

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

БлоккоС®

Регистрационный номер:

Торговое наименование: БлоккоС®

Международное непатентованное или группировочное наименование: бупивакаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав

Одна ампула содержит

Действующее вещество: бупивакаина гидрохлорида моногидрат в пересчете на бупивакаина гидрохлорид 20 мг.

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, динатрия эдетат, хлористоводородной кислоты раствор 0,1 М¹ или натрия гидроксида раствор 0,1 М² (для коррекции рН), вода для инъекций.

¹Хлористоводородной кислоты раствор 0,1 М получают из хлористоводородной кислоты концентрированной и воды для инъекций.

²Натрия гидроксида раствор 0,1 М получают из натрия гидроксида и воды для инъекций.

Описание: прозрачный бесцветный раствор.

Фармакотерапевтическая группа: анестетики; местные анестетики; амиды.

Код АТХ: N01BB01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Местный анестетик длительного действия амидного типа, в 4 раза сильнее лидокаина.

Обратимо блокирует проведение импульса по нервному волокну за счет влияния на натриевые каналы. Оказывает гипотензивное действие, замедляет частоту сердечных

сокращений. Послеоперационная анальгезия поддерживается в течение 7–14 ч при межреберной блокаде. При однократной эпидуральной инъекции длительность эффекта при использовании концентрации 5 мг/мл составляет от 2 до 5 ч и до 12 ч – при периферической блокаде нерва.

Использование растворов в концентрации 2,5 мг/мл оказывает меньший эффект на двигательные нервы.

Фармакокинетика

Бупивакаин имеет показатель pK_a – 8,2, коэффициент разделения 346 (при температуре 25 °С в среде н-октанол / фосфатный буфер pH 7,4).

Абсорбция

Бупивакаин полностью абсорбируется в кровь из эпидурального пространства, абсорбция носит двухфазный характер, период полувыведения для двух фаз составляет соответственно 7 минут и 6 часов. Медленная элиминация бупивакаина определяется наличием медленной фазы абсорбции эпидурального пространства, что объясняет более длительный период полувыведения ($T_{1/2}$) после эпидурального введения по сравнению с внутривенным (в/в) введением.

Плазменная концентрация бупивакаина зависит от дозировки препарата, метода введения препарата, васкуляризации в области введения.

Распределение

Общий плазменный клиренс бупивакаина составляет 0,58 л/мин, объем распределения в равновесном состоянии 73 л, конечный период полувыведения 2,7 часа, промежуточный показатель печеночной экстракции около 0,38 после в/в введения. Бупивакаин главным образом связывается с α_1 -кислым гликопротеином плазмы (связывание с белками плазмы – 96 %). Клиренс бупивакаина практически полностью обусловлен метаболизмом препарата в печени и больше зависит от активности ферментных систем печени, чем от перфузии печени. Метаболиты обладают меньшей фармакологической активностью, чем бупивакаин.

Биотрансформация

Бупивакаин подвергается метаболизму в печени главным образом путем ароматического гидроксилирования до 4-гидрокси-бупивакаина и N-деалкилирования до 2,6-пипеколоксидина (РПК). Обе реакции происходят с участием изофермента цитохрома СYP3A4.

Элиминация

Около 1 % бупивакаина экскретируется с мочой в неизменном виде в течение суток после введения, и приблизительно 5 % в виде РРК. Концентрация РРК и 4-гидроксибупивакаина в плазме во время и после продленного введения бупивакаина низкая по отношению к введенной дозе препарата.

Проникает через плаценту. Связь с белками плазмы в организме плода ниже, чем в организме матери, концентрация несвязанной фракции бупивакаина в организме плода и матери одинакова.

Дети

У детей в возрасте от 1 года до 7 лет фармакокинетика препарата сходна с показателями у взрослых.

Показания к применению

- Хирургическая анестезия у взрослых и детей в возрасте от 12 лет;
- инфильтрационная анестезия, когда требуется достижение длительного анестезирующего эффекта, например, при послеоперационной боли;
- проводниковая анестезия с продолжительным эффектом или эпидуральная анестезия в случаях, при которых добавление эпинефрина противопоказано, и значительное расслабление мышц не требуется;
- анестезия в акушерстве.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к бупивакаину, другим местным анестетикам амидного типа или к любому из вспомогательных веществ;
- состояния, при которых противопоказано проведение эпидуральной анестезии:
 - текущие заболевания центральной нервной системы (ЦНС), такие как менингит, полиомиелит, внутричерепное кровоизлияние, а также новообразования ЦНС;
 - туберкулез позвоночника;
 - пернициозная анемия с подострой комбинированной дегенерацией спинного мозга;
 - гнойничковое поражение кожи в месте предполагаемой пункции или граничащее с местом пункции;
 - кардиогенный или гиповолемический шок;
 - нарушение свертываемости крови или сопутствующая антикоагулянтная терапия.

БлоккоС® 5 мг/мл не одобрен для применения у детей в возрасте до 12 лет.

Препарат не используется при проведении внутривенной регионарной анестезии (блокада по Биру).

С осторожностью

- Пожилой возраст;
- ослабленные пациенты;
- атриовентрикулярная блокада II и III степени;
- нарушение функции печени и почек тяжелой степени;
- женщины на поздних сроках беременности;
- совместное применение с антиаритмическими препаратами III класса (например, амиодарон);
- совместное применение с другими местными анестетиками или препаратами, имеющими структурное сходство с местными анестетиками амидного типа, такими как антиаритмические препараты Ib класса (например, лидокаин, мексилетин);
- парацервикальная блокада.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Следует применять препарат только в том случае, если ожидаемая польза для матери превышает возможный риск для плода.

Бупивакаин использовался у большого числа беременных женщин и женщин детородного возраста, однако до настоящего времени не отмечалось специфических изменений репродуктивной функции у женщин детородного возраста и повышения частоты дефектов развития у плода.

Добавление эпинефрина к бупивакаину может уменьшать кровоток в матке и ее сократимость, особенно при случайном введении раствора анестетика в сосуды матери. Побочные эффекты, вызванные действием местного анестетика у плода, такие как брадикардия, наиболее часто обнаруживаются при парацервикальной блокаде (анестетик при этом достигает плода в высокой концентрации).

Грудное вскармливание

Так же как и другие местные анестетики, бупивакаин может проникать в грудное молоко в незначительных количествах, не представляющих опасности для ребенка.

Способ применения и дозы

Препарат БлоккоС® должен применяться только врачами, имеющими опыт проведения местной анестезии или под их наблюдением.

Режим дозирования

Следует использовать минимальную дозу, позволяющую достигнуть адекватной анестезии. Приведенные ниже дозы носят рекомендательный характер; выбор дозы проводят с учетом глубины анестезии и общего состояния пациента.

Инфильтрационная анестезия

5–30 мл препарата (25–150 мг бупивакаина).

Межреберная блокада

2–3 мл препарата (10–15 мг бупивакаина) на один нерв, в общей сложности, не более 10 нервов.

Обширные блокады (например, эпидуральная блокада, сакральная блокада, блокада плечевого сплетения)

15–30 мл препарата (75–150 мг бупивакаина).

Эпидуральная анестезия при кесаревом сечении

15–30 мл препарата (75–150 мг бупивакаина).

Максимальные рекомендованные дозы

Максимальная рекомендованная доза бупивакаина, определенная из расчета 2 мг/кг массы тела, для взрослых составляет 150 мг в течение 4 часов (что эквивалентно 30 мл препарата БлоккоС® 5 мг/мл). Максимальная рекомендованная суточная доза составляет 400 мг. Суммарную дозу препарата следует корректировать с учетом возраста и состояния пациента, а также других значимых обстоятельств.

Способ применения

Инфильтрационно, эпидурально, для межреберной блокады и обширных блокад.

Необходимо соблюдать осторожность, чтобы избежать случайного внутрисосудистого введения бупивакаина. Рекомендуется проводить аспирационную пробу до введения и во время введения препарата. Препарат следует вводить медленно, со скоростью 25–50 мг бупивакаина в минуту, или дробными дозами, поддерживая непрерывный словесный контакт с пациентом и контролируя частоту сердечных сокращений. Так, при случайном внутрисосудистом введении отмечается кратковременное увеличение частоты сердечных сокращений, а при случайном интратекальном введении могут развиваться симптомы

спинального блока. При появлении симптомов токсичности введение препарата следует немедленно прекратить.

Если требуется введение большой дозы, например, при эпидуральной блокаде, рекомендуется предварительное введение тест-дозы: 3–5 мл бупивакаина с адреналином.

Дети

Эффективность и безопасность препарата БлоккоС® у детей в возрасте до 12 лет не установлена, имеющиеся данные ограничены.

Эффективность и безопасность препарата БлоккоС® для эпидурального болюсного или непрерывного введения не установлены, имеющиеся данные ограничены.

Побочное действие

Резюме профиля безопасности

Побочные реакции, вызванные препаратом БлоккоС®, трудно отличить от физиологических проявлений блокады нервов (например, артериальная гипотензия, брадикардия), реакций, вызванных непосредственно (например, повреждение нерва) или косвенно (например, эпидуральный абсцесс) введением иглы.

Повреждение нервной ткани является редким, но известным осложнением регионарной анестезии, в особенности эпидуральной и спинальной анестезии.

Информация о симптомах и лечении острой системной токсичности приводится в разделе «Передозировка».

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции приведены в соответствии с классификацией системно-органных классов MedDRA и упорядочены по частоте их возникновения. Частота встречаемости определяется в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения следующим образом:

очень часто ($\geq 1/10$);

часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$);

нечасто ($\geq 1/1000$, но $< 1/100$);

редко ($\geq 1/10000$, но $< 1/1000$);

очень редко ($< 1/10000$);

частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

<p>Очень часто</p>	<p><i>Нарушения со стороны сосудов:</i> артериальная гипотензия. <i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:</i> тошнота</p>
<p>Часто</p>	<p><i>Нарушения со стороны нервной системы:</i> парестезия, головокружение. <i>Нарушения со стороны сердца:</i> брадикардия. <i>Нарушения со стороны сосудов:</i> артериальная гипертензия. <i>Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:</i> рвота. <i>Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей:</i> задержка мочи</p>
<p>Нечасто</p>	<p><i>Нарушения со стороны нервной системы:</i> симптомы токсичности со стороны ЦНС (судороги, периоральная парестезия, онемение языка, гиперакузия, зрительные нарушения, потеря сознания, тремор, головокружение, шум и звон в ушах, дизартрия)</p>
<p>Редко</p>	<p><i>Нарушения со стороны иммунной системы:</i> аллергические реакции, анафилактический шок. <i>Нарушения со стороны нервной системы:</i> нейропатия, повреждение периферических нервов, арахноидит, парез, параплегия. <i>Нарушения со стороны органа зрения:</i> диплопия. <i>Нарушения со стороны сердца:</i> остановка сердца, аритмия. <i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:</i> угнетение дыхания</p>

Дети

У детей отмечаются такие же побочные реакции, как у взрослых пациентов, однако выявление ранних проявлений токсичности местных анестетиков у детей может быть затруднено, если блокада проводится на фоне седации или общей анестезии.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

или npr@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

<https://www.roszdravnadzor.gov.ru>

Передозировка

Симптомы

Острая системная токсичность

Симптомы острой системной токсичности могут отмечаться со стороны ЦНС и сердечно-сосудистой системы. Они обусловлены высокой концентрацией местного анестетика в крови в результате случайного внутрисосудистого введения препарата, передозировки или необычно быстрой абсорбции из области высокой васкуляризации (см. раздел «Особые указания»).

Симптомы токсичности со стороны ЦНС схожи для всех местных анестетиков амидного типа, в то время как проявления со стороны сердечно-сосудистой системы различаются в большей степени при применении различных препаратов. Случайное внутрисосудистое введение местного анестетика может немедленно (от нескольких секунд до нескольких минут) вызвать системную токсическую реакцию. В случае передозировки симптомы системной токсичности развиваются позже (через 15–60 минут после инъекции) из-за более медленного повышения концентрации местного анестетика в крови.

Проявления токсичности со стороны ЦНС развиваются постепенно в виде признаков и симптомов нарушения функции ЦНС, тяжесть которых нарастает. Начальными проявлениями токсичности обычно являются головокружение, периоральная парестезия, онемение языка, гиперакузия, шум и звон в ушах и зрительные расстройства. Дизартрия, подергивания мышц или тремор являются более серьезными симптомами и предшествуют развитию генерализованных судорог. Эти явления не следует ошибочно расценивать как невротическое поведение. Вслед за ними возможна потеря сознания и развитие больших судорожных припадков длительностью от нескольких секунд до нескольких минут. Вследствие повышенной мышечной активности и нарушения нормального процесса дыхания вскоре после начала судорог появляются гипоксия и гиперкапния. В тяжелых случаях может развиваться апноэ. Ацидоз усиливает токсический эффект местных анестетиков.

Данные явления разрешаются за счет метаболизма местного анестетика и его перераспределения из ЦНС. Купирование токсических явлений может наступать быстро, если анестетик не был введен в очень большом количестве.

Появление симптомов токсичности со стороны сердечно-сосудистой системы, как правило, свидетельствует о тяжести клинической ситуации. Им обычно предшествуют симптомы токсичности со стороны ЦНС, распознавание которых может быть затруднено в случае общей анестезии или глубокой седации при применении таких препаратов, как бензодиазепины и барбитураты. На фоне высокой системной концентрации местных анестетиков отмечены артериальная гипотензия, брадикардия, аритмия и в ряде случаев, остановка сердца. Токсические реакции со стороны сердечно-сосудистой системы часто связаны с нарушением внутрисердечной проводимости и функции миокарда, что приводит к уменьшению сердечного выброса, артериальной гипотензии, атриовентрикулярной блокаде, брадикардии и в ряде случаев к желудочковой аритмии, в том числе, к желудочковой тахикардии, фибрилляции желудочков и остановке сердца. Этим симптомам обычно предшествуют проявления тяжелой токсичности со стороны ЦНС, например, судороги, однако в редких случаях остановка сердца возникала без предшествующих симптомов со стороны ЦНС. При очень быстром внутривенном болюсном введении в коронарных артериях может достигаться высокая концентрация бупивакаина, и токсические эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы могут возникать без предшествующих симптомов со стороны ЦНС или предшествовать этим симптомам. В таких случаях угнетение миокарда может быть первым симптомом токсичности.

Особое внимание нужно обращать на выявление ранних признаков системной токсичности у детей, так как у них обширные блокады часто выполняются на фоне общей анестезии.

Лечение

В случае полного спинального блока следует обеспечить адекватную вентиляцию (обеспечить проходимость дыхательных путей, подачу кислорода, при необходимости – интубацию и искусственную вентиляцию легких). При артериальной гипотензии/брадикардии вводят вазопрессоры, предпочтительно с положительным инотропным эффектом.

При появлении симптомов острой системной токсичности следует немедленно прекратить введение местного анестетика. Лечение должно быть направлено на поддержание адекватной вентиляции (с подачей кислорода) и гемодинамики.

Во всех случаях системной токсичности необходима оксигенотерапия. При необходимости следует прибегнуть к интубации и искусственной вентиляции легких (возможно, с гипервентиляцией). При судорогах показано введение диазепама, при брадикардии – атропина.

При развитии сосудистого шока (артериальная гипотензия, брадикардия) терапия включает внутривенное введение инфузионных растворов, вазопрессоров, инотропных препаратов и/или жировых эмульсий. Следует внутривенно вводить инфузионные растворы, добутамин и, если потребуется, норадреналин (первоначально в дозе 0,05 мкг/кг/мин, и, если потребуется, увеличивать дозу на 0,05 мкг/кг/мин каждые 10 минут), руководствуясь данными мониторинга гемодинамических параметров в более тяжелых случаях. Также можно применить эфедрин. При остановке кровообращения могут потребоваться длительные (несколько часов) реанимационные мероприятия. Во всех случаях необходимо корректировать ацидоз.

Дети

При лечении острой токсичности у детей следует учитывать их возраст и массу тела при выборе доз препаратов.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Бупивакаин должен применяться с осторожностью у пациентов, получающих другие местные анестетики или антиаритмические препараты Ib класса, из-за возможности развития аддитивного токсического эффекта.

Совместное применение бупивакаина с местными анестетиками и антиаритмическими препаратами III класса (например, амиодароном) не изучалось в исследованиях

лекарственного взаимодействия, однако рекомендуется соблюдать осторожность при одновременном назначении этих препаратов (см. раздел «Особые указания»).

Особые указания

При выполнении регионарной и местной анестезии, за исключением наиболее простых блокад, оборудование для проведения реанимационных мероприятий должно быть доступно для немедленного использования. При выполнении обширных блокад перед введением местного анестетика необходимо установить внутривенный катетер.

Были отмечены случаи остановки сердца или смерти во время применения бупивакаина для эпидуральной анестезии или периферической блокады. В некоторых случаях реанимация была затруднена или невозможна, несмотря на правильное ее проведение.

Проведение блокады периферических нервов связано с введением большого объема местного анестетика в области высокой васкуляризации, часто – близко к крупным сосудам. В таких случаях увеличивается риск случайного внутрисосудистого введения местного анестетика и/или системной абсорбции препарата, что, в свою очередь, может привести к повышению плазменной концентрации. Как и все остальные местные анестетики, при высокой концентрации в крови бупивакаин может оказывать токсические эффекты на ЦНС и сердечно-сосудистую систему. Это относится в особенности к случайному внутрисосудистому введению или введению в области высокой васкуляризации.

Определенные виды блокад могут быть связаны с серьезными неблагоприятными реакциями, например:

- эпидуральная анестезия может сопровождаться угнетением сердечно-сосудистой системы, особенно на фоне гиповолемии. Поэтому следует соблюдать осторожность у пациентов с нарушением функции сердечно-сосудистой системы;
- в редких случаях при ретробульбарном введении возможно проникновение препарата в краниальное субарахноидальное пространство, при этом возникает временная слепота, сердечно-сосудистый коллапс, апноэ и судороги. Эти симптомы требуют незамедлительного лечения;
- при ретробульбарном и перibuльбарном введении местных анестетиков существует небольшой риск возникновения стойкого нарушения функции глазных мышц. Основными причинами являются травма и/или местное токсическое действие введенного препарата на мышцы и/или нервы;
- случайное внутрисосудистое введение местных анестетиков в области головы и шеи даже в низких дозах может вызывать симптомы токсичности со стороны ЦНС;

- парацервикальная блокада иногда приводит к брадикардии/тахикардии у плода, поэтому следует тщательно мониторировать сердечный ритм у плода.

Тяжесть подобных тканевых реакций зависит от степени повреждения, концентрации местного анестетика и длительности экспозиции ткани к местному анестетику. Поэтому следует использовать наименьшую эффективную дозу препарата.

Следует соблюдать осторожность у пациентов с атриовентрикулярной блокадой II или III стадии, поскольку местные анестетики могут снижать проводимость миокарда. Следует соблюдать осторожность у пациентов с нарушением функции печени или почек тяжелой степени, пожилых или ослабленных пациентов.

Пациенты, получающие антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон), должны находиться под тщательным наблюдением с контролем ЭКГ с учетом риска развития осложнений со стороны сердечно-сосудистой системы из-за возможного аддитивного эффекта.

При эпидуральной анестезии могут отмечаться артериальная гипотензия и брадикардия. Снизить вероятность этих осложнений можно путем предварительного введения кристаллоидных или коллоидных растворов. В случае артериальной гипотензии следует проводить терапию немедленно, например, внутривенно ввести эфедрин в дозе 5–10 мг, при необходимости введение можно повторить.

Были отмечены случаи хондролиза при послеоперационной продленной внутрисуставной инфузии местных анестетиков. В большинстве описанных случаев проводилась инфузия в плечевой сустав. Причинно-следственная связь с использованием анестетиков не установлена из-за наличия нескольких предрасполагающих факторов. БлоккоС® не одобрен для продленной внутрисуставной инфузии.

Вспомогательные вещества

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия на ампулу, то есть, по сути, «не содержит натрия».

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В зависимости от способа введения, бупивакаин может оказывать транзиторное влияние на двигательную функцию и координацию.

Форма выпуска

Раствор для инъекций, 5 мг/мл.

4 мл в ампулы бесцветного стекла тип I с цветным кольцом разлома или с цветной точкой и насечкой. На ампулы дополнительно наносят одно, два или три цветных кольца или без дополнительных цветных колец.

На каждую ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и пленки полимерной, или без пленки.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

Условия хранения

Хранить при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

5 лет.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Производитель / Фасовщик (первичная упаковка) / Упаковщик (вторичная упаковка)

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

Московская обл., г.о. Сергиево-Посадский, п. Беликово, д. 10

Выпускающий контроль качества

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

Московская обл., г.о. Сергиево-Посадский, п. Беликово, д. 11

Держатель регистрационного удостоверения / Организация, принимающая претензии потребителей

Российская Федерация

ЗАО «ФармФирма «Сотекс»

СООТВЕТСТВУЕТ ЭКСПЕРТНОМУ ОТЧЕТУ
от 13.01.2026 № 194
(ПОСЛЕДОВАТЕЛЬНОСТЬ 0002)

141345, Московская обл., г. Сергиев Посад, п. Беликово, д. 11

Тел.: +7 (495) 956-29-30

Электронная почта: pharmacovigilance@sotex.ru