

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Лидокаин-Чайкафарма 10 mg/ml инжекционен разтвор
Lidocaine-Tchaikapharma 10 mg/ml solution for injection

Лидокаин-Чайкафарма 20 mg/ml инжекционен разтвор
Lidocaine-Tchaikapharma 20 mg/ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всеки ml от Лидокаин-Чайкафарма 10 mg/ml инжекционен разтвор съдържа 10 mg/ml лидокаинов хидрохлорид монохидрат (lidocaine hydrochloride monohydrate) (100 mg за ампула от 10 ml).

Помощни вещества с известно действие: всеки ml от инжекционния разтвор 10 mg/ml съдържа приблизително 0,121 mmol натрий (като натриев хлорид).

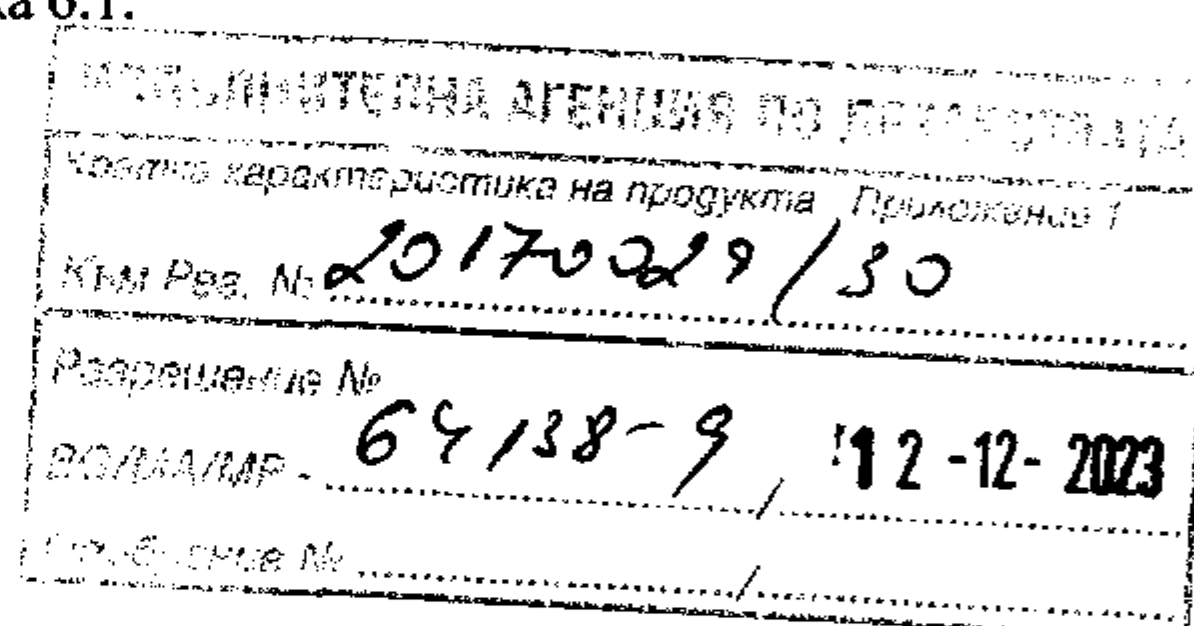
Всеки ml от Лидокаин-Чайкафарма 20 mg/ml инжекционен разтвор съдържа 20 mg/ml лидокаинов хидрохлорид монохидрат (lidocaine hydrochloride monohydrate) (200 mg за ампула от 10 ml или 100 mg за ампула от 5 ml).

Помощни вещества с известно действие: всеки ml от инжекционния разтвор 20 mg/ml съдържа приблизително 0,091 mmol натрий (като натриев хлорид).

За пълния списък на помощните вещества вижте точка 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.
Прозрачен и безцветен разтвор.



4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични показания

- За локална анестезия в хирургията, стоматологията, урологията, кардиологията, офталмологията, оториноларингологията и при различни инвазивни инструментални изследвания.
- За терапия на камерни аритмии, включително и след инфаркт на миокарда и кардиохирургични интервенции.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Локална анестезия

Дозировката и начинът на приложение зависят от техниката на анестезията и хирургичната интервенция. Препоръчват се следните дозировки:

Възрастни:

- За перкутанна инфилтративна анестезия: 1-60 ml от 0,5%-1% разтвор (5-300 mg).
- За периферна нервна блокада – 50-100 ml 0,5% разтвор на лидокаин. За удължаване на местния анестетичен ефект към 10 ml 0,5% лидокаинов разтвор се добавя адреналин 1:200 000.



- За симпатикусова нервна блокада: за цервикална блокада 5 ml от 1% разтвор (50 mg); за лумбална блокада 5-10 ml от 1% разтвор (50-100 mg).
- Епидурална анестезия – използва се лидокаин с концентрация 1,5-2%.
- Спинална анестезия – до 3 ml 2% разтвор на лидокаин (60 mg). Действието настъпва бързо, в рамките на 5 min, а продължителността е от 30 до 120 min.
- За интравенозна регионална анестезия се използва 10-40 ml от 0,5% разтвор на лидокаин (50–200 mg).
- За анестезия в стоматологията – използва се 1-5 ml 2% разтвор на лидокаин (20-100 mg).

Педиатрична популация

Дозата се индивидуализира според възрастта и теглото на детето. Дозата не трябва да превишава 3 mg/kg.

Антиаритмично приложение

Начин на приложение

Интравенозно, интрамускулно и подкожно. Лечението се провежда в болнична обстановка.

Интравенозно приложение

Възрастни

За лечение на вентрикуларни аритмии и сърдечен арест (когато електрошок и адреналин не са възстановили сърдечния ритъм), лидокаин се прилага в дози 1-1,5 mg/kg венозно струйно и при необходимост дозата се повтаря до достигане на максимална доза от 3 mg/kg.

При стабилни пациенти лидокаин се прилага венозно струйно в доза 50-100 mg или 1-1,5 mg със скорост 25-50 mg/min. В случай че не се достигне терапевтичен ефект в рамките на 5-10 минути, дозата се повтаря до достигане на максимална доза 200-300 mg за 1 час. След натоварващата доза, лидокаин се прилага инфузионно със скорост 1-4 mg/min за 24 часа. При пациентите със сърдечна недостатъчност или чернодробни заболявания, както и при гериатрични пациенти, дозите се редуцират с около 50%.

Педиатрична популация

Опитът с приложението на лидокаин в педиатричната практика е ограничен. Препоръчва се следната дозировка:

- натоварваща доза – 0,8 до 1 mg/kg, която може да се повтори при необходимост, като общата доза не трябва да превишава 3-5 mg/kg.
- продължителна инфузия 10-50 µg/kg/min.

Интрамускулно приложение

При спешни състояния и липса на условия за интравенозно приложение, лидокаин може да бъде приложен мускулно, като инжектирането се извършва в делтоидния мускул. Дозата за интрамускулно приложение е 4-5 mg/kg телесно тегло (250-350 mg).

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество лидокаин или някое от помощните вещества;
- Свръхчувствителност към други анестетици от амиден тип;
- Порфирия;
- Проводни нарушения (високостепенни SA и AV блок);
- Кардиогенен шок;
- Неконтролирана епилепсия;
- Хиповолемия;
- Едновременно приложение със султоприд (виж т. 4.5.).



4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Безопасността и ефикасността на лидокаин като локален анестетик зависи от правилното дозиране, коректното приложение на продукта и съобразяване със съответните предупреждения и адекватни предпазни мерки.

Препоръчва се приложение на минималната ефективна доза за предизвикване на анестезия, за да се избегнат високи плазмени концентрации на лидокаин и да се намали риска от поява на сериозни нежелани лекарствени реакции.

При предизвикване на анестезия е необходимо да има готовност за оказване на спешна помощ при поява на сериозни нежелани реакции или токсични ефекти.

Прилагането на лидокаин, дори и в ниски дози, в областта на главата и шията (включително и ретробулбарен, дентален и ганглионарен блок) може да предизвика сериозни системни нежелани реакции като объркване, конвулсии, потискане или спиране на дишането, стимулиране или потискане на сърдечната дейност.

Внимателно трябва да се наблюдава сърдечната и дихателната дейност, както и степента на съзнание на пациента след всяко локално прилагане на лидокаин. Поява на симптоми като безпокойство, тревожност, шум в ушите, замъглено виждане, тремор, сънливост може да бъде ранен сигнал за токсични увреждания на централната нервна система.

Лидокаин трябва да се прилага с повишено внимание при новородени, поради опасност от животозастрашаващи странични ефекти, в това число продължителен гърч.

Лидокаин се прилага с внимание при: пациенти над 65 години; сърдечно-съдова недостатъчност; брадикардия; нарушена дихателна функция; състояния на шок; миастения гравис.

Лидокаин се метаболизира основно в черния дроб и трябва да се прилага с повишено внимание при нарушения на чернодробната функция и тежки чернодробни заболявания.

Метаболитите на лидокаин могат да кумулират в организма при тежки бъбречни заболявания и нарушения на бъбречната функция, което може да повиши риска от нежелани лекарствени реакции.

В хода на лечението с лидокаин е възможно повишаване на плазмените нива на креатин фосфокиназата, особено в случаите на интрамускулна апликация.

Лидокаин-Чайкафарма 10 mg/ml съдържа 1,2 mmol (28 mg) натрий в една ампула, което трябва да се вземе под внимание при пациенти, подложени на диета с контролиран прием на натрий.

Лидокаин-Чайкафарма 20 mg/ml съдържа по-малко от 1 mmol (23 mg) натрий в една ампула, т.е. може да се каже, че практически не съдържа натрий.

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

Антипсихотици (султоприд): едновременното приложение на лидокаин и султоприд е противопоказано поради висок риск от поява на полиморфна камерна тахикардия (*torsades de pointes*).

Други локални анестетици, антиаритмични лекарства (структурно сходни с локални анестетици от амиден тип): при съвместно приложение с лидокаин рискът от системни токсични ефекти се повишава (адитивен ефект).

Антиконвулсанти и хидантоин: при едновременно приложение с лидокаин може да се наблюдава адитивен кардиодепресивен ефект.

Бета-адренергични блокери: понижаване интензивността на чернодробния метаболизъм на лидокаин, повишаване на плазмените му концентрации и риск от токсични ефекти могат да се наблюдават при едновременно приложение с бета-блокери.

Циметидин: понижаване на чернодробния клирънс на лидокаин е налице при едновременно приложение с циметидин, поради което при болни, приемащи и двата лекарствени продукта е



наложително мониториране на плазмените концентрации на лидокаин.

Невромускулни блокери: при високи дози и особено в случаите на интравенозно приложение на лидокаин с невромускулни блокери е налице взаимно потенциране на ефектите им.

Адреналин: едновременно приложение с лидокаин води до удължаване на локалната анестезия, най-вероятно в резултат на спазъм на съдовете на мястото на приложението, предизвикан от адреналин. Това от своя страна намалява скоростта на съдовата резорбция на лидокаин, плазмените му концентрации и степента на метаболизиране.

Активността на лидокаин намалява в кисела среда (възпалително огнище), при уремия и едновременно прилагане с глюкоза и калциеви продукти.

4.6. Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Лидокаин и метаболитите му преминават плацентарно и при новородените може да се наблюдава депресия на централната нервна система и брадикардия. Лидокаин-Чайкафарма не трябва да се използва по време на бременност, освен в случаите на необходимост.

Кърмене

Лидокаин се екскретира с кърмата, поради което има възможност за предизвикване на алергична реакция у новороденото, макар и дистанционно, но това налага необходимостта от внимателното му прилагане по време на кърмене.

Фертилитет

Няма данни за въздействието на това лекарство върху фертилитета.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Лидокаин-Чайкафарма повлиява в малка степен способността за шофиране и работа с машини, когато се прилага като локален анестетик в стоматологията и при амбулаторни хирургични манипулации. В някои случаи може да предизвика хипотония и сънливост, поради което трябва да се избягва шофиране и работа с машини до отзвучаване на тези прояви.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Тежестта и честотата на поява на нежелани лекарствени реакции от страна на лидокаин показват изразена дозо- и възрастова (над 65 години) зависимост.

Подобно на други локални анестетици, нежеланите лекарствени реакции към лидокаин са редки и обикновено са в резултат на повишени плазмени концентрации, прекомерна доза или бърза абсорбция от силно кръвоснабдени области. Появата на нежелани лекарствени реакции може да се дължи на свръхчувствителност, особености или понижена толерантност от страна на пациента. Системната токсичност се отразява главно на централната нервна система и/или сърдечно-съдовата система (вж. също точка 4.9).

Много чести ($\geq 1/10$)	Съдови нарушения	Хипотония
	Стомашно-чревни нарушения	Гадене
Чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$)	Нарушения на нервната система	Парестезия, замаяност
	Сърдечни нарушения	Брадикардия, инфаркт
	Съдови нарушения	Хипертония
	Стомашно-чревни нарушения	Повръщане
Нечести ($\geq 1/10$ до $< 1/100$)	Нарушения на нервната система	Симптоми на токсичност на ЦНС (конвулсии, парестезии)



		парестезия, изтръпване на езика, хиперакузис, зрителни нарушения, загуба на съзнания, тремор, сънливост, виене на свят, тинитус, чувство на интоксикация, дизартрия)
Редки ($\geq 1/10$ до $< 1/1000$)	<i>Нарушения на имунната система</i>	Реакция на свръхчувствителност, уртикария, оток, обрив, кожни лезии, ангиоедем, в тежки случаи анафилактичен шок
	<i>Нарушения на нервната система</i>	Невропатия, увреждане на периферния нерв, арахноидит
	<i>Нарушения на окото</i>	Двойно виждане, замъглено виждане, нистагъм
	<i>Сърдечни нарушения</i>	Сърдечен арест, аритмия
	<i>Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения</i>	Респираторна депресия, бронхоспазъм
	<i>Нарушения на кръвоносната и лимфната система</i>	Метхемоглобинемия

Съобщаване на подозирани нежелани реакции

Ако получите някакви нежелани лекарствени реакции, уведомете Вашия лекар или фармацевт. Това включва всички възможни неописани в тази листовка нежелани реакции. Можете също да съобщите нежелани реакции директно чрез:

Изпълнителна агенция по лекарствата
ул. „Дамян Груев“ № 8
1303 София
тел.: +359 2 8903417
уебсайт: www.bda.bg

4.9. Предозиране

Симптоми

Централна нервна система и дихателна система:

Токсично повишени концентрации на лидокаин могат да причинят парестезии, изтръпване на езика, замаяност, хиперакузия и шум в ушите. Нарушение на зрението и мускулни тремори или мускулни спазми са по-сериозни и предхождат появата на генерализирани гърчове. Тези симптоми не трябва да се бъркат с невротично поведение. В следствие на гърчове, поради увеличаване на мускулната активност, може да се появи и хипоксия, заедно с нарушаване на нормалното дишане. При по-тежки случаи може да се появи и апнея.

Сърдечно-съдова система:

Ефектите вследствие от предозиране на лидокаин върху сърдечно-съдовата система могат да се проявят само с тежки, крайни случаи на системно прилагане на високи концентрации. Изразяват се в повишено кръвно налягане, брадикардия, аритмия, сърдечен арест.

Лечение на остра токсичност

При проявяване на признаци на остра системна токсичност, инжектирането на анестетика трябва да се прекрати незабавно.

Провежда се симптоматично лечение – инхалира се кислород, прилага се сърдечно-съдова и



дихателна реанимация, инжектират се интравенозно барбитурати или бензодиазепини за контрол на гърчовете.

Непрекъснатото подаване на кислород, поддържането на циркулацията на кръвта и лечението на възникналата ацидоза са от жизненоважно значение при предозиране на лидокаин.

Диализата е с по-ниска стойност при лечението на остро предозиране с лидокаин.

5. Фармакологични свойства

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: Локални анестетици от амиден тип, АТС код: N01BB02
Антиаритмични продукти клас Ib, АТС код: C01BB01

Механизъм на действие

Лидокаин е локален анестетик с амидна структура, който се използва за всички видове локална анестезия. Предизвиква временна обратима блокада на периферните неврорецептори 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.

Според съвременната класификация на антиаритмичните медикаменти, лидокаин принадлежи към група Ib, като основният електрофизиологичен ефект на лекарствата от този клас се изразява в тяхната способност да намаляват максималната скорост (V_{max}) на деполяризацията на сърдечната клетка. Този ефект е свързан с повишаване на праговата граница на възбудимост, намаляване скоростта на провеждане на възбудния процес и силно удължаване на ефективния рефрактерен период, както и потискане на спонтанната диастолна деполяризация на клетките на възбудно-проводната система. Чрез удължаване на рефрактерния период тези лекарствени продукти могат да премахнат ритъмните нарушения, възникнали по риентри механизъм, а поради потискане на спонтанната диастолна деполяризация те са ефективни и в случаите на аритмии, възникнали чрез повишен ектопичен автоматизъм.

Фармакодинамични ефекти

Действие на лидокаина като локален анестетик

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 инициирането 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 стволлове 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.



Антиаритмични ефекти

Антиаритмичният ефект на лидокаин е свързан със следните ефекти върху миокарда:

- намаляване степента на деполяризация;
- потискане автоматизма на миокарда;
- понижаване възбудимостта на камерната мускулатура във фазата на диастолата посредством директно действие върху тъканите и по-специално върху мрежата на Пуркиние, без при това да оказва действие върху автономната система.

Главно предимство на лидокаина са бързо настъпващият и бързо отзвучаващият му ефект.

Клинична ефикасност и безопасност

Действието на лидокаина започва бързо (около една минута след интравенозно инжектиране и петнадесет минути след интрамускулно прилагане) като бързо се разпределя в околните тъкани. Ефектът му продължава около 10-20 минути след интравенозно приложение и около 60 минути след интрамускулно инжектиране.

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

Педиатрична популация

Опитът с приложението на лидокаин в педиатричната практика е ограничен. Безопасността и ефикасността на лидокаин в управлението на камерни аритмии при деца не са установени от контролирани клинични проучвания.

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 лекарството 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).

Аритмии

- Терапевтична плазмена концентрация: 1,5-5 µg/ml.
- Концентрацията на несвързания лидокаин варира от 0,5 до 1,5 µg/ml. Определянето на концентрацията на несвързания лидокаин е препоръчително при пациенти с инфаркт на миокарда.
- Токсична плазмена концентрация – над 9 µg/ml.
 - Steady-state плазмени концентрации се достигат след 3- до 4-часова венозна инфузия. Това време се удължава отчетливо при болни с остър миокарден инфаркт (8-10 часа).

Локална анестезия

Факторите, които повлияват системната абсорбция на локално приложеният лидокаин, са: мястото на инжектиране, терапевтичната доза, концентрацията на лекарството, 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 със сърдечна недостатъчност. Потенциалът за свързване на лидокаин с плазмените протеини е около 51%.

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



Времето за разпределение на лидокаин е от 15 до 30 min.

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 лидокаин в черния дроб включва окислително деетилиране до моноетилглицинксилидид (MEGX) и глицин ксилидид (GX), последвано от хидролиза до ксилидин. Два фактора определят неговата ефективност – активността на тези ензими и чернодробният кръвоток.

Елиминиране

Времето на полуелиминиране варира между 1 и 2 часа (средно 100 минути) и показва изразена дозова зависимост. Лидокаин 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 лидокаин е обратнопропорционална на неговия протеин-свързващ афинитет и pH на урината. Това предполага, че отделянето на лидокаин става чрез нейонна дифузия.

Лидокаин преминава през плацентата.

5.3. Предклинични данни за безопасност

LD₅₀ 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

Продуктът се утаява мигновено при смесването му с метохексита натрий, фенитоин натрий, цефазолин натрий, дакарбазин или амфотерицин В.

6.3. Срок на годност

3 години

6.4. Специални условия на съхранение

Няма специални условия на съхранение.

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

6.5. Вид и съдържание на опаковката

Лидокаин-Чайкафарма 10 mg/ml инжекционен разтвор е опакован в 10 ml тип I стъкло ампула, поставена в картонена кутия от 10 или от 100 броя с листовка за пациента.



Лидокаин-Чайкафарма 20 mg/ml инжекционен разтвор е опакован в 5 ml или 10 ml тип I стъклена ампула, поставена в картонена кутия от 10 или от 100 броя с листовка за пациента.

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати в продажба.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

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

Този лекарствен продукт е за еднократна употреба. Изхвърлете неизползвания продукт. Използвайте само ако разтворът е бистър без видими частици.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

“Чайкафарма Висококачествените Лекарства” АД
бул. “Г. М. Димитров” № 1, гр. София 1172, България
тел.: +359 2 962 54 54
факс: +359 2 9603 703
e-mail: info@tchaikapharma.com

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

10 mg/ml: Рег. №: 20170029
20 mg/ml: Рег. №: 20170030

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

Дата на първо разрешаване: 24.01.2017 г.
Дата на последно подновяване:

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Ноември, 2023

