

ЗАТВЕРДЖЕНО
Наказ Міністерства охорони
здоров'я України
15.12.2016 № 1345
Реєстраційне посвідчення
№ UA/4935/01/01

ІНСТРУКЦІЯ
для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКАІН-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 %.

ОРИГІНАЛ



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 уведенням 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; повна поперечна блокада серця; 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, іміпрамін, 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 мікосомального 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.

Пропафенон – 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 болочості 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 внутрішньощуночкової 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 сплетіння) 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 - 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, епінефрина (адреналіна), є небажаною (підвищена чутливість до епінефрину, артеріальна гіпертензія, цукровий діабет, глаукома) або потрібна короточасна 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, астенія, 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 короточасної 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 спазми, 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, анафілактичні реакції; 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, злоякісна 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.

Дата останнього перегляду.

Подпис

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного дос'є

Узгоджено з матеріалами
реєстраційного дос'є

текст узгоджено