

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА МЕДИЦИНСКИОТ ПРОИЗВОД

Лидокаин хидрохлорид АЛКАЛОИД®, 40 mg/2 ml раствор за инјектирање.

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

2 ml раствор за инјектирање (1 ампула) содржи 40 mg лидокаин хидрохлорид (во форма на монохидрат).

За ексципиентите, видете го делот 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКА ФОРМА

* Раствор за инјектирање
Безбоен, бистар раствор.

4. КЛИНИЧКИ ОСОБЕНОСТИ

4.1 Терапевтски индикации

Локална анестезија со површна инфилтрација за регионална, епидурална, каудална и за стоматолошка анестезија. Лидокаин хидрохлорид може да се комбинира со адреналин. Сузбивање вентрикуларни екстрасистולי и вентрикуларна тахикардија, особено по миокарден инфаркт.

4.2 Дозирање и начин на примена

Дозирањето на лидокаинот треба да биде индивидуално за секој пациент, според возраста и според телесната тежина. Се препорачува употреба на најмала доза и на најниска концентрација со која се постигнува саканиот ефект.

Локален анестетик

Инфилтративна анестезија

За перкутана инфилтративна анестезија препорачана доза кај возрасни е 5 – 300 mg (максималната доза е 4,5 mg/kg/тт).

За интравенска регионална анестезија препорачана доза е 50 – 300 mg (максималната доза е 4 mg/kg/тт за возрасни и 3 mg/kg/тт за деца).

За блокада на периферни нерви се препорачуваат различни дози – од 30 до 300 mg.

За блокада на симпатични нерви препорачани дози се 50 mg за цервикални нерви, а 50 – 100 mg за лумбални нерви.

Епидурална и каудална анестезија

Препорачана доза за лумбална епидурална анестезија е 250 – 300 mg, а за парацервикален блок во опстетриција препорачана доза е 200 – 300 mg.



Антиаритмик

Интравенска инјекција

Препорачана доза е 1 mg/kg/тт (50 – 100 mg). Почетната доза од 25 – 50 mg/мин. може да се повтори по 5 минути до 300 mg за еден час.

Кај деца дозата изнесува од 0,5 до 1 mg/kg/тт (25 – 50 mg). Дозата може да се повтори по 5 минути до тотална доза од 3 mg/kg/тт.

Интравенска инфузија

Препорачана доза е 20 – 50 µg/kg, до 1 – 4 mg/мин. Максимална доза е 300 mg (околу 4,5 mg/kg/тт) на час. Препорачана доза за деца е 30 µg/kg/мин.

Интрамускулна инјекција

Препорачана доза е 4,3 mg/kg/тт и може да се повторува по 60 до 90 минути ако е неопходно. Дозата може да се зголемува до 4,5 mg/kg/тт секој час. Кај постари пациенти и кај пациенти со срцева слабост, со кардиоген шок или со хепатални заболувања, дозата треба видно да се намали (до 50% од нормалната доза) и протокот на инфузијата треба да се редуцира на 1 – 2 mg/мин. Како додаток за интрамускулни инјекции се користи според упатствата за соодветниот препарат.

4.3 Контраиндикации

Преосетливост на локален анестетик од амиден тип.

Брадикардија, АВ-блок и други срцеви оштетувања во спроводливоста.

4.4 Посебни предупредувања и мерки на претпазливост

Како и другите локални анестетици, Лидокаин хидрохлорид треба да се употребува со претпазливост кај пациенти со епилепсија, мијастенија гравис, нарушена срцева спроводливост (видете го и делот 4.3), со конгестивна срцева слабост, брадикардија, шок, со нарушена респираторна функција како и кај пациенти со нарушена ренална функција со клиренс помал од 10 ml/min. Лидокаинот се метаболизира во хепарот и треба внимателно да се дава на пациентите со хепатална инсуфициенција. Кај пациенти со конгестивна срцева слабост и кај пациенти подготвени за операција на срцето треба да се даваат помали дози.

Ако пациентот има хипокалемија, хипоксија или дисбаланс на ацидобазната рамнотежа, тие треба да бидат коригирани пред да се даде лидокаин хидрохлорид. Кога се даваат локални анестетици, во близина треба да има опрема за ресусцитација.

Не треба да се аплицира во инфицирани делови бидејќи ќе се намали ефектот на анестетикот.

При давањето на локалната анестезија може да се појават сериозни несакани ефекти, независно од тоа кој локален анестетик се аплицира.

- Централната анестезија може да предизвика кардиоваскуларна депресија, особено доколку постои хиповолемија. Затоа, кај пациентите со нарушена кардиоваскуларна функција треба внимателно да се дава епидурална анестезија.

- Епидуралната анестезија може да предизвика хипотензија и брадикардија. Ризикот може да се намали со претходно давање кристалоидни и колоидни раствори. Хипотензијата треба веднаш да биде ставена под контрола.

- Парацервикалниот блок може да предизвика фетална брадикардија или тахикардија; затоа постојано треба да се следи работата на срцето на фетусот кај брамените жени.



- Инјекции во деловите на главата и на вратот може да предизвикаат церебрални симптоми ако случајно анестетикот биде даден во артерија, дури и ако биде ниска дозата на анестетикот.
- Ретробулбарните инјекции ретко може да бидат вбригани во субарахноидалниот простор, што може да предизвика сериозни реакции како кардиоваскуларен колапс, апнеја, конвулзии и привремено слепило.
- Ретробулбарно и перибулбарно инјектирање локални анестетици носи со себе низок ризик од трајна окуларна моторна дисфункција. Причината е траума или токсичен ефект на локалните мускули и нерви. Колкаво ќе биде оштетувањето на ткивата и на нивната функцијата зависи од степенот на траумата и од времетраењето на експозицијата на анестетикот. Затоа, секогаш треба да се користи најмалата ефективна доза од локалниот анестетик. Употребата на лидокаин инјекциите кај новороденчиња не се препорачува. Не е утврдена оптималната ефективна доза за оваа возрасна група.

Во терапијата на аритмии смее да се користи само лидокаин без додаток на адреналин. Заедно со адреналин може да се користи само во локална анестезија.

4.5 Интеракции со други медицински производи и други форми на интеракција

Клиренсот на лидокаинот може да биде намален од дејството на бета-блокаторите (на пр. пропранолол) и на циметидин. Во тој случај треба да се намали дозата лидокаин. Лидокаин треба да се употребува со претпазливост кај пациенти кои примаат други локални анестетици или средства структурно слични на амидниот тип локални анестетици како на пр. мексилитин, поради дополнителните системски токсични дејства. Специфични студии за интеракции помеѓу лидокаин и антиаритмици од III група (амиодарон) не се изведени, но потребна е претпазливост.

Може да постои зголемен ризик од појава на вентрикуларна аритмија при истовремена употреба на лидокаин со антипсихотици кои го продолжуваат или кои може да го продолжат QT-интервалот (на пр. pimozide, sertindole, olanzapine, quetiapine, zotepine), или со 5HT₃-антагонисти (на пр. tropisetron, dolasetron).

Истовремена употреба со quinupristin/dalfopristin треба да се избегнува.

Може да има зголемен ризик од појава на засилена и продолжена нервномускулна блокада кај пациенти кои се истовремено лекувани со мускулни релаксанти (на пр. со suxamethonium).

4.6 Бременост и доене

Бременост

Иако не е утврдено дека лидоканиот е штетен за фетусот (во студии на животни), тој ја минува плацентата и не треба да се употребува во раната бременост, освен ако придобивката за мајката не е поголема од ризикот.

Лидокаинот даден со епидурален или со парацервикален блок, особено во високи дози, или при локална перинеална инфилтрација пред породување, стигнува брзо во феталната циркулација. Лидокаинот може да се задржи кај бебето во голема концентрација најмалку 48 часа по раѓањето. Кај бебето може да се појави брадикардија, хипотонија или респираторна депресија.

Лактација



Мали количини лидокаин се секретираат во мајчиното млеко и секогаш постои можност од појава на алергиска реакција кај доенчето.

4.7 Влијание врз способноста за возење и за ракување со машини

Кога се анестезира дел од телото кој се користи при возење и при ракување со машини, пациентот треба да се посоветува да не вози и да не ракува со машини додека не помине дејството на анестетикот.

4.8 Несакани дејства

Слично како и кај другите анестетици, несаканите ефекти поврзани со лидокаин се ретки и се должат на зголемената концентрација на плазмата, најчесто поради случајно интраваскуларно инјектирање, поради поголема доза или поради брза апсорпција во густото васкуларизирано ткиво. Несаканите дејства, исто така, може да бидат резултат на хиперсензитивност, идиосинкразија или на намалена толеранција кај пациентот. Системската токсичност, главно, ги опфаќа кардиваскуларниот и нервниот систем (видете го делот 4.9. *Предозирање*).

Кардиваскуларни нарушувања

Хипотензија, брадикардија, миокардијална депресија, аритмии, кардијак арест и циркулаторен колапс.

Хипотензијата може да се појави при спинална и при епидурална анестезија. Пријавени се изолирани случаи на брадикардија и на кардијак арест.

Нарушувања на увото и на лабиринтот

Тинитус, хиперакузија.

Нарушувања на очите

Заматен вид, диплопија и привремена амауроза.

Билатералната амауроза може да биде последица од инјектирање на анестетикот во оптичкиот нерв при окуларни процедури. Пријавени се орбитална инфламација и диплопија по ретробулбарна и по перибулбарна анестезија (видете го делот 4.4. *Посебни предупредувања и мерки на претпазливост*).

Гастроинтестинални нарушувања

Наузеја, vomitus.

Нарушувања на имунолошкиот систем

Хиперсензитивни реакции (алергиски или анафилактични реакции, анафилактичен шок) – видете го и делот *Нарушувања на кожата и на поткожното ткиво*.

Нарушувања на нервниот систем и психијатриски нарушувања

Невролошки знаци на системска токсичност со лидокаин се вртоглавица или зашеметеност, нервоза, тремор, парестезија, вкочанетост на јазикот, сонливост, конвулзии, кома.

Може да се појават ексцитаторни или депресивни невролошки реакции. Ексцитаторните реакции може и воопшто да не се појават, и во тој случај првите знаци на токсичност би биле збунетост и сонливост, а по нив пациентот може да западне во кома и да се појави респираторен колапс.

Невролошка минлива компликација на спинална анестезија е болка во долниот дел од грбот, задникот и од нозете. Овој симптом обично се појавува во првите 24 часа по анестезирањето и трае неколку денови. Изолирани случаи на арахноидитис и на синдром на кауда еквина се пријавени по давање спинална анестезија со лидокаин и со други слични анестетици. Овие синдроми се проследени со перзистентна парестезија,



со гастроинтестинална и со уринарна дисфункција, или со парализа на долните екстремитети. Најголем број од овие случаи се асоцирани со хипербарични концентрации на лидокаин или со пролонгирана спинална анестезија.

Респираторни, торакални и медијастинални нарушувања

Диспнеја, бронхоспазма, респираторна депресија, респираторен арест.

Нарушувања на кожата и на поткожните ткива

Исип, уртикарија, ангиоедем, едем на лицето.

4.9 Предозирање

Симптоми на акутна системска токсичност

Знаците на акутна токсичност кои се манифестираат од страна на централниот нервен систем имаат прогресирачки карактер. Состојбата може да започне со појава на парестезии, здрвеност на јазикот, зашеметеност, хиперакузија и тинитус. Потоа се појавува нарушување на видот, мускулен тремор и грчеви кои претходат на појавата на генерализирани конвулзии. Овие знаци не смеат да бидат поистовестувани со невротично однесување. Понатаму, може да следат загуба на свеста и појава на гранд мал напади кои може да траат од неколку секунди до неколку минути. Поради зголемената мускулна активност и поради нарушената респирација при конвулзиите, брзо се развива хипоксија и хиперкапнија. Кај посериозните случаи може да дојде до појава на апнеја. Ацидозата ќе ги потенцира токсичните ефекти од анестетикот.

Кај посериозните случаи, знаци на акутна токсичност ќе се манифестираат и од страна на кардиоваскуларниот систем, како хипотензија, брадикардија, аритмија и кардијак арест со потенцијален фатален исход.

Може да дојде до подобрување на состојбата по редистрибуција на анестетикот од нервниот систем бидејќи метаболизмот е брз, освен ако не била дадена голема доза.

Терапија на акутната токсичност

Доколку се појават знаци на акутна системска токсичност, треба веднаш да се сопре инјектирањето на анестетикот.

Терапија ќе биде потребна само доколку се појават конвулзии и депресија на ЦНС.

Терапијата се состои во одржување на оксигенацијата, купирање на конвулзиите и одржување на циркулацијата. Треба да се контролира дишењето и да се даде кислород, ако има потреба и со асистирани вентилација (маска и кесичка). Циркулацијата се одржува со инфузија на плазма и на интравенозни раствори. Ако има потреба, може да се употреби и вазопресорен лек, но оваа постапка носи со себе ризик од експитација на ЦНС. Ако конвулзиите спонтано не престанат за 15 до 20 секунди, може да се даде Diazepam или Thiopentone Sodium, земајќи предвид дека овие лекови може да предизвикаат депресија на респирацијата и на циркулацијата. Пролонгираните конвулзии може да го оневозможат дишењето и доволната оксигенација, па поради тоа може да има потреба од ендотрахеална интубација. Ако се појави кардијак арест, треба да се спроведат стандардните мерки за кардиопулмонална ресусцитација. Најважно е да се обезбеди континуирана оптимална оксигенација, вентилација, циркулаторна поддршка и корекција на системската ацидоза. Дијализата нема некоја вредност во терапијата на акутното предозирање со лидокаин.



5. ФАРМАКОЛОШКИ СВОЈСТВА

5.1 Фармакодинамски својства

Фармакотерапевтска група: локален анестетик, амид; и антиаритмик група IB.
АТС-код: N01BB02; C01BB01

Лидокаинот е локален анестетик од амиден тип. Лидокаинот се користи за локална анестезија на различни делови од телото. Овој локален анестетик ја стабилизира невронската мембрана инхибирајќи го јонскиот рефлукс потребен за иницирање и за спроведување на нервните импулси. Покрај ова дејство, лидокаинот дејствува и на централниот нервен систем и на кардиоваскуларниот систем. По апсорпцијата, лидокаинот прво може да го ексцитира ЦНС, со негова последователна инхибиција, а во кардиоваскуларниот систем дејствува примарно на миокардот со инхибиција на ексцитабилноста, спроводливоста на импулсите и на силата на контракцијата.

5.2 Фармакокинетски својства

Брзината и количината на апсорпција на лидокаинот од местото на вбригување зависи од самото место на апликација и од прокрвеноста на ткивото. Исклучувајќи го интраваскуларното вбригување, најдобра ресорпција се постигнува при интеркостален нервен блок, а најслаба – по субкутано вбригување. Лидокаинот се врзува за плазматските протеини, вклучувајќи го алфа-1-гликопротеинот. Анестетикот ја минува крвномозочната и плацентарната бариера.

Лидокаинот се метаболизира во хепарот и околу 90% од дозата подлежи на N-деалкилација по што се добива моноетилглицинксилонид и глицинксилонид, на кои се должи терапевтското и токсичното дејство на лидокаинот. Метаболитите се екскретирани преку урината, а помалку од 10% од дозата се исфла како непроменет лидокаин. Полувремето на елиминација по интравенозна болус-инјекција е еден до два часа и може да биде пролонгирано кај пациенти со хепатална инсуфициенција.

5.3 Предклинички податоци за безбедноста на медицинскиот производ

Нема клинички податоци кои откриваат особен ризик кај луѓе кои се базирани на конвенционални студии за безбедност на лекот, токсичност при повторена доза, генотоксичност, карциноген потенцијал и за токсичност на репродукцијата.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ОСОБЕНОСТИ

6.1 Листа на ексципиенти:

- натриум хлорид;
- натриум хидроксид;
- вода за инјекции.

6.2 Инкомпатибилности

Во отсуство на студии за компатибилност, да не се меша со други медицински



производи.

6.3 Рок на траење

Три (3) години.

6.4 Посебни мерки на чување

Медицинскиот производ не бара посебни услови за чување.
Да се чува надвор од дофат на деца.

6.5 Опис и содржина на пакувањето

Растворот за инјектирање е спакуван во безбојни ампули од неутрално стакло од 2 ml во пластични инсерти; секој инсерт содржи 5 ампули.
Кутијата содржи 100 ампули од 40 mg/2 ml.

6.6 Посебни мерки на претпазливост при исфрлање

Неискористениот производ или отпадните материјали треба да се отстранат во согласност со законските барања.

7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

АЛКАЛОИД АД – Скопје
бул. Александар Македонски 12
1000 Скопје, Република Македонија
тел.: + 389 2 310 40 00
факс: + 389 2 31 04 021
www.alkaloid.com.mk

8. БРОЈ И ДАТУМ НА РЕШЕНИЕТО ЗА ПРОМЕТ

9. ДАТУМ НА ПРВАТА РЕГИСТРАЦИЈА/ОБНОВА НА РЕГИСТРАЦИЈАТА

10. ДАТУМ НА РЕВИЗИЈА НА ТЕКСТОТ

Декември 2012 г.

