

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

ЛИДОКАИН ВП 10 mg/ml инжекционен разтвор
LIDOCAIN VP 10 mg/ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа 10 mg лидокаинов хидрохлорид (lidocaine hydrochloride).

Всяка ампула от 10 ml инжекционен разтвор съдържа 100 mg лидокаинов хидрохлорид (lidocaine hydrochloride).

Помощни вещества с известно действие: Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа приблизително 0,118 mmol натрий.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.

Бистър, безцветен разтвор, практически свободен от видими частици

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лидокаин ВП е показан за приложение при инфилтрационна анестезия, интравенозна регионална анестезия, нервни блокади и епидурална анестезия.

Лидокаин ВП 10 mg/ml е предназначен за възрастни и деца над 1 година.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Дозировка

Лидокаин ВП трябва да се прилага от или под ръководството на лекар с опит в регионалната анестезия и умения за провеждане на ресусцитация. При приложение на локални анестетици е необходимо наличие на оборудване за ресусцитация. Трябва да се приложи възможно най-ниска доза, достатъчна да постигне желаните ефект.

Таблицата може да послужи като ръководство за приложение при възрастни с тегло около 70 килограма. Дозата трябва да бъде съобразена в зависимост от възрастта, теглото и състоянието на пациента.

Начин на приложение или процедура	Препоръчителна доза лидокаинов хидрохлорид		
	Концентрация (mg/ml)	Обем (ml)	Обща доза (mg)
Инфилтрационна анестезия:			
Малки процедури	10 mg/ml	2-10 ml	20-100 mg
Големи процедури	10 mg/ml	10-20 ml	100-200 mg
Интравенозна регионална анестезия			

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА		
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1		
Към Рег. №	20180091	
Разрешение №	BG/MK/MA-42969	
Одобрение №	12-04-2018	



Ръка	10 mg/ml	10-20 ml	100-200 mg
Крак	10 mg/ml	20 ml	200 mg
Нервни блокади	10 mg/ml	2-20 ml	20-200 mg
Епидурална анестезия:			
Лумбална аналгезия	10 mg/ml	25-40 ml	250-400 mg
Торакална анестезия	10 mg/ml	20-30 ml	200-300 mg
Сакрална хирургична аналгезия	10 mg/ml	40 ml	400 mg
Сакрална гинекологична аналгезия	10 mg/ml	20-30 ml	200-300 mg

Препоръчителната максимална единична доза на лидокаинов хидрохлорид не трябва да надвишава 400 mg.

Педиатрична популация

При деца и пациенти с влошено общо състояние дозите са намалени.

Необходимо е особено внимание при лечение на деца под 4-годишна възраст.

Количеството, което ще бъде инжектирано, трябва да се определи в зависимост от възрастта и теглото на детето и степента на оперативната интервенция. Техниката на анестезиране трябва да бъде внимателно подбрана. Болезнените техники на анестезиране трябва да се избягват. Поведението на детето по време на лечението трябва да се наблюдава внимателно.

Средната доза за единична сесия е от порядъка на 20 mg до 30 mg лидокаинов хидрохлорид. Дозата на лидокаинов хидрохлорид в mg, която може да бъде приложена при деца, може да бъде алтернативно изчислена от формулата:

тегло на детето (в килограми) x 1,33

Да не се надвишава дозата, еквивалентна на 5 mg лидокаинов хидрохлорид на килограм телесно тегло.

Инжекционният разтвор на лидокаин не се препоръчва за употреба при новородени (вж. точка 5.2). Оптималната серумна концентрация на лидокаин, при която да се избегнат прояви на токсичност, като гърчове и сърдечни аритмии, е неизвестна в тази възрастова група.

Специални популации

При пациенти с бъбречно увреждане, чернодробно увреждане и в старческа възраст дозата трябва да бъде намалена в зависимост от възрастта и физическото състояние (вж. точка 4.4).

Начин на приложение

Начинът на приложение на лидокаин варира в зависимост от процедурата (инфилтрационна анестезия, интравенозна регионална анестезия, нервна блокада или епидурална анестезия).

Лидокаин ВП може да бъде приложен чрез интравенозна, интрамускулна, подкожна или епидурална инжекция.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към активното вещество, към локални анестетици от амиден тип или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.
- Лидокаин ВП не трябва да бъде използван за епидурална анестезия при пациенти с изразена хипотения или с кардиогенен или хиповолемичен шок.

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

С изключение на най-тривиалните процедури, регионалната и локалната анестезия трябва винаги да бъдат провеждани при наличието на оборудване за ресусцитация.



При всяка голяма блокада, преди инжектирането на локалния анестетик, е необходимо поставяне на интравенозна канюла.

Както всички локални анестетици, когато приложението му води до високи концентрации в кръвта, лидокаин може да предизвика остри токсични ефекти върху централната нервна система и сърдечно-съдовата система, особено след екстензивно втресъдово приложение.

Необходима е предпазливост в лечението на следните категории пациенти:

- Пациенти в старческа възраст и с влошено общо състояние.
- Пациенти с AV блок II или III, тъй като локалните анестетици могат да влошат миокардната проводимост.
- Пациенти с конгестивна сърдечна недостатъчност, брадикардия или нарушена дихателна функция.
- Пациенти с тежко чернодробно заболяване или бъбречно нарушение.
- Пациенти с епилепсия.
- Пациенти с нарушена коагулация. Лечението с коагуланти (напр. хепарин), НСПВС или плазмозаместители причинява повишена склонност към кървене. Случайното нараняване на кръвосни съдове може да доведе до сериозно кървене. При необходимост трябва да се проведат изследвания на времето на кървене, куик тест за активирано парциално тромбoplastиново време (aPTT) и брой на тромбоцитите.
- Трети триместър от бременността.

Пациентите, лекувани с атиаритмици от клас III (напр. амиодарон) трябва да бъдат внимателно наблюдавани и да се има предвид ЕКГ мониториране, тъй като сърдечните ефекти на лидокаин и антиаритмиците от клас III могат да бъдат адитивни (вж. точка 4.5).

Налице са постмаркетингови съобщения за хондролита при пациенти, подложени на постоперативна интраартикуларна продължителна инфузия на локални анестетици. Повечето от съобщените случаи на хондролита са включвали раменната става. Поради множеството допринасящи фактори и непоследователните данни в научната литература за механизма на действие, причинно-следствената връзка не е доказана.

Интраартикуларната продължителна инфузия не е одобрено показание за лидокаин.

Епидуралната анестезия може да причини тежки нежелани реакции, като потискане на сърдечно-съдовата система, особено в случаите на съпътстваща хиповолемия. При пациенти с редуцирана сърдечно-съдова функция, винаги трябва да се подхожда с предпазливост.

Основните причини са травматичните нервни увреждания и/или локалните токсични ефекти върху мускулите и нервите, причинени от инжектирания локален анестетик. Травматичните нервни увреждания и/или локалните токсични ефекти върху мускулите и нервите се причиняват основно от инжектиране на локални анестетици. Степента на тези тъканни увреждания зависи от размера на травмата, концентрацията на локалните анестетици и продължителността на тъканната експозиция на действието на локалния анестетик. Ето защо трябва да се използва най-ниската ефективна доза.

Случайните интраваскуларни инжекции в областта на главата и шията могат да причинят церебрални симптоми дори в ниски дози.

Ретробулбарните инжекции рядко могат да достигнат краниалното субарахноидално пространство, причиняващи сериозни/тежки реакции, включващи сърдечносъдов колапс, апнея, конвулсии и преходна слепота.

Ретро- и перибулбарното инжектиране на локални анестетици носи нисък риск от персистираща очно-моторна дисфункция. Първичните причини включват травма и локални токсични ефекти върху мускулите и/или нервите.



Ефектът на локалния анестетик може да бъде отслабен, ако инжекцията е приложена във възпалена или инфектирана област.

Лидокаин, приложен интрамускулно, може да повиши концентрациите на креатинин фосфокиназата, което може да интерферира с диагнозата на острия миокарден инфаркт.

Има сведения, че лидокаин е порфириногенен при животни и не трябва да бъде прилаган на пациенти с остра порфирия, освен ако не е абсолютно неизбежно. При всички пациенти с порфирия е необходимо особено внимание.

Епидуралната анестезия може да доведе до хипотония и брадикардия. Този риск може да бъде редуциран чрез интравенозно приложение на кристалоидни или колоидни разтвори. Хипотонията трябва да бъде незабавно лекувана, например с 5-10 mg ефедрин интравенозно, като при необходимост може да се приложи повторно.

Парацервикалната блокада може понякога да причини фетална брадикардия или тахикардия и затова е необходимо внимателно мониториране на сърдечната честота на плода (вж. точка 4.6).

Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа приблизително 0,118 mmol натрий (ако се използва концентрация от 10 mg/ml). Това трябва да се има предвид при пациенти на диета с контролиран прием на натрий.

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Лекарствата, които инхибират метаболизма на лидокаин (напр. циметидин), могат да доведат до потенциално токсични плазмени концентрации, когато лидокаин се прилага многократно във високи дози за продължителни периоди от време. Това взаимодействие не е клинично значимо при краткосрочно лечение с лидокаин в препоръчаните дози.

Лидокаин трябва да се употребява предпазливо при пациенти, приемащи други локални анестетици или антиаритмични лекарства от клас Ib, тъй като токсичните ефекти са адитивни. Не са провеждани специфични проучвания за взаимодействие на лидокаин с антиаритмични лекарства от клас III (напр. амиодарон), но се препоръчва повишено внимание (вж т.4.4).

4.6 Бременност и кърмене

Бременност

Липсват адекватни данни за лечение при бременни жени.

Лидокаин преминава през плацентата (вж. точка 5.2). Логично е да се предположи, че лидокаин е прилаган при голям брой бременни жени и жени в детеродна възраст. Няма сведения, че лидокаин причинява нарушения на репродуктивния процес, като например повишена честота на малформации. Рискът при хора обаче не е напълно проучен. Проучванията при животни са показали репродуктивна токсичност (вж. точка 5.3).

При краткотрайна употреба по време на бременност и раждане, е необходимо да бъдат преценени ползите срещу рисковете. Парацервикалната или пудендалната блокада с лидокаин повишават риска от реакции, като фетална брадикардия/тахикардия. Ето защо сърдечната честота на плода трябва внимателно да се мониторира (вж. точка 5.2).

Кърмене

Лидокаин се екскретира в малки количества в майчиното мляко. Когато се използва в препоръчителните дози, няма вероятност за влияние върху детето. Ето защо по време на лечение с Лидокаин ВП, кърменето може да продължи.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини



В зависимост от дозата и начина на приложение, лидокаин може да има временен ефект върху моторните функции и координацията, повлияващи способността за шофиране и работа с машини. Пациентите трябва да бъдат съветвани да избягват тези дейности, докато нормалните им функции не са напълно възстановени.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Нежеланите лекарствени реакции са класифицирани по честота, както следва: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$), много редки ($< 1/10\ 000$), с неизвестна честота (от наличните данни не може да бъде направена оценка).

Нежеланите лекарствени реакции, причинени от самото лекарство могат трудно да бъдат отличени от физиологичния ефект на нервната блокада (напр. хипотония, брадикардия) и състоянията, причинени директно (напр. увреждане на нерв) или индиректно (напр. епидурален абсцес) от инжектирането.

Много чести ($> 1/10$)	Съдови нарушения	Хипотония
	Стомашно-чревни нарушения	Гадене
Чести ($> 1/100$ до $< 1/10$)	Нарушения на нервната система	Парестезия, замаяност
	Сърдечни нарушения	Брадикардия
	Съдови нарушения	Хипертония
	Стомашно-чревни нарушения	Повръщане
Нечести ($> 1/1\ 000$ до $< 1/100$)	Нарушения на нервната система	Симптоми на токсичност на ЦНС (конвулсии, Периорална парестезия, изтръпване на езика, хиперакузис, зрителни нарушения, загуба на съзнание, тремор, сънливост, виене на свят, тинитус, чувство на интоксикация, дизартрия)
Редки ($> 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$)	Нарушения на имунната система	Реакции на свръхчувствителност, уртикария, обрив, ангиоедем, в тежки случаи анафилактичен шок
	Нарушения на нервната система	Невропатия, увреждане на периферния нерв, арахноидит
	Нарушения на окото	Двойно виждане
	Сърдечни нарушения	Сърдечен арест, аритмии
		Респираторна депресия



	Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения	
--	---	--

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:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ № 8

1303 София

Тел.: +359 2 8903417

уебсайт: www.bda.bg

4.9 Предозиране

Случайното интерваскуларно инжектиране на локални анестетици може да причини незабавна системна токсичност (в рамките на секунди или няколко минути). Признаците на системна токсичност, дължаща се на предозиране се появяват по-късно (15-60 минути след инжектиране) като резултат от по-бавното нарастване на концентрацията на локалния анестетик в кръвта (вж. Точка 4.8). Ако се появят признаци на системна токсичност, инжектирането трябва да бъде незабавно преустановено.

Токсичност:

Перорално приложение: Дози, по-ниски от 50 mg, изглежда не са рискови при малки деца. 75 mg при 2-годишно дете са редуцирали болката, 100mg, приложени на 5 месечно бебе са довели до тежка интоксикация, 300 + 300 mg в рамките на 4 часа, при 3½ годишно дете са причинили тежка до много тежка интоксикация, 400-500 mg, при 2-годишно дете и 1 g за 12 часа, при 1-годишно дете са довели до много тежка интоксикация. 600 mg при възрастен са редуцирали болката, а 2 mg при възрастен са довели до умерена интоксикация.

Перентрално приложение: 50 mg i.v. при едномесечно бебе са довели до много тежка интоксикация. 200-400 mg инфилтрация при възрастен са причинили тежка, а 500 mg при 80-годишен възрастен и 1g i.v. при възрастен са причинили много тежка интоксикация.

Локално приложение: 8.6-17.2 mg/kg, при малки деца, приложени върху рани от изгаряне на кожата, са причинили тежка интоксикация.

Симптоми:

Първо възбуда на ЦНС, последвана от потискане на ЦНС. Във високи дози, внезапната поява на гърчове може да бъде първи симптом. Безпокойство, замаяност, зрителни нарушения, периорална парастезия, гадене. Последващи атаксия, слухови нарушения, еуфория, обърканост, говорни нарушения, бледност, изпотяване, тремор, конвулсии, кома, респираторен арест. Аритмии, основно брадиаритмии, но при високи дози също и камерна тахикардия, камерно мъждене, разширение на QRS комплекса, AV блок. Сърдечна недостатъчност, хипотония (в изолирани случаи е описана метхемоглобинемия).

Лечение:

При перорално предозиране- активен въглен. (Провокираното повръщане може да бъде опасно поради анестезията на лигавицата и риска от гърчове в ранен етап. При необходимост от стомашна промивка, тя трябва да бъде извършена чрез тръба и след издотраховане (интубация).



В случай на предозиране, трябва да бъдат предприети незабавни мерки за поддържане на циркулацията и дишането, и за контрол на гърчовете.

Трябва да се осигури проходимост на дихателните пътища на пациента и да се приложи кислород, при необходимост с асистирана вентилация. Циркулацията трябва да се поддържа с инфузии на интравенозни течности, добутамин и при необходимост, норадреналин (първоначално $0.05\mu\text{g}/\text{kg}/\text{min}$, при необходимост- повишаване с $0.05\mu\text{g}/\text{kg}/\text{min}$ на всеки 10 минути), с хемодинамично мониториране в по-тежките случаи. Ефедрин също може да бъде прилаган.

Гърчовете могат да бъдат контролирани с интервенозно приложение на диазепам или тиопентал натрий, като се има предвид, че антиепилептичните лекарства също могат да постигнат дишането и циркулацията.

За брадикардията може да бъде приложен атропин. Ако настъпи сърдечен арест, е необходимо да се предприемат стандартни процедури по ресусцитация.

Диализата има пренебрежима 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

Лидокаин е локален анестетик от амиден тип. Механизмът му на действие се базира на понижения мембранен пермеабилитет на неврона за натриеви йони. Като следствие от това, степента на деполяризация се понижава и прагът на възбуждане се повишава, което има за резултат обратимо локално обезчувствяване.

Той се използва за осигуряване на локална анестезия чрез нервна блокада в различни части на тялото и за контрол на дисритмии. Действа посредством инхибиране на йонния рефлукс, необходим за инициране и провеждане на импулсите, като по този начин стабилизира невроналната мембрана. В допълнение към блокиране на провеждането в невроналните аксони в периферната нервна система, лидокаин упражнява съществени ефекти върху централната нервна система и сърдечно-съдовата система. След абсорбация, лидокаин може да предизвика стимулация на ЦНС, последвана от потискане, а в сърдечно-съдовата система действа основно върху миокарда, където може да причини понижения в електричната възбудимост, степента на провеждане и силата на съкращението. Има бързо начало на действието (около една минута след интравенозно инжектиране) и бързо се разпространява в околните тъкани. Ефектът продължава около десет до двадесет минути и около шейсет до деветдесет минути, след интравенозно и интрамускулно приложение, съответно.

5.2 Фармакокинетични свойства

Степента на абсорбация ще зависи от дозата, пътя на въвеждане и перфузията на мястото на инжектиране. Интеркосталните блокади водят до най-високи плазмени концентрации (приблизително $1.5\mu\text{g}/\text{ml}$ на инжектирани 100mg), докато подкожното инжектиране в абдоминалната област води до най-ниски плазмени концентрации (приблизително $0.5\mu\text{g}/\text{ml}$ на инжектирани 100mg). Обемът на разпределение в равновесно състояние е свързан с плазмените протеини, основно към алфа-1-кисел гликопротеин.



6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1 Списък на помощните вещества

Натриев хлорид
Вода за инжекции

6.2 Несъвместимости

Поради липса на данни за съвместимост, този лекарствен продукт не трябва да бъде смесван с други лекарствени продукти.

6.3 Срок на годност

5 години.

Да се използва непосредствено след първото отваряне.

6.4 Специални условия на съхранение

При температура под 25°C, на сухо и защитено от светлина място.

6.5 Вид и съдържание на опаковката

Ампули от безцветно неутрално стъкло тип I, самочупещи се по 10 ml.
5 ампули по 10 ml в блистери от PVC фолио и заедно с листовка за пациента, поставени в картонени кутии.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

Само за еднократна употреба.

Ако се използва само част от съдържанието на ампулата или флакона, останалото количество трябва да се изхвърли.

Инжекционният разтвор не трябва да се използва, ако в него има видими частици.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

ВЕТПРОМ АД, 2400 гр.Радомир, България, ул."Отец Паисий" № 26

тел.: +35924519300

e-mail: office@vpharma.bg

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА 02/2017

