

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА**

Лидокаин-АКОС, 4,6 мг/доза, спрей для местного и наружного применения дозированный

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лидокаина гидрохлорид.

1 доза содержит 4,6 мг лидокаина гидрохлорида (в виде моногидрата).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: спирт этиловый 96 % (этанол), пропиленгликоль (см. раздел 4.4.).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Спрей для местного и наружного применения дозированный.

Прозрачная бесцветная или с желтоватым оттенком жидкость.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. Показания к применению**

Препарат показан к применению у взрослых и детей (см. разделы 4.3., 4.4).

Препарат может быть использован для местного обезболивания в следующих случаях:

В стоматологии

Для проведения терминальной (поверхностной) анестезии: обезболивание области укола перед местной анестезией; вскрытие поверхностных абсцессов; перед наложением швов на слизистую оболочку; перед фиксацией коронок и мостов; при лечении воспаления десен, пародонтопатий; экстирпация молочных зубов; удаление зубного камня, у детей при операции иссечения уздечки языка и вскрытии кист слюнных желез.

В оториноларингологии

Операции на носовой перегородке и удаление полипов носа; проведение электрокоагуляции при лечении носовых кровотечений; устранение глоточного рефлекса и обезболивание места введения инъекционной иглы перед удалением миндалин; вскрытие перитонзиллярных абсцессов; пункция верхнечелюстной пазухи.

В акушерстве и гинекологии

Эпизиотомия и обработка разреза; удаление швов; небольшие операции на влагалище и шейке матки; прорыв плевы; обработка нитевого нагноения.

При инструментальных и эндоскопических исследованиях

Перед введением зонда через нос или рот (в т.ч. дуоденальное зондирование и дробное исследование желудочной секреции); при ректоскопии, интубации;

При рентгенографическом обследовании

Устранение тошноты и глоточного рефлекса.

В качестве анальгезирующего (обезболивающего) лекарственного средства

При ожогах (включая солнечные); укусах; контактном дерматите (в т.ч. вызванном раздражающими растениями); небольших ранах (в т.ч. царапинах).

Поверхностная анестезия кожных покровов

При небольших хирургических вмешательствах.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Дозировка может варьировать в зависимости от показаний и размера зоны, подлежащей анестезии.

Одна доза спрея, освобождаемая нажатием на дозирующий клапан, содержит 4,6 мг лидокаина.

Рекомендации по количеству нажатий в различных областях применения:

Область применения	Количество нажатий
Стоматология	1–4
Оториноларингология	1–4
Эндоскопические и инструментальные исследования	2–3
Акушерство	15–20
Гинекология	4–5
Дерматология	1–3

Во избежание всасывания препарата в системный кровоток следует применять минимальную дозу, обеспечивающую эффект. Обычно достаточно 1–3 нажатий; возможно применение 15–20 или более нажатий (максимальная доза – 40 нажатий на 70 кг массы тела).

Способ применения

Местно, наружно.

Препарат можно также наносить при помощи смоченного в нем ватного тампона.

Дети

В стоматологической практике у детей предпочтительнее применять в виде смазывания (во избежание испуга ребенка при распылении) путем предварительной пропитки ватного тампона.

4.3. Противопоказания

- гиперчувствительность к лидокаину или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- применение лидокаина в виде спрея для тонзиллэктомии и аденотомии у детей до 8 лет.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

- инструментальные исследования (ректоскопия) у пациентов с геморроидальным кровотечением;
- местная инфекция в области применения;
- травма слизистой оболочки или кожных покровов в области применения;
- тяжелая соматическая патология;
- эпилепсия;
- брадикардия, нарушение сердечной проводимости;
- нарушения функции печени;
- тяжелый шок;
- сопутствующие острые заболевания;
- ослабленные больные;
- беременность, период грудного вскармливания;
- младший детский возраст;
- пожилой возраст.

Особые указания

При использовании флакон следует держать в вертикальном положении.

Следует избегать попадания в глаза и дыхательные пути (риск аспирации). Требуется особой осторожности нанесение препарата в область задней стенки глотки.

Нанесение на слизистую оболочку щёк сопровождается риском дисфагии и последующей аспирации, особенно у детей. При нарушении чувствительности языка и слизистой оболочки щёк повышается риск их прикусывания.

Лидокаин хорошо всасывается через слизистые оболочки (особенно в трахее) и поврежденную кожу. Это следует принимать во внимание, особенно при обработке больших участков ткани у детей.

В случае применения спрея при хирургических операциях в глотке или носоглотке следует учесть, что лидокаин, подавляя глоточный рефлекс, попадает в гортань и трахею и

подавляет кашлевой рефлекс, что может привести к бронхопневмонии. Это особенно важно у детей, поскольку у них чаще вызывается глоточный рефлекс. В связи с этим спрей не рекомендуется для местной анестезии перед тонзилэктомией и аденотомией у детей в возрасте до 8 лет.

Следует соблюдать осторожность при нанесении лидокаина на поврежденную слизистую оболочку и/или инфицированные зоны.

Препарат следует применять с осторожностью у больных эпилепсией, а также при брадикардии, нарушении проведения в сердце, нарушении функции печени и тяжелом шоке, особенно когда можно ожидать всасывания значительного количества препарата при обработке больших участков ткани высокими дозами.

Более низкие дозы следует применять у ослабленных и пожилых пациентов, при острых заболеваниях, а также у детей – в соответствии с возрастом и общим состоянием.

У детей в возрасте до 2 лет Лидокаин-АКОС спрей рекомендуется наносить ватным тампоном, смоченным в препарате.

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 реакций, нежелательных явлений и реакций, и других осложнений.

Вспомогательные вещества

Пропиленгликоль

Препарат содержит пропиленгликоль, который может вызывать раздражение кожи.

Спирт этиловый 96 % (этанол)

Препарат содержит небольшое количество этанола (алкоголя), менее чем 100 мг на 1 дозу.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Вазоконстрикторы (эпинефрин, фенилэфрин, метоксамин) удлиняют местноанестезирующее действие лидокаина.

Циметидин и пропранолол снижают печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма вследствие ингибирования микросомального окисления и снижения печеночного кровотока) и повышают риск развития токсических эффектов (в т.ч. состояние оглушенности, сонливость, брадикардия, парестезии и др.).

Барбитураты, фенитоин, рифампицин (~~индукторы микросомальных ферментов печени~~) снижают эффективность лидокаина (может потребоваться увеличение дозы).

При назначении с аймалином, фенитоином, верапамилом, хинидином, амиодароном возможно усиление отрицательного инотропного эффекта.

Совместное назначение с бета-адреноблокаторами увеличивает риск развития брадикардии.

Сердечные гликозиды ослабляют кардиотонический эффект, курареподобные препараты усиливают мышечную релаксацию.

Прокаионамид повышает риск развития возбуждения центральной нервной системы, галлюцинаций.

При одновременном назначении лидокаина и снотворных и седативных препаратов возможно усиление их угнетающего действия на центральную нервную систему.

При внутривенном введении гексобарбитала или тиопентала натрия на фоне действия лидокаина возможно угнетение дыхания.

Под влиянием ингибиторов моноаминоксидазы (МАО) (фуразолидон, прокарбазин, селегилин) возможно усиление местноанестезирующего действия лидокаина. Пациентам, принимающим ингибиторы МАО, не следует назначать лидокаин парентерально.

При одновременном применении лидокаина и полимиксина возможно усиление угнетающего влияния на нервно-мышечную передачу, поэтому в таком случае необходимо следить за функцией дыхания больного.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Результаты контролируемых клинических исследований у беременных отсутствуют.

При необходимости использования местной анестезии и отсутствии более безопасного лечения, препарат можно применять во время беременности.

Лактация

Лидокаин выделяется в грудное молоко, однако после нанесения обычных терапевтических доз его количество, выделяющееся с молоком, слишком мало, чтобы нанести какой-либо вред грудному ребенку.

Фертильность

Данные о влиянии лидокаина на фертильность человека отсутствуют.

4.7. Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

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

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нарушение со стороны иммунной системы: возможен аллергический контактный дерматит (гиперемия в месте нанесения, кожная сыпь, крапивница, зуд), ангионевротический отёк, анафилактический шок, бронхоспазм.

Применение препарата следует прекратить при возникновении любой аллергической реакции.

Частота системных реакций после применения спрея Лидокаин-АКОС чрезвычайно мала, т.к. наносится очень небольшое количество активного препарата, который может попасть в кровоток.

В случае нанесения больших доз, а также при быстром всасывании, гиперчувствительности, идиосинкразии, плохой переносимости препарата могут наблюдаться нижеследующие побочные эффекты со стороны центральной нервной системы и сердечно-сосудистой системы.

Нарушения со стороны нервной системы: могут наблюдаться системные реакции - головная боль, головокружение, судороги, тремор, нарушение зрения, шум в ушах, возбуждение и/или депрессия, чувство страха, эйфория, беспокойство, жар, ощущение холода, угнетение дыхания.

Нарушения со стороны сердца и сосудов: повышение артериального давления, снижение артериального давления, брадикардия, аритмия, угнетение функции миокарда.

Общие нарушения и реакции в месте введения: слабое жжение, которое прекращается после наступления анестезии (в течение 1 минуты), эритема, отёк, нарушение чувствительности.

Прочие: уретрит (после местного нанесения).

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

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

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения (Росздравнадзор)

Телефон: +7 800 550 99 03

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

Повышенное потоотделение, бледность кожных покровов, тошнота, рвота, головокружение, головная боль, нечеткость зрительного восприятия, звон в ушах, диплопия, снижение артериального давления, брадикардия, аритмия, сонливость, озноб, онемение, тремор, беспокойство, возбуждение, судороги, метгемоглобинемия, остановка сердца.

Лечение

При появлении первых признаков интоксикации (головокружение, тошнота, рвота, эйфория) пациента переводят в горизонтальное положение и назначают ингаляцию кислорода; при психомоторном возбуждении – внутривенно 10 мг диазепама; при судорогах – в/в 1 % раствор гексобарбитала или тиопентала натрия; при брадикардии – в/в 0,5–1 мг атропина, симпатомиметические средства (норэпинефрин, фенилэфрин). Диализ неэффективен.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее средство

Код АТХ: D04AB01

Механизм действия и фармакодинамические эффекты

Лидокаин – местный анестетик амидного типа.

Местноанестезирующее действие обусловлено обратимым угнетением нервной проводимости за счет блокады натриевых каналов в нервных окончаниях, что препятствует генерации импульсов в окончаниях чувствительных нервов и проведению болевых импульсов по нервным волокнам.

Лидокаин обладает быстрым началом действия, высокой анестезирующей активностью и низкой токсичностью.

При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия. Обладает анальгезирующим эффектом.

Эффект развивается через 1–5 мин после нанесения на слизистые оболочки или кожу и сохраняется в течение 30–60 мин.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Быстро всасывается со слизистых оболочек (особенно глотки и дыхательного тракта), степень всасывания препарата определяется степенью кровоснабжения слизистой оболочки, общей дозой препарата, локализацией участка и продолжительностью аппликации. После нанесения на слизистую оболочку верхних дыхательных путей частично проглатывается и инактивируется в желудочно-кишечном тракте.

Время достижения максимальной концентрации (TC_{max}) в плазме при нанесении на слизистую оболочку полости рта и верхних дыхательных путей – 10–20 мин. Связь с белками зависит от концентрации препарата и составляет 60–80 % при концентрации препарата 1–4 мкг/мл (4,3–17,2 мкмоль/л).

Распределение

Распределяется быстро (период полувыведения ($T_{1/2}$) фазы распределения – 6–9 мин), сначала поступает в хорошо кровоснабжаемые ткани (сердце, легкие, мозг, печень, селезенка), затем в жировую и мышечную ткани. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, секретируется с материнским молоком (40 % от концентрации в плазме матери).

Биотрансформация

Метаболизируется в печени (на 90–95 %) с участием микросомальных ферментов путем дезалкилирования аминогруппы и разрыва амидной связи с образованием менее активных по сравнению с лидокаином метаболитов (моноэтилглицинксилидин и глицинксилидин), $T_{1/2}$ которых составляет 2 ч и 10 ч соответственно. При заболеваниях печени интенсивность метаболизма снижается и составляет от 50 % до 10 % от нормальной величины.

Элиминация

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Спирт этиловый 96 % (этанол)

Пропиленгликоль

Натрия гидроксид (натрия гидроокись)

Натрия сахарината дигидрат (сахарин натрия)

Рацементол (ментол рацемический)

Вода очищенная

6.2. Несовместимость

Не применимо.

6.3. Срок годности (срок хранения).

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 20 г (не менее 340 доз) или 38 г (не менее 650 доз) во флаконы из полиэтилена высокой плотности, укупоренные насадкой-распылителем, в комплекте с адаптером.

Один флакон с инструкцией по применению помещают в пачку из картона.

6.6. Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата и других манипуляции с препаратом

Нет особых требований к утилизации.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ПАО «Синтез»

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Телефон: +7 (495) 646-28-68

Адрес электронной почты: info@binnopharmgroup.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения:

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ПАО «Синтез»

640008, Курганская обл., г. Курган, проспект Конституции, д. 7

Телефон: +7 (495) 646-28-68

Адрес электронной почты: info@binnopharmgroup.ru

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП-№(002293)-(РГ-RU)

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации: 04.05.2023

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Лидокаин-АКОС доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет» <https://eec.eaeunion.org/>.