Геликаин



Международное непатентованное название (Действующее вещество):

- Лидокаин

Полезные ссылки:

Цена в Яндексе Горздрав Столички Апрель
Госреестр[МНН] Википедия[МНН] Реестр ЕАЭС
РЛС VIDAL Mail.Ru Drugs.com[англ]

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Антиаритмическое средство класса IB, местный анестетик, производное ацетанилида. Обладает мембраностабилизирующей активностью. Вызывает блокаду натриевых каналов возбудимых мембран нейронов и мембран кардиомиоцитов.

Уменьшает продолжительность потенциала действия и эффективного рефрактерного периода в волокнах Пуркинье, подавляет их автоматизм. При этом лидокаин подавляет электрическую активность деполяризованных, аритмогенных участков, но минимально влияет на электрическую активность нормальных тканей. При применении в средних терапевтических дозах практически не изменяет сократимость миокарда и не замедляет AV-проводимость. При применении в качестве антиаритмического средства при в/в введении начало действия через 45-90 сек, длительность - 10-20 мин; при в/м введении начало действия через 5-15 мин, длительность - 60-90 мин.

Вызывает все виды местной анестезии: терминальную, инфильтрационную, проводниковую.

Фармакокинетика

После в/м введения абсорбция практически полная. Распределение быстрое, V_d составляет около 1 л/кг (у пациентов с сердечной недостаточностью ниже). Связывание с белками зависит от концентрации активного вещества в плазме и составляет 60-80%. Метаболизируется главным образом в печени с образованием активных метаболитов, которые могут способствовать проявлению терапевтического и токсического действия, особенно после инфузии в течение 24 ч и более.

$T_{1/2}$ имеет тенденцию к двухфазности с фазой распределения 7-9 мин. В целом $T_{1/2}$ зависит от дозы, составляет 1-2 ч и может увеличиваться до 3 ч и более во время длительных в/в инфузий (более 24 ч). Выводится почками в виде метаболитов, 10% в неизмененном виде.

Показания к применению:

В кардиологической практике: лечение и профилактика желудочковых аритмий (экстрасистолия, тахикардия, трепетание, фибрилляция), в т.ч. в остром периоде инфаркта миокарда, при имплантации искусственного водителя ритма, при гликозидной интоксикации, наркозе.

Для анестезии: терминальная, инфильтрационная, проводниковая, спинномозговая (эпидуральная) анестезия в

хирургии, акушерстве и гинекологии, урологии, офтальмологии, стоматологии, оториноларингологии; блокада периферических нервов и нервных узлов.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Аритмия
- Интоксикация
- Инфильтраты
- Кардит
- Миокардит
- Стоматит
- Тахикардия
- Фиброз
- Экстрасистолия

Противопоказания:

Тяжелые кровотечения, шок, артериальная гипотензия, инфицирование места предполагаемой инъекции, выраженная брадикардия, кардиогенный шок, тяжелые формы хронической сердечной недостаточности, СССУ у пациентов пожилого возраста, AV-блокада II и III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков), тяжелые нарушения функции печени.

Для субарахноидальной анестезии - полная блокада сердца, кровотечения, артериальная гипотензия, шок, инфицирование места проведения люмбальной пункции, септицемия.

Повышенная чувствительность к лидокаину и другим местным анестетикам амидного типа.

Способ применения и дозы:

В качестве антиаритмического средства взрослым при введении нагрузочной дозы в/в - 1-2 мг/кг в течение 3-4 мин; средняя разовая доза 80 мг. Затем сразу переходят на капельную инфузию со скоростью 20-55 мкг/кг/мин. Капельную инфузию можно проводить в течение 24-36 ч. При необходимости на фоне капельной инфузии можно повторить в/в струйное введение лидокаина в дозе 40 мг через 10 мин после первой нагрузочной дозы.

В/м вводят по 2-4 мг/кг, при необходимости повторное введение возможно через 60-90 мин.

Детям при в/в введении нагрузочной дозы - 1 мг/кг, при необходимости возможно повторное введение через 5 мин. Для непрерывной в/в инфузии (обычно после введения нагрузочной дозы) - 20-30 мкг/кг/мин.

Для применения в хирургической и акушерской практике, стоматологии, ЛОР-практике режим дозирования устанавливают индивидуально, в зависимости от показаний, клинической ситуации и используемой лекарственной формы.

Максимальные дозы: взрослым при в/в введении нагрузочная доза - 100 мг, при последующей капельной инфузии - 2 мг/мин; при в/м введении - 300 мг (около 4.5 мг/кг) в течение 1 ч.

Детям в случае повторного введения нагрузочной дозы с интервалом 5 мин суммарная доза составляет 3 мг/кг; при непрерывной в/в инфузии (обычно после введения нагрузочной дозы) - 50 мкг/кг/мин.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС и периферической нервной системы: головокружение, головная боль, слабость, двигательное беспокойство, нистагм, потеря сознания, сонливость, зрительные и слуховые нарушения, тремор, тризм, судороги (риск их развития повышается на фоне гиперкапнии и ацидоза), синдром "конского хвоста" (паралич ног, парестезии), паралич дыхательных мышц, остановка дыхания, блок моторный и чувствительный, респираторный паралич (чаще развивается при субарахноидальной анестезии), онемение языка (при использовании в стоматологии).

Со стороны сердечно-сосудистой системы: повышение или снижение АД, тахикардия - при введении с вазоконстриктором, периферическая вазодилатация, коллапс, боль в грудной клетке.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота, непроизвольная дефекация.

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница (на коже и слизистых оболочках), зуд кожи, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Местные реакции: при спинальной анестезии - боль в спине, при эпидуральной анестезии - случайное попадание в субарахноидальное пространство; при местном применении в урологии - уретрит.

Прочие: непроизвольное мочеиспускание, метгемоглобинемия, стойкая анестезия, снижение либидо и/или потенции, угнетение дыхания, вплоть до остановки, гипотермия; при анестезии в стоматологии: потеря чувствительности и парестезии губ и языка, удлинение анестезии.

Применение при беременности и кормлении грудью:

При беременности и в период лактации применять только по жизненным показаниям. Лидокаин выделяется с грудным молоком.

В акушерской практике с осторожностью применять парацервикально при нарушениях внутриутробного развития плода, фетоплацентарной недостаточности, недоношенности, переношенности, гестозе.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

При одновременном применении с барбитуратами (в т.ч. с фенобарбиталом) возможно повышение метаболизма лидокаина в печени, снижение концентрации в плазме крови и, вследствие этого, уменьшение его терапевтической эффективности.

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами (в т.ч. с пропранололом, надололом) возможно усиление эффектов лидокаина (в т.ч. токсических), по-видимому, вследствие замедления его метаболизма в печени.

При одновременном применении с ингибиторами МАО возможно усиление местноанестезирующего действия лидокаина.

При одновременном применении с препаратами, вызывающими блокаду нервно-мышечной передачи (в т.ч. с суксаметония хлоридом) возможно усиление действия препаратов, вызывающих блокаду нервно-мышечной передачи.

При одновременном применении со снотворными и седативными средствами возможно усиление угнетающего действия на ЦНС; с аймалином, хинидином - возможно усиление кардиодепрессивного действия; с амиодароном - описаны случаи развития судорог и СССУ.

При одновременном применении с гексеналом, тиопенталом натрия (в/в) возможно угнетение дыхания.

При одновременном применении с мексилетином повышается токсичность лидокаина; с мидазоламом - умеренное уменьшение концентрации лидокаина в плазме крови; с морфином - усиление анальгезирующего эффекта морфина.

При одновременном применении с прениламином развивается риск развития желудочковой аритмии типа "пируэт".

Описаны случаи возбуждения, галлюцинаций при одновременном применении с прокаинамидом.

При одновременном применении с пропафеноном возможно увеличение продолжительности и повышение степени тяжести побочных эффектов со стороны ЦНС.

Полагают, что под влиянием рифампицина возможно уменьшение концентрации лидокаина в плазме крови.

При одновременной в/в инфузии лидокаина и фенитоина возможно усиление побочных эффектов центрального генеза; описан случай синоатриальной блокады вследствие аддитивного кардиодепрессивного действия лидокаина и фенитоина.

У пациентов, получающих фенитоин в качестве противосудорожного средства, возможно уменьшение концентрации лидокаина в плазме крови, что обусловлено индукцией микросомальных ферментов печени под влиянием фенитоина.

При одновременном применении с циметидином умеренно уменьшается клиренс лидокаина и повышается его концентрация в плазме крови, имеется риск усиления побочного действия лидокаина.

Особые указания и меры предосторожности:

С осторожностью следует применять при состояниях, сопровождающихся снижением печеночного кровотока (в т.ч. при хронической сердечной недостаточности, заболеваниях печени), прогрессирующей сердечно-сосудистой недостаточности (обычно вследствие развития блокад сердца и шока), у тяжелых и ослабленных больных, у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет); для эпидуральной анестезии - при неврологических заболеваниях, септицемии, невозможности проведения пункции из-за деформации позвоночника; для субарахноидальной анестезии - при боли в спине, инфекции головного мозга, доброкачественных и злокачественных новообразованиях

головного мозга, при коагулопатиях различного генеза, мигрени, субарахноидальном кровоизлиянии, артериальной гипертензии, артериальной гипотензии, парестезии, психозе, истерии, у неконтактных больных, невозможности проведения пункции из-за деформации позвоночника.

Следует с осторожностью вводить растворы лидокаина в ткани с обильной васкуляризацией (например, в область шеи при операциях на щитовидной железе), в таких случаях лидокаин применяют в меньших дозах.

При одновременном применении с бета-адреноблокаторами, с циметидином требуется уменьшение дозы лидокаина; с полимиксином В - следует контролировать функцию дыхания.

В период лечения ингибиторами МАО не следует применять лидокаин парентерально.

Растворы для инъекций, в состав которых входят эпинефрин и норэпинефрин, не предназначены для в/в введения.

Лидокаин нельзя добавлять в переливаемую кровь.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

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

При нарушениях функции печени

Противопоказан при тяжелых нарушениях функции печени.

С осторожностью следует применять при заболеваниях печени, сопровождающихся снижением печеночного кровотока.

Применение в пожилом возрасте

С осторожностью следует применять у пациентов пожилого возраста (старше 65 лет).

Источник: http://drugs.thead.ru/Gelikain