CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

LIGNOCAINUM HYDROCHLORICUM WZF 1%, 10 mg/ml, roztwór do wstrzykiwań

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każdy ml roztworu zawiera 10 mg lidokainy chlorowodorku jednowodnego (*Lidocaini hydrochloridum*).

Każda ampułka 2 ml zawiera 20 mg lidokainy chlorowodorku jednowodnego.

Każda fiolka 20 ml zawiera 200 mg lidokainy chlorowodorku jednowodnego.

Substancja pomocnicza o znanym działaniu:
Każdy ml roztworu zawiera 2,75 mg sodu.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Roztwór do wstrzykiwań

Bezbarwny, przezroczysty płyn.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

- Znieczulenie regionalne - nasiękowe, blokady nerwów, pni nerwowych i splotów nerwowych, podpajęczynówkowe, zewnątrzoponowe - w chirurgii ogólnej, urologii, ortopedii, ginekologii, położnictwie, ponadto w różnych procedurach diagnostycznych i terapeutycznych.
- Komorowe zaburzenia rytmu serca (przedwczesne skurcze komorowe, częstoskurcz komorowy), zwłaszcza w przebiegu ostrego zawału mięśnia sercowego lub po przedawkowaniu glikozydów nasercowych.
- Leczenie bólu w okresie okołooperacyjnym, jako składnik analgezji prewencyjnej (zapobiegawczej) i analgezji multimodalnej (wielokierunkowej).
- Leczenie bólu neuropatycznego, jako lek drugiego rzutu.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Znieczulenie regionalne

Maksymalna dawka jednorazowa lidokainy dla dorosłego pacjenta wynosi 200 mg (4,5 mg/kg mc.). Podane dawki mają charakter orientacyjny i dotyczą osób dorosłych, w dobrym stanie ogólnym, bez chorób współistniejących. U dzieci nie należy przekraczać dawki 3 mg/kg mc. Lidokainę należy

dawkować indywidualnie, kierując się masą ciała i stanem ogólnym pacjenta. W trakcie znieczulenia pacjenta należy nadzorować oraz monitorować czynności życiowe.

Siła i czas działania lidokainy zależą od stężenia i objętości zastosowanego roztworu. Zwiększenie objętości i stężenia przyspiesza, wydłuża i nasila działanie miejscowo znieczulające.
Lidokainę, podobnie jak inne środki miejscowo znieczulające, należy podawać powoli, po uprzednim wykonaniu próby aspiracji, co pozwala uniknąć niezamierzonego podania donaczyniowego.

Podczas wykonywania znieczulenia zewnątrzoponowego podanie zasadniczej dawki środka znieczulającego należy poprzedzić dawką testową (3 do 5 ml chlorowodorku lidokainy z dodatkiem adrenaliny). Po omyłkowym, donaczyniowym podaniu dawki testowej zawarta w niej adrenalina wywołuje wyraźne przyspieszenie czynności serca. Dlatego przez 5 minut po podaniu należy obserwować zapis EKG na ekranie monitora. Negatywny wynik testu uprawnia do wstrzyknięcia (z szybkością 25 do 50 mg/min) pozostałej dawki środka znieczulającego. W tym czasie należy utrzymywać stały, słowny kontakt z pacjentem i jeżeli pojawią się nawet łagodne objawy przedawkowania, należy natychmiast przerwać iniekcję.
Dawka testowa pozwala również uniknąć niebezpieczeństw związanych z niezamierzonym, podpajęczynówkowym wstrzyknięciem produktu z następowym całkowitym znieczuleniem rdzeniowym.
Odstępy między kolejnymi, podawanymi zewnątrzoponowo dawkami produktu nie powinny być krótsze niż 90 minut.
Maksymalna dawka lidokainy podawana w trakcie blokady okołoszyjkowej (podczas porodu i w ginekologii) nie powinna przekraczać 200 mg co 90 minut.
Należy zawsze stosować najmniejsze skuteczne dawki lidokainy, aby ograniczyć ryzyko przedawkowania. Produkt można rozcieńczać 0,9% roztworem chlorku sodu.

Stężenie leku	**Rodzaj znieczulenia**	**Dawka maksymalna**
0,5 do 2%	Znieczulenie nasiękowe	Do 200 mg
0,5 do 2%	Blokady pni i splotów nerwowych	Do 200 mg
0,5 do 2%	Znieczulenie zewnątrzoponowe	Do 200 mg
1 do 2%	Znieczulenie podpajęczynówkowe	Do 80 mg (1,5 do 4 ml)
0,5 do 1%	Znieczulenie odcinkowe dożylne	Do 200 mg

Zaburzenia rytmu serca

W celu leczenia zaburzeń rytmu u osób dorosłych podaje się dożylnie lidokainę w jednorazowej dawce wynoszącej od 50 do 100 mg, lub w dawkach podzielonych po 25 do 50 mg na minutę. Jeśli początkowa dawka nie była skuteczna, kolejną (50 do 100 mg) można podać po upływie 5 minut. Nie należy przekraczać dawki 200 do 300 mg w ciągu godziny.
U chorych z tendencją do nawrotów zaburzeń rytmu lub opornych na działanie doustnych leków przeciwarytmicznych można zastosować ciągłą infuzję dożylną lidokainy z szybkością od 1 do 4 mg/min (20 do 50 μg/kg mc./min) pod stałą kontrolą EKG. Infuzję należy przerwać, gdy ustąpią zaburzenia rytmu lub pojawią się objawy przedawkowania.
U osób w wieku podeszłym należy dawkę dostosować do ogólnego stanu pacjenta.
Natomiast zaburzenia rytmu serca u dzieci leczy się lidokainą podawaną dożylnie w dawce 0,8 do 1 mg/kg mc., którą w razie potrzeby można powtarzać do łącznej dawki 3 do 5 mg/kg mc. Lidokainę można również podawać w ciągłej infuzji dożylnej z szybkością 10 do 50 μg/kg mc./min.

Leczenie bólu w okresie okołooperacyjnym

Lidokaina podawana dożylnie w okresie okołooperacyjnym jest stosowana u pacjentów dorosłych jako adiuwant w terapii multimodalnej (wielokierunkowej) i w analgezji prewencyjnej

(zapobiegawczej). Lidokainę podaje się dożylnie w zabiegach operacyjnych z niewielkim do znacznego i rozległego urazem tkanek.

Zazwyczaj stosowane dawkowanie:
- dawka nasycająca 1,5 mg/kg mc. podawana w bolusie, a następnie 1,5 do 3 mg/kg mc./godz. w infuzji ciągłej w trakcie operacji; zalecane jest rozpoczęcie podawania lidokainy 30 minut przed indukcją znieczulenia, jednak nie później niż w czasie indukcji znieczulenia;
- w okresie pooperacyjnym: 1 do 3 mg/kg mc./godz. w infuzji ciągłej przez 24 do 48 godz.

Jeśli u pacjenta lidokaina stosowana jest jednocześnie jako lek znieczulający miejscowo (nasiękowo), np. w celu ostrzyknięcia przewidywanej linii cięcia oraz w infuzji dożylnej, całkowitą dawkę lidokainy należy zmniejszyć.
Jeśli istnieje taka konieczność, infuzję dożylną lidokainy można rozpocząć 4 do 8 godzin po podaniu ostatniej dawki (w bolusie) leku stosowanego w znieczuleniu regionalnym. W przypadku nieudanego znieczulenia zewnątrzoponowego, po zatrzymaniu infuzji ciągłej do przestrzeni zewnątrzoponowej i bez podania dawki do przestrzeni zewnątrzoponowej w bolusie, ciągła infuzja dożylna lidokainy może być rozpoczęta natychmiast, ale bez podania dożylnego w bolusie.

Dawkę lidokainy należy zmniejszyć w stanach, w których może dojść do zwiększenia wolnej frakcji leku w surowicy – kwasicy, hiperkapnii, hipoksji, hipoproteinemii oraz zaburzeń czynności wątroby i (lub) nerek. U pacjentów z niewydolnością krążenia, wątroby i (lub) nerek należy zmniejszyć dawkę lidokainy i monitorować czynność układu krążenia.

Leczenie pacjentów z bólem neuropatycznym
Dorośli:
Infuzja ciągła dożylna w dawce 3-5 mg/kg mc. przez minimum 30 minut, ale nie dłużej niż 6 godzin, raz na dobę.

Sposób podawania
Produkt można stosować dożylnie, nasiękowo, podpajęczynówkowo i zewnątrzoponowo.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancję czynną lub inne leki miejscowo znieczulające o budowie amidowej, lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Ogólne przeciwwskazania do wykonywania znieczulenia podpajęczynówkowego i zewnątrzoponowego, niezależnie od rodzaju środka znieczulającego:
  - ostre choroby ośrodkowego układu nerwowego (np. zapalenie opon mózgowo-rdzeniowych, guzy, zapalenie istoty szarej rdzenia, krwawienie śródczaszkowe);
  - zwężenie kanału rdzenia kręgowego, czynne choroby kręgosłupa (np. proces zapalny, gruźlica kręgosłupa, guzy) lub niedawno przebyte urazy kręgosłupa (np. złamania);
  - posocznica;
  - podostre zwyrodnienie rdzenia kręgowego w przebiegu niedokrwistości złośliwej;
  - zakażenie skóry w miejscu wykonywania znieczulenia lub w jego okolicy;
  - wstrząs kardiogenny lub hipowolemiczny;
  - zaburzenia krzepnięcia lub leczenie lekami przeciwzakrzepowymi.
- Infuzja dożylna lidokainy stosowanej w leczeniu bólu w okresie okołooperacyjnym jest przeciwwskazana, jeżeli jednocześnie stosowane jest znieczulenie regionalne, szczególnie takie, w którym podaje się lek znieczulenia miejscowego w bolusie lub w dużych dawkach (np. znieczulenie zewnątrzoponowe, znieczulenia pni i splotów nerwowych).

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Znieczulenie miejscowe za pomocą lidokainy może być wykonywane wyłącznie przez lekarzy dobrze znających technikę znieczuleń oraz przeszkolonych w diagnostyce i leczeniu następstw przedawkowania lidokainy, które mogą pojawić się w trakcie znieczulenia regionalnego.

W pomieszczeniu, w którym wykonywane są znieczulenia, musi znajdować się źródło tlenu, sprzęt resuscytacyjny i niezbędne leki. Przed przystąpieniem do znieczulenia należy zapewnić dostęp do żyły. Opóźnienie podjęcia działań resuscytacyjnych może prowadzić do niedotlenienia, kwasicy, zatrzymania czynności serca, a nawet zgonu pacjenta.
Każde wstrzyknięcie lidokainy w celu znieczulenia należy poprzedzić próbą aspiracji, aby uniknąć niezamierzonego podania donaczyniowego.

Warunki bezpiecznego stosowania lidokainy: odpowiednie dawkowanie, poprawna technika znieczulenia, przestrzeganie środków ostrożności oraz gotowość do podjęcia postępowania resuscytacyjnego.

Powtarzanie dawek lidokainy może doprowadzić do niebezpiecznie wysokiego wzrostu stężenia w surowicy. Ponieważ ogólna reakcja na wysokie stężenie zależy od stanu pacjenta, u osób wyniszczonych, w podeszłym wieku oraz dzieci należy dostosować dawkę do masy ciała i stanu zdrowia.

Lidokaina jest metabolizowana w wątrobie, dlatego w przypadkach niewydolności wątroby należy uwzględnić możliwość zwiększenia stężenia lidokainy w płynach ustrojowych.

Podczas znieczulenia należy stale monitorować stan świadomości oraz czynność układów krążenia i oddychania. Wczesnymi objawami toksycznych stężeń lidokainy w ośrodkowym układzie nerwowym są: metaliczny smak w ustach, niepokój, szumy uszne, zawroty głowy, zaburzenia widzenia, drżenia mięśniowe lub senność.
Przestrzeganie środków ostrożności jest szczególnie ważne podczas wykonywania znieczuleń w obrębie głowy i szyi. Znieczulenie w obrębie głowy i szyi może wywołać objawy zatrucia mimo zastosowania dopuszczalnej dawki środka znieczulającego. Opisywano w tych przypadkach zaburzenia świadomości, drgawki, depresję układów oddechowego i krążenia. Powyższe reakcje mogą być następstwem niezamierzonego donaczyniowego podania lidokainy. Szczególnie groźne mogą być konsekwencje wstrzyknięcia produktu do światła tętnicy zaopatrującej ośrodkowy układ nerwowy.

Należy zachować ostrożność podając lidokainę zewnątrzoponowo pacjentom z blokiem serca, a także ciężkim nadciśnieniem tętniczym.

Przed wykonaniem znieczulenia podpajęczynówkowego, bez względu na zastosowany środek miejscowo znieczulający, należy rozważyć potencjalne ryzyko i korzyść dla pacjenta.

Groźnym powikłaniem znieczuleń centralnych jest całkowite znieczulenie rdzeniowe, które jest następstwem podania do przestrzeni podpajęczynówkowej zbyt dużej dawki środka miejscowo znieczulającego. W rezultacie dochodzi do niewydolności układów krążenia i oddechowego.
Niewydolność krążenia jest spowodowana rozległą blokadą układu współczulnego, której objawami są niedociśnienie, znaczna bradykardia lub nawet zatrzymanie pracy serca.
Niewydolność oddechowa jest spowodowana porażeniem mięśni oddechowych w wyniku zahamowania przewodnictwa w nerwach zaopatrujących mięśnie oddechowe, w tym również przeponę.

Ryzyko wystąpienia wysokiego znieczulenia podpajęczynówkowego jest większe u pacjentów otyłych, z nadciśnieniem wewnątrzbrzusznym oraz u kobiet w zaawansowanej ciąży. W tych przypadkach należy zmniejszyć dawkę środka miejscowo znieczulającego.

Natomiast całkowite znieczulenie rdzeniowe jest zazwyczaj rezultatem niezamierzonego, omyłkowego podania do przestrzeni podpajęczynówkowej dawki leku przeznaczonej do znieczulenia zewnątrzoponowego.

Wykonanie znieczulenia podpajęczynówkowego u pacjenta z hipowolemią (niezależnie od rodzaju i dawki zastosowanego środka miejscowo znieczulającego) może doprowadzić do nagłego i znacznego obniżenia ciśnienia tętniczego.

Trwałe powikłania neurologiczne (brak czucia, zaburzenia czynności ruchowych lub porażenia) bardzo rzadko są następstwem znieczulenia podpajęczynówkowego.

Zaleca się zachowanie ostrożności u pacjentów z zaburzeniami neurologicznymi, takimi jak stwardnienie rozsiane, porażenie połowicze, porażenie poprzeczne, zaburzenia nerwowo-mięśniowe, mimo że nie obserwowano nasilenia tych zaburzeń po wykonaniu znieczulenia podpajęczynówkowego.

Przed podaniem lidokainy w leczeniu bólu w okresie okołooperacyjnym oraz w leczeniu bólu neuropatycznego, jako leku drugiego rzutu, należy u pacjenta wykluczyć i (lub) wyrównać zaburzenia gospodarki wodno-elektrolitowej.

Produkt leczniczy zawiera 2,75 mg sodu na każdy ml roztworu, co odpowiada 0,14% zalecanej przez WHO maksymalnej 2 g dobowej dawki sodu u osób dorosłych.

Ampułki 2 ml
Produkt leczniczy zawiera 5,5 mg sodu na ampułkę 2 ml, co odpowiada 0,28% zalecanej przez WHO maksymalnej 2 g dobowej dawki sodu u osób dorosłych.

Fiolki 20 ml
Produkt leczniczy zawiera 55 mg sodu na fiolkę 20 ml, co odpowiada 2,75% zalecanej przez WHO maksymalnej 2 g dobowej dawki sodu u osób dorosłych.

Produkt może być rozcieńczany w 0,9% roztworze chlorku sodu. Zawartość sodu pochodzącego z rozcieńczalnika powinna być brana pod uwagę w obliczeniu całkowitej zawartości sodu w przygotowanym rozcieńczeniu produktu. W celu uzyskania dokładnej informacji dotyczącej zawartości sodu w roztworze wykorzystanym do rozcieńczenia produktu, należy zapoznać się z charakterystyką produktu leczniczego stosowanego rozcieńczalnika.
U pacjentów ze zmniejszoną czynnością nerek należy uwzględnić zawartość sodu w produkcie gotowym do podania.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Stosowane w celu leczenia drgawek pochodne hydantoiny (np. fenytoina) mogą nasilać kardiodepresyjne działanie lidokainy, ale mogą również przyspieszać jej metabolizm na skutek indukcji enzymatycznej.

Jednoczesne, uzasadnione terapeutycznie stosowanie lidokainy z innymi lekami przeciwarytmicznymi może nasilać jej niepożądane działania.

Leki beta-adrenolityczne mogą spowolniać metabolizm lidokainy w wątrobie i nasilać jej toksyczność.

Cymetydyna hamuje metabolizm lidokainy, zmniejsza jej klirens wątrobowy i zwiększa stężenie w osoczu.

Duże dawki lidokainy mogą nasilać działanie środków zwiotczających mięśnie.

Lidokaina podawana dożylnie może nasilić działanie analgetyczne leków przeciwbólowych stosowanych w monoterapii. Okołooperacyjne zastosowanie lidokainy zmniejsza zapotrzebowanie na opioidy.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Badania przeprowadzone na zwierzętach nie wykazały teratogennego działania lidokainy. Nie przeprowadzono jednak dostatecznie dużych, dobrze kontrolowanych badań u ciężarnych kobiet. W związku z tym, tylko w wyjątkowych przypadkach produkt może być stosowany u ciężarnych w czasie trwania organogenezy.

Okres porodu
Środki miejscowo znieczulające podawane w trakcie porodu z łatwością przenikają przez łożysko, w związku z czym mogą wywoływać objawy zatrucia zarówno u matki jak i płodu. Toksyczność lidokainy zależy od metody i techniki znieczulenia oraz zastosowanej dawki. Zatrucie lidokainą wywołuje u płodu zaburzenia czynności serca. Zastosowanie środków o budowie amidowej do blokady okołoszyjkowej w trakcie porodu wywołuje bradykardię u około 30% płodów. Dlatego wskazane jest stałe monitorowanie tętna płodu. Zbyt wysokie stężenie lidokainy we krwi matki może wywołać spadek ciśnienia tętniczego. Znieczulenie może też hamować czynność skurczową macicy i przedłużać poród. Podejmując decyzję o zastosowaniu znieczulenia okołoszyjkowego w szczególnych sytuacjach położniczych, takich jak: poród przedwczesny, zatrucie ciążowe oraz stan wewnątrzmacicznego zagrożenia płodu, należy rozważyć, czy oczekiwane korzyści przeważają nad potencjalnym ryzykiem.
U noworodków, których matki otrzymywały podczas porodu niektóre środki miejscowo znieczulające, obserwowano w pierwszych dwu dniach życia obniżone napięcie mięśni szkieletowych. Jednak nie wiadomo, czy wiąże się to z jakimiś odległymi skutkami.

Karmienie piersią
Ponieważ lidokaina przenika do mleka, stosowanie u kobiet karmiących piersią wymaga zachowania ostrożności.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwania maszyn

Wpływ lidokainy na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwania maszyn zależy od rodzaju przeprowadzanego zabiegu i ilości zastosowanej lidokainy.
Po znieczuleniu lidokainą pacjent nie powinien prowadzić pojazdów i obsługiwać maszyn przez co najmniej 24 godziny po zakończeniu zabiegu.

4.8 Działania niepożądane

Działania niepożądane lidokainy są zazwyczaj rezultatem jej nadmiernego stężenia w płynach ustrojowych w wyniku zastosowania zbyt dużej dawki (przedawkowanie względne lub bezwzględne), zaburzeń kinetyki lub niewłaściwej techniki wstrzykiwania.
Działania niepożądane zostały podzielone ze względu na częstość występowania: bardzo rzadko (<1/10 000), częstość nieznana (nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia układu immunologicznego
Bardzo rzadko: reakcje nadwrażliwości (zwykle zmiany skórne, pokrzywka, obrzęki);
Częstość nieznana: reakcje anafilaktoidalne.

Zaburzenia układu nerwowego
Bardzo rzadko: brak czucia, zaburzenia czynności ruchowych lub porażenia (są następstwem znieczulenia podpajęczynówkowego);
Częstość nieznana: metaliczny smak w ustach, uczucie oszołomienia, pobudzenie, niepokój, euforia, drżenia mięśniowe, senność, zaburzenia świadomości, bóle i zawroty głowy, szumy uszne, parestezje, utrata świadomości, drgawki, całkowite znieczulenie rdzeniowe (w następstwie omyłkowego podania do przestrzeni podpajęczynówkowej zbyt dużej dawki lidokainy), wysokie znieczulenie podpajęczynówkowe (w następstwie podania do przestrzeni podpajęczynówkowej zbyt dużej dawki lidokainy).

Zaburzenia oka
Częstość nieznana: zaburzenia widzenia.

Zaburzenia serca
Częstość nieznana: bradykardia, zatrzymanie czynności serca (w skrajnie ciężkich przypadkach).

Zaburzenia naczyniowe

Częstość nieznana: niedociśnienie.

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia
Częstość nieznana: zaburzenia oddychania, w tym zatrzymanie oddechu.

Zaburzenia żołądka i jelit
Częstość nieznana: nudności, wymioty.

Po dożylnym zastosowaniu lidokainy w analgezji multimodalnej (wielokierunkowej) najczęściej występowały: senność, uczucie zmęczenia, nudności, drętwienie warg, metaliczny smak w ustach i zawroty głowy.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych
Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem
Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych
Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych
Al. Jerozolimskie 181C
02-222 Warszawa
Tel.: + 48 22 49 21 301
Faks: + 48 22 49 21 309
Strona internetowa: https://smz.ezdrowie.gov.pl
Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Objawy toksyczne pojawiają się po przekroczeniu określonego stężenia lidokainy w surowicy i zależą od podanej dawki, dodatku leków obkurczających naczynia krwionośne, miejsca wstrzyknięcia, dystrybucji w tkankach, metabolizmu i stanu ogólnego pacjenta.

Przedawkowanie może być rezultatem:
- przedawkowania względnego, gdy lek zostaje podany bezpośrednio do naczynia krwionośnego lub w okolicę bogato unaczynioną;
- przedawkowania bezwzględnego, gdy zostaje przekroczona dawka dopuszczalna.

Objawy przedawkowania:
- faza pobudzenia ośrodkowego układu nerwowego - zaburzenia czucia w obrębie warg i języka, metaliczny smak w ustach, niespójność mowy, zawroty głowy, szumy uszne, zaburzenia widzenia, dreszcze, pobudzenie ruchowe, drżenia mięśni, drgawki;
- faza depresji ośrodkowego układu nerwowego - śpiączka, depresja oddychania i krążenia. Ponadto mogą wystąpić: tachykardia, wzrost ciśnienia tętniczego i oporu naczyniowego, osłabienie automatyzmu serca, bradykardia, asystolia, rozszerzenie oskrzeli.

Objawy zatrucia są wskazaniem do natychmiastowego przerwania podawania leku. Jeżeli ich natężenie jest niewielkie (zaburzenia widzenia, zawroty głowy) należy uspokoić pacjenta, podać mu tlen do oddychania i sprawdzić dostęp do żyły. W przypadku silniejszej reakcji toksycznej (ograniczenie świadomości i drżenia mięśni), gdy to konieczne, należy zastosować wentylację zastępczą płuc, dożylnie podać leki podwyższające ciśnienie tętnicze (efedryna, katecholaminy) oraz leki przeciwdrgawkowe (midazolam lub diazepam). Jeśli dochodzi do utraty świadomości z drgawkami kloniczno-tonicznymi, należy natychmiast zaintubować pacjenta i podjąć wentylację zastępczą płuc 100% tlenem, podać dożylnie leki przeciwdrgawkowe (diazepam, propofol, tiopental), korygować kwasicę i leczyć objawowo zgodnie z zasadami intensywnej terapii.
Dializa w przypadkach ostrego przedawkowania lidokainy nie jest skuteczna.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki przeciwarytmiczne klasy IB, kod ATC: C01BB01
Grupa farmakoterapeutyczna: leki miejscowo znieczulające; amidy, kod ATC: N01BB02

Lidokaina jest środkiem miejscowo znieczulającym i przeciwarytmicznym o budowie amidowej. Hamuje powstawanie i przewodzenie bodźców we włóknach nerwowych i układzie przewodzącym serca. Lidokaina blokuje kanały sodowe błon komórek nerwowych. Zahamowanie napływu jonów Na^+ uniemożliwia generowanie i przewodzenie impulsów pojawiających się w odpowiedzi na depolaryzację. Wzrasta próg pobudliwości włókien nerwowych aż do całkowitego zablokowania przewodzenia. Stężenie lidokainy blokujące przewodnictwo jest odwrotnie proporcjonalne do średnicy włókna. W pierwszej kolejności blokowane są cienkie włókna bólowe, następnie grubsze czuciowe. Do zablokowania włókien ruchowych (najgrubszych) konieczne są najwyższe stężenia lidokainy.

Przeciwarytmiczne działanie lidokainy jest rezultatem blokowania kanału sodowego. Lidokaina zaliczana jest do leków przeciwarytmicznych grupy I B wg Vaughna - Williamsa (nie wpływa na czas trwania potencjału czynnościowego). Lidokaina blokuje kanały sodowe i hamuje aktywność bioelektryczną w zdepolaryzowanym mięśniu serca. Natomiast w niewielkim stopniu wpływa na mięsień niezdepolaryzowany oraz na układ przewodzący. Dlatego jest skuteczna w leczeniu zaburzeń rytmu, związanych z depolaryzacją (np. niedokrwienie, przedawkowanie glikozydów nasercowych), natomiast jej działanie w zaburzeniach rytmu powstających w tkance niezdepolaryzowanej jest niewielkie. Lidokaina hamuje depolaryzację diastoliczną i automatyzm komór w układzie przewodzącym.

Lidokaina w stężeniach terapeutycznych:
- nieznaczne obniża rzut serca, opór obwodowy i ciśnienie tętnicze;
- nie wykazuje wpływu na przedsionki, kurczliwość mięśnia sercowego oraz przewodnictwo przedsionkowo-komorowe.

Badania kliniczne wykazały skuteczność analgetyczną lidokainy podawanej w okresie okołooperacyjnym i poprawę czynności motorycznej jelit po zabiegach radykalnej prostatektomii, a w operacjach brzusznych (laparoskopowych i laparotomiach), mniejszy odsetek atonii i niedrożności pooperacyjnej jelit, nudności i wymiotów, co przełożyło się na skrócenie czasu hospitalizacji. Okołooperacyjne zastosowanie lidokainy zmniejsza zapotrzebowanie na opioidy. Oprócz działania analgetycznego, lidokaina stosowana dożylnie hamuje reakcję zapalną indukowaną zabiegiem operacyjnym. Uważa się, że wynikiem jej stosowania w okresie pooperacyjnym jest zmniejszenie osoczowych stężeń, m.in. IL-6, IL-8, C3a, IL-1ra, CD11b, L- i P-selektyny. Ponadto skuteczność analgetyczna lidokainy może być znacząco większa w bólu trzewnym niż w bólu somatycznym.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Lidokaina wchłania się całkowicie z miejsca zdeponowania w tkankach. Szybkość narastania stężenia we krwi zależy od wielu czynników, spośród których ważne jest miejsce podania. Najwyższe stężenie lidokainy w osoczu (poza przypadkami, gdy podawana jest dożylnie) stwierdza się w trakcie blokady nerwów międzyżebrowych, nieco niższe w trakcie znieczulenia zewnątrzoponowego, natomiast najniższe w trakcie znieczulenia nasiękowego.
Stopień wiązania lidokainy z białkami zależy od stężenia w osoczu. Przy stężeniach od l µg/ml do 4 µg/ml z białkami wiąże się od 40% do 80% środka. Lidokaina przenika przez barierę krew-mózg i przez łożysko, docierając do krążenia płodu.
Lidokaina jest bardzo szybko metabolizowana w wątrobie do kilku pochodnych N-dealkilowanych, które wykazują słabszą aktywność farmakologiczną.
Lek jest wydalany przez nerki przede wszystkim w postaci metabolitów, a tylko 10% w postaci niezmienionej. Po wstrzyknięciu dożylnym okres półtrwania w surowicy wynosi 1,6 godz.
Kinetyka zmienia się u osób z upośledzoną czynnością wątroby, u których okres półtrwania może być wydłużony nawet dwukrotnie.

Upośledzenie czynności nerek nie ma wpływu na kinetykę lidokainy, jakkolwiek w tych przypadkach stwierdza się podwyższone stężenie metabolitów we krwi.
Po przekroczeniu stężenia 6 µg/ml surowicy krwi występuje toksyczne działanie na ośrodkowy układ nerwowy w postaci drgawek. Objawy zatrucia może potęgować kwasica oraz stosowanie leków pobudzających aktywność OUN.
Dodanie noradrenaliny ogranicza szybkość wchłaniania z tkanek do krwiobiegu, dzięki czemu wydłuża się czas działania oraz zmniejsza stężenie w surowicy; pozwala to na zastosowanie większej dawki.

Skuteczne działanie przeciwbólowe lidokainy podawanej dożylnie w okresie okołooperacyjnym uzyskiwane jest po osiągnięciu stężenia w surowicy wynoszącego 1,1-4,2 µg/ml.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

W badaniach na zwierzętach lidokaina nie wywołuje teratogennego działania w dawkach przekraczających dawki stosowane u ludzi 6,6-krotnie. Nie prowadzono badań dotyczących działania rakotwórczego i mutagennego oraz wpływu na płodność u zwierząt.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Sodu chlorek
Sodu wodorotlenek 10% (do ustalenia pH)
Woda do wstrzykiwań

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Produkt wykazuje niezgodność i nie powinien być mieszany w jednej strzykawce z roztworami zawierającymi wodorowęglan sodu oraz innymi roztworami o odczynie zasadowym.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w oryginalnym opakowaniu w celu ochrony przed światłem, w temperaturze poniżej 25°C. Nie zamrażać.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

10 ampułek z bezbarwnego szkła po 2 ml w tekturowym pudełku.
5 fiolek z bezbarwnego szkła po 20 ml w tekturowym pudełku.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Po pobraniu pierwszej dawki niezużytą w ciągu 24 godzin zawartość fiolki należy zniszczyć.

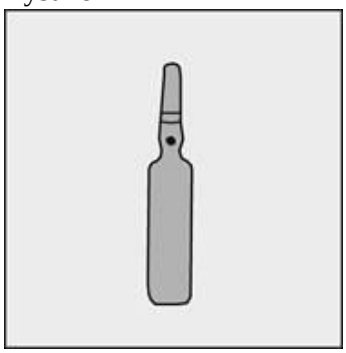
Instrukcja otwierania ampułki

Przed otwarciem ampułki należy upewnić się, że cały roztwór znajduje się w dolnej części ampułki.
Można delikatnie potrząsnąć ampułką lub postukać w nią palcem, aby ułatwić spłynięcie roztworu.
Na każdej ampułce umieszczono kolorową kropkę (patrz rysunek 1.) jako oznaczenie znajdującego się poniżej niej punktu nacięcia.

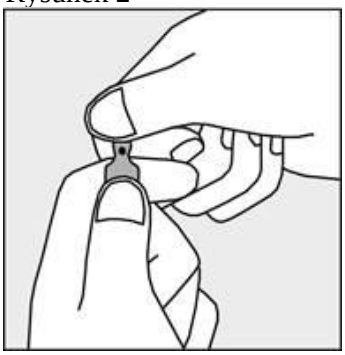
- Aby otworzyć ampułkę należy trzymać ją pionowo, w obu dłoniach, kolorową kropką do siebie - patrz rysunek 2. Górną część ampułki należy uchwycić w taki sposób, aby kciuk znajdował się powyżej kolorowej kropki.
- Nacisnąć zgodnie ze strzałką umieszczoną na rysunku 3.

Ampułki są przeznaczone wyłącznie do jednorazowego użytku, należy je otwierać bezpośrednio przed użyciem. Pozostałą zawartość niezużytego produktu należy zniszczyć zgodnie z obowiązującymi przepisami.

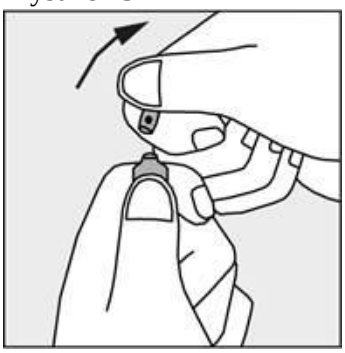
Rysunek 1



Rysunek 2



Rysunek 3



7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Warszawskie Zakłady Farmaceutyczne Polfa S.A.
ul. Karolkowa 22/24
01-207 Warszawa

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Ampułki 2 ml
Pozwolenie nr R/0383

Fiolki 20 ml
Pozwolenie nr R/6791

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Ampułki 2 ml
Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 28.11.1975 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 21.05.2012 r.

Fiolki 20 ml
Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 26.08.1996 r.
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 04.08.2011 r.

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

10.08.2022 r.