

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Лидокаин, 10 мг/мл, раствор для инъекций.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лидокаин.

1 мл раствора содержит 10,0 мг лидокаина гидрохлорида.

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: натрий (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Раствор для инъекций.

Прозрачный от бесцветного до светло-желтого цвета раствор.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1. Показания к применению

Препарат Лидокаин показан к применению у взрослых и детей в возрасте от 1 года до 18 лет: местная и регионарная анестезия, проводниковая анестезия при больших и малых хирургических вмешательствах.

4.2. Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Режим дозирования следует подбирать, основываясь на реакции пациента в месте введения.

Препарат следует вводить в наименьшей концентрации и наименьшей дозе, дающей требуемый эффект.

Максимальная доза для взрослых не должна превышать 300 мг.

Объем раствора, подлежащий введению, зависит от вида анестезии, размера анестезируемого участка.

Детям, пожилым и ослабленным пациентам препарат вводят в меньших дозах,

соответствующих их возрасту и физическому состоянию.

У взрослых и детей 12 – 18 лет однократная доза лидокаина (за исключением спинальной анестезии) не должна превышать 4,5 мг/кг, при максимальной – 300 мг.

Дозы, рекомендуемые для взрослых

Инфильтрационная анестезия: внутривенно, подкожно, внутримышечно	
Малые вмешательства	2 – 10 мл (20 – 100 мг)
Большие вмешательства	10 – 20 мл (100 – 200 мг)
Проводниковая анестезия (анестезия/блокада периферических нервов, в т.ч. блокада нервных сплетений)	
Перинеурально	3 – 20 мл (30 – 200 мг)
Блокада нервов пальцев кисти и стопы	2 – 4 мл (20 – 40 мг)
Блокада нервных сплетений	10 – 20 мл (100 – 200 мг)
Блокада межреберных нервов	3 мл (30 мг)
Блокада плечевого нерва	25 – 30 мл (250 – 300 мг)
Паравертебральная анестезия	3 – 5 мл (30 – 50 мг)
Вагосимпатическая блокада шейного	5 мл (50 мг)
Вагосимпатическая блокада поясничного отдела	5 – 10 мл (50 – 100 мг)
Эпидуральная анестезия	
Торакальный отдел	20 – 30 мл (200 – 300 мг)
Лумбальный отдел	25 – 30 мл (250 – 300 мг)
Сакральный отдел	20 – 30 мл (200 – 300 мг)
Спинальная анестезия	
Внутривенная регионарная анестезия (введение анестетика непосредственно в вену конечности (при условии, наложения жгута выше места введения))	Не более 5 мг (50 мл)

Дети

Дети от 1 года до 12 лет

Максимальная доза у детей 1 – 12 лет составляет 4,5 мг/кг массы тела 1 % раствора.

Дети младше 1 года

Опыт применения у детей младше 1 года ограничен.

Особые группы пациентов

Пожилые и ослабленные пациенты

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

Способ применения

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

Инструкции по приготовлению лекарственного препарата перед применением см. раздел 6.6.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к лидокаину и к анестетикам амидного типа или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- Тяжелая синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, атриовентрикулярная (AV) блокада 3 степени, тяжелые нарушения внутрижелудочковой проводимости, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта;
- Кардиогенный или гиповолемический шок, острая декомпенсация сердечной недостаточности;
- Детский возраст до 1 года.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

Следует с осторожностью применять у пациентов:

- с миастенией *gravis*;
- лиц пожилого возраста;
- с эпилепсией. Необходимо тщательно наблюдать за пациентами с судорожными расстройствами на предмет симптоматики со стороны центральной нервной системы (ЦНС). Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность;
- с полной или неполной блокадой внутрисердечного проведения, поскольку местные анестетики могут угнетать AV – проведение;
- с хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания;
- с коагулопатией. Терапия антикоагулянтами (например, гепарином), нестероидными

противовоспалительными препаратами (НПВП) или плазмозаменителями повышает склонность к кровотечениям. Случайное повреждение сосудов может привести к тяжелым кровотечениям. При необходимости следует проверить время кровотечения, активированное частичное тромбопластиновое время 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 почечной недостаточности, при которой могут кумулировать метаболиты лидокаина);
- третий триместр беременности.

С осторожностью проведение субарахноидальной анестезии необходимо при: боли в спине, инфекции головного мозга, доброкачественных и злокачественных новообразованиях головного мозга, мигрени, субарахноидальном кровоизлиянии, артериальной гипертензии, артериальной гипотензии, психозе, истерии.

Особые указания

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.

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 электрокардиографический (ЭКГ) мониторинг, поскольку влияние на сердце может потенцироваться.

Поступали пострегистрационные сообщения о хондроллизе у пациентов, которым осуществляли длительную внутрисуставную инфузию местных анестетиков после операции. В большинстве случаев хондроллиз 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 сердечных сокращений у плода (см. раздел 4.6).

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.

Раствор для инъекций лидокаина не рекомендуется применять у новорожденных. Оптимальная сывороточная концентрация лидокаина, позволяющая избежать такой токсичности, как судороги и аритмии, у новорожденных не установлена.

Следует избегать внутрисосудистого введения, если таковое напрямую не показано. Особую осторожность следует проявлять при проведении местной анестезии богатых кровеносными сосудами органов. При введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Препарат Лидокаин, раствор для инъекций, 10 мг/мл не разрешен для интратекального введения (субарахноидальной анестезии).

Вспомогательные вещества

Данный препарат содержит 4,718 мг натрия на минимальную дозу 20 мг (2 мл), то есть, по сути, не содержит натрия. Данный препарат содержит 70,77 мг натрия на максимальную дозу 300 мг (30 мл). Необходимо учитывать пациентам, находящимся на диете с ограничением поступления натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Токсичность лидокаина увеличивается при его одновременном применении с циметидином и пропранололом вследствие повышения концентрации лидокаина, это требует снижения дозы лидокаина. Оба препарата снижают печеночный кровоток. Кроме того, циметидин ингибирует микросомальную активность ферментов печени.

Ранитидин, дилтиазем, верапамил, пропранолол и другие β -адреноблокаторы уменьшают

клиренс лидокаина, что приводит к повышению его концентрации в плазме крови.

Повышение сывороточной концентрации лидокаина также могут вызывать противовирусные средства (например, ампренавир, атазанавир, дарунавир, лопинавир).

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

Лидокаин следует применять с осторожностью у пациентов, получающих другие местные анестетики или средства, структурно сходные с местными анестетиками амидного типа (например, антиаритмическими средствами, такими как мексилетин, токаинид), поскольку системные токсические эффекты носят аддитивный характер.

При сочетанном применении лидокаина с наркотическими анальгетиками, гексеналом или тиопенталом натрия возможно усиление угнетающего действия на ЦНС и дыхание.

Отдельные исследования лекарственного взаимодействия между лидокаином и антиаритмическими средствами III класса (например, амиодароном) не проводились, однако рекомендуется соблюдать осторожность при их совместном применении.

У пациентов, одновременно получающих антипсихотические средства, удлиняющие или способные удлинять интервал QT (например, пимозид, сертиндол, оланзапин, кветиапин, зотепин), прениламин, эпинефрин (при случайном внутривенном введении) или антагонисты 5-HT₃-серотониновых рецепторов (например, трописетрон, доласетрон), может повышаться риск развития желудочковых аритмий.

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

У пациентов, получающих миорелаксанты (например, суksamетоний), может повышаться риск усиленной и пролонгированной нервно-мышечной блокады.

После применения бупивакаина у пациентов, получавших верапамил и тимолол, сообщалось о развитии сердечно-сосудистой недостаточности; лидокаин близок по структуре к бупивакаину.

Допамин и 5-гидрокситриптамиин снижают порог судорожной готовности у пациентов, получающих лидокаин.

Опиоиды, вероятно, обладают противосудорожным действием, что подтверждается данными, что лидокаин снижает судорожный порог к фентанилу у человека.

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.

Применение эпинефрина вместе с лидокаином может снизить системную абсорбцию, но при случайном внутривенном введении резко возрастает риск желудочковой тахикардии и фибрилляции желудочков.

Одновременное применение других антиаритмических препаратов, β -адреноблокаторов и блокаторов «медленных» кальциевых каналов может дополнительно снижать АВ — проведение, проведение по желудочкам и сократимость миокарда.

Одновременное применение сосудосуживающих средств увеличивает длительность действия лидокаина.

Одновременное применение лидокаина и алкалоидов спорыньи (например, эрготамина) может вызвать тяжелую артериальную гипотензию.

Необходимо соблюдать осторожность при применении седативных средств, поскольку они могут повлиять на действие местных анестетиков на ЦНС.

Следует соблюдать осторожность при применении противоэпилептических средств (фенитоин), барбитуратов и других ингибиторов микросомальных ферментов печени, поскольку это может привести к снижению эффективности и, как следствие, повышенной потребности в лидокаине. С другой стороны, внутривенное введение фенитоина может усилить угнетающее действие лидокаина на сердце.

Анальгезирующий эффект местных анестетиков может усиливаться опиоидами и клонидином.

Совместное применение лидокаина с прокаинамидом может вызвать возбуждение ЦНС, галлюцинации.

При одновременном применении лидокаина и полимиксина-В необходимо следить за функцией дыхания пациента. Этиловый спирт, особенно при длительном злоупотреблении, может снижать действие местных анестетиков. Лидокаин несовместим с амфотерицином В, метогекситоном и нитроглицерином.

При одновременном применении лидокаина с наркотическими анальгетиками развивается аддитивный эффект, что используется при проведении эпидуральной анестезии, однако

усиливает угнетение ЦНС и дыхания.

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

Использование с ингибиторами моноаминоксидазы (фуразолидон, прокарбазин, селегилин), вероятно, усиливает местноанестезирующее действие лидокаина и повышает риск снижения артериального давления.

Гуанадрел, гуанетидин, мекамиламин, триметафана камсилат повышают риск выраженного снижения артериального давления и брадикардии.

Антикоагулянты (в т.ч. ардепарин натрия, далтепарин натрия, данапароид натрия, эноксапарин натрия, гепарин, варфарин и др.), НПВП или плазмозаменители увеличивают риск развития кровотечений. Лидокаин снижает кардиотонический эффект дигитоксина.

Лидокаин снижает эффект антимиастенических лекарственных средств (прозерин, оксазил и др.), усиливает и удлиняет действие миорелаксирующих лекарственных средств.

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

Смешивать лидокаин с другими лекарственными препаратами не рекомендуется.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Применять лидокаин во время беременности и в период грудного вскармливания возможно, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и новорожденного. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования.

При осложнениях или кровотечении в анамнезе проведение эпидуральной анестезии лидокаином в акушерстве противопоказано.

Лидокаин применяли у большого числа беременных женщин и женщин с сохраненным репродуктивным потенциалом. Какие-либо репродуктивные нарушения (повышение частоты пороков развития плода) не зарегистрированы.

Вследствие потенциального достижения высокой концентрации местных анестетиков у плода после парацервикальной блокады могут развиваться нежелательные реакции, такие как фетальная брадикардия.

В связи с этим лидокаин в концентрации, превышающей 1 %, в акушерстве не применяют. В исследованиях на животных вредное воздействие на плод не обнаружено.

Лактация

Лидокаин в небольшом количестве проникает в грудное молоко, его пероральная биодоступность очень низкая. При применении лидокаина в период грудного вскармливания в рекомендуемых дозах влияние на ребенка маловероятно. Тем не менее следует проявлять осторожность при применении лидокаина в период грудного вскармливания. Решение о возможности применения лидокаина в период грудного вскармливания принимает врач.

Фертильность

Данные о влиянии лидокаина на фертильность человека отсутствуют.

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

В период лечения из-за возможных побочных эффектов 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.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции перечислены ниже в соответствии с классификацией по основным системам и органам и частоте встречаемости, которая была определена в соответствии с классификацией Всемирной организации здравоохранения (ВОЗ): 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 (не может быть установлена на основании имеющихся данных).

Подобно другим местным анестетикам, нежелательные реакции на лидокаин редки и, как правило, обусловлены повышенной плазменной концентрацией вследствие случайного внутрисосудистого введения, превышения дозы или быстрой абсорбцией из участков с обильным кровоснабжением, либо вследствие гиперчувствительности, идиосинкразии или сниженной переносимости пациентом. Реакции системной токсичности, главным образом,

проявляются со стороны центральной нервной и/или сердечно-сосудистой системы (см. также раздел 4.9)

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: реакции гиперчувствительности, кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Нарушения со стороны нервной системы и психические нарушения

Часто: головокружение, парестезии.

Нечасто: судороги, парестезия вокруг рта, онемение языка, гиперacusia, нарушение зрения, тремор, сонливость, шум в ушах, спутанность сознания, дизартрия.

Редко: нейропатия, повреждение периферических нервов, арахноидит.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: затуманенное зрение, диплопия.

Нарушения со стороны сердца

Часто: брадикардия.

Редко: угнетение миокарда (отрицательный инотропный эффект), аритмии, возможна остановка сердца или недостаточность кровообращения.

Нарушения со стороны сосудов

Очень часто: артериальная гипотензия.

Часто: артериальная гипертензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: одышка, бронхоспазм, угнетение дыхания, остановка дыхания.

Желудочно-кишечные нарушения:

Часто: рвота.

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

Сайт в информационно-телекоммуникационной сети «Интернет»:

www.roszdravnadzor.gov.ru

4.9. Передозировка

Симптомы

Токсичность со стороны ЦНС проявляется симптомами, нарастающими по тяжести. Сначала может развиваться парестезия вокруг рта, онемение языка, головокружение, тошнота, рвота, эйфория, гиперacusия и шум в ушах. Нарушение зрения и мышечный тремор или мышечные подергивания свидетельствуют о более серьезной токсичности и предшествуют генерализованным судорогам. Эти признаки не следует путать с невротическим поведением. Затем могут наступить потеря сознания и большие судорожные припадки продолжительностью от нескольких секунд до нескольких минут. Судороги приводят к быстрому нарастанию гипоксии и гиперкапнии, обусловленных повышенной мышечной активностью и нарушением дыхания. В тяжелых случаях может развиваться апноэ. Ацидоз усиливает токсические эффекты местных анестетиков.

В тяжелых случаях возникают нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы. При высокой системной концентрации могут развиваться артериальная гипотензия, брадикардия, аритмия и остановка сердца, которые могут оказаться летальными.

Разрешение передозировки происходит вследствие перераспределения местного анестетика из ЦНС и его метаболизма, оно может протекать достаточно быстро (если не была введена очень большая доза препарата).

Лечение

При возникновении признаков передозировки введение анестетика следует немедленно прекратить.

Судороги, угнетение ЦНС и кардиотоксичность требуют медицинского вмешательства. Главные цели терапии заключаются в поддержании оксигенации, прекращении судорог, поддержании адекватного кровообращения и купирования ацидоза (в случае его развития).

В соответствующих случаях необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей и

назначить кислород, а также наладить вспомогательную вентиляцию легких (масочную или с помощью мешка Амбу). Поддержание кровообращения осуществляется посредством вливания плазмы или инфузионных растворов. При необходимости длительного поддержания кровообращения следует рассмотреть возможность введения вазопрессоров, однако они повышают риск возбуждения ЦНС. Контроль судорог можно достичь посредством внутривенного введения диазепама (0,1 мг/кг) или тиопентала натрия (1 – 3 мг/кг), при этом следует учитывать, что противосудорожные средства могут также угнетать дыхание и кровообращение. Продолжительные судороги могут препятствовать вентиляции легких и оксигенации пациента, в связи с чем следует рассмотреть возможность ранней эндотрахеальной интубации. При остановке сердца приступают к стандартной сердечно-легочной реанимации.

Эффективность диализа при лечении острой передозировки лидокаином очень низкая.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа: анестетики; местные анестетики; амиды

Код АТХ: N01BB02.

Механизм действия, фармакодинамические эффекты

Лидокаин является короткодействующим местным анестетиком амидного типа. В основе его механизма действия лежит уменьшение проницаемости мембраны нейрона для ионов натрия. В результате этого снижается скорость деполяризации и повышается порог возбуждения, приводя к обратимому местному онемению. Лидокаин применяется в целях достижения проводниковой анестезии в различных участках тела и контроля аритмий. Обладает быстрым началом действия (около одной минуты после внутривенного введения и пятнадцати минут после внутримышечного), быстро распространяется в окружающие ткани. Действие продолжается 10 – 20 минут и около 60 – 90 минут после внутривенного и внутримышечного введения, соответственно.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Лидокаин быстро абсорбируется из желудочно-кишечного тракта, однако вследствие

эффекта "первичного прохождения" через печень лишь небольшое его количество достигает системного кровотока.

Системная абсорбция лидокаина определяется местом введения, дозой и его фармакологическим профилем. Максимальная концентрация в крови достигается после межреберной блокады, далее (в порядке снижения концентрации), после введения в поясничное эпидуральное пространство, плечевое сплетение и подкожные ткани. Основным фактором, определяющим скорость абсорбции и концентрацию в крови, является общая введенная доза, независимо от участка введения. Имеется линейная зависимость между количеством введенного лидокаина и результирующей максимальной концентрацией анестетика в крови.

Распределение

Лидокаин связывается с белками плазмы, включая α_1 -кислый гликопротеин (АКГ) и альбумин. Степень связывания вариабельна, составляет приблизительно 66 %. Концентрация АКГ в плазме крови у новорожденных низкая, поэтому у них отмечается относительно высокое содержание свободной биологически активной фракции лидокаина. Лидокаин проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, вероятно, посредством пассивной диффузии.

Биотрансформация

Лидокаин метаболизируется в печени, около 90 % введенной дозы подвергается N-дезалкилированию с образованием моноэтилглицинксилида (MEGX) и глицинксилида (GX), оба вносят вклад в терапевтические и токсические эффекты лидокаина. Фармакологические и токсические эффекты MEGX и GX сопоставимы с таковыми лидокаина, но выражены слабее. GX обладает более длинным, чем лидокаин, периодом полувыведения (около 10 часов) и может кумулировать при многократном введении.

Элиминация

Метаболиты, образующиеся в результате последующего метаболизма, выводятся почками, содержание неизменного лидокаина в моче не превышает 10 %. При хронической почечной недостаточности возможна кумуляция метаболитов. Подкисление мочи способствует увеличению выведения лидокаина.

Терминальный период полувыведения лидокаина после внутривенного болюсного введения здоровым взрослым добровольцам составляет 1 – 2 часа. Терминальный период

полувыведения GX составляет около 10 часов, MEGX — 2 часа.

Особые группы пациентов

Вследствие быстрого метаболизма на фармакокинетику лидокаина могут оказывать влияние состояния, нарушающие функцию печени. У пациентов с нарушением функции печени период полувыведения лидокаина может повышаться в 2 и более раз.

Нарушение функции почек не влияет на фармакокинетику лидокаина, но может приводить к кумуляции его метаболитов.

У новорожденных отмечается низкая концентрация АКГ, поэтому связь с белками плазмы может снижаться. Вследствие потенциально высокой концентрации свободной фракции применение лидокаина у новорожденных не рекомендуется.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия хлорид

Натрия гидроксида раствор

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами, за исключением упомянутых в разделе 6.6.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года.

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 25 °С. Хранить в оригинальной упаковке (пачке).

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Раствор для инъекций, 10 мг/мл.

По 3,5 мл или 5 мл в ампулы нейтрального стекла марки НС-3 или в ампулы медицинского стекла 1-го гидролитического класса. Ампулы используются с насечкой/надрезом и точкой или кольцом излома.

На каждую ампулу наклеивают этикетку из бумаги этикеточной или самоклеящуюся.

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной.

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому

применению помещают в пачку из картона.

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

Объем раствора, подлежащий введению, зависит от размера анестезируемого участка. Если есть потребность в введении большого объема с низкой концентрацией, то стандартный раствор разводят солевым раствором (0,9 % раствор натрия хлорида). Разведение осуществляют непосредственно перед введением.

Утилизация

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

Адрес: 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: +7 (495) 640-25-28

Электронная почта: reception@promomed.pro

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «ПРОМОМЕД РУС»

Адрес: Российская Федерация, 129090, г. Москва, проспект Мира, дом 13, строение 1, офис 13

Телефон: 8 800 222 95 63; 8 800 777 86 04 (круглосуточно)

Электронная почта: hot_line@promomed.pro

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

Дата первой регистрации:

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

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