

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКАЇНУ ГІДРОХЛОРИД (LIDOCAINE HYDROCHLORIDE)

Склад:

діюча речовина: лідокаїну гідрохлорид;

1 мл розчину містить лідокаїну гідрохлориду, в перерахуванні на безводну речовину 20 мг; *допоміжні речовини:* натрію хлорид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна або ледь забарвлена рідина.

Фармакотерапевтична група. Препарати для місцевої анестезії. Амідні. Лідокаїн.

Код АТХ N01B B02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Лідокаїн – місцевоанестезуючий засіб. Місцевоанестезуюча дія зумовлена стабілізацією нейрональної мембрани за рахунок зниження її проникності для іонів натрію, що перешкоджає виникненню потенціалу дії і проведенню нервових імпульсів. Можливий антагонізм з іонами кальцію. Ефективний для усіх видів місцевої анестезії. Пригнічує проведення не тільки больових імпульсів, але й імпульсів іншої модальності. Швидко гідролізується у слабколужному середовищі тканин і після короткого латентного періоду діє протягом 1-1,5 години. Анестезуюча дія лідокаїну в 2-6 разів сильніша, ніж прокаїну. При запаленні анестезуюча активність знижується. При місцевому застосуванні розширює судини, не чинить місцевоподразнювальної дії.

Фармакокінетика.

При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація в крові досягається через 5-15 хвилин. У плазмі зв'язується з білками крові на 33-80 %. Ступінь зв'язування значною мірою залежить від концентрації препарату і вмісту альфа-1-ацидглікопротеїну у плазмі крові. Зв'язування з білками плазми збільшується у пацієнтів з уремією і реципієнтів ниркової трансплантації і посилюється після гострого інфаркту міокарда, що характеризується збільшенням рівня альфа-1-ацидглікопротеїну. Високе зв'язування з білками може зменшувати дію вільного лідокаїну або спричиняти загальне підвищення концентрацій препарату у плазмі крові. Терапевтичний ефект розвивається при концентрації 1,5-5 мкг/мл. Швидко розподіляється у тканинах, об'єм розподілу становить 1 л/кг. Спочатку надходить у тканини з високим темпом кровопостачання: серце, мозок, нирки, легені, печінка, селезінка, потім – у жирову і м'язову тканини. Легко проникає крізь гістогематичні бар'єри, включаючи гематоенцефалічний і плацентарний. В організмі немовляти виявляється 40-55 % від концентрації препарату в організмі матері. Метаболізується у печінці з участю мікросомальних ферментів з утворенням метаболітів: моноетилгліцинексилідиду і гліцинексилідиду. Швидкість метаболізму визначається кровотоком у печінці і, як результат, може бути порушена у пацієнтів після інфаркту міокарда та/або у пацієнтів із застійною серцевою недостатністю. Виводиться з організму нирками у формі метаболітів (приблизно 90 %) і в незміненому вигляді (10 %). Виведення незміненого препарату із сечею частково залежить від рН сечі. Кисла сеча призводить до збільшення частки, виведеної із сечею. Період напіввиведення після внутрішньовенного болюсного введення – 1,5-2 години. Період напіввиведення метаболітів становить 2 і 10 годин відповідно. При порушенні функції печінки період напіввиведення може зростати.

Клінічні характеристики.

Показання. Місцева анестезія (термінальна, інфільтраційна, провідникова) у хірургії, офтальмології, стоматології, отоларингології; як розчинник антибактеріальних засобів групи цефалоспоринів.

Протипоказання.

Індивідуальна підвищена чутливість до компонентів препарату, а також до інших амідних місцевоанестезуючих лікарських засобів; наявність в анамнезі на епілептоформні судоми, пов'язані з

введенням лідокаїну гідрохлориду; AV-блокада II і III ступеня, синдром слабкості синусового вузла, синдром Вольфа-Паркінсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса, тяжкі форми серцевої недостатності (II-III ступеня), виражена артеріальна гіпотензія, брадикардія, кардіогенний шок; міастенія; гіповолемія; порфірія; тяжка ниркова та/або печінкова недостатність; ретробульбарне введення хворим на глаукому, розлади згортання крові, антикоагулянтна терапія; інфекції у місці ін'єкції; неконтактні пацієнти.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При комбінованому застосуванні лідокаїну з такими препаратами як хлорпромазин, петидин, бупівакаїн, хінідин, дизопірамід, амітриптилін, імipрамін, нортриптилін концентрація лідокаїну у плазмі крові знижується.

Антиаритмічні препарати (у т. ч. аміодарон, верапаміл, хінідин, дизопірамід, аймалін) – посилюється кардіодепресивна дія (відбувається подовження інтервалу QT, у поодиноких випадках можливий розвиток AV-блокади або фібриляції шлуночків); одночасне застосування з аміодароном може призвести до розвитку судом.

Новокаїн, новокаїнамід, прокаїнамід – можливе збудження центральної нервової системи, марення, галюцинації.

Курареподібні препарати – посилюється міорелаксація (можливий параліч дихальних м'язів).

Етанол посилює пригнічувальну дію лідокаїну на дихання.

Вазоконстриктори (епінефрин, метоксамін, фенілефрин) сприяють уповільненню всмоктування лідокаїну і пролонгують дію останнього.

Циметидин знижує печінковий кліренс лідокаїну (зниження метаболізму внаслідок інгібування мікросомального окиснення), підвищує його концентрацію і ризик розвитку токсичних ефектів.

Гуанадрель, гуанетидин, мекаміламін, триметафан – при комбінованому застосуванні для спінальної і епідуральної анестезії підвищується ризик вираженої артеріальної гіпотензії і брадикардії.

β -адреноблокатори уповільнюють метаболізм лідокаїну у печінці, посилюють ефекти лідокаїну (у т. ч. токсичні) і підвищують ризик розвитку брадикардії та артеріальної гіпотензії. При одночасному застосуванні β -адреноблокаторів і лідокаїну необхідно зменшити дозу останнього.

Серцеві глікозиди – послаблюється кардіотонічний ефект серцевих глікозидів.

Глікозиди наперстянки – на тлі інтоксикації лідокаїн може посилювати тяжкість AV-блокади.

Снодійні або седативні лікарські засоби – можливе посилення пригнічувальної дії на ЦНС снодійних і седативних препаратів.

Наркотичні аналгетики (морфін) – посилюється аналгезивний ефект наркотичних аналгетиків, пригнічення дихання.

Інгібітори MAO (фуразолідон, прокарбазин, селегілін) – підвищується ризик розвитку артеріальної гіпотензії і пролонгується місцевоанестезуюча дія останнього. У період лікування інгібіторами MAO не слід застосовувати лідокаїн парентерально.

Антикоагулянти (у т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароїд, еноксапарин, гепарин, варфарин) збільшують ризик розвитку кровотеч.

Засоби для наркозу – посилюється пригнічувальна дія на дихальний центр засобів для наркозу (гексобарбітал, тіопентал натрію внутрішньовенно).

Поліміксин В – необхідний контроль функції дихання.

Рифампіцин – можливе зниження концентрації останнього у крові.

Пропафенон – можливе збільшення тривалості і підвищення тяжкості побічних ефектів з боку ЦНС.

Преніламін – підвищується ризик розвитку шлуночкової аритмії типу «пірует».

Протисудомні засоби, барбітурати (фенобарбітал) – можливе прискорення метаболізму лідокаїну у печінці, зниження концентрації у крові, посилення кардіодепресивного ефекту.

Ізадрин, глюкагон – підвищується кліренс лідокаїну.

Норепінефрин, мексилетин – знижується кліренс лідокаїну (посилюється токсичність); зменшується печінковий кровотік.

Ацетазоламід, тіазидні і петльові діуретики зменшують ефект лідокаїну у результаті створення гіпокаліємії.

Мідазолам – підвищується концентрація лідокаїну у плазмі крові.

Препарати, що зумовлюють блокаду нервово-м'язової передачі – посилюється дія цих препаратів, оскільки вони зменшують провідність нервових імпульсів.

Норадреналін – має синергичний ефект при взаємодії з лідокаїном.

При ацидозі концентрація вільного лідокаїну у плазмі крові збільшується і є ризик розвитку токсичних ефектів.

Лікарські засоби, що впливають на печінковий метаболізм та мікосомальну індукцію ферментів (наприклад, фенітоїн), можуть знижувати ефективність лідокаїну.

При одночасному застосуванні міорелаксантів (наприклад, суксаметоній) може бути синергічний ефект. Для всіх видів ін'єкційного знеболювання можливе поєднання лідокаїну з епінефрином (1:50000-1:100000; готувати *ex tempore*, додавати 1 краплю 0,1 % розчину епінефрину на 5-10 мл розчину лідокаїну), за винятком випадків, коли системна дія, яку чинить епінефрин (адреналін), небажана – підвищена чутливість до епінефрину, артеріальна гіпертензія, цукровий діабет, глаукома або потрібна короткочасна анестезуюча дія. Епінефрин сприяє уповільненню всмоктування лідокаїну і пролонгує його дію.

Особливості застосування.

Перед застосуванням лідокаїну необхідно провести шкірну пробу на індивідуальну чутливість до препарату, про яку свідчить набряк і почервоніння місця ін'єкції.

Введення лідокаїну можуть здійснювати тільки медичні працівники.

При обробці місця ін'єкції дезінфікуючими речовинами, що містять важкі метали, підвищується ризик розвитку місцевої реакції у вигляді болючості і набряку.

Під час застосування лідокаїну обов'язковим є контроль ЕКГ. У випадку порушень діяльності синусового вузла, подовження інтервалу P-Q, розширення QRS або при розвитку нової аритмії слід зменшити дозу або відмінити препарат.

Перед застосуванням лідокаїну при захворюваннях серця (гіпокаліємія знижує ефективність лідокаїну) необхідно нормалізувати рівень калію в крові.

Перед введенням лідокаїну у високих дозах рекомендується призначення барбітуратів. При проведенні планової субарахноїдальної анестезії необхідно відмінити інгібітори MAO не пізніше, ніж за 10 днів до проведення анестезії.

Слід дотримуватися обережності, щоб уникнути випадкового інтравазального (особливо при проведенні місцевої анестезії у ділянки, що містять багато кровоносних судин) або субдурального введення препарату. Необхідно встановити пильний контроль за системною токсичною дією препарату на серцево-судинну і центральну нервову системи (оскільки дози, призначені для епідуральної анестезії, завжди вищі, ніж для субдуральної); при введенні у васкуляризовані тканини рекомендується проводити аспіраційну пробу.

Надзвичайної обережності слід дотримуватися при анестезії навколо хребтового відділу для хворих із неврологічними захворюваннями, деформацією хребта, септицемією і тяжкою артеріальною гіпертензією. Менші дози препарату слід вводити в ділянку голови і шиї, включаючи ретробульбарне і стоматологічне введення, а також застосування для блокади зірчастого ганглія, оскільки системні токсичні ефекти препарату через ретроградний потік можуть проникнути у мозковий кровообіг.

Надзвичайної обережності слід дотримуватися при ретробульбарному введенні, оскільки можливі побічні ефекти: колапс, задишка, судоми, оборотна сліпота.

Оскільки лідокаїн чинить виражену антиаритмічну дію і може сам виступати як аритмогенний фактор, що може спричиняти розвиток аритмії, перед введенням препарату необхідно зібрати анамнез і з обережністю застосовувати препарат особам зі скаргами на аритмії у минулому.

З обережністю і в менших дозах застосовувати пацієнтам із серцевою недостатністю помірного ступеня, артеріальною гіпотензією помірного ступеня, неповною AV-блокадою, порушенням внутрішньощуночкової провідності, порушеннями функції печінки і нирок помірного ступеня (кліренс креатиніну не менше 10 мл/хв), порушеннями функції дихання, епілепсією, після операцій на серці, при генетичній схильності до зловиясної гіпертермії, ослабленим хворим і пацієнтам літнього віку.

При внутрішньом'язовому введенні лідокаїну може підвищитися концентрація креатиніну, що може призвести до помилки при постановці діагнозу гострого інфаркту міокарда.

При місцевій анестезії тканин з вираженою васкуляризацією (наприклад, шиї у разі операції на щитовидній залозі) слід дотримуватись особливої обережності, щоб уникнути потрапляння препарату у судини.

Безпека застосування анестетиків групи амідів сумнівна у хворих, схильних до зловиясної гіпертермії, тому їх застосування у таких випадках слід уникати.

Слід дотримуватись особливої обережності при застосуванні лідокаїну пацієнтам з недостатністю кровообігу, піповолемією, артеріальною гіпотензією, печінковою та нирковою недостатністю.

З обережністю призначати пацієнтам з розладами центральної нервової системи, які застосовують наркотики, тому що можуть виникнути раптові побічні ефекти з боку серцево-судинної системи. При тривалому застосуванні потрібно моніторувати рівень електролітів у крові. З обережністю застосовувати пацієнтам зі схильністю до судом, у стані шоку, при гіпоксії.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Препарат проникає через плацентарний бар'єр та може спричинити брадикардію плода, тому його не рекомендується призначати у період вагітності. При необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Препарат впливає на функцію центральної нервової системи, тому після застосування лідокаїну не рекомендується керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Перед застосуванням препарату необхідно провести шкірну пробу на переносимість препарату, за умови відсутності протипоказань до її проведення.

Препарат застосовувати ін'єкційно (підшкірно, внутрішньом'язово) і місцево на слизові оболонки.

Слід уникати внутрішньосудинного введення препарату.

Введення лідокаїну передбачає проведення проби для визначення індивідуальної чутливості до цього лікарського засобу.

Для термінальної анестезії слизової оболонки дорослим змащувати препаратом у дозі до 2 мг/кг лідокаїну, тривалість анестезії \approx 15-30 хвилин.

Максимальна доза препарату для дорослих \approx 20 мл.

Для провідникової анестезії (у т. ч. для знеболювання плечового і крижового сплетінь) вводити 5-10 мл (100-200 мг лідокаїну) препарату, для анестезії пальців кінцівок, носа, вух \approx 2-3 мл (40-60 мг препарату).

Максимальна доза препарату для дорослих \approx 10 мл (200 мг).

Для анестезії в офтальмології по 2 краплі препарату інстилювати у кон'юнктивальний мішок 2-3 рази з інтервалом 30-60 секунд безпосередньо перед дослідженням або хірургічним втручанням.

Втручання	Лідокаїн		
	Концентрація	Об'єм	Загальна доза
Інфільтрація:	5 мг/мл (0,5 %)	1-60 мл	5-300 мг
– Через шкіру	або 10 мг/мл (1 %)		
– Внутрішньовенно	5 мг/мл (0,5 %)	10-60 мл	50-300 мг
Блокада периферичних нервів:			
– Плечового сплетіння	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
– Стоматологія	20 мг/мл (2 %)	1-5 мл	20-100 мг
– Міжреберна	10 мг/мл (1 %)	3 мл	30 мг
– Паравертебральний	10 мг/мл (1 %)	3-5 мл	30-50 мг
– Сечостатева система	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Парацервікально:			
– Анестезія в акушерстві	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Симпатична нервова блокада:			
– Цервікально	10 мг/мл (1 %)	5 мл	50 мг
– Люмбально	10 мг/мл (1 %)	5-10 мл	50-100 мг

Блокада центральної нервової системи:			
– Епідурально*	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
– Люмбально	10 мг/мл (1 %)	25-30 мл	250-300 мг
– Знеболювання	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
– Анестезія	20 мг/мл (2 %)	10-15 мл	200-300 мг
*Доза залежить від кількості дерматомів (ділянок шкіри), які потребують анестезії (2-3 мл/дерматом)			
Каудальна анестезія			
– Знеболювання в акушерстві	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
– Знеболювання в хірургії	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300мг

Діти та підлітки.

Дітям призначати найнижчу загальну дозу відповідно до маси тіла та у більшому розведенні (0,5 %; 0,1 %). Максимальна разова доза лідокаїну – 3 мг/кг маси тіла.

Максимальну разову дозу не можна застосовувати при повторному введенні впродовж 24 годин.

Дітям до 3-х років максимальна доза становить 1,25 мл, у тому числі і дітям з порушенням функції нирок. Впродовж 24 годин доза повинна становити не більше 4-х доз.

Недостатньо даних щодо тривалого застосування 2 % лідокаїну місцево дітям до 3-х років, препарат треба застосовувати вкрай обережно залежно від маси тіла дитини.

Максимальне дозування дітям до 3-х років – не більше 1,25 мл місцево на тампоні кожні 3 години чи 10 мл впродовж 24 годин. Дітям від 3 років доза становить 5 мл. Дітям до 12 років при запаленні глотки та ротової порожнини необхідно враховувати вік дитини, вагу та спосіб введення препарату (площу тіла при нанесенні препарату у вигляді м'яких лікарських форм). Застосування препарату дітям здійснюється після отримання згоди батьків.

Препарат місцево не застосовувати повторно протягом 2 годин після застосування.

Діти.

Застосування дітям – див. розділ «Спосіб застосування та дози».

Передозування.

Можливе посилення побічних реакцій.

Симптоми: психомоторне збудження, запаморочення, загальна слабкість, зниження артеріального тиску, тремор, порушення зору, тоніко-клонічні судоми, кома, колапс, АВ-блокада, асфіксія, апное, депресія, сонливість, тривожність, дзвін у вухах. При значному передозуванні можливе порушення свідомості, пригнічення дихання, шок, інфаркт міокарда. Перші симптоми передозування виникають при концентрації лідокаїну у крові більше 0,006 мг/кг, судоми – при 0,01 мг/кг.

Лікування: припинення введення препарату, оксигенотерапія, вазоконстриктори (норадреналін, мезатон), протисудомні засоби, холінолітики. Пацієнтові слід перебувати у горизонтальному положенні; необхідно забезпечити доступ свіжого повітря, подачу кисню і/або проведення штучного дихання. Симптоми з боку центральної нервової системи коригуються застосуванням бензодіазепінів або барбітуратів короткочасної дії. Якщо передозування виникає у процесі анестезії, слід застосовувати міорелаксант короткотривалої дії. Для корекції брадикардії і порушень провідності застосовувати атропін (0,5-1 мг внутрішньовенно), при артеріальній гіпотензії – симпатоміметики у комбінації з агоністами β-адренорецепторів. При зупинці серця показане негайне проведення реанімаційних заходів. Можливе проведення інтубації, штучної вентиляції легенів. У гострій фазі передозування лідокаїном діаліз не ефективний. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції.

З боку нервової системи: збудження центральної нервової системи (при застосуванні у високих дозах), занепокоєння, головний біль, запаморочення, порушення сну, сплутаність свідомості, сонливість, втрата свідомості, кома, порушення чутливості, м'язові сипання, оніміння язика і губ (при застосуванні у стоматології), моторний блок, дизартрія, дисфагія; стійка анестезія, парез або елегія нижніх кінцівок та

втрата управління сфінктером (наприклад, синдром кінського хвоста) поколювання шкіри у пацієнтів із підвищеною чутливістю – ейфорія, тремор, тризм, руховий неспокій, парестезії, судоми.

Психічні розлади: анорексія, дратівливість, невгамовність, галюцинації, депресії; після застосування високих доз – збуджений стан, ейфорія.

З боку органів зору: порушення зору, ністагм, оборотна сліпота, диплопія, миготіння «мушок» перед очима, світлобоязнь, кон'юнктивіт.

З боку органів слуху: слухові порушення, шум у вухах, гіперакузія.

З боку серцево-судинної системи: при застосуванні у високих дозах – аритмія, брадикардія, уповільнення провідності серця, поперечна блокада серця, зупинка серцевої діяльності, периферична вазодилатація, колапс, тахікардія, підвищення/зниження артеріального тиску, біль у ділянці серця.

З боку системи травлення: нудота, блювання.

З боку дихальної системи: задишка, риніт, пригнічення або зупинка дихання.

З боку імунної системи: алергічні реакції, включаючи набряк, шкірні реакції, кропив'янка, свербіж, ангіоневротичний набряк, реакції гіперчутливості, включаючи анафілактоїдні реакції (у т.ч. анафілактичний шок), генералізований ексфоліативний дерматит; пригнічення імунної системи.

Інші: відчуття жару, холоду або оніміння кінцівок, набряки, слабкість, злоякісна гіпертермія.

Місцеві реакції: реакції у місці введення, відчуття легкого печіння, що зникає зі зростанням анестезувального ефекту (протягом 1 хвилини), гіперемія. При спінальній або епідуральній анестезії може спостерігатися біль у спині, ногах, часткова/повна спинномозкова блокада, що супроводжується зниженням артеріального тиску, порушенням дефекації, мимовільним сечовипусканням, імпотенцією, втратою чутливості у ділянці промежини (імовірність цих ефектів зростає при застосуванні вищих доз або у разі випадкового введення лідокаїну у спинномозковий простір, коли доза, призначена для введення в епідуральний простір, потрапляє у спинномозковий простір); в окремих випадках після такого втручання відновлення рухової, сенсорної та/або вегетативної функції відбувається повільно (через кілька місяців) або неповною мірою.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одному шприці. Лідокаїн випадає в осад при змішуванні з амфотерицином, метогекситоном або сульфадазином. Залежно від рН розчину лідокаїн може бути несумісний з ампіциліном.

Упаковка. По 2 мл в ампулі, по 10 ампул у контурній чарунковій упаковці, по 1 контурній чарунковій упаковці в пачці; по 2 мл в ампулі, по 10 ампул у коробці.

1 контурній

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПАТ «Галичфарм».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 79024, м. Львів, вул. Опришківська, 6/8.

ИНСТРУКЦИЯ по медицинскому применению лекарственного средства

ЛИДОКАИНА ГИДРОХЛОРИД (LIDOCAINE HYDROCHLORIDE)

Состав:

действующее вещество: лидокаина гидрохлорид;

1 мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида, в перерасчете на безводное вещество 20 мг;
вспомогательные вещества: натрия хлорид, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа. Препараты для местной анестезии. Амиды. Лидокаин.

Код АТХ N01B B02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Лидокаин – местноанестезирующее средство. Местноанестезирующее действие предопределено стабилизацией нейрональной мембраны за счет снижения ее проницаемости для ионов натрия, который препятствует возникновению потенциала действия и проведению нервных импульсов. Возможен антагонизм с ионами кальция. Эффективен для всех видов местной анестезии. Подавляет проведение не только болевых импульсов, но и импульсов другой модальности. Быстро гидролизруется в слабощелочной среде тканей и после короткого латентного периода действует в течение 1-1,5 часа. Анестезирующее действие лидокаина в 2-6 раза сильнее, чем прокаина. При воспалении анестезирующая активность снижается. При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Фармакокинетика.

При внутримышечном введении максимальная концентрация в крови достигается через 5-15 минут. В плазме связывается с белками крови на 33-80 %. Степень связывания в значительной степени зависит от концентрации препарата и содержащего альфа-1-ацидгликопротеина в плазме крови. Связывание с белками плазмы увеличивается у пациентов с уреимией и реципиентов почечной трансплантации и усиливается после острого инфаркта миокарда, который характеризуется увеличением уровня альфа-1-ацидгликопротеина. Высокое связывание с белками может уменьшать действие свободного лидокаина или вызывать общее повышение концентрации препарата в плазме крови. Терапевтический эффект развивается при концентрации 1,5- 5 мкг/мл. Быстро распределяется в тканях, объем распределения представляет 1 л/кг. Сначала приходит в ткани с высоким темпом кровоснабжения: сердце, мозг, почки, легкие, печень, селезенка, потом – в жировую и мышечную ткани. Легко проникает через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический и плацентарный. В организме новорожденного обнаруживается 40-55 % от концентрации препарата в организме матери. Метаболизируется в печени при участии микросомальных ферментов с образованием метаболитов: моноэтилглицинексилидида и глицинексилидида. Скорость метаболизма определяется кровотоком в печенке и, как результат, может быть нарушена у пациентов после инфаркта миокарда и/или у пациентов с застойной сердечной недостаточностью. Выводится из организма почками в форме метаболитов (около 90 %) и в неизменном виде (10 %). Вывод неизменном виде с мочой частично зависит от рН мочи. Кислая моча приводит к увеличению доли, выведенной с мочой. Период полувыведения после внутривенного болюсного введения – 1,5-2 часа. Период полувыведения метаболитов составляет 2 и 10 часов соответственно. При нарушении функции печени период полувыведения может возрасть.

Клинические характеристики.

Показания. Местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, офтальмологии, стоматологии, оториноларингологии; в качестве растворителя антибактериальных средств группы цефалоспоринов.

Противопоказания.

Индивидуальная повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также к другим амидным местно-анестезирующим лекарственным средствам; наличие в анамнезе эпилептиформных судорог, связанных с введением лидокаина гидрохлорида; АВ- блокада I и III степени; синдром слабости синусового узла; синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта; синдром Адамса-Стокса; тяжелые формы сердечной недостаточности (II-III степени); выраженная артериальная гипотензия; брадикардия; кардиогенный шок; миастения; гиповолемия; порфирия; тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность; ретробульбарное введение больным с глаукомой; нарушения свертывания крови, антикоагулянтная терапия; инфекции в месте инъекции; неконтактные пациенты.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При комбинированном применении лидокаина с такими препаратами как хлорпромазин, петидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, амитриптилин, имипрамин, нортриптилин концентрация лидокаина в плазме крови снижается.

Антиаритмические препараты (в т. ч. амиодарон, верапамил, хинидин, дизопирамид, аймалин) – усиливается кардиодепрессивное действие (происходит удлинение интервала QT, в редких случаях возможно развитие АВ-блокады или фибрилляции желудочков); одновременное применение с амиодароном может привести к развитию судорог.

Новокаин, новокаиамид, прокаинамид – возможно возбуждение центральной нервной системы, бред, галлюцинации.

Курареподобные препараты – усиливается миорелаксация (возможен паралич дыхательных мышц). Этанол усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) способствуют замедлению всасывания лидокаина и пролонгируют действие последнего.

Циметидин снижает печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма вследствие ингибирования микросомального окисления), повышает его концентрацию и риск развития токсических эффектов.

Гуанадрель, гуанетидин, мекамиламин, триметафан – при комбинированном применении для спинальной и эпидуральной анестезии повышается риск выраженной артериальной гипотензии и брадикардии.

β -адреноблокаторы замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливают эффекты лидокаина (в т. ч. токсические) и повышают риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении β -адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшить дозу последнего.

Сердечные гликозиды – ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

Гликозиды наперстянки – на фоне интоксикации лидокаин может усиливать тяжесть АВ-блокады.

Снотворные или седативные лекарственные средства – возможно усиление угнетающего действия на ЦНС снотворных и седативных препаратов.

Наркотические анальгетики (морфин) – усиливается анальгезирующий эффект наркотических анальгетиков, угнетение дыхания.

Ингибиторы МАО (фуразолидон, прокарбазин, селегилин) – повышается риск развития артериальной гипотензии и пролонгируется местноанестезирующее действие последнего. В период лечения ингибиторами МАО не следует применять лидокаин парентерально.

Антикоагулянты (в т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароид, эноксапарин, гепарин, варфарин) увеличивают риск развития кровотечений.

Средства для наркоза – усиливается угнетающее действие на дыхательный центр средств для наркоза (гексобарбитал, тиопентал натрия внутривенно).

Полимиксин В – необходим контроль функции дыхания.

Рифампицин – возможно снижение концентрации последнего в крови.

Пропафенон – возможно увеличение продолжительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны ЦНС.

Прениламин – повышается риск развития желудочковой аритмии типа «пируэт».

Противосудорожные средства, барбитураты (фенobarбитал) – возможно ускорение метаболизма лидокаина в печени, снижение концентрации в крови, усиление кардиодепрессивного эффекта.

Изадрин, глюкагон – повышается клиренс лидокаина.

Норэпинефрин, мексилетин – снижается клиренс лидокаина (усиливается токсичность) уменьшается печеночный кровоток.

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики уменьшают эффект лидокаина в результате создания гипокалиемии.

Мидазолам – повышается концентрация лидокаина в плазме крови.

Препараты, обуславливающие блокаду нервно-мышечной передачи – усиливается действие этих препаратов, поскольку они уменьшают проводимость нервных импульсов.

Норадреналин – имеет синергический эффект при взаимодействии с лидокаином.

При ацидозе концентрация свободного лидокаина в плазме крови увеличивается и имеется риск развития токсических эффектов.

Лекарственные средства, влияющие на печеночный метаболизм и микросомальную индукцию ферментов (например, фенитоин), могут снижать эффективность лидокаина.

При одновременном применении миорелаксантов (например, суксаметоний) может быть синергический эффект.

Для всех видов инъекционного обезболивания возможно сочетание лидокаина с эpineфрином (1:50000–1:100000; готовить *ex tempore*, добавлять 1 каплю 0,1 % раствора эpineфрина на 5-10 мл раствора лидокаина), за исключением случаев, когда системное действие, которое оказывает эpineфрин (адреналин), нежелательна – повышена чувствительность к эpineфрину, артериальная гипертензия, сахарный диабет, глаукома или необходимо кратковременное анестезирующее действие. Эpineфрин способствует замедлению всасывания лидокаина и пролонгирует его действие.

Особенности применения.

Перед применением лидокаина обязательно проведение кожной пробы на индивидуальную чувствительность к препарату, о которой свидетельствует отек и покраснение места инъекции.

Введение лидокаина могут проводить только медицинские работники.

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

При применении лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинения интервала PQ, расширения QRS или при развитии новой аритмии следует уменьшить дозу или отменить препарат.

Перед применением лидокаина при заболеваниях сердца (гипокалиемия снижает эффективность лидокаина) необходимо нормализовать уровень калия в крови.

Перед введением лидокаина в высоких дозах рекомендуется назначение барбитуратов. При проведении плановой субарахноидальной анестезии необходимо отменить ингибиторы MAO не позднее, чем за 10 дней до проведения анестезии.

Следует соблюдать осторожность, чтобы избежать случайного интравазального (особенно при проведении местной анестезии в участки, содержащие много кровеносных сосудов) или субдурального введения препарата. Необходимо установить строгий контроль за системным токсическим действием препарата на сердечно-сосудистую и центральную нервную системы (поскольку дозы, предназначенные для эпидуральной анестезии, всегда выше, чем для субдуральной); при введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при анестезии вокруг позвоночного отдела для больных с неврологическими заболеваниями, деформацией позвоночника, септицемией и тяжелой артериальной гипертензией.

Меньшие дозы следует вводить в область головы и шеи, включая ретробульбарное и стоматологическое введение, а также применение для блокады звездчатого ганглия, поскольку системные токсические эффекты препарата через ретроградный поток могут проникнуть в мозговое кровообращение.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при ретробульбарном введении, поскольку возможны побочные эффекты: коллапс, одышка, судороги, обратимая слепота.

Поскольку лидокаин оказывает выраженное антиаритмическое действие и может сам выступать как аритмогенный фактор, что может вызывать развитие аритмии, перед введением препарата необходимо собрать анамнез и с осторожностью применять препарат лицам с жалобами на аритмии в прошлом.

С осторожностью и в меньших дозах применять пациентам с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотензией умеренной степени, неполной AV-блокадой, нарушением внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек средней степени (клиренс креатинина менее 10 мл/мин), нарушением функции дыхания, эпилепсией, после операций на сердце, при генетической предрасположенности к злокачественной гипертермии, ослабленным больным и пациентам пожилого возраста.

При внутримышечном введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может привести к ошибке при постановке диагноза острого инфаркта миокарда.

При местной анестезии тканей с выраженной васкуляризацией (например, шеи в случае операции на щитовидной железе) следует соблюдать особую осторожность, чтобы избежать попадания препарата в сосуды.

Безопасность применения анестетиков группы амидов сомнительна у больных, склонных к злокачественной гипертермии, поэтому их применения в таких случаях следует избегать.

Следует соблюдать особую осторожность при применении лидокаина пациентам с недостаточностью кровообращения, гиповолемией, артериальной гипотонией, печеночной и почечной недостаточностью.

С осторожностью назначать пациентам с нарушениями центральной нервной системы, которые применяют наркотики, поскольку могут возникнуть внезапные побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы. При длительном применении необходимо мониторить уровень электролитов в крови. С осторожностью применять пациентам со склонностью к судорогам, в состоянии шока, при гипоксии.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Препарат проникает через плацентарный барьер и может вызвать брадикардию плода, поэтому его не рекомендуется назначать в период беременности. При необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

Препарат влияет на функцию центральной нервной системы, поэтому после применения лидокаина не рекомендуется управлять автотранспортом или работать с другими механизмами.

Способ применения и дозы.

Перед применением препарата необходимо провести кожную пробу на переносимость препарата, при условии отсутствия противопоказаний к ее проведению.

Препарат применять инъекционно (подкожно, внутримышечно) и местно на слизистые оболочки.

Следует избегать внутрисосудистого введения препарата.

Введение лидокаина предусматривает проведение пробы для определения индивидуальной чувствительности к этому лекарственному средству.

Для терминальной анестезии слизистой оболочки взрослым смазывать препаратом в дозе 2 мг/кг лидокаина, продолжительность анестезии – 15-30 минут.

Максимальная доза для взрослых – 20 мл.

Для проводниковой анестезии (в т. ч. для обезболивания плечевого и крестцового сплетений) вводить 5-10 мл (100-200 мг лидокаина) препарата для анестезии пальцев конечностей, носа, ушей – 2-3 мл (40-60 мг).

Максимальная доза для взрослых – 10 мл (200 мг).

Для анестезии в офтальмологии по 2 капли препарата инстилировать в конъюнктивальный мешок 2-3 раза с интервалом 30-60 секунд непосредственно перед исследованием или хирургическим вмешательством.

Вмешательство	Лидокаин		
	Концентрация	Объем	Общая доза
Инфильтрация:	5 мг/мл (0,5%) или	1-60 мл	5-300 мг
– Через кожу	10 мг/мл (1 %)		
– Внутривенно	5 мг/мл (0,5 %)	10-60 мл	50-300 мг
Блокада периферических нервов:			
– Плечевого сплетения	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
– Стоматология	20 мг/мл (2 %)	1-5 мл	20-100 мг
– Межреберная	10 мг/мл (1 %)	3 мл	30 мг
– Паравертебральная	10 мг/мл (1 %)	3-5 мл	30-50 мг
– Мочевыделительная система	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Парацервикально:			
– Анестезия в акушерстве	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Симпатическая нервная блокада:			
– Цервикально	10 мг/мл (1 %)	5 мл	50 мг
– Люмбально	10 мг/мл (1 %)	5-10 мл	50-100 мг

Блокада центральной нервной системы:			
– Эпидурально*			
– Люмбально:	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
– Обезболивание			
– Анестезия	10 мг/мл (1 %)	25-30 мл	250-300 мг
*Доза зависит от количества дерматомов (участков кожи), требующих анестезии (2-3 мл/дерматом)	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
	20 мг/мл (2 %)	10-15 мл	200-300 мг
Каудальная анестезия:			
– Обезболивание в акушерстве	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
– Обезболивание в хирургии	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300мг

Дети и подростки.

Детям назначать самую низкую общую дозу в соответствии с массой тела и в большем разведении (0,5 %; 0,1 %). Максимальная разовая доза лидокаина – 3 мг/кг массы тела.

Максимальную разовую дозу нельзя применять при повторном введении в течение 24 часов.

Детям до 3-х лет максимальная доза составляет 1,25 мл, в том числе и детям с нарушением функции почек. В течение 24 часов доза должна составлять не более 4-х доз.

Недостаточно данных относительно длительного применения 2 % лидокаина местно детям до 3-х лет, препарат следует применять крайне осторожно в зависимости от массы тела ребенка.

Максимальная дозировка детям до 3-х лет – не более 1,25 мл местно на тампоне каждые 3 часа, или 10 мл в течение 24 часов. Детям от 3 лет доза составляет 5 мл. Детям до 12 лет при воспалении глотки и ротовой полости необходимо учитывать возраст ребенка, вес и способ введения препарата (площадь тела при нанесении в виде мягких лекарственных форм). Применение препарата детям осуществляется после получения согласия родителей.

Препарат местно не применять повторно в течение 2-х часов после применения.

Дети. Применение детям – см. раздел «Способ применения и дозы».

Передозировка.

Возможно усиление побочных реакций.

Симптомы: психомоторное возбуждение, головокружение, общая слабость, снижение артериального давления, тремор, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, АВ-блокада, асфиксия, апноэ, депрессия, сонливость, тревожность, звон в ушах. При значительной передозировке возможно нарушение сознания, угнетение дыхания, шок, инфаркт миокарда. Первые симптомы передозировки возникают при концентрации лидокаина в крови больше 0,006 мг/кг, судороги – при 0,01 мг/кг.

Лечение: прекращение введения препарата, оксигенотерапия, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), протисудомни средства, холинолитики. Пациенту следует находиться в горизонтальном положении; необходимо обеспечить доступ свежего воздуха, подачу кислорода и/или проведение искусственного дыхания. Симптомы со стороны центральной нервной системы корректируются применением бензодиазепинов или барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применять миорелаксант с кратковременным действием. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применяют атропин (0,5-1 мг внутривенно), при артериальной гипотензии – симпатомиметики в комбинации с агонистами β-адренорецепторов. При остановке сердца показано немедленное проведение реанимационных мероприятий. Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких. В острой фазе передозировки лидокаином диализ не эффективен. Специфического антидота нет.

Побочные реакции.

Со стороны нервной системы: возбуждение центральной нервной системы (при применении в высоких дозах), беспокойство, головная боль, головокружение, нарушение сна, спутанность сознания, сонливость, потеря сознания, кома, нарушения чувствительности, мышечные подергивания, онемение языка и губ (при применении в стоматологии), моторный блок, дизартрия, дисфагия; стойкая анестезия, парез или элегия нижних конечностей и потеря управления сфинктером (например, синдром конского хвоста)

покалывание кожи у пациентов с повышенной чувствительностью – эйфория, тремор, тризм, двигательное беспокойство, парестезии, судороги.

Психические расстройства: анорексия, раздражительность, неугомонность, галлюцинации, депрессии; после применения высоких доз – возбужденное состояние, эйфория.

Со стороны органов зрения: нарушение зрения, нистагм, обратимая слепота, диплопия, мелькание «мушек» перед глазами, светобоязнь, конъюнктивит.

Со стороны органов слуха: слуховые нарушения, шум в ушах, гиперacusia.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: при применении в высоких дозах □ аритмия, брадикардия, замедление проводимости сердца, поперечная блокада сердца, остановка сердечной деятельности, периферическая вазодилатация, коллапс, тахикардия, повышение/снижение артериального давления, боль в области сердца.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Со стороны дыхательной системы: одышка, ринит, угнетение или остановка дыхания.

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая отек, кожные реакции, крапивница, зуд, ангионевротический отек, реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции (в т.ч. анафилактический шок), генерализованный эксфолиативный дерматит; угнетение иммунной системы.

Другие: ощущение жара, холода или онемения конечностей, отеки, слабость, злокачественная гипертермия.

Местные реакции: реакции в месте введения, ощущение легкого жжения, исчезающего с нарастанием анестезирующего эффекта (в течение 1 минуты), гиперемия. При спинальной или эпидуральной анестезии может наблюдаться боль в спине, ногах, частичная/полная спинномозговая блокада, которая сопровождается снижением артериального давления, нарушением дефекации, непроизвольным мочеиспусканием, импотенцией, потерей чувствительности в области промежности (вероятность этих эффектов возрастает при применении высоких доз или в случае случайного введения лидокаина в спинномозговое пространство, когда доза, предназначенная для введения в эпидуральное пространство, попадает в спинномозговое пространство); в отдельных случаях после такого вмешательства возобновление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или в неполной мере.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения. Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С в недоступном для детей месте.

Несовместимость. Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одной емкости. Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогекситоном или сульфатазином. В зависимости от pH раствора лидокаин может быть несовместим с ампицилином.

Упаковка. По 2 мл в ампуле, по 10 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке; по 2 мл в ампуле, по 10 ампул в коробке.

1

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности.

Украина, 79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.