

RAVIMI OMADUSTE KOKKUVÕTE

1. RAVIMPREPARAADI NIMETUS

LIDOCAINE – GRINDEKS, 20 mg/ml süstelahus

2. KVALITATIIVNE JA KVANTITATIIVNE KOOSTIS

Üks 5 ml ampull sisaldab 100 mg lidokaiinvesinikkloriidi.

1 ml sisaldab 20 mg lidokaiinvesinikkloriidi.

INN. Lidocainum

3. RAVIMVORM

Süstelahus. Steriilne.

4. KLIINILISED ANDMED

4.1 Näidustused

Lokaal- ja regionaalanesteesia, närviblokaadid.

Ventrikulaarsete rütmihäirete (ekstrasüstoolia, tahhükardia, fibrillatsioon) ravi erakorralises situatsioonis, eriti pärast müokardiinfarkti või müokardi mehhaanilist ärritust (südameoperatsioonid, perkutaansed interventsioonid).

4.2 Annustamine ja manustamisviis

Anesteesia

Lidokaiini kasutatakse lokaal- ja regionaalanesteesiaks, järgides igale anesteesialiigile kehtestatud tehnilisi ja ohutusnõudeid. Annuse suurus sõltub individuaalsest taluvusest, anesteesia liigist, tuimestatava pinna suuruselt ja kudede verevarustusest.

Täiskasvanud. Lidokaiini tavaannus ei tohi ületada 200 mg.

Lapsed. Lidokaiini tavaannus ei tohi ületada 3 mg/kg.

Epiduraalanesteesia korral tuleb vähemalt 5 minutit enne kogudoosi manustada prooviannus vältimaks ravimi soovimatut sattumist veresoonde või subarahnoidaalruumi. Soovitatakse süstlaga perioodiliselt aspireerida, veendumaks, et süstlasse ei ole sattunud verd.

Kestva epiduraal-, kaudaal- või paratservikaalanesteesia korral ei tohi maksimaalannust manustada sagedamini kui 90 minuti tagant.

Intravenoosse regionaalanesteesia (Bier'i blokaadi) korral ei tohi žgutti vabastada enne kui manustamisest on möödunud 20 minutit.

Südame rütmihäired

Ravimit manustatakse intravenoosselt.

Täiskasvanud. Tavaannus on 50...100 mg intravenoosselt EKG kontrolli all. Ravimit süstitakse kiirusega 25...50 mg (1,25...2,5 ml 20 mg/ml süstelahust) minutis. Vajaduse korral võib uue annuse manustada 5 minuti pärast. Lidokaiini ei tohi 1 tunni jooksul manustada rohkem kui 200...300 mg.

Korduma kalduvate rütmihäirete korral ja patsientidele, kes ei ole võimelised suukaudseid antiarütmikume võtma, võib lidokaiini manustada infusioonina 1...4 mg minutis (20...50 µg/kg/min). Veenisisest infusiooni peab teostama EKG kontrolli all, et vältida võimalikku üleannustamist ja toksilisust. Infusioon tuleb lõpetada kohe, kui patsiendi südame

rütm stabiliseerub või ilmnevad esimesed toksilisuse nähud. Harvadel juhtudel on vajalik jätkata infusiooni kauem kui 24 tundi. Patsiendil tuleb esimesel võimalusel alustada säilitusravi suukaudse antiarütmikumiga.

Lapsed. Kogemused lidokaiini kasutamisega on piiratud. Stardiannusena on soovitatud kasutada 0,8...1 mg/kg, mida vajadusel korrata kuni 3...5 mg/kg saavutamiseni ning seejärel jätkata veenisese infusioonina 10...50 µg/kg/min.

Eakatel ja nõrgestatud organismiga patsientidel, samuti maksa- ja neerukahjustuse korral tuleb lidokaiini annust vähendada ja vajaduse korral määrata vere lidokaiinisaldust.

4.3 Vastunäidustused

Ülitundlikkus lidokaiini ja teiste amiidide gruppi kuuluvate lokaalanesteetikumide suhtes. Porfüüria.

4.4 Hoiatused ja ettevaatusabinõud kasutamisel

Lidokaiini tuleb ettevaatusega kasutada epilepsia, maksa või kopsude kahjustuse, südame paispuudulikkuse, raskete neeruhaiguste, märkimisväärse hüpoksia, raske respiratoorse puudulikkuse, hüpovoleemia või šoki korral ning väljendunud ülejuhtehäirete ning siinusbradükardia korral. Hüpokaleemia, hüpoksia ning happe-alustasakaalu häired peavad olema korrigeeritud enne lidokaiinravi alustamist.

Südamepuudulikkusega, eakatele ja nõrgestatud organismiga patsientidele, samuti maksakahjustuse korral või südameoperatsioonide järgselt tuleb lidokaiini manustada väiksemas annuses.

Erilise ettevaatusega tuleb ravimit manustada pea- või kaelapiirkonda. Seoses nimetatud piirkonna hea verevarustusega on seal suur oht süstida ravimit otse veresoonde, mis võib põhjustada tõsiseid kõrvaltoimeid. Seetõttu on närviblokaadide korral vajalik süstlaga aspireerida veendumaks, et süstlasse ei ole sattunud verd. Veenisese manustamise ajal on soovitatav jälgida teadvusseisundit, hingamisfunktsiooni ja EKG-d, soovitatav on valmistada ette elustamisvahendid ja tüsistuste raviks vajaminevad ravimid. Raskete kõrvaltoimete ilmnemise korral tuleb lidokaiini manustamine viivitamatult katkestada.

Veritsuskalduvusega patsientide puhul (hüübimishäirete või antikoagulantravi korral) tuleks hoiduda lidokaiini manustamisest *truncus sympaticus*'e ja selle ganglionide piirkonda, sügavale lihasesse ja epiduraalselt.

Ravimit ei soovitata kasutada patsientidel, kellel on anamneesis maligne hüpertermia.

Korduva lidokaiini manustamisega kaasneb kumuleerumisoht.

4.5 Koostoimed teiste ravimitega ja muud koostoimed

Vasokonstriktorsed ained (epinefriin või norepinefriin) pikendavad lidokaiini toime kestust ning vähendavad selle imendumist süstekohast. Valmis segatud lahus tuleb koheselt ära kasutada (vt lõik 6.2).

Kesknärvisüsteemi aktiivsust vähendavate ravimite ja lidokaiini samaaegne manustamine võib suurendada pärssivat toimet kesknärvisüsteemile.

Samaaegne kasutamine koos lokaalanesteetikumi bupivakaiiniga võib suurendada vaba lidokaiini kontsentratsiooni plasmas. Lidokaiini vaba fraktsiooni võib suurendada ka kokaiini ning östrogeenide (sh östrogeeni sisaldavate kontratseptiivide) samaaegne kasutamine, mille tagajärjel lidokaiini toksilisus suureneb.

Samaaegset kasutamist koos reboksetiiniga soovitatakse vältida.

Lidokaiini ja teiste antiarütmikumide (näiteks amiodarooni, tokainiidi jt) pärssiv toime südametegevusele on aditiivne.

Samaaegne kasutamine koos antibakteriaalsete ravimitega (kvinupristiin/dalfopristiin) suurendab ventrikulaarsete rütmihäirete tekke ohtu.

Lidokaiini samaaegsel kasutamisel koos narkootiliste või anesteetiliste ainetega tuleb jälgida sünergistlikku toimet, respiratoorse puudulikkuse tekke risk on suurenenud.

Lidokaiin võib tugevdada suksametoniumi toimet.

Kuna tsimetidiin ja beeta-blokaatorid (propranolool, nadolool) võivad vähendada lidokaiini kliirensit, suurendab nende ravimite samaaegne kasutamine lidokaiini kõrvaltoimete tekkeohtu.

Mikrosomaalsete ensüümide indutseerijad (näiteks barbituraadid, bensodiasepiinid, fenütoiin) võivad kiirendada lidokaiini metabolismi maksas ning vajalikuks võib osutada lidokaiini annuse suurendamine.

Atsetasolamiidist, lingudiureetikumidest ja tiasiididest tingitud hüpokaleemia vähendab lidokaiini toimet.

4.6 Rasedus ja imetamine

Lidokaiin läbib platsentaarbarjääri. Loomkatsed ei ole näidanud, et lidokaiin mõjuks lootele kahjulikult. Siiski puuduvad küllaldased ja hästi kontrollitud uuringud rasedate naistega, millest tulenevalt ei soovitata ravimit sellel perioodil kasutada.

Sünnituse ajal võib lidokaiini analgeesiaks kasutada. Lidokaiini ja teiste lokaalsete anesteetikumide kasutamisel tuleb arvestada, et võib tekkida hüpotensioon, sünnitustegevus võib aeglustuda, lapsel võib hüpoksia ja bradükardia tekkimise oht suurenedada ning lihastoonus võib olla esimestel sünnijärgsetel päevadel vähenenud.

Ravim eritub rinnapiima, seetõttu tuleb olla ettevaatlik selle kasutamise ja imetamise ajal.

4.7 Autojuhtimine ja masinatega töötamine

Ei ole kohaldatav, kuna ravimit kasutatakse haiglatingimustes. Siiski tuleb arvesse võtta, et mõnikord võib lidokaiini süsteemne toime halvendada vaimset või füüsilist võimekust.

4.8 Kõrvaltoimed

Kõrvaltoimete põhjuseks on tavaliselt üleannustamine, mis võib olla tingitud liigsest lidokaiini annusest, või tehnilistest vigadest manustamisel (süstimine veresoonde, süstimine väga hea verevarustusega piirkondadesse - näiteks pea- või kaelapiirkonda), või individuaalne ülitundlikkus kõnealuse ravimi suhtes. Allergilisi reaktsioone on esinenud harva.

Lidokaiini kõrvaltoimetena on esinenud järgmisi kõrvaltoimeid:

Kesknärvisüsteem: pearinglus, unisus, uimasus, närvilisus, eufooria, tinnitus, hägune või kahelinägemine, nüstagmid, oksendamise, kuuma- ja külmatunne, tõmbused, treemor, krampid, teadvusekadu, hingamispuudulikkus või –pidurdus.

Kardiovaskulaarsüsteem: hüpotensioon, kardiovaskulaarne kollaps ja bradükardia, mis võivad viia südameseiskusele.

4.9 Üleannustamine

Äge lidokaiinimürgistus avaldab kõige tugevamat toimet KNSile ja kardiovaskulaarsüsteemile ning võib resulteeruda raske hüpotensiooni, asüstoolia, bradükardia, apnoe, toonilis-klooniliste krampide, kooma, südameseiskuse, hingamisseiskuse ja surmaga. Mürgistuse varajasteks tundemärkideks on rahutus, ärevus, tinnitus, pearinglus, ähmane nägemine, treemor, meeoleolu langus, unisus, astenia, keele tuimus.

Spetsiifiline antidoot puudub. Intoksikatsiooni sümptomatoloogia avaldumisel tuleb ravimi manustamine viivitamatult lõpetada. Vajalik võib olla juhitud hingamine ning hapniku manustamine. Hüpotensiooni raviks soovitatakse kasutada vasopressoorseid aineid ning intravenoosset vedeliku manustamist. Raskete krampide puhul võib kasutada väikestes annustes diasepaami või ülilühikese toimeajaga barbituraati (tiopentoon), anesteetias patsiendile võib intravenooselt manustada lühikese toimeajaga lihaslõõgastit (suksametonium).

Dialüüsil ei ole positiivset mõju.

5. FARMAKOLOOGILISED OMADUSED

5.1 Farmakodünaamilised omadused

Farmakoterapeutiline grupp: Lokaalanesteetikum, antiarütmikum.

ATC-kood: N01 BB02; C01 BB01

Lidokaiin pärssib naatriumi ja kaaliumi liikumist läbi närvikiudude membraanide ja muudab need stabiilseteks. Selle tagajärjel pidurduvad erutusteke ning selle ülekanne, millest tulenebki anesteetiline toime. Lidokaiini toime saabub väga kiiresti ja kestab kuni kaks tundi. Lidokaiin pärssib diastoolset depolarisatsiooni, lühendab aktsioonipotentsiaali ja efektiivset refraktaarset perioodi, pärssib automatismi, ei mõjuta eriti müokardi kontraktiilsust, ülejuhet atrioventrikulaarses sõlmes, erutatavust ja eferentset innervatsiooni. Lidokaiin klassifitseeritakse 1b klassi (membraane stabiliseerivate) antiarütmikumide hulka.

5.2 Farmakokineetilised omadused

Süstituna imendub lidokaiin kiiresti ja jaotub organismi kõigi kudede vahel. Lidokaiin läbib vabalt hematoentsefaal- ja platsentaarbarjääri. Lidokaiini lihasesisese manustamise järgselt saavutati terapeutiline kontsentratsioon veres 5...15 minutiga ja see püsis 60...90 minutit. Veenisisesese manustamise puhul saavutati toime kohe ja see püsis 10...20 minutit. Lidokaiini poolväärtusaeg on 1,6 tundi. Lidokaiin seondub 65% ulatuses plasmavalkudega.

Ventrikulaarsete rütmihäirete pärssimiseks vajalik lidokaiini plasmakontsentratsioon (ümberarvestatult lidokaiinalusele) on ligikaudu 1,5...5 µg/ml. Veenisisesese manustamise korral toimub lidokaiini jaotumine kahes faasis. Varases faasis jõuab ravim kõige parema verevarustusega kudedesse. Teise, hilise faasi ajal jaotub ravim rasvkoesse ja skeletilihastesse. Südame paispuudulikkuse korral ravimi jaotusruumala väheneb.

Ravim metaboliseerub maksa mikrosomaalsete ensüümide toimetel kiiresti ja täielikult (80% ulatuses annusest) aktiivseteks metaboliitideks. Kõik maksa funktsiooni mõjutavad tegurid võivad muuta lidokaiini farmakokineetikat. Lidokaiini poolväärtusaeg plasmas on 1,5...2 tundi ja kestva infusiooni korral 3 tundi või rohkem. Lidokaiini poolväärtusaeg ($T_{1/2}$) on maksahaiguste korral kaks või enam korda pikem.

Lidokaiin eritub neerude kaudu, 10% ulatuses muutumatul kujul ja ülejäänud osas metaboliitidena. Neerufunktsiooni häirete korral võivad lidokaiini metaboliidid kumuleeruda.

5.3 Prekliinilised ohutusandmed

Lidokaiinvesinikkloriidi manustamise järgselt toitmata ja toidetud emastele rottidele oli LD₅₀ vastavalt 214 (159...324) ja 459 (346...773) mg/kg.

Lidokaiini võimalike kantserogeensete või mutageensete omaduste hindamiseks ei ole korraldatud ühtegi uuringut.

Annustega, mis ületasid inimestel kasutatavaid terapeutilisi annuseid kuni 6,6-kordselt ei ilmnenud rottidega läbi viidud reproduktiivsusuuringutes lidokaiini kahjulikku mõju lootele.

6. FARMATSEUTILISED ANDMED

6.1 Abiainete loetelu

Naatriumkloriid, naatriumhüdroksiid, 1M lahus, süstevesi.

Lahuse pH on 5,0...7,0.

6.2 Sobimatus

Lidokaiinvesinikkloriidi lahus on teadaolevalt kokkusobimatu amfoteritsiiniga, samuti sulfadiasiinnaatriumi, metoksitoonnaatriumi, tsefasoliinnaatriumi ja fenütoiinnaatriumiga.

Segatuna lidokaiinvesinikkloriidi lahustega võivad happelises keskkonnas stabiilsed ravimid (nt epinefriin, norepinefriin või isoprenaliin) mõne tunni jooksul muunduda, kuna lidokaiini lahuse lisamise tõttu võib segu pH tase tõusta kõrgemale eelnimetatud ravimite pH-stabiilsusmaksimumist. Taolised *ex tempore* valmistatud segud tuleb ära kasutada vahetult pärast valmistamist.

6.3 Kõlblikkusaeg

4 aastat.

6.4 Säilitamise eritingimused

Hoida valguse eest kaitstult. Hoida temperatuuril kuni 25°C.

6.5 Pakendi iseloomustus ja sisu

5 ml klaasampullid, 10 tk pakendis.

6.6 Erihoiatused ravimi käsitlemiseks ja hävitamiseks

Erijuhised puuduvad.

7. MÜÜGILOA HOIDJA JA TOOTJA

AS GRINDEKS.

Krustpils iela 53, Rīga, LV-1057, Läti

Tel.: +371 67083205

Faks: +371 67083505

e-mail: grindeks@grindeks.lv

8. MÜÜGILOA NUMBER

410503

**9. ESMASE MÜÜGILOA VÄLJASTAMISE/MÜÜGILOA UUENDAMISE
KUUPÄEV**

04.04.2003/28.03.2013

10. TEKSTI LÄBIVAATAMISE KUUPÄEV

Ravimiametis kinnitatud juulis 2013