

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

Лидокаин, 20 мг/мл, раствор для инъекций.

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лидокаин.

Каждый мл раствора содержит 20 мг лидокаина (в виде 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.

Бесцветная или слегка окрашенная прозрачная жидкость.

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

Лидокаин показан к применению у взрослых и детей от 1 года для:

- Проведения местной и регионарной анестезии;
- Проведения проводниковой анестезии при больших и малых хирургических вмешательствах.

4.2. Режим дозирования и способ примененияРежим дозирования

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

Максимальная доза для здоровых взрослых не должна превышать 300 мг.

У взрослых однократная доза лидокаина (за исключением спинальной анестезии) не должна превышать 5 мг/кг, при максимальной - 300 мг.

Дозы, рекомендуемые для взрослых

	10 мг/мл	20 мг/мл
Инфильтрационная анестезия: внутривенно, подкожно, внутримышечно		
Малые вмешательства	2-10 мл (20-100 мг)	
Большие вмешательства	10-20 мл (100-200 мг)	5-10 мл (100-200 мг)
Проводниковая анестезия (анестезия/блокада периферических нервов, в т.ч. блокада нервных сплетений)		
Перинеурально:	3-20 мл (30-200 мг)	1,5-10 мл (30-200 мг)
Блокада нервов пальцев кисти	2-4 мл (20-40 мг)	2-4 мл (40-80 мг)

и стопы		
Блокада нервных сплетений	10-20 мл (100-200 мг)	5-10 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 отдела	5 мл (50 мг)	
Вагосимпатическая блокада поясничного отдела	5-10 мл (50-100 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	20-30 мл (200-300 мг)	10-15 мл (200-300 мг)
Люмбальный отдел	25-40 мл (250-400 мг)	12,5-20 мл (250-400 мг)
Сакральный отдел	20-30 мл (200-300 мг)	10-15 мл (200-300 мг)
Спинальная анестезия		
Субарахноидально		3-4 мл (60-80 мг)
Внутривенная регионарная анестезия (введение анестетика непосредственно в вену конечности (при условии наложения жгута выше места введения))	Не более 5 мл (50 мг)	Не более 2,5 мл (50 мг)

Особые группы пациентов

Пожилые и ослабленные пациенты

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

Дети

Детям препарат вводят в меньших дозах, соответствующих их возрасту и физическому состоянию.

Дети в возрасте от 0 до 1 года

Безопасность и эффективность препарата Лидокаин у детей от 0 до 1 года на данный момент не установлены. Данные отсутствуют.

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.

Дети в возрасте от 1 до 12 лет

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

Подростки в возрасте от 12 до 18 лет

Режим дозирования у подростков в возрасте от 12 до 18 лет не отличается от режима дозирования для взрослых.

Способ применения

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

Препарат вводят внутривенно, подкожно, внутримышечно, внутривенно и перинеурально.

Инструкции по разведению лекарственного препарата перед применением см. в разделе 6.6.

Разведение осуществляется непосредственно перед введением.

4.3. Противопоказания

- Гиперчувствительность к лидокаину, анестетикам амидного типа или любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1;
- Полная атриовентрикулярная (AV) блокада;
- Гиповолемия.

4.4. Особые указания и меры предосторожности при применении

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.

Как и все местные анестетики, лидокаин при высоких концентрациях в крови, особенно после внутрисосудистого введения, может вызывать острые токсические реакции со стороны центральной нервной системы (ЦНС) и сердечно-сосудистой системы.

С осторожностью следует назначать:

- если в анамнезе пациента наблюдалась аллергическая или другая нежелательная реакция на лидокаин или другие местные анестетики, такая как кожная сыпь или одышка;

- с нарушениями возбудимости и проводимости сердца, поскольку местные анестетики могут угнетать проводимость в миокарде (см. раздел 4.3);
- пациентам, получающими антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон) (см. раздел 4.5);
- при хронической сердечной недостаточности, при брадикардии или после операции на сердце. Такие пациенты должны находиться под тщательным наблюдением, необходим мониторинг ЭКГ, так как нарушения со стороны сердца могут ухудшаться;
- при коагулопатии, так как терапия антикоагулянтами (например, гепарином), нестероидными противовоспалительными препаратами (НПВП) или плазмозаменителями повышает склонность к кровотечениям. Случайное повреждение кровеносных сосудов может привести к тяжелым кровотечениям. При необходимости следует контролировать время кровотечения, активированное частичное тромбопластиновое время (АЧТВ), протромбиновое время по Квику и содержание тромбоцитов;
- при тяжелом шоке;
- при нарушениях функции дыхания;
- при эпилепсии;
- при миастении gravis;
- у пациентов пожилого возраста и ослабленных пациентов (см. раздел 4.2);
- с нарушениями функции печени, поскольку препарат метаболизируется в печени;
- при нарушениях функции почек с клиренсом креатинина менее 10 мл/мин;
- в период беременности (см. раздел 4.6.);
- в период лактации (см. раздел 4.6.).

Перед началом внутривенного регионарного введения лидокаина необходимо устранить гипокалиемию, гипоксию и нарушение кислотно-щелочного баланса.

Было показано, что лидокаин может вызывать порфирию у животных, следует избегать его применения у пациентов с порфирией.

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

Меры предосторожности при проведении спинальной анестезии

Во время спинальной анестезии следует контролировать уровень артериального давления. Эпидуральная анестезия может приводить к артериальной гипотензии и брадикардии. Риск можно снизить предварительным введением кристаллоидных или коллоидных растворов. Необходимо немедленно купировать артериальную гипотензию. Следует

всегда соблюдать осторожность у пациентов с нарушениями функции сердечно-сосудистой системы.

Меры предосторожности при проведении парацервикальной блокады

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 4.6).

Меры предосторожности при проведении анестезии области шеи и головы

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

Меры предосторожности при ретробульбарном введении

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.

Меры предосторожности при ретро- и перibuльбарном введении

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.

Меры предосторожности при внутримышечном введении

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

Хондролиз

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.

Следует избегать внутрисосудистого введения, если таковое напрямую не показано.

Вспомогательные вещества

Натрия хлорид

Данный препарат содержит 1,5 ммоль (или 36 мг) натрия на 15 мл раствора (максимальная

разовая доза в пересчете на 300 мг), что необходимо учитывать пациентам, находящимся на диете с ограничением поступления натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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.

Циметидин, ранитидин

Циметидин и ранитидин снижают печеночный клиренс лидокаина вследствие ингибирования микросомального окисления, повышая его концентрацию в крови и риск развития кардиологических и неврологических побочных эффектов, 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.

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

Повышение сывороточной концентрации лидокаина с возможным усилением его токсических эффектов также могут вызывать противовирусные средства.

Диуретики

Гипокалиемия, вызываемая диуретиками, может снижать действие лидокаина при их одновременном применении.

Местные анестетики

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

Антиаритмические препараты III класса

Отдельные исследования лекарственного взаимодействия между лидокаином и антиаритмиками III класса (например, амиодароном) не проводились, однако рекомендуется соблюдать осторожность (см. раздел 4.4.).

Антипсихотические препараты, антагонисты 5-HT₃-серотониновых рецепторов и антидепрессанты

У пациентов, одновременно получающих антипсихотические средства, удлиняющие или способные удлинять интервал QT (например, пимозид, сертиндол, оланзапин, кветиапин, зотепин), некоторые антидепрессанты (например, флувоксамин) или антагонисты 5-HT₃-серотониновых рецепторов (например, тропisetрон, доласетрон), может повышаться риск развития желудочковых аритмий.

Прениламин

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

Хинупристин, дальфопристин

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

Миорелаксанты

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

Клонидин

Применение клонидина может усиливать анальгетический эффект местных анестетиков.

Оральные контрацептивы и заместительная гормональная терапия

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

Допамин и 5-гидрокситриптамин

Допамин и 5-гидрокситриптамин снижают порог судорожной готовности к лидокаину.

Фентанил

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

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.

Вазоконстрикторы (эпинефрин)

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

Блокаторы кальциевых каналов

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

Алкалоиды спорыньи

Одновременное применение лидокаина и алкалоидов спорыньи может вызвать тяжелую артериальную гипотензию.

Барбитураты

Следует соблюдать осторожность при одновременном применении барбитуратов и других ингибиторов микросомальных ферментов печени, поскольку это может привести к снижению эффективности и, как следствие, повышенной потребности в лидокаине.

Фенитоин

Следует соблюдать осторожность при применении противосудорожных средств (фенитоин), 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.

Этанол

Этанол усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание. Этиловый спирт, особенно при длительном злоупотреблении, может снижать действие местных анестетиков.

Наркотические анальгетики (морфин и др.)

При одновременном применении лидокаина с наркотическими анальгетиками усиливается анальгетическое действие наркотических анальгетиков. Может возрастать риск угнетения дыхания.

Антикоагулянты

Антикоагулянты (в т.ч. эноксапарин натрия, гепарин, варфарин и др.) увеличивают риск развития кровотечений.

Лидокаин не совместим с амфотерицином В, метогекситоном и нитроглицерином.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

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 вредное воздействие на плод не обнаружено. Тем не менее лидокаин разрешается применять во время беременности только при условии, что польза превышает риски. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования. При осложнениях или кровотечении в анамнезе проведение эпидуральной анестезии лидокаином в акушерстве противопоказано.

Лидокаин при эпидуральной или парацервикальной блокаде (особенно в больших дозах) или при инфильтрационной анестезии в перианальную область, введенный перед родами, быстро проникает в кровоток плода. Повышенная концентрация лидокаина может сохраняться у новорожденного в течение не менее 48 часов после родов. У плода может развиваться брадикардия, у новорожденного наблюдаться брадикардия, гипотония или угнетение дыхания. В связи с этим лидокаин в концентрациях, превышающей 1 %, в акушерстве не применяют.

Лактация

Лидокаин в небольшом количестве 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.

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

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

Если при анестезии затрагиваются участки тела, связанные с вождением транспортного средства или работой с механизмами, пациентам рекомендуется избегать этих действий до полного восстановления нормальной функции.

4.8. Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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. раздел 4.9.).

После спинальной или эпидуральной анестезии с применением лидокаина могут наблюдаться артериальная гипотензия, гиповентиляция, синдром Горнера и гипокалиемия. Выраженность данных эффектов зависит от дозы и уровня блокады. После крестцовой или поясничной эпидуральной блокады может возникнуть задержка мочи. Продолжительность задержки мочи не должна превышать продолжительность блокады. После блокады звездочного ганглия могут наблюдаться апноэ и гемипарез. Причиной может быть введение лидокаина в позвоночную или сонную артерию.

Резюме нежелательных реакций

Внутри каждого системно-оргannого класса нежелательные реакции классифицированы в соответствии с частотой их возникновения: очень часто ($\geq 1/10$), часто ($\geq 1/100$, но $< 1/10$), нечасто ($\geq 1/1\ 000$, но $< 1/100$), редко ($\geq 1/10\ 000$, но $< 1/1\ 000$), очень редко ($< 1/10\ 000$), частота неизвестна (на основании имеющихся данных оценить невозможно).

Нарушения со стороны крови и лимфатической системы

Частота неизвестна: метгемоглобинемия.

Нарушения со стороны иммунной системы

Редко: реакции гиперчувствительности¹, крапивница, кожная сыпь, ангионевротический отек, бронхоспазм, в тяжелых случаях анафилактический шок.

Нарушения со стороны нервной системы²

Часто: парестезии, 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).

Редко: невропатия, поражение периферических нервов, арахноидит.

Частота неизвестна: повышенная возбудимость, кома.

Нарушения со стороны органа зрения

Редко: нечеткость зрения, диплопия и преходящая потеря зрения, двусторонняя потеря зрения³.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Частота неизвестна: шум в ушах, гиперактузия.

Нарушения со стороны сердца

Часто: брадикардия.

Редко: остановка сердца, аритмии.

Нарушения со стороны сосудов

Очень часто: артериальная гипотензия.

Часто: артериальная гипертензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Редко: угнетение дыхания.

Частота неизвестна: одышка, остановка дыхания.

Желудочно-кишечные нарушения

Очень часто: тошнота.

Часто: рвота.

¹ Кожные пробы для выявления аллергии на лидокаин считаются ненадежными.

² К неврологическим осложнениям спинальной анестезии относятся преходящие неврологические симптомы, такие как боль в нижней части спины, ягодицах и ногах. Эти симптомы развиваются, как правило, в течение 24 часов после анестезии и проходят в течение нескольких дней. После спинальной анестезии лидокаином и сходными препаратами описаны отдельные случаи возникновения арахноидита или симптома конского хвоста с персистирующей парестезией, дисфункцией кишечника и мочевыводящих путей или параличом нижних конечностей. Большинство случаев были связаны с гипербарической концентрацией лидокапина или длительной спинальной инфузией.

³ Двусторонняя потеря зрения также может быть следствием случайного введения в оболочку зрительного нерва во время офтальмологических процедур. После ретро- и перibuльбарной анестезии сообщалось о случаях воспаления тканей глазницы и диплопии.

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации 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 Российской Федерации
(Росздравнадзор)

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»:
<http://www.roszdravnadzor.gov.ru/>

4.9. Передозировка

Симптомы острой системной токсичности

Токсичность со стороны ЦНС проявляется симптомами, нарастающими по тяжести. Сначала может развиваться парестезия вокруг рта, онемение языка, головокружение, 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 острой токсичности

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 купировании 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. Если судороги не купируются самопроизвольно в течение 15-20

секунд, их можно купировать посредством внутривенного введения диазепама (0,1 мг/кг)

или

тиопентала

натрия

(внутривенно в дозе 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. Жизненно важное значение имеют постоянная оптимальная оксигенация, вентиляция легких и поддержка кровообращения, а также лечение ацидоза.

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 и фармакодинамические эффекты

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.

5.2. Фармакокинетические свойства

Абсорбция

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

Распределение

Связь с белками плазмы – 50 – 80 %. Распределяется быстро (период полураспределения: 6 - 9 минут), 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).

Биотрансформация

Метаболизируется в печени (на 90 - 95 %) с участием цитохрома P450 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.

Элиминация

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

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Натрия хлорид

Натрия гидроксида 1М раствор (для коррекции pH)

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Лидокаин несовместим с растворами, содержащими амфотерицин В, метогекситал натрия, нитроглицерин. 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 в защищённом от света месте при температуре не выше 25 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

По 2 мл в стеклянные шприцы нейтрального стекла с замком Луер-Лок, с твердым колпачком и комплектующими.

По 1 шприцу в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной или полиэтилентерефталатной.

По 1 контурной ячейковой упаковке вместе с иглой инъекционной и инструкцией по медицинскому применению (листком-вкладышем) 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

Нет особых требований к утилизации.

Инструкция по разведению лекарственного препарата

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 разводят солевым раствором (0,9 % раствор натрия хлорида).

Раствор лидокаина в концентрации 10 мг/мл получают путем смешивания раствора лидокаина в концентрации 20 мг/мл с физиологическим раствором (0,9 % раствор натрия хлорида) в соотношении 1:1 (т.е. при смешивании 1 мл лидокаина в концентрации 20 мг/мл с 1 мл физиологического раствора (0,9 % раствор натрия хлорида) получится 2 мл лидокаина в концентрации 10 мг/мл).

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие Научно-производственный центр «Фармзащита» Федерального медико-биологического агентства (ФГУП НПЦ «Фармзащита» ФМБА России)

141402, Московская область, г.о. Химки, г. Химки, ш. Вашутинское, д.11

Тел.: 8 (495) 789-65-55

Факс: 8 (495) 789-65-55 (доб. 100)

Адрес электронной почты: info@atompharm.ru

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

Федеральное государственное унитарное предприятие Научно-производственный центр «Фармзащита» Федерального медико-биологического агентства (ФГУП НПЦ «Фармзащита» ФМБА России)

141402, Московская область, г.о. Химки, г. Химки, ш. Вашутинское, д.11

Тел.: 8 (495) 789-65-55

Факс: 8 (495) 789-65-55 (доб. 100)

Адрес электронной почты: info@atompharm.ru

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/>