

## **КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА**



## 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Лидокаин Акорд 10 mg/ml инжекционен разтвор

Лидокаин Акорд 20 mg/ml инжекционен разтвор

Lidocaine Accord 10 mg/ml solution for injection

Lidocaine Accord 20 mg/ml solution for injection

|                                                |              |
|------------------------------------------------|--------------|
| ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА            |              |
| Кратка характеристика на продукта Приложение 1 |              |
| Към Рег. №                                     | 2015-0323/24 |
| Разрешение №                                   | 20-05-2024   |
| BG/MA/MP -                                     | 65477-8      |
| Одобрение №                                    |              |

## 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

10 mg/ml:

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

Всяка ампула от 2 ml инжекционен разтвор съдържа 20 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Всяка ампула от 5 ml инжекционен разтвор съдържа 50 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

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

Всяка ампула от 20 ml инжекционен разтвор съдържа 200 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

20 mg/ml:

Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа 20 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Всяка ампула от 2 ml инжекционен разтвор съдържа 40 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Всяка ампула от 5 ml инжекционен разтвор съдържа 100 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Всяка ампула от 10 ml инжекционен разтвор съдържа 200 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Всяка ампула от 20 ml инжекционен разтвор съдържа 400 mg лидокаинов хидрохлорид (*lidocaine hydrochloride*).

Помощни вещества с известно действие:

10 mg/ml: Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа приблизително 0,118 mmol натрий.

20 mg/ml: Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа приблизително 0,082 mmol натрий.

За пълния списък на помощните вещества, вижте точка 6.1.

## 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.

Бистър, безцветен разтвор, практически свободен от видими частици

pH на разтвора е 4.0 - 5.5

Осмоларитетът на разтвора е 270 - 320 mOsmol/kg H<sub>2</sub>O

## 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

### 4.1 Терапевтични показания

Лидокаин Акорд е показан за приложение при инфилтративна анестезия, интравенозна





регионална анестезия, нервни блокади и епидурална анестезия.

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

Лидокаин Акорд 20 mg/ml е предназначен за възрастни и юноши над 12 години.

## 4.2 Дозировка и начин на приложение

### Дозировка

#### Възрастни и юноши над 12 години

Лидокаин Акорд 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-ниската 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 хидрахлорид |            |                |
|------------------------------------------|--------------------------------------------|------------|----------------|
|                                          | Концентрация (mg/ml)                       | Обем (ml)  | Обща доза (mg) |
| <b>Инфилтративна анестезия:</b>          |                                            |            |                |
| Малки процедури                          | 10 mg/ml                                   | 2-10 ml    | 20-100 mg      |
| Големи процедури                         | 10 mg/ml                                   | 10-20 ml   | 100-200 mg     |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 5-10 ml    | 100-200 mg     |
| <b>Интравенозна регионална анестезия</b> |                                            |            |                |
| Ръка                                     | 10 mg/ml                                   | 10-20 ml   | 100-200 mg     |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 5-10 ml    | 100-200 mg     |
| Крак                                     | 10 mg/ml                                   | 20 ml      | 200 mg         |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 10 ml      | 200 mg         |
| Нервни блокади                           | 10 mg/ml                                   | 2-20 ml    | 20-200 mg      |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 1-10 ml    | 20-200 mg      |
| <b>Епидурална анестезия:</b>             |                                            |            |                |
| Лумбална аналгезия                       | 10 mg/ml                                   | 25-40 ml   | 250-400 mg     |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 12.5-20 ml | 250-400 mg     |
| Торакална анестезия                      | 10 mg/ml                                   | 20-30 ml   | 200-300 mg     |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 10-15 ml   | 200-300 mg     |
| Сакрална хирургична аналгезия            | 10 mg/ml                                   | 40 ml      | 400 mg         |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 20 ml      | 400 mg         |
| Сакрална гинекологична аналгезия         | 10 mg/ml                                   | 20-30 ml   | 200-300 mg     |
|                                          | 20 mg/ml                                   | 10-15 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 израза:

**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 (инфилтративна анестезия, интравенозна регионална анестезия, нервна блокада или епидурална анестезия).

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

### **4.3 Противопоказания**

Свръхчувствителност към активното вещество, към локални анестетици от амиден тип, като прилокаин, мепивакаин и бупивакаин или към някое от помощните вещества, изброени в точка 6.1.

Лидокаин Акорд не трябва да бъде използван за епидурална анестезия при пациенти с изразена хипотония 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 вътресъдово приложение.

Необходима е предпазливост в лечението на следните категории пациенти:

- Пациенти в старческа възраст и с влошено общо състояние.
- Ацидозата или хипоксията при пациента повишава риска и тежестта на токсичните реакции от страна на централната нервна система или сърдечно-съдовата система (вж. точка 4.9).
- Пациенти с AV блок II или III, тъй като локалните анестетици могат да повлияят на миокардната проводимост.





- Пациенти с конгестивна сърдечна недостатъчност, брадикардия или нарушена дихателна функция.
- Пациенти с тежко чернодробно заболяване или бъбречно нарушение.
- Пациенти с епилепсия.
- 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 хондролиза при пациенти, подложени на постоперативна интраартикуларна продължителна инфузия на локални анестетици. Повечето от съобщените случаи на хондролиза 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.

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. Тези усложнения трябва незабавно да бъдат разпознати и лекувани.

Ретро- и перибулбарното инжектиране на локални анестетици носи нисък риск от персистираща очно-моторна дисфункция. Първичните причини включват травма и/или локални токсични ефекти върху мускулите и/или нервите. Степента на тези тъканни увреждания зависи от размера на травмата, концентрацията на локалния анестетик и продължителността на излагане на тъканта на локалния анестетик. Поради тази причина трябва да се използва най-ниската ефективна доза. Вазоконстрикторите и други добавки могат да засилят тъканните реакции и трябва да се използват само ако са показани.

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) или 0,082 mmol натрий (ако се използва концентрация





от 20 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 или бета блокери), 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. точка 4.4).

#### **4.6 Фертилитет, 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 препоръчаните дози, няма вероятност за влияние върху детето. Ето защо, по време на лечение с Лидокаин Акорд, 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, 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<br>( $\geq 1/10$ )                | Съдови нарушения                               | Хипотония                                                                                                                                                                                        |
|                                               | Стомашно-чревни нарушения                      | Гадене                                                                                                                                                                                           |
| Чести<br>( $\geq 1/100$ до $< 1/10$ )         | Нарушения на нервната система                  | Парестезия, замаяност                                                                                                                                                                            |
|                                               | Сърдечни нарушения                             | Брадикардия                                                                                                                                                                                      |
|                                               | Съдови нарушения                               | Хипертония                                                                                                                                                                                       |
|                                               | Стомашно-чревни нарушения                      | Повръщане                                                                                                                                                                                        |
| Нечести<br>( $\geq 1/1\ 000$ до $< 1/100$ )   | Нарушения на нервната система                  | Симптоми на токсичност на ЦНС (конвулсии, периорална парестезия, изтръпване на езика, хиперакузис, зрителни нарушения, загуба на съзнания, тремор, сънливост, виене на свят, тинитус, дизартрия) |
| Редки<br>( $\geq 1/10\ 000$ до $< 1/1\ 000$ ) | Нарушения на имунната система                  | Реакции на свръхчувствителност, анафилактични реакции/шок                                                                                                                                        |
|                                               | Нарушения на нервната система                  | Невропатия, увреждане на периферния нерв, арахноидит                                                                                                                                             |
|                                               | Нарушения на окото                             | Двойно виждане                                                                                                                                                                                   |
|                                               | Сърдечни нарушения                             | Сърдечен арест, аритмия                                                                                                                                                                          |
|                                               | Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения | Респираторна депресия                                                                                                                                                                            |

#### 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:

Изпълнителна агенция по лекарствата

ул. „Дамян Груев“ № 8

1303 София

Тел.: +359 2 8903417

уебсайт: [www.bda.bg](http://www.bda.bg)

#### **4.9 Предозиране**

Случайното интраваскуларно инжектиране на локални анестетици може 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.

#### Остра системна токсичност

Системните прояви на токсичност могат да засегнат както централната нервна система, така и сърдечносъдовата система. Такива реакции се причиняват предимно от високи кръвни концентрации на локалния анестетик, които могат да възникнат в резултат на (случайно) интраваскуларно инжектиране, предозиране или изключително бърза абсорбция от добре перфузирани области (вж. точка 4.4). Реакциите от страна на централната нервна система са сходни за всички локални анестетици от амиден тип, докато сърдечните реакции са по-специфични за лекарството, както в количествено, така и в качествено отношение. По принцип проявите на сърдечносъдова токсичност се





предшестват от прояви на токсичност от страна на централната нервна система, освен ако пациентът не е подложен на обща анестезия или е тежко седирани с лекарства като бензодиазепини или барбитурати.

Токсичността от страна на централната нервна система се развива постепенно, с нарастваща тежест на симптомите и проявите. Първите наблюдавани симптоми са усещане за изтръпване около устата, изтръпване на езика, световъртеж, хиперакузия и шум в ушите и зрителни смущения. Дизартрия, потрепване или тремор са по-сериозни и могат да предшестват генерализирани гърчове. Тези прояви не трябва да се разглеждат като невротично поведение. Впоследствие могат да последват загуба на съзнание и генерализирани тонично-клонични гърчове с различна продължителност от няколко секунди до минути.

Хипоксия и хиперкапния се развиват бързо по време на гърчовете като следствие от повишена мускулна активност и смущения в дишането. В тежки случаи може да настъпи апнея. Ацидозата, хиперкалиемията, хипокалиемията, хипокалциемията и хипоксията увеличават и засилват токсичните ефекти на локалните анестетици. Възстановяването е вследствие от преразпределение на локалния анестетик от централната нервна система, последвано от метаболизъм и екскреция. Възстановяването може да бъде бързо, освен ако не са инжектирани големи количества.

**Сърдечносъдовата токсичност** е показателна за по-сериозни ситуации и обикновено се предхожда от прояви на токсичност от страна на централната нервна система. Продромалните симптоми на централната нервна система може да липсват при силно седирани пациенти или пациенти под обща анестезия. В резултат на високи системни концентрации на локални анестетици може да възникнат хипотония, брадикардия, аритмии и дори сърдечен арест, като в редки случаи сърдечният арест настъпва без продромални ефекти върху ЦНС.

**При деца първите сигнали за токсичност от страна на ЦНС са трудни за идентифициране, ако се появят по време на блокада или под обща анестезия.**

#### *Лечение на остра токсичност:*

В случай на остра токсичност, прилагането на локалния анестетик трябва да се преустанови незабавно. Трябва да се приложат течности интравенозно, за да се предотвратят хипоксията и ацидозата, които потенцират системната токсичност на локалния анестетик (LAST) и влошават прогресията до сърдечносъдов колапс и припадъци.

Ако възникнат гърчове, трябва да се поддържа оксигенацията и да се стимулира кръвообращението. Ако е необходимо, да се приложи антиконвулсант. Трябва да се има предвид използването на интравенозна липидна емулсия.

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, с хемодинамично мониториране в по-тежките случаи. Ефедрин също може да бъде прилаган.

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

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

За успешен изход може да са необходими продължителни реанимационни усилия.





Пациентите с изявиени признаци на LAST трябва да бъдат наблюдавани най-малко 12 часа, тъй като сърдечносъдовата депресия може да персистира или да се появи отново след лечението.

Аналептиците с централно действие са противопоказани.

Няма специфичен антидот.

Диализата има пренебрежима стойност при лечението на остро предозиране с лидокаин.

## **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА**

### **5.1 Фармакодинамични свойства**

Фармакотерапевтична група: Локални анестетици от амидан тип, АТС код: N01BB02

Лидокаин е локален анестетици от амиден тип с бързо начало и средна продължителност на ефекта. 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 абсорбция, 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 петнадесет минути след подкожно 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 абсорбция ще зависи от дозата, пътят на въвеждане и перфузията на мястото на инжектиране. Интеркосталните блокади водят до най-високи плазмени концентрации (приблизително 1,5 µg/ml на инжектирани 100 mg), докато подкожното инжектиране в абдоминалната област води до най-ниски плазмени концентрации (приблизително 0,5 µg/ml на инжектирани 100 mg). Обемът на разпределение в равновесно състояние е 91 литра, а свързването с плазмените протеини, основно към алфа-1-кисел гликопротеин, е 65 %.

Абсорбцията е пълна и бифазна от епидуралното пространство с полуживоти от приблизително 9,3 минути и 82 минути, съответно. Бавната абсорбция е скорост-лимитиращ фактор в елиминирането на лидокаин, което обяснява по-бавното елиминиране след епидурално инжектиране, отколкото след интравенозно инжектиране.

Елиминирането на лидокаин е главно чрез метаболизиране, основно чрез деалкилиране до моноетилглицин ксидид (MEGX), което е метирано както от CYP1A2, така и от CYP3A4. MEGX се метаболизира до 2,6-диметил анилин и глицинексидид (GX). 2,6-диметиланилин се трансформира по-нататък от CYP2A6 до 4-хидрокси-2,6- диметиланилин, който е сновния метаболит в урината (80%) и се





екскретира като конюгат. MEGX има конвулсивна активност, подобна на тази на лидокаин, докато GX няма конвулсивна активност. MEGX се открива в плазмени концентрации близки до тези на изходното вещество. Скоростта на елиминиране на лидокаин и MEGX след интравенозна болус доза е приблизително 1,5-2 часа и 2,5 часа, съответно. Поради бързия метаболизъм в черния дроб, кинетиката е чувствителна към всички чернодробни заболявания. Полуживотът може да бъде повече от двойно по-дълъг при пациенти с чернодробно нарушение. Бъбречните нарушения не повлияват кинетиката, но могат да повишат натрупването на метаболити.

Лидокаин преминава плацентарната бариера и концентрацията на несвързания лидокаин ще бъде една и съща при майката и при плода. Общата плазмена концентрация, обаче, ще бъде по-ниска при плода, поради по-ниската степен на свързване с протеините.

#### *Специални популации*

Фармакокинетиката на лидокаин може да бъде повлияна от състояния, засягащи чернодробната функция, поради неговия бърз метаболизъм. Полуживотът може да бъде удължен 2 или повече пъти при пациенти с чернодробна дисфункция.

Нарушенията на бъбречната функция не се отразяват върху фармакокинетиката на лидокаин, но могат да доведат до натрупване на неговите метаболити.

При новородени, нивата на  $\alpha 1$ -киселия гликопротеин са ниски и свързването с протеините може да бъде намалено. Тъй като свободната фракция може да бъде по-висока, приложението на лидокаин при новородени не се препоръчва.

#### *Старческа възраст*

Елиминационният полуживот и обемът на разпределение могат да бъдат удължени, респ. повишени при пациенти в старческа възраст, поради намаления сърдечен дебит и/или чернодробен кръвоток.

### **5.3 Предклинични данни за безопасност**

В проучванията при животни, токсичността отбелязана след приложение на високи дози лидокаин, се е проявила като ефекти върху централната нервна система и сърдечно-съдовата система.

В проучвания върху репродуктивната токсичност, са отбелязани ембриотоксични и фетотоксични ефекти на лидокаин, приложен подкожно при зайци в дози от 25 mg/kg. При плъхове, в субтоксичния за майката дозов диапазон, лидокаин не е повлиял върху постнаталното развитие на потомството. Не е наблюдавано увреждане на фертилитета от лидокаин при мъжки и женски плъхове. Лидокаин преминава плацентарната бариера чрез проста дифузия.

В *in-vitro* и *in-vivo* изпитвания за генотоксичност, лидокаин не е показал генотоксичен потенциал. Обаче при 2,6-диметиланилин, който е метаболит на лидокаин, има доказателства за генотоксична активност.

С лидокаин не са провеждани проучвания за канцерогенност. В предклинични токсикологични проучвания, оценяващи хроничната експозиция, 2,6-диметиланилин е демонстрирал карциногенен потенциал. Клиничната значимост на тези данни е неясна.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1 Списък на помощните вещества**

Натриев хлорид

Натриев хидроксид (за корекция на pH)

Хлороводородна киселина (за корекция на pH)





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**

3 години.

Да се използва непосредствено след първото отваряне.

## **6.4 Специални условия на съхранение**

Този лекарствен продукт не изисква специални условия на съхранение.

## **6.5 Вид и съдържание на опаковката**

Прозрачни стъклени ампули тип I и прозрачни стъклени флакони тип I с хлоробутилова запушалка и алуминиева обкатка.

10 mg/ml

Стъклени ампули: 5 x 2 ml, 10 x 2 ml, 20 x 2 ml  
5 x 5 ml, 10 x 5 ml, 20 x 5 ml  
10 x 10 ml, 20 x 10 ml

Стъклени флакони: 1 x 20 ml

20 mg/ml

Стъклени ампули: 5 x 2 ml, 10 x 2 ml, 20 x 2 ml  
5 x 5 ml, 10 x 5 ml, 20 x 5 ml  
5 x 10 ml, 10 x 10 ml, 20 x 10 ml

Стъклени флакони: 1 x 20 ml

Не всички видове опаковки могат да бъдат пуснати на пазара.

## **6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне**

Да се използва съгласно лекарското предписание.

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 частици.

## **7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Accord Healthcare Polska Sp. z o.o.,  
ul. Taśmowa 7,  
02-677, Warszawa, Mazowieckie,  
Полша





**8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

10 mg: Рег. № 20150323

20 mg: Рег. № 20150324

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

Дата на първо разрешаване: 09 октомври 2015 г.

Дата на последно подновяване: 21 октомври 2021 г.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

Април 2024 г.

