

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКАЇН-ДАРНИЦЯ
(LIDOCAINE-DARNITSA)

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 властивості: прозора, безбарвна або злегка забарвлена рідина.

Фармакотерапевтична група.

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

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

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.

Фармакокінетика.

При місцевому застосуванні на слизових оболонках лідокаїн всмоктується різною мірою залежно від дози та місця нанесення (максимальна концентрація досягається через 10-20 хвилин); на всмоктування впливає швидкість перфузії через слизову оболонку. При внутрішньом'язовому введенні максимальна концентрація досягається через 5-15 хвилин. Зв'язування з білками плазми крові – 60-80 % (залежно від дози).

Легко проходить через гістогематичні бар'єри, включаючи гематоенцефалічний. Спочатку

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, введеного породіллі.

Метаболізується на 90 % у печінці шляхом окислювального N-дезалкілювання з утворенням активних метаболітів: моноетилгліцинксилідину і гліцинксилідину, що мають періоди напіввиведення 2 та 10 годин відповідно. Виявляє ефект «першого проходження».

При порушенні функції печінки період напіввиведення може зростати більше ніж у 2 рази. У незмінному вигляді з сечею виводиться 5-20 %.

Клінічні характеристики.

Показання.

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

Протипоказання.

Індивідуальна підвищена чутливість до компонентів препарату, а також до інших амідних місцевоанестезуючих лікарських засобів; наявність в анамнезі епілептоформних судом, пов'язаних з введенням лідокаїну гідрохлориду; AV-блокада II і III ступеня, повна поперечна блокада серця; синдром слабкості синусового вузла; синдром Вольфа-Паркінсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса; тяжкі форми серцевої недостатності (II-III ступеня); виражена артеріальна гіпотензія; тяжка брадикардія; кардіогенний шок; міастенія; гіповолемія; порфірія; тяжка ниркова та/або печінкова недостатність; ретробульбарне введення хворим на глаукому; розлади згортання крові, антикоагулянтна терапія; інфекції у місці ін'єкції; неконтактні пацієнти.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Хлорпромазин, петидин, бупівакаїн, хінідин, дизопірамід, амітриптилін, імипрамін, нортриптилін – при комбінованому застосуванні з лідокаїном концентрація останнього у плазмі крові знижується.

Антиаритмічні препарати (у т. ч. аміодарон, верапаміл, хінідин, дизопірамід, аймалін) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном посилюється кардіодепресивна дія, зокрема відбувається подовження інтервалу QT і у поодиноких випадках можливий розвиток AV-блокади або фібриляції шлуночків. Одночасне застосування з аміодароном може призвести до розвитку

судом.

Прокаїнамід – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливі марення, галюцинації.

Новокаїн, новокаїнамід – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливе збудження центральної нервової системи, галюцинації.

Курареподібні препарати – при комбінованому застосуванні з лідокаїном посилюється міорелаксація (можливий параліч дихальних м'язів).

Етанол – при комбінованому застосуванні з лідокаїном посилює пригнічувальну дію останнього на дихання.

Вазоконстриктори (епінефрин, метоксамін, фенілефрин) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном сприяють уповільненню всмоктування лідокаїну і пролонгують дію останнього.

Циметидин – при комбінованому застосуванні знижує печінковий кліренс лідокаїну (зниження метаболізму внаслідок інгібування мікросомального окислювання) і підвищує його концентрацію та ризик розвитку токсичних ефектів.

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

β-адреноблокатори – при комбінованому застосуванні уповільнюють метаболізм лідокаїну у печінці, посилюються ефекти лідокаїну (у т. ч. токсичні) і підвищується ризик розвитку брадикардії та артеріальної гіпотензії. При одночасному застосуванні β-адреноблокаторів та лідокаїну необхідно зменшити дозу останнього.

Серцеві глікозиди – при комбінованому застосуванні з лідокаїном послаблюється кардіотонічний ефект серцевих глікозидів.

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

Снодійні або седативні лікарські засоби – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливе посилення пригнічувальної дії на ЦНС снодійних та седативних препаратів.

Наркотичні анальгетики (морфін) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном посилюється анальгезуючий ефект наркотичних анальгетиків, однак підсилюється і пригнічення дихання.

Інгібітори моноаміноксидази (фуразолідон, прокарбазин, селегілін) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном підвищується ризик розвитку артеріальної гіпотензії та пролонгується місцевоанестезуюча дія останнього. У період лікування інгібіторами моноаміноксидази не слід застосовувати лідокаїн парентерально.

Антикоагулянти (у т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароїд, еноксапарин, гепарин, варфарин) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном збільшують ризик розвитку кровотеч.

Засоби для наркозу – при комбінованому застосуванні з лідокаїном останній посилює пригнічувальну дію на дихальний центр засобів для наркозу (гексобарбітал, тіопентал натрію внутрішньовенно).

Поліміксин В – при комбінованому застосуванні з лідокаїном необхідний контроль функції дихання.

Рифампіцин – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливе зниження концентрації останнього у крові.

Пропafenон – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливе збільшення тривалості і підвищення тяжкості побічних ефектів з боку центральної нервової системи.

Преніламін – при комбінованому застосуванні з лідокаїном підвищується ризик розвитку шлуночкової аритмії типу «пірует».

Протисудомні засоби, барбітурати (фенітоїн) – при комбінованому застосуванні з лідокаїном можливе прискорення метаболізму лідокаїну у печінці, зниження концентрації у крові, посилення кардіодепресивного ефекту.

Ізадрин, глюкагон – при комбінованому застосуванні з лідокаїном підвищується кліренс лідокаїну.

Норепінефрин, мексилетин – при комбінованому застосуванні з лідокаїном знижується кліренс останнього (посилюється токсичність); зменшується печінковий кровоток.

Ацетазоламід, тіазидні і петльові діуретики – при комбінованому застосуванні з лідокаїном у результаті розвитку гіпокаліємії зменшують ефект останнього.

Мідазолам – при комбінованому застосуванні з лідокаїном підвищується концентрація останнього у плазмі крові.

Препарати, що зумовлюють блокаду нервово-м'язової передачі – при комбінованому застосуванні з лідокаїном посилюється дія препаратів, що зумовлюють блокаду нервово-м'язової передачі, оскільки останні 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 і набряку.

Під час застосування лідокаїну обов'язковим є контроль ЕКГ. У випадку порушень діяльності синусового вузла, подовження інтервалу P-Q, розширення комплексу QRS або при розвитку нової аритмії слід зменшити дозу або відмінити препарат.

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

При проведенні планованої субарахноїдальної анестезії необхідно відмінити інгібітори моноаміноксидази не менше ніж за 10 днів до проведення анестезії.

При проведенні місцевої анестезії особливу обережність слід виявляти при введенні препарату у ділянки, що містять багато кровоносних судин. Під час проведення ін'єкції слід уникати потрапляння у судини.

При введенні у васкуляризовані тканини рекомендується проводити аспіраційну пробу.

Перед введенням лідокаїну у високих дозах рекомендується призначення барбітуратів.

Слід дотримуватися обережності, щоб уникнути випадкового субдурального або інтравазального введення препарату. Необхідно встановити пильний контроль за системною токсичною дією препарату на серцево-судинну і центральну нервову систему (оскільки дози, призначені для епідуральної анестезії, завжди вищі, ніж для субдуральної).

Надзвичайної обережності слід дотримуватися при анестезії навколохребтового відділу у хворих із неврологічними захворюваннями, деформацією хребта, септицемією і тяжкою артеріальною гіпертензією.

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.

Слід пам'ятати, що лідокаїн чинить виражену антиаритмічну дію і може сам виступати як аритмогенний фактор. Тому перед введенням препарату необхідно зібрати анамнез на факт наявності ознак аритмії і з обережністю застосовувати препарат особам зі скаргами на аритмії в минулому.

З обережністю та в менших дозах застосовувати пацієнтам із серцевою недостатністю помірного ступеня, артеріальною гіпотензією помірного ступеня, неповною атріовентрикулярною 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 гіпертермії, ослабленим хворим та пацієнтам літнього віку.

При внутрішньом'язовому введенні лідокаїну може підвищитися концентрація креатиніну що може призвести до помилки при встановленні діагнозу гострого інфаркту міокарда.

При місцевій анестезії тканин з вираженою васкуляризацією (наприклад, шиї у разі операції на щитовидній залозі) слід дотримуватись особливої обережності, щоб уникнути потрапляння препарату у судини.

Безпека застосування анестетиків групи амідів сумнівна у хворих, схильних до злоякісної гіпертермії, тому їх застосування у таких випадках слід уникати.

Слід дотримуватись особливої обережності при застосуванні лідокаїну пацієнтам з недостатністю кровообігу, гіповолемією, артеріальною гіпотензією, печінковою та нирковою недостатністю.

З обережністю призначати пацієнтам з розладами центральної нервової системи, які застосовують наркотики, тому що можуть виникнути раптові побічні ефекти з боку серцевої системи. При тривалому застосуванні потрібно моніторувати рівень електролітів у крові. З обережністю застосовувати пацієнтам зі схильністю до судом, у стані шоку, при гіпоксії.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Застосування препарату у період вагітності протипоказане.

При необхідності застосування препарату годування груддю слід припинити.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Після застосування препарату не слід займатися діяльністю, що потребує швидкості психомоторних реакцій.

Спосіб застосування та дози.

Перед застосуванням лідокаїну гідрохлориду обов'язкове проведення шкірної проби на підвищену чутливість до препарату, про що свідчать набряк і почервоніння місця ін'єкції.

Для місцевої анестезії застосовувати ін'єкційно (підшкірно, внутрішньом'язово) і місцево на слизові оболонки. Слід уникати внутрішньосудинного введення препарату.

Для провідникової анестезії (у т. ч. для знеболювання плечового і крижового сплетінь) вводити 5-10 мл розчину (100-200 мг препарату).

Для знеболювання пальців кінцівок, носа, вух вводити 2-3 мл розчину (40-60 мг препарату). Максимальна доза препарату для дорослих при застосуванні для провідникової анестезії становить 10 мл (200 мг лідокаїну гідрохлориду).

Для всіх видів ін'єкційного знеболювання можливе поєднання лідокаїну з епінефрином (1:50000-1:100000; готувати *ex tempore*, додати 1 краплю 0,1 % розчину епінефрину на 5-10 мл 2 % розчину лідокаїну), за винятком випадків, коли системна дія, яку чинить епінефрин (адреналін), є небажаною (підвищена чутливість до епінефрину, артеріальна гіпертензія, цукровий діабет, глаукома) або потрібна короткочасна анестезуюча дія. Епінефрин сприяє уповільненню всмоктування лідокаїну і пролонгує його дію.

Для анестезії в офтальмології по 2 краплі розчину інстилювати у кон'юнктивальний мішок 2-3 рази з інтервалом 30-60 секунд безпосередньо перед дослідженням або хірургічним втручанням.

Для термінальної анестезії на слизові оболонки нанести розчин лідокаїну в об'ємі не більше 20 мл для дорослих у дозі до 2 мг/кг маси тіла, тривалість анестезії – 15-30 хвилин. Максимальна доза розчину для дорослих становить 20 мл.

Дітям при усіх видах периферичного знеболювання загальна доза лідокаїну гідрохлориду не має перевищувати 3 мг/кг маси тіла.

Діти.

Препарат не застосовують дітям віком до 12 років.

Передозування.

Основні симптоми пов'язані з пригніченням центральної нервової системи і серцево-судинної системи: загальна слабкість, сонливість, депресія, запаморочення, дезорієнтація, тоніко-клонічні судоми, кома, тремор, порушення зору, дзвін у вухах, атріовентрикулярна блокада, асфіксія, нудота, блювання, ейфорія, психомоторне збудження, астения, апное, брадикардія, зниження артеріального тиску, колапс. Перші симптоми передозування у здорових людей виникають при концентрації лідокаїну гідрохлориду у крові понад 0,006 мг/кг; судоми – при 0,01 мг/кг.

Лікування: припинення введення препарату, оксигенотерапія, вазоконстриктори (норадреналін, мезатон), протисудомні засоби, холінолітики. Пацієнт повинен перебувати у горизонтальному положенні; необхідно забезпечити доступ свіжого повітря, подачу кисню і/або проведення штучного дихання. Симптоми з боку центральної нервової системи коригувати застосуванням бензодіазепінів або барбітуратів короткочасної дії. Якщо передозування виникає у процесі анестезії, слід застосовувати міорелаксанти короткої дії. Для корекції брадикардії і порушень провідності застосовувати 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 лідокаїном діаліз неефективний. Специфічного антидоту немає.

Побічні реакції.

При застосуванні препарату можливі такі побічні реакції:

з боку серцево-судинної системи: зниження артеріального тиску, тахікардія – при введенні з вазоконстриктором, брадикардія, периферична вазодилатація, колапс, тахікардія, відчуття серцебиття, біль у грудній клітці, біль у серці, аритмія, уповільнення провідності серця, поперечна блокада серця, фібриляція шлуночків, зупинка серцевої діяльності; дуже рідко – артеріальна гіпертензія;

з боку центральної і периферичної нервової системи: збудження центральної нервової системи (при застосуванні у високих дозах), занепокоєння, запаморочення, сплутаність свідомості, сонливість, порушення сну, головний біль, слабкість, руховий неспокій, ейфорія, ністагм, втрата свідомості, порушення чутливості, парестезії, оніміння язика та губ (при застосуванні у стоматології); у пацієнтів з підвищеною чутливістю – ейфорія, тремор, тризм, м'язові сіпання, руховий неспокій, судоми (ризик їхнього розвитку підвищується на тлі гіперкапнії та ацидозу); стійка анестезія, парез або елегія нижніх кінцівок та втрата управління сфінктером (наприклад, синдром кінського хвоста) – спричиняє частіше інших місцевоанестезуючих засобів, моторний і чутливий

блок, дизартрія, дисфагія, кома;

з боку органів зору: порушення зору, нечіткість зору, диплопія, ністагм, мигтіння «мушок» перед очима, розширення зіниць, світлобоязнь, оборотна сліпота, кон'юнктивіт;

з боку органа слуху: слухові порушення, шум у вухах, гіперакузія;

психічні порушення: анорексія, дратівливість, невгамовність, галюцинації, депресії, відчуття тривоги, порушення сну, стан збудження;

з боку респіраторної системи, органів грудної клітки та середостіння: риніт, задишка, утруднене дихання, відчуття ядухи, пригнічення дихання, бронхоспазм, параліч дихальних м'язів, респіраторний параліч (частіше розвивається при субарахноїдальній анестезії), зупинка дихання;

з боку травного тракту: нудота, блювання, мимовільна дефекація, біль у животі;

з боку сечовидільної системи: мимовільне сечовипускання;

з боку шкіри та підшкірної клітковини: гіперемія, свербіж, висипання, кропив'янка;

з боку репродуктивної системи: зниження лібідо та/або потенції;

з боку імунної системи: реакції гіперчутливості, включаючи ангіоневротичний набряк, генералізований ексfolіативний дерматит, анафілактичний шок, анафілактична реакція; пригнічення імунної системи;

реакції у місці введення: відчуття легкого печіння, яке зникає з розвитком анестезуючого ефекту (протягом 1 хвилини), набряк, гіперемія, свербіж, висипання, тромбофлебіт, локалізоване пошкодження нерва у місці ін'єкції; 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 у ділянці промежини (імовірність 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 та/або вегетативної функції відбувається повільно (через кілька місяців) або неповною мірою;

загальні розлади: стійка анестезія, гіпотермія, відчуття жару, холоду або оніміння кінцівок, злаякісна гіпертермія, підвищене потовиділення, блідість шкіри, набряковий синдром, слабкість.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморожувати.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Несумісність.

Препарат не слід змішувати з іншими лікарськими засобами в одній ємності, за винятком розчинників, зазначених у розділі «Спосіб застосування та дози».

Лідокаїн випадає в осад при змішуванні з амфотерицином, метогекситоном або сульфадіазином. Залежно від рН розчину лідокаїн може бути несумісний з ампіциліном.

Упаковка.

По 2 мл в ампулі; по 5 ампул у контурній чарунковій упаковці; по 2 контурні чарункові упаковки в пачці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. ПрАТ «Фармацевтична фірма «Дарниця».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 02093, м. Київ, вул. Бориспільська, 13.

ИНСТРУКЦИЯ

по медицинскому применению лекарственного средства

ЛИДОКАИН-ДАРНИЦА

(LIDOCAINE-DARNITSA)

Состав:

действующее вещество: lidocaine;

1 мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида 20 мг;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид, вода для инъекций.

Лекарственная форма. Раствор для инъекций.

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

Фармакотерапевтическая группа.

Препараты для местной анестезии. Лидокаин. Код АТХ N01B B02.

Фармакологические свойства.

Фармакодинамика.

Местноанестезирующее средство для терминальной, инфильтрационной, проводниковой анестезии. Относительная токсичность лидокаина гидрохлорида зависит от концентрации раствора. В малых концентрациях (0,5 %) он существенно не отличается по токсичности от новокаина, с увеличением концентрации (1 % и 2 %) токсичность повышается.

Фармакокинетика.

При местном применении на слизистых оболочках лидокаин всасывается в разной степени в зависимости от дозы и места нанесения (максимальная концентрация достигается через 10-20 минут); на всасывание влияет скорость перфузии через слизистую оболочку. При внутримышечном введении максимальная концентрация 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), потом – в жировую и мышечную ткани. Проникает через плаценту, в организме новорожденного выявляется 40-55 % концентрации препарата, введенного роженице.

Метаболизируется на 90 % в печени путем окислительного N-дезалкилирования с образованием активных метаболитов: моноэтилглицинксилидина и глицинксилидина, имеющих периоды полувыведения 2 и 10 часов соответственно. Проявляет эффект «первого прохождения».

При нарушении функции печени период полувыведения может возрасти более чем в 2 раза. В неизменном виде с мочой выводится 5-20 %.

Клинические характеристики.

Показания.

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

Противопоказания.

Индивидуальная повышенная чувствительность к компонентам препарата, а также к другим амидным местноанестезирующим лекарственным средствам; указание в анамнезе на эпилептоформные судороги, связанные с введением лидокаина гидрохлорида; AV-блокада II и III степени, полная поперечная блокада сердца; синдром слабости синусового узла; синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта, синдром Адамса-Стокса; тяжелые формы сердечной недостаточности (II-III степени); выраженная артериальная гипотензия; тяжелая брадикардия; кардиогенный шок; полная поперечная блокада сердца; миастения; гиповолемия; порфирия; тяжелая почечная и/или печеночная недостаточность; ретробульбарное введение больным глаукомой; расстройства свертывания крови, антикоагулянтная терапия; инфекции в месте инъекции; неконтактные пациенты.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

Хлорпромазин, петидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, амитриптилин, имипрамин, нортриптилин – при комбинированном применении с лидокаином концентрация последнего в плазме крови снижается.

Антиаритмические препараты (в т. ч. амиодарон, верапамил, хинидин, дизопирамид, аймалин) – при комбинированном применении с лидокаином усиливается кардиодепрессивное действие, в частности происходит удлинение интервала QT и в единичных случаях возможно развитие AV-блокады или фибрилляции желудочков. Одновременное применение с амиодароном может привести к развитию судорог.

Прокаинамид – при комбинированном применении с лидокаином возможен бред, галлюцинации.

Новокаин, новокаинамид – при комбинированном применении с лидокаином возможно возбуждение центральной нервной системы, галлюцинации.

Курареподобные препараты – при комбинированном применении с лидокаином усиливается миорелаксация (возможен паралич дыхательных мышц).

Этанол – при комбинированном применении с лидокаином усиливает подавляющее действие последнего на дыхание.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилефрин) – при комбинированном

применении с лидокаином способствуют замедлению всасывания лидокаина и пролонгируют действие последнего.

Циметидин – при комбинированном применении снижает печеночный клиренс лидокаина (снижение метаболизма в результате ингибирования микросомального окисления) и повышает его концентрацию и риск развития токсичных эффектов.

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

β-адреноблокаторы – при комбинированном применении замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливаются эффекты лидокаина (в т. ч. токсичные) и повышается риск развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении β-адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшить дозу последнего.

Сердечные гликозиды – при комбинированном применении с лидокаином ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

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

Снотворные или седативные лекарственные средства – при комбинированном применении с лидокаином возможно усиление подавляющего действия на ЦНС снотворных и седативных препаратов.

Наркотические анальгетики (морфин) – при комбинированном применении с лидокаином усиливается анальгезирующий эффект наркотических анальгетиков, однако усиливается и угнетение дыхания.

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

Антикоагулянты (в т. ч. ардепарин, далтепарин, данапароид, эноксапарин, гепарин, варфарин) – при комбинированном применении с лидокаином увеличивается риск развития кровотечений.

Средства для наркоза – при комбинированном применении с лидокаином последний усиливает угнетающее действие на дыхательный центр средств для наркоза (гексобарбитал, тиопентал натрия внутривенно).

Полимиксин В – при комбинированном применении с лидокаином необходим контроль функции дыхания.

Рифампицин – при комбинированном применении с лидокаином возможно снижение концентрации последнего в крови.

Пропafenон – при комбинированном применении с лидокаином возможно увеличение продолжительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны центральной нервной системы.

Прениламин – при комбинированном применении с лидокаином повышается риск развития желудочковой аритмии типа «пируэт».

Противосудорожные средства, барбитураты (фенитоин) – при комбинированном применении с лидокаином возможно ускорение метаболизма лидокаина в печени, снижение концентрации в крови, усиление кардиодепрессивного эффекта.

Изадрин, глюкагон – при комбинированном применении с лидокаином повышается клиренс лидокаина.

Норэпинефрин, мексилетин – при комбинированном применении с лидокаином снижается клиренс последнего (усиливается токсичность); уменьшается печеночный кровоток.

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики – при комбинированном применении с лидокаином в результате создания гипокалиемии уменьшают эффект последнего.

Мидазолам – при комбинированном применении с лидокаином повышается концентрация последнего в плазме крови.

Препараты, блокирующие нервно-мышечную передачу – при комбинированном применении с лидокаином усиливается действие препаратов, блокирующих нервно-мышечную передачу, поскольку последние 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 применения лидокаина обязательным является контроль ЭКГ. В случае нарушений деятельности синусового узла, удлинения интервала P-Q, расширения комплекса 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.

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

При проведении местной анестезии особую осторожность следует проявлять при введении препарата в области, богатые кровеносными сосудами. Во время проведения инъекции следует

избегать попадания в сосуды.

При введении в васкуляризированные ткани рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Перед введением лидокаина в высоких дозах рекомендуется назначение барбитуратов. Следует соблюдать осторожность во избежание случайного субдурального или интравазального введения препарата. Необходимо установить пристальный контроль за системным токсичным действием препарата на сердечно-сосудистую и центральную нервную систему (поскольку дозы, предназначенные для эпидуральной анестезии, всегда более высокие, чем для субдуральной).

Чрезвычайную осторожность следует соблюдать при анестезии околопозвоночного отдела у больных с неврологическими заболеваниями, деформацией позвоночника, септициемией и тяжелой артериальной гипертензией.

Меньшие дозы препарата следует вводить в область головы и шеи, включая ретробульбарное и стоматологическое введение, а также применение для блокады звездчатого ганглия, поскольку системные токсичные 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.

Следует помнить, что лидокаин оказывает выраженное антиаритмическое действие и может сам выступать как аритмогенный фактор. Поэтому перед введением препарата необходимо собрать анамнез относительно наличия признаков аритмии и с осторожностью применять препарат у лиц с жалобами на аритмии в прошлом.

С осторожностью и в меньших дозах применять у пациентов с сердечной недостаточностью умеренной степени, артериальной гипотензией умеренной степени, неполной атриовентрикулярной блокадой, нарушениями внутрижелудочковой проводимости, нарушениями функции печени и почек умеренной степени (клиренс креатинина не менее 10 мл/мин), нарушением функции дыхания, эпилепсией, после операций на сердце, при генетической склонности к гипертермии, ослабленным и пожилым пациентам.

При внутримышечном введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может привести к ошибке при установлении 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 применение в таких случаях следует избегать.

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

С осторожностью назначать пациентам с расстройствами центральной нервной системы, которые применяют наркотики, так как могут возникнуть внезапные

побочные эффекты со стороны сердечно-сосудистой системы. При длительном применении нужно мониторить уровень электролитов в крови. С осторожностью применять пациентам со склонностью к судорогам, в состоянии шока, при гипоксии.

Применение в период беременности или кормления грудью.

Применение в период беременности противопоказано.

При необходимости применения препарата кормление грудью следует прекратить.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами.

После применения препарата не следует заниматься деятельностью, которая требует скорости психомоторных реакций.

Способ применения и дозы.

Перед применением лидокаина гидрохлорида обязательно проведение кожной пробы на повышенную чувствительность к препарату, о чем свидетельствуют отек и покраснение места инъекции.

Для местной анестезии применять инъекционно (подкожно, внутримышечно) и местно на слизистые оболочки. Следует избегать внутрисосудистого введения препарата.

Для проводниковой анестезии (в т. ч. для обезболивания плечевого и крестцового сплетений) вводить 5-10 мл раствора (100-200 мг препарата).

Для обезболивания пальцев конечностей, носа, ушей вводить 2-3 мл раствора (40-60 мг препарата). Максимальная доза препарата для взрослых при применении для проводниковой анестезии – 10 мл (200 мг лидокаина гидрохлорида).

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

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

Для терминальной анестезии на слизистые оболочки нанести раствор лидокаина в объеме не более 20 мл для взрослых в дозе до 2 мг/кг массы тела, длительность анестезии – 15-30 минут. Максимальная доза раствора для взрослых составляет 20 мл.

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

Дети.

Препарат не применяют детям до 12 лет.

Передозировка.

Основные симптомы связаны с угнетением центральной нервной системы и сердечно-сосудистой системы: общая слабость, сонливость, депрессия, головокружение, дезориентация, тонико-клонические судороги, кома, тремор, нарушения зрения, звон в ушах, атриовентрикулярная блокада, асфиксия, тошнота, рвота, эйфория, психомоторное возбуждение, астения, апноэ, брадикардия, снижение артериального давления, коллапс. Первые симптомы передозировки у здоровых людей возникают при концентрации лидокаина гидрохлорида в крови свыше 0,006 мг/кг; судороги – при 0,01 мг/кг.

Лечение: прекращение введения препарата, оксигенотерапия, вазоконстрикторы (норадреналин, мезатон), противосудорожные 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 корректировать применением бензодиазепинов или барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применять миорелаксант короткого действия. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применять 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 неэффективен. Специфического антидота нет.

Побочные реакции.

При применении препарата возможны побочные реакции:

со стороны сердечно-сосудистой системы: снижение артериального давления, тахикардия – при введении с вазоконстриктором, брадикардия, периферическая вазодилатация, коллапс, тахикардия, ощущение сердцебиения, боль в грудной клетке, боль в сердце, аритмия, замедление проводимости сердца, поперечная блокада сердца,

фибриляция желудочков, остановка сердечной деятельности; очень редко – артериальная гипертензия;

со стороны центральной и периферической нервной системы: возбуждение центральной нервной системы (при применении в высоких дозах), беспокойство, головокружение, спутанность сознания, сонливость, нарушение сна, головная боль, слабость, двигательное беспокойство, эйфория, нистагм, потеря сознания, нарушение чувствительности, парестезии, онемение языка и губ (при применении в стоматологии); у пациентов с повышенной чувствительностью – эйфория, тремор, тризм, мышечные подергивания, двигательное беспокойство, судороги (риск их развития повышается на фоне гиперкапнии и ацидоза); стойкая анестезия, парез или элегия нижних конечностей и потеря управления сфинктером (например, синдром конского хвоста) – вызывает чаще других местноанестезирующих средств, моторный и чувствительный блок, дизартрия, дисфагия, кома;

со стороны органов зрения: нарушение зрения, нечеткость зрения, диплопия, нистагм, мелькание «мушек» перед глазами, расширение зрачков, светобоязнь, обратимая слепота, конъюнктивит;

со стороны органов слуха: слуховые нарушения, шум в ушах, гиперacusия;

психические нарушения: анорексия, раздражительность, неугомонность, галлюцинации, депрессии, чувство тревоги, нарушения сна, состояние возбуждения;

со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения: ринит, одышка, затрудненное дыхание, ощущение удушья, угнетение дыхания, бронхоспазм, паралич дыхательных мышц, респираторный паралич (чаще развивается при субарахноидальной анестезии), остановка дыхания;

со стороны пищеварительного тракта: тошнота, рвота, непроизвольная дефекация, боль в животе;

со стороны мочевыделительной системы: непроизвольное мочеиспускание;

со стороны кожи и подкожной клетчатки: гиперемия, зуд, сыпь, крапивница;

со стороны репродуктивной системы: снижение либидо и/или потенции;

со стороны иммунной системы: реакции гиперчувствительности, включая ангионевротический отек, генерализованный эксфолиативный дерматит, анафилактический шок, анафилактические реакции, угнетение иммунной системы;

реакции в месте введения: ощущение легкого жжения, которое исчезает с развитием анестезирующего эффекта (в течение 1 минуты), отек, гиперемия, зуд, сыпь, тромбофлебит, локализованное повреждение нерва в месте инъекции; 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 восстановление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или в неполной мере;

общие нарушения: стойка анестезия, гипотермия, ощущение жара, холода или онемения конечностей, злокачественная гипертермия, повышенное потоотделение, бледность кожи, отечный синдром, слабость.

Срок годности. 3 года.

Условия хранения.

Хранить в оригинальной упаковке при температуре не выше 25 °С. Не замораживать.

Хранить в недоступном для детей месте.

Несовместимость.

Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одной емкости, за исключением растворителей, указанных в разделе «Способ применения и дозы».

Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогекситоном или сульфадиазином. В зависимости от pH раствора лидокаин может быть несовместим с ампициллином.

Упаковка.

По 2 мл в ампуле; по 5 ампул в контурной ячейковой упаковке; по 2 контурные ячейковые упаковки в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель. ЧАО «Фармацевтическая фирма «Дарница».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности. Украина, 02093, г. Киев, ул. Бориспольская, 13.