

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКАЇН (LIDOCAINE)

Склад:

діюча речовина: лідокаїн;

1 мл розчину містить лідокаїну гідрохлориду у перерахуванні на безводну речовину 20 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, натрію гідроксид, вода для ін'єкцій.

Лікарська форма. Розчин для ін'єкцій.

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

Фармакотерапевтична група. Препарати для місцевої анестезії. Аміді. 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 за участю мікосомальних 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;
- зазначення в анамнезі на епілептиформні судоми, пов'язані із введенням лідокаїну;
- АВ-блокада II і III ступеня, синдром слабкості синусового вузла, синдром Вольфа-Паркінсона-Уайта, синдром Адама-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;
- період у перші три місяці після інфаркту міокарда зі зменшеним серцевим викидом лівого шлуночка (менше 35 % від норми);
- розлади згортання крові, антикоагулянтна терапія;
- інфекції у місці ін'єкції;
- неконтактні пацієнти;
- істотне зниження функції лівого шлуночка.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

При комбінованому застосуванні лідокаїну з такими препаратами як *клорпромазин, петидин, бупівакаїн, хінідин, дизопірамід, амітриптилін, іміпрамін, нотриптилін* концентрація лідокаїну у плазмі крові знижується.

Антиаритмічні препарати (у т.ч. *аміодарон, верапаміл, дизопірамід, аймалін*) – посилюється кардіодепресивна дія (відбувається подовження інтервалу QT та у поодиноких випадках можливий розвиток АВ-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 внаслідок інгібування мікросомального окислення), підвищує його концентрацію і ризик розвитку токсичних ефектів. Також має синергичний ефект при взаємодії з лідокаїном.

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

β-адреноблокатори (наприклад, *пропранолол, метопролол*) 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 зменшувати дозу останнього. Також β-адреноблокатори мають синергичний ефект при взаємодії з лідокаїном; відбувається інгібуючий вплив на серцеву провідність, що може привести до підвищення скоротливості міокарда.

Серцеві глікозиди – послаблюється кардіотонічний ефект серцевих глікозидів.

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

Наркотичні аналгетики (*морфін*) – посилюється аналгезуючий 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 в крові.

Пропрофенон – можливе збільшення тривалості і підвищення тяжкості побічних ефектів з боку центральної нервової системи.

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, тiazидні і петльові діуретики зменшують ефект лідокаїну у результаті 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 й існує ризик розвитку токсичних ефектів.

При взаємодії лідокаїну з іншими антиаритмічними препаратами, наприклад, з антагоністами кальцію, відбувається інгібуючий вплив на серцеву провідність, що може призвести до підвищення скоротливості міокарда.

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 синергичний ефект. З обережністю призначати з діазепамом.

Для всіх видів ін'єкційного знеболювання можливе поєднання лідокаїну з епінефрином (1:50000-1:100000; готувати extempore, 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 у 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 АВ-блокадою, порушенням внутрішньослуночкової провідності, порушеннями функції печінки і нирок помірного ступеня (кліренс креатиніну не менше 10 мл/хв), порушенням функції дихання, епілепсією, після операцій на серці, при генетичній схильності до злоякісної 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 злоякісної гіпертермії, тому їх застосування у таких випадках слід уникати.

Слід дотримуватись особливої обережності при застосуванні лідокаїну пацієнтам з недостатністю кровообігу, гіповолемією, 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 серцевої системи. При тривалому застосуванні потрібно монітувати 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.

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 – 15-30 хвилин.

Максимальна доза препарату для дорослих – 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 – 2-3 мл (40-60 мг препарату).

Максимальна доза препарату для дорослих – 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
Інфільтрація	5 мг/мл (0,5%) або 10 мг/мл (1 %)	1-60 мл	5-300 мг
– Через шкіру			
– 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
– Міжреберний	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
– Люмбарно	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
– Люмбарно:			
– Знеболювання	10 мг/мл (1 %)	25-30 мл	250-300 мг
– Анестезія	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
*Доза залежить від кількості дерматомів (ділянок шкіри), які потребують анестезії (2-3 мл /дерматом)	20 мг/мл (2 %)	10-15 мл	200-300 мг
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 віком до 3 років максимальна доза становить 1,25 мл, у тому числі і дітям з порушенням функції нирок. Впродовж 24 годин доза не повинна становити більше 4 доз.

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

Максимальне дозування дітям віком до 3-х років – не більше 1,25 мл місцево на тампоні кожні 3 години, чи 10 мл впродовж 24 годин. Дітям віком від 3 років доза становить 5 мл. Дітям віком 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.

Порядок роботи з ампулою

1. Відокремити одну ампулу від блоку і струснути її, утримуючи за горлечко (Рис. 1).
2. Стиснути ампулу рукою (при цьому не повинно відбуватися витікання препарату) і обертальними рухами скрутити і відокремити голівку (Рис. 2).
3. Через отвір, що утворився, негайно з'єднати шприц з ампулою (Рис. 3).
4. Перевернути ампулу і повільно витягнути в шприц її вміст (Рис. 4).
5. Надіти голку на шприц.



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 AV-блокада, асфіксія, апное, депресія, сонливість, тривожність, дзвін у вухах. При значному передозуванні можливе порушення свідомості, пригнічення дихання, шок, інфаркт міокарда. Перші симптоми передозування у здорових людей виникають при концентрації лідокаїну в крові більше 0,006 мг/кг; судоми – при 0,01 мг/кг.

Лікування. Припинення введення препарату, оксигенотерапія, вазоконстриктори (норадреналін, мезатон), протисудомні засоби, холінолітики.

Пацієнт повинен перебувати в горизонтальному положенні; необхідно забезпечити доступ свіжого повітря, подачу кисню та/або проведення штучного дихання. Симптоми з боку центральної нервової системи коригуються застосуванням бензодіазепінів або барбітуратів короткочасної дії. Якщо передозування виникає у процесі анестезії, слід застосувати міорелаксанти короткої 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. У гострій фазі передозування лідокаїну діаліз неефективний. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції.

Неврологічні розлади: занепокоєння, сонливість, запаморочення, головний біль, порушення сну, сплутаність свідомості, втрата свідомості аж до коми, порушення чутливості, м'язові спазми, судоми, моторний блок, дизартрія, дисфагія, стійка анестезія, парез або елегія нижніх кінцівок та втрата управління сфінктером (наприклад, синдром кінського хвоста), поколювання шкіри.

При застосуванні у стоматології: оніміння язика і губ.

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 та вестибулярного апарату: вертиго, слухові порушення, шум або дзвін 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 серці, припливи.

З боку шлунково-кишкового тракту: 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, злякисна гіпертермія, набряки, слабкість.

Місцеві реакції: реакції у місці введення, відчуття легкого печіння, що зникає зі зростанням анестезуючого ефекту протягом 1 хв., тромбофлебіт, гіперемія.

При спінальній або епідуральній анестезії може спостерігатися біль у спині, ногах, часткова/повна спинномозкова блокада, що супроводжується артеріальною гіпотензією, порушенням дефекації, мимовільним сечовипусканням, імпотенцією та 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, проникає 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.

2 роки.

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

Несумісність.

Препарат небажано змішувати з іншими лікарськими засобами.

Лідокаїн випадає в осад при змішуванні з амфотерицином, метогекситоном або сульфадіазином. Залежно від рН розчину лідокаїн може бути несумісний з ампіциліном.

Упаковка. По 2 мл в ампулах поліетиленових. По 10, 50, 100 ампул в пачці із картону.

Категорія відпуску.

За рецептом.

Виробник.

ТОВ «НІКО».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

86123, Україна, Донецька обл., м. Макіївка, вул.Тайожна, 1-1.

Тел.: +38(062)341-46-41.

E-mail:office@nikopharm.com.ua