

RIASSUNTO DELLE CARATTERISTICHE DEL PRODOTTO

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

LIDOCAINA CLORIDRATO S.A.L.F. 10 mg/ml soluzione iniettabile

LIDOCAINA CLORIDRATO S.A.L.F. 20 mg/ml soluzione iniettabile

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 10 mg/ml soluzione iniettabile.

1 ml di soluzione contiene:

Principio attivo:

Lidocaina cloridrato monoidrato 10,65 mg (corrispondente a 10 mg di Lidocaina cloridrato)

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 20 mg/ml soluzione iniettabile.

1 ml di soluzione contiene:

Principio attivo:

Lidocaina cloridrato monoidrato 21,30 mg (corrispondente a 20 mg di Lidocaina cloridrato)

Eccipiente con effetti noti: sodio cloruro

Per l'elenco completo degli eccipienti, vedere paragrafo 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICA

Soluzione iniettabile.

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

Come anestetico locale

Interventi conservativi e chirurgici in odontostomatologia (estrazioni, levigatura dei denti per corone e ponti, preparazione di cavità, estirpazioni vitali, incisioni di ascessi, apicectomie), piccoli interventi sulla cute (ad esempio asportazione di cisti), chirurgia mascellare.

Come antiaritmico

Per trattare le aritmie ventricolari, specialmente dopo infarto del miocardio o durante le manipolazioni cardiache, come per esempio il cateterismo cardiaco o in interventi cardiocirurgici.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

Come anestetico locale

10 - 40 mg o più in relazione alle esigenze dell'intervento, per infiltrazione oppure per blocco nervoso periferico. La soluzione anestetica deve essere iniettata in piccole dosi, con una velocità di somministrazione di circa 1 ml/minuto, previa un'appropriata aspirazione.

Nell'adulto sano, non pretrattato con sedativi, le dosi massime, in singola somministrazione o in più somministrazioni ripetute in un tempo inferiore ai 120 minuti, sono di complessivi 300 mg di lidocaina cloridrato. In pediatria ridurre le dosi proporzionalmente al peso e all'età.

Agenzia Italiana del Farmaco

Come antiaritmico

Adulti

Somministrazione diretta endovenosa (bolo) per il trattamento iniziale delle aritmie ventricolari

La dose usuale di lidocaina è di 50-100 mg (0,7-1,4 mg/kg) da somministrarsi, sotto controllo ECG, con una velocità di iniezione di 25-50 mg/minuto (0,35-0,7 mg/kg/minuto); se con questa dose non si ottiene la risposta desiderata, è possibile somministrarne una seconda dopo 5 minuti-10 minuti.

Non più di 200-300 mg di lidocaina dovrebbero essere somministrati in un'ora.

Infusione endovenosa continua

Dopo la somministrazione di un bolo, un'infusione di mantenimento può essere somministrata alla dose di 0,01 - 0,05 mg/kg/minuto (1-4 mg/minuto per un adulto di 70 kg), eventualmente opportunamente diluito con glucosio 5%.

Raramente è necessario continuare l'infusione oltre le 24 ore, ma in caso sia necessaria una somministrazione prolungata, è opportuno considerare una riduzione della dose per evitare rischi di tossicità.

Non appena possibile, la terapia di mantenimento deve essere continuata con un antiaritmico somministrato per via orale.

L'infusione deve essere effettuata sotto controllo ECG per evitare la comparsa di fenomeni di sovradosaggio e tossicità. L'infusione deve essere interrotta quando il ritmo cardiaco del paziente risulta stabile o al primo manifestarsi di segni di tossicità.

Bambini

La sicurezza e l'efficacia dell'uso della lidocaina nei bambini non è stata stabilita. E' stata suggerita una dose iniziale (bolo) di 0,5-1 mg/kg ripetuta, se necessario, fino a 3-5 mg/kg, seguito da un infusione continua di 10-50 mcg/kg/minuto.

Anziani

La dose dovrebbe essere valutata in relazione all'età e alle condizioni fisiche del paziente.

È possibile che sia necessario ridurre la dose e la velocità di infusione.

Pazienti con compromissione cardiaca, epatica o renale

Questi pazienti possono richiedere una riduzione della dose e della velocità di infusione.

4.3 Controindicazioni

Ipersensibilità al principio attivo e agli altri anestetici locali di tipo amidico, o ad uno qualsiasi degli eccipienti elencati al paragrafo 6.1.

Gravidanza accertata o presunta (vedere Paragrafo 4.6).

Bambini di età inferiore a 4 anni.

4.4 Avvertenze speciali e precauzioni di impiego

La soluzione deve essere limpida, incolore e priva di particelle visibili. E' necessario avere la disponibilità immediata delle attrezzature, dei farmaci e del personale idonei al trattamento di emergenza, poiché in rari casi sono state riferite, a seguito dell'uso di anestetici locali, reazioni gravi, talora ad esito infausto, anche in assenza di ipersensibilità individuale nell'anamnesi.

Come anestetico locale

L'efficacia e la sicurezza dell'uso della lidocaina in ambito odontoiatrico dipendono dal dosaggio adeguato, dall'appropriata tecnica di somministrazione e dalle opportune precauzioni.

Prima dell'uso il medico deve accertarsi dello stato delle condizioni circolatorie del soggetto da trattare; deve altresì informarsi sulle terapie in corso e su eventuali reazioni allergiche antecedenti.

Occorre evitare qualsiasi sovradosaggio di anestetico e non somministrare mai due dosi massime di quest'ultimo senza che sia trascorso un intervallo minimo di 24 ore.

E' necessario, comunque, usare le dosi e le concentrazioni più basse che possano consentire di ottenere l'effetto ricercato. Il paziente deve essere mantenuto sotto accurato controllo, sospendendo immediatamente la somministrazione al primo segno di allarme (per es. modificazioni del sensorio). Usare massima cautela in pazienti con affezioni cardiovascolari e specialmente in caso di shock, di turbe della conduzione atrioventricolare o di bradicardia sinusale.

La soluzione anestetica deve essere iniettata con cautela in piccole dosi dopo 10 secondi circa da una preventiva aspirazione.

Specialmente quando si devono infiltrare zone molto vascolarizzate è consigliabile lasciare trascorrere circa 2 minuti prima di procedere al blocco loco-regionale vero e proprio.

Deve essere assolutamente evitata la somministrazione diretta in vena.

Per evitare morsicature alle labbra, alla lingua ed alle mucose il paziente deve essere sensibilizzato a non masticare nulla prima che sia tornata la sensibilità.

L'anestesia locale deve essere evitata nelle zone infette e nelle infiammazioni.

Come antiaritmico

Per una corretta somministrazione è essenziale un costante monitoraggio elettrocardiografico.

Potrebbero verificarsi reazioni gravi a carico del sistema cardiovascolare, respiratorio e nervoso centrale, per cui deve essere immediatamente disponibile un'adeguata attrezzatura di rianimazione.

In caso di reazioni gravi, la lidocaina deve essere sospesa.

La lidocaina deve essere usata con cautela quando viene somministrata per via endovenosa per il trattamento delle aritmie ventricolari, nei pazienti che presentino patologie epatiche e renali gravi, nei pazienti con insufficienza cardiaca congestizia, blocco cardiaco o altri disturbi della conduzione, ipovolemia, ipossia marcata e grave depressione respiratoria, nei pazienti con predisposizione genetica all'ipertermia maligna. Condizioni come l'ipopotassiemia, l'iperpotassiemia l'ipossia o le alterazioni dell'equilibrio acidobase devono essere corrette prima di iniziare la somministrazione di lidocaina.

Informazioni importanti su alcuni eccipienti:

Le fiale da 5 ml contengono meno di 1 mmol (23 mg) di sodio, cioè sono praticamente senza sodio.

Le fiale da 10 ml contengono circa 1 mmol (23,6 mg) di sodio, Da tenere in considerazione in persone con ridotta funzionalità renale o che seguono una dieta a basso contenuto di sodio.

I flaconi da 50 ml contengono circa 5 mmol (118 mg) di sodio. Da tenere in considerazione in persone con ridotta funzionalità renale o che seguono una dieta a basso contenuto di sodio.

4.5 Interazioni con altri medicinali e altre forme di interazione

La cimetidina ed i beta-bloccanti rallentano il catabolismo epatico degli anestetici locali, mentre l'amiodarone ne riduce la clearance; i livelli sierici di lidocaina possono anche essere aumentati dai medicinali antivirali; i digitalici aumentano il rischio di bradicardia e di disturbi della conduzione auricolo-vestibolare.

L'effetto depressivo sulla funzionalità cardiaca della lidocaina può sommarsi a quello di altri farmaci antiaritmici

I pazienti in trattamento concomitante con antipsicotici che prolungano o possono prolungare l'intervallo QT o con antagonisti del 5HT₃ possono avere un rischio maggiore di aritmie ventricolari.

È necessaria cautela nei soggetti trattati con farmaci IMAO o antidepressivi triciclici.

L'uso concomitante di medicinali che inibiscono i citocromi CYP1A2 e CYP3A4 possono ridurre l'eliminazione della lidocaina aumentandone di conseguenza il rischio di tossicità.

La lidocaina può prolungare l'azione di bloccanti neuromuscolari come suxametonio e cisatracurio.

4.6 Gravidanza e allattamento

La sicurezza della lidocaina in gravidanza non è stata stabilita. La lidocaina attraversa la barriera placentare ed è secreta nel latte materno.

4.7 Effetti sulla capacità di guidare e sull'uso di macchinari

Alle dosi consigliate il farmaco non influenza significativamente e per lungo tempo la capacità di attenzione. Solo il medico può decidere se, dopo l'intervento, il paziente può guidare veicoli o utilizzare macchinari.

4.8 Effetti indesiderati

Di seguito sono riportati gli effetti indesiderati della lidocaina cloridrato organizzati secondo la classificazione sistemica-organica MedDRA. Non sono disponibili dati sufficienti per stabilire la frequenza dei singoli effetti elencati.

Gli effetti indesiderati sono generalmente dose-dipendenti e possono derivare da alti livelli plasmatici conseguenti ad eccessivo dosaggio, a rapido assorbimento, ad accidentale iniezione intravasale, oppure possono essere determinati da ipersensibilità, idiosincrasia, diminuita tolleranza da parte del paziente.

Disturbi del sistema immunitario

Eruzioni cutanee di tipo vario, orticaria, prurito; reazione di tipo anafilattoide, broncospasmo, edema laringeo fino al collasso cardiorespiratorio da shock anafilattico.

Patologie del sistema nervoso

Manifestazioni di eccitazione o di depressione associate a vertigini, capogiri, sonnolenza, sensazione di testa leggera, parestesia, ipotonia (neonati), difficoltà di parola, tinnito, tremori seguiti da modificazioni dello stato di coscienza, convulsioni, trisma, contrazione muscolare, atassia, perdita di memoria, nistagmo e coma.

Disturbi psichiatrici

Ansia, disorientamento, confusione mentale, agitazione, nervosismo, euforia, allucinazioni e psicosi.

Patologie cardiache

Tachicardia, bradicardia, aritmie, depressione miocardica fino all'arresto cardiaco. In caso di grave disfunzione miocardica si può verificare un aggravamento della insufficienza cardiaca.

Patologie dell'occhio

Midriasi, turbe della visione.

Patologie gastrointestinali

Nausea, vomito.

Patologie respiratorie, toraciche e mediastiniche

Tachipnea, dispnea, broncodilatazione, arresto respiratorio.

Patologie della cute e del tessuto sottocutaneo

Sudorazione.

Patologie vascolari

Vasodilatazione, ipotensione, ipertensione.

Patologie del sistema emolinfopoietico

Metaemoglobinemia

Patologie sistemiche e condizioni relative alla sede di somministrazione

Aumento del metabolismo e della temperatura corporea.

Segnalazione delle reazioni avverse sospette

La segnalazione delle reazioni avverse sospette che si verificano dopo l'autorizzazione del medicinale è importante, in quanto permette un monitoraggio continuo del rapporto beneficio/rischio del medicinale. Agli operatori sanitari è richiesto di segnalare qualsiasi reazione avversa sospetta

4.9 Sovradosaggio

Le emergenze con l'uso degli anestetici locali sono generalmente da mettere in relazione con alti livelli plasmatici determinati da accidentale iniezione endovenosa. Per i sintomi vedere Paragrafo 4.8.

Trattamento

Al primo segno di allarme occorre interrompere la somministrazione, porre il paziente in posizione orizzontale ed assicurarne la pervietà delle vie aeree, somministrandogli ossigeno in caso di dispnea grave o effettuando la ventilazione artificiale.

L'uso di analettici bulbari deve essere evitato per non aggravare la situazione aumentando il consumo di ossigeno. Eventuali convulsioni possono essere controllate con l'uso di diazepam in dose di 10-20 mg per via endovenosa. Sono sconsigliabili invece i barbiturici, che possono accentuare la depressione bulbare.

Il circolo può essere sostenuto con la somministrazione di cortisonici in dosi appropriate per via endovenosa; possono aggiungersi soluzioni diluite di alfabetamolo stimolanti ad azione vasocostrittiva (mefentermina, metaraminolo ed altri) o di atropina solfato. Come antiacidoso può essere impiegato il sodio bicarbonato in concentrazioni opportune, per via endovenosa.

5. PROPRIETÀ FARMACOLOGICHE

5.1 Proprietà farmacodinamiche

Categoria farmacoterapeutica: anestetici locali - codice ATC: N01BB02.

La lidocaina è un anestetico di tipo amidico. Le sue proprietà sono determinate dall'inibizione dei flussi ionici responsabili della generazione dell'impulso a livello delle membrane neuronali.

L'insorgenza dell'azione anestetica è rapida. La durata dell'effetto anestetico dipende dal punto di iniezione e dalla concentrazione.

Categoria farmacoterapeutica: antiaritmici, classe 1B - codice ATC: C01BB01

La lidocaina è un agente antiaritmico di classe 1 B. La lidocaina diminuisce l'automaticità, riducendo la velocità di depolarizzazione diastolica di fase 4 sulle fibre del Purkinje e alterando la soglia di eccitabilità. La durata del potenziale d'azione e il periodo refrattario delle fibre del Purkinje sono diminuiti. In genere, la durata dell'intervallo PR, QRS e QT non è influenzata dalla lidocaina.

5.2 Proprietà farmacocinetiche

La lidocaina viene velocemente metabolizzata dal fegato ed i suoi metaboliti o la sostanza tal quale vengono escreti dal rene.

La sua biotrasformazione include la N-dealchilazione N-ossidativa, la idrossilazione dell'anello, la rottura del legame amidico e coniugazione. La N-dealchilazione, il più importante processo di biotrasformazione, genera i metaboliti monoetilglicenxilidide e glicinexilidide. L'attività farmacologica e tossicologica di questi metaboliti è simile, ma meno potente, a quella della lidocaina. Il 90% circa della lidocaina somministrata viene eliminata nella forma dei suoi diversi metaboliti e meno del 10% nella forma immodificata.

Il metabolita principale nelle urine è una coniugazione del 4-idrossi-2,6-dimetilanilina.

Il legame plasmatico della lidocaina dipende dalla concentrazione del farmaco, e la frazione legata diminuisce aumentando la concentrazione.

A concentrazioni di 1,4 mg di base libera per ml, il 60-80% della lidocaina è legato alle proteine plasmatiche.

Tale legame dipende anche dalla concentrazione plasmatica di alfa-1glicoproteina acida.

La lidocaina attraversa la barriera ematoencefalica e placentare, probabilmente per diffusione passiva.

Studi sul metabolismo della lidocaina a seguito di iniezione endovenosa, hanno dimostrato che l'emivita del farmaco è costante e cioè di 1.5-2.0 ore.

Siccome la lidocaina viene velocemente metabolizzata, qualsiasi patologia epatica può modificare la cinetica della sostanza; la sua emivita, infatti, può raddoppiarsi in pazienti con disfunzioni epatiche.

Le patologie renali non influenzano l'emivita della lidocaina ma possono comportare un accumulo dei suoi metaboliti.

5.3 Dati preclinici di sicurezza

DL₅₀ - s.c.-topo = 278 mg/kg; i.v.-topo: 27 mg/kg; i.p.-ratto: 167 mg/kg; s.c.ratto=469 mg/kg.

L'aggiunta di adrenalina non modifica la tossicità della lidocaina.

Tossicità sub-acuta nel ratto (4 settimane di trattamento): dosaggi: 5-15-40 mg/kg/die per via i.m. di lidocaina cloridrato al 2% con o senza adrenalina; 100 mg x 30 minuti per via inalatoria di lidocaina base al 10%. Nessun effetto tossico apprezzabile, tranne con il dosaggio più alto (40 mg/kg) di lidocaina per il quale si è osservato un precoce scadimento delle condizioni generali, comparsa di eccitazione e, occasionalmente, di convulsioni. Nessun effetto tossico con la formulazione spray.

Tossicità cronica nel ratto (6 mesi): somministrazione per via i.m. di lidocaina cloridrato al 2% al dosaggio di 5-10-20 mg/kg 1 volta al dì, 5 volte la settimana. Lo studio ha dimostrato che nel ratto il trattamento per 6 mesi è ben tollerato: solo la dose più alta (20 mg/kg) provoca un aumento di peso delle surrenali associato ad un'iperplasia della corticale.

Tossicità nel cane (16 settimane): la somministrazione per via i.m. di lidocaina cloridrato al 2% a dosaggi di 5 e 10 mg/kg/die non ha evidenziato alcun effetto tossico.

Tossicità fetale: studi sperimentali nell'animale hanno dimostrato che la lidocaina non ha effetti negativi sui processi riproduttivi e non presenta attività teratogena.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Elenco degli eccipienti

Sodio cloruro, acqua per preparazioni iniettabili, q.b.

6.2 Incompatibilità

Lidocaina è incompatibile con Amfotericina, metexitone sodico, sulfadiazina sodica, mefentermina cloridrato, alcali, metalli pesanti, agenti ossidanti, tannino, aria e luce.

6.3 Periodo di validità

3 anni a confezionamento integro.

Il medicinale deve essere utilizzato subito dopo l'apertura del contenitore; dopo l'uso, il contenitore (e l'eventuale medicinale residuo) deve essere eliminato, anche se parzialmente utilizzato.

6.4 Precauzioni particolari per la conservazione

Conservare nella confezione originale per riparare il medicinale dalla luce. Non sono richieste particolari condizioni di conservazione in relazione alla temperatura. Non congelare.

6.5 Natura e contenuto del contenitore

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 10 mg/ml soluzione iniettabile.
Fiala di vetro da 5 e 10 ml.

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 20 mg/ml soluzione iniettabile.
Fiala di vetro da 5 e 10 ml. Flacone di vetro da 50 ml.

6.6 Precauzioni particolari per lo smaltimento e la manipolazione

Il medicinale non utilizzato e i rifiuti derivati da tale medicinale devono essere smaltiti in conformità alla normativa locale vigente.

7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

S.A.L.F. S.p.A. Laboratorio Farmacologico - Via Marconi, 2 - Cenate Sotto (BG) - Tel. 035 - 940097

8. NUMERO(I) DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 10 mg/ml soluzione iniettabile.
5 fiale da 5 ml AIC 031973050
5 fiale da 10 ml AIC 031973086

Lidocaina cloridrato S.A.L.F. 20 mg/ml soluzione iniettabile.
5 fiale da 5 ml AIC 031973100
5 fiale da 10 ml AIC 031973035
4 flaconcini da 50 ml AIC 031973148

9. DATA DELLA PRIMA AUTORIZZAZIONE/RINNOVO DELL'AUTORIZZAZIONE

08 novembre 1993 / 05 Maggio 2008

10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO

Determinazione AIFA del