Tờ hướng dẫn sử dụng thuốc tiếng Việt
Rx. Thuốc này chỉ dùng theo đơn thuốc

SEPTODONT VĂN PHÒNG ĐẠI DIỆN TẠI THÀNH PHỐ HỒ CHÍ MINH PHÁP

LIGNOSPAN STANDARD

(Dung dịch thuốc tiêm dùng trong nha khoa)

Để xa tầm tay trẻ em.
Đọc kỹ hướng dẫn sử dụng trước khi dùng.
Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sỹ những phản ứng có hại gặp phải khi sử dụng thuốc.

1. Thành phần công thức thuốc:
Thành phần hoạt chất:

Lidocaine Hydrochloride	36 mg
Epinephrine	0,018 mg

Thành phần tá dược: Kali metabisulphite, Natri edetat, Natri clorid, dung dịch natri hydroxid vừa đủ, nước cất để pha thuốc tiêm vừa đủ 1,8 ml.

2. Dạng bào chế: Dung dịch thuốc tiêm dùng trong nha khoa.

3. Chỉ định:
Dung dịch Lignospan standard dùng để gây tê cục bộ trong các thủ thuật nha khoa bằng cách phong bế thần kinh hoặc quy trình gây tê tiêm ngấm.

4. Cách dùng, liều dùng:
- Liều Lignospan standard (Lidocain HCl và epinephrine) phụ thuộc vào tình trạng thể lực của người bệnh, khu vực khoang miệng được gây tê, tình trạng tưới máu của mô ở khoang miệng và kỹ thuật gây tê được dùng.
- Nên dùng thể tích dung dịch nhỏ nhất có thể tạo ra hiệu quả gây tê cục bộ, cần có thời gian giữa các lần tiêm để theo dõi biểu hiện của một phản ứng có hại. Về kỹ thuật và quy trình gây tê đặc biệt ở khoang miệng, xin tham khảo tài liệu chuẩn.
- Trong thủ thuật nha khoa thông thường nhất Lignospan standard (Lidocain 2% với nồng độ epinephrine 1:100 000) được dùng nhiều hơn.
- Liều yêu cầu cần được xác định tùy trường hợp cụ thể. Gây tê tiêm ngấm ở vùng miệng hoặc phong bế hàm dưới, liều khởi đầu từ 1,0-5,0 ml (0,5-2,5 ống) Lignospan standard (Lidocain 2% với nồng độ epinephrine 1:50 000 hoặc 1:100 000) thường có hiệu quả.
- Ở trẻ em dưới 10 tuổi, ít khi cần dùng nhiều hơn 0,5 ống (từ 0,9-1,0 ml hoặc từ 18-20 mg Lidocain) cho 1 lần gây tê cục bộ thủ thuật liên quan đến 1 răng đơn. Trong trường hợp gây tê tiêm ngấm hàm trên, lượng thuốc đó thường đủ để xử lý 2, thậm chí 3 răng. Tuy nhiên khi phong bế xương hàm dưới, sự gây tê thành công cũng đạt được khi phong bế bằng lượng thuốc này cho phép xử lý các răng ở cùng 1 góc.
- Nên hút ra trước khi tiêm, vì điều này làm giảm khả năng bị tiêm vào tĩnh mạch, do đó giảm tỷ lệ gặp tác dụng ngoại ý và hiệu quả gây tê kém. Tuy nhiên cần luôn luôn tiêm chậm.

***Liều tối đa được khuyến cáo của Lignospan standard (Lidocain 2% với nồng độ epinephrine 1:100 000) là:**
Người lớn:
Với người lớn khỏe mạnh, lượng Lidocain HCl được dùng nên ở mức dưới 500 mg và trong bất kì trường hợp nào cũng không được quá 7 mg/kg (3,2 mg/lb) cân nặng.

Trẻ em:
Các bệnh nhi: khó có thể khuyến cáo một liều tối đa của bất kỳ thuốc nào cho các bệnh nhi vì liều này biến đổi tùy thuộc vào tuổi và cân nặng. Với các bệnh nhi dưới 10 tuổi có thể trọng và phát triển bình thường, liều tối đa có thể xác định bằng cách áp dụng một trong các công thức tính liều chuẩn (Quy tắc Clark). Ví dụ, ở những bệnh nhi dưới 5 tuổi, cân nặng 50 lbs, liều Lidocain HCl không được vượt quá 7 mg/kg (3,2 mg/lb) cân nặng.

Ghi nhớ:
Các thuốc dùng ngoài đường tiêu hóa phải được kiểm tra cảm quan các vi tiểu phân lạ và sự biến màu trước khi dùng bất cứ khi nào dung dịch và bao bì cho phép.
Dung dịch đã bị biến màu hoặc có tiểu phân lạ không được phép dùng và bất kỳ phần dư nào còn lại trong ống thuốc Lignospan standard đều phải loại bỏ.

5. Chống chỉ định:
Lignospan standard chống chỉ định với người có tiền sử mẫn cảm với thuốc tê nhóm amid hoặc với bất kỳ thành phần nào trong công thức thuốc tiêm.

6. Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc:
+ Cảnh báo đặc biệt:
- Bác sĩ nha khoa đang hành nghề có sử dụng thuốc gây tê phải thông thạo về chẩn đoán và xử lý các trường hợp cấp cứu có thể xảy ra khi dùng các thuốc này. Các thiết bị hồi sức, oxy và các thuốc hồi sức khác phải sẵn có để dùng ngay tức thì.
- Không được tiêm vào mạch máu.
- Chỉ được tiêm chậm.
- Để giảm thiểu việc tiêm phải mạch máu, trước khi tiêm một dung dịch gây tê cục bộ cần phải hút ra. Nếu có máu bị hút ra, kim cần được đặt lại cho đến khi không còn máu bị lấy ra khi kéo pitong để hút. Tuy nhiên, nên nhớ rằng sự không có máu trong xi lanh không đảm bảo rằng sẽ tránh được tiêm vào mạch máu và việc hút kép luôn luôn được khuyến cáo.
- Thủ thuật gây tê cục bộ cần được tiến hành thận trọng khi khu vực định tiêm bị viêm hoặc nhiễm khuẩn.
- Các dung dịch Lignospan standard có chứa Kali metabisulphit, là một sulphit có thể gây phản ứng kiểu dị ứng, bao gồm các triệu chứng phản vệ và cơn hen đe dọa tính mạng hoặc ít nguy hiểm hơn ở một số người nhạy cảm. Sự phổ biến của tình trạng mẫn cảm với sulphit trên dân số vẫn còn chưa được biết và có thể thấp. Nhạy cảm với sulphit thường hay gặp ở người mắc bệnh hen hơn ở những người không bị hen.

+ Thận trọng khi dùng thuốc:
Thận trọng chung:
- Sự an toàn và tính hiệu lực của Lidocain phụ thuộc vào liều thích hợp, kỹ thuật chính xác, sự thận trọng thỏa đáng và sẵn sàng xử lý các trường hợp cấp cứu. Các thiết bị hồi sức, oxy và các thuốc hồi sức khác cần sẵn sàng có để dùng ngay tức thì (xin đọc "Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc").
- Nên dùng liều thấp nhất có hiệu quả gây tê để tránh nồng độ cao trong huyết tương và các tác dụng có hại nghiêm trọng. Các liều Lidocain nhắc lại có thể làm tăng đáng kể nồng độ trong máu sau mỗi lần nhắc lại, do có sự tích lũy chậm của thuốc và các chất chuyển hóa. Khả năng dung nạp các nồng độ cao trong máu biến đổi theo trạng thái của người bệnh, người suy yếu, người cao tuổi, người bị bệnh cấp tính và trẻ em nên được dùng giảm liều phù hợp với tuổi và tình trạng thể lực của họ (xin đọc phần "Cách dùng, liều dùng").
- Nếu người bệnh được cho dùng thuốc an thần để giảm bớt sự sợ hãi, nên giảm liều vì các thuốc gây tê cũng như các thuốc an thần khác làm ức chế thần kinh trung ương, nếu kết hợp có thể gây tác dụng cộng hưởng. Trẻ em cho dùng liều tối thiểu mỗi loại.

- Nên dùng thận trọng Lidocain ở những người bị shock nặng hoặc block tim. Thận trọng khi dùng Lidocain cho người bệnh suy tim mạch. Phải dùng thận trọng các dung dịch gây tê cục bộ chứa chất co mạch, ở những vùng cơ thể có nhiều động mạch hoặc có hệ thống cấp máu bị tổn thương.
- Người bị bệnh ở mạch ngoại vi và người bị tăng huyết áp có đáp ứng co mạch quá mức, có thể gây thiếu máu cục bộ hay hoại tử. Các chế phẩm có chứa chất co mạch phải được dùng thận trọng với các người bệnh đang dùng hoặc vừa dùng các chất gây mê, vì có thể gặp loạn nhịp tim.
- Những dấu hiệu sống còn về tim mạch, hô hấp và sự tỉnh táo của người bệnh cần được giám sát sau mỗi lần tiêm. Các dấu hiệu bồn chồn, ù tai, chóng mặt, mờ mắt, run, trầm cảm hoặc ngủ gật có thể báo trước cho thầy thuốc về khả năng nhiễm độc hệ thần kinh trung ương.
- Dấu hiệu và triệu chứng của suy giảm chức năng tim mạch thường có thể do một phản ứng mạch thần kinh phế vị, đặc biệt nếu người bệnh đang ở tư thế đứng: đặt người bệnh nằm xuống khi nhận ra một đáp ứng bất lợi sau khi tiêm thuốc gây tê (xin đọc phần "Tác dụng không mong muốn của thuốc").
- Thận trọng khi dùng Lidocain cho người bệnh có bệnh gan, vì các thuốc gây tê nhóm amid được chuyển hóa tại gan. Người bệnh bị bệnh gan nặng, do không có khả năng chuyển hóa bình thường thuốc tê, nên thường có nguy cơ bị tăng nồng độ trong huyết tương tới mức gây độc.
- Nhiều thuốc tê được coi là tác nhân quan trọng gây ra chứng sốt cao ác tính có tính chất gia đình. Vì không biết rõ liệu các chất gây tê nhóm amid có thể gây ra phản ứng này không và vì việc cần thiết dùng chất gây mê bổ sung không thể được dự đoán trước, người ta khuyên nên sẵn sàng có phương pháp xử lý chuẩn. Những dấu hiệu sớm không giải thích được của các chứng nhịp tim nhanh, thở nhanh, huyết áp không ổn định và nhiễm acid chuyển hóa có thể đến trước khi nhiệt độ tăng cao. Việc xử lý thành công phụ thuộc vào chuẩn đoán sớm, ngừng ngay các tác nhân bị nghi ngờ, điều trị nhanh bao gồm thở oxy, dantrolen (đọc kỹ bao bì dantrolen natri tiêm tĩnh mạch trước khi dùng) và các biện pháp hỗ trợ khác.
- Thận trọng khi dùng Lidocain cho người đã biết là có nhạy cảm với thuốc. Người bệnh dị ứng với các dẫn chất của acid para-aminobenzoic (procain, tetracain, benzocaine...) không có mẫn cảm chéo với Lidocain.

+ Sử dụng ở vùng đầu và cổ:

- Thuốc gây tê cục bộ được tiêm với liều nhỏ ở khu vực đầu và cổ, bao gồm vùng sau nhãn cầu, răng, phong bế hạch có thể gây ra phản ứng có hại tương tự như ngộ độc toàn thân gặp phải khi tiêm vào mạch do không chủ định và với những liều lớn. Các dấu hiệu lú lẫn, co giật, suy hô hấp hoặc ngừng hô hấp và kích thích hoặc ức chế tim mạch đã được ghi nhận. Những phản ứng này có thể do tiêm thuốc gây tê cục bộ vào tĩnh mạch với dòng trào ngược vào tuần hoàn não. Những người bệnh bị phong bế như vậy cần được kiểm soát liên tục. Đội ngũ hồi sức cấp cứu và nhân viên điều trị những phản ứng có hại của thuốc cần thường trực để chạy chữa kịp thời.
- Không nên vượt quá liều khuyến cáo (xin đọc phần "Cách dùng, liều dùng").

+ Thông tin cho người bệnh:

- Cần thông báo cho người bệnh biết về khả năng mất tạm thời cảm giác và chức năng cơ sau khi tiêm ngấm và phong bế thần kinh.
- Người bệnh cần được thông báo cẩn thận tránh chấn thương do sơ ý ở môi, lưỡi, niêm mạc trong má hoặc vòm miệng, khi các nơi này bị gây tê. Vì vậy cần hoãn ăn trước khi hết tác dụng của thuốc tê và các chức năng bình phục.
- Cần thông báo cho người bệnh phải đến gặp bác sỹ nha khoa nếu vẫn còn tê hoặc bị phát ban.

+ Sử dụng trong nhi khoa:

Liều dùng trong nhi khoa cần giảm thích hợp với tuổi, cân nặng và tình trạng sức khỏe (xin đọc phần "Cách dùng, liều dùng").

7. Sử dụng thuốc cho phụ nữ có thai và cho con bú:

Phụ nữ mang thai:

Tác dụng gây quái thai (nhóm B): Các nghiên cứu về sinh sản được thực hiện ở chuột cống với liều gấp 6,6 lần liều cho người không thấy có biểu hiện gây hại cho thai do Lidocain gây ra. Tuy nhiên chưa có nghiên cứu đầy đủ và được kiểm soát kỹ ở người mang thai. Các nghiên cứu về sinh sản của động vật không phải luôn dự báo chính xác cho đáp ứng của người. Cần cân nhắc tổng quát yếu tố này trước khi dùng Lidocain cho người mang thai, đặc biệt trong thời gian đầu của thai kỳ khi sự hình thành của các cơ quan diễn ra mạnh nhất.

Thời kỳ cho con bú:

Vẫn còn chưa rõ thuốc này có bài tiết qua sữa mẹ hay không. Vì nhiều thuốc bài tiết được qua sữa, nên cần thận trọng khi dùng Lidocain cho phụ nữ trong thời kỳ cho con bú.

8. Ảnh hưởng của thuốc lên khả năng lái xe, vận hành máy móc: Không có.

9. Tương tác, tương kỵ của thuốc:

Tương tác thuốc đáng kể trong lâm sàng:

- Việc sử dụng các dung dịch gây tê cục bộ có chứa epinephrine hoặc không phải epinephrine cho người bệnh đang sử dụng thuốc ức chế monoamin oxidase (IMAO), thuốc chống trầm cảm 3 vòng hoặc các phenothiazine có thể gây tăng hoặc hạ huyết áp kéo dài nguy hiểm. Nên tránh dùng đồng thời những thuốc này với Lidocain. Nếu bắt buộc phải dùng phối hợp thì nhất thiết phải giám sát người bệnh chặt chẽ.
- Việc dùng đồng thời với thuốc gây tăng huyết áp và thuốc trợ đẻ loại ergot có thể gây tăng huyết áp dai dẳng, nguy hiểm hoặc tai biến mạch máu não. Vì dung dịch Lignospan standard có chứa chất co mạch (epinephrine) nên việc dùng đồng thời dung dịch này với bất kỳ một thuốc chẹn β adrenergic (như propanolol, timolol…) hoặc với một dung dịch gây tê có chứa chất co mạch, có thể gây ra chứng tăng huyết áp phụ thuộc liều và nhịp tim chậm, có thể kèm theo block tim.

Tương tác thuốc và các xét nghiệm:

Tiêm bắp Lidocain có thể gây tăng nồng độ creatin phosphokinase. Vì thế, việc dùng xét nghiệm này mà không tách riêng isoenzym như một phép thử chẩn đoán nhồi máu cơ tim cấp, có thể bị sai do tiêm bắp Lidocain.

10. Tác dụng không mong muốn của thuốc:

Các phản ứng bất lợi sau khi dùng Lidocain tương tự về bản chất với những phản ứng được thấy khi dùng thuốc gây tê cục bộ khác cùng nhóm amid. Những phản ứng này nói chung liên quan đến liều và có thể cho nồng độ cao trong huyết tương vì liều cao quá mức, hấp thu nhanh do tiêm vào mạch không chủ định hoặc có thể do quá mẫn cảm, đặc ứng hoặc giảm dung nạp ở một số người bệnh. Những phản ứng có hại nghiêm trọng thường xảy ra toàn thân. Các loại phản ứng sau đây thường được ghi nhận hơn cả:

- ***Hệ thần kinh trung ương:***

Biểu hiện của thần kinh trung ương gồm kích thích hoặc trầm cảm và có thể đặc trưng bởi choáng váng nhẹ, bồn chồn, lo âu, sảng khoái, lẫn, chóng mặt, ngủ gật, ù tai, mờ mắt hoặc nhìn đôi, nôn, nhạy cảm với nóng lạnh, tê cóng, co giật cơ, run, co giật, bất tỉnh, suy và ngừng hô hấp. Biểu hiện kích thích có thể rất ít hoặc không xuất hiện, trong trường hợp này, biểu hiện đầu tiên của ngộ độc có thể là ngủ gật kết hợp với bất tỉnh và ngừng hô hấp. Ngủ gật sau khi dùng Lidocain thường là dấu hiệu sớm của nồng độ thuốc cao trong máu, có thể coi như hậu quả của sự hấp thu nhanh.

- ***Hệ tim mạch:***

Biểu hiện về tim mạch thường là suy giảm, đặc trưng bởi nhịp tim chậm, hạ huyết áp và trụy tim mạch, có thể dẫn tới ngừng tim. Dấu hiệu và triệu chứng của chức năng tim mạch bị suy giảm thường có thể do một phản ứng của mạch thần kinh phế vị, đặc biệt nếu người bệnh đang ở vị trí đứng. Những triệu chứng ít phổ biến, có thể là do tác dụng trực tiếp của thuốc. Sự không nhận ra dấu hiệu trước giám sát như toát mồ hôi, cảm giác ngất, biến đổi ở mạch hoặc trung tâm cảm giác, có thể gây ra giảm oxy não tiến triển và cơn tai biến tim mạch nghiêm trọng. Việc điều trị bao gồm đặt người bệnh ở tư thế nằm và cho thở oxy. Điều trị bổ trợ chứng suy tuần hoàn có thể đòi hỏi truyền dịch tĩnh mạch và khi phù hợp, dùng chất co mạch (như: ephedrine) được chỉ định tùy trạng thái lâm sàng.

- ***Dị ứng:***

Phản ứng dị ứng được đặc trưng bởi những tổn thương ở da, mề đay, phù niêm mạc hoặc phản ứng phản vệ. Phản ứng dị ứng do nhạy cảm với Lidocain rất hiếm và nếu xuất hiện, có thể được điều trị bằng phương pháp thông thường. Phát hiện sự nhạy cảm bằng phản ứng da có giá trị không chắc chắn.

- ***Phản ứng thần kinh:***

Tai biến về phản ứng có hại (như suy nhược thần kinh dai dẳng) kèm theo với dùng chất gây tê cục bộ có thể liên quan tới kỹ thuật gây tê đã áp dụng, tổng liều thuốc tê đã dùng, đường dùng và điều kiện thể lực của người bệnh.

Thông báo ngay cho bác sỹ hoặc dược sĩ khi gặp các tác dụng không mong muốn như trên khi sử dụng thuốc hoặc báo cáo các phản ứng có hại của thuốc về Trung tâm Thông tin thuốc và Theo dõi phản ứng có hại của thuốc (ADR) Quốc Gia. Địa chỉ: 13 - 15 Lê Thánh Tông - Hoàn Kiếm - Hà Nội. Điện thoại: 024.3.9335.618; Fax: 024.3.9335642; Email: di.pvcenter@gmail.com.

11. Quá liều và cách xử trí:

Tình trạng cấp cứu do các thuốc tê cục bộ nói chung có liên quan tới nồng độ cao trong huyết tương gặp phải trong quá trình điều trị bằng thuốc tê cục bộ hoặc do vô tình tiêm vào mạch các dung dịch thuốc tê cục bộ (xem "Cảnh báo và thận trọng khi dùng thuốc", "Tác dụng không mong muốn của thuốc").

Xử lý các trường hợp cấp cứu do gây tê cục bộ:

- Lưu ý đầu tiên là do phòng ngừa, được thực hiện tốt nhất bằng cách giám sát cẩn thận và thường xuyên các dấu hiệu sống còn về tim mạch, hô hấp và trạng thái tỉnh táo của người bệnh sau mỗi lần tiêm thuốc gây tê cục bộ. Khi có dấu hiệu bất thường đầu tiên, cần sử dụng oxy ngay.
- Bước đầu tiên trong xử lý co giật là chú ý ngay việc duy trì đường thở thông suốt và không khí có trợ giúp hoặc có kiểm soát với oxy và hệ thống cung cấp cho phép đạt ngay áp lực dương tính trong đường thở nhờ mặt nạ. Ngay sau phần cơ bản của những biện pháp thông khí này, cần đánh giá sự tương xứng của tuần hoàn và nhớ rằng những thuốc để điều trị co giật đôi khi làm suy giảm tuần hoàn nếu tiêm tĩnh mạch. Có thể cơn co giật vẫn dai dẳng, bất chấp việc trợ hô hấp và nếu tình trạng tuần hoàn cho phép, có thể tiêm tĩnh mạch thêm một lượng nhỏ loại Barbiturat tác dụng rất ngắn (như thiopental hoặc thiamylal) hoặc bột benzodiazepin (như diazepam). Thầy thuốc lâm sàng phải quen dùng những thuốc chống co giật này trước khi dùng thuốc tê. Điều trị hỗ trợ suy giảm tuần hoàn có thể đòi hỏi truyền dịch qua tĩnh mạch và một thuốc co mạch (như ephedrin) có thể được chỉ định tùy trạng thái lâm sàng.
- Nếu không được xử lý kịp thời, cả chứng co giật và suy tim mạch có thể gây thiếu oxy, nhiễm acid chuyển hóa, nhịp tim chậm, loạn nhịp tim và ngừng tim. Nếu có ngừng tim, các biện pháp hồi sức tim-phổi chuẩn phải được thực hiện ngay.
- Đặt nội khí quản, dùng các thuốc và kỹ thuật quen thuộc với thầy thuốc lâm sàng sau khi khởi đầu bằng mặt nạ oxy, nếu gặp khó khăn trong việc duy trì đường thở thông suốt hoặc nếu có chỉ định bổ

trợ thông khí lâu dài (có trợ giúp hoặc kiểm soát). Thẩm tách máu có giá trị không đáng kể trong trường hợp quá liều Lidocain cấp tính.

- Liều LD_{50} của Lidocain HCl tiêm tĩnh mạch ở chuột nhắt cái là 26 (21-31) mg/kg và LD_{50} tiêm dưới da là 264 (203-304) mg/kg.

12. Đặc tính dược lực học:

Cơ chế tác dụng:

Lidocain làm ổn định màng nơ ron thần kinh bằng cách ức chế dòng ion cần cho khởi phát và dẫn truyền xung động thần kinh, từ đó có tác dụng gây tê cục bộ.

Khởi đầu và quá trình gây tê:

- Khi được dùng gây tê tiêm ngấm ở người bệnh chữa răng, thời gian khởi đầu trung bình là dưới 2 phút cho cả 2 dạng Lignospan.
- Lignospan standard (dung dịch Lidocain HCl 2% và nồng độ Adrenalin (epinephrine) 1:100 000) cho thời gian gây tê tủy răng trung bình ít nhất 60 phút với giai đoạn gây tê mô mềm khoảng 2,5 giờ.
- Nếu dùng để phong bế tủy răng ở người bệnh chữa răng thì thời gian bắt đầu gây tê trung bình 2-4 phút. Nếu gây tê tủy răng thời gian trung bình ít nhất 90 phút với giai đoạn gây tê mô mềm khoảng 3-3,5 giờ.

13. Đặc tính dược động học:

Huyết động học:

Hàm lượng trong máu quá cao có thể gây biến đổi lưu lượng tim, sự đề kháng toàn thể mạch ngoại vi và áp lực động mạch chủ trung bình. Những biến đổi này có thể do tác dụng trực tiếp của thuốc tê lên các thành phần của hệ tim mạch và do tác dụng kích thích thụ thể β adrenergic khi có mặt epinephrine.

Dược động học và chuyển hóa:

+ Các thông tin thu được từ công thức, nồng độ và cách sử dụng chỉ ra rằng Lidocain được hấp thu hoàn toàn sau khi tiêm, tốc độ hấp thu của thuốc tùy thuộc vào các yếu tố khác nhau như vị trí tiêm và có hay không có thuốc co mạch. Trừ đường tiêm mạch máu, nồng độ cao nhất trong máu là sau khi phong bế thần kinh liên sườn và nồng độ thấp nhất là sau khi tiêm dưới da.

+ Sự liên kết với protein huyết tương của Lidocain tùy thuộc vào nồng độ thuốc và liên kết phân đoạn giảm khi nồng độ tăng. Với nồng độ 1-4 µg base tự do trong 1 ml, thì 60-80% Lidocain liên kết với protein. Liên kết này cũng phụ thuộc vào nồng độ α-1-acid glicoprotein trong huyết tương.

+ Lidocain vượt qua hàng rào vào máu não và hàng rào nhau thai có thể qua hình thức khuếch tán thụ động.

+ Lidocain chuyển hóa nhanh ở gan, các chất chuyển hóa và chất mẹ chưa chuyển hóa được thải qua thận. Sự chuyển hóa sinh học bao gồm các phản ứng N-oxy hóa mất alkyl, hydroxyl hóa ở nhân thơm, cắt dây nối amid và phản ứng liên hợp. N-oxy hóa mất alkyl là đường chuyển hóa sinh học chính tạo ra các chất monoethylglycinexylided và glycenixylidid. Các tác dụng dược lý và độc tính của những chất chuyển hóa này tương tự nhưng không mạnh bằng Lidocain.

+ Khoảng 90% Lidocain đã dùng được thải trừ dưới các dạng chuyển hóa khác nhau và dưới 10% được thải trừ dưới dạng chất mẹ không biến đổi. Sản phẩm chuyển hóa chính trong nước tiểu là chất liên hợp của 4-hydroxy-2,6-dimethylanilin.

+ Các nghiên cứu về chuyển hóa của Lidocain sau khi tiêm tĩnh mạch cho thấy thời gian bán thải của thuốc này từ 1,5-2 giờ. Do tốc độ chuyển hóa nhanh của Lidocain, bất kỳ điều kiện nào ảnh hưởng đến chức năng gan đều cũng có ảnh hưởng tới động học của Lidocain. Thời gian bán thải có thể kéo dài gấp hai hoặc hơn nữa ở các người bệnh suy gan nặng. Suy thận không ảnh hưởng tới động học của Lidocain nhưng có thể tăng tích lũy các chất chuyển hóa của Lidocain.

+ Các yếu tố như nhiễm acid chuyển hóa và việc sử dụng các chất kích thích và ức chế hệ thần kinh trung ương ảnh hưởng tới nồng độ cần thiết của Lidocain trong hệ thần kinh trung ương để gây tác động toàn thân. Các biểu hiện bất lợi khách quan tăng lên cùng với tăng nồng độ trong huyết tương tới trên 6,0 µg base tự do trong 1 ml. Khi Rhesus có nồng độ Lidocain trong máu động mạch 18-21 µg/ml được coi là ngưỡng để bị co giật.

14. Quy cách đóng gói: Hộp 5 vỉ x 10 ống 1,8 ml.

15. Điều kiện bảo quản, hạn dùng, tiêu chuẩn chất lượng của thuốc:

- Điều kiện bảo quản: Nơi khô ráo, dưới 25°C.
- Hạn dùng: 24 tháng kể từ ngày sản xuất.
- Tiêu chuẩn chất lượng: Tiêu chuẩn cơ sở.

16. Tên, địa chỉ của cơ sở sản xuất thuốc:

SEPTODONT
58, rue du Pont de Créteil
94100 Saint-Maur-des-Fossés – Pháp.