

ИНСТРУКЦИЯ
ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА
ЛИДОКАИН

Регистрационный номер: ЛП-001065

Торговое наименование: Лидокаин

Международное непатентованное или группировочное наименование: Лидокаин

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав (на 1 мл):

Действующее вещество:

Лидокаина гидрохлорид моногидрат (в пересчете на лидокаина гидрохлорид) - 20,0 мг

Вспомогательные вещества:

Натрия хлорид - 6,0 мг

Натрия гидроксид - до pH 5,0 – 7,0

Вода для инъекций - до 1,0 мл

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее средство.

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 эпинефрина – 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 Р450 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 неизмененном 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 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. Острая декомпенсация сердечной недостаточности. Кардиогенный или гиповолемический шок. Детский возраст до 18 лет (для детей в возрасте от 1 года используется дозировка 10 мг/мл).

Для субарахноидальной анестезии (дополнительно) – полная блокада сердца, кровотечения, артериальная гипотензия, шок, инфицирование места проведения люмбальной пункции, септицемия.

С осторожностью

Следует с осторожностью применять:

- у пациентов с миастенией *gravis*;
- у лиц пожилого возраста;
- у пациентов с эпилепсией. Необходимо тщательно наблюдать за пациентами с судорожными расстройствами на предмет симптоматики со стороны ЦНС. Низкие дозы лидокаина также могут повышать судорожную готовность;
- у пациентов с полной и неполной блокадой внутрисердечного проведения, поскольку местные анестетики могут угнетать AV-проведение;
- у пациентов с хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания;
- у пациентов 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 стадии почечной недостаточности, при которой могут кумулировать метаболиты лидокаина);
- в третьем триместре 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. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования. При осложнениях или кровотечении проведение эпидуральной анестезии лидокаином в акушерстве противопоказано. Лидокаин применяли у большого числа беременных женщин и женщин репродуктивного возраста. Какие-либо репродуктивные нарушения не зарегистрированы, т.е. повышения частоты пороков развития не отмечалось. Лидокаин быстро проникает через плаценту, у новорожденных с высокой плазменной концентрацией лидокаин может угнетать ЦНС и, следовательно, затруднять оценку состояния по шкале Апгар. Вследствие потенциального достижения высокой концентрации местных анестетиков после парацервикальной блокады у плода могут развиваться нежелательные реакции, такие как фетальная брадикардия. В связи с этим лидокаин в концентрации, превышающей 1%, в акушерстве не применяют. В исследованиях на животных вредное воздействие на плод не обнаружено.

Грудное вскармливание. Лидокаин в небольшом количестве проникает в грудное молоко. Однако его пероральная биодоступность очень низкая, поэтому количество лидокаина, которое может поступить с грудным молоком, незначительное, и, следовательно, потенциальный вред для ребенка небольшой. Решение о возможности применения лидокаина в период грудного вскармливания принимает врач.

Способ применения и дозы

Лидокаин применяют для инфильтрационной, проводниковой, внутривенной регионарной, эпидуральной и спинальной анестезии.

Режим дозирования следует подбирать, основываясь на реакции пациента и месте введения. Препарат следует вводить в наименьшей концентрации и наименьшей дозе, дающей требуемый эффект.

Объем раствора, подлежащий введению, зависит от вида анестезии, размера анестезируемого участка, характера и продолжительности оперативного вмешательства. Если есть потребность во введении большого объема с низкой концентрацией, то стандартный раствор лидокаина разводят солевым раствором (0,9% 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 мг/кг. Повторное введение в течение 24 часов не рекомендуется. 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.

Рекомендуемые дозы:

Инфильтрационная анестезия (внутрикожно, подкожно, внутримышечно)	
Большие вмешательства	5-10 мл (100-200 мг)
Проводниковая анестезия (анестезия/блокада периферических нервов, в т.ч. блокада нервных сплетений)	
Перинеурально:	1,5-10 мл (30-200 мг)
Блокада нервов пальцев кисти и стопы	2-4 мл (40-80 мг)
Блокада нервных сплетений	5-10 мл (100-200 мг)
В стоматологии	1-5 мл (20-100 мг)
В офтальмологии:	
Ретробульбарная анестезия	3-4 мл (60-80 мг)
Парабульбарная анестезия	1-2 мл (20-40 мг)
Эпидуральная анестезия	
Торакальный отдел	10-15 мл (200-300 мг)
Люмбальный отдел	12,5-20 мл (250-400 мг)
Сакральный отдел	10-15 мл (200-300 мг)
Спинальная анестезия	
Субарахноидально	3-4 мл (60-80 мг)

Внутривенная регионарная анестезия (введение анестетика непосредственно в вену конечности (при условии наложения жгута выше места введения))	Не более 2,5 мл (50 мг)
---	-------------------------

Побочное действие

Со стороны центральной и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, слабость, двигательное беспокойство, нистагм, потеря сознания, сонливость, зрительные и слуховые нарушения, тремор, тризм, судороги (риск их развития повышается на фоне гиперкапнии и ацидоза), паралич дыхательных мышц, остановка дыхания, блок моторный и чувствительный, паралич дыхательного центра.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение или снижение артериального давления, брадикардия, аритмия, тахикардия – при введении с вазоконстриктором, периферическая вазодилатация, коллапс, боль в грудной клетке.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, непроизвольная дефекация.

Со стороны крови: метгемоглобинемия.

Со стороны мочевыделительной системы: непроизвольное мочеиспускание.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница (на коже и слизистых оболочках), зуд кожи, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Местные реакции: при спинальной анестезии - боль в спине, при эпидуральной анестезии - случайное попадание в субарахноидальное пространство.

Прочие: стойкая анестезия, угнетение дыхания, вплоть до остановки, гипотермия.

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.

Меры по оказанию помощи при передозировке

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 средствами

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 угнетение 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; следует избегать внутрисосудистой инъекции во время введения. При введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соответствующим образом оборудованном помещении, при доступности готового к немедленному использованию оборудования и препаратов, необходимых для проведения мониторинга сердечной деятельности и реанимационных мероприятий. Персонал, выполняющий анестезию, должен быть квалифицированным и обучен технике выполнения анестезии, должен быть знаком с диагностикой и лечением системных токсических реакций, нежелательных явлений и реакций и других осложнений.

Лидокаин следует с осторожностью применять у пациентов с миастенией *gravis*, эпилепсией, хронической сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания, а также в комбинации с препаратами, взаимодействующими с лидокаином и приводящими к повышению его биодоступности, потенцированию эффектов (например, фенитоином) или удлинению 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 при 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.

Раствор для инъекций лидокаина не рекомендуется применять у новорожденных. Оптимальная сывороточная концентрация лидокаина, позволяющая избежать такой токсичности как судороги и аритмии, у новорожденных не установлена.

Следует избегать внутрисосудистого введения, если таковое напрямую не показано.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, 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.

По 2 мл в ампулы с точкой или кольцом излома нейтрального стекла или стекла с классом сопротивления гидролизу HGA1 (первый гидролитический).

5 ампул помещают в контурную ячейковую упаковку из пленки поливинилхлоридной (ПВХ) или полиэтилентерефталатной (ПЭТФ).

1 или 2 контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары.

5 или 10 ампул вместе с инструкцией по применению помещают в пачку из картона для потребительской тары с гофрированным вкладышем.

Упаковка для стационаров.

4, 5 или 10 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в пачку из картона для потребительской тары.

50 или 100 контурных ячейковых упаковок вместе с инструкциями по применению в количестве, равном количеству контурных ячейковых упаковок, помещают в коробку из картона гофрированного.

Срок годности

3 года. Не использовать по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия хранения

Хранить в защищенном от света месте, при температуре не выше 30 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Наименование и адрес производителя

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20,
стр. 2

**Владелец регистрационного удостоверения и организация, принимающая претензии
потребителей**

ООО «Эллара»

601122, Владимирская обл., Петушинский р-н, г. Покров, ул. Франца Штольверка, д. 20
тел./факс: (49243) 6-42-22, (49243) 6-42-24