

## **Состав**

*діюча речовина:* lidocaine;

1 мл| розчину містить| лідокаїну гідрохлориду | 100 мг;

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

## **Лекарственная форма**

Раствор для инъекций.

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

## **Фармакотерапевтическая группа**

Средства для лечения заболеваний сердечно-сосудистой системы.  
Антиаритмические препараты Ib класса. Лидокаин. Код АТХ С01В В01.

## **Фармакодинамика**

Антиаритмическая активность препарата обусловлена угнетением фазы 4 (диастолической деполяризации) в волокнах Пуркинье, уменьшением автоматизма, подавлением эктопических ячеек возбуждения. При этом лидокаин подавляет электрическую активность деполяризованных, аритмогенных участков, но и минимально влияет на электрическую проводимость нормальных тканей. На скорость быстрой деполяризации (фаза 0) не влияет или снижает незначительно. Увеличивает проницаемость мембран для ионов калия, ускоряет процесс реполяризации клеточных мембран, сокращает продолжительность потенциала действия и эффективного рефрактерного периода.

При применении в средних терапевтических дозах практически не изменяет сократимости миокарда, не замедляет АВ-проводимость, не снижает значительно артериальное давление. При применении как антиаритмическое средство при внутривенном введении, начало действия развивается через 45-90 секунд, длится 10-20 минут, при введении действие развивается через 5-15 минут, продолжается 60-90 минут.

Имеет местноанестезирующую активность, обусловленную стабилизацией нейрональной мембраны, снижением ее проницаемости для ионов натрия, препятствует возникновению потенциала действия и проведению импульсов.

## **Фармакокинетика**

При внутривенном введении  $C_{max}$  достигается через 45-90 секунд, при внутримышечном через 5-15 минут. Связывание с белками плазмы крови - 60-80% (в зависимости от дозы). Стабильная концентрация в крови устанавливается через 3-4 часа при непрерывном введении у больных с острым инфарктом миокарда - через 8-10 часов. 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 оказывается 40-55% концентрации препарата, применяемого роженицей. Терапевтическая концентрация в крови в среднем составляет 0,0035 мг / мл |.

Метаболизируется на 90% в печени путем окислительного N-дезалкилирования с образованием активных метаболитов : моноэтилглицинксилидина и глицинксилидина, имеющих  $T_{1/2}$  2 часа и 10 часов соответственно. Имеет эффект «первого прохождения».

$T_{1/2}$  после внутривенного болезненного введения составляет 1,5-2 часа, при длительных внутривенных инфузиях - до 3 часов и более. При нарушении функции печени  $T_{1/2}$  может расти более, чем в 2 раза. В неизмененном виде с мочой выводится 5-20%.

## **Показания**

Желудочковые аритмии (экстрасистолия, тахикардия, трепетание, фибрилляция), в том числе в острый период инфаркта миокарда, при имплантации искусственного водителя ритма, гликозидной интоксикации, наркозе.

## **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 слабости синусового узла, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса, AV (AV) блокада II и III степени;
- гиповолемия, тяжелые нарушение функции печени / почек;
- порфирия , миастения.

## **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 (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* - возможное возбуждение ЦНС, галлюцинации.

*Курареподобные препараты* - усиливается миорелаксация (возможен паралич дыхательных мышц).

*Этанол* усиливает угнетающее действие лидокаина на дыхание.

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

*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 кардиотоническое эффект сердечных гликозидов.

*Гликозиды наперстянки* - на фоне интоксикации лидокаин может усугублять тяжесть AV-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 МАО (фуразолидон, прокарбазин, селегилин)* - повышается риск развития артериальной гипотензии.

*Антикоагулянты (ардепарин, далтепарин, данапароидом, эноксапарин, гепарин, варфарин и т.д.)* 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.

*Пропафенон* - 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 возникновения 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 осуществлять только медицинские работники.

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

Во время лечения необходим ЭКГ-мониторинг. При синусовой дисфункции, удлинении интервала PQ, расширении QRS или новой аритмии следует уменьшить дозу препарата или прекратить лечение.

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

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

В период лечения ингибиторами MAO не следует применять лидокаин парентерально.

При введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может привести к ошибке при постановке диагноза острого инфаркта миокарда.

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

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

После применения лидокаина не рекомендуется заниматься видами деятельности, требующими быстроты 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**

Назначают внутримышечно, внутривенно струйно, внутривенно капельно.

Раствор лидокаина 10% вводят внутримышечно в ягодичную или дельтовидную мышцу. Взрослым вводят 10% раствор в дозе 2-4 мг / кг (максимальная разовая доза - не более 200 мг (2 мл) с интервалом 4-6 часов.

Детям введение не рекомендуется.

Для струйного введения применяют 10% раствор лидокаина, разведенный в концентрации 20 мг / мл стерильным 0,9% раствором натрия хлорида или 5% раствором глюкозы.

Для внутривенного капельного введения применяют раствор, содержащий 2 мг лидокаина в 1 мл: для этого 2 мл (1 ампула) препарата разбавляют в 100 мл стерильного 0,9% раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. Общее количество вводимого раствора взрослым внутривенно капельно в сутки - не более 1200 мл. Инфузию проводят под постоянным ЭКГ-мониторингом.

Взрослым назначают при введении нагрузочной дозы внутривенно струйно 0,5-2 мг / кг в течение 3-4 минут, средняя разовая доза - 80 мг, максимальная разовая доза - 100 мг. Затем сразу переходят на капельную инфузию со скоростью 0,02-0,055 мг / кг / мин (максимальная скорость - 2 мг / мин) в 0,9% растворе натрия хлорида или в 5% растворе глюкозы (до капельного введения переходят только после струйного). Капельную инфузию можно проводить в течение 24-36 часов (до улучшения состояния пациента); продолжительность инфузии зависит от состояния пациента и результатов применения препарата.

При введении более 24 часов необходимо уменьшить скорость инфузии. При необходимости на фоне капельной инфузии можно повторить внутривенное струйное введение лидокаина в дозе 40 мг через 10 минут после первой дозы нагрузки.

Максимальная доза при внутривенном введении нагрузочной дозы - 100 мг, при следующей капельной инфузии - 300 мг (4,5 мг / кг) по 1:00.

Пациентам пожилого возраста дозу снижают на 1/3.

При инфаркте миокарда до госпитализации как разовую профилактическую дозу вводят обычно 4 мг / кг массы тела однократно (максимально - 200-300 мг (2-3 мл 10% раствора)).

*Детям старше 12 лет при аритмиях* назначают только при острой необходимости с особой осторожностью; препарат растворяют так же, как для взрослых. Вводят внутривенно струйно дозу нагрузки 1 мг / кг в течение 5-10 минут, в случае необходимости возможно повторное введение через 5 минут (суммарная доза не должна превышать 3 мг / кг). Для непрерывной инфузии (обычно после ввода нагрузочной дозы) - 0,02-0,03 мг / кг / мин. Максимальная доза для детей в случае повторного ввода нагрузочной дозы с интервалом 5 минут - 3 мг / кг; при непрерывной инфузии (обычно после ввода нагрузочной

дозы) - 0,05 мг / кг / мин. Максимальная суточная доза для детей - 4 мг / кг.

## **Дети**

Препарат назначают детям в возрасте от 12 лет.

## **Передозировка**

Возможно усиление побочных реакций.

*Симптомы:* психомоторное возбуждение, головокружение, общая слабость, снижение артериального давления, тремор, нарушение зрения, тонико-клонические судороги, кома, коллапс, AV-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 короткое миорелаксант. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применяют атропин (0,5-1 мг), 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. Специфического антидота нет.

## **Побочные реакции**

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

*Со стороны органов зрения:* нистагм, обратная слепота, диплопия, беспокойство, 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; очень редко - тахикардия, повышение / понижение артериального давления, боли в сердце.

*Со стороны пищеварительной системы:* тошнота, рвота.

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

*Аллергические реакции:* очень редко - кожные высыпания, крапивница, зуд, генерализованный эксфолиативный дерматит, ангионевротический отек, анафилактические реакции (анафилактический шок).

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

*Местные реакции:* ощущение легкого жжения, исчезающее с ростом анестезирующего эффекта (в течение 1 минуты), гиперемия.

### **Срок годности**

3 года.

### **Условия хранения**

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

### **Упаковка**

По 2 мл в ампулах, по 10 ампул в картонной пачке.

### **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 Шевченка, дом 22.

**Источник инструкции**

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