалары

Дозалоо

Чоңдор

Кийинки таблица бөгөттөрдү жүргүзүүнүн өтө көп колдонулуучу ыкмаларын колдонууда препаратты орто курактагы чоңдор үчүн дозалоонун нускамасы болуп саналат. Сандар препараттын орточо мүмкүн болгон дозаларынын күтүлгөн диапазонун көрсөтөт. Бөгөттөрдү жүргүзүүнүн башка ыкмаларына таасир берүүчү факторлор бар болгон учурларда жана бейтаптардын жеке талаптарын камсыздоо үчүн доза боюнча стандарттык сунуштамаларды эске алуу керек.

Көңүл бургула!

Узакка созулган бөгөттөрдү же үзгүлтүксүз инфузия жолу аркылуу же болбостук кайталап куюу жолун жүргүзүү учурунда кан плазмасында дарынын токсиндүү концентрацияларга жетүү коркунучун же нервдердин жергиликтүү жабыркоо коркунучун эске алуу керек. Дарыгерлердин тажрыйбасы жана бейтаптын абалы тууралуу маалыматтар дарынын зарыл болгон дозасын эсептөөдө негизги фактор болуп саналат. Адекваттуу анестезияны жүргүзүү үчүн зарыл болгон эң аз дозаларды колдонуу керек. Анестезияны жүргүзүүнүн башында же учурунда жеке өзгөрүү учурлары болушу мүмкүн.

Чоңдорго дары каражатын дозалоо боюнча сунуштамалар

1-таблица

	Концентрация,	Көлөм, мл	Доза, мг	Таасир берүүнүн	Таасирдин узактыгы,
--	---------------	-----------	----------	-----------------	---------------------

	мг/мл			башталышы, мин	сааттар ³⁾
Хирургиялык кийлигишүүлөрдөгү анестезия					
Дарыны люмбалдык эпидуралдык куюу¹⁾					
Хирургиялык кийлигишүү	5,0	15–30	75–150	15–30	2–3
Дарыны люмбалдык эпидуралдык куюу¹⁾					
Кесарев кесүү	5,0	15–30	75–150	15–30	2–3
Дарыны торакалдык эпидуралдык куюу¹⁾					
Хирургиялык кийлигишүү	5,0	5–10	25–50	10–15	2–3
Каудалдык эпидуралдык бөгөт¹⁾					
	5,0	20–30	100–150	15–30	2–3
Чоң нервдердин бөгөтү²⁾					
(мисалы, ийин, бел, көчүк нервдеринин чырмалышуусу)	5,0	10–35	50–175	15–30	4–8
Жергиликтүү анестезия					
(мисалы, чоң эмес нервдердин бөгөттөрү жана инфльтрациясы)	5,0	≤ 30	≤ 150	1–10	3–8

¹⁾ Доза өзүнө изилденген дозаны камтыйт.

²⁾ Чоң нервдердин бөгөттөрү үчүн препаратты куюу ордуна жана бейтаптын абалына жараша дозаны ондоп-түздөө керек. Тепкич аралык бөгөттө жана акыректин үстүндөгү ийин нервдеринин чырмалышуусунун бөгөттөрүндө олуттуу жагымсыз таасирлердин жогорку жыштыгы байкалышы мүмкүн, колдонулган жергиликтүү анестетиктердин түрүнө көз каранды болбостон; ошондой эле «Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз.

³⁾ Лонгокаин адреналинсиз.

Жалпысынан, хирургиялык кийлигишүүлөрдө (мисалы, эпидуралдык куюу үчүн) анестезия үчүн дарынын өтө жогорку концентрацияларын жана дозаларын колдонуу талап кылынат. Азыраак интенсивдик бөгөттү жүргүзүү талап кылынганда (мисалы, төрөт ооруларын жеңилдетүү үчүн) дарынын өтө азыраак концентрациясын колдонуу талап кылынат. Колдонула турган дарынын көлөмү анестезияны бөлүштүрүү деңгээлине таасирин тийгизет. Ички кан тамыр инъекциясынан алыс болуу үчүн аспирациондук сынамды жүргүзүү сунушталат жана жай түрдө өзүнчө дозалар менен куя турган дарынын жалпы дозасын кайталап куюу сунушталат, бир учурда бейтаптын жашоого маанилүү болгон функцияларын

көңүл коюп байкоо жана аны менен вербалдык байланышты кармоо менен дарыны 25–50 мг/мин ылдамдык менен куюу сунушталат. Капыстан ички кан тамыр инъекциясынын жүрөк жыйрылууларынын жыштыгынын жогорулоо убактысы боюнча аныктоого болот, ал эми капыстан интратекалдык инъекцияны – спиналдык бөгөттүн белгилери менен аныктоого болот. Интоксикациянын симптомдору пайда болсо дарыны куюуну дароо токтотуу керек («Кыйыр реакциялар» бөлүмүн караңыз).

Азыркы учурда топтолгон тажрыйба 24 сааттын ичинде куюла турган 400 мг доза орто курактагы чоң адамдарда жакшы көтөрүлөөрүн көрсөтөт.

Балдар

Балдарда Лонгокаин ошондой көрсөтмөлөрдө колдонулбайт.

Ашыкча дозалоо

Жергиликтүү анестетиктердин капыстан болгон ички кан тамыр инъекциясы күтүүсүз системалык токсиндүү реакцияларды пайда кылышы мүмкүн (бир нече секунддан бир нече минутага чейин). Ашыкча дозалоо учурунда кандагы жергиликтүү анестетиктин концентрациясынын акырын жогорулоосунун натыйжасында системалык токсиндүүлүк кечирээк пайда болот (инъекциядан 15–60 минута өткөндөн кийин) («Кыйыр реакциялар» бөлүмүн караңыз).

Кыйыр таасирлери

Дарыны субарахноидалдык аймакка капыстан куюу өтө жогорку деңгээлдеги спиналдык анестезиянын өрчүүсүнө алып келиши мүмкүн, балким апноэ жана татаал артериялык гипотензияга.

Лонгокаин препаратынын кыйыр таасиринин профили узак таасир берүүчү башка жергиликтүү анестетиктерди колдонууда пайда болуучу кыйыр таасирлердин профилине окшош. Препараттын өзүнөн пайда болгон кыйыр таасирлерди нерв булаларынын бөгөттүнүн физиологиялык таасирлеринен (мисалы, артериялык кан басымдын төмөндөөсү, брадикардия), ошондой эле ийне пункциясы менен түздөн-түз (мисалы, нервдердин жараттары) же түз эмес (мисалы, эпидуралдык абсцесс) пайда болгон көрүнүштөрдөн айырмалоо оор болот.

Неврологиялык жабыркоолор сейрек болуп саналат, бирок регионалдык, өзгөчө эпидуралдык жана спиналдык анестезиянын жакшы белгилүү натыйжалары менен. Алар бир нече себептер менен байланышуусу мүмкүн, мисалы, жүлүндүн же жүлүн нервдеринин түз жараттары менен, астыңкы жүлүн артериясынын жабыркоо синдрому менен, дүүлүккөн заттын инъекциясы же тазаланбаган эритменин инъекциясы менен. Бул локализацияланган аймактарда парестезия же анестезияга, мотордук алсыздыкка, сфинктер жана параплегиянын үстүнөн көзөмөлдү жоготууга алып келиши мүмкүн. Кээде бул көрүнүштөр узак мөөнөттүү болуп саналат.

Таблица түрүндө аткарылган кыйыр таасирлердин тизмеси.

Кыйыр таасирлер жок дегенде эле лонгокаин менен дарылоого байланыштуу, маалыматтардан тышкары ылайыктуу дарылардын клиникалык изилдөөлөрүн жүргүзүүнүн жүрүшүндө, ошондой эле төмөндө дене органдарынын системалар класстары боюнча жана абсолюттук жыштык боюнча көрсөтүлгөн препаратты колдонуунун каттоодон кийинки

мезгилинде алынган маалыматтарга байланыштуу. Жыштык абдан тез ($> 1/10$), тез-тез ($> 1/100$ дөн $< 1/10$ го чейин), тез эмес ($> 1/1000$ дөн $< 1/100$ го чейин), сейрек ($> 1/10000$ дөн $< 1/1000$) абдан сейрек ($< 1/10000$), же белгисиз (бар маалыматтардын негизинде бааланышы мүмкүн эмес) деп белгиленет.

Препаратты колдонууда пайда болгон кыйыр таасирлер

2-таблица

Органдардын системаларынын класстары	Жыштык боюнча классификациясы	Препаратты колдонууга кыйыр таасирлер
Иммундук системасы тарабынан	Сейрек	Аллергиялык реакциялар, анафилактикалык реакция/эстен тануу («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз)
Нерв системасы тарабынан	Тез-тез	Парестезиялар, баш айлануу.
	Тез эмес	БНС тарабынан токсиндүүлүктүн белгилери жана симптомдору (карышуулар, ооздун айланасындагы парестезия, тилден калуу, гиперакузия, көрүүнүн бузулуусу, эс тутумду жоготуу, тремор, бир аз баш айлануу, кулактардагы чуулдоо, дизартрия, булчуңдардын кыймылдоосу).
	Сейрек	Невропатия, перифериялык нервдердин жабыркоосу, арахноидит, парез жана параллегия
Көрүү органдары тарабынан	Сейрек	Диплопия (көрүүнүн экиге бөлүнүүсү)
Жүрөк тарабынан	Тез-тез	Брадикардия («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз)
	Сейрек	Жүрөктүн токтоп калуусу («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз), жүрөк аритмиялары.
Кан тамырлар тарабынан	Абдан тез	Артериялык гипотензия («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз).
	Тез-тез	Артериялык гипертензия («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз).
Дем алуу системасы, төш клеткаларынын органдары жана орто көңдөй тарабынан	Сейрек	Дем алуунун начарлоосу
Ашказан-ичеги жолу тарабынан	Абдан тез	Көңүл айнуу
	Тез-тез	Кусуу
Бөйрөк жана заара бөлүп чыгаруу	Тез-тез	Зааранын кармалуусу

Бупивакаиндин кайталанган инъекциясы же узак мөөнөттүү инфузиясынан кийин аспаргатаминотрансфераздын (АСТ), аланинаминотрансфераздын (АЛТ), шакардуу фосфатаз жана билирубиндин деңгээлинин кайталанып жогорулоосу менен боор дисфункциясы катталган. Эгер бупивакаин менен дарылоо учурунда боор дисфункциясынын белгилери байкалса дарыны колдонууну токтотуу керек.

Курч системалык токсиндүүлүк

Системалык токсиндүү реакциялар көбүнчө борбордук нерв системасы жана жүрөк-кан тамыр системасы менен байланыш. Мындай реакциялар кандагы жергиликтүү анестетиктин жогорку концентрациясы менен пайда болушу мүмкүн, ички кан тамыр инъекциясы (капыстан), ашыкча дозалоо же катуу васкуляцияланган ткандарынан өтө тез абсорбция менен шартталышы мүмкүн. («Өзгөчө көрсөтмөлөр» бөлүмүн караңыз). Нерв системасы тарабынан болгон симптомдор амиддик түрдөгү бардык жергиликтүү анестетиктер үчүн бирдей, жүрөк симптомдору ар кандай дарылар үчүн саны жана сапаты жагынан айырмаланат.

Борбордук нерв системасына болгон токсиндүү таасири оордук деңгээлинин өсүүсү менен коштолгон симптомдору жана белгилери менен баскыч-баскычы болгон реакцияны көрсөтөт. Биринчи симптомдор көбүнчө бир аз баш айлануу, ооздун айланасындагы парестезия, тилден калуу, гиперактузия, кулактардагы чуулдоо жана көрүүнүн бузулуусу сыяктуу болуп пайда болот. Дизартрия, булчундардын карышуусу же тремор жайылган карышуулар менен коштолгон өтө олуттуу симптомдор болуп саналат. Бул белгилерди невротикалык алып жүрүү деп түшүндүрүүгө болбойт. Мындан кийин эс тутумду жоготуу жана чоң эпилептикалык кулоолор байкалышы мүмкүн, бир нече секунддан бир нече минутага чейин созулушу мүмкүн. Жогорку булчун активдүүлүгүнөн кийин болгон карышуу учурунда дем алуу жана дем алуу жолдорунун функциясынын начарлоосу менен чогуу кычкылтек жетишсиздиги жана гиперкапния тез өрчүйт (кандагы CO₂ курамынын жогорулоосу). Оор учурларда апноэ дагы өрчүшү мүмкүн. Ацидоз, гиперкалиемия жана кычкылтек жетишсиздигинин өрчүүсү жергиликтүү анестетиктердин токсиндүү таасирлерин жогорулатат жана узартат.

Сакаюу борбордук нерв системасы жана кийинки метаболизмден же экскрециядан тышкары жергиликтүү анестетиканын кайра таралуусунун эсебинен болот. Бул дары каражатынын өтө көп өлчөмү куюлган учурларын кошпогондо тез болот.

Жүрөк-кан тамыр системасына токсиндүү таасири оор учурларда байкалышы мүмкүн жана аны борбордук нерв системасына болгон токсиндүү таасирлер коштоп жүрөт. БНС тарабынан продромалдык симптомдор күчтүү седативдик дары каражаттарынын таасири астында жаткан же жалпы анестезия үчүн дары кабыл алып жаткан бейтаптарда пайда болбойт. Жергиликтүү анестетиктердин жогорку системалык концентрациясынын натыйжасы катары артериялык кан басым төмөндөшү мүмкүн, брадикардия, аритмия жана керек болсо жүрөк токтоп калышы мүмкүн, бирок сейрек учурларда жүрөктүн токтоп калуусу борбордук нерв системасы тарабынан продромалдык таасирлерсиз байкалган.

Курч токсиндүүлүктү дарылоо

Курч системалык токсиндүүлүктүн белгилери пайда болгондо жергиликтүү анестетиктерди колдонууну дароо токтотуу керек.

Дарылоону карышууну тез токтотууга багыттоо керек жана кычкылтекти колдонуу менен адекваттык вентиляцияны камсыз кылуу керек, зарыл болгон учурда – жасалма жана көзөмөлдөөчү вентиляциянын жардамы менен (респирациялар).

Андан кийин, качан карышуу көзөмөлдөнүп жана өпкөнүн адекваттык вентиляциясы камсыз кылынгандан кийин, эреже катары башка дарылоону белгилөөнүн кажети жок.

Жүрөк-кан тамыр системасынын функциясы начарлаган учурда (артериялык гипотензия, брадикардия) суюктукту кан тамырга куюуну, вазопрессордук каражат, инотроптор жана/же липиддик эмульсия менен ылайыктуу дарылоону белгилөө тууралуу суроону карап чыгуу керек. Кан айлануу токтоп калган учурда жүрөк-өпкө жандандырууну жүргүзүү боюнча чараларды аткаруу керек. Өпкөнүн жана кан айлануунун оксигенация, вентиляция деңгээлин колдоо керек, ошондой эле ацидозду дарылоо олуттуу мааниге ээ.

Бупивакаинди колдонуудан жүрөктүн токтоп калуусу электр дефибрилляциясына туруктуу болушу мүмкүн, ошондуктан узакка созулган мезгил аралыгында жандандыруу иш чараларын жүргүзүүнү активдүү түрдө улантуу керек.

Чоң жана толук жүлүн бөгөтүнүн пайда болуусу дем алуу кыймылсыздыгына жана артериялык гипотензияга алып келиши мүмкүн, эпидуралдык анестезия учурунда дем алуу жолдорунун эркин өткөрүмдүүлүгүн колдоо жолу аркылуу дарылоо керек, ал эми өпкөнүн вентиляциясынын жеңилдөөсү жана көзөмөлү үчүн кычкылтекти берүү керек.

Күтүлгөн кыйыр таасирлер тууралуу маалымат

Дары каражатын каттагандан кийин күтүлгөн кыйыр таасирлер тууралуу маалымат маанилүү болуп саналат. Бул дары каражатынын пайда/коркунучунун өз ара байланышынын көзөмөлүн улантууга шарт түзөт. Медицина кызматкерлеринен маалыматтардын улуттук системасы аркылуу бардык күтүлгөн кыйыр таасирлер тууралуу маалымдоосун суранышат.

Шектүү жагымсыз реакциялар жөнүндө маалымат

Шектелген жагымсыз реакциялар тууралуу дары препаратынын «пайда-кооптуулук» балансына үзгүлтүксүз мониторинг жүргүзүү, дары каражатын каттоодон өткөндөн кийин кабарлоо маанилүү. Медицина кызматкерлери Кыргыз Республикасынын Жагымсыз реакциялар жөнүндө улуттук маалымат системасы аркылуу ар кандай шектүү жагымсыз реакциялар жөнүндө билдирүүгө чакырылат:

Кыргыз Республикасынын Саламаттык сактоо министрлигинин алдындагы Дары каражаттары жана медициналык буюмдар департаменти

<http://www.pharm.kg>

Мындан сырткары маалыматты электрондук дарек аркылуу жөнөтүүгө болот asia.kppv@uf.ua же төмөнкү телефон аркылуу кайрылса болот: +996 550 740402.

Жарактуулук мөөнөтү

2 жыл.

Сактоо шарты

25 °C дан жогору эмес аба табында сактоо керек. Тондурбоо керек.

Балдар жетпеген жерде сактоо керек.

Дал келбестиги

Бупивакаин 6,5 тен жогору болгон рН аз ээрий тургандыктан алкализация басырылууну пайда кылышы мүмкүн.

Таңгакча

5 мл ден ампулаларда № 10 кутучада.

Берүү шарты

Рецепт боюнча.

Өндүрүүчү

«Юрия-Фарм» ЖЧК

Өндүрүүчүнүн дареги

Украина, 18030, Черкасы обл., Черкасы ш., Кобзарь көчөсү 108.

Тел.: +38 (044) 281-01-01.