

УТВЕРЖДЕНА
Приказом председателя
Комитета Фармации
Министерства здравоохранения
Республики Казахстан
от « ____ » _____ 201__ г.
№ _____

**Инструкция по медицинскому применению
лекарственного средства**

ЛИДОКАИНА ГИДРОХЛОРИД-DF

Торговое название

Лидокаина гидрохлорид-DF

Международное непатентованное название

Лидокаин

Лекарственная форма

Раствор для инъекций 10 мг/мл и 20 мг/мл

Состав

Одна ампула раствора содержит:

активное вещество: лидокаина гидрохлорид 40 мг в 2 мл или 35 мг в 3.5 мл и 50 мг в 5 мл;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, 1 М раствор натрия гидроксида (до pH 5.0-7.0), вода для инъекций.

Описание

Прозрачная, бесцветная или слегка желтоватого цвета жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Анестетики. Анестетики местные. Амиды. Лидокаин

Код АТХ N01BB02

Фармакологические свойства

Фармакокинетика

При парентеральном введении степень абсорбции зависит от места введения и дозы. При внутривенном струйном введении максимальная концентрация лидокаина в плазме крови создается через 3-5 мин, при внутримышечном – через 5-15 мин. Связь с белками плазмы – 50 - 80 %. Распределяется быстро ($T_{1/2}$ фазы распределения – 6-9 мин). Сначала поступает в хорошо кровоснабжаемые ткани (сердце, легкие, 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 микросомальных ферментов путем дезаминирования с образованием активных метаболитов (моноэтилглицинксилидин и глицинксилидин), $T_{1/2}$ которых составляет 2 ч и 10 ч соответственно. При заболеваниях печени интенсивность метаболизма снижается и составляет от 50 % до 10 % от нормальной величины.

Период полувыведения после внутривенного болюсного введения – 1,5-2 ч, у новорожденных – 3 ч, при длительных внутривенных инфузиях — до 3 ч и более. При нарушении функции печени период полувыведения может увеличиваться в 2 раза и более.

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

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.

Показания к применению

- местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, офтальмологии, стоматологии, отоларингологии
- блокада периферических нервов и нервных узлов

Способ применения и дозы

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

Для проведения анестезии количество лекарственного средства и общая доза зависят от вида анестезии и характера оперативного вмешательства.

При инфильтрационной анестезии используется до 30 мл раствора с концентрацией 10 мг/мл (1 %).

При проводниковой анестезии применяют растворы с концентрацией 10 мг/мл (1 %) и 20 мг/мл (2 %); максимальная общая доза – до 400 мг (40 мл 1 % раствора и 20 мл 2 % раствора лидокаина).

В стоматологической практике используют 1 - 5 мл (20 - 100 мг) 2 % раствора; при блокаде межреберных нервов – 3-5 мл (30-50 мг) 1 % раствора; при парацервикальной анестезии – 10 мл (100 мг) 1 % раствора в каждую сторону (возможно повторное введение не менее чем через 1,5 ч); при блокаде по Оберсту-Лукашевичу – 2 - 3 мл 2 % раствора.

Вагосимпатическая блокада: шейного отдела – 5 мл (50 мг) 1 % раствора, поясничного – 5 - 10 мл (50 - 100 мг) 1 % раствора.

Эпидуральная анестезия – используется 200 - 300 мг (10-15 мл) 2 % раствора лидокаина. Не рекомендуется использовать непрерывное введение анестетика с помощью катетера; введение максимальной дозы не должно повторяться чаще, чем через 90 мин.

Для анестезии слизистых оболочек (при интубации трахеи, бронхоэзофагоскопии, фиброгастродуоденоскопии, удалении полипов, проколах гайморовой пазухи и др.) применяют 2 % раствор в объеме не более 20 мл. Длительность анестезии 15-30 минут.

В офтальмологии: 2 капли 2 % раствора закапывают в конъюнктивальный мешок 2 – 3 раза с интервалом 30 – 60 секунд непосредственно перед хирургическим вмешательством или исследованием.

Максимальная доза для взрослых – не более 4,5 мг/кг или 300 мг.

Для удлинения действия лидокаина возможно добавление *ex tempore* 0,1 % раствора адреналина (1 капля на 5 - 10 мл раствора лидокаина, но не более 5 капель). При этом максимально допустимая доза лидокаина увеличивается до 500 мг.

Примечание: после внутривенного введения лидокаин имеет короткую продолжительность действия (продолжительностью 15-20 мин). Если внутривенное вливание путем капельной инфузии недоступно, после немедленного начального внутривенного введения можно повторить 50 - 100 мг при необходимости один или два раза с интервалом не менее 10 мин.

Для приготовления инфузионного раствора 1 г или 2 г лидокаина добавляют к 1 л 5 % раствора декстрозы для инъекций и получают раствор лидокаина в концентрации 1 мг/мл или 2 мг/мл.

У пожилых пациентов рекомендуется уменьшение дозы, особенно при длительной внутривенной инфузии. При хронической почечной недостаточности коррекции дозы не требуется. При заболеваниях печени (цирроз, гепатит) и у пациентов со сниженным печеночным кровотоком (например, на фоне хронической сердечной недостаточности) доза должна быть снижена на 40-50 %.

Внимание!

При быстром внутривенном введении может произойти резкое снижение артериального давления и развиться коллапс. В этих случаях применяют фенилэфрин, эфедрин и другие сосудосуживающие средства.

1 % раствор лидокаина применяют в качестве растворителя для приготовления инъекционных растворов для внутримышечного введения

β -лактамных антибиотиков группы цефалоспоринов из расчета 3 мл лидокаина на флакон, содержащий 1,0 г антибиотика.

Побочные действия

Нарушения со стороны нервной системы:

часто - парестезии, головокружение;

нечасто - признаки системной нейротоксичности (судороги, парестезия вокруг рта, онемение языка, тремор, бред, сонливость, дизартрия, потеря сознания), редко - нейропатия, повреждения периферических нервов, арахноидит.

Нарушения со стороны органов зрения:

редко - диплопия (двоение в глазах).

Нарушения со стороны сердца:

часто - брадикардия;

редко - аритмия, остановка сердца.

Нарушения со стороны сосудов:

очень часто - гипотензия;

часто - гипертензия.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:

редко - дыхательная недостаточность, угнетение и остановка дыхания.

Нарушения со стороны иммунной системы:

редко - аллергические реакции (крапивница, кожные высыпания, отек Квинке, в более тяжелых случаях - анафилактический шок).

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта:

очень часто - тошнота;

часто - рвота.

Противопоказания

- гиперчувствительность к любому из компонентов лекарственного средства или другим амидным местноанестезирующим лекарственным средствам в анамнезе
- синдром слабости синусового узла (особенно у больных пожилого возраста), значительное снижение функции левого желудочка
- синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта
- блокады сердца: атриовентрикулярная II - III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков), внутрижелудочковая; синусно-предсердная
- нарушения внутрижелудочковой проводимости
- кардиогенный шок
- ретробульбарное введение (особенно больным глаукомой)
- порфирия
- синдром Морганьи-Адамса-Стокса

- для анестезии в акушерской практике – нарушения внутриутробного развития плода, фетоплацентарная недостаточность, недоношенность, переносимость, гестоз
- для эпидуральной анестезии – тяжелая гипотензия, кардиогенный шок и гиповолемический шок, неврологические заболевания, септицемия, невозможность проведения пункции из-за деформации позвоночника
- для субарахноидальной анестезии – боль в спине, инфекции головного мозга, доброкачественные и злокачественные новообразования головного мозга, коагулопатии различного генеза, мигрень, субарахноидальное кровоизлияние, артериальная гипертензия и гипотензия, парестезии, психоз, истерия, неконтактные больные, невозможность проведения пункции из-за деформации позвоночника
- эпилептиформные судороги при предшествующем применении Лидокаина (в анамнезе)
- детский и подростковый возраст до 18 лет

С осторожностью: при тяжелой форме сердечной недостаточности, тяжелой печеночной и/или почечной недостаточности, у ослабленных больных, при гиповолемии, АВ блокаде, синусовой брадикардии, артериальной гипотензии, тяжелой миастении, беременности и в период лактации.

Лекарственные взаимодействия

Совместное назначение с бета-адреноблокаторами увеличивает риск развития брадикардии и токсических эффектов лидокаина.

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

Барбитураты, фенитоин, рифампицин (индукторы микросомальных ферментов печени) снижают эффективность (может потребоваться увеличение дозы).

При назначении с аймалином, фенитоином, верапамиллом, хинидином, амиодароном возможно усиление отрицательного инотропного эффекта.

Сердечные гликозиды ослабляют кардиотонический эффект, курареподобные лекарственные средства усиливают мышечную релаксацию.

Прокаинамид повышает риск развития возбуждения центральной нервной системы, галлюцинаций.

При одновременном назначении лидокаина, барбитуратов, иных снотворных и седативных лекарственных средств возможно усиление их угнетающего действия на центральную нервную систему.

Под влиянием ингибиторов моноаминоксидазы возможно усиление местноанестезирующего действия лидокаина. Больным, принимающим ингибиторы моноаминоксидазы, не следует назначать лидокаин парентерально.

При одновременном применении лидокаина и полимиксина В возможно усиление угнетающего влияния на нервно-мышечную передачу (необходим мониторинг респираторных функций).

Фармацевтическая несовместимость

Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогекситоном или сульфадиазином. В зависимости от рН раствора лидокаин может проявлять несовместимость с ампициллином.

Особые указания

Перед применением лидокаина необходимо провести кожную пробу на индивидуальную чувствительность к препарату, о которой свидетельствует отек и покраснение места инъекции. Ведение лидокаина могут осуществлять только медицинские работники.

Регионарная и местная анестезия должна проводиться опытными специалистами в соответствующем 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.

У больных с острым инфарктом миокарда назначение лидокаина может повысить риск смертельного исхода за счет увеличения частоты возникновения асистолий. Внутримышечные инъекции лидокаина могут увеличить активность креатининфосфокиназы, что может затруднить диагностику инфаркта миокарда. Не рекомендуется применять лидокаин при суправентрикулярных аритмиях (из-за неэффективности и риска учащения желудочковых сокращений – при трепетании и мерцании предсердий).

При введении лидокаина необходимы особая осторожность и снижение дозы в случаях недостаточности кровообращения, гипотонии, гиповолемии, гипокалиемии, нарушении функции печени и/или почек. До начала применения Лидокаина следует нормализовать уровень калия в плазме крови.

Эпидуральная анестезия может привести к гипотензии и брадикардии, этот риск можно уменьшить предварительным введением коллоидных и кристаллоидных растворов. Парацервикальная блокада может вызвать брадикардию или тахикардию плода, в связи, с чем необходим мониторинг его сердечной деятельности.

Следует соблюдать особую осторожность при введении препарата пациентам пожилого возраста.

Пациенты, предрасположенные к злокачественной гипертензии, требуют особого внимания, поскольку они могут быть резистентны к амидным местным анестетикам.

При ретробульбарном введении лидокаин редко достигает субарахноидального пространства, вызывая при этом серьезные побочные реакции, включая сердечно-сосудистую недостаточность, апноэ, судороги и временную слепоту. Запрещается вводить растворы лидокаина ретробульбарно больным глаукомой.

Следует осторожно вводить лидокаин в сильно васкуляризированные ткани во избежание интравазального попадания препарата. При введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу. Случайная инъекция препарата в артерию головы и шеи может привести к появлению общемозговой симптоматики. При быстром внутривенном введении может резко снизиться артериальное давление и развиваться коллапс.

Злоупотребление алкоголем усиливает угнетающий эффект лидокаина на дыхание.

Ингибиторы МАО необходимо отменить не менее, чем за 10 дней до плановой субарахноидальной анестезии лидокаином.

Беременность и лактация. Лидокаин проходит через плацентарный барьер, в связи, с чем при беременности (особенно в I триместре) его назначение не рекомендовано, только после тщательного анализа польза/риск. Небольшое количество лидокаина может выделяться в грудное молоко, поэтому при назначении лидокаина следует прекратить грудное вскармливание.

Использование в педиатрии. Нет данных о применении препарата в детской практике, в связи с чем, не рекомендуется его применение у детей.

Особенности влияния лекарственного препарата на способность к управлению автотранспорта и потенциально опасными механизмами.

В период лечения не рекомендуется управлять транспортом и работать с механизмами, требующими концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Передозировка

Симптомы: начальные признаки интоксикации – головокружение, тошнота, рвота, эйфория, астения, снижение артериального давления; затем – судороги мимической мускулатуры лица, тонико-клонические судороги скелетной мускулатуры, психомоторное возбуждение, брадикардия, коллапс; при использовании в родах у новорожденного – брадикардия, угнетение дыхательного центра, остановка дыхания.

Лечение: при появлении первых признаков интоксикации введение прекращают, пациента переводят в горизонтальное положение; проводят ингаляцию кислорода. При судорогах показано внутривенное введение диазепама, при брадикардии – м-холиноблокаторов (атропин), вазоконстрикторов (норэпинефрин, фенилэфрин). При необходимости проводят интубацию, искусственную вентиляцию легких, реанимационные мероприятия. Диализ не эффективен.

Форма выпуска и упаковка

Раствор для инъекций 10 мг/мл: в ампулах полимерных из полиэтилена высокого давления низкой плотности по 5 мл и 3.5 мл.

Раствор для инъекций 20 мг/мл: в ампулах полимерных из полиэтилена высокого давления низкой плотности по 2 мл.

На ампулы полимерные наклеивают этикетки из бумаги этикеточной.

По 5 или 10 ампул вместе с инструкцией по медицинскому применению на государственном и русском языках помещают в пачку из картона.

Условия хранения

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

Хранить в недоступном для детей месте!

Срок хранения

2 года.

Не применять по истечении срока годности

Условия отпуска из аптек

По рецепту

Производитель

ТОО «DOSFARM», Казахстан, 050034, г. Алматы, ул. Чаплыгина, 3, тел.: (727) 253-03-88

Владелец регистрационного удостоверения

ТОО «DOSFARM», Казахстан

Адрес организации, принимающей на территории Республики Казахстан претензии от потребителей по качеству лекарственных средств и ответственной за пострегистрационное наблюдение за безопасностью лекарственных средств:

ТОО «DOSFARM», Казахстан, 050034, г. Алматы, ул. Чаплыгина, 3, тел./факс: (727) 253-07-07, 253-03-88, эл. адрес: dosfarm@dosfarm.kz