МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ

ИНСТРУКЦИЯ

по применению лекарственного препарата для медицинского применения

ЛИДОКАИН

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Лидокаин

Международное непатентованное наименование: лидокаин

Химическое название: *N*-(2,6-Диметилфенил)-2-(диэтиламино)ацетамида гидрохлорид, моногидрат

Лекарственная форма: раствор для инъекций

Состав:

На 1 мл препарата

Активное вещество: лидокаина гидрохлорида моногидрат 21,34 мг в пересчете на лидокаина гидрохлорид — 20,00 мг.

Вспомогательные вещества: натрия хлорид — 6,00 мг, вода для инъекций — до 1 мл.

Описание: прозрачная бесцветная или слегка окрашенная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа: местноанестезирующее средство

Код АТХ: N01BB02

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Лидокаин является местным анестетиком амидного типа. Лидокаин обратимо блокирует импульсы в нервных волокнах чувствительных нейронов, ингибируя транспорт ионов натрия через мембрану нейрона, тем самым оказывая местное анестезирующее действие. Схожие эффекты также наблюдаются на возбудимых мембранах головного мозга и сердечной мышцы. Лидокаин обладает быстрым началом действия, высокой анестезирующей активностью и низкой токсичностью. В более низких концентрациях лидокаин оказывает меньшее влияние на двигательные нервные волокна. При местном применении расширяет сосуды, не оказывает

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

местнораздражающего действия.

Фармакокинетика

Скорость абсорбции зависит от дозы, пути введения и кровоснабжения места инъекции. Межреберные блокады приводят к наибольшей плазменной концентрации (порядка 1,5 мкг/мл при введении 100 мг), тогда как при подкожном введении в область живота отмечается наименьшая плазменная концентрация (порядка 0,5 мкг/мл при введении 100 мг). Объем распределения в равновесном состоянии составляет 91 л, а связь с белками плазмы, преимущественно с α_1-кислым гликопротеином, 65 %.

Абсорбция из эпидурального пространства полная и двухфазная с периодом полувыведения около 9,3 и 82 мин соответственно. Медленная абсорбция является ограничивающим время фактором элиминации лидокаина, что объясняет более медленную элиминацию после эпидуральной инъекции, чем после внутривенного введения.

Элиминация лидокаина осуществляется преимущественно за счет метаболизма, главным образом путем дезалкилирования до моноэтилглизинксилидида (МЭГК), опосредованного изоферментами CYP1A2 и CYP3A4. МЭГК метаболизируется до 2,6-диметиланилина и глицинксилидида (ГК). В дальнейшем изофермент CYP2D6 конвертирует 2,6-диметилаланин в 4-гидрокси-2,6-диметилаланин, являющийся основным метаболитом мочи (80 %) и выводящийся в виде конъюгата. МЭГК обладает судорожной активностью, аналогичной лидокаину, тогда как ГК такой активностью не обладает. Плазменная концентрация МЭГК сопоставима с концентрацией исходного соединения. Скорость элиминации лидокаина и МЭГК после внутривенного болюсного введения составляет около 1,5–2 ч и 2,5 ч соответственно.

Вследствие быстрого метаболизма в печени, кинетика восприимчива ко всем нарушениям функции печени. У пациентов с печеночной недостаточностью период полувыведения может удваиваться. Почечная недостаточность не влияет на кинетику, но может повышать накопление метаболитов.

Лидокаин проникает через плацентарный барьер, концентрации несвязанного лидокаина в плазме матери и плода одинаковы. Однако общая плазменная концентрация у плода ниже вследствие более низкой связи с белками плазмы.

Показания к применению

Местная анестезия: внутривенная регионарная анестезия, инфильтрационная анестезия, проводниковая (блокада нервов), эпидуральная анестезия, спинальная (люмбальная) анестезия.

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

Противопоказания

Гиперчувствительность к местным анестетикам амидного типа или какому-либо вспомогательному веществу препарата.

Синдром слабости синусового узла, выраженная брадикардия, атриовентрикулярная блокада II-III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков), синоатриальная блокада, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта, острая и хроническая сердечная недостаточность (III-IV функционального класса), кардиогенный шок, синдром Морганьи-Адамса-Стокса, нарушения внутрижелудочковой проводимости.

Лидокаин не допускается применять для эпидуральной анестезии у пациентов с тяжелой артериальной гипотензией или с кардиогенным или гиповолемическим шоком.

Также необходимо учитывать общие противопоказа́ния к проведению того или иного вида анестезии.

С осторожностью

Хроническая сердечная недостаточность (I-II функционального класса), артериальная гипотензия, гиповолемия, атриовентрикулярная блокада I степени; у пациентов, получавших антиаритмики III класса (например, амиодарон), за ними следует установить тщательный контроль и мониторинг ЭКГ, поскольку сердечные эффекты лидокаина и антиаритмиков III класса могут суммироваться (см. раздел «Взаимодействие с другими лекарственными препаратами»); синусовая брадикардия, тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность, тяжелая миастения, эпилептиформные судороги (в том числе в анамнезе), у пациентов с нарушением функции дыхания, у ослабленных или пожилых (старше 65 лет).

Применение при беременности и в период грудного вскармливания

Беременность

Адекватные данные о лечении беременных женщин отсутствуют.

Лидокаин проникает через плаценту. Лидокаин применялся у большого числа беременных женщин и женщин детородного возраста. Данные о нарушении лидокаином репродуктивных процессов (например, повышение частоты пороков развития или какое-либо прямое или непрямое влияние на плод) отсутствуют. Тем не менее, риск для человека до конца не установлен.

Исследования на животных относительно влияния лидокаина на беременность, эмбрио-фетальное развитие, роды и постнатальное развитие неполные.

При краткосрочном применении во время беременности и родов польза для матери должна превышать риск для плода. Парацервикальная или пудендальная блокада лидокаином повышает

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

риск таких реакций у плода, как брадикардия или тахикардия. В связи с этим необходимо контролировать частоту сердечных сокращений плода (см. раздел «Фармакокинетика»).

Грудное вскармливание

Небольшое количество лидокаина проникает в грудное молоко. При применении в рекомендуемых дозах влияние на ребенка маловероятно. Тем не менее, следует проявлять осторожность, при применении лидокаина у кормящих матерей.

Способ применения и дозы

Лидокаин вводят внутривенно, внутримышечно, подкожно или эпидурально.

Лидокаин допускается применять лишь врачам (или под их надзором), имеющим опыт проведения регионарной анестезии. Следует вводить наименьшую дозу, вызывающую требуемый эффект.

Способ введения лидокаина зависит от вида анестезии (внутривенная регионарная анестезия, инфильтрационная анестезия, блокада нервов и эпидуральная анестезия).

Эффект лидокаина может быть удлинен добавлением 0.1% раствора эпинефрина (0.1 мл на 20 мл лидокаина).

Взрослые

Максимальная рекомендуемая доза лидокаина с адреналином (эпинефрином) не должна превышать 7 мг/кг массы тела, максимальная рекомендованная суммарная доза не должна превышать 500 мг. При использовании без адреналина максимальная индивидуальная доза не должна превышать 4,5 мг/кг массы тела, при этом максимальная рекомендованная суммарная доза не должна превышать 300 мг.

Инфильтрационная анестезия (внутримышечно,внутрикожно, подкожно) - используются 0.125%, 0.25%, 0.5% растворы; для достижения инфильтрационной анестезии используется до 60 мл 0.5% раствора или до 30 мл 1% раствора.

Для проводниковой анестезии (анестезия периферических нервов, в т.ч. при блокаде нервных сплетений) применяют перинервально 1 и 2% растворы; максимальная общая доза - до 400 мг (40 мл 1% раствора и 20 мл 2% раствора лидокаина). Для блокады нервных сплетений - 10-20 мл 1% раствора или 5-10 мл 2% раствора.

Эпидуральная анестезия (эпидурально) - для получения анальгезии используется 25-30 мл (250-300 мг) 1% раствора; для получения анестезии 15-20 мл (225-300 мг) 1.5% раствора или 10-15 мл (200-300 мг) 2% раствора; для торакальной эпидуральной анестезии - 20-30 мл (200-300 мг) 1% раствора. Не рекомендуется использовать непрерывное введение анестетика с помощью

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

катетера; введение максимальной дозы не должно повторяться чаще, чем через 90 мин.

Спинальная анестезия: субарахноидально, 3-4 мл раствора 2% раствора (60-80 мг).

При использовании каудальной анестезии (эпидурально, в крестцовый канал): в акушерской практике 200-300 мг (10-15 мл) 2% раствора; в хирургической практике - 15-20 мл (225-300 мг) 1.5% раствора. Не рекомендуется использовать непрерывное введение анестетика с помощью катетера; введение максимальной дозы не должно повторяться чаще, чем через 90 мин.

Для внутривенной регионарной анестезии - 10-60 мл (50-300 мг) 0.5% раствора.

Для проводниковой анестезии периферических нервов (периневрально): плечевого - 15-20 мл (225-300 мг) 1.5% раствора; в стоматологической практике - 1-5 мл (20-100 мг) 2% раствора; блокады межреберных нервов - 3 мл (30 мг) 1% раствора.

Парацервикальная анестезия (под слизистую) - 10 мл (100 мг) 1% раствора в каждую сторону, при необходимости возможно повторное введение не менее чем через 1.5 ч.

Паравертебральная анестезия (паравертебрально) - от 3 до 5 мл (30-50 мг) 1% раствора.

Ретробульбарная анестезия (ретробульбарно) - 3-5 мл (120-200 мг) 4% раствора, 3-4 мл 2% раствора.

Парабульбарная анестезия (парабульбарно) - 1-2 мл 2% раствора.

Местная инфильтрационная (субконъюнктивальная) анестезия - 0.5-1.0 мл 2% раствора.

Вагосимпатическая блокада (в клетчатку вокруг сосудисто-нервного пучка, соответствующей локализации): шейного отдела (звездчатого узла) - 5 мл (50 мг) 1% раствора, поясничного - 5-10 мл (50-100 мг) 1% раствора.

Транстрахеальная анестезия - 2-3 мл (80-120 мг) 4% раствора, возможно сочетание с местным интрафарингеальным введением 4% раствора в виде спрея, максимальная доза в этом случае не должна превышать 5 мл (200 мг) или 3 мг/кг.

Максимальная доза для взрослых - не более 4.5 мг/кг или 300 мг; для внутривенной регионарной анестезии - не более 4 мг/кг.

У детей и ослабленных пациентов дозу снижают.

Дети

Максимальная доза для детей варьирует в зависимости от возраста и веса.

Например, у ребенка 5 лет весом 50 кг доза лидокаина не должна превышать 75-100 мг (1,5 до 2 мг/кг). При использовании препарата в более разбавленных растворах (например, от 0,25 до 0,5%) общая доза не должна превышать 3 мг/кг.

Детям старшего возраста

Рекомендуемые дозы для детей при нервно-мышечной блокаде - до 4,5 мг/кг 0.25-1% раствора,

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

при внутривенной регионарной анестезии - 3 мг/кг 0.25-0.5% раствора.

Максимальная доза для детей – 4,5 мг/кг.

При применении у детей должна быть использована самая низкая эффективная концентрация и низкая эффективная доза препарата. Для разбавления применяют 0,9% раствор хлорида натрия для инъекций.

Повторное введение в течение 24 часов не рекомендуется.

Побочное действие

Нежелательные реакции, вызываемые лидокаином, зачастую сложно отличить от физиологических эффектов блокады нервов (например, снижения артериального давления, брадикардии) и состояний, обусловленных введением напрямую (например, повреждение нерва) или косвенно (например, эпидуральный абсцесс).

Очень часто (≥1/10)	Со стороны сосудов	Снижение артериального давления
	Со стороны желудочно-кишечного тракта	Тошнота
Часто (≥1/100, <1/10)	Со стороны нервной системы	Парестезия, головокружение
	Со стороны сердца	Брадикардия
	Со стороны сосудов	Повышение артериального давления
	Со стороны желудочно-кишечного тракта	Рвота
Нечасто (≥1/1000, <1/100)	Со стороны нервной системы	Периоральная парестезия, онемение языка, гиперакузия, шум в ушах, нарушение зрения, сонливость, потеря сознания, тремор, судороги, дизартрия
Редко (≥1/10 000, <1/1000)	Со стороны нервной системы	Нейропатия, повреждение периферических нервов, арахноидит
	Со стороны сердца	Остановка сердца, аритмии
	Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	Дыхательная недостаточность, паралич дыхательных мышц
	Со стороны иммунной системы	Реакции гиперчувствительности, крапивница, сыпь, ангионевротический отек, в тяжелых случаях — анафилактический шок
	Со стороны органа зрения	Двоение в глазах

Передозировка

Непреднамеренное внутрисосудистое введение местных анестетиков может стать причиной

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

острой системной токсичности (от нескольких секунд до нескольких минут). Признаки системной токсичности вследствие передозировки проявляются позднее (через 15–60 мин после введения), что обусловлено более медленным повышением концентрации местного анестетика в крови (см. раздел «Побочное действие»). При появлении признаков системной токсичности введение следует немедленно прекратить.

Симптомы

Возбуждение центральной нервной системы, сменяющееся ее угнетением. При введении больших доз первым симптомом может служить быстрое начало судорог. Беспокойство, головокружение, нарушение зрения, периоральная парестезия, тошнота. Затем атаксия, слуховые нарушения, эйфория, спутанность сознания, затруднение речи, бледность, потливость, тремор, судороги, кома, остановка дыхания. Аритмии, преимущественно брадиаритмии, но при больших дозах также желудочковая тахикардия, фибрилляция желудочков, расширение комплекса QRS, АВ-блокада. Сердечная недостаточность, снижение артериального давления (в отдельных случаях описана метгемоглобинемия).

Лечение

При передозировке необходимо принять неотложные меры по поддержанию кровообращения и дыхания и контролю судорог. Необходимо обеспечить проходимость дыхательных путей, начать введение кислорода, при необходимости — искусственная вентиляция легких. Поддержание гемодинамики осуществляют путем введения плазмы или плазмозамещающих растворов, добутамина и, при необходимости, норэпинефрина (начиная с дозы 0,05 мкг/кг/мин, повышая, при необходимости, на 0,05 мкг/кг/мин каждые 10 мин), в тяжелых случаях устанавливают мониторинг гемодинамики. Возможно применение эфедрина. Контроль над судорогами устанавливают с помощью внутривенного введения диазепама или тиопентала натрия, принимая во внимание, что противосудорожные средства могут угнетать дыхание и кровообращение. При брадикардии возможно введение атропина. При остановке сердца проводят стандартные реанимационные мероприятия.

Эффективность гемодиализа при острой передозировке лидокаином незначительна.

Взаимодействие с другими лекарственными препаратами

Лекарственные препараты, ингибирующие метаболизм лидокаина (например, циметидин), могут приводить к возникновению потенциально токсических концентраций последнего, если лидокаин вводился многократно в высоких дозах или в течение продолжительного периода времени. Такого рода взаимодействия не имеют клинической значимости при краткосрочном лечении лидокаином в рекомендуемых дозах.

Лидокаин следует с осторожностью применять с другими местными анестетиками или

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
РП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

антиаритмиками IB класса, ввиду потенциальной суммации эффектов.

Отдельные исследования лекарственных взаимодействий местных анестетиков с антиаритмиками III класса (например, амиодароном) не проводились, рекомендуется соблюдать осторожность (см. раздел «Особые указания»).

Лидокаин несовместим с растворами амфотерицина В, сульфадиазина, метогекситала и фенитоина.

Стабильные в кислой среде лекарственные средства, например, эпинефрин, норэпинефрин и изопреналин через несколько часов нахождения в растворе лидокаина начинают деградировать, поскольку лидокаин может повысить pH образовавшегося раствора выше pH, необходимой для стабильности указанных веществ.

Защелачивание может привести к образованию осадка лидокаина, поскольку последний слаборастворим при pH >6,5.

Особые указания

За исключением наиболее простых процедур, при проведении процедур регионарной и местной анестезии необходимо иметь наготове оборудование для реанимации. При любой крупной блокаде до начала введения анестетика необходимо установить внутривенную канюлю. Подобно прочим местным анестетикам, лидокаин может вызывать острые токсические явления со стороны центральной нервной и сердечно-сосудистой систем, если его применение приводит к высоким плазменным концентрациям, особенно при значительном внутрисосудистом введении.

Эпидуральная анестезия может приводить к тяжелым нежелательным реакциям, например, угнетению сердечно-сосудистой системы, особенно при сопутствующей гиповолемии. При нарушении сердечно-сосудистой функции во всех случаях следует соблюдать осторожность.

Основными причинами травматических поражений нервов и (или) местных токсических эффектов на мышцы и нервы является введение местного анестетика. Объем таких поражений зависит от размера травмы, концентрации местного анестетика и продолжительности воздействия местного анестетика на ткань. В этой связи необходимо вводить наименьшую эффективную дозу.

Значительные внутрисосудистые инъекции в области головы и шеи могут вызвать симптомы со стороны головного мозга даже в низких дозах.

Действие местных анестетиков снижается при введении в воспаленные или инфицированные области.

При эпидуральном введении анестетика возможно снижение артериального давления и брадикардия. Риск снижается при внутривенном введении кристаллоидных или коллоидных

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
ЛП 002505 - 170614
СОГЛАСОВАНО

растворов. Снижение артериального давления следует купировать, например, с помощью введения 5–10 мг эфедрина внутривенно, повторяя введения при необходимости.

При введении лидокаина в мышцу возможно повышение плазменной активности креатинфосфокиназы, что может затруднить диагностику острого инфаркта миокарда.

Не исключена порфирогенная активность лидокаина, поэтому его введение пациентам с острой порфирией следует осуществлять лишь при отсутствии других альтернатив. Необходимо соблюдать строгую осторожность у всех пациентов с порфирией.

Влияние на способность управлять автотранспортом и заниматься другими потенциально опасными видами деятельности

В зависимости от дозы и способа введения лидокаин может оказывать временное влияние на двигательную способность и координацию. В период лечения необходимо соблюдать осторожность при управлении транспортными средствами и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

Форма выпуска

Раствор для инъекций 20 мг/мл.

По 2 мл в ампулы из бесцветного прозрачного стекла с точкой надлома. На каждую ампулу наклеивают этикетку или наносят маркировку быстрозакрепляющейся краской.

По 10 ампул в блистер из ПВХ, по 1 блистеру вместе с инструкцией по применению в пачку из картона. По 5 ампул в блистер из ПВХ, по 2 блистера вместе с инструкцией по применению в пачку из картона.

Срок годности

3 года. Не применять по истечении срока годности.

Условия хранения

Хранить в защищённом от света месте при температуре не выше 25 °С.

Хранить в недоступном для детей месте.

Условия отпуска

По рецепту.

83600

МИНЗДРАВ РОССИИ
РУ ЛП-002383 - 170814
СОГЛАСОВАНО

Наименование и адрес юридического лица, на имя которого выдано регистрационное удостоверение:

ООО «АЛВИЛС»

Адрес: Россия, 109316, г. Москва, Остаповский проезд, д. 5, стр. 1

Тел: +7-495-775-71-61

Производитель:

Северная Китайская Фармацевтическая Корпорация Лтд.

№ 388 Хэпин Ист Роуд, Шицзячжуан, провинция Хэбэй, Китай

Организация, принимающая претензии потребителей:

ООО «АЛВИЛС»

Адрес: Россия, 109316, г. Москва, Остаповский проезд, д. 5, стр. 1

Тел: +7-495-775-71-61

Генеральный директор

ООО «АЛВИЛС»

Общество с ограниченной ответственностью "АЛВИЛС" * Москва * 1160044 * Г.Р. №

Ионов А. Г.

МЗ РФ
ФГБУ
ЭКСПЕРТНЫЙ ОТЧЕТ ДЕЙСТВИТЕЛЕН ДЛЯ ДАННОЙ ВЕРСИИ ДОКУМЕНТА
0 0 0 0 0 0 0 0 0 0 4
ЦЭККИМП

Больше информации об этом лекарстве на ПроТаблетки
https://protabletky.ru/lidocaine/