

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЛЕКОЛТ

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ЛЕКОЛТ

Международное непатентованное или группировочное наименование: лидокаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: лидокаина гидрохлорида моногидрат – 21,34 мг (в пересчете на лидокаина гидрохлорид – 20,00 мг).

Вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксида раствор 1 М, вода для инъекций.

Описание: прозрачная, бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: анестетики; местные анестетики; амиды

Код АТХ: N01BB02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Обладает местноанестезирующим действием, блокирует потенциалзависимые натриевые каналы, что препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению импульсов по нервным волокнам. Подавляет проведение не только болевых импульсов, но и импульсов другой модальности. Анестезирующее действие лидокаина в 2–6 раз сильнее, чем прокаина (действует быстрее и дольше – до 75 минут, а после добавления эпинефрина – более 2 часов). При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Фармакокинетика

Абсорбция – полная (скорость абсорбции зависит от места введения и дозы). При внутримышечном введении время достижения максимальной концентрации – 30–45 минут.

Связь с белками плазмы – 50–80 %. Распределяется быстро (период полураспределения: 6–9 мин), сначала поступает в хорошо кровоснабжаемые ткани (сердце, легкие, головной мозг, печень, селезенка), затем в жировую и мышечную ткани. Проникает через

гематоэнцефалический барьер, плацентарный барьер и в грудное молоко (40 % от концентрации в плазме матери).

Метаболизируется в печени (на 90–95 %) с участием цитохрома Р450 путем дезалкилирования аминогруппы и разрыва амидной связи с образованием активных метаболитов (моноэтилглицинсилидин и глицинсилидин), период полувыведения которых составляет 2 ч и 10 ч, соответственно. При заболеваниях печени интенсивность метаболизма снижается и составляет от 50 % до 10 % от нормальной величины.

Выводится с желчью и почками (до 10 % в неизменном виде). При хронической почечной недостаточности возможна кумуляция метаболитов. Подкисление мочи способствует увеличению выведения лидокаина.

Показания к применению

Препарат показан для применения у взрослых в возрасте от 18 лет.

Местная и регионарная анестезия, проводниковая анестезия при больших и малых хирургических вмешательствах.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к лидокаина гидрохлориду, анестетикам амидного типа или к любому из вспомогательных веществ, входящих в состав препарата.
- Тяжелая синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, атриовентрикулярная (AV) блокада 3 степени, тяжелые нарушения внутрижелудочковой проводимости, синдром WPW (синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта).
- Острая декомпенсация сердечной недостаточности.
- Кардиогенный или гиповолемический шок.
- Детский возраст до 18 лет (для детей в возрасте от 1 года используется дозировка 10 мг/мл).

С осторожностью

Следует с осторожностью применять:

- у пациентов с миастенией *gravis*;
- у лиц пожилого возраста;
- у пациентов с эпилепсией. Необходимо тщательно наблюдать за пациентами с судорожными расстройствами на предмет симптоматики со стороны ЦНС. Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность;
- у пациентов с полной или неполной блокадой внутрисердечного проведения, поскольку

местные анестетики могут угнетать АВ-проводение;

- у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания;
- у пациентов с коагулопатией. Терапия антикоагулянтами (например, гепарином), нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВН) или плазмозаменителями повышает склонность к кровотечениям. Случайное повреждение сосудов может привести к тяжелым кровотечениям. При необходимости следует проверить время кровотечения, активированное частичное тромбопластиновое время (АЧТВ) и содержание тромбоцитов;
- у пациентов с синдромом Мелькерссона-Розенталя (аллергические и токсические реакции со стороны нервной системы в ответ на введение местных анестетиков могут развиваться чаще);
- в комбинации с препаратами, взаимодействующими с лидокаином и приводящими к повышению его биодоступности, потенцированию эффектов (например, фенитоином) или замедлению выведения (например, при печеночной или терминальной стадии почечной недостаточности, при которой могут кумулировать метаболиты лидокаина);
- в третьем триместре беременности.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Фертильность

Данные о влиянии лидокаина на фертильность человека отсутствуют.

Беременность

Лидокаин разрешается применять во время беременности. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования. При осложнениях или кровотечении проведение эпидуральной анестезии лидокаином в акушерстве противопоказано.

Лидокаин применяли у большого числа беременных женщин и женщин репродуктивного возраста. Какие-либо репродуктивные нарушения не зарегистрированы, то есть повышения частоты пороков развития не отмечалось. Лидокаин быстро проникает через плаценту, у новорожденных с высокой плазменной концентрацией лидокаин может угнетать ЦНС и, следовательно, затруднять оценку состояния по шкале Апгар. Вследствие потенциального достижения высокой концентрации местных анестетиков после парацервикальной блокады у плода могут развиваться нежелательные реакции, такие как фетальная брадикардия. В связи с этим лидокаин в концентрации, превышающий 1 %, в акушерстве не применяют.

В исследованиях на животных вредное воздействие на плод не обнаружено.

Лактация

Лидокаин в небольшом количестве проникает в грудное молоко. Однако его пероральная биодоступность очень низкая, поэтому количество лидокаина, которое может поступить с грудным молоком, незначительное, и, следовательно, потенциальный вред для ребенка небольшой. Решение о возможности применения лидокаина в период грудного вскармливания принимает врач.

Способ применения и дозы

Лидокаин применяют для инфильтрационной, проводниковой, внутривенной регионарной, эпидуральной анестезии.

Режим дозирования

Режим дозирования следует подбирать, основываясь на реакции пациента и месте введения. Препарат следует вводить в наименьшей концентрации и наименьшей дозе, дающей требуемый эффект.

Объем раствора, подлежащий введению, зависит от вида анестезии, размера анестезируемого участка, характера и продолжительности оперативного вмешательства. Если есть потребность во введении большого объема с низкой концентрацией, то стандартный раствор лидокаина разводят солевым раствором (натрия хлорида раствор 0,9 %).

Разведение осуществляют непосредственно перед введением.

Максимальная доза для взрослых – не более 4,5 мг/кг, рекомендуется не превышать дозу 300 мг; для внутривенной регионарной анестезии – не более 4 мг/кг. Повторное введение в течение 24 часов не рекомендуется. Не рекомендуется применять непрерывное введение анестетика с помощью катетера; введение максимальной дозы не должно повторяться чаще, чем через 90 мин.

Рекомендуемые дозы:

Инфильтрационная анестезия (внутрикожно, подкожно, внутримышечно)	
Большие вмешательства	5–10 мл (100–200 мг)
Проводниковая анестезия (анестезия/блокада периферических нервов, в т.ч. блокада нервных сплетений)	
Перинеурально:	1,5–10 мл (30–200 мг)
Блокада нервов пальцев кисти и стопы	2–4 мл (40–80 мг)
Блокада нервных сплетений	5–10 мл (100–200 мг)
В стоматологии	1–5 мл (20–100 мг)
В офтальмологии:	
Ретробульбарная анестезия	3–4 мл (60–80 мг)
Парабульбарная анестезия	1–2 мл (20–40 мг)

Эпидуральная анестезия	
Торакальный отдел	10–15 мл (200–300 мг)
Люмбальный отдел	12,5–15 мл (250–400 мг)
Сакральный отдел	10–15 мл (200–300 мг)
Внутривенная регионарная анестезия (введение анестетика непосредственно в вену конечности (при условии наложения жгута выше места введения))	Не более 2,5 мл (50 мг)

Пожилые и ослабленные пациенты

Пожилым и ослабленным пациентам препарат вводят в меньших дозах, соответствующих их возрасту и физическому состоянию.

Нежелательные реакции

Подобно другим местным анестетикам, нежелательные реакции на лидокаин редки и, как правило, обусловлены повышенной плазменной концентрацией вследствие случайного внутрисосудистого введения, превышения дозы или быстрой абсорбции из участков с обильным кровоснабжением, либо вследствие гиперчувствительности, идиосинкразии или сниженной переносимости пациента. Реакции системной токсичности, главным образом, проявляются со стороны центральной нервной и (или) сердечно-сосудистой системы (см. также раздел «Передозировка»).

Нежелательные реакции перечислены ниже по системно-органным классам и частоте.

Частоты определены как: 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: ($< 1/10000$) и частота не установлена (нельзя установить на основании доступных данных).

Нежелательные реакции	Частота нежелательных реакций
<i>Нарушения со стороны иммунной системы</i>	
Реакции гиперчувствительности, кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, анафилактический шок	Редко
<i>Психические нарушения</i>	
Спутанность сознания	Нечасто
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	
Головокружение, парестезии	Часто
Судороги, парестезия вокруг рта, онемение языка, гиперacusия, нарушение зрения, тремор, сонливость, шум в ушах, дизартрия	Нечасто
Нейропатия, повреждение периферических нервов, арахноидит	Редко
<i>Нарушения со стороны органа зрения</i>	
Затуманенное зрение, диплопия	Редко
<i>Нарушения со стороны сердца</i>	
Брадикардия	Часто

Угнетение миокарда (отрицательный инотропный эффект), аритмии, возможна остановка сердца или недостаточность кровообращения	Редко
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>	
Артериальная гипотензия	Очень часто
Артериальная гипертензия	Часто
<i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения</i>	
Одышка, бронхоспазм, угнетение дыхания, остановка дыхания	Редко
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>	
Рвота	Часто

Передозировка

Первые признаки интоксикации – головокружение, тошнота, рвота, эйфория, снижение артериального давления; затем – судороги мимической мускулатуры лица с переходом в тонико-клонические судороги скелетной мускулатуры, психомоторное возбуждение, астения, апноэ, брадикардия, коллапс, метгемоглобинемия; при применении в родах у новорожденного – брадикардия, угнетение дыхательного центра, апноэ.

Меры по оказанию помощи при передозировке

При первых признаках интоксикации введение препарата прекращают. Пациент должен находиться в горизонтальном положении; назначают ингаляцию кислорода. В случаях проявления судорог вводят внутривенно 10 мг диазепама. При брадикардии – м-холиноблокаторы (атропин), вазоконстрикторы (норэпинефрин, фенилэфрин). Диализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) удлиняют местноанестезирующее действие. Циметидин снижает печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма, вследствие ингибирования микросомальных ферментов печени и снижения печеночного кровотока) и повышают риск развития токсических эффектов. Бета-адреноблокаторы замедляют метаболизм лидокаина, увеличивая его токсичность (снижение величины печеночного кровотока), увеличивают риск развития брадикардии. Сердечные гликозиды ослабляют кардиотонический эффект. При одновременном применении лидокаина и снотворных и/или седативных лекарственных средств возможно усиление их угнетающего действия на центральную нервную систему. При совместном применении с наркотическими анальгетиками развивается аддитивный эффект, что используется при проведении эпидуральной анестезии, однако усиливается угнетения дыхания. Использование с ингибиторами моноаминоксидазы (MAO) – фуразолидон, прокарбазин, селегилин,

повышает риск снижения артериального давления. Антикоагулянты (в т.ч. ардепарин натрия, далтепарин натрия, данапароид натрия, эноксапарин натрия, гепарин, варфарин и др.) увеличивают риск развития кровотечений. Лидокаин снижает эффект антимиастенических лекарственных средств, усиливает и удлиняет эффект миорелаксирующих лекарственных средств.

Алкоголь усиливает угнетающий эффект лидокаина на центр дыхания.

Особые указания

Препарат ЛЕКОЛТ не разрешен для интратекального введения (субарахноидальной анестезии).

Особую осторожность следует проявлять при проведении местной анестезии богатых кровеносными сосудами органов; следует избегать внутрисосудистой инъекции во время введения. При введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соответствующем оборудованном помещении, при доступности готового к немедленному использованию оборудования и препаратов, необходимых для проведения мониторинга сердечной деятельности и реанимационных мероприятий. Персонал, выполняющий анестезию, должен быть квалифицированным и обучен технике выполнения анестезии, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических и нежелательных реакций, и других осложнений.

Лидокаин следует с осторожностью применять у пациентов с миастенией *gravis*, эпилепсией, хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания, а также в комбинации с препаратами, взаимодействующими с лидокаином и приводящими к повышению его биодоступности, потенцированию эффектов (например, фенитоином) или удлинению выведения (например, при печеночной или терминальной почечной недостаточности, при которой могут кумулировать метаболиты лидокаина).

За пациентами, получающими антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон) необходимо установить тщательное наблюдение и ЭКГ-мониторинг, поскольку влияние на сердце может потенцироваться.

Поступали пострегистрационные сообщения о хондролизе у пациентов, которым осуществляли длительную внутрисуставную инфузию местных анестетиков после операции. В большинстве случаев хондролиз отмечался в плечевом суставе. Вследствие множества вносящих вклад факторов и противоречивости научной литературы относительно механизма

реализации эффекта, причинно-следственная связь не выявлена. Длительная внутрисуставная инфузия не является разрешенным показанием к применению лидокаина.

Внутримышечное введение лидокаина может повышать активность креатинфосфокиназы, что может затруднить диагностику острого инфаркта миокарда.

Показано, что лидокаин может вызывать порфирию у животных, его применения у лиц с порфирией следует избегать.

При введении в воспаленные или инфицированные ткани эффект лидокаина может снижаться.

Перед началом внутривенного введения лидокаина необходимо устранить гипокалиемию, гипоксию и нарушение кислотно-основного состояния.

Некоторые процедуры местной анестезии могут приводить к серьезным нежелательным реакциям, независимо от применяемого местного анестетика.

Проводниковая анестезия спинномозговых нервов может приводить к угнетению сердечно-сосудистой системы, особенно на фоне гиповолемии, поэтому при проведении эпидуральной анестезии пациентам с сердечно-сосудистыми нарушениями следует соблюдать осторожность.

Эпидуральная анестезия может приводить к артериальной гипотензии и брадикардии. Риск можно снизить предварительным введением кристаллоидных или коллоидных растворов. Необходимо немедленно купировать артериальную гипотензию.

В некоторых случаях парацервикальная блокада при беременности может приводить к брадикардии или тахикардии у плода, в связи с чем требуется тщательный мониторинг частоты сердцебиения у плода (см. раздел «Применение при беременности и в период грудного вскармливания»).

Введение в область головы и шеи может привести к непреднамеренному попаданию в артерию с развитием церебральной симптоматики даже в низких дозах.

Ретробульбарное введение в редких случаях может приводить к попаданию в субарахноидальное пространство черепа, приводя к серьезным/тяжелым реакциям, включая сердечно-сосудистую недостаточность, апноэ, судороги и временную слепоту.

Ретро- и перibuльбарное введение местных анестетиков несет низкий риск стойкой глазодвигательной дисфункции. К основным причинам относят травму и (или) местное токсическое действие на мышцы и (или) нервы.

Тяжесть подобных реакций зависит от степени травмы, концентрации местного анестетика и продолжительности его экспозиции в тканях. В связи с этим любой местный анестетик

необходимо применять в наименьшей эффективной концентрации и дозе.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

В период лечения, из-за возможных нежелательных реакций со стороны сердечно-сосудистой и нервной системы, необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятиях другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 20 мг/мл.

По 2 мл, 5 мл, 10 мл препарата в ампулы нейтрального бесцветного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца.

На ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

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

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по медицинскому применению и скарификатор ампульный.

20, 48, 50, 96, 100 контурных ячейковых упаковок помещают в тару из гофрированного картона с равным количеством инструкций по медицинскому применению и скарификаторов ампульных (для стационаров).

Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велтрэйд» (ООО «Велтрэйд»)

115172, г. Москва, ул. Народная, д. 14, стр. 3, эт. 3, пом. I, ком. 3

Производитель/Организация, принимающая претензии от потребителей

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: +7 (3522) 48-60-00

E-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону +7 (3522) 55-51-80 или на сайте:

www.brwaygroup.ru, в разделе «ПРОДУКЦИЯ» – «Фармаконадзор».

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЛЕКОЛТ

Регистрационный номер:

Торговое наименование: ЛЕКОЛТ

Международное непатентованное или группировочное наименование: лидокаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

Состав на 1 мл:

Действующее вещество: лидокаина гидрохлорида моногидрат – 106,7 мг (в пересчете на лидокаина гидрохлорид – 100,0 мг).

Вспомогательные вещества: натрия гидроксида раствор 1 М, вода для инъекций.

Описание: прозрачная, бесцветная или слегка желтоватая жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: средства для лечения заболеваний сердца; антиаритмические средства, классы I и III; антиаритмические средства, класс IB

Код АТХ: C01BB01

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лидокаин по химической структуре относится к производным ацетанилида. Обладает выраженным антиаритмическим (IB класс) действием.

Антиаритмические свойства лидокаина обусловлены его способностью стабилизировать клеточную мембрану, блокировать натриевые каналы, увеличивать проницаемость мембран для ионов калия. Практически не влияя на электрофизиологическое состояние предсердий, лидокаин ускоряет реполяризацию в желудочках, угнетает IV фазу деполяризации в волокнах Пуркинье (фаза диастолической деполяризации), уменьшая их автоматизм и продолжительность потенциала действия, увеличивает минимальную разность потенциалов, при которой миофибриллы реагируют на преждевременную стимуляцию. На скорость быстрой деполяризации (фаза 0) не влияет или незначительно снижает. Не оказывает существенного влияния на проводимость и сократимость миокарда (угнетает проводимость только в больших, близких к токсическим, дозах). Интервалы PQ, QRS и QT под его влиянием на электрокардиограмме (ЭКГ) не изменяются. Отрицательный инотропный

эффект также выражен незначительно и проявляется кратковременно лишь при быстром введении препарата в больших дозах.

Фармакокинетика

Время достижения максимальной концентрации в плазме крови при медленной внутривенной инфузии без начальной насыщенной дозы – через 5–6 часов (у больных с острым инфарктом миокарда – до 10 ч).

Белки плазмы крови связывают 50–80 % препарата. Быстро распределяется (период полувыведения фазы распределения – 6–9 минут) в органах и тканях с хорошей перфузией, в т.ч. в сердце, легких, печени, почках, затем в мышечной и жировой ткани.

Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, секретируется с материнским молоком (до 40 % от концентрации в плазме матери).

Метаболизируется главным образом в печени (90–95 %) при участии микросомальных ферментов с образованием активных метаболитов – моноэтилглицинксилидида и глицинксилидида, имеющих период полувыведения 2 ч и 10 ч соответственно. Интенсивность метаболизма снижается при заболеваниях печени (может составлять от 50 до 10 % от нормальной величины); при нарушении перфузии печени у пациентов после инфаркта миокарда и/или с застойной сердечной недостаточностью. Период полувыведения при непрерывной инфузии в течение 24–48 ч – около 3 ч; при нарушении функции почек – может увеличиваться в 2 и более раз. Выводится с желчью и мочой (до 10 % в неизменном виде). Подкисление мочи способствует увеличению выведения лидокаина.

Показания к применению

Препарат показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 12 до 18 лет для профилактики повторной фибрилляции желудочков при остром коронарном синдроме и повторных пароксизмов желудочковой тахикардии (обычно в течение 12–24 ч.). Желудочковые аритмии, обусловленные гликозидной интоксикацией.

Противопоказания

- Гиперчувствительность к лидокаину гидрохлориду, анестетикам амидного типа или любому из вспомогательных веществ.
- Синдром слабости синусового узла.
- Выраженная брадикардия.
- Атриовентрикулярная блокада II–III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков).

- Синоатриальная блокада.
- Синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта.
- Острая и хроническая сердечная недостаточность (III–IV функциональный класс).
- Кардиогенный шок.
- Выраженное снижение артериального давления.
- Синдром Адамса-Стокса.
- Нарушения внутрижелудочковой проводимости.

С осторожностью

Лидокаина гидрохлорид следует применять с осторожностью у пациентов:

- если в анамнезе пациента наблюдалась аллергическая или другая нежелательная реакция на лидокаин или другие местные анестетики, такая как кожная сыпь или одышка;
- с нарушениями функции печени, поскольку препарат метаболизируется в печени;
- с нарушениями функции почек с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин;
- с миастенией *gravis*;
- с хронической сердечной недостаточностью II–III стадии;
- с гиповолемией;
- с нарушениями функции дыхания;
- с порфирией (показано, что лидокаин может вызывать порфирию у животных);
- с судорожными расстройствами (в том числе в анамнезе);
- у тяжелобольных, ослабленных и пожилых (старше 65 лет) пациентов;
- в детском возрасте до 12 лет (вследствие замедленного метаболизма возможно накопление препарата) (см. раздел «Способ применения и дозы»);
- в третьем триместре беременности.

У пациентов с синдромом Мелькерссона-Розенталя в ответ на введение лидокаина могут чаще развиваться аллергические реакции и токсические реакции со стороны центральной нервной системы.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Лидокаин проникает через плаценту. Нет доказательств того, что лидокаин вызывает нарушения репродуктивной функции, повышает частоту пороков развития или оказывает прямое или косвенное влияние на плод. В исследованиях на животных не выявлено доказательств негативного воздействия на плод. Тем не менее лидокаин можно применять во

время беременности только при условии, что польза превышает риски. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования.

У новорожденных с высокими плазменными концентрациями лидокаина может наблюдаться угнетение центральной нервной системы (ЦНС) и, соответственно, снижение баллов по шкале Апгар.

Лактация

Лидокаин в небольших количествах проникает в грудное молоко, его пероральная биодоступность очень низкая. Таким образом, ожидаемое количество, поступающее с грудным молоком, очень небольшое, следовательно, потенциальный вред для ребенка очень низкий. Решение о возможности применения лидокаина в период грудного вскармливания принимает врач.

Фертильность

Данные о влиянии лидокаина на фертильность человека отсутствуют.

Способ применения и дозы

Лидокаина гидрохлорид вводят внутривенно.

Для внутривенного введения в качестве антиаритмического средства используют раствор лидокаина 100 мг/мл, предварительно разведенный до концентрации лидокаина 20 мг/мл.

Введение начинается с нагрузочной дозы 1 мг/кг (в течение 2–4 минут со скоростью 25–50 мг/мин) с немедленным подключением постоянной инфузии со скоростью 1–4 мг/мин. Вследствие быстрого распределения (период полувыведения приблизительно 8 мин) через 10–20 минут после введения первой дозы происходит снижение концентрации препарата в плазме крови, что может потребовать повторного болюсного введения (на фоне постоянной инфузии) в дозе равной 1/2-1/3 нагрузочной дозы, с интервалом 8–10 минут.

Взрослые

Внутривенную инфузию обычно проводят в течение 12–24 часов с постоянным ЭКГ-мониторированием, после чего инфузию прекращают, чтобы оценить необходимость изменения антиаритмической терапии у пациента.

Дозы, рекомендуемые для взрослых:

Максимальная доза в 1 час не должна превышать 300 мг.

Максимальная доза в 1 сутки не должна превышать 2000 мг.

Дети

Опыт применения у детей ограничен.

Новорожденные от 0 до 1 месяца

Раствор лидокаина гидрохлорида не рекомендуется применять у новорожденных.

Оптимальная концентрация лидокаина в сыворотке, позволяющая избежать токсических реакций в виде судорог и аритмий, у новорожденных не установлена.

Дети в возрасте от 0 до 12 лет

У детей до 12 лет лидокаин следует применять с осторожностью из-за риска кумуляции препарата (см. раздел 4.4.).

Дети в возрасте 12–18 лет

Режим дозирования для детей от 12 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Нежелательные реакции

Нежелательные реакции при применении лидокаина гидрохлорида возникают редко. Как правило, они обусловлены повышенной концентрацией препарата в плазме вследствие случайного внутрисосудистого введения, превышения дозы или быстрого всасывания из областей с обильным кровоснабжением, либо могут быть результатом гиперчувствительности, идиосинкразии или уменьшения переносимости пациента. Системная токсичность в основном проявляется реакциями со стороны центральной и/или сердечно-сосудистой системы.

Нежелательные реакции, которые могут возникнуть во время лечения препаратом, классифицируются в соответствующие группы по системам органов и в зависимости от частоты возникновения следующим образом: очень часто: $\geq 1/10$; часто: $\geq 1/100$, $< 1/10$; нечасто: $\geq 1/1000$, $< 1/100$; редко: $\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$; очень редко: $< 1/10\ 000$; частота неизвестна: не может быть определена на основании имеющихся данных

Частота встречаемости	Нежелательная реакция
<i>Нарушения со стороны крови и лимфатической системы:</i>	
Частота неизвестна:	метгемоглобинемия
<i>Нарушения со стороны иммунной системы:</i>	
Редко:	реакции гиперчувствительности ¹ , крапивница, кожная сыпь, ангионевротический отек, бронхоспазм, в тяжелых случаях анафилактический шок
<i>Нарушения со стороны нервной системы</i>	
Часто:	головная боль, головокружение
Нечасто:	симптомы токсического действия на ЦНС (судороги, парестезия вокруг рта, онемение языка, гиперактузия, нарушения зрения, потеря сознания, тремор, сонливость, головокружение, шум в ушах, ощущение интоксикации, дизартрия)
Частота неизвестна:	повышенная возбудимость, кома

<i>Нарушения со стороны органа зрения</i>	
Редко:	нечеткость зрения, диплопия и преходящая потеря зрения, двусторонняя потеря зрения
Частота неизвестна:	нистагм
<i>Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта</i>	
Частота неизвестна:	шум в ушах, гиперacusия
<i>Нарушения со стороны сердца</i>	
Часто:	брадикардия
Редко:	остановка сердца, аритмии
Частота неизвестна:	сердечная недостаточность (из-за отрицательного инотропного эффекта), боль в грудной клетке
<i>Нарушения со стороны сосудов</i>	
Очень часто:	артериальная гипотензия
Часто:	артериальная гипертензия
Частота неизвестна:	периферическая вазодилатация, коллапс
<i>Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения</i>	
Редко:	угнетение дыхания
Частота неизвестна:	одышка, бронхоспазм, остановка дыхания
<i>Желудочно-кишечные нарушения</i>	
Очень часто:	тошнота
Часто:	рвота
Частота неизвестна:	непроизвольная дефекация
<i>Нарушения со стороны почек и мочевыводящих путей</i>	
Частота неизвестна:	непроизвольное мочеиспускание
<i>Нарушения со стороны репродуктивной системы и молочных желез</i>	
Частота неизвестна:	снижение либидо и/или потенции
<i>Общие нарушения и реакции в месте введения</i>	
Частота неизвестна:	гипотермия

Примечание: ¹ – кожные пробы для выявления аллергии на лидокаин считаются ненадежными.

Передозировка

Симптомы

Токсическое действие на центральную нервную систему проявляется симптомами, нарастающими по тяжести. Сначала у пациентов могут наблюдаться парестезии вокруг рта, онемение языка, головокружение, гиперacusия и шум в ушах. Нарушение зрения и тремор или подергивания мышц являются более серьезными симптомами и предшествуют возникновению генерализованных судорог. Эти признаки не следует путать с невротическим поведением. Затем может последовать потеря сознания и большие судорожные припадки продолжительностью от нескольких секунд до нескольких минут. Судороги из-за повышенной мышечной активности и нарушения дыхания приводят к быстрому нарастанию гипоксии и гиперкапнии. В тяжелых случаях может развиваться апноэ.

Ацидоз усиливает токсические эффекты лидокаина.

В тяжелых случаях возникают нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы.

При высокой системной концентрации препарата может развиваться артериальная гипотензия, брадикардия, аритмия и остановка сердца, которые могут привести к летальному исходу.

Уменьшение проявлений передозировки происходит вследствие перераспределения лидокаина из центральной нервной системы и его метаболизма, оно может протекать достаточно быстро, если не была введена большая доза препарата.

Лечение

При проявлении признаков острой системной токсичности введение препарата следует немедленно прекратить.

Пациент должен находиться в горизонтальном положении.

Судороги, угнетение ЦНС и симптомы кардиотоксичности требуют лечения. Целью терапии является поддержка оксигенации, купирование судорог, купирование ацидоза, поддержка кровообращения. В соответствующих случаях необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей и подачу кислорода, а также наладить вспомогательную вентиляцию легких (с помощью маски и мешка), если это необходимо.

Поддержка кровообращения должна осуществляться с помощью инфузии плазмы или растворов для внутривенного введения. Если требуется дальнейшая поддержка кровообращения, следует рассмотреть возможность введения вазопрессоров, однако они повышают риск возбуждения ЦНС. Если судороги не купируются самопроизвольно в течение 15–20 с, их можно купировать с помощью внутривенного введения диазепама (0,1 мг/кг) или натрия тиопентала (внутривенно в дозе 1–3 мг/кг), при этом следует учитывать, что противосудорожные препараты могут также угнетать дыхание и кровообращение.

Продолжительные судороги могут ухудшать вентиляцию легких и оксигенацию, в связи с чем следует рассмотреть возможность ранней эндотрахеальной интубации. В случае остановки сердца приступают к стандартным мероприятиям сердечно-легочной реанимации. Жизненно важное значение имеют постоянная оптимальная оксигенация, вентиляция легких и поддержка кровообращения, а также лечение ацидоза.

Аналептики центрального действия противопоказаны.

Эффективность диализа при лечении острой передозировки лидокаином незначительная.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Эффект лидокаина на другие лекарственные препараты

Местные анестетики

Лидокаина гидрохлорид следует применять с осторожностью у пациентов, получающих другие местные анестетики или препараты, структурно сходные с местными анестетиками амидного типа (например, антиаритмические препараты, такие как мексилетин, токаирид), поскольку системные токсические эффекты препаратов могут потенцироваться.

Антиаритмические препараты III класса

Специальные исследования лекарственного взаимодействия лидокаина с антиаритмическими препаратами III класса (например, амиодароном) не проводились, однако при их одновременном использовании следует соблюдать осторожность.

Миорелаксанты

У пациентов, одновременно получающих миорелаксанты (например, суксаметоний), может повышаться риск увеличения выраженности и длительности нервно-мышечной блокады.

Влияние других лекарственных препаратов на лидокаин

Бета-адреноблокаторы

Бета-адреноблокаторы (например, пропранолол, метопролол, тимолол) замедляют метаболизм лидокаина в печени, тем самым усиливая его эффекты, в том числе и токсические, и повышают риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении бета-адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшить дозу последнего.

Блокаторы кальциевых каналов

Применение блокаторов «медленных» кальциевых каналов (верапамил) может дополнительно снижать АВ-проведение, проведение по желудочкам и сократимость, потенцируя таким образом кардиодепрессивный эффект.

Прениламин

При совместном применении с лидокаином повышается риск развития тахикардии типа «пируэт».

Диуретики

Гипокалиемия, вызываемая диуретиками, может снижать действие лидокаина при их одновременном применении (см. раздел 4.4.).

Допамин и 5-гидрокситриптамин

Допамин и 5-гидрокситриптамин снижают порог судорожной готовности при применении лидокаина.

Антикоагулянты

Применение антикоагулянтов, таких, как гепарин, варфарин, эноксапарин увеличивает риск

развития кровотечений.

Циметидин, ранитидин

Циметидин и ранитидин снижают печеночный клиренс лидокаина вследствие ингибирования микросомального окисления, повышает его концентрацию в крови и риск развития кардиологических и неврологических нежелательных реакций, таких как оглушенность, сонливость, брадикардия, парестезии. При необходимости одновременного назначения лидокаина и циметидина необходимо наблюдение врача, ЭКГ-мониторирование и коррекция дозы лидокаина, в том числе после отмены циметидина.

Антипсихотические препараты и антидепрессанты

У пациентов, одновременно получающих антипсихотические препараты, удлиняющие или возможно удлиняющие интервал QT (например, пимозид, сертиндол, оланзапин, кветиапин, зотепин), а также некоторые антидепрессанты (например, флувоксамин) может повышаться риск развития желудочковых аритмий.

Фенитоин

Необходимо соблюдать осторожность при применении, так как это может привести к снижению эффективности и, как следствие, повышенной потребности в лидокаине. Внутривенное введение фенитоина может усилить кардиодепрессивный эффект лидокаина.

Антиретровирусные средства (например, ампренавир, атазанавир, дарунавир, лопинавир)

Могут вызывать повышение сывороточной концентрации лидокаина с возможным усилением его токсических эффектов.

Антагонисты 5-HT₃-серотониновых рецепторов (трописетрон, доласетрон)

При совместном применении повышается риск возникновения желудочковых аритмий. Алкалоиды спорыньи Одновременное применение лидокаина и алкалоидов спорыньи может вызвать тяжелую артериальную гипотензию.

Барбитураты

Одновременное применение барбитуратов и других ингибиторов микросомальных ферментов печени может привести к снижению эффективности и, как следствие, повышенной потребности в лидокаине.

Хинупристин, дальфопристин

Одновременное применение хинупристина/дальфопристина может увеличивать концентрацию лидокаина и повышать, таким образом, риск желудочковых аритмий; их одновременного применения следует избегать.

Наркотические анальгетики (морфин и др.)

При совместном применении усиливается анальгетическое действие наркотических анальгетиков. Может возрастать риск угнетения дыхания.

Фентанил

Лидокаин снижает судорожный порог к фентанилу у человека.

Клонидин

Применение клонидина может усилить анальгетический эффект местных анестетиков.

Оральные контрацептивы и заместительная гормональная терапия

У женщин, принимающих пероральные контрацептивы или заместительную гормональную терапию, повышается концентрация свободной фракции лидокаина.

Вазоконстрикторы (эпинефрин)

При случайном внутрисосудистом введении может повышаться риск развития желудочковых аритмий.

Комбинация опиоидов и противорвотных средств

Комбинация опиоидов и противорвотных средств, иногда применяемая в целях седации у детей, может снизить судорожный порог к лидокаину и повысить его угнетающее действие на ЦНС.

Этанол

Этанол усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание. Этанол, особенно при длительном злоупотреблении, может уменьшать эффективность лидокаина.

Лидокаин не совместим с амфотерицином В, метогекситоном и нитроглицерином.

Смешивать лидокаин с другими лекарственными средствами не рекомендуется.

Особые указания

Лидокаин должен вводиться медицинскими работниками, которые обладают навыками проведения реанимационных мероприятий и работы с необходимым оборудованием. При использовании лидокаина должны быть доступны средства для проведения реанимационных мероприятий. Персонал, использующий лидокаин у пациентов, должен быть квалифицированным и обучен технике выполнения инъекции лидокаина, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических и нежелательных реакций, и других осложнений.

Лидокаин при высоких концентрациях в крови, особенно после внутрисосудистого введения, может вызывать острые токсические реакции со стороны ЦНС и сердечно-сосудистой системы.

Перед началом внутривенного введения лидокаина необходимо устранить гипокалиемию,

гипоксию и нарушения кислотно-основного состояния.

За пациентами, принимающими антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон) при назначении лидокаина необходимо тщательное наблюдение, включающее ЭКГ-мониторинг, так как возможно потенцирование кардиотропных эффектов.

Раствор лидокаина для инъекций не рекомендуется применять у новорожденных. Оптимальная концентрация лидокаина в крови, позволяющая избежать таких токсических проявлений как судороги и нарушения ритма сердца, у новорожденных не установлена.

Препарат содержит натрий

Данный лекарственный препарат в одной ампуле 2 мл содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия, т.е. практически не содержит натрия.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Лидокаин влияет на ЦНС и, соответственно, на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами.

Пациентам рекомендуется избегать вождения транспортного средства или работы с механизмами при применении лидокаина.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 100 мг/мл.

По 2 мл препарата в ампулы нейтрального бесцветного стекла с кольцом излома или с надрезом и точкой. На ампулы дополнительно может быть нанесено одно, два или три цветных кольца.

На ампулу наклеивают самоклеящуюся этикетку.

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

1, 2 контурные ячейковые упаковки помещают в пачку из картона.

В каждую пачку вкладывают инструкцию по медицинскому применению и скарификатор ампульный.

20, 48, 50, 96, 100 контурных ячейковых упаковок помещают в тару из гофрированного картона с равным количеством инструкций по медицинскому применению и скарификаторов ампульных (для стационаров).

Скарификатор ампульный не вкладывают при использовании ампул с кольцом излома или с надрезом и точкой.

Условия хранения

При температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велтрэйд» (ООО «Велтрэйд»)

115172, г. Москва, ул. Народная, д. 14, стр. 3, эт. 3, пом. I, ком. 3

Производитель/Организация, принимающая претензии от потребителей

Российская Федерация

Общество с ограниченной ответственностью «Велфарм» (ООО «Велфарм»)

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 11

Тел.: +7 (3522) 48-60-00

E-mail: fsk@velpharm.ru

Сообщить о нежелательных реакциях можно по телефону +7 (3522) 55-51-80 или на сайте:
www.brwaygroup.ru, в разделе «ПРОДУКЦИЯ» – «Фармаконадзор».