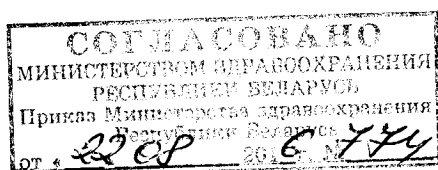


МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РЕСПУБЛИКИ БЕЛАРУСЬ



ИНСТРУКЦИЯ

(информация для специалистов)

по медицинскому применению лекарственного средства

ЛИДОКАИНА ГИДРОХЛОРИД

Торговое название: Лидокаина гидрохлорид.

Международное непатентованное название: Лидокаин (Lidocaine).

Форма выпуска: раствор для инъекций 20 мг/мл.

Описание: прозрачный бесцветный или слегка желтоватый раствор.

Состав на одну ампулу/флакон: активное вещество – *лидокаина гидрохлорид* – 40,0 мг/2 мл; 200,0 мг/10 мл.

вспомогательные вещества – натрия хлорид, натрия гидроксида 1 М раствор, вода для инъекций.

Фармакотерапевтическая группа: Средства для местной анестезии. Амиды.

Код АТС: N01BB02.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лидокаин относится к анестетикам амидного типа. Оказывает местноанестезирующее действие, стабилизируя мембраны нейронов, снижая их проницаемость для ионов натрия, что препятствует генерации и проведению нервных импульсов. Подобный эффект наблюдается на возбудимых мембранах клеток сердечной мышцы и головного мозга. Лидокаин характеризуется быстрым началом действия, высокой анестезирующей активностью и низкой токсичностью. В более низких концентрациях лидокаин оказывает меньшее влияние на двигательные нервные волокна. При местном применении расширяет сосуды, не оказывает раздражающего действия на ткани.

Фармакокинетика

При парентеральном введении степень абсорбции зависит от дозы, пути и места введения. Максимальная концентрация в крови достигается после межреберной блокады (порядка 1,5 мкг/мл при введении 100 мг), тогда как при подкожном введении в область живота отмечается наименьшая плазменная концентрация (около 0,5 мкг/мл при введении 100 мг). Объем распределения в равновесном состоянии составляет 91 л, а связь с белками плазмы, преимущественно с α 1-кислым гликопротеином, 65%.

Абсорбция из эпидурального пространства полная и двухфазная, с периодом полувыведения около 9,3 и 82 минут соответственно. Медленная абсорбция является ограничивающим фактором элиминации лидокаина, что объясняет более медленную элиминацию лидокаина после эпидуральной инъекции, чем после внутривенного введения.

Элиминация лидокаина осуществляется преимущественно за счет метаболизма. Метаболизируется в печени путем дезалкилирования с участием микросомальных изоферментов цитохрома P450 CYP1A2 и CYP3A4 до моноэтилглицилксиледида (МЭГК),

который затем метаболизируется до 2,6-диметиланилина и глицилксилидина (ГК). В дальнейшем изофермент CYP2A6 конвертирует 2,6-диметиланилин в 4-гидрокси-2,6-диметиланилин, являющийся основным метаболитом мочи (80%) и выводящимся в виде конъюгатов. МЭГК обладает судорожной активностью, аналогичной лидокаину, тогда как у ГК такая активность отсутствует. Плазменная концентрация МЭГК сопоставима с концентрацией исходного соединения. Скорость элиминации лидокаина и МЭГК после внутривенного болюсного введения составляет около 1,5-2 ч и 2,5 ч соответственно. Вследствие быстрого метаболизма, кинетика восприимчива ко всем нарушениям функции печени. У пациентов с печеночной недостаточностью период полувыведения может удваиваться. При почечной недостаточности кинетика не изменяется, но может повышаться вероятность накопления метаболитов.

Лидокаин проникает через гематоэнцефалический барьер, плацентарный барьер и в грудное молоко. Концентрация несвязанного лидокаина в плазме матери и плода одинаковы, однако общая плазменная концентрация у плода ниже вследствие более низкой связи с белками.

Показания к применению

Проводниковая анестезия.

Способ применения и дозы

Осуществлять введение лидокаина гидрохлорида должны врачи, имеющие опыт в проведении региональной анестезии (или под их надзором).

При проведении местной анестезии режим дозирования устанавливают в зависимости от вида анестезии и характера оперативного вмешательства.

Раствор лидокаина гидрохлорида 10 мг/мл назначается взрослым и детям старше 1 года, раствор с концентрацией 20 мг/мл предназначен для применения у взрослых.

Для проводниковой анестезии применяют растворы с концентрацией 10 мг/мл и 20 мг/мл, не превышая максимальную общую дозу для взрослых; в стоматологической практике используют 1-5 мл раствора 20 мг/мл.

Максимальная рекомендованная суммарная доза: 20 мл раствора 20 мг/мл (400 мг лидокаина гидрохлорида).

Необходимо вводить наименьшую дозу, обеспечивающую требуемый эффект.

Средняя суточная доза должна быть снижена для пациентов с нарушениями функции печени и почек.

Для пожилых пациентов рекомендуется снижение дозы, соизмеримое с возрастом.

Побочное действие

Побочные эффекты, вызванные лекарственным средством, иногда трудно отличить от физиологических эффектов блока нерва (например, снижение артериального давления, брадикардия) и от непосредственно (например, повреждение нерва) или косвенно (эпидуральный абсцесс) вызванных проколом.

Указанные ниже побочные эффекты представлены в соответствии со следующими градациями частоты их возникновения: 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 (по имеющимся данным определить частоту встречаемости не представляется возможным).

Со стороны нервной системы: нечасто: парестезия, головокружение; редко: признаки системной нейротоксичности (судороги, периоральная парестезия, онемение языка, потеря сознания, тремор, бред, сонливость, дизартрия); очень редко: нейропатия, повреждения периферических нервов, арахноидит.

Со стороны органа зрения: очень редко: диплопия.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: часто: гипотензия; нечасто: гипертензия, брадикардия; очень редко: остановка сердца, аритмии.

Со стороны органов грудной клетки, средостения, дыхательных путей: очень редко: нарушение дыхания.

Со стороны желудочно-кишечного тракта: часто: тошнота; нечасто: рвота.
Со стороны иммунной системы: очень редко: аллергические реакции (крапивница, зуд, ангионевротический отек), анафилактический шок.

Противопоказания

Гиперчувствительность к любому из компонентов лекарственного средства или другим местным анестетикам амидного типа в анамнезе. Наличие в анамнезе эпилептиформных судорог на введение лидокаина.

Эпидуральная и парацервикальная анестезия – для раствора 20 мг/мл.

Лидокаин не допускается применять для эпидуральной анестезии у пациентов с тяжелой артериальной гипотензией, кардиогенным или гиповолемическим шоком.

При анестезии пальцев рук и ног, ушей, носа, полового члена – совместное использование с адреналином.

Также следует учитывать общие противопоказания к проведению того или иного вида анестезии.

Детский возраст – для раствора 20 мг/мл; возраст детей до 1 года – для раствора 10 мг/мл.

Передозировка

Непреднамеренное внутрисосудистое введение местных анестетиков может вызвать немедленные системные токсические реакции (от нескольких секунд до нескольких минут). Признаки системной токсичности при передозировке возникают позже (15-60 мин после инъекции) из-за более медленного увеличения концентрации местного анестетика в крови.

Симптомы: возбуждение центральной нервной системы, сменяющееся ее угнетением. При введении больших доз первым симптомом может служить быстрое начало судорог. Начальные признаки интоксикации – беспокойство, головокружение, тошнота, нарушение зрения, периоральная парестезия. Затем атаксия, слуховые нарушения, эйфория, спутанность сознания, трудности речи, бледность, потливость, тремор, судороги, кома, остановка дыхания. Аритмии, преимущественно брадиаритмии, но при больших дозах также возможны желудочковая тахикардия, фибрилляция желудочков, расширение комплексов QRS, АВ-блокада. Сердечная недостаточность, артериальная гипотония (в отдельных случаях описана метгемоглобинемия).

Лечение: при появлении первых признаков интоксикации введение прекращают, пациента переводят в горизонтальное положение, обеспечивают проходимость дыхательных путей, начинают ингаляции кислорода, при необходимости – искусственную вентиляцию легких. При судорогах рекомендуется внутривенное введение диазепама, при брадикардии – применение М-холиноблокаторов (атропина). При недостаточности кровообращения поддержание гемодинамики осуществляют путем введения плазмозамещающих растворов, добутамина и, при необходимости, норэпинефрина (начиная с дозы 0,05 мкг/кг/мин, увеличивая, если нужно, на 0,05 мкг/кг/мин каждые 10 минут), в тяжелых случаях устанавливают мониторинг гемодинамики. При остановке сердца проводят стандартные реанимационные мероприятия. Диализ неэффективен.

Меры предосторожности

За исключением наиболее простых процедур, при проведении региональной и местной анестезии необходимо иметь наготове оборудование для реанимации. При любой крупной блокаде до начала введения анестетика необходимо установить внутривенную канюлю. Лидокаин должны вводить специалисты, прошедшие соответствующее обучение и владеющие навыками реанимации.

Подобно другим местным анестетикам, лидокаин может вызвать острые токсические явления со стороны нервной и сердечно-сосудистой систем, если его применение приводит к высоким плазменным концентрациям, особенно при непреднамеренном внутрисосудистом введении.

Следует соблюдать осторожность при лечении следующих категорий пациентов:

– пожилые пациенты и пациенты с тяжелым общим состоянием;

- пациенты с тяжелыми заболеваниями печени и почек;
- пациенты с нарушениями проводимости миокарда (атриовентрикулярная блокада различной степени, синдром слабости синусового узла, выраженная брадикардия и др.), так как местные анестетики могут вызывать нарушения проводимости миокарда;
- пациенты, получающие антиаритмические средства класса III (например, амиодарон), должны находиться под тщательным наблюдением и мониторингом ЭКГ (см. также раздел «Взаимодействие с другими лекарственными средствами»);
- пациенты, страдающие эпилепсией или миастенией;
- пациенты с дыхательной недостаточностью;
- у пациентов с порфирией использование лидокаина возможно с особой осторожностью, при тщательной оценке соотношения пользы и риска.

При проведении процедур обезболивания могут возникать серьезные побочные реакции. Эпидуральную анестезию следует применять с осторожностью у пациентов с нарушением функции сердечно-сосудистой системы, особенно если она сопровождается гиповолемией. Эпидуральная анестезия может привести к гипотензии и брадикардии. Этот риск может быть уменьшен путем предварительного введения кристаллоидных или коллоидных растворов. Снижение артериального давления следует купировать, например, с помощью введения 5-10 мг эфедрина внутривенно, при необходимости повторяя введение.

Парацервикальная блокада иногда может вызывать брадикардию или тахикардию плода, в связи с чем необходим тщательный мониторинг сердечного ритма плода.

При местной анестезии вводить препарат в сильно васкуляризованные ткани следует осторожно во избежание его попадания в кровяное русло. При введении в васкуляризованные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Случайная инъекция лидокаина в артерию в области головы или шеи может привести к появлению общемозговой симптоматики, даже при использовании в низких дозах.

При ретробульбарном введении лидокаин может достигать субарахноидального пространства, вызывая при этом серьезные реакции, включая сердечно-сосудистую недостаточность, апноэ, судороги и временную слепоту.

Возможны травматические поражения нервов и/или местные токсические эффекты на мышцы и нервы при введении местного анестетика. Степень повреждения тканей зависит от размера травмы, локальной концентрации анестетика и продолжительности его воздействия на ткани. В этой связи следует вводить наименьшую эффективную дозу.

При введении лидокаина в мышцу возможно повышение плазменной активности креатинфосфокиназы, что может затруднить диагностику острого инфаркта миокарда.

Эффективность лидокаина снижается при наличии воспаления или инфекции в месте введения.

Использование в педиатрии. Раствор с концентрацией 20 мг/мл не предназначен для применения у детей.

Применение во время беременности и в период лактации. Адекватные данные о применении лидокаина у беременных женщин отсутствуют. Лидокаин проникает через плаценту. Лидокаин применялся у большого числа беременных женщин и женщин детородного возраста. Данные о нарушении лидокаином репродуктивных процессов (например, повышение частоты пороков развития или какое-либо прямое или косвенное влияние на плод) отсутствуют. Тем не менее, риск для человека до конца не установлен. Исследования на животных относительно влияния лидокаина на беременность, эмбрио-фетальное развитие, роды и постнатальное развитие неполные. При краткосрочном применении у беременных женщин следует тщательно оценивать ожидаемую пользу терапии для матери и потенциальный риск для плода. Парацервикальная или пудентальная блокада лидокаином повышает риск таких реакций у плода, как брадикардия или тахикардия. В связи с этим необходимо контролировать частоту сердечных сокращений у плода.

Небольшое количество лидокаина проникает в грудное молоко. При применении в рекомендуемых дозах влияние на ребенка маловероятно. Тем не менее, при необходимости применения лидокаина во время кормления грудью следует проявлять осторожность, оценивать соотношение пользы и риска лечения, учитывая возможность возникновения у ребенка аллергической реакции.

Влияние на способность к управлению автотранспортом и другими потенциально опасными механизмами. В зависимости от дозы и способа введения лидокаин может оказывать кратковременное воздействие на подвижность и координацию. Следует отказаться от управления автотранспортом и потенциально опасными механизмами в случае, если местная анестезия затрагивает функцию частей тела, используемых при данном роде деятельности. Возобновить деятельность можно лишь после полного восстановления функций анестезируемой части тела.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Циметидин и пропранолол уменьшают печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма вследствие ингибирования микросомального окисления и снижения печеночного кровотока) и повышают риск развития токсических эффектов.

Лидокаин следует с осторожностью применять с другими местными анестетиками и антиаритмиками IV класса ввиду потенциальной суммации их токсических эффектов. Отдельные исследования лекарственных взаимодействий местных анестетиков с антиаритмиками III (например, амиодароном) не проводились, следует соблюдать осторожность (см. раздел «Меры предосторожности»).

При совместном назначении с курареподобными лекарственными средствами усиливается мышечная релаксация.

Под влиянием ингибиторов моноаминоксидазы возможно усиление местноанестезирующего действия лидокаина.

Условия хранения

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

Срок годности

2 года.

Не применять по истечении срока годности.

Упаковка

По 2 мл в ампулах. По 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в коробки из картона. По 5 ампул в контурную ячейковую упаковку, 1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку.

По 10 мл во флаконах. 1 флакон вместе с инструкцией по применению помещают в пачку.

Упаковка для стационаров: 40 флаконов вместе с соответствующим количеством инструкций по применению помещают в групповые коробки.

Условия отпуска

По рецепту.

Производитель:
РУП "Белмедпрепараты",
Республика Беларусь, 220007, г. Минск,
ул. Фабрициуса, 30, т./ф.: (+375 17) 220 37 16,
e-mail: medic@belmedpreparaty.com.

