

**1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ**

**LIDOCAINE SOPHARMA 5 mg/ml, 10 mg/ml, 20 mg/ml solution for injection**  
**ЛИДОКАИН СОФАРМА 5 mg/ml, 10 mg/ml, 20 mg/ml инжекционен разтвор**

**2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**

В 1 ml инжекционен разтвор се съдържа активно вещество лидокаинов хидрохлорид (lidocaine hydrochloride) 5, 10 или 20 mg.

За пълния списък на помощните вещества, вж. точка 6.1.

**3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА**

Инжекционен 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**

Прилагат се инжекционни разтвори на лидокаин в концентрации 50 mg/10 ml (0,5%); 100 mg/10 ml (1%); 40 mg/2 ml (2%) и 200 mg/10 ml (2%).

**Локален анестетик:**

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 мин., продължителността е по-кратка - от 30 до 120 мин.
- За интравенозна регионална анестезия се използва 0,5% разтвор на лидокаин - 50-200 mg (10-40 ml).
- За анестезия в стоматологията – използва се 1-5 ml 2% разтвор на лидокаин (20-100 mg).

**Деца:**

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

**Антиаритмичен продукт**





Начин на приложение: интравенозно, интрамускулно. Предпочита се интравенозното приложение. 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 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%.

**Деца:**

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

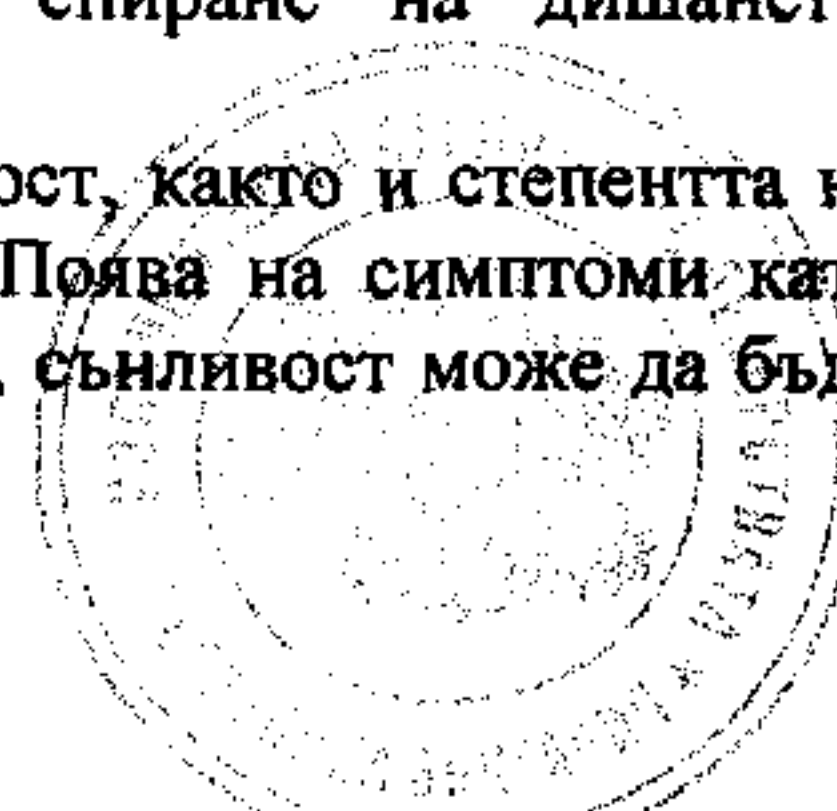
Безопасността и ефикасността на лидокаин като локален анестетик зависи от правилното дозиране, коректното приложение на продукта и съобразяване със съответните предупреждения и адекватни предпазни мерки.

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 степенята 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.

#### **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 невро-мускулни блокери е налице взаимно потенциране на ефектите им.

**Адреналин.** Едновременното 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 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 Софарма не трябва да се използва по време на бременност, освен в случаите на необходимост.

##### **Кърмене**

Лидокаин се екскретира с кърмата, поради което трябва внимателно да се прилага по време на кърмене.

#### **4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Лидокаин Софарма 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.

**Нарушения на нервната система.** Нервност, възбуда, еуфория, объркване, безпокойство, замайване, сънливост, шум в ушите, мускулни потрепвания, парестезии, тремор, конвулсии.

**Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения.** Потискане на дишането, спиране на дишането, кома.

**Сърдечни нарушения.** Хипотензия, брадикардия, аритмия, сърдечен арест.

**Нарушения на окото.** Замъглено, двойно виждане, нистагъм.

**Стомашно-чревни нарушения.** Гадене, повръщане.

**Нарушения на кръвоносната и лимфната система.** Метхемоглобинемия.

**Нарушения на имунната система.** Уртикария, оток, анафилактична реакция.

#### 4.9 Предозиране

**Симптоми.** Артериална хипотония, дихателни смущения, гърчове, нарушена атриовентрикуларна проводимост, метхемоглобинемия.

**Лечение.** Вливането на продукта се спира. Провежда се симптоматично лечение - инхалира се кислород, прилага се сърдечно-съдова и дихателна реанимация, инжектират се интравенозно барбитурати или бензодиазепини за контрол на гърчове.

### 5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

#### 5.1 Фармакодинамични свойства

**Фармакотерапевтична група:** Локални анестетици от амиден тип, АТС код: N01BB02

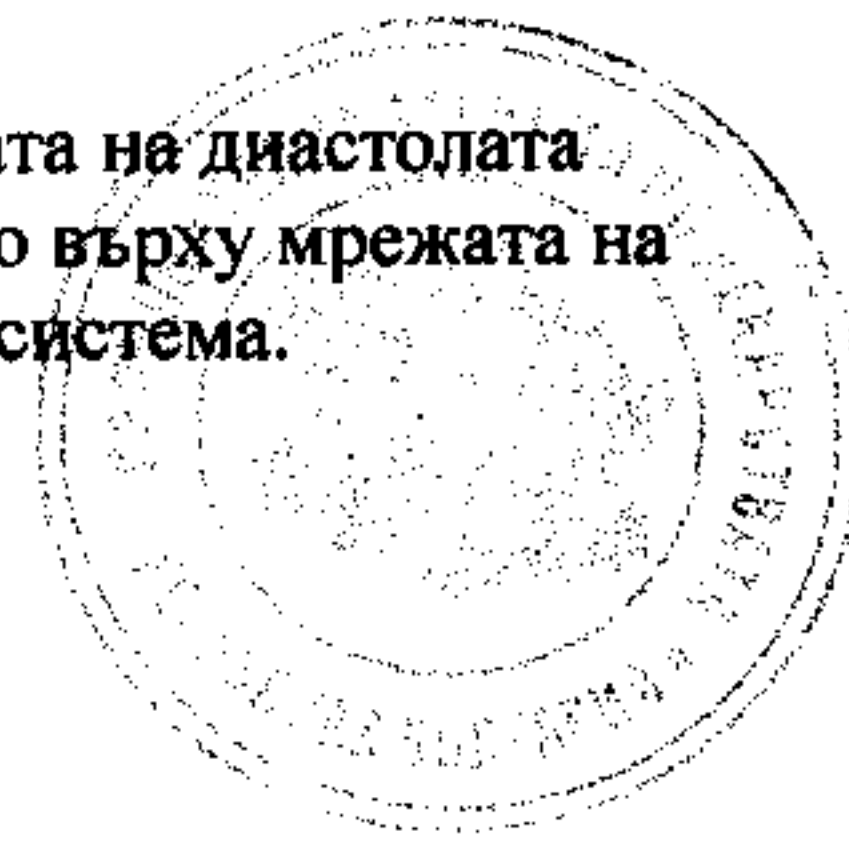
**Фармакотерапевтична група:** Антиаритмични продукти клас Ib, АТС код: C01BB01

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

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 диастолична деполяризация на клетките на възбудно-проводната система. Чрез удължаване на рефрактерния период тези лекарствени продукти могат да премахнат ритъмните нарушения, възникнали по re-entry механизъм, а поради потискане на спонтанната диастолична деполяризация те са ефективни и в случаите на аритмии, възникнали чрез повишен ектопичен автоматизъм.

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.





Не повлиява миокардния контрактилитет, систолното артериално налягане, скоростта на проводимостта през AV възела. Главно предимство на лидокаин е бързо настъпващият и бързо отзвучаващият му ефект.

## 5.2 Фармакокинетични свойства

**Резорбция.** Резорбцията на лидокаин зависи от мястото на приложение и дозата.

Терапевтичната плазмена концентрация е 1,5-5 µg/ml, а токсичната - 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).

**Разпределение.** Обемът на разпределение ( $V_d$ ) е средно 1 l/kg т.м., като намалява по-значимо при болни със сърдечна недостатъчност. Свързва се с плазмените протеини около 66%.

**Метаболизъм.** В черния дроб се метаболизира 90% от приложената доза. При венозно инжектиране лидокаин се метаболизира бързо от чернодробните микрозомни ензими. Два фактора определят неговата ефективност - активността на тези ензими и чернодробният кръвоток. До момента са установени два основни активни метаболита, които определят неговите фармакологични и токсични ефекти - monoethylglycinexylidide и glycinexylidide.

**Екскреция.** Времето на полуелиминиране варира между 1 и 2 часа (средно 100 минути) и показва изразена дозова зависимост. Елиминира се от организма чрез бъбречна екскреция основно под формата на метаболити (90%), а останалите 10% от приложената доза се елиминират в непроменен вид. Лидокаин преминава през плацентата.

## 5.3 Предклинични данни за безопасност

LD<sub>50</sub> 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

Не са известни.

### 6.3 Срок на годност

2 години.

### 6.4 Специални условия на съхранение

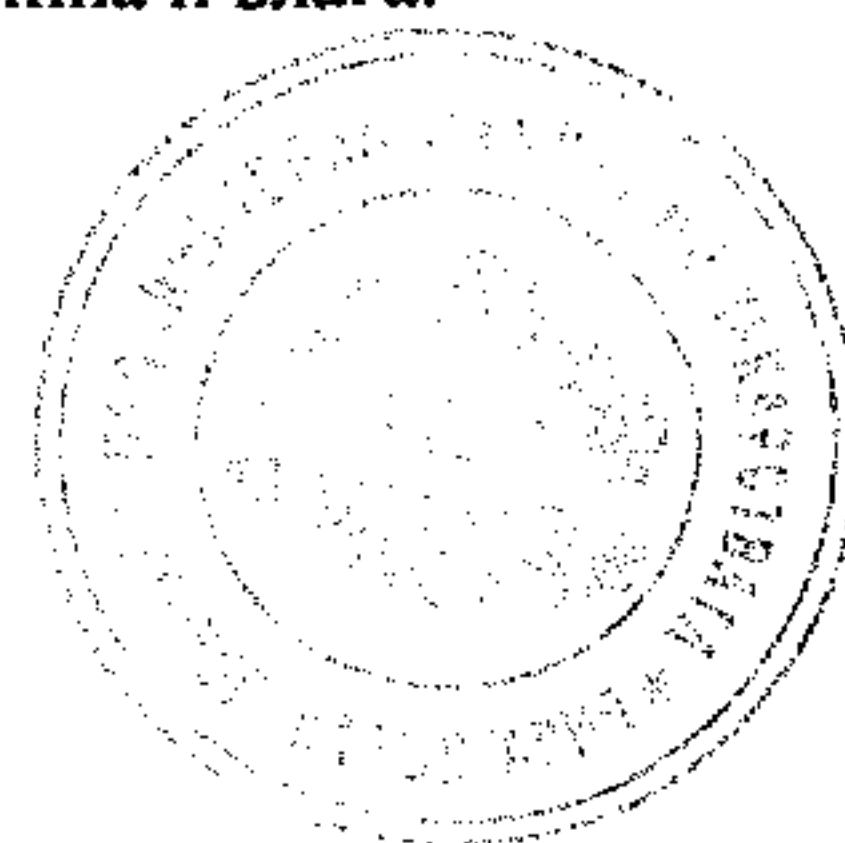
Да се съхранява в оригиналната опаковка, за да се предпази от светлина и влага.

Да се съхранява под 25°C.

Да не се замразява!

Да се съхранява на място, недостъпно за деца!

### 6.5 Данни за опаковката





*Първична опаковка*

Ампули от безцветно стъкло 1-ви хидролитичен клас, с вместимост 2 ml и 10 ml, с маркировка за отваряне на ампулата – цветна точка или пръстен.

*Вторична опаковка*

Ампули по 5 mg/ml - 10 ml и 10 mg/ml - 10 ml: 5 ампули в блистер от PVC фолио, по 1 или 10 блистера в картонена кутия, заедно с листовка (5 или 50 ампули).

Ампули по 20 mg/ml - 2 ml: 10 ампули в блистер от PVC фолио, по 1 или 10 блистера в картонена кутия, заедно с листовка (10 или 100 ампули).

Ампули по 20 mg/ml - 10 ml: 5 ампули в блистер от PVC фолио, по 1 или 10 блистера в картонена кутия, заедно с листовка (5 или 50 ампули).

**6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа**

Няма специални изисквания.

**7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

СОФАРМА АД

ул. Илиенско шосе 16, 1220 София, България

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

Лидокаин Софарма инжекционен разтвор 5 mg/ml – 20020814

Лидокаин Софарма инжекционен разтвор 10 mg/ml – 20020815

Лидокаин Софарма инжекционен разтвор 20 mg/ml – 20020816

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

11.10.2002 г.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

Февруари, 2008 г.

