

УТВЕРЖДЕНО
Приказ Министерства
здравоохранения Украины
19.08.2016 № 872
Регистрационное удостоверение
№ UA/15384/01/01

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению лекарственного средства
ЛИДОКАИН
(LIDOCAINE)

Состав:

действующее вещество: lidocaine;

1 мл раствора содержит лидокаина гидрохлорида 10 мг;

вспомогательные вещества: натрия хлорид, натрия гидроксид 1 М раствор, 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. Лидокаин – мембраностабилизирующее средство группы амидов для местной анестезии. Он ингибирует чувствительные нервные окончания кожи и слизистых оболочек, то есть вызывает обратное угнетение проводимости тканевых элементов нервных клеток (нейрон, аксон, синапсы).

Механизм действия местноанестезирующих средств заключается в угнетении ионных потоков, которые являются обязательными для образования раздражителя – через нейронные мембраны.

Лидокаин подавляет активированное раздражителем транзиторное повышение проницаемости для ионов натрия и в меньшей степени снижает замедленную проницаемость для ионов калия и натрия, за счет чего он стабилизирует нейронные мембраны. Лидокаин уменьшает степень деполяризации, что происходит в ответ на физиологический раздражитель, а также амплитуду потенциала действия, и подавляет нервную проводимость.

Среди различных сенсорных способов действия местноанестезирующие средства прежде всего подавляют болевую чувствительность, которая сопровождается угнетением ощущения тепла и тактильных ощущений. Абсорбированный после местного применения Лидокаин может вызвать возбуждение или депрессию со стороны центральной нервной системы. Его влияние на сердечно-сосудистую систему может проявляться в виде нарушения проводимости и периферической вазодилатации.

Фармакокинетика. После парентерального введения лидокаин полностью всасывается. Степень абсорбции зависит от места введения препарата, наличия или отсутствия вазоконстриктора.

Кроме внутрисосудистого введения, высокие плазменные уровни лидокаина отмечаются при блокаде межреберных нервов, а самые низкие – при подкожном введении. Связывание с белками плазмы крови составляет 60-80 %. Лидокаин проникает через плацентарный и гематоэнцефалический барьеры.

Лидокаин быстро метаболизируется в печени, главным образом путем окислительного N-деалкилирования. Его метаболиты имеют такие же фармакологические и токсикологические эффекты, как и неизмененное соединение, но они менее мощные. Почти 90 % введенной дозы лидокаина выводится в виде метаболитов. Примерно 10 % введенной дозы выводится в неизмененном виде почками. Период полувыведения составляет 1,5-2 часа. У больных с заболеваниями печени период полувыведения длиннее.

Клинические характеристики.

Показания.

Местная анестезия (терминальная, инфильтрационная, проводниковая) в хирургии, офтальмологии, стоматологии, оториноларингологии; применяют как растворитель антибактериальных средств группы цефалоспоринов.

Противопоказания.

Повышенная чувствительность к компонентам препарата, другим амидным местноанестезирующим средствам, 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, АВ (AV) блокада II и III степени, гиповолемия, тяжелые нарушения функции печени/почек, порфирия, миастения, ретробульбарное введение больным глаукомой; противопоказано пациентам в первые три месяца после инфаркта миокарда с уменьшенным сердечным выбросом левого желудочка (менее 35 % от нормы); расстройства свертывания крови, антикоагулянтная терапия; инфекции в месте инъекции; противопоказано неконтактным пациентам; существенное снижение функции левого желудочка.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий.

При комбинированном применении лидокаина с такими препаратами, как *хлорпромазин, петидин, бупивакаин, хинидин, дизопирамид, амитриптилин, имипрамин, нотриптилин*, концентрация лидокаина в плазме крови снижается.

Антиаритмические препараты (в т. ч. амиодарон, верапамил, дизопирамид, аймалин) – усиливается кардиодепрессивное действие (происходит удлинение интервала QT, а в редких случаях возможно развитие АВ-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 вследствие ингибирования микросомального окисления), повышает его концентрацию и риск развития токсических эффектов. Также циметидин имеет синергический эффект при взаимодействии с лидокаином.

Гуанадрель, гуанетидин, микамиламин, триметафан – при комбинированном применении для спинальной и эпидуральной анестезии повышается риск выраженной артериальной гипотензии и брадикардии.

β-адреноблокаторы (например, пропранолол, метопролол) замедляют метаболизм лидокаина в печени, усиливают эффекты лидокаина (в т. ч. токсичные) и повышают риск

развития брадикардии и артериальной гипотензии. При одновременном применении β-адреноблокаторов и лидокаина необходимо уменьшать дозу последнего. Также β-блокаторы имеют синергетический эффект при взаимодействии с лидокаином; происходит ингибирующее влияние на сердечную проводимость, что может привести к повышению сократимости миокарда.

Сердечные гликозиды – ослабляется кардиотонический эффект сердечных гликозидов.

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

Наркотические анальгетики (морфин) – усиливается анальгезирующее действие наркотических анальгетиков, угнетение дыхания.

Ингибиторы моноаминоксидазы (фуразолидон, прокарбазин, селегилин) – 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, данапароидом, 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.

Пропафенон – возможно увеличение продолжительности и повышение тяжести побочных эффектов со стороны центральной нервной системы.

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.

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

Ацетазоламид, тиазидные и петлевые диуретики уменьшают эффект лидокаина, так как вызывают гипокалиемию.

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 есть риск развития токсических эффектов.

При взаимодействии лидокаина с другими антиаритмическими препаратами, например с антагонистами кальция, происходит ингибирующее влияние на сердечную проводимость, что может привести к повышению сократимости миокарда.

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.

С осторожностью назначать с диазепамом.

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), нежелательно: повышенная чувствительность к эпинефрину, артериальная гипертензия, сахарный диабет, глаукома или когда нужно кратковременное анестезирующее действие. Эпинефрин способствует замедлению всасывания лидокаина и пролонгирует его действие.

Особенности применения.

Перед применением лидокаина необходимо провести кожную пробу на индивидуальную чувствительность к препарату, о которой свидетельствует отек и покраснение места инъекции.

Введение лидокаина могут осуществлять 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/отменить препарат.

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

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 на участках, где размещено 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 у 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, так как возможны побочные эффекты: коллапс, одышка, судороги, обратимая слепота.

Поскольку лидокаин оказывает выраженное антиаритмическое действие и может сам выступать в качестве аритмогенного фактора, который 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 гипотонией умеренной степени, неполной АВ-блокадой, нарушением 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.

При внутримышечном введении лидокаина может повыситься концентрация креатинина, что может привести к установлению ошибочного 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 для больных, склонных к злокачественной гипертермии сомнительна, 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. Препарат проникает через плацентарный барьер и может вызвать брадикардию у плода, поэтому не рекомендуется назначать в период беременности. При необходимости применения препарата в период лактации кормление грудью следует прекратить.

Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или другими механизмами. Препарат влияет на функцию центральной нервной системы, поэтому после применения лидокаина не рекомендуется управлять транспортными средствами или другими механизмами.

Способ применения и дозы.

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

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

Максимальная доза для взрослых – 20 мл.

Для проводниковой анестезии (в т. ч. для обезболивания плечевого и крестцового сплетений) вводить 10-20 мл (100-200 мг лидокаина) препарата, *для анестезии пальцев конечностей, носа, ушей* – 4-6 мл (40-60 мг). Максимальная доза препарата для взрослых – 20 мл (200 мг).

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

Вмешательство	Лидокаин		
	Концентрация	Объем	Общая доза
Инфильтрация	5 мг/мл (0,5 %) или 10 мг/мл (1 %)	1-60 мл	5-300 мг
Через кожу			
Внутривенно	5 мг/мл (0,5 %)	10-60 мл	50-300 мг
Блокада периферических нервов			
Плечевое сплетение	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг
Стоматология	20 мг/мл (2 %)	1-5 мл	20-100 мг
Межреберный	10 мг/мл (1 %)	3 мл	30 мг
Паравертибральный	10 мг/мл (1 %)	3-5 мл	30-50 мг
Мочеполовая система	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Парацервикально			
Анестезия в акушерстве	10 мг/мл (1 %)	10 мл	100 мг
Симпатическая нервная блокада:			
цервикально	10 мг/мл (1 %)	5 мл	50 мг
люмбарно	10 мг/мл (1 %)	5-10 мл	50-100 мг
Блокада центральной нервной системы			
Эпидурально*	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
Люмбарно:	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
*Доза зависит от количества			

дерматомов (участков кожи), которые требуют анестезии (2-3 мл/дерматом)			
Каудальная анестезия:			
обезболивание в акушерстве	10 мг/мл (1 %)	20-30 мл	200-300 мг
обезболивание в хирургии	15 мг/мл (1,5 %)	15-20 мл	225-300 мг

Дети. Дозы для детей должны быть уменьшены, в соответствии с возрастом, массой тела и физическим состоянием.

Трудно рекомендовать максимальную дозу препарата для детей, поскольку она меняется в зависимости от возраста и веса. Для детей старше 3 лет с массой тела в пределах нормы максимальная доза определяется исходя из веса ребенка.

Например, для ребенка в возрасте 5 лет и весом около 23 кг доза лидокаина гидрохлорида не должна превышать 75-100 мг (3,2-4,3 мг/кг). Использование еще более разбавленных растворов (то есть 0,25-0,5 %) и суммарной дозы не более 3 мг/кг рекомендуется для введения для местной анестезии у детей.

Для предотвращения общей токсичности должна использоваться самая действующая доза. В некоторых случаях необходимо развести доступные концентрации 0,9% стерильным раствором натрия хлорида для достижения необходимой концентрации.

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 у здоровых добровольцев возникают при концентрации лидокаина в крови больше 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 центральной нервной системы корректируются применением бензодиазепинов/барбитуратов кратковременного действия. Если передозировка возникает в процессе анестезии, следует применять краткосрочный миорелаксант. Для коррекции брадикардии и нарушений проводимости применять атропин (0,5-1 мг), при артериальной гипотензии – симпатомиметики в комбинации с агонистами β-адренорецепторов.

При остановке сердца показано немедленное проведение реанимационных мероприятий. В острой фазе передозировки лидокаина диализ неэффективен. Специфического антидота нет.

Побочные реакции.

Со стороны нервной системы: беспокойство, сонливость, головокружение, головная боль, нарушение сна, спутанность сознания, потеря сознания, вплоть до комы, нарушения чувствительности, мышечные подергивания, судороги, моторный блок, дизартрия, дисфагия; стойкая анестезия, парез или элегия нижних конечностей и потеря управления сфинктером (например, синдром конского хвоста), покалывание кожи.

При применении в стоматологии: онемение языка и губ.

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

Со стороны органов зрения: нарушение зрения, нистагм, обратная слепота, диплопия, мелькание «мушек» перед глазами, светобоязнь, конъюнктивит.

Со стороны органов слуха и вестибулярного аппарата: вертиго, слуховые нарушения, шум или звон в ушах, гиперакузия.

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/понижение артериального давления, боли в сердце, приливы.

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, злокачественная гипертермия, отеки, слабость.

Местные реакции: в месте введения, ощущение легкого жжения, исчезающее с ростом анестезирующего эффекта в течение 1 мин, тромбоз, гиперемия.

При спинальной или эпидуральной анестезии может наблюдаться боль в спине, ногах, частичная/полная спинномозговая блокада, сопровождающаяся артериальной гипотонией, нарушением дефекации, непроизвольным мочеиспусканием, импотенцией и потерей чувствительности в области промежности (вероятность этих эффектов возрастает при применении высоких доз или при случайном введении лидокаина в спинномозговое пространство, когда доза, предназначенная для введения в эпидуральное пространство, проникает в спинномозговое пространство). В отдельных случаях после такого вмешательства восстановление двигательной, сенсорной и/или вегетативной функции происходит медленно (через несколько месяцев) или не в полной мере.

Срок годности. 2 года.

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

Несовместимость. Препарат не следует смешивать с другими лекарственными средствами в одном шприце. Лидокаин выпадает в осадок при смешивании с амфотерицином, метогеситоном или сульфадиазином. В зависимости от pH раствора лидокаин может быть несовместим с ампициллином.

Упаковка. В ампулах по 3,5 мл или по 5 мл, по 10 либо по 100 ампул в пачке или по 5 ампул в блистере, по 2 блистера в пачке.

Категория отпуска. По рецепту.

Производитель/заявитель. АО «Лекхим-Харьков».

Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности/местонахождение заявителя и/или представителя заявителя.

61115, Украина, г. Харьков, ул. семнадцатого Партсъезда, д. 36.

Дата последнего пересмотра.