

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування препарату
КАТЕДЖЕЛЬ З ЛІДОКАЇНОМ
(CATHEJELL LIDOCAIN®)

Склад:

діючі речовини: 1 г гелю містить 20 мг лідокаїну гідрохлориду і 0,5 мхлоргексидину дигідрохлориду;
допоміжні речовини: гідроксietилцелюлоза, гліцерин, натрію лактату розчин, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Гель.

Фармакотерапевтична група. Препарати для місцевої анестезії. Лідокаїн, комбінації.
Код АТС N01B B52.

Клінічні характеристики.

Показання.

Для місцевої анестезії слизових оболонок та як лубрикант при:

- катетеризації уретри;
- зондуванні;
- ендоскопічних дослідженнях;
- ендотрахеальній інтубації.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до компонентів препарату, а також підвищена чутливість до інших місцевих анестетиків амідного типу; бульбокавернозний (уретрокавернозний) рефлюкс; тяжка серцева недостатність (IV ФК за класифікацією NYHA); виражена брадикардія (< 33 ударів за хвилину); тяжка атріовентрикулярна блокада (III ступеню); кардіогенний шок; гіповолемічний шок

Спосіб застосування та дози.

КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном вводять винятково лікар або спеціально підготовлений медичний персонал.
Доза підбирається індивідуально.

Застосування препарату при введенні катетера, ендоскопа чи інших медичних інструментів в уретру.

Гофрована шприц-туба містить 12,5 г гелю, із яких приблизно 10 г потрапляють в уретру під час інстиляції.

Рекомендовані дози для дорослих чоловіків: для достатнього заповнення уретри застосовують 12,5 г препарату. Вмісту однієї гофрованої шприц-туби достатньо для заповнення уретри. Для проведення однієї маніпуляції не рекомендується використовувати більше однієї туби. Початок дії препарату настає через 5-10 хвилин.

Жінки, діти (віком 2-12 років) та підлітки (віком від 12 років): спеціальні рекомендації щодо дозування у даній категорії пацієнтів відсутні. Протягом 24 годин не можна застосовувати більше 4 доз.

Спосіб застосування:

1. Очистити та продезінфікувати зовнішній отвір уретри.
2. Зняти папір, яким покритий прозорий блістер до конусного кінця.
3. Відламати наконечник туби; якщо можливо, залишаючи тубу у блістері.
4. Видалити наконечник туби повністю, щоб уникнути випадкового потрапляння його в уретру.
5. Видавити краплю гелю, щоб полегшити введення наконечника.
6. Легко натискаючи на тубу, повільно ввести гель в уретру.

Залишок гелю слід викинути.

Анестезія при проведенні загальної та трахеальної інтубації

Дорослі та діти старше 15 років: рівномірно розподілити приблизно 5 мл гелю по нижній третині трубки. Щоб уникнути висихання, гель наносять на інструмент безпосередньо перед застосуванням. Гель не повинен потрапляти всередину просвіту трубки. Для дорослих із середньою масою тіла максимальна доза КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном становить 6 г.

Дози для дітей віком від 2 до 15 років: дітям до 15 років доза препарату не має перевищувати 6 мг лідокаїну (= 0,3 мл гелю/кг маси тіла). Протягом 24 годин не можна застосовувати більше 4 доз.

Рекомендації з дозування для пацієнтів групи ризику.

Для літніх, ослаблених і тяжкохворих пацієнтів, а також при порушенні функції печінки або тяжкій нирковій недостатності дозу препарату слід підбирати індивідуально.

Максимальна разова доза розраховується у міліграмах лідокаїну гідрохлориду на кілограм маси тіла (2,9 мг лідокаїну гідрохлориду/кг маси тіла).

Побічні реакції.

Побічні реакції після застосування КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном з'являються рідко ($< 1/10000$), якщо препарат застосовувати відповідно до рекомендацій з дозування і способу введення.

Рідко можуть спостерігатися випадки розвитку місцевих та/або системних реакцій гіперчутливості до лідокаїну і/або хлоргексидину. Системні побічні реакції можуть бути спричинені високим рівнем діючої речовини у плазмі крові, що може бути спричинено швидким всмоктуванням, передозуванням, гіперчутливістю, індивідуальною непереносимістю або зниженням переносимості з можливою появою таких симптомів: *з боку центральної нервової системи (ЦНС):* нервозність, запаморочення, затуманення зору, тремор, сонливість, втрата свідомості, зупинка дихання; *з боку серцево-судинної системи:* артеріальна гіпотензія, брадикардія, асистолія; *з боку імунної системи:* бронхоспазм, синдром дихальної недостатності; *реакції гіперчутливості:* бронхоспазм, синдром дихальної недостатності, анафілактичний шок, кропив'янка, набряк, ураження шкіри; *реакції у місці застосування:* печія, свербіж; охриплість (при ендотрахеальній інтубації).

Передозування.

При професійному застосуванні КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном у плазмі крові досягаються токсичні концентрації препарату (>5 $\mu\text{г/мл}$). Однак, сумісне застосування інших місцевих анестетиків може спричинити адитивний ефект, що, у свою чергу, може призвести до передозування препарату з розвитком системних токсичних реакцій.

Якщо симптоми системної інтоксикації все ж таки з'являються, характер цих симптомів буде схожий на ті, які можуть розвинути при інших методах застосування місцевих анестетиків (наприклад, інфільтраційної анестезії та провідникової анестезії), насамперед, лідокаїну (дивитися симптоми інтоксикації лідокаїном).

Інтоксикація лідокаїном відбувається двофазово:

Стимуляція: у низькій токсичній концентрації лідокаїн діє як стимулятор центральної нервової системи, внаслідок чого відбувається збудження ЦНС, що супроводжується занепокоєнням, запамороченням, тремором, та стимуляція серцево-судинної системи, а саме – збільшення частоти серцевих скорочень, підвищення артеріального тиску та почервоніння шкіри.

Пригнічення: у діапазоні високих токсичних доз може спостерігатися пригнічення функції ЦНС та серцево-судинної системи (сонливість, седативний ефект, блідість, кома).

Реакції, які виникають унаслідок токсичного впливу лідокаїну на ЦНС, зазвичай передують реакціям з боку серцево-судинної системи, оскільки попередні спостерігаються при більш низьких концентраціях препарату у плазмі крові.

Першим симптомом передозування лідокаїну є збудження; пацієнти стають неспокійними, скаржаться на запаморочення, порушення слуху та зору, поколювання в ділянці язика і губ або ністагм. Субконвульсивні рівні лідокаїну у плазмі крові часто призводять до сонливості і седативного ефекту. Тремтіння та посмикування м'язів є попередниками неминучих генералізованих нападів. Унаслідок збільшення токсичного впливу препарату на ЦНС значно порушується функція стовбура мозку, що супроводжується симптомами пригнічення дихання і навіть комою.

Зниження артеріального тиску і брадикардія є першими симптомами токсичного впливу лідокаїну на серцево-судинну систему, що в результаті призводить до ослаблення роботи міокарда і збільшення часу шлуночкової активності. Побічні реакції з боку серцево-судинної системи спостерігаються зазвичай при дуже високій концентрації лідокаїну у плазмі крові і практично не мають клінічної значущості.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

У період вагітності КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном можна застосовувати лише після ретельного аналізу лікарем співвідношення користь/ризик і після встановлення індивідуальної дози. Повторне застосування препарату у період вагітності не рекомендується.

У період годування груддю КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном слід застосовувати лише за необхідністю; дози слід підбирати індивідуально. Інтервал міжінстиляцією Катеджелю з лідокаїномі наступним годуванням груддю має становити 12 годин. Повторне застосування препарату у період годування груддю не рекомендується.

Діти.

Катеджелю з лідокаїном не слід призначати дітям віком до 2 років.

Особливості застосування.

Слід уникати потрапляння КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном в очі.

КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном слід з обережністю застосовувати пацієнтам з тяжкими порушеннями функції печінки (III і IV стадії), порушеннями функції нирок (кліренс креатинину < 30 мл/хв.), при тяжкому порушенні серцевої або дихальної функцій (III-IV ст.).

Особливої обережності рекомендується дотримуватися в таких випадках:

- ☐ при застосуванні високих доз або при коротких інтервалах між дозами. Це може призвести до високого рівня препарату у плазмі крові і розвитку тяжких побічних ефектів. Ступінь всмоктування препарату слизовою оболонкою змінюється, але особливо високий він у бронхіальному дереві. Тому застосування препарату у бронхіальному дереві може призвести до швидкого зростання або підвищеного рівня у плазмі крові і пов'язане з підвищеним ризиком розвитку токсичних симптомів, таких як судоми;
- ☐ особам літнього віку, ослабленим і тяжкохворим пацієнтам, а також хворим, схильним до нападів;
- ☐ пацієнтам з наявністю ран, травмованих слизових оболонок, виразок на тканинах або сепсису у ділянці пропонованого застосування. Ушкодження слизової оболонки призводить до збільшення системної абсорбції при орофарингеальному застосуванні. Унаслідок цього може розвинутися дисфагія і збільшитися ризик аспірації. Оніміння язика або ротової ділянки може збільшити ризик травмування внаслідок укусу;
- ☐ пацієнтам, які приймають антиаритмічні засоби III класу (наприклад, аміодарон); за такими пацієнтами слід встановити ретельне спостереження та контролювати ЕКГ, оскільки може посилитися дія на серце.

Припускають, що КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном гель може впливати на перебіг порфірії, тому його не слід застосовувати хворим на гостру порфірію, якщо немає переконливих показань щодо його застосування.

При застосуванні вмісту більш ніж одного шприц-туби або якщо значна кількість гелю проникає в сечовий міхур, або якщо уретра запалена/виразкова, може посилитися всмоктування лідокаїну, особливо у дітей і пацієнтів літнього віку, що, у свою чергу, призводить до передозування препарату з побічною дією на центральну нервову та серцево-судинну системи.

Пацієнти з міастенією особливо чутливі до місцевої анестезії.

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

КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном практично не впливає на здатність керувати автотранспортом або роботу з іншими механізмами, але його вплив не може бути повністю виключений у випадках підвищеної індивідуальної чутливості.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном не слід застосовувати сумісно з препаратами, що містять лідокаїну гідрохлорид, або з іншими місцевими анестетиками амідного типу, оскільки це може призвести до непередбачуваного взаємного впливу препаратів.

Через можливий адитивний вплив на серце лідокаїн слід застосовувати з обережністю пацієнтам, які одночасно отримують антиаритмічні препарати, такі як мексилетин та токаїнід, бета-адреноблокатори (наприклад, пропранолол) або антагоністи кальцієвих каналів (наприклад, дилтіазем, верапаміл). Пропранолол, дилтіазем і верапаміл призводять до значного подовження періоду напіввиведення внаслідок зниження кліренсу лідокаїну. Лікарські засоби, які знижують кліренс лідокаїну, можуть призводити до потенційно токсичних концентрацій у плазмі крові, якщо лідокаїн застосовують повторно у великих дозах протягом тривалого часу. Тому при короткочасному лікуванні КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном у рекомендованих дозах такі взаємодії не мають клінічного значення.

Спеціальні дослідження взаємодії лідокаїну та антиаритмічних засобів III класу (наприклад, аміодарону) не проводилися, проте рекомендується дотримуватися обережності при їх сумісному застосуванні.

Слід дотримуватися обережності при сумісному застосуванні КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном з циметидином, антагоністом H₂-рецепторів. Концентрація лідокаїну у плазмі крові може підвищуватися внаслідок зменшення печінкової перфузії та пригнічення мікосомальних ензимів.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном – стерильний антисептичний гель з місцевою анестезуючою дією. Шляхом місцевої, поверхневої анестезії КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном забезпечує анестезію слизових оболонок, що призводить до швидкого симптоматичного зменшення больових відчуттів. Початок дії настає вже через 5-10 хвилин після застосування і триває 20-30 хвилин. Крім знеболювальної дії, КАТЕДЖЕЛЬ з лідокаїном значною мірою запобігає інфекціям сечовивідних шляхів після катетеризації.

Лідокаїн – клінічно випробуваний анестетик групи амідів для місцевого застосування. Лідокаїнооборотно та місцево гальмує провідність чутливих нервових волокон. Чутливість послідовно знижується: холод/тепло, дотик і тиск. При місцевій анестезії початок дії, як правило, настає через 3-5 хвилин. У запалених тканинах його ефект зменшується через кислотну величину рН, яка там домінує. Крім анестезуючої дії, лідокаїн має також антиаритмічний ефект. На відміну від більшості інших місцевих анестетиків, лідокаїн не чинить судинорозширювального дію.

Хлоргексидин – протимікробний препарат, активний проти більшості грампозитивних та грамнегативних бактерій, а також проти ряду грибів та вірусів. У складі препарату діє як профілактичний засіб з метою запобігання ятрогенним інфекціям при місцевому застосуванні.

Фармакокінетика.

Абсорбція

Лідокаїн швидко всмоктується у кров через слизові оболонки. Абсорбована кількість лідокаїну після місцевого застосування на слизових оболонках залежить від концентрації і загальної застосовуваної дози, конкретного місця застосування і тривалості застосування. Місцеві анестетики, як правило, найшвидше всмоктуються після інтратрахеального та бронхіального застосування, що може призводити до швидкого зростання або до дуже високої концентрації лідокаїну у плазмі крові з підвищеним ризиком інтоксикації. Лідокаїн швидко всмоктується у шлунково-кишковому тракті, незважаючи на те, що лише незначна кількість діючої речовини надходить у кровотік через метаболічний розпад у печінці («ефект першого проходження»).

Через 45-60 хвилин після інтрауретральної інстиляції 10-40 мл 2 % гелю (200-800 мг лідокаїну) максимальна концентрація лідокаїну у плазмі крові становила 0,06-0,2 мкг/мл. Ці значення у 7,5-27,5 разів нижчі, ніж плазмові концентрації (1,5-5,5 мкг/мл), які мають терапевтичне значення щодо антиаритмічного ефекту і в 30 разів нижчі, ніж токсичні концентрації у плазмі крові (5-8 мкг/мл).

Слід пам'ятати, що виражені запалення слизової оболонки уретри і гіпертрофія поверхні внаслідок розширення уретри може призводити до збільшення абсорбції лідокаїну.

Абсорбція *хлоргексидину* при місцевому застосуванні надзвичайно низька.

Розподіл

Об'єм розподілу лідокаїну становить 1,3-1,6 л/кг; він швидко розподіляється по всіх тканинах, особливо по дуже васкуляризованих органах, таких як легені, нирки та скелетні м'язи. Близько 65 % лідокаїну зв'язується з білками плазми крові та альфа-1 кислими глікопротеїнами (AAGs).

Біотрансформація, виведення

Лідокаїн метаболізується значною мірою при першому проходженні через печінку. Приблизно 90 % дози лідокаїну швидко деалкілується і метаболізується у печінці в моноетилгліцинксілідид (МЕГК) або гліцинксілідид (ГК). Як блокатори натрієвих каналців, МЕГК і ГК менш активні, ніж лідокаїн. Іншими метаболітами є 2,6-ксілідин і 4-гідрокси-2,6-ксілідин.

Кінцевий період напіввиведення 1,8 години представляє у першу чергу печінковий метаболізм, але він може бути подовжений до <2,3 годин у пацієнтів літнього віку. Період напіввиведення активних метаболітів становить 0,9 години.

Загальний плазмовий кліренс 0,95 л/хв може бути зменшений у пацієнтів із серцевою або печінковою недостатністю. При нирковій недостатності може відбуватися накопичення метаболітів. Менше 5 % лідокаїну виводиться із сечею у незміненому вигляді.

Кінетика при печінковій, нирковій та серцевій недостатності

Унаслідок швидкої біотрансформації лідокаїну у печінці період напіввиведення його може бути подовжений у 2 і більше разів у пацієнтів з порушенням функції печінки, наприклад, до 4,5-6 годин при хронічних захворюваннях печінки, спричинених зловживанням алкоголю. У пацієнтів з тяжкою серцевою недостатністю період напіввиведення може бути подовжений до 4-10 годин. Ниркова недостатність може призводити до накопичення метаболітів.

Фармацевтичні характеристики.

Основні фізико-хімічні властивості: стерильний, водорозчинний, прозорий, безбарвний гель.

Термін придатності. 3 років.

Умови зберігання. Зберігати у захищеному від світла та недоступному для дітей місці.

Упаковка. Гофровані шприц-туби №1, №5, №25

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Pharmazeutische Fabrik MONTAVIT GmbH, Austria,
Фармацевтіше Фабрік МОНТАВІТ ГмбХ, Австрія.

Місцезнаходження.

Salzbergstrasse 96, 6067 Absam, Austria,
Зальбергштрассе 96, 6067 Абзам, Австрія