

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ЛИДОКАИН ДС 20 mg/ml инжекционен разтвор
LIDOCAIN DS 20 mg/ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 ml разтвор съдържа като активно вещество 20 mg Лидокаинов хидрохлорид (*Lidocaine Hydrochloride Eur.Ph.*).

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.

Бистър и безцветен стерилен разтвор.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

За инфилтрационна анестезия, проводна анестезия и нервна блокада.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Дозировката се адаптира според терапевтичния отговор и мястото на приложение. По принцип трябва да се прилага най-ниската възможна доза и концентрация на лидокаин, с която може да се постигне необходимият анестетичен ефект.

Препоръчителна дозировка:

Възрастни – като правило максималната доза за възрастни е 3 mg/kg тегло или 200 mg.

Пациенти в старческа възраст – препоръчват се по-ниски дози при пациенти на възраст над 60 г.

Деца – дозировката се изчислява на база телесно тегло. Прилага се доза до 3 mg/kg, съответстваща на 0,15 ml 2 % разтвор на лидокаин/ kg тегло.

Дозировката трябва да се намали при пациенти със сърдечна недостатъчност, чернодробни заболявания и такива, приемащи лекарствени продукти, които увеличават ефектите на лидокаин (виж т.4.5).

Начин на приложение – интрамускулно, вътрекожно, подкожно при инфилтрационна анестезия; перинеурално или епидурално инжектиране при проводна анестезия.

Начинът на приложение зависи от техниката на анестезията и хирургичната интервенция.

Необходимо е внимание за избягване на нежелано интраваскуларно инжектиране на лидокаин.

Препоръчва се внимателна аспирация по време на инжектиране. Когато се инжектира голяма доза, например при епидурално прилагане, се препоръчва тест доза от 3-5 ml лидокаин с адреналин.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към лидокаин или към някое от помощните вещества на продукта, изброени в т. 6.1.
- Свръхчувствителност към други анестетици от амиден тип.

4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Както всеки друг анестетик, лидокаин трябва да се използва с повишено внимание при пациенти, страдащи от епилепсия, нарушена сърдечна проводимост, застойна сърдечна недостатъчност.

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА	
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1	
Към Рег. №	20080458
Разрешение №	BG/MK/MP-44368-9
Одобрение №	УМ-4263/ 28-01-2019



брадикардия или нарушена дихателна функция, ако дозата или начина на приложение е възможно да предизвикат високи кръвни нива.

Лидокаин се метаболизира в черния дроб и трябва да се прилага с повишено внимание при пациенти с нарушена чернодробна функция.

Изисква се повишено внимание, за да се избегне случайно вътресъдово попадане с ранни признаци на токсичност и признаци от страна на ЦНС, като възбуда, спазми или конвулсии, последвани от кома с апнея (спиране на дишането) и сърдечно-съдов колапс. Трябва да е налице апаратура за реанимация.

Продуктът може да предизвика алергия и /реакции на свръхчувствителност.

Абсорбцията от лигавиците, например респираторния тракт може да предизвика плазмени концентрации близки до тези при интравенозно приложение; голямо внимание се изисква, когато се анестезират лигавици или други богато кръвоснабдени полета особено ако са възпалени или травмирани.

Този лекарствен продукт съдържа по-малко от 1 mmol (23 mg) натрий на доза, т.е. по същество е без съдържание на натрий.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Активността на лидокаин намалява силно в кисела среда (възпалително огнище), при уремия и едновременно прилагане с глюкоза и калциеви продукти. Анестетичният му ефект се засилва и удължава от аналгетици, транквилизатори и общи анестетици.

Антипсихотици (султоприд) – едновременното приложение на лидокаин и султоприд може да доведе до поява на полиморфна камерна тахикардия (torsades de pointes) и е противопоказно.

Когато адреналин (епинефрин) се използва заедно с лидокаин, може да намали съдовата резорбция на лидокаин, да повиши опасността от вентрикуларна тахикардия или фибриляция, ако случайно попадне интравенозно.

Бета блокерите (пропранолол, метопролол) и циметидин потискат чернодробния метаболизъм на лидокаин. При едновременно използване с бета блокер или циметидин дозата на лидокаин трябва да се намали.

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Лидокаин не трябва да се използва по време на бременност, освен в случаите когато ползата надвишава риска.

Дозата, която се прилага трябва да е възможно най-ниската.

Лидокаин преминава през плацентарната бариера и при новородени може да предизвика фетална или неонатална токсичност, включително промени в ЦНС, периферния съдов тонус и сърдечната функция.

Лидокаин преминава в млякото, поради което трябва внимателно да се прилага по време на кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Поради ефектите на лидокаин върху ЦНС способността за шофиране и работа с машини може да бъде нарушена, когато се прилага като локален анестетик в стоматологията или хирургически манипулации. Пациентите трябва да избягват тези дейности, до възстановяване на нормалните функции.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите реакции след приложение на лидокаин са дозо-зависими и са резултат от повишени плазмени нива при предозиране, бърза резорбция от богато кръвоснабдени тъкани, инцидентно интраваскуларно инжектиране, или могат да се дължат на свръхчувствителност. Системната токсичност на лидокаин засяга главно нервната система /или сърдечно-съдовата система.

Нежеланите реакции са систематизирани по система-орган-клас и категория честота както следва.



много чести ($\geq 1/10$); чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$); редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1000$); много редки ($< 1/10\ 000$); с неизвестна честота (не може да бъде определена от наличните данни).

Нарушения на нервната система:

Чести: парестезии, световъртеж.

Нечести: признаци и симптоми на токсичност от страна на ЦНС (конвулсии, тремор, втвърдяване на езика, дизартрия, потискане на ЦНС).

Редки: невропатия, увреждане на периферни нерви (вкл. синдром на cauda equina), удължена нервна блокада, арахноидит.

Сърдечни нарушения:

Чести: брадикардия.

Редки: сърдечна аритмия, сърдечен арест.

Съдови нарушения:

Чести: хипотония, хипертония.

Стомашно-чревни нарушения:

Чести: гадене, повръщане.

Нарушения на ухото и лабиринта:

Нечести: хиперакузис, тинитус.

Нарушения на очите:

Редки: смущения в зрението, диплопия.

Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения:

Редки: респираторна депресия.

Нарушения на имунната система:

Редки: алергични реакции, анафилаксия/шок.

Нарушения на кръвта и лимфната система:

Редки: метхемоглобинемия.

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Съобщаването на подозирани нежелани реакции след разрешаване за употреба на лекарствения продукт е важно. Това позволява да продължи наблюдението на съотношението полза/риск за лекарствения продукт. От медицинските специалисти се изисква да съобщават всяка подозирана нежелана реакция чрез национална система за съобщаване в Изпълнителна агенция по лекарствата ул. "Дамян Груев" № 8, 1303 София, Тел.: +35928903417, уебсайт: www.bda.bg.

4.9. Предозиране

Симптоми

Конвулсии, загуба на съзнание или кома, респираторна депресия или апнея, шок, нарушена атриовентрикуларна проводимост.

Лечение, антидот

Прилагането на продукта се спира. Прилага се кислород или асистирана вентилация при нужда.

За спиране на гърчовете се инжектира венозно диазепам или краткочействащи барбитурати.

В случаи на рязко падане на кръвното налягане се осигурява подходяща позиция на пациента с нископоставена глава и се прилага ефедрин 15-30 mg за предизвикване на вазоконстрикция и повишаване на кръвното налягане; вливане на обемо-заместващи течности.

В случаи на брадикардия се прилага атропин i.v. При необходимост може да се приложи временен пейсмейкър.



Няма специфичен антидот.
Лидокаин не се диализира.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Локални анестетици. Амиди.
АТС код: N01BB02.

Механизъм на действие

Лидокаин е локален анестетик с амидна структура, който се използва за всички видове локална анестезия. Предизвиква временна обратима блокада на периферните нервнорецептори и предаването на нервния импулс по аферентните влакна при пряк и непряк контакт с тях, без да уврежда нервните структури. Лидокаин стабилизира плазматичната мембрана и по този начин противодейства на процесите на деполяризация. Ефектът му е свързан с влияние върху калциевия поток към и извън клетката и с повлияването на калций зависимите процеси на промяна в пермеабилитета на клетъчната мембрана на нервните влакна. Той оказва влияние върху потенциала на покой, което довежда до намаляване на преминаването на натриеви и калиеви йони през клетъчната мембрана на невроните. Това води до намаляване на скоростта на деполяризация и покачване на праговата граница на възбудимост, което води до временна локална липса на чувствителност.

Фармакодинамични ефекти

Локална анестезия представлява загуба на усещане в част от тялото, без загуба на съзнание или увреждане на централния контрол на жизнените функции. Тя предлага две основни предимства:

- първо – избягват се физиологични смущения, свързани с обща анестезия;
- второ – неврофизиологични отговори на болката и стреса могат да бъдат променени благоприятно.

Локалните анестетици предотвратяват иницирането и размножаването на нервни импулси (потенциал на действие). В резултат на блокиране на преминаването на натриеви йони през натриевите йонни канали в нервните окончания, те увеличават прага на възбудимост, а в резултат на това се блокира проводимостта на аферентните нервни окончания. Влакната в нервните стволчета биват засегнати от деполяризацията в съответствие с техните размери:

- първо най-малките (автономни, сетивни нервни влакна) – вероятно защото те имат пропорционално по-голяма площ
- и след това – по-големите (моторни) нервни влакна.

В резултат от тези процеси ефектът в ЦНС е стимулация.

Клинична ефикасност и безопасност

Действието на лидокаина започва бързо (около една минута след интравенозно инжектиране и петнадесет минути след интрамускулно инжектиране) като бързо се разпределя в околните тъкани. Ефектът му продължава около десет-двадесет минути след интравенозно приложение и около шестдесет минути след интрамускулно инжектиране.

При локална анестезия, интрадермално инжектиране: ефектът на лидокаина продължава 10 мин.

Педиатрична популация

Опитът с приложението на лидокаина в педиатричната практика е ограничен. За да се минимизира възможността от възникване на токсични реакции при деца общата доза не трябва да превишава оптималната (посочена в т.4.2).

5.2. Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Лидокаинът се абсорбира в стомашно-чревния тракт и се метаболизира бързо в черния дроб. Абсорбират се само 35 % от лекарствения продукт и приложението на дози от 250 до 500 mg при



възрастни има като резултат достигането на субтерапевтични концентрации. Адекватни терапевтични концентрации се постигат при инжектиране на лидокаин в добре кръвоснабдени участъци (напр. делтоидния мускул е за предпочитане пред големия седалищен мускул или vastus lateralis).

Факторите, които повлияват системната абсорбция на локално приложеният лидокаин са: мястото на инжектирането му, терапевтичната доза, концентрацията на лекарствения продукт, добавянето или не на вазоконстриктор напр. епинефрин. Съществува линейна зависимост между дозата и плазмената концентрация на лидокаин.

- Терапевтична плазмена концентрация: 3 -5,5 µg/ml;
- Токсична плазмена концентрация – над 6 µg/ml.

Разпределение

Обемът на разпределение (V_d) е средно 1,7 l/kg, като намалява средно до 1 l/kg при болни пациенти със сърдечна недостатъчност. Потенциалът за свързване на лидокаин с плазмените протеини е около 51 %.

Разпределението на лидокаина е във всички телесни органи. Като цяло, органите с по-висока перфузия показват по-високи концентрации на лидокаин.

Времето за разпределение на лидокаин е 15 до 30 мин.

Биотрансформация

В черния дроб се метаболизира 90 % от приложената доза. При венозно инжектиране лидокаин се метаболизира бързо от чернодробните микрозомни ензими. Основният път за метаболизиране на лидокаина черния дроб включва окислително де-етилиране до monoethylglycinexylidide, последвано от хидролиза до xylidide. Два фактора определят неговата ефективност – активността на тези ензими и чернодробния кръвоток. До момента са установени два основни активни метаболита, които определят неговите фармакологични и токсични ефекти - monoethylglycinexylidide и glycinexylidide.

Елиминиране

Времето на полуелиминиране варира между 1 и 2 часа (средно 100 минути) и показва изразена дозова зависимост. Лидокаинът се елиминира от организма чрез бъбречна екскреция основно под формата на метаболити (90 %), а останалите 10 % от приложената доза се елиминират в непроменен вид.

Бъбречната екскреция на лидокаина е обратно пропорционална на неговия протеин свързващ афинитет и рН на урината. Това предполага, че отделянето на лидокаин става чрез не-йонна дифузия. Лидокаин преминава през плацентата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

LD_{50} за лидокаин при перорално приложение върху мишки е 292 mg/kg т.м.

Експерименталните изследвания върху плъхове и кучета при използване на дози надвишаващи средно 6,6 пъти терапевтичните дози използвани в хуманната медицина показват, че лидокаин не оказва негативно действие върху репродуктивната способност на тези опитни видове, както и не притежава ембриотоксично и тератогенно действие в условията на тези експерименти.

Няма съобщения за мутагенно, респ. канцерогенно действие на продукта.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Натриев хлорид

Вода за инжекции.

6.2. Несъвместимости

Лидокаинов хидрохлорид е несъвместим с разтвори, съдържащи натриев бикарбонат, амфотерицин, сулфадиазин натрий, метохекситон натрий и други алкални разтвори. Лидокаин не трябва да се смесва с такива разтвори.



6.3. Срок на годност

5 години.

6.4. Специални условия на съхранение

При температура под 25°C, на сухо и защитено от светлина място.
Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Вид и съдържание на опаковката

Първична опаковка

Самочупещи се ампули от безцветно неутрално стъкло, I-ви хидролитичен клас, с вместимост 2 ml.
Ампулите се поставят в блистери от PVC фолио.

Вторична опаковка

Единични блистери (10 ампули), заедно с листовка за пациента се поставят в клиширани, сгъваеми картонени кутии.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

Неизползваният продукт или отпадъчните материали от него трябва да се изхвърлят в съответствие с местните изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

ДАНСОН-БГ ООД,
2400 гр. Радомир, България,
ул. „Отец Паисий“ №26,
тел.: 02 451 93 00,
e-mail: office@danhson.bg

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Първоначално разрешение за употреба: П-5994.
Подновяване: П-29834.

Рег.№ 20090458

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Дата на първо разрешение: 12.10.2009 г.
Дата на последно подновяване: 16.06.2015 г.

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Ноември, 2018 г.

