

Состав

действующее вещество: лидокаина гидрохлорид;

1 мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида, в перерасчете на безводное вещество 20 мг;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, вода для инъекций.

Лекарственная форма

Раствор для инъекций.

Основные физико-химические свойства: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа

Препараты для местной анестезии. Амиды. Лидокаин.

Код АТХ N01B B02.

Фармакодинамика

Лидокаин – местноанестезирующее средство. Местноанестезирующее действие предопределено стабилизацией нейрональной мембраны за счет снижения ее проницаемости для ионов натрия, который препятствует возникновению потенциала действия и проведению нервных импульсов. Возможен антагонизм с ионами кальция. Эффективен для всех видов местной анестезии. Подавляет проведение не только болевых импульсов, но и импульсов другой модальности. Быстро гидролизруется в слабощелочной среде тканей и после короткого латентного периода действует в течение 1-1,5 часа. Анестезирующее действие лидокаина в 2-6 раза сильнее, чем прокаина. При воспалении анестезирующая активность снижается. При местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Фармакокинетика

При внутримышечном введении максимальная концентрация в крови достигается через 5-15 минут. В плазме связывается с белками крови на 33-80%. Степень связывания в значительной степени зависит от концентрации препарата и содержащего альфа-1-ацидгликопротеина в плазме крови. Связывание с

белками плазмы увеличивается у пациентов с уремией и реципиентов почечной трансплантации и усиливается после острого инфаркта миокарда, который характеризуется увеличением уровня альфа-1-ацидгликопротеина. Высокое связывание с белками может уменьшать действие свободного лидокаина или вызывать общее повышение концентрации препарата в плазме крови.

Терапевтический эффект развивается при концентрации 1,5-5 мкг/мл. Быстро распределяется в тканях, объем распределения представляет 1 л/кг. Сначала приходит в ткани с высоким темпом кровоснабжения: сердце, мозг, почки, легкие, печень, селезенка, потом – в жировую и мышечную ткани. Легко проникает через гистогематические барьеры, включая гематоэнцефалический и плацентарный. В организме новорожденного обнаруживается 40-55% от концентрации препарата в организме матери. Метаболизируется в печени при участии микросомальных ферментов с образованием метаболитов: моноэтилглицинексилидида и глицинексилидида. Скорость метаболизма определяется кровотоком в печени и, как результат, может быть нарушена у пациентов после инфаркта миокарда и/или у пациентов с застойной сердечной недостаточностью. Выводится из организма почками в форме метаболитов (около 90%) и в неизмененном виде (10%). Вывод неизмененном виде с мочой частично зависит от pH мочи. Кислая моча приводит к увеличению доли, выведенной с мочой. Период полувыведения после внутривенного болюсного введения – 1,5-2 часа. Период полувыведения метаболитов составляет 2 и 10 часов соответственно. При нарушении функции печени период полувыведения может возрасть.

Показания

Местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, офтальмологии, стоматологии, оториноларингологии; в качестве растворителя антибактериальных средств группы цефалоспоринов.

Противопоказания

Индивидуальная повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также к другим амидным местно-анестезирующим лекарственным средствам; наличие в анамнезе эпилептиформных судорог, связанных с введением лидокаина гидрохлорида; AV- блокада II и III степени; синдром слабости синусового узла; синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта; синдром Адамса-Стокса; тяжелые формы сердечной недостаточности (II-III степени); выраженная артериальная гипотензия; брадикардия; кардиогенный шок; миастения; гиповолемия; порфирия; тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность; ретробульбарное введение больным с глаукомой; нарушения свертывания крови,

антикоагулянтная терапия; инфекции в месте инъекции; неконтактные пациенты.

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, в редких случаях возможно развитие AV-блокады или фибрилляции желудочков); одновременное применение с амиодароном может привести к развитию судорог.

Новокаин, новокаинамид, прокаинамид – возможно возбуждение центральной нервной системы, 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 вследствие 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.

β -адреноблокаторы замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливают эффекты лидокаина (в т. ч. токсические) и повышают риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении β -адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшить дозу последнего.

Сердечные гликозиды – ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

Гликозиды наперстянки – на фоне интоксикации лидокаин может усиливать тяжесть AV-блокады.

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

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

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

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

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

Полимиксин В – необходим контроль функции дыхания.

Рифампицин – возможно снижение концентрации последнего в крови.

Пропafenон – возможно 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.

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

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

Мидазолам – повышается концентрация лидокаина в плазме крови.

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

Норадреналин – имеет синергический эффект при взаимодействии с лидокаином.

При ацидозе концентрация свободного лидокаина в плазме крови увеличивается и имеется риск развития токсических эффектов.

Лекарственные средства, влияющие на печеночный метаболизм и микросомальную индукцию ферментов (например, фенитоин), могут снижать эффективность лидокаина.

При одновременном применении миорелаксантов (например, суксаметоний) может быть синергический эффект.

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

Особенности применения

Введение лидокаина могут проводить только медицинские работники.

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

При применении лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинения интервала P-Q, расширения QRS или при развитии новой аритмии следует уменьшить дозу или 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 плановой субарахноидальной анестезии необходимо отменить ингибиторы MAO не позднее, чем за 10 дней до проведения анестезии.

Следует соблюдать осторожность, чтобы избежать случайного интравазального (особенно при проведении местной анестезии в участки, содержащие много кровеносных сосудов) или субдурального введения препарата. Необходимо

установить строгий контроль за системным токсическим действием препарата на сердечно-сосудистую и центральную нервную системы (поскольку дозы, предназначенные для эпидуральной анестезии, всегда выше, чем для субдуральной); при введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при анестезии вокруг позвоночного отдела для больных с неврологическими заболеваниями, деформацией позвоночника, септицемией и тяжелой артериальной гипертензией.

Меньшие дозы следует вводить в область головы и шеи, включая ретробульбарное и стоматологическое введение, а также применение для 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 побочные эффекты: коллапс, одышка, судороги, обратимая слепота.

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

С осторожностью и в меньших дозах применять пациентам с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотензией умеренной степени, неполной AV-блокадой, нарушением внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек средней степени (клиренс креатинина не менее 10 мл/мин), нарушением функции дыхания, 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 привести к ошибке при постановке диагноза острого инфаркта миокарда.

При местной анестезии тканей с выраженной васкуляризацией (например, шеи в случае операции на щитовидной железе) следует соблюдать особую осторожность, чтобы избежать попадания препарата в сосуды.

Безопасность применения анестетиков группы амидов сомнительна у больных, склонных к злокачественной гипертермии, поэтому их применения в таких случаях следует избегать.

Следует соблюдать особую осторожность при применении лидокаина пациентам с недостаточностью кровообращения, гиповолемией, артериальной гипотензией, печеночной и почечной недостаточностью.

С осторожностью назначать пациентам с нарушениями центральной нервной системы, которые применяют наркотики, поскольку могут возникнуть внезапные побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы. При длительном применении необходимо мониторить уровень электролитов в крови. С осторожностью применять пациентам со склонностью к судорогам, в состоянии шока, при гипоксии.

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

Препарат влияет на функцию центральной нервной системы, поэтому после применения лидокаина не рекомендуется управлять автотранспортом или работать с другими механизмами.

Применение в период беременности или кормления грудью

Препарат проникает через плацентарный барьер и может вызвать брадикардию плода, поэтому его не рекомендуется назначать в период беременности. При необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

Способ применения и дозы

Препарат применять инъекционно (подкожно, внутримышечно) и местно на слизистые оболочки.

Следует избегать внутрисосудистого введения препарата.

Введение лидокаина предусматривает проведение пробы для определения индивидуальной чувствительности к этому лекарственному средству.

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

Максимальная доза препарата для взрослых – 20 мл.

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

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

Вмешательство	Лидокаин		
	Концентрация	Объем	Общая доза
<i>Инфильтрация:</i>			
Через кожу	5 мг/мл (0,5%) або 10 мг/мл (1%)	1-60 мл	5-300 мг
Внутривенно	5 мг/мл (0,5%)	10-60 мл	50-300 мг
<i>Блокада периферических нервов:</i>			
Плечевого сплетения	15 мг/мл (1,5%)	15-20 мл	225-300 мг
Стоматология	20 мг/мл (2%)	1-5 мл	20-100 мг
Межреберная	10 мг/мл (1%)	3 мл	30 мг
Паравертебральная	10 мг/мл (1%)	3-5 мл	30-50 мг
Мочевыделительная система	10 мг/мл (1%)	10 мл	100 мг
<i>Парацервикально:</i>			
Анестезия в акушерстве	10 мг/мл (1%)	10 мл	100 мг
<i>Симпатическая нервная блокада:</i>			
Цервикально	10 мг/мл (1%)	5 мл	50 мг
Люмбально	10 мг/мл (1%)	5-10 мл	50-100 мг
<i>Блокада центральной нервной системы:</i>			
Эпидурально*	10 мг/мл (1%)	20-30 мл	200-300 мг
Люмбально:	10 мг/мл (1%)	25-30 мл	250-300 мг
Обезболивание	15 мг/мл (1,5%)	15-20 мл	225-300 мг
Анестезия	20 мг/мл (2%)	10-15 мл	200-300 мг
<i>Каудальная анестезия:</i>			

Обезболивание в акушерстве	10 мг/мл (1%)	20-30 мл	200-300 мг
Обезболивание в хирургии	15 мг/мл (1,5%)	15-20 мл	225-300мг
* Доза зависит от количества дерматомов (участков кожи), требующих анестезии (2-3 мл/дерматом)			

Дети и подростки.

Детям назначать самую низкую общую дозу в соответствии с массой тела и в большем разведении (0,5%; 0,1%). Максимальная разовая доза лидокаина – 3 мг/кг массы тела.

Максимальную разовую дозу нельзя применять при повторном введении в течение 24 часов.

Детям до 3-х лет максимальная доза составляет 1,25 мл, в том числе и детям с нарушением функции почек. В течение 24 часов доза должна составлять не более 4-х доз.

Недостаточно данных относительно длительного применения 2% лидокаина местно детям до 3-х лет, препарат следует применять крайне осторожно в зависимости от массы тела ребенка.

Максимальная дозировка детям до 3-х лет – не более 1,25 мл местно на тампоне каждые 3 часа, или 10 мл в течение 24 часов. Детям от 3 лет доза составляет 5

мл. Детям до 12 лет при воспалении глотки и ротовой полости необходимо учитывать возраст ребенка, вес и способ введения препарата (площадь тела при нанесении в виде мягких лекарственных форм). Применение препарата детям осуществляется после получения согласия родителей.

Препарат местно не применять повторно в течение 2-х часов после применения.

Дети

Применение детям – см. раздел «Способ применения и дозы».

Передозировка

Возможно усиление побочных реакций.

Симптомы: психомоторное возбуждение, головокружение, общая слабость, снижение артериального давления, тремор, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, АВ-блокада, асфиксия, апноэ, депрессия, сонливость, тревожность, звон в ушах. При значительной передозировке возможно нарушение сознания, угнетение дыхания, шок, инфаркт миокарда. Первые симптомы передозировки возникают при концентрации лидокаина в крови больше 0,006 мг/кг, судороги – при 0,01 мг/кг.

Лечение: прекращение введения препарата, оксигенотерапия, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), протисудомни средства, холинолитики. Пациенту следует находиться в горизонтальном положении; необходимо обеспечить доступ свежего воздуха, подачу кислорода и/или проведение искусственного дыхания. Симптомы со стороны центральной нервной системы корректируются применением бензодиазепинов или барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применять миорелаксант с кратковременным действием. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применяют атропин (0,5-1 мг внутривенно), при артериальной гипотензии – симпатомиметики в комбинации с агонистами β -адренорецепторов. При остановке сердца показано немедленное проведение реанимационных мероприятий. Возможно проведение интубации, искусственной вентиляции легких. В острой фазе передозировки лидокаином диализ не эффективен. Специфического антидота нет.

Побочные реакции

Со стороны нервной системы: возбуждение центральной нервной системы (при применении в высоких дозах), беспокойство, головная боль, головокружение, нарушение сна, спутанность сознания, сонливость, потеря сознания, кома,

нарушения чувствительности, мышечные подергивания, онемение языка и губ (при применении в стоматологии), моторный блок, дизартрия, дисфагия; стойкая анестезия, парез или элегия нижних конечностей и потеря управления сфинктером (например, синдром конского хвоста) покалывание кожи у пациентов с повышенной чувствительностью – эйфория, тремор, тризм, двигательное беспокойство, парестезии, судороги.

Психические расстройства: анорексия, раздражительность, неугомонность, галлюцинации, депрессии; после применения высоких доз – возбужденное состояние, эйфория.

Со стороны органов зрения: нарушение зрения, нистагм, обратимая слепота, диплопия, мелькание «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, тахикардия, повышение/снижение артериального давления, боль в области сердца.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

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

Со стороны иммунной системы: аллергические реакции, включая отек, кожные реакции, крапивница, зуд, ангионевротический отек, реакции гиперчувствительности, включая анафилактические реакции (в т.ч. анафилактический шок), генерализованный эксфолиативный дерматит; угнетение иммунной системы.

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

Местные реакции: реакции в месте введения, ощущение легкого жжения, исчезающего с нарастанием анестезирующего эффекта (в течение 1 минуты), гиперемия. При спинальной или эпидуральной анестезии может наблюдаться боль в спине, ногах, частичная/полная спинномозговая блокада, которая сопровождается снижением артериального давления, нарушением дефекации, непроизвольным мочеиспусканием, импотенцией, потерей чувствительности в области промежности (вероятность этих эффектов возрастает при применении высоких доз или в случае случайного введения лидокаина в спинномозговое

пространство, когда доза, предназначенная для введения в эпидуральное пространство, попадает в спинномозговое пространство); в отдельных случаях после такого вмешательства возобновление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или в неполной мере.

Срок годности

3 года.

Условия хранения

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

Упаковка

По 2 мл в ампуле, по 10 ампул в контурной ячейковой упаковке, по 1 контурной ячейковой упаковке в пачке.

Категория отпуска

По рецепту.

Производитель

ПАО «Галичфарм».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности

Украина, 79024, г. Львов, ул. Опрышковская, 6/8.

Источник инструкции

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