

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

Лидокаин, 20 мг/мл, раствор для инъекций

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество: лидокаина гидрохлорида моногидрат

Каждый мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида моногидрата (в пересчете на лидокаина гидрохлорид) 20 мг.

Каждая ампула объемом 2 мл содержит лидокаина гидрохлорида моногидрата (в пересчете на лидокаина гидрохлорид) 40 мг.

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

Прозрачная бесцветная или светло-желтая жидкость

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ**4.1. 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.

4.2. Режим дозирования и способ применения**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.

Максимальная доза для взрослых - не более 4,5 мг/кг, но не более 300 мг; для внутривенной регионарной анестезии - не более 4 мг/кг.

Повторное введение в течение 24 часов не рекомендуется.

Дозы, рекомендуемые для взрослых

Инфильтрационная анестезия: внутривенно, 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)
Блокады межреберных нервов	1,5-2,5 мл (30-50 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 (250-300 мг)
Сакральный отдел	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 2,5 мл (50 мг)

Не рекомендуется применять непрерывное введение анестетика с помощью катетера; введение максимальной дозы не должно повторяться чаще, чем через 90 мин.

Пожилые и ослабленные пациенты

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

Способ применения

Инфильтрационная, проводниковая, внутривенная регионарная, эпидуральная, спинальная анестезия.

Инструкцию по приготовлению лекарственного препарата см. в разделе 6.6.

4.3. Противопоказания

Гиперчувствительность к лидокаину гидрохлориду, анестетикам амидного типа или к 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 18 лет.

Субарахноидальная анестезия - полная блокада сердца, кровотечения, артериальная гипотензия, шок, инфицирование места проведения

люмбальной пункции, септицемия.

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. Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность. У пациентов с полной и неполной блокадой внутрисердечного проведения, поскольку местные анестетики могут угнетать АВ-проведение; с хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания; с коагулопатией. Терапия антикоагулянтами (например, гепарином), нестероидными противовоспалительными препаратами 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 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 (см. разделе ниже).

Особые указания

Введение лидокаина должны осуществлять специалисты, обладающие опытом проведения и оборудованием для реанимации. При введении местных анестетиков необходимо располагать оборудованием для проведения реанимации.

Его 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. Низкие дозы лидокаина также могут

повышать судорожную готовность. У пациентов с полной и неполной блокадой внутрисердечного проведения, поскольку местные анестетики могут угнетать АВ-проведение; с хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания; с коагулопатией. Терапия антикоагулянтами (например, гепарином), нестероидными противовоспалительными препаратами 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 почечной недостаточности, при которой могут кумулировать метаболиты лидокаина).

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.

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 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 сердечнососудистой 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 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.

Вспомогательные вещества

Натрий

Данный препарат содержит менее 1 ммоль (23 мг) натрия в расчете на одну ампулу 2 мл, то есть по сути не содержит натрия.

4.5. Взаимодействие с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

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 (МАО) – 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.

4.6. Фертильность, беременность и лактация

Фертильность

Данные о влиянии лидокаина на фертильность человека отсутствуют.

Беременность

Лидокаин разрешается применять во время беременности и грудного вскармливания. 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 детородного возраста. Какие-либо репродуктивные нарушения не зарегистрированы, т.е. повышения частоты пороков развития не отмечалось.

Вследствие потенциального достижения высокой концентрации местных анестетиков у плода после парацервикальной блокады у него могут развиваться нежелательные реакции, такие как фетальная брадикардия. В связи с этим лидокаин в концентрации, превышающей 1 %, в акушерстве не применяют.

Лидокаин быстро проникает через плаценту, у новорожденных с высокой плазменной концентрацией лидокаин может угнетать ЦНС и, следовательно, затруднять оценку состояния по шкале Апгар.

В исследованиях на животных вредное воздействие на плод не обнаружено.

Грудное вскармливание

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.

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

В зависимости от дозы и способа введения лидокаин может оказывать временное влияние на двигательную способность и координацию. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

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 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.).

Резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции описаны в соответствии с системно-органными классами MedDRA.

Частота определена следующим образом: очень часто ($\geq 1/10$); часто ($\geq 1/100$, $< 1/10$); нечасто ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); редко ($\geq 1/10000$, $< 1/1000$); очень редко ($< 1/10000$), включая отдельные сообщения; частота неизвестна (частота не может быть подсчитана по доступным данным).

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы: очень часто - артериальная гипотензия; часто - брадикардия, артериальная гипертензия; редко - угнетение миокарда (отрицательный инотропный эффект), аритмии, возможна остановка сердца или недостаточность кровообращения.

Нарушения со стороны нервной системы и психические расстройства: часто - головокружение, парестезии; нечасто - судороги, парестезия вокруг рта, онемение языка, гиперакузия, нарушение зрения, тремор, сонливость, шум в ушах, спутанность сознания, дизартрия; редко - нейропатия, повреждение периферических нервов, арахноидит.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта: часто - рвота.

Нарушения со стороны иммунной системы: редко - реакции гиперчувствительности, кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Нарушения со стороны органа зрения: редко - затуманенное зрение, диплопия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: редко - одышка, бронхоспазм, угнетение дыхания, остановка дыхания.

Сообщения о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозрительных 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

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»:

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

4.9. Передозировка

Симптомы

Токсичность со стороны центральной нервной системы 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. 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 центральной нервной системы 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: местноанестезирующее средство.

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 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).

Биотрансформация

Метаболизируется в печени (на 90-95 %) с участием цитохрома P450 путем дезалкилирования аминоксигруппы 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 раствор 1 М

Вода для инъекций

6.2. Несовместимость

Данный лекарственный препарат не следует смешивать с другими лекарственными препаратами.

6.3. Срок годности (срок хранения)

3 года

6.4. Особые меры предосторожности при хранении

В защищенном от света месте при температуре не выше 30 °С.

6.5. Характер и содержание первичной упаковки

Первичная упаковка

По 2 мл препарата в ампулы нейтрального стекла НС-3 или импортные с точкой или кольцом излома.

На каждую ампулу наклеивают этикетку из бумаги или самоклеящуюся этикетку.

Вторичная упаковка

По 10 ампул вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона с вкладышем из бумаги или гофрированной ленты, или со специальными гнездами и наклеивают этикетку-бандероль из бумаги. Допускается текст этикетки-бандероли наносить непосредственно на пачку.

По 5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной и фольги алюминиевой лакированной или без фольги.

По 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона.

Не все размеры упаковок могут быть доступны для реализации.

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. Весь оставшийся лекарственный препарат и отходы следует уничтожить в установленном порядке.

Инструкция по приготовлению лекарственного препарата

Если есть потребность во введении большого объема с низкой концентрацией, то стандартный раствор разводят солевым раствором (0,9 % раствор натрия хлорида). Разведение осуществляется непосредственно перед введением.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Российская Федерация

ФКП «Армавирская биофабрика»

352212, Краснодарский край, Новокубанский район, п. Прогресс, ул. Мечникова, д. 11

Тел.: (86195) 2-11-15, факс: (86195) 4-10-26.

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ФКП «Армавирская биофабрика»

352212, Краснодарский край, Новокубанский район, п. Прогресс, ул. Мечникова, д. 11

Тел.: (86195) 2-11-15, факс: (86195) 4-10-26.

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

9. ДАТА ПЕРВИЧНОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ, ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)

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/>.