

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 - 100,0 мг

(в пересчете на лидокаина

гидрохлорид)

Вспомогательные вещества:

Натрия гидроксид - до pH 5,0 – 7,0

Вода для инъекций - до 1,0 мл

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: антиаритмическое средство.

Код АТХ: C01BB01.

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лидокаин по химической структуре относится к производным ацетанилида. Обладает выраженным антиаритмическим (Ib класс) действием.

Антиаритмические свойства лидокаина обусловлены его способностью стабилизировать клеточную мембрану, блокировать натриевые каналы, увеличивать проницаемость мембран для ионов калия. Практически не влияя на электрофизиологическое состояние предсердий, лидокаин ускоряет реполяризацию в желудочках, угнетает IV фазу деполяризации в волокнах Пуркинье (фаза диастолической деполяризации), уменьшая их автоматизм и продолжительность потенциала действия, увеличивает минимальную разность потенциалов, при которой миофибриллы реагируют на преждевременную стимуляцию. На скорость быстрой деполяризации (фаза 0) не влияет или незначительно снижает. Не оказывает существенного влияния на проводимость и сократимость миокарда (угнетает проводимость только в больших, близких к токсическим, дозах). Интервалы PQ, QRS и QT под его влиянием на электрокардиограмме (ЭКГ) не изменяются. Отрицательный инотропный эффект также выражен незначительно и проявляется кратковременно лишь при быстром введении препарата в больших дозах.

Фармакокинетика

Время достижения максимальной концентрации в плазме крови при медленной внутривенной инфузии без начальной насыщающей дозы – через 5-6 часов (у больных с острым инфарктом миокарда – до 10 ч). Белки плазмы крови связывают 50-80 % препарата. Быстро распределяется (период полувыведения фазы распределения – 6-9 минут) в органах и тканях с хорошей перфузией, в т.ч. в сердце, легких, печени, почках, затем в мышечной и жировой ткани.

Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, секретируется с материнским молоком (до 40 % от концентрации в плазме матери). Метаболизируется главным образом в печени (90-95 %) при участии микросомальных ферментов с образованием активных метаболитов – моноэтилглицилсилилидида и глицилсилилидида, имеющих период полувыведения 2 ч и 10 ч соответственно. Интенсивность метаболизма снижается при заболеваниях печени (может составлять от 50 до 10 % от нормальной величины); при нарушении перфузии печени у пациентов после инфаркта миокарда и/или с застойной сердечной недостаточностью. Период полувыведения при непрерывной инфузии в течение 24-48 ч – около 3 ч; при нарушении функции почек – может увеличиваться в 2 и более раз. Выводится с желчью и мочой (до 10 % в неизменном виде). Подкисление мочи способствует увеличению выведения лидокаина.

Показания к применению

Профилактика повторной фибрилляции желудочков при остром коронарном синдроме и повторных пароксизмов желудочковой тахикардии (обычно в течение 12-24 ч). Желудочковые аритмии, обусловленные гликозидной интоксикацией.

Противопоказания

Повышенная чувствительность к лидокаину или компонентам препарата; повышенная чувствительность к другим анестетикам амидного типа, в т.ч. в анамнезе; синдром слабости синусового узла; выраженная брадикардия; атриовентрикулярная блокада II-III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков); синоатриальная блокада; синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта; острая и хроническая сердечная недостаточность (III-IV функциональный класс); кардиогенный шок; выраженное снижение артериального давления; синдром Адамса-Стокса; нарушения внутрижелудочковой проводимости; детский возраст до 18 лет.

С осторожностью

Лидокаин следует применять с осторожностью при заболевании почек и печени, тяжелой миастении, хронической сердечной недостаточности II-III стадии, гиповолемии, синусовой брадикардии, нарушениях атриовентрикулярной и внутрижелудочковой проводимости, угнетении дыхания, порфирии (показано,

что лидокаин может вызывать порфирию у животных), судорожных расстройствах (в том числе в анамнезе), у тяжелобольных, ослабленных и пожилых (старше 65 лет) людей, в третьем семестре беременности.

У пациентов с синдромом Мелькерссона-Розенталя в ответ на введение лидокаина могут чаще развиваться аллергические реакции и токсические реакции со стороны центральной нервной системы.

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Применять лидокаин во время беременности и в период грудного вскармливания возможно, если ожидаемая польза для матери превышает потенциальный риск для плода и новорожденного. Необходимо строго придерживаться назначенного режима дозирования.

Контролируемые исследования применения лидокаина у беременных не проводились.

Клинический опыт применения свидетельствует об отсутствии тератогенных эффектов лидокаина. Лидокаин быстро проникает через плаценту. У новорожденных с высокими плазменными концентрациями лидокаина может наблюдаться угнетение ЦНС и, соответственно, снижение баллов по шкале Апгар. В грудное молоко лидокаин проникает в небольших количествах, и его пероральная биодоступность крайне низка, поэтому при использовании терапевтических доз лидокаина риск развития у младенца нежелательных явлений минимален.

Способ применения и дозы

Препарат предназначен только для внутривенного введения

В качестве антиаритмического средства лидокаин применяется внутривенно, используется раствор лидокаина 100 мг/мл. Перед применением 25 мл раствора 100 мг/мл следует развести 100 мл физиологического раствора до концентрации лидокаина 20 мг/мл. Этот разведенный раствор используют для введения нагрузочной дозы. Введение начинается с нагрузочной дозы 1 мг/кг (в течение 2-4 мин со скоростью 25-50 мг/мин) с немедленным подключением постоянной инфузии со скоростью 1-4 мг/мин. Вследствие быстрого распределения (период полувыведения приблизительно 8 мин) через 10-20 минут после введения первой дозы происходит снижение концентрации препарата в плазме крови, что может потребовать повторного болюсного введения (на фоне постоянной инфузии) в дозе, равной 1/2-1/3 нагрузочной дозы, с интервалом 8-10 минут. Максимальная доза в 1 час – 300 мг, в сутки – 2000 мг. Внутривенную инфузию обычно проводят в течение 12-24 часов с постоянным ЭКГ-мониторированием, после чего инфузию прекращают, чтобы оценить необходимость изменения антиаритмической терапии у пациента.

Побочное действие

Нежелательные реакции описаны в соответствии с системно-органными классами MedDRA.

Нарушения со стороны иммунной системы

Аллергические и анафилактикоидные реакции (кожная сыпь, крапивница на коже и слизистых оболочках, кожный зуд, ангионевротический отек), анафилактикоидный шок. См. также нарушения со стороны кожи и подкожных тканей. Кожная аллергическая проба на лидокаин считается ненадежной.

Нарушения со стороны нервной системы и психические расстройства

Головная боль, головокружение, слабость, двигательное беспокойство, нервозность, нистагм, онемение языка, сонливость, зрительные и слуховые нарушения, тремор, параоральные парестезии, спутанность или потеря сознания, судороги (риск их развития повышается на фоне гиперкапнии и ацидоза), кома, паралич дыхательных мышц, блок моторный и чувствительный, дыхательная недостаточность, остановка дыхания, респираторный паралич.

Нарушения со стороны органа зрения

Затуманенное зрение, диплопия и преходящий амвроз, нистагм.

Нарушения со стороны органа слуха и лабиринта

Шум в ушах, гиперacusia.

Нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы

Повышение или снижение артериального давления, брадикардия, при введении с вазоконстриктором – тахикардия, периферическая вазодилатация, коллапс, сердечная недостаточность (из-за отрицательного инотропного эффекта), аритмия, остановка сердца, боль в грудной клетке.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки средостения

Одышка, бронхоспазм, угнетение дыхания, остановка дыхания.

Нарушения со стороны желудочно-кишечного тракта

Тошнота, рвота, непроизвольная дефекация.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей

Сыпь, крапивница, ангионевротический отек, отек лица.

Нарушения со стороны мочевыделительной системы

Непроизвольное мочеиспускание.

Нарушения со стороны крови

Метгемоглобинемия.

Прочие

Снижение либидо и/или потенции, гипотермия.

Передозировка

Симптомы

Первые признаки интоксикации – головокружение, тошнота, дурнота, рвота, эйфория, циркуморальные парестезии (парестезии вокруг рта), нечувствительность языка, гиперкузия, звон в ушах; в более тяжелых случаях развиваются зрительные расстройства, мышечная дрожь или фибриллярные подергивания мышц, которые могут переходить в генерализованные тонико-клонические судороги с потерей сознания, психомоторное возбуждение, астения, гипоксия и гиперкапния, апноэ, гипотония, брадикардия, аритмия, остановка сердца; метгемоглобинемия; при использовании при родах у новорожденного – брадикардия, угнетение дыхательного центра, апноэ. Ацидоз усиливает токсические эффекты лидокаина.

Лечение

При появлении симптомов передозировки введение лидокаина должно быть немедленно прекращено. Пациент должен находиться в горизонтальном положении. Назначаются ингаляции кислорода, при необходимости – в сочетании со вспомогательной вентиляцией легких, с целью поддержания гемодинамики – инфузионная терапия, при необходимости могут применяться вазопрессоры (норэпинефрин, фенилэфрин), хотя это увеличивает риск развития возбуждения ЦНС, при брадикардии – м-холиноблокаторы (атропин). Для купирования судорог вводят внутривенно диазепам 0,1 мг/кг или тиопентал натрия 1-3 мг/кг. При остановке дыхания и кровообращения проводится стандартная сердечно-легочная реанимация. Аналептики центрального действия противопоказаны. Диализ неэффективен.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Токсичность лидокаина увеличивается при совместном назначении с циметидином, что требует снижения дозы лидокаина. При внутривенном введении лидокаина больным, принимающим циметидин, возможны такие нежелательные эффекты, как состояние оглушенности, сонливости, брадикардия, парестезии и др. Это связано с повышением уровня лидокаина в плазме крови, что объясняется высвобождением лидокаина из связи с белками крови, а также замедлением его инактивации в печени.

Ранитидин, дилтиазем, верапамил, пропранолол и другие β-блокаторы уменьшают клиренс лидокаина и могут приводить к увеличению его концентрации в крови, когда лидокаин применяется неоднократно в высоких дозах в течение длительного периода времени. Противовирусные средства (например, ампренавив, атазанавир, дарунавир, лопинавир) могут приводить к повышению сывороточных концентраций лидокаина. Гипокалиемия, вызываемая диуретиками, может снижать эффективность лидокаина при их совместном применении.

Лидокаин следует с осторожностью применять у пациентов, получающих средства, структурно сходные с местными анестетиками амидного типа (например, антиаритмиками, такими как мексилетин, токанид) из-за возможности потенцирования системных токсических эффектов. Отдельных исследований лекарственного взаимодействия лидокаина и антиаритмиков III класса не проводилось. Однако рекомендуется соблюдать осторожность при их совместном назначении.

Совместное применение лидокаина и антипсихотических препаратов, удлиняющих или способных удлинять интервал QT (например, пимозид, сертиндол, оланзапин, кветиапин, зотепин), прениламина, адреналина (при случайном внутривенном введении) или антагонистов 5-HT₂-серотониновых рецепторов (например, тропisetрон, доласетрон) может приводить к повышению риска желудочковых аритмий.

Следует избегать одновременного применения лидокаина и хинупристина или дальфопристина, так как последние могут приводить к увеличению концентрации лидокаина в крови и повышать таким образом риск желудочковых аритмий.

Одновременное применение прочих антиаритмиков, β-адреноблокаторов и блокаторов «медленных» кальциевых каналов может дополнительно ухудшать атриоventрикулярную проводимость, внутрижелудочковую проводимость и сократимость миокарда.

Одновременное применение лидокаина и алкалоидов спорыньи (например, эрготамина) может приводить к развитию тяжелой артериальной гипотензии.

Этиловый спирт, особенно при длительном злоупотреблении, может уменьшать эффективность лидокаина. Имеются сообщения о развитии сердечно-сосудистой недостаточности после применения бупивакаина у пациентов, получавших верапамил и тимолол; лидокаин близок по структуре к бупивакаину.

При совместном применении лидокаина и допамина, 5-гидрокситриптамина, а также опиоидных наркотических анальгетиков (фентанила) снижается порог судорожной готовности. Комбинация опиоидов и противорвотных средств, иногда применяемая в целях седации у детей, может снизить судорожный порог и усилить угнетающее действие лидокаина на ЦНС.

Аймалин, амиодарон, верапамил и хинидин усиливают отрицательный инотропный эффект лидокаина.

Индукторы микросомальных ферментов печени (барбитураты, фенитоин, рифампицин) снижают эффективность лидокаина, что может потребовать увеличение его дозы. В то же время, внутривенное введение фенитоина может усилить отрицательное инотропное действие лидокаина.

Совместное применение лидокаина с прокаинамидом может вызвать возбуждение центральной нервной системы, галлюцинации.

Больным, принимающим ингибиторы моноаминоксидазы, не следует назначать лидокаин парентерально.

При одновременном назначении лидокаина и полимиксина-В необходимо следить за функцией дыхания больного.

При сочетанном применении лидокаина со снотворными или седативными средствами, наркотическими анальгетиками, гексеналом или тиопенталом натрия возможно усиление угнетающего действия на центральную нервную систему и дыхание.

Лидокаин усиливает и удлиняет действие миорелаксантов; снижает кардиотонический эффект дигитоксина; снижает эффект антимастенических средств (прозерин, оксазил и др.). При совместном применении с гепарином, нестероидными противовоспалительными препаратами или плазмозаместителями повышает склонность к кровотечениям.

Лидокаин не совместим с амфотерицином В, метогекситоном и нитроглицерином.

Смешивать лидокаин с другими лекарственными препаратами не рекомендуется.

Особые указания

ПРЕПАРАТ, КОТОРЫЙ ВЫ ДЕРЖИТЕ В РУКАХ, ПРЕДНАЗНАЧЕН ТОЛЬКО ДЛЯ ВНУТРИВЕННОГО ВВЕДЕНИЯ!

Перед началом внутривенного введения лидокаина необходимо устранить гипокалиемию, гипоксию и нарушения кислотно-основного состояния.

За пациентами, принимающими антиаритмические препараты III класса (например, амиодарон) при назначении лидокаина необходимо тщательное наблюдение, включающее ЭКГ-мониторинг, так как возможно потенцирование кардиотропных эффектов.

Раствор лидокаина для инъекций не рекомендуется применять у новорожденных. Оптимальная концентрация лидокаина в крови, позволяющая избежать таких токсических проявлений как судороги и нарушения ритма сердца, у новорожденных не установлена.

Возможное влияние на способность управлять транспортными средствами и другими механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 100 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