Лидокаин



Код АТХ:

- N01BB02

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]

Форма выпуска:

Раствор для в/в введения прозрачный, бесцветный или почти бесцветный, без запаха.

	1 мл	**1 амп.**
лидокаина гидрохлорид (в форме моногидрата)	100 мг	200 мг

Вспомогательные вещества: вода д/и.

2 мл - ампулы бесцветного стекла (5) - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

Раствор для инъекций прозрачный, бесцветный или почти бесцветный, без запаха.

	1 мл	**1 амп.**
лидокаина гидрохлорид (в форме моногидрата)	20 мг	40 мг

Вспомогательные вещества: натрия хлорид (для парентеральных лекарственных форм), вода д/и.

2 мл - ампулы (5) - упаковки ячейковые контурные (20) - коробки картонные.

Фармакотерапевтическая группа:

- Нейротропные средства

Фармакологические свойства:

Фармакодинамика

Лидокаин по химической структуре относится к производным ацетанилида. Обладает выраженным местноанестезирующим и антиаритмическим (I b класс) действием. Местноанестезирующее действие обусловлено угнетением нервной проводимости за счет блокады натриевых каналов в нервных окончаниях и нервных волокнах. По своему анестезирующему действию лидокаин значительно (в 2-6 раз) превосходит прокаин; действие лидокаина развивается быстрее и длится дольше - до 75 мин, а при одновременном применении с эпинефрином - более 2 ч. При

местном применении расширяет сосуды, не оказывает местнораздражающего действия.

Антиаритмические свойства лидокаина обусловлены его способностью стабилизировать клеточную мембрану, блокировать натриевые каналы, увеличивать проницаемость мембран для ионов калия. Практически не влияя на электрофизиологическое состояние предсердий, лидокаин ускоряет реполяризацию в желудочках, угнетает IV фазу деполяризации в волокнах Пуркинье (фаза диастолической деполяризации), уменьшая их автоматизм и продолжительность потенциала действия, увеличивает минимальную разность потенциалов, при которой миофибриллы реагируют на преждевременную стимуляцию. На скорость быстрой деполяризации (фаза 0) не влияет или незначительно снижает. Не оказывает существенного влияния на проводимость и сократимость миокарда (угнетает проводимость только в больших, близких к токсическим дозах). Интервалы PQ, QRS и QT под его влиянием на ЭКГ не изменяются. Отрицательный инотропный эффект также выражен незначительно и проявляется кратковременно лишь при быстром введении препарата в больших дозах.

Фармакокинетика

Время достижения C_{max} в плазме крови после в/м введения - 5-15 мин, при медленной в/в инфузии без начальной насыщающей дозы - через 5-6 ч (у больных с острым инфарктом миокарда - до 10 ч). Связывание с белками плазмы - 50-80%. Быстро распределяется ($T_{1/2}$ фазы распределения - 6-9 мин) в органах и тканях с хорошей перфузией, в т.ч. в сердце, легких, печени, почках, затем в мышечной и жировой ткани. Проникает через гематоэнцефалический и плацентарный барьеры, секретируется с материнским молоком (до 40% от концентрации в плазме матери). Метаболизируется главным образом в печени (90-95% дозы) при участии микросомальных ферментов с образованием активных метаболитов – моноэтилглицинксилидида и глицинксилидида, имеющих $T_{1/2}$ 2 ч и 10 ч соответственно. Интенсивность метаболизма снижается при заболеваниях печени (может составлять от 50% до 10% от нормальной величины); при нарушении перфузии печени у пациентов после инфаркта миокарда и/или с застойной сердечной недостаточностью. $T_{1/2}$ при непрерывной инфузии в течение 24-48 ч - около 3 ч; при нарушении функции почек - может увеличиваться в 2 и более раз. Выводится с желчью и мочой (до 10% в неизмененном виде). Подкисление мочи способствует увеличению выведения лидокаина.

Показания к применению:

— инфильтрационная, проводниковая, спинальная и эпидуральная анестезия;

— терминальная анестезия (в т.ч. в офтальмологии);

— купирование и профилактика повторной фибрилляции желудочков при остром коронарном синдроме и повторных пароксизмов желудочковой тахикардии (обычно в течение 12-24 ч);

— желудочковые аритмии, обусловленные гликозидной интоксикацией.

Относится к болезням:

- Анестезия
- Аритмия
- Желудочковая тахикардия
- Интоксикация
- Инфильтраты
- Пароксизм
- Тахикардия
- Фиброз

Противопоказания:

— синдром слабости синусового узла;

— выраженная брадикардия;

— AV-блокада II-III степени (за исключением случаев, когда введен зонд для стимуляции желудочков);

— синоатриальная блокада;

— синдром WPW;

— острая и хроническая сердечная недостаточность (III-IV ФК);

— кардиогенный шок;

— выраженное снижение АД;

— синдром Адамса-Стокса;

— нарушения внутрижелудочковой проводимости;

— ретробульбарное введение больным с глаукомой;

— беременность;

— период лактации (проникает через плацентарный барьер, выделяется с грудным молоком);

— повышенная чувствительность к любому из компонентов препарата.

С *осторожностью* - хроническая сердечная недостаточность II-III степени, артериальная гипотензия, гиповолемия, AV-блокада I степени, синусовая брадикардия, тяжелая печеночная и/или почечная недостаточность, тяжелая миастения, эпилептиформные судороги (в т.ч. в анамнезе), сниженный печеночный кровоток, ослабленные или пожилые больные (старше 65 лет), дети до 18 лет (вследствие замедленного метаболизма возможно накопление препарата), повышенная чувствительность к другим амидным местноанестезирующим средствам в анамнезе.

Также необходимо учитывать общие противопоказания к проведению того или иного вида анестезии.

Способ применения и дозы:

Для инфильтрационной анестезии: внутрикожно, п/к, в/м. Применяют раствор лидокаина 5 мг/мл (максимальная доза 400 мг).

Для блокады периферических нервов и нервных сплетений: периневрально, 10-20 мл раствора 10 мг/мл или 5-10 мл раствора 20 мг/мл (не более 400 мг).

Для проводниковой анестезии: периневрально применяют растворы 10 мг/мл и 20 мг/мл (не более 400 мг).

Для эпидуральной анестезии: эпидурально, растворы 10 мг/мл или 20 мг/мл (не более 300 мг).

Для спинальной анестезии: субарахноидально, 3-4 мл раствора 20 мг/мл (60-80 мг).

В офтальмологии: раствор 20 мг/мл закапывают в конъюнктивальный мешок по 2 капли 2-3 раза с интервалом 30-60 сек непосредственно перед хирургическим вмешательством или исследованием.

Для удлинения действия лидокаина возможно добавление extempore 0.1% раствора адреналина (по 1 капле на 5-10 мл раствора лидокаина, но не более 5 капель на весь объем раствора).

Рекомендуется снижение дозы лидокаина у **пожилых пациентов и больных с заболеваниями печени (цирроз, гепатит) или со сниженным печеночным кровотоком (хроническая сердечная недостаточность)** на 40-50%.

В качестве антиаритмического средства: в/в.

Лидокаин раствор для в/в введения 100 мг/мл можно применять только после разбавления.

25 мл раствора 100 мг/мл следует развести 100 мл физиологического раствора до концентрации лидокаина 20 мг/мл. Этот разведенный раствор используют для введения нагрузочной дозы. Введение начинается с нагрузочной дозы 1 мг/кг (в течение 2-4 мин со скоростью 25-50 мг/мин) с немедленным подключением постоянной инфузии со скоростью 1-4 мг/мин. Вследствие быстрого распределения ($T_{1/2}$ приблизительно 8 мин), через 10-20 мин после введения первой дозы происходит снижение концентрации препарата в плазме крови, что может потребовать повторного болюсного введения (на фоне постоянной инфузии) в дозе равной 1/2-1/3 нагрузочной дозы, с интервалом 8-10 мин. Максимальная доза в 1 ч - 300 мг, в сутки - 2000 мг.

В/в инфузию обычно проводят в течение 12-24 ч с постоянным ЭКГ-мониторированием, после чего инфузию прекращают, чтобы оценить необходимость изменения антиаритмической терапии у пациента.

Скорость выведения препарата снижена при **сердечной недостаточности и нарушении функции печени (цирроз, гепатит) и у пожилых пациентов**, что требует снижения дозы и скорости введения препарата на 25-50%.

При **хронической почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется.

Побочное действие:

Со стороны ЦНС: эйфория, головная боль, головокружение, сонливость, общая слабость, невротические реакции, спутанность или потеря сознания, дезориентация, судороги, шум в ушах, парестезии, диплопия, нистагм, светобоязнь, тремор, тризм мимических мышц, тревога.

Со стороны сердечно-сосудистой системы: снижениеАД, периферическая вазодилатация, коллапс, боль в груди,

брадикардия (вплоть до остановки сердца).

Аллергические реакции: кожная сыпь, крапивница, зуд, ангионевротический отек, анафилактический шок.

Со стороны пищеварительной системы: тошнота, рвота.

Прочие: ощущение жара или холода, стойкая анестезия, эректильная дисфункция, гипотермия, метгемоглобинемия.

Передозировка:

Симптомы: первые признаки интоксикации - головокружение, тошнота, рвота, эйфория, снижение АД, астения; затем - судороги мимической мускулатуры с переходом в тонико-клонические судороги скелетной мускулатуры, психомоторное возбуждение, брадикардия, асистолия, коллапс; при использовании при родах у новорожденного - брадикардия, угнетение дыхательного центра, апноэ.

Лечение: прекращение введения препарата, ингаляция кислородом. Симптоматическая терапия. При судорогах в/в вводят 10 мг диазепама. При брадикардии - м-холиноблокаторы (атропин), вазоконстрикторы (норэпинефрин, фенилэфрин). Гемодиализ неэффективен.

Применение при беременности и кормлении грудью:

Противопоказан к применению при беременности и в период лактации.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Бета-адреноблокаторы и циметидин повышают риск развития токсических эффектов.

Снижает кардиотонический эффект дигитоксина.

Усиливает мышечную релаксацию курареподобных препаратов.

Аймалин, амиодарон, верапамил и хинидин усиливают отрицательный инотропный эффект.

Индукторы микросомальных ферментов печени (барбитураты, фенитоин, рифампицин) снижают эффективность лидокаина.

Вазоконстрикторы (эпинефрин, метоксамин, фенилэфрин) удлиняют местноанестезирующее действие лидокаина и могут вызывать повышение АД и тахикардию.

Лидокаин снижает эффект антимиастенических средств.

Совместное применение с прокаинамидом может вызвать возбуждение ЦНС, галлюцинации.

Гуанадрел, гуанетидин, мекамиламин, триметафан повышают риск выраженного снижения АД и брадикардии.

Усиливает и удлиняет действие миорелаксантов.

Сочетанное применение лидокаина и фенитоина следует использовать с осторожностью, т.к. возможно уменьшение резорбтивного действия лидокаина, а также развитие нежелательного кардиодепрессивного эффекта.

Под влиянием ингибиторов МАО вероятно усиление местноанестезирующего действия лидокаина и снижения АД. Больным, принимающим ингибиторы МАО, не следует назначать лидокаин парентерально.

При одновременном назначении лидокаина и полимикисина В необходимо следить за функцией дыхания больного.

При сочетанном применении лидокаина со снотворными или седативными средствами, опиоидными анальгетиками, гексеналом или тиопентал-натрием возможно усиление угнетающего действия на ЦНС и дыхание.

При в/в введении лидокаина больным, принимающим циметидин, возможны такие нежелательные эффекты, как состояние оглушенности, сонливость, брадикардия, парестезии. Это связано с повышением уровня лидокаина в плазме крови, что объясняется высвобождением лидокаина из связи с белками крови, а также замедлением его инактивации в печени. В случае необходимости проведения комбинированной терапии этими препаратами следует уменьшать дозу лидокаина.

При обработке места инъекции дезинфицирующими растворами, содержащими тяжелые металлы, повышается риск развития местной реакции в виде болезненности и отека.

Особые указания и меры предосторожности:

Необходимо отменить ингибиторы МАО не менее чем за 10 дней, в случае запланированного использования лидокаина.

Следует проявлять осторожность при проведении местной анестезии тканей с высокой васкуляризацией, во избежание внутрисосудистой инъекции рекомендуется проводить аспирационную пробу.

Влияние на способность к вождению автотранспорта и управлению механизмами

В период лечения необходимо соблюдать осторожность при вождении автотранспорта и занятии другими потенциально опасными видами деятельности, требующими повышенной концентрации внимания и быстроты психомоторных реакций.

При нарушениях функции почек

При **хронической почечной недостаточности** коррекции дозы не требуется.

С *осторожностью* - тяжелая почечная недостаточность.

При нарушениях функции печени

Рекомендуется снижение дозы лидокаина у **больных с заболеваниями печени (цирроз, гепатит)**.

С *осторожностью* - тяжелая печеночная недостаточность.

Применение в пожилом возрасте

Рекомендуется снижение дозы у **пожилых пациентов**. С *осторожностью* - ослабленные или пожилые больные (старше 65 лет).

Применение в детском возрасте

С *осторожностью* - дети до 18 лет (вследствие замедленного метаболизма возможно накопление препарата).

Условия хранения:

При температуре от 15° до 25°С, в недоступном для детей место Не использовать после истечения срока годности указанного на упаковке.

Срок годности:

5 лет.

Условия отпуска в аптеке:

По рецепту.

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