ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКАЇН-ЗДОРОВ’Я

Склад:

діюча речовина: lidocaine;

1 мл розчину містить лідокаїну гідрохлориду 20 мг;

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

Лікарська форма. Розчин для ін’єкцій.

Основні фізико-хімічні|фізико-хімічні| властивості: прозорий безбарвний або злегка забарвлений розчин.

Фармакотерапевтична група. Препарати для місцевої анестезії. Лідокаїн. Код АТХ N01B B02.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Похідне ацетаніліду. Місцевоанестезуючий засіб, що чинить термінальну, інфільтраційну, провідникову анестезії. Відносна токсичність лідокаїну гідрохлориду залежить від концентрації розчину. У малих концентраціях (0,5 %) він суттєво не відрізняється за токсичністю від новокаїну, зі збільшенням концентрації (1 % і 2 %) токсичність підвищується (40-50 %).

Фармакокінетика. При місцевому застосуванні на слизових оболонках лідокаїн всмоктується різною мірою, залежно від дози і місця нанесення (C_{max} досягається через 10-20 хвилин); на всмоктування впливає швидкість перфузії у слизову оболонку. При внутрішньом’язовому введенні|вступі| C_{max} досягається через 5-15 хвилин. Зв’язування|зв'язування| з|із| білками плазми крові – 60-80 % (залежно від дози). Легко проходить через гістогематичні бар’єри, включаючи гематоенцефалічний|. Спочатку надходить|надходить| у тканини з добрим кровопостачанням| (серце, легені, мозок, печінка, селезінка), потім – у жирову і м’язову тканини. Проникає через плаценту, в організмі новонародженого виявляється 40-55 % концентрації препарату, застосованого породіллі.

Метаболізується на 90 % у печінці шляхом окиснювального N-дезалкілування з утворенням активних метаболітів: моноетилгліцинксилідину і гліцинксилідину, що мають $T_{½}$ 2 години і 10 годин відповідно. Має ефект «першого проходження».

При порушенні функції печінки $T_{½}$ може зростати більш ніж у 2 рази. У незміненому

вигляді|виді| із|із| сечею виводиться 5-20 %.

Клінічні характеристики.

Показання. Місцева анестезія (термінальна, інфільтраційна, провідникова) у хірургії, офтальмології, стоматології, оториноларингології; блокада периферичних нервів і нервових сплетінь при різних больових синдромах.

Протипоказання. Підвищена чутливість до компонентів препарату/інших амідних місцевоанестезуючих засобів, наявність в анамнезі епілептиформних судом на лідокаїн, тяжка брадикардія, тяжка|виказана,висловлена| артеріальна| гіпотензія, кардіогенний шок, тяжкі|тяжкі| форми хронічної серцевої|сердечної| недостатності (II-III ступеня), синдром слабкості синусового вузла, синдром Вольфа-Паркінсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса, атріовентрикулярна (AV) блокада II і III ступеня, гіповолемія, тяжкі порушення функції печінки/нирок, порфірія|, міастенія, ретробульбарне введення хворим на глаукому.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій. При комбінованому застосуванні лідокаїну з такими препаратами, як *хлорпромазин, петидин, бупівакаїн, хінідин, дизопірамід, амітриптилін, іміпрамін, нортриптилін*, концентрація лідокаїну у плазмі крові знижується.

Антиаритмічні препарати (у т. ч. аміодарон, верапаміл, хінідин, дизопірамід, аймалін) – посилюється кардіодепресивна дія (відбувається подовження інтервалу QT і, в дуже поодиноких випадках, можливий розвиток AV-блокади або фібриляції шлуночків); одночасне застосування з аміодароном може призвести до розвитку судом.

Новокаїн, новокаїнамід, прокаїнамід – можливе збудження ЦНС, марення, галюцинації.

Кураreподібні 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 метаболізму внаслідок інгібування мікросомального окислювання), підвищує його концентрацію і ризик розвитку токсичних ефектів.

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

β-адреноблокатори уповільнюють метаболізм лідокаїну в печінці, посилюють ефекти лідокаїну (у т. ч. токсичні) і підвищують ризик розвитку брадикардії та артеріальної гіпотензії. При одночасному застосуванні β-адреноблокаторів і лідокаїну необхідно зменшити дозу останнього.

Серцеві глікозиди – послаблюється кардіотонічний ефект серцевих глікозидів.

Глікозиди наперстянки – на тлі інтоксикації лідокаїн може посилювати тяжкість AV-блокади.

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

Наркотичні аналгетики (морфін тощо) – посилюється аналгезуючий ефект наркотичних аналгетиків, пригнічення дихання.

Інгібітори МАО (фуразолідон, прокарбазин, селегілін) – підвищується ризик розвитку артеріальної гіпотензії і пролонгується місцевоанестезуюча дія останнього. У період лікування інгібіторами МАО не слід застосовувати лідокаїн парентерально.

Антикоагулянти (у т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароїд, еноксапарин, гепарин, варфарин тощо) 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 у крові.

Пропафенон – можливе збільшення тривалості і підвищення тяжкості побічних ефектів з боку ЦНС.

Преніламін – підвищується ризик розвитку шлуночкової аритмії типу «пірует».

Протисудомні засоби, барбітурати (фенобарбітал) – можливе прискорення метаболізму лідокаїну в печінці, зниження концентрації у крові, посилення кардіодепресивного ефекту.

Ізадрин, глюкагон – підвищується кліренс лідокаїну.

Норепінефрин, мексилетин – знижується кліренс лідокаїну (посилюється токсичність); зменшується печінковий кровотік.

Ацетазоламід, тіазидні і петльові діуретики зменшують ефект лідокаїну в результаті виникнення 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.

Особливості застосування. Введення лідокаїну можуть здійснювати тільки медичні працівники.

При обробці місця ін'єкції дезінфікуючими розчинами, що містять важкі метали, підвищується ризик розвитку місцевої реакції у вигляді болючості та набряку.

Під час застосування лідокаїну обов'язковим є контроль ЕКГ. У випадку порушень діяльності

синусового вузла, подовження інтервалу PQ, розширення QRS або при розвитку нової аритмії слід зменшити дозу/відмінити препарат.

Перед застосуванням лідокаїну при захворюваннях серця (гіпокаліємія знижує ефективність лідокаїну) необхідно нормалізувати рівень калію у крові.

Перед введенням лідокаїну у високих дозах рекомендується призначення барбітуратів.

При проведенні планованої субарахноїдальної анестезії необхідно відмінити інгібітори МАО не менше 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 ЦНС (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 навколохребтового відділу у хворих із неврологічними захворюваннями, деформацією хребта, септицемією.

Менші дози препарату слід вводити у 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 тяжкі 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 на факт наявності ознак аритмії і з обережністю застосовувати препарат особам зі скаргами на аритмії у минулому.

З обережністю і в менших дозах застосовують пацієнтам із серцевою недостатністю помірного ступеня, артеріальною гіпотензією помірного ступеня, неповною AV-блокадою, порушеннями внутрішньошлуночкової 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.

Цей лікарський засіб містить менше 1 ммоль (23 мг)/дозу натрію, тобто практично вільний від натрію.

Застосування|вживання| у період вагітності або годування груддю. У період вагітності препарат протипоказаний. При необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Після|потім| застосування|вживання| препарату не рекомендується займатися діяльністю, що потребує швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування|вживання| та дози. Препарат застосовують ін'єкційно (підшкірно, внутрішньом'язово) і місцево на слизові оболонки. Слід уникати внутрішньосудинного введення препарату.

Для термінальної|поверхової,зверхньої| анестезії слизові оболонки дорослим змазують 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) вводять 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 інстилюють у кон'юнктивальний мішок 2-3 рази з інтервалом 30-60 секунд безпосередньо перед дослідженням або хірургічним втручанням.

Дітям віком від 12 років при всіх видах периферичного знеболювання загальна доза лідокаїну не повинна перевищувати 3 мг/кг маси тіла.

Для всіх видів ін'єкційного знеболювання можливе поєднання лідокаїну з епінефрином (1:50000-1:100000; готують ex tempore, додають 1 краплю 0,1 % розчину епінефрину на 5-10 мл розчину лідокаїну 2 %), 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.

Діти. Препарат застосовують дітям віком від 12 років.

Передозування. Можливе посилення побічних реакцій.

Симптоми: психомоторне збудження, запаморочення, загальна|спільна| слабкість, зниження артеріального тиску|тиснення|, тремор, порушення зору, тоніко-клонічні судоми, кома, колапс, AV-блокада, асфіксія, апное. Перші симптоми передозування у|в,біля| здорових добровольців виникають при концентрації лідокаїну у крові більше 0,006 мг/кг, судоми – при 0,01 мг/кг.

Лікування: припинення введення препарату, оксигенотерапія, протисудомні засоби, вазоконстриктори (норадреналін, мезатон), холінолітики. Пацієнт повинен перебувати в горизонтальному положенні; необхідно забезпечити доступ свіжого повітря, подачу кисню і/або проведення штучного дихання. Симптоми з боку ЦНС коригуються застосуванням бензодіазепінів/барбітуратів короткочасної дії. Якщо передозування виникає у процесі анестезії, слід застосовувати короткотривалий міорелаксант. Для корекції брадикардії і

порушень провідності застосовують атропін (0,5-1 мг внутрішньовенно), при артеріальній гіпотензії – симпатоміметики у комбінації з агоністами β-адренорецепторів. При зупинці серця показане негайне проведення реанімаційних заходів. Можливе проведення інтубації, штучної вентиляції легенів. У гострій фазі передозування діаліз неефективний. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції. *З боку нервової системи:* збудження ЦНС (при застосуванні у високих дозах), занепокоєння, головний біль, запаморочення, порушення сну, сплутаність свідомості, сонливість, втрата свідомості, кома, порушення чутливості, оніміння язика і губ (при застосуванні у стоматології), моторний блок; у пацієнтів із підвищеною чутливістю – ейфорія, тремор, тризм, руховий неспокій, парестезії, судоми.

З боку органів зору: ністагм, оборотна сліпота, диплопія|неспокій|, мигтіння «мушок» перед очима, світлобоязнь, кон'юнктивіт.

З боку органів слуху: слухові порушення, шум у вухах, гіперакузія.

З боку серцево-судинної системи: при застосуванні|вживанні| у високих дозах – аритмія, брадикардія, уповільнення провідності серця, поперечна блокада серця, зупинка серцевої діяльності, периферична вазодилатація, колапс; дуже рідко – тахікардія, підвищення/зниження артеріального тиску, біль у серці.

З боку травної системи: нудота, блювання.

З боку дихальної системи: задишка, риніт, пригнічення або зупинка дихання.

Алергічні реакції: вкрай|*надто*| рідко – шкірні|шкіряний| висипання, кропив'янка, свербіж, генералізований| ексфоліативний| дерматит, ангіоневротичний набряк, анафілактичні реакції (у т. ч. анафілактичний шок).

Інші: відчуття жару, холоду або оніміння кінцівок|скінченностей|, набряки, слабкість, злоякісна гіпертермія.

Місцеві реакції: відчуття легкого печіння, що зникає зі зростанням анестезуючого ефекту (протягом 1 хвилини), гіперемія. При спінальній або епідуральній анестезії може спостерігатися біль у спині, ногах, часткова/повна спинномозкова блокада, що супроводжується зниженням артеріального тиску, порушенням дефекації, мимовільним сечовипусканням, імпотенцією, втратою чутливості в ділянці промежини (ймовірність цих ефектів зростає при застосуванні вищих доз або у разі випадкового введення лідокаїну у спинномозковий простір, коли доза, призначена для введення в епідуральний простір, потрапляє у спинномозковий простір); в окремих випадках після такого втручання відновлення рухової, сенсорної і/або вегетативної функції відбувається повільно (через кілька місяців) або неповною мірою.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність. Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одному шприці. Лідокаїн випадає в осад при змішуванні з амфотерицином, метогекситоном або сульфадіазином. Залежно від pH розчину лідокаїн може бути несумісний з ампіциліном.

Упаковка. По 2 мл в ампулах № 10 у коробці; № 5х2, № 10 у блістері у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ТОВАРИСТВО З ОБМЕЖЕНОЮ ВІДПОВІДАЛЬНІСТЮ «КОРПОРАЦІЯ «ЗДОРОВ'Я».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності. Україна, 61013, Харківська обл., місто Харків, вулиця Шевченка, будинок 22.