

## **Состав**

*действующее вещество:* lidocain;

1 мл раствора содержит гидрохлорида лидокаина 20 мг;

*другие составляющие:* натрия хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Раствор для инъекций.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачный, бесцветный или слегка окрашенный раствор.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Препараты местной анестезии. Лидокаин. Код АТХ N01B B02.

## **Фармакодинамика**

Производное ацетанилида. Местноанестезирующее средство, оказывающее терминальную, инфильтрационную, проводниковую анестезию. Относительная токсичность гидрохлорида лидокаина зависит от концентрации раствора. В малых концентрациях (0,5%) он существенно не отличается по токсичности новокаина, с увеличением концентрации (1% и 2%) токсичность повышается (40-50%).

## **Фармакокинетика**

При местном применении на слизистых лидокаин всасывается в разной степени, в зависимости от дозы и места нанесения ( $C_{max}$  достигается через 10-20 минут); на всасывание влияет скорость перфузии в слизистую. При внутримышечном введении  $C_{max}$  достигается через 5-15 минут. Связывание с белками плазмы крови – 60-80% (в зависимости от дозы). Легко проходит через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический. Сначала поступает в ткани с хорошим кровоснабжением (сердце, легкие, мозг, печень, селезенка), затем – в жировую и мышечную ткани. Проникает через плаценту, в организме новорожденного выявляется 40-55% концентрации препарата, примененного роженицы.

Метаболизируется на 90% в печени путем окислительного N-дезалкилирования с образованием активных метаболитов: моноэтилглицинксилидина и

глицинксидина, имеющих  $T_{1/2}$  2 часа и 10 часов соответственно. Обладает эффектом «первого прохождения».

При нарушении функции печени  $T_{1/2}$  может возрасти более чем в 2 раза. В неизменном виде с мочой выводится 5-20%.

## **Показания**

Местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, офтальмологии, стоматологии, оториноларингологии; блокада периферических нервов и нервных сплетений при разных болевых синдромах.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к компонентам препарата/других амидных местноанестезирующих средств, наличие в анамнезе эпилептиформных судорог на лидокаин, тяжелая брадикардия, тяжелая артериальная гипотензия, кардиогенный шок, тяжелые формы хронической сердечной недостаточности (II-III степени); синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса, атриовентрикулярная (AV) блокада II и III степени, гиповолемия, тяжелые нарушения функции печени/почек, порфирия, миастения, ретробульбарное введение больным глаукомой.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

При комбинированном применении лидокаина с такими препаратами как хлорпромазин, петидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, амитриптилин, имипрамин, нортриптилин, концентрация лидокаина в плазме крови снижается.

Антиаритмические препараты (в т. ч. амиодарон, верапамил, хинидин, дизопирамид, аймалин) – усиливается кардиодепрессивное действие (происходит удлинение интервала QT и, в очень редких случаях, возможно развитие AV-блокады или фибрилляции желудочков); одновременное применение с амиодароном может привести к развитию судорог.

Новокаин, новокаинамид, прокаинамид – возможно возбуждение ЦНС, бред, галлюцинации.

Курареподобные препараты – усиливается миорелаксация (возможен паралич дыхательных мышц).

Этанол усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) способствуют замедлению всасывания лидокаина и пролонгируют действие последнего.

Циметидин снижает печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма в результате ингибирования микросомального окисления), повышает его концентрацию и риск развития токсических эффектов.

Гуанадрель, гуанетидин, мекамиламин, триметафан – при комбинированном применении для спинальной и эпидуральной анестезии повышается риск выраженной артериальной гипотензии и брадикардии.

$\beta$ -адреноблокаторы замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливают эффекты лидокаина (в т.ч. токсичные) и повышают риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении  $\beta$ -адреноблокаторов и лидокаина необходимо снизить дозу последнего.

Сердечные гликозиды – ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

Гликозиды наперстянки – на фоне интоксикации лидокаин может усугублять тяжесть АВ-блокады.

Снотворные или седативные лекарственные средства – возможно усиление угнетающего действия на ЦНС снотворных и седативных препаратов.

Наркотические анальгетики (морфин и т.п.) – усиливается анальгезирующий эффект наркотических анальгетиков, угнетение дыхания.

Ингибиторы MAO (фуразолидон, прокарбазин, селегилин) – повышается риск развития артериальной гипотензии и пролонгируется местноанестезирующее действие последнего. В период лечения ингибиторами MAO не следует применять лидокаин парентерально.

Антикоагулянты (в т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароид, эноксапарин, гепарин, варфарин и др.) увеличивают риск развития кровотечений.

Средства для наркоза – усиливается угнетающее действие на дыхательный центр средств для наркоза (гексобарбитал, тиопентал натрия внутривенно).

Полимиксин В – необходимый контроль функции дыхания.

Рифампицин – возможное снижение концентрации последнего в крови.

Пропафенон – возможное увеличение продолжительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны ЦНС.

Прениламин – повышается риск развития желудочковой аритмии типа «пируэт».

Противосудорожные средства, барбитураты (фенобарбитал) – возможно ускорение метаболизма лидокаина в печени, снижение концентрации в крови, усиление кардиодепрессивного эффекта.

Изадрин, глюкагон – повышается клиренс лидокаина.

Норепинефрин, мексилетин – снижается клиренс лидокаина (усиливается токсичность); уменьшается печеночный кровоток.

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики уменьшают эффект лидокаина в результате гипокалиемии.

Мидазолам – повышается концентрация лидокаина в плазме крови.

Препараты, обуславливающие блокаду нервно-мышечной передачи – усиливается действие этих препаратов, поскольку они уменьшают проводимость нервных импульсов.

## **Особенности применения**

Введение лидокаина могут проводить только медицинские работники.

При обработке места инъекции дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, увеличивается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

При применении лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинения интервала PQ, расширения QRS или при развитии новой аритмии следует снизить дозу/отменить препарат.

Перед применением лидокаина при заболеваниях сердца (гипокалиемия снижает эффективность лидокаина) необходимо нормализовать уровень калия в крови.

Перед введением лидокаина в высоких дозах рекомендуется назначение барбитуратов.

При проведении планируемой субарахноидальной анестезии необходимо отменить ингибиторы MAO не менее чем за 10 дней до анестезии.

Следует соблюдать осторожность во избежание случайного интравазального (особенно при проведении местной анестезии у участков, содержащих много кровеносных сосудов) или субдурального введения препарата. Необходимо

установить тщательный контроль за системным токсическим действием препарата на сердечно-сосудистое и ЦНС (поскольку дозы, предназначенные для эпидуральной анестезии, всегда выше, чем для субдуральной). При введении в васкуляризованные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при анестезии околопозвоночного отдела у больных с неврологическими заболеваниями, деформацией позвоночника, септицемией.

Меньшие дозы препарата следует вводить в область головы и шеи, включая ретробульбарное и стоматологическое введение, а также применение блокады звездчатого ганглия, поскольку системные токсические эффекты препарата через ретроградный поток могут проникнуть в мозговое кровообращение.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при ретробульбарном введении, поскольку возможны тяжелые побочные эффекты: коллапс, одышка, судороги, обратимая слепота.

Поскольку лидокаин оказывает выраженное антиаритмическое действие и может сам выступать как аритмогенный фактор, что может вызвать развитие аритмии, перед введением препарата необходимо собрать анамнез на факт наличия признаков аритмии и с осторожностью применять препарат лицам с жалобами на аритмии в прошлом.

С осторожностью и в меньших дозах применяют пациентам с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотензией умеренной степени, неполной AV-блокадой, нарушениями внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек умеренной степени (клиренс креатинина не менее 10 мл/мин эпилепсией, после операций на сердце, при генетической предрасположенности к злокачественной гипертермии, ослабленным больным и пациентам пожилого возраста.

При внутримышечном введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может вызвать ошибку при постановке диагноза острого инфаркта миокарда.

Это лекарственное средство содержит менее 1 ммоль (23 мг)/дозу натрия, то есть практически свободно от натрия.

**Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

После применения препарата не рекомендуется заниматься деятельностью, требующей скорости психомоторных реакций.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

В период беременности препарат противопоказан. При необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

### **Способ применения и дозы**

Препарат применяют инъекционно (подкожно, внутримышечно) и местно слизистые. Следует избегать внутрисосудистого введения препарата.

Для терминальной анестезии слизистые взрослым смазывают препаратом в дозе до 2 мг/кг лидокаина, продолжительность анестезии – 15-30 минут.

Максимальная доза для взрослых – 20 мл.

Для проводниковой анестезии (в т. ч. для обезболивания плечевого и крестцового сплетений) вводят 5-10 мл (100-200 мг лидокаина) препарата, для анестезии пальцев конечностей, носа, ушей – 2-3 мл (40-60 мг) препарата .

Максимальная доза для взрослых – 10 мл (200 мг).

Для анестезии в офтальмологии по 2 капли инстиллируют в конъюнктивальный мешок 2-3 раза с интервалом 30-60 секунд непосредственно перед исследованием или хирургическим вмешательством.

Детям старше 12 лет при всех видах периферического обезболивания общая доза лидокаина не должна превышать 3 мг/кг массы тела.

Для всех видов инъекционного обезболивания возможно сочетание лидокаина с эпинефрином (1:50000-1:100000; готовят *ex tempore*, добавляют 1 каплю 0,1% раствора эпинефрина на 5-10 мл раствора лидокаина 2%), за исключением случаев, когда системное действие, оказывает эпинефрин (адреналин), нежелательно – повышенная чувствительность к эпинефрину, артериальная гипертензия, сахарный диабет, глаукома или кратковременное анестезирующее действие. Эпинефрин способствует замедлению всасывания лидокаина и пролонгирует его действие.

### **Дети**

Препарат применяют детям от 12 лет.

### **Передозировка**

Возможно усиление побочных реакций.

Симптомы: психомоторное возбуждение, головокружение, общая слабость, снижение АД, тремор, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, АВ-блокада, асфиксия, апноэ. Первые симптомы передозировки у здоровых добровольцев возникают при концентрации лидокаина в крови более 0,006 мг/кг, судороги – при 0,01 мг/кг.

Лечение: прекращение введения препарата, оксигенотерапия, противосудорожные средства, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), холинолитики. Пациент должен находиться в горизонтальном положении; необходимо обеспечить доступ свежего воздуха, подачу кислорода и/или проведение искусственного дыхания. Симптомы со стороны ЦНС корректируются применением бензодиазепинов/барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применять кратковременный миорелаксант. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применяют атропин (0,5-1 мг внутривенно), при артериальной гипотензии – симпатомиметики в комбинации с агонистами  $\beta$ -адренорецепторов. При остановке сердца показано немедленное проведение реанимационных мероприятий. Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких. В острой фазе передозировки диализ неэффективен.

### **Побочные реакции**

*Со стороны нервной системы:* возбуждение ЦНС (при применении в высоких дозах), беспокойство, головная боль, головокружение, нарушение сна, спутанность сознания, сонливость, потеря сознания, запятая, нарушение чувствительности, онемение языка и губ (при применении в стоматологии), моторный блок; у пациентов с повышенной чувствительностью – эйфория, тремор, тризм, двигательное беспокойство, парестезии, судороги.

*Со стороны органов зрения:* нистагм, обратимая слепота, диплопия, мигание «мушек» перед глазами, светобоязнь, конъюнктивит.

*Со стороны органов слуха:* слуховые нарушения, шум в ушах, гиперacusia.

*Со стороны сердечно-сосудистой системы:* при применении в высоких дозах – аритмия, брадикардия, замедление проводимости сердца, поперечная блокада сердца, остановка сердечной деятельности, периферическая вазодилатация, коллапс; очень редко – тахикардия, повышение/снижение АД, боль в сердце.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота.

*Со стороны дыхательной системы:* одышка, ринит, угнетение или остановка дыхания.

*Аллергические реакции:* крайне редко - кожная сыпь, крапивница, зуд, генерализованный эксфолиативный дерматит, ангионевротический отек, анафилактические реакции (в т. ч. анафилактический шок).

*Другие:* ощущение жара, холода или онемения конечностей, отеки, слабость, злокачественная гипертермия.

*Местные реакции:* ощущение легкого жжения, которое исчезает с ростом анестезирующего эффекта (в течение 1 минуты), гиперемия. При спинальной или эпидуральной анестезии может наблюдаться боль в спине, ногах, частичная/полная спинномозговая блокада, сопровождающаяся снижением артериального давления, нарушением дефекации, самопроизвольным мочеиспусканием, импотенцией, потерей чувствительности в области промежности (возможность этих эффектов случайного введения лидокаина в спинномозговое пространство, когда доза, предназначенная для введения в эпидуральное пространство, попадает в спинномозговое пространство); в отдельных случаях после такого вмешательства восстановление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или в полной мере.

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25°C. Хранить в недоступном для детей месте.

### *Несовместимость*

Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одном шприце. Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогекситоном или сульфадиазином. В зависимости от рН раствора лидокаин может быть несовместим с ампициллином.

### **Упаковка**

По 2 мл в ампулах №10 в блистере в коробке.



**Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

Общество с ограниченной ответственностью «Фармацевтическая компания Здоровье».

**Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Украина, 61013, Харьковская обл., город Харьков, улица Шевченко, дом 22.

**Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).