

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

ЛИДОКАИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование препарата: Лидокаин

Международное непатентованное или группировочное наименование препарата:
лидокаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав

Действующее вещество: лидокаина гидрохлорида моногидрат (в пересчете на лидокаина гидрохлорид) 20,0 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид 6,0 мг, натрия гидроксида 1М раствор до pH 5,0 -7,0, вода для инъекций до 1 мл

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость

Фармакотерапевтическая группа: анестетики; местные анестетики; амиды.

Код АТХ: N01BB02

Фармакологическое действие

Фармакодинамика

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 эpineфрина – более 2 часов). При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Фармакокинетика

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

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).

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.

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

Показания к применению

Местная и регионарная анестезия, проводниковая анестезия при больших и малых хирургических вмешательствах.

Противопоказания

Гиперчувствительность к компонентам препарата и к анестетикам амидного типа. Тяжелая синоатриальная блокада, синдром слабости синусового узла, атриовентрикулярная (AV) блокада 3 степени, тяжелые нарушения внутрижелудочковой проводимости, синдром WPW (синдром Вольфа-Парксинсона-Уайта). Кардиогенный или гиповолемический шок, острая декомпенсация сердечной недостаточности. Для субарахноидальной анестезии (дополнительно) - полная блокада сердца, кровотечения, артериальная гипотензия, шок, инфицирование места проведения люмбальной пункции, септицемия, детский возраст для - до 18 лет

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 ЦНС. Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность;
- с полной и 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), 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 (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. раздел «Особые указания»).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

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 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.

Способ применения и дозы

Режим дозирования следует подбирать, основываясь на реакции пациента и месте введения. Препарат следует вводить в наименьшей концентрации и наименьшей дозе, дающей требуемый эффект. Лидокаин применяют для инфильтрационной, проводниковой, внутривенной регионарной, эпидуральной и спинальной анестезии. 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 %- ный раствор натрия хлорида). Разведение осуществляют непосредственно перед введением. Максимальная доза для взрослых - не более 4,5 мг/кг, рекомендуется не превышать дозу 300 мг; для внутривенной регионарной анестезии – не более 4 мм/кг. Повторное введение в течение 24 часов не рекомендуется.

Дозы, рекомендуемые для взрослых

<i>Инфильтрационная анестезия:</i> внутривожно, подкожно, внутримышечно	
Большие вмешательства	5-10 мл (100-200 мг)
<i>Проводниковая анестезия</i> (<i>анестезия/блокада периферических нервов, в т.ч. блокада нервных сплетений</i>)	
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)
<i>Эпидуральная анестезия</i>	
Торакальный отдел	10-15 мл (200-300 мг)

Люмбальный отдел	12,5-20 мл (250-400 мг)
Сакральный отдел	10-15 мл (200-300 мг)
<i>Спинальная анестезия</i> (субарахноидально)	3-4 мл (60-80 мг)
<i>Внутривенная регионарная анестезия</i> (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.

Побочное действие

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.

Нежелательные реакции перечислены ниже по системно-органным классам и частоте. Частоты определены как: 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 ($< 1/10000$) и частота не установлена (нельзя установить на основании доступных данных).

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, парастезия вокруг рта, онемение языка, гиперактузия, 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.

Передозировка

Первые признаки интоксикации – головокружение, тошнота, рвота, эйфория, снижение артериального давления; затем – судороги мимической мускулатуры лица с переходом в тонико-клонические судороги скелетной мускулатуры, психомоторное возбуждение, астения, апноэ, брадикардия, коллапс, метгемоглобинемия; при применении в родах у новорожденного – брадикардия, угнетение дыхательного центра, апноэ.

При первых признаках интоксикации введение препарата прекращают. Пациент должен находиться в горизонтальном положении; назначают ингаляцию кислорода. В случаях проявления судорог вводят внутривенно 10 мг диазепама. При брадикардии – м-холиноблокаторы (атропин), вазоконстрикторы (норэпинефрин, фенилэфрин). Диализ неэффективен.

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.

Особые указания

Особую осторожность следует проявлять при проведении местной анестезии богатых кровеносными сосудами органов. При введении в васкуляризованные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу. Персонал, выполняющий анестезию, должен быть квалифицированным и обучен технике выполнения анестезии, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических реакций, нежелательных явлений или реакций, и других осложнений.

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*;
- у пожилых пациентов;
- при эпилепсии. Необходимо тщательно наблюдать за пациентами с судорожными расстройствами на предмет симптоматики со стороны ЦНС. Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность.

- с полной и 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), 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 (АЧТВ) и содержание тромбоцитов.

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

У пациентов с синдромом Мелькерссона-Розенталя аллергические и токсические реакции со стороны нервной системы в ответ на введение местных анестетиков могут развиваться чаще.

Лидокаин следует с осторожностью применять 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).

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 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 сердцебиения у плода (см. раздел «Применение во время беременности и в период грудного вскармливания»).

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.

Следует избегать внутрисосудистого введения, если таковое напрямую не показано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами и 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.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 20 мг/мл

Первичная упаковка лекарственного препарата.

По 2, 5, 10 мл в ампулы полиэтиленовые из полиэтилена низкой плотности. На ампулы наносят маркировку принтером в соответствии с маркировкой первичной упаковки лекарственного препарата.

Вторичная упаковка лекарственного препарата.

По 10 ампул, соединенных в кассеты с инструкцией по применению (листочком-вкладышем) помещают в пачку из картона для потребительской тары подгрупп хромовый или хром-эрзац или другого аналогичного качества. Пачки помещают в групповую упаковку.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

3 года.

Не применять по истечении срока годности.

Условия отпуска

Отпускается по рецепту.

Производитель

АО «Фармасинтез», Россия.

Юридический адрес:

Россия, 664007, Иркутская обл., г. Иркутск, Красногвардейская д.23, офис 3.

Адрес производственной площадки:

г. Иркутск ул.Р. Люксембург, д. 184

Владелец регистрационного удостоверения/Организация, принимающая претензии потребителей

АО "Фармасинтез", Россия,

664040, г. Иркутск, ул. Р. Люксембург, д. 184.

тел.: 8-800-100-1550,

www.pharmasyntez.com