

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ И СОЦИАЛЬНОГО РАЗВИТИЯ
РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ
по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЛИДОКАИН

Регистрационный номер:

Торговое название: Лидокаин

Международное непатентованное название: лидокаин

Химическое название: (2-диэтиламино)-(2,6-диметилфенил) ацетамид (и в виде гидрохлорида)

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

	10 мг/мл	20 мг/мл	100 мг/мл
<i>Активное вещество:</i>			
Лидокаина гидрохлорида моногидрат (в пересчете на лидокаина гидрохлорид)	- 10 мг	- 20 мг	- 100 мг
<i>Вспомогательные вещества:</i>			
натрия хлорид	- 6 мг	- 6 мг	-
1 М раствор натрия гидроксида	- до pH 5,0–7,0		
вода для инъекций	- до 1 мл		

Описание: прозрачная бесцветная или слегка желтоватого цвета жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее и антиаритмическое средство

Код АТХ: [N01BB02], [C01BB01]

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лидокаин по химической структуре относится к производным ацетанилида. Обладает выраженным местноанестезирующим и антиаритмическим (ІВ класс) действием. Местноанестезирующее действие обусловлено угнетением нервной проводимости за счет блокады натриевых каналов в нервных окончаниях и нервных волокнах. По своему анестезирующему действию лидокаин значительно (в 2-6 раз) превосходит прокаин; действие лидокаина развивается быстрее и длится дольше – до 75 минут, а при одновременном применении с эпинефрином – более 2 часов. При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Антиаритмические свойства лидокаина обусловлены его способностью стабилизировать клеточную мембрану, блокировать натриевые каналы. Практически не влияя на электрофизиологическое состояние предсердий, лидокаин ускоряет реполяризацию в желудочках, угнетает ІV фазу деполяризации в волокнах Пуркинье (фаза диастолической деполяризации), уменьшая их автоматизм и продолжительность потенциала действия, увеличивает минимальную разность потенциалов, при которой миофибриллы реагируют на прежде-

временную 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 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 после внутримышечного введения – 5-15 минут, при медленной внутривенной инфузии без начальной насыщающей дозы – через 5-6 часов (у больных с острым инфарктом миокарда – до 10 часов). С белками плазмы крови связывается 50-80 % лидокаина. Быстро распределяется (период полувыведения фазы распределения – 6-9 минут) в органах и тканях с хорошей перфузией, в том числе 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 % дозы) при участии микросомальных ферментов с образованием активных метаболитов – моноэтилглицинксилидида и глицинксилидида, имеющих период полувыведения 2 часа и 10 часов 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 хронической сердечной недостаточностью. Период полувыведения при непрерывной инфузии в течение 24-48 часов – около 3 часов; 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

Инфильтрационная (в том числе субконъюнктивальная), проводниковая (в том числе ретробульбарная, парабульбарная анестезия), спинальная и эпидуральная анестезия.

Купирование устойчивых пароксизмов желудочковой тахикардии (в том числе при инфаркте миокарда и кардиохирургических вмешательствах), профилактика повторной фибрилляции желудочков при остром коронарном синдроме и повторных пароксизмов желудочковой тахикардии (обычно в течение 12-24 часов), желудочковые аритмии, обусловленные гликозидной интоксикацией (применяют раствор с концентрацией 100 мг/мл).

Противопоказания

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 функционального класса), кардиогенный шок, синдром Морганьи-Адамса-Стокса, нарушения внутрижелудочковой проводимости; гиперчувствительность к любому из компонентов препарата; беременность, период лактации (проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком).

Также необходимо учитывать общие противопоказания к проведению того или иного вида анестезии.

С осторожностью

Хроническая сердечная недостаточность (II функционального класса), артериальная гипотензия, гиповолемия, атриовентрикулярная блокада I степени, синусовая брадикардия, тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность, тяжелая миастения, эпилептиформные судороги (в том числе в анамнезе), сниженный печеночный кровоток, ослабленные или пожилые больные (старше 65 лет), дети до 18 лет (вследствие замедленного метаболизма возможно накопление лидокаина), гиперчувствительность к другим амидным местноанестезирующим средствам в анамнезе.

Применение при беременности и в период лактации

Препарат при беременности и в период лактации противопоказан.

Способ применения и дозы

Для инфильтрационной анестезии: внутримышечно, внутривенно, подкожно. Применяют раствор лидокаина 5 мг/мл (максимальная доза 400 мг).

Для блокады периферических нервов и нервных сплетений: перинеурально, 10-20 мл раствора 10 мг/мл или 5-10 мл раствора 20 мг/мл (не более 400 мг).

Для проводниковой анестезии: перинеурально применяют растворы 10 мг/мл и 20 мг/мл (не более 400 мг).

Для эпидуральной анестезии: эпидурально, растворы 10 мг/мл или 20 мг/мл (не более 300 мг).

Для спинальной анестезии: субарахноидально, 3-4 мл раствора 20 мг/мл (60-80 мг).

Парабульбарная анестезия: парабульбарно, 1-2 мл раствора лидокаина 20 мг/мл.

Ретробульбарная анестезия: ретробульбарно, 3-4 мл раствора лидокаина 20 мг/мл.

Субконъюнктивальная анестезия: введение под конъюнктиву, 0,5-1 мл раствора лидокаина 20 мг/мл.

Для удлинения действия лидокаина возможно добавление *ex tempore* 0,1% раствора эпинефрина (адреналина) (по 1 капле на 5-10 мл раствора лидокаина, но не более 5 капель на весь объем раствора).

Рекомендуется снижение дозы лидокаина у пожилых пациентов и больных с заболеваниями печени (цирроз, гепатит) или со сниженным печеночным кровотоком (хроническая сердечная недостаточность) на 40-50 %.

При хронической почечной недостаточности коррекции дозы не требуется.

Для детей при местной анестезии максимальные дозы у новорожденных – 4 мг/кг, у детей старше 1 года – 5-7 мг/кг.

Лидокаин раствор с концентрацией 100 мг/мл можно применять только после разбавления.

В качестве антиаритмического средства: внутривенно, 25 мл раствора 100 мг/мл следует развести 100 мл 0,9 % раствора натрия хлорида до концентрации лидокаина 20 мг/мл. Этот разведенный раствор используют для введения нагрузочной дозы. 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.

Максимальная доза в 1 час – 300 мг, в сутки – 2000 мг.

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.

Внутривенно струйно детям – 1 мг/кг (обычно 50-100 мг) в качестве нагрузочной дозы при скорости введения 25-50 мг/мин (т.е. в течение 3-4 мин); при необходимости введение дозы повторяют через 5 мин, после чего назначают непрерывную инфузию.

Внутривенно в виде непрерывной инфузии (обычно после нагрузочной дозы): максимальная доза для детей – 30 мкг/кг/мин.

Побочное действие

Со стороны нервной системы, органов чувств и психики: угнетение или возбуждение центральной нервной системы, нервозность, эйфория, головная боль, головокружение, сонливость, общая слабость, невротические реакции, спутанность или потеря сознания, угнетение или остановка дыхания, дезориентация, судороги (риск развития повышается на

фоне гиперкапнии и ацидоза), шум в ушах, парестезии, диплопия, нистагм, светобоязнь, тремор, тризм мимических мышц, тревога.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение или повышение артериального давления, нарушение проводимости сердца, аритмия, синусовая брадикардия, периферическая вазодилатация, коллапс, боль в груди, остановка сердца.

Аллергические реакции: генерализованный эксфолиативный дерматит, анафилактический шок, ангионевротический отек, контактный дерматит (гиперемия в месте нанесения, кожная сыпь, крапивница, зуд).

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Прочие: ощущение «жара», «холода» или онемения конечностей, стойкая анестезия, эректильная дисфункция, злокачественная гипертермия, метгемоглобинемия, мелькание «мушек» перед глазами и тахикардия при одновременном введении с вазоконстриктором.

Передозировка

Симптомы: первые признаки интоксикации – головокружение, тошнота, рвота, эйфория, снижение артериального давления, астения; затем – судороги мимической мускулатуры с переходом в тонико-клонические судороги скелетной мускулатуры, психомоторное возбуждение, брадикардия, асистолия, коллапс; при использовании при родах, у новорожденного возможно – брадикардия, угнетение дыхательного центра, апноэ.

Лечение – прекращение введения препарата, легочная вентиляция, ингаляция кислородом. Симптоматическая терапия. При судорогах внутривенно вводят 10 мг диазепама. При брадикардии – м-холиноблокаторы (атропин), вазоконстрикторы (норэпинефрин, фенилэфрин). Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких, реанимационных мероприятий. Гемодиализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Бета-адреноблокаторы и циметидин повышают риск развития токсических эффектов.

Аймалин, амиодарон, верапамил и хинидин усиливают отрицательный инотропный эффект.

Индукторы микросомальных ферментов печени (барбитураты, фенитоин, рифампицин) снижают эффективность лидокаина.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) удлиняют местноанестезирующее действие лидокаина и могут вызывать повышение артериального давления и тахикардию.

Лидокаин снижает эффект антимиастенических средств.

Совместное применение с прокаинамидом может вызвать возбуждение центральной нервной системы, галлюцинации.

Гуанадрел, гуанетидин, мекамиламин, триметафан камзилат повышают риск выраженного снижения артериального давления и брадикардии.

Усиливает и удлиняет действие миорелаксантов.

Сочетанное применение лидокаина и фенитоина следует использовать с осторожностью, так как возможно уменьшение резорбтивного действия лидокаина, а также развитие нежелательного кардиодепрессивного эффекта.

Под влиянием ингибиторов моноаминоксидазы вероятно усиление местноанестезирующего действия лидокаина и снижения артериального давления. Больным, принимающим ингибиторы моноаминоксидазы, лидокаин назначать не следует.

При одновременном назначении лидокаина и полимиксина В возможно усиление угнетающего влияния на нервно-мышечную передачу. В этом случае необходимо следить за функцией дыхания больного.

При сочетанном применении лидокаина со снотворными или седативными средствами, наркотическими анальгетиками, гексеналом или тиопенталом натрия возможно усиление угнетающего действия на центральную нервную систему и дыхание.

При внутривенном введении лидокаина больным, принимающим циметидин, возможны такие нежелательные эффекты, как состояние оглушенности, сонливость, брадикардия,

парестезии и др. Это связано с повышением концентрации лидокаина в плазме крови, что объясняется высвобождением лидокаина из связи с белками крови, а также замедлением его инактивации в печени. В случае необходимости проведения комбинированной терапии этими препаратами следует уменьшать дозу лидокаина.

При обработке места инъекции дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Особые указания

Не рекомендуется профилактическое назначение препарата всем без исключения больным с острым инфарктом миокарда (рутинное профилактическое назначение лидокаина может повысить риск смерти за счет увеличения частоты возникновения асистолий).

При неэффективности лидокаина необходимо в первую очередь исключить гипокалиемию, в неотложных ситуациях существует несколько вариантов дальнейших действий: осторожное увеличение дозы до появления побочных эффектов со стороны центральной нервной системы (заторможенность, затрудненная речь); назначение, иногда совместное, лекарственных средств IA класса (прокаинамид), переход к препаратам III класса (амиодарон, бретилия тозилат).

Необходимо отменить ингибиторы моноаминоксидазы не менее чем за 10 дней, в случае запланированного использования лидокаина.

Следует проявлять осторожность при проведении местной анестезии тканей с высокой васкуляризацией, во избежание внутрисосудистой инъекции рекомендуется проводить аспирационную пробу.

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 10 мг/мл, 20 мг/мл, 100 мг/мл.

По 5 мл или 10 мл (для растворов 10 мг/мл или 20 мг/мл) и по 2 мл (для растворов 20 мг/мл или 100 мг/мл) в ампулах.

По 10 ампул по 2 мл или 10 мл помещены в коробки из картона с гофрированными перегородками.

По 5 ампул по 2 мл, 5 мл или 10 мл в контурной ячейковой упаковке из пленки поливинилхлоридной. По 1, 2 контурные ячейковые упаковки помещены в пачку из картона.

В каждую пачку, коробку вкладывают инструкцию по применению, нож ампульный или скарификатор (при упаковке ампул с кольцом излома, точкой и надсечкой нож ампульный или скарификатор не вкладывают).

Срок годности

2 года. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска из аптек

По рецепту.

Производитель/организация, принимающая претензии

ОАО «Биосинтез», Россия, 440033, г. Пенза, ул. Дружбы, 4, тел/факс (8412) 57-72-49.

Генеральный директор
ОАО «Биосинтез»



О.Ю. Клыгина