

ИНСТРУКЦИЯ
по медицинскому применению препарата
ЛИДОКАИН-ЛИКВО™
раствор для инъекций

Торговое название: Лидокаин-Ликво

Международное непатентованное название: Лидокаин.

Лекарственная форма: раствор для инъекций 1% и 2%.

Состав: активное вещество: - лидокаина гидрохлорид - 10 г/л или 20 г/л; вспомогательное вещество - натрия хлорид, вода для инъекций.

Описание: Бесцветная или с желтоватым оттенком прозрачная жидкость.

Фармакотерапевтическая группа – местноанестезирующее средство, антиаритмик IB класса.

АТХ код: C01BB01, N01BB02

Фармакологические свойства

Лидокайн является местным анестетиком амидного типа. Вызывает все виды местной анестезии: терминалную, инфильтрационную, проводниковую. Механизм местноанестезирующего действия заключается в стабилизации нейрональной мембранны, снижении ее проницаемости для ионов натрия, что препятствует возникновению потенциала действия и проведению импульса. Со слизистых оболочек всасывается достаточно быстро и может оказывать системное действие.

Антиаритмический препарат IB класса, эффективен преимущественно при желудочковых аритмиях и экстрасистолиях. Оказывает мембраностабилизирующее действие. Блокирует медленный ток ионов натрия в клетках миокарда, и в связи с этим способен подавлять автоматизм эпикардиальных очагов импульсообразования. Функция проводимости при этом не угнетается. Способствует выходу ионов калия из клеток миокарда и ускоряет процесс реополяризации клеточных мембран, укорачивает продолжительность потенциала действия и эффективного рефрактерного периода. Эффект развивается быстро (примерно через 1 минуту после внутривенного и 15 минут после внутримышечного введения). Продолжительность действия составляет 10-20 минут после внутривенной и 60-90 минут после внутримышечной инъекции.

Фармакокинетика

Всасывание. При парентеральном применении растворов лидокаина абсорбция зависит от места инъекции, дозы препарата, степени васкуляризации тканей. За исключением внутривенного введения, самая высокая концентрация лидокаина в крови отмечается при межреберной блокаде и самая низкая – после подкожного введения.

Распределение. Распределяется во всех тканях, прежде всего в хорошо кровоснабжаемых органах: сердце, почках, печени, селезенке, затем в жировой и мышечной ткани. Связь с белками плазмы - 60-80 %. Проникает через гемато-энцефалический и плацентарный барьеры.

Метabolизм. Метаболизируется в печени (около 90 %) с образованием двух фармакологически активных метаболитов.

Выделение. Элиминируется с мочой в виде метаболитов. Период полувыведения составляет 1 – 2 ч. Выделение препарата замедляется при нарушении функции печени.

Показания к применению

Желудочковые аритмии (экстрасистолия, тахикардия), особенно в остром периоде инфаркта миокарда.

Все виды местной анестезии (инфилтратационная, проводниковая, эпидуральная анестезия, блокада периферических нервов).

Противопоказания

Повышенная чувствительность к лидокайну или другим местным анестетикам из группы амидов, выраженная брадикардия, выраженная артериальная гипотензия, синоатриальная и/или атриовентрикулярная блокада, кардиогенный шок, тяжелые формы хронической сердечной недостаточности, синдром слабости суновского узла, полная блокада сердца, гиповолемия, порфирίя, синдром Адамса-Стокса, синдром Вольфа-Паркинсона-Уайта.

С осторожностью применяется препарат у пациентов с эпилепсией, миастенией гравис, нарушением проводимости сердца, застойной сердечной недостаточностью, брадикардией и угнетением дыхания, тяжелым шоком, нарушением дыхательной, почечной (клиренс креатинина < 10 мл/мин) или печечночной функций. При застойной сердечной недостаточности и после операции на сердце следует применять низкие дозы препарата.

Способ применения и дозы

В кардиологии:

Взрослым вводят внутривенно струйно 50-100 мг со скоростью 25-50 мг в минуту. Эта доза может повторяться через каждые 5-10 минут. Однако, суммарная доза препарата, введенная в течение 1 часа не должна превышать 200-300 мг. Пожилым пациентам, пациентам с застойной сердечной недостаточностью или кардиогенным шоком могут потребоваться более низкие дозы.

Внутривенно капельно препарат вводят в дозе 20-50 мкг/кг/мин (1-4 мг в минуту для больного весом ~ 70 кг). Для инфузии препарат разводят в 5% растворе глюкозы или 0,9% растворе натрия хлорида до концентрации 2-4 мг/мл. У больных с застойной сердечной недостаточностью или нарушением функции печени необходима более низкая скорость инфузии. Не требуется коррекция дозы у пациентов с почечной недостаточностью. В случае возникновения аритмий во время инфузии лидокаина необходимо струйное внутривенное введение малых доз лидокаина для быстрого увеличения концентрации препарата в плазме; соответственно увеличивается и скорость инфузии. При восстановлении сердечного ритма, а также при начальных признаках интоксикации инфузию следует прекратить.

К внутривенному капельному введению переходят только после струйного.

Детям возможно внутривенное струйное введение в начальной дозе 0,5-1 мг/кг. Эта доза может повторяться, однако, суммарная доза препарата не должна превышать 3-5 мг/кг. Возможна поддерживающая внутривенная инфузия в дозе 10-50 мкг/кг/мин с помощью инфузионного насоса.

Во избежание потенциальной передозировки и интоксикации, введение лидокаина должно проводиться под ЭКГ мониторингом. При недоступности оборудования для ЭКГ мониторинга, необходимо ограничиться одним внутримышечным введением дозы препарата (предпочтительно в deltoidовидную мышцу), при отсутствии брадикардии.

Местная анестезия:

Детям, пожилым и ослабленным пациентам препарат вводят в меньших дозах, соответствующих их возрасту и физическому состоянию.

Во избежание развития токсических реакций, у детей рекомендуется применение растворов лидокаина с низкой концентрацией (0,5%, 1%).

У взрослых и детей старше 12 лет разовая доза лидокаина не должна превышать 4,5 мг/кг (или 200 мг).

У детей в возрасте до 12 лет при проведении местной инфильтрационной анестезии доза лидокаина не должна превышать 3 мг/кг, при необходимости возможны повторные введения с интервалом не менее 4 часов.

При непрерывной эпидуральной или каудальной анестезии, а также при парацервикальной блокаде в акушерской практике (включая аборты) интервал между введениями максимальной дозы (200 мг) должен составлять не менее 1,5 часа.

Для внутривенной региональной анестезии у взрослых, с использованием 0,5% раствора лидокаина, вводимая доза не должна превышать 4 мг/кг.

Для эпидуральной или каудальной анестезии применяется 1% раствор лидокаина гидрохлорида (без консерванта). Во избежание внутрисосудистого или субарахноидального введения препарата при эпидуральной анестезии, тестовую дозу 2-5 мл следует вводить в течение не менее 5 минут, до введения общей дозы.

При эпидуральной анестезии обычно требуется 2-3 мл 1% раствора для каждого сегмента.

При каудальной анестезии в акушерской практике или при эпидуральной анестезии в грудном отделе: 20-30 мл 1% раствора (200-300 мг).

Поясничная эпидуральная анестезия: 25-30 мл (250-300 мг) 1% раствора.

Блокада межреберных нервов: 3 мл 1% раствора (30 мг).

Паравertebralная блокада: 3-5 мл 1% раствора (30-50 мг).

Пудентальная анестезия (с каждой стороны): 10 мл 1% раствора (100 мг).

Парацервикальная анестезия в акушерстве (с каждой стороны): 10 мл 1% раствора (100 мг).

Блокада шейного нерва (звездчатый ганглий): 5 мл 1% раствора (50 мг).

Блокада поясничного нерва: 5-10 мл 1% раствора (50-100 мг).

Для подкожной инфильтрационной анестезии: 1-60 мл 0,5% раствора или 0,5-30 мл 1% раствора (5-300 мг).

Внутривенная региональная анестезия: 10-60 мл 0,5% раствора (50-300 мг).

Побочное действие

Подобно другим местным анестетикам, нежелательные реакции на лидокаин редки и, как правило, обусловлены повышенной плазменной концентрацией, вследствие случайного внутрисосудистого введения, превышения дозы или быстрой абсорбции из участков с обильным кровоснабжением; либо вследствие гиперчувствительности, идиосинкрезии или плохой переносимости препарата некоторыми пациентами. Реакции системной токсичности, главным образом, проявляются со стороны центральной нервной и (или) сердечно-сосудистой систем.

Во время региональной анестезии, при интракалярном или экстрадуральном введении лидокаина возможно развитие гипотензии, гиповентиляции, Синдрома Горнера и гипогликемии. Степень выраженности этих эффектов будет зависеть от дозы и места блокады. При эпидуральной анестезии на уровне поясничного и крестцового отделов возможна задержка мочи. Апноэ и гемипарез могут возникать при блокаде звездчатого ганглия (вероятно из-за введения лидокаина в позвоночные или сонные артерии).

Со стороны иммунной системы: Реакции гиперчувствительности (аллергические или анафилактоидные реакции, анафилактический шок). Кожная аллергическая проба на лидокаин считается ненадежной.

Со стороны ЦНС: Головокружение, нервозность, трепор, парестезия вокруг рта, онемение языка, сонливость, судороги, кома. Реакции со стороны нервной системы могут проявляться ее возбуждением или угнетением. Признаки стимуляции ЦНС могут быть непродолжительными или не возникать вовсе, вследствие чего первыми проявлениями токсичности

могут служить признаки угнетения ЦНС - спутанность сознания и сонливость, сменяющиеся комой и дыхательной недостаточностью.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: Брадикардия, артериальная гипотензия, аритмия, угнетение сократительной функции миокарда. Возможна остановка сердца или недостаточность кровообращения.

Нарушения со стороны дыхательной системы: Одышка, бронхоспазм, угнетение дыхания, остановка дыхания.

Нарушения со стороны органа зрения: Затуманенное зрение, диплопия и преходящий амавроз. Двусторонний амавроз также может быть следствием случайного введения в ложе зрительного нерва в ходе офтальмологических процедур. После ретро- и периферической анестезии сообщалось о воспалении глаза и диплопии.

Нарушения со стороны органа слуха: Шум в ушах, гиперакутизия.

Со стороны органов ЖКТ: Тошнота, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей: Сыпь, крапивница, ангидровротический отек, отек лица.

Со стороны кроветворной и лимфатической системы: Метемглобинемия.

Передозировка

Симптомы

Токсичность со стороны ЦНС проявляется симптомами, нарастающими по тяжести. Сначала может развиться парестезия вокруг рта, онемение языка, головокружение, гиперакутизия и шум в ушах. Наружение зрения и мышечный трепет или мышечные подергивания свидетельствуют о более серьезной токсичности и предшествуют генерализованным судорогам. После могут наступить потеря сознания и большие судорожные припадки продолжительностью от нескольких секунд до нескольких минут. Судороги приводят к быстрому нарастанию гипоксии и гиперкапнии, обусловленной повышенной мышечной активностью и нарушением дыхания. В тяжелых случаях может развиться апноэ. Ацидоз усиливает токсические эффекты местных анестетиков.

В тяжелых случаях возникают нарушения со стороны сердечно-сосудистой системы. При высокой системной концентрации могут развиться артериальная гипотензия, брадикардия, аритмия и остановка сердца, которые могут оказаться летальными.

Впоследствии, из-за перераспределения анестетика из ЦНС и его последующего метаболизма и экскреции, происходит достаточно быстрое восстановление функций, если только не была введена большая доза препарата.

Лечение

При появлении первых признаков острой системной токсичности следует немедленно прекратить введение препарата. При появлении судорог и симптомов угнетения ЦНС больному требуется адекватное лечение, целью которого является поддержание оксигенации, купирование судорог, поддержание деятельности сердечно-сосудистой системы. Следует обеспечить оксигенацию кислородом, а при необходимости – переход на искусственную вентиляцию легких. При угнетении деятельности сердечно-сосудистой системы (снижение АД, брадикардия) необходимо соответствующее лечение (внутривенное введение жидкостей, вазопрессоров, хронотропных и инотропных препаратов). При развитии циркуляторной недостаточности или остановке сердца следует немедленно начать стандартные реанимационные мероприятия. Жизненно важно поддерживать оптимальную оксигенацию, вентиляцию и циркуляцию крови, а также корректировать ацидоз.

Эффективность диализа при лечении острой передозировки лидокаином очень низкая.

Особые указания

Перед началом внутривенного введения лидокаина необходимо устранить гипокалиемию, гипоксию и нарушение кислотно-основного состояния.

Препарат следует использовать при наличии реанимационной аппаратуры и лекарственных средств для купирования токсических реакций.

При введении в воспаленные или инфицированные ткани анестезирующий эффект лидокаина может снижаться.

Лидокаин при внутрисуставном введении может оказывать хондротокическое действие.

Следует избегать применения препарата у пациентов с острой порфирией, так как есть предположение, что лидокаин может вызывать порфирию.

Внутримышечное введение лидокаина может увеличить концентрацию креатининфосфориназы, что может помешать диагностике острого инфаркта миокарда.

Некоторые процедуры местной анестезии могут приводить к серьезным нежелательным реакциям, независимо от применяемого местного анестетика:

- Центральная блокада может приводить к угнетению сердечно-сосудистой системы, особенно на фоне гиповолемии; соблюдать осторожность при проведении эпидуральной анестезии пациентам с сердечно-сосудистыми нарушениями.

- Эпидуральная анестезия может приводить к артериальной гипотензии и брадикардии. Риск можно снизить предварительным введением кристаллоидных или коллоидных растворов. Необходимо немедленно купировать артериальную гипотензию.

- В некоторых случаях парацервикальная блокада при беременности может приводить к брадикардии или тахикардии у плода, в связи с чем требуется тщательный мониторинг ЧСС у плода.

- Введение в область головы и шеи может привести к непреднамеренному попаданию в артерию с развитием церебральной симптоматики, даже в низких дозах.

- Ретробульбарное введение в редких случаях может приводить к попаданию лидокаина в субарахноидальное пространство черепа, что может сопровождаться серьезными/тяжелыми реакциями, включая сердечно-сосудистую недостаточность, апноэ, судороги и временную слепоту.

- Ретро- и периферическую введение местных анестетиков несет низкий риск стойкой глазодвигательной дисфункции. К основным причинам относят травму и (или) местное токсическое действие на мышцы и (или) нервы.

Тяжесть подобных реакций зависит от степени травмы, концентрации местного анестетика и продолжительности его экспозиции в тканях. В связи с этим любой местный анестетик необходимо применять в наименьшей эффективной концентрации и дозе.

Препарат не рекомендуется применять у новорожденных.

Так как препарат содержит 55 мг натрия в каждом флаконе (20 мл), с осторожностью применять у пациентов, соблюдающих бессолевую диету.

С осторожностью следует вводить растворы лидокаина в сильно васкуляризованные ткани, во избежание интравазального попадания препарата (например, в область шеи при операциях на щитовидной железе); в таких случаях показаны меньшие дозы препарата.

Раствор лидокаина, содержащий эpineфрин, нельзя использовать в качестве антиаритмического средства.

Применение в период беременности и кормления грудью

В период беременности и кормления грудью препарат можно назначать только в случае острой необходимости.

Влияние на способность водить и использовать машины

После применения лидокаина не рекомендуется заниматься видами деятельности, требующими высокой концентрации внимания и быстрых психомоторных реакций.

Лекарственное взаимодействие

Лидокайн следует с осторожностью применять у пациентов, получающих другие местные анестетики или средства, структурно сходные с местными анестетиками амидного типа (н/р, антиаритмиками, такими как мексилетин), поскольку системные токсические эффекты носят аддитивный характер. Отдельные исследования лекарственного взаимодействия между лидокаином и антиаритмиками III класса (н/р, амиодароном) не проводились, однако рекомендуется соблюдать осторожность.

Лидокаин может усиливать и удлинять действие миорелаксантов (н/р суксаметоний).

При одновременном применении с циметидином и пропранололом токсичность лидокаина увеличивается (вследствие повышения его концентрации), что требует снижения дозы лидокаина. Повышение сывороточной концентрации лидокаина также могут вызывать противовирусные средства (н/р, ампренавир, атазанавир, дарунавир, лопинавир).

При одновременном применении с антипсихотическими средствами, удлиняющими или способными удлинять интервал QT (пимозид, сертindол, оланzapин, кветиапин, зотепин), или антиагонистами 5-HT₃-серотониновых рецепторов (трописетрон, доласетрон) может повышаться риск желудочных аритмий.

Совместное применение с эpinefрином может снизить системную абсорбцию, но при случайном внутривенном введении резко возрастает риск желудочной тахикардии и фибрилляции желудочков.

Следует избегать совместного применения с хинутистилом/дафлопростилем.

Гипокалиемия, вызываемая диуретиками, может снижать действие лидокаина при их одновременном применении.

При одновременном применении с ингибиторами CYP1A2, (флуоксамин) и ингибиторами CYP3A4 (эрбитромицин) возможно повышение плазменной концентрации лидокаина.

Индукторы микросомальных ферментов печени (н/р фенитоин) могут снизить концентрацию лидокаина в крови.

Опиоиды, вероятно, обладают проконвульсивным действием, что подтверждается данными, что лидокаин снижает судорожный порог к фентанилу у человека.

Комбинация опиоидов и противорвотных средств, иногда применяемая в целях седации у детей, может снизить судорожный порог к лидокаину и повысить его угнетающее действие на ЦНС.

Форма выпуска. Раствор для инъекций 1% или 2% во флаконах из стекла по 20 мл. 10 флаконов вместе с инструкциями по применению в картонном блоке.

Условия хранения. Хранить при температуре не выше 25 °C в защищенном от света месте.

Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности. 2 года. Не использовать препарат после истечения срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска из аптек. По рецепту.

Производитель



ЗАО «Ликворт», Армения
0089, Ереван, Коинянья 7/9

Тел: 37460 378800

E-mail: info@liqvor.com