

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

НАЦИОНАЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВОТА	
Кратка характеристика на продукта Приложение I	
Към Рег. №	20180091
Разрешение №	
ВГ/МА/МР	67328 / 12-01-2024
Съдебен №	

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Лидокаин Дансон 10 mg/ml инжекционен разтвор
Lidocain Danhson 10 mg/ml solution for injection

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

1 ml инжекционен разтвор съдържа 10 mg лидокаинов хидрохлорид (lidocaine hydrochloride).

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

Помощни вещества с известно действие:

Всеки ml от инжекционния разтвор съдържа приблизително 0,118 mmol натрий.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Инжекционен разтвор.

Бистър, безцветен разтвор, практически свободен от видими частици.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1 Терапевтични показания

Лидокаин Дансон 10 mg/ml е предназначен за възрастни и деца над 1 година за:

- Инфилтрационна, епидурална и интравенозна регионална анестезия, нервни блокади, анестезия при инвазивни инструментални изследвания;
- Лечение на камерни аритмии, вкл. след инфаркт на миокарда и кардиохирургични интервенции.

4.2 Дозировка и начин на приложение

Локална анестезия

Дозировка

Дозировката и начинът на приложение зависят от вида на хирургичната интервенция и техниката на анестезията.

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

Възрастни

Прилаганата доза трябва да бъде съобразена с възрастта, теглото и състоянието на пациента. Таблицата може да послужи като ръководство за приложение при възрастни с тегло около 70 kg.



Начин на приложение и процедура	Препоръчителна доза лидокаинов хидрохлорид		
	Концентрация (mg/ml)	Обем (ml)	Обща доза (mg)
<i>Инfiltrационна анестезия</i>			
Малки процедури	10 mg/ml	2-10 ml	20-100 mg
Големи процедури	10 mg/ml	10-20 ml	100-200 mg
<i>Интравенозна регионална анестезия</i>			
Ръка	10 mg/ml	10-20 ml	100-200 mg
Крак	10 mg/ml	20 ml	200 mg
<i>Нервни блокади</i>	10 mg/ml	2-20 ml	20-200 mg
<i>Епидурална анестезия</i>			
Лумбална аналгезия	10 mg/ml	25-40 ml	250-400 mg
Торакална анестезия	10 mg/ml	20-30 ml	200-300 mg
Сакрална хирургична аналгезия	10 mg/ml	40 ml	400 mg
Сакрална гинекологична аналгезия	10 mg/ml	20-30 ml	200-300 mg

Препоръчителната максимална единична доза не трябва да надвишава 400 mg.

Педиатрична популация

Количеството, което ще бъде инжектирано, трябва да се определи в зависимост от възрастта и теглото на детето и вида на оперативната интервенция. Техниката на анестезия трябва да бъде внимателно подбрана.

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

$$\text{Тегло на детето (в килограми)} \times 1,33$$

Доза, еквивалентна на 5 mg лидокаинов хидрохлорид на килограм телесно тегло не трябва да бъде надвишавана.

Лекарственият продукт не се препоръчва за употреба при новородени (вж. точка 5.2). Оптималната плазмена концентрация на лидокаин, при която прояви на токсичност могат да бъдат избегнати (напр. гърчове и сърдечни аритмии), е неизвестна за тази възрастова група.

Специални популации

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

Начин на приложение

Лидокаин Дансон може да бъде приложен чрез интравенозна, интрамускулна, подкожна или епидурална инжекция. Начинът на приложение е в зависимост от вида на процедурата.

Лечение на камерни аритмии

Дозировка

Възрастни



Вентрикуларни аритмии и сърдечен арест (при отсъствие на възстановяване на сърдечния ритъм след приложение на адреналин и електрошок), лидокаин се прилага в доза 1 – 1,5 mg/kg, струйно венозно, като при необходимост дозата се повтаря до достигане на максимална доза 3 mg/kg.

При пациенти в стабилно състояние, лидокаин се прилага струйно венозно в доза 50 – 100 mg или 1 – 1,5 mg със скорост 25 – 50 mg/min. При непостигане на терапевтичен ефект за период от 5 – 10 минути, дозата се повтаря до максимална доза 200 – 300 mg за 1 час.

След приложението на натоварващата доза, лидокаин се прилага под формата на интравенозна инфузия със скорост 1 – 4 mg/min. за 24 часа.

При пациенти със сърдечна недостатъчност или чернодробни заболявания, както и при лица в старческа възраст, е необходимо редуциране на дозата с приблизително 50%.

При спешни състояния и/или липса на условия за интравенозно приложение, лидокаин може да се приложи интрамускулно, в делтоидния мускул в доза 4 – 5 mg/kg т.т. (250 – 350 mg).

Педиатрична популация

Опитът с приложение на лидокаин като антиаритмично средство е ограничен. Препоръчва се следната дозировка:

- натоварваща доза – 0,8 до 1 mg/kg, която може да бъде повторена при необходимост. Общата доза не трябва да надвишава 3 – 5 mg/kg;
- продължителна инфузия – 10 – 50 µg/kg/min.

4.3 Противопоказания

- Свръхчувствителност към лидокаин, към други локални анестетици от амиден тип или към някои от помощните вещества, изброени в точка 6.1;
- Чернодробна порфирия;
- Сърдечни проводни нарушения (високостепенен 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

Регионалната и локалната анестезия трябва винаги да бъдат провеждани при наличие на оборудване за ресусцитация.

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

Подобно на другите локални анестетици, когато приложението на лидокаин води до създаване на високи плазмени концентрации, това може да предизвика остри токсични ефекти върху централната нервна и сърдечно-съдовата система, особено след екстензивно вътресъдово приложение.

За постигане на анестезия се препоръчва приложение на минимална ефективна доза с оглед избягване на високи плазмени концентрации и риск от поява на сериозни нежелани лекарствени реакции.

Прилагането на лидокаин, дори и в ниски дози, в областта на главата и шията (вкл. ретробулбарен, дентален, ганглионарен блок) може да предизвика сериозни системни нежелани реакции (объркване, конвулсии, дихателна депресия или арест, стимулиране или потискане на сърдечната дейност).

Ретробулбарните инжекции рядко могат да достигнат краниалното субарахноидно пространство, причиняващи сериозни/тежки реакции, включващи сърдечно-съдов колапс.



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

Необходимо е внимателно контролиране на сърдечната дейност и дишането, както и степента на съзнание след всяко локално прилагане на лидокаин. Поява на симптоми като безпокойство, тревожност, шум в ушите, замъглено виждане, тремор, сънливост може да бъде ранна клинична проява на токсично увреждане на ЦНС.

Лидокаин се прилага с повишено внимание при:

- Новородени, поради опасност от развитие на животозастрашаващи нежелани реакции, в това число продължителен гърч;
- Деца на възраст под 4 години;
- Лица на възраст над 65 години;
- Сърдечно-съдова недостатъчност;
- Високостепенна брадикардия;
- Нарушена дихателна функция;
- Шок и състояния на хиповолемия;
- Миастения гравис;
- Неконтролирана епилепсия;
- Чернодробни заболявания и нарушения на чернодробната функция (лидокаин се метаболизира основно в черния дроб);
- Бъбречни увреждания и бъбречни заболявания (метаболитите на лидокаин могат да кумулират в организма, което да повиши риска от нежелани лекарствени реакции);
- Трети триместър на бременността.

При пациенти с нарушения в коагулацията или лекувани с антикоагуланти, НСПВС или плазмозаместители е налице повишена склонност към кървене, поради което случайно нараняване на кръвосни съдове по време на анестезията може да доведе до сериозно кървене. При необходимост трябва да се проведат изследвания на времето на кървене, тест за определяне на активирано парциално тромбoplastиново време (aPTT) и брой на тромбоцитите преди манипулацията.

Пациентите, лекувани с атиаритмици от клас III (напр. амиодарон) трябва да бъдат внимателно мониторираны, вкл. и чрез ЕКГ контрол, тъй като лидокаин и антиаритмиците клас III могат да имат адитивни ефекти по отношение на сърдечно-съдовата система (вж. точка 4.5).

Налице са постмаркетингови съобщения за хондролита при пациенти, подложени на постоперативна интраартикуларна продължителна инфузия на локални анестетици. Повечето от съобщените случаи на хондролита са включвали раменната става. Поради множеството утежняващи 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 приложение на лидокаин.

Епидуралната анестезия може да причини тежки нежелани реакции, като потискане на сърдечно-съдовата система, особено в случаите на съпътстваща хиповолемия. При пациенти с ограничена сърдечно-съдова функция, винаги трябва да се подхожда с предпазливост. Основните причини са травматичните нервни увреждания и/или локалните токсични ефекти върху мускулите и нервите, причинени от инжектирания локален анестетик. Степента на тези тъканни увреждания зависи от размера на травмата, концентрацията на локалните анестетици и продължителността на тъканната експозиция на локалния анестетик. Предвид това е необходимо да се използва най-ниската ефективна доза.

Ефектът на локалния анестетик може да бъде отслабен, при приложение във възпален или инфектиран тъкан.



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

Има сведения, че лидокаин е порфириногенен при животни и не трябва да бъде прилаган на пациенти с остра порфирия, освен ако приложението му е абсолютно неизбежно. При всички пациенти с порфирия е необходимо особено внимание (вж. точка 4.3).

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

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

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

4.5 Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Лекарствата, които инхибират метаболизма на лидокаин (напр. циметидин), могат да доведат до достигане на плазмени концентрации на лидокаин, които да бъдат потенциално токсични, особено 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 при едновременното им приложение (вж т.4.4).

4.6 Фертилитет, бременност и кърмене

Бременност

Липсват данни от адекватни клинични изпитвания за приложение на лидокаин при бременни жени.

Лидокаин преминава през плацентата (вж. точка 5.2). Няма сведения, че лидокаин причинява нарушения в репродукцията, вкл. повишена честота на малформации. Смята се, че лидокаин е прилаган при голям брой бременни жени и жени в детородна възраст, но рискът при хора не е напълно проучен. Проучванията при животни са показали наличие на репродуктивна токсичност (вж. точка 5.3).

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

Кърмене

Лидокаин се екскретира в малки количества в майчиното мляко. Когато се използва в препоръчителните дози, вероятност за негативно влияние върху детето е пренебрежимо поради което по време на лечение с лидокаин, кърменето може да продължи.



Фертилитет

Няма данни за нарушения във фертилитета, свързани с приложение на лидокаин.

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

Следната терминология е използвана при класифицирането на нежеланите реакции по отношение на тяхната честота: много чести ($\geq 1/10$), чести ($\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечести ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редки ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), много редки ($< 1/10000$), с неизвестна честота (честотата не може да бъде определена от наличните данни).

Нежеланите лекарствени реакции, свързани с ефекти 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.

MedDRA SOC/Честота	Нежелана лекарствена реакция
<u>Нарушения на сърдечно-съдовата система</u> <i>Много чести</i> <i>Чести</i> <i>Редки</i>	Хипотония Брадикардия, хипертония Сърдечен арест, аритмия
<u>Стомашно-чревни нарушения</u> <i>Много чести</i> <i>Чести</i>	Гадене Повръщане
<u>Нарушения на нервната система</u> <i>Чести</i> <i>Нечести</i> <i>Редки</i>	Парестезия, замаяност Симптоми на токсичност на ЦНС (конвулсии, периорална парестезия, изтръпване на езика, хиперакузис, зрителни нарушения, загуба на съзнание, тремор, сънливост, виене на свят, тинитус, чувство на интоксикация, дизартрия) Невропатия, увреждане на периферния нерв, арахноидит
<u>Нарушения на имунната система</u> <i>Редки</i>	Реакции на свръхчувствителност, уртикария, обрив, ангиоедем, случаи анафилактичен шок
<u>Нарушения на окото</u> <i>Редки</i>	Двойно виждане



Респираторни, гръдни и медиастинални нарушения

Редки

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

4.9 Предозиране

Случайното вътресъдово инжектиране на локални анестетици може да причини незабавна системна токсичност (в рамките на секунди или няколко минути). Признаците на системна токсичност, дължаща се на предозиране се появяват по-късно (15-60 минути след инжектиране) като резултат от по-бавното нарастване на плазмената концентрация (вж. точка 4.8). Ако се появят признаци на системна токсичност, приложението трябва да бъде незабавно преустановено.

Токсичност

Перорално приложение: Дози, по-ниски от 50 mg, приложени при малки деца изглеждат не са рискови. Доза от 75 mg лидокаин, приложена при 2-годишно дете е довела до редуциране на болката; доза от 100 mg, приложена при 5 месечно бебе е предизвикала тежка интоксикация; доза от 300 + 300 mg, приложена в рамките на 4 часа, при 3½ годишно дете са причинили тежка до много тежка интоксикация; а доза от 400-500 mg, при дете на 2 години и доза от 1 g, приложена за 12 часа при дете на 1 година са довели до много тежка интоксикация. Приложението на 600 mg лидокаин при възрастни индивиди води до редуциране на болката, а приложението на 2 g до умерена интоксикация.

Перентрално приложение: Интравенозното приложение на 50 mg лидокаин при новородено на 30 дни води до много тежка интоксикация. Инфилтрационното приложение на 200-400 mg при възрастен причинява тежка, а приложението на 500 mg при 80-годишен възрастен и 1 g i.v. при възрастен води до много тежка интоксикация.

Локално приложение: Лидокаин, приложен върху рани при кожно изгаряне, в доза 8,6 – 17,2 mg/kg при малки деца е предизвикал тежка интоксикация.

Симптоми

Клиничната картина при първоначално се владее от симптоми на възбуда на ЦНС, последвани от прояви на потисканете и. При приложение на високи дози, внезапната поява на гърчове може да бъде първи симптом. Безпокойство, замаяност, зрителни нарушения, перiorална парестезия, гадене, с последващи атаксия, слухови нарушения, еуфория, обърканост, говорни нарушения, бледност, изпотяване, тремор, конвулсии, кома, респираторен арест са възможните клинични прояви на острата интоксикация с лидокаин. Аритмии, основно брадиаритмии, при високи дози камерна тахикардия, камерно мъждене, разширение на QRS комплекса, AV блок са клиничните прояви от страна на сърдечно-съдовата система. Сърдечна недостатъчност (характеризирана с изоларани случаи е описана метхемоглобинемия) също са възможни прояви на остлото предозиране.

Лечение



Приложение на активен въглен при перорално приложение. Необходимо е да се отбележи, че провокираното повръщане може да бъде опасно поради анестезията на лигавицата и риска от поява на гърчове в ранен етап. При необходимост от стомашна промивка, тя трябва да бъде извършена чрез тръба и след ендотрахеална интубация.

В съображение трябва да влезе предприемане на незабавни мерки за поддържане циркулацията и дишането, както и за осигуряване на ефективен контрол на гърчовете.

Необходимо е да се осигури проходимост на дихателните пътища, както и кислородотерапия, при необходимост с асистирана вентилация. Циркулацията трябва да се поддържа посредством адекватно приложение на инфузионни, добутамин и при необходимост, норадреналин (първоначално 0,05 µg/kg/min, при необходимост - повишаване с 0,05µg/kg/min на всеки 10 минути), с хемодинамично мониториране в по-тежките случаи. Ефедрин също може да бъде прилаган по преценка.

Контрол върху гърчовете може да бъде постигнат чрез интервенозно приложение на диазепам или тиопентал натрий, като се има предвид, че антиепилептичните лекарства също могат да потиснат дишането и циркулацията.

При лица с брадикардия, приложението на атропин се счита за адекватно. При настъпване на сърдечен арест, е необходимо да се предприемат стандартни процедури по ресусцитация.

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

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.

Механизъм на действие

Лидокаин е локален анестетик от амиден тип. Действа посредством инхибиране на йонния рефлукс, необходим за инициране и провеждане на импулсите, като по този начин стабилизира невроналната мембрана. Механизмът му на действие се базира на понижения мембранен пермеабилитет на неврона за натриеви йони. Като следствие от това, степента на деполяризация се понижава, прагът на възбуждане се повишава. Предизвиква временна обратима блокада на периферните нервни рецептори и предаването на нервния импулс по аферентните влакна при пряк и непряк контакт с тях, без да уврежда нервните структури. 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.

Лидокаин принадлежи към клас Ib на антиаритмичните лекарства с основен електрофизиологичен ефект намаляване максималната скорост на деполяризация на сърдечната клетка. Това води до повишаване на прага на възбудимост, намаляване скоростта на провеждане на възбудния процес и силно удължаване на ефективния рефрактерен период, потискане на спонтанната диастолна деполяризация на клетките на възбудно-проводната система.

Фармакологични ефекти

Предизвиканата от лидокаин анестезия настъпва бързо (около една минута след интравенозно приложение), както и бързо се разпространява в околните тъкани. Ефектът продължава около 10 до 20 минути и около 60 до 90, след интравенозно и интрамускулно приложение съответно. Предизвиканата локална анестезия се използва за постигане на нервна блокада в различни части на тялото.



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.

Лидокаин премахва ритъмните нарушения, възникнали по re-entry механизъм или поради повишен ектопичен автоматизъм. Ефектът настъпва бързо и също така бързо се изчерпва.

5.2 Фармакокинетични свойства

Абсорбция

Степента на абсорбция зависи от размера на приложената доза, пътя 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 създава 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 α-1-кисел гликопротеин е 65%.

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

Биотрансформация и елиминиране

Елиминирането на лидокаин се осъществява основно чрез метаболизиране, главно по пътя на деалкилиране до моноетилглицин ксилонид (MEGX), което е метаболитизирано както от CYP1A2, така и от CYP3A4. MEGX има конвулсивна активност, подобна на тази на лидокаин, докато GX не притежава такава. MEGX се открива в плазмени концентрации близки до тези на изходното вещество.

Скоростта на елиминиране на лидокаин и MEGX след интервенозна болус доза е приблизително 1,5-2 часа и 2,5 часа, съответно. Поради бързия чернодробен метаболизъм, фармакокинетичното поведение на лидокаин е зависимо в значима степен от функционалното състояние на черния дроб и наличието на чернодробни заболявания. Полуживотът може да бъде повече от двойно по-дълъг при пациенти с чернодробно нарушение. Лидокаин преминава плацентарната бариера, като концентрацията на несвързания лидокаин е еднаква за майката и 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 чернодробен метаболизъм. Полуживотът може да бъде удължен 2 или повече пъти при пациенти с чернодробна дисфункция.

Бъбречните нарушения не повлияват кинетиката, но могат да доведат до повишено натрупване на метаболити.

При новородени, нивата на α1-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.

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



5.3 Предклинични данни за безопасност

В проучванията при животни, проявите на токсичността след приложение на високи дози лидокаин са ефекти върху централната нервна система и сърдечно-съдовата система.

В проучвания за оценка на репродуктивната токсичност, са отбелязани ембриотоксични и фетотоксични ефекти на лидокаин, приложен подкожно при зайци в дози от 25 mg/kg. При плъхове, в субтоксичен за майката дозов диапазон, лидокаин не е повлиял постнаталното развитие на потомството. Не е наблюдавано увреждане на фертилитета на 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. Налице са доказателства за генотоксична активност за метаболита на лидокаин 2,6-диметиланилин.

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
Вода за инжекции

6.2 Несъвместимости

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

6.3 Срок на годност

5 години.

Да се използва непосредствено след първото отваряне.

6.4 Специални условия на съхранение

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

6.5 Вид и съдържание на опаковката

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

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Да се съхранява на място, недостъпно за деца.

Само за еднократна употреба.

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

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



7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

ДАНСОН-БГ ООД,
ул. "Отец Паисий" №26
2400 гр. Радомир,
България
тел.: 02 451 93 00
e-mail: office@danhson.com

8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

Регистрационен № 20180091

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

Дата на първо разрешаване: 12.04.2018
Дата на последно подновяване: 14.02.2023

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

12/2023

