

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

Bupicain®

2,5 mg/ml soluzione iniettabile

5 mg/ml soluzione iniettabile

10 mg/ml soluzione iniettabile iperbarica

ATC: N01BB01

bupivacaina cloridrato

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

Bupicain®	2,5 mg/ml	5 mg/ml	10 mg/ml
1 ml contiene:			
- Principi attivi: -			
bupivacaina cloridrato	mg 2,5	mg 5,0	mg
10,0			

3. FORMA FARMACEUTICA

Soluzione iniettabile.

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

Bupicain® si può utilizzare in ogni tipo di anestesia periferica:

- infiltrazione locale;
- blocco endovenoso retrogrado e blocco endoarterioso
- tronculare;
- loco-regionale;
- peridurale sacrale;
- blocco simpatico;
- spinale sottoaracnoidea.

Bupicain® è quindi indicato in tutti gli interventi di chirurgia generale, ortopedia, oculistica, otorinolaringoiatria, stomatologia, ostetricia-ginecologia, dermatologia, impiegato sia da solo sia in associazione a narcosi.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

Bupicain® è solitamente usato in dosaggi minimi, variabili secondo le indicazioni, da 2-3 mg a 100-150 mg, come indicato a titolo orientativo nella tabella.

Tipo di anestesia	Concentrazione (mg)	Dosaggio		Osservazioni
		ml	mg	
Blocco trigemino	2,5	1-5	2,5-12,5	La dose è per ogni spazio intercostale
Blocco ascellare	5	0,5-4	2,5-20	
	2,5	20-40	50-100	
Blocco ganglio stellato	5	10-30	50-150	
	2,5	10-20	25-50	
Blocco intercostale	2,5	4-8	10-20	
	5	3-5	15-25	
Peridurale	2,5	30-40	75-100	
	5	10-20	50-100	
Peridurale continua	2,5	si inizia con 10 ml poi 3-5-8 ml ogni 4-6 ore, a seconda dei segmenti che si desidera anestetizzare e dell'età del paziente		
	5			
Sacrale	2,5	15-40	37,5-100	
	5	15-20	75-100	
Blocco splancnico	2,5	10-40	25-100	
Blocco simpatico lombare	2,5	10-40	25-100	
Blocco e.v. retrogrado	5	15-25	75-125	
Blocco pelvico	5	20-30	100-150	
Spinale	5	4	20	
subaracnoidea	10	2	20	

Il dosaggio massimo per un adulto e per singola somministrazione non dovrebbe superare i 150 mg, corrispondenti a 30 ml della soluzione alla concentrazione di 5 mg/ml ed a 60 ml della soluzione alla concentrazione di 2,5 mg/ml; più in generale la dose di sicurezza, sia per adulti sia per bambini, che è consigliabile non superare, è di 2 mg/kg per singola somministrazione. Nella terapia antalgica protratta si impiegano solitamente dosi variabili da 0,25 a 1 mg/kg di peso corporeo; la somministrazione può essere ripetuta 2-3 volte nelle 24 ore.

4.3 Controindicazioni

Ipersensibilità verso i componenti o sostanze strettamente correlate dal punto di vista chimico, in particolare verso gli anestetici locali dello stesso gruppo. Gravidanza accertata o presunta. Sono stati riportati casi di arresto cardiaco a seguito dell'uso di bupivacaina per anestesia epidurale in partorienti; nella maggiore parte dei casi ciò è avvenuto all'uso della soluzione allo 0,75%. Pertanto l'uso di bupivacaina allo 0,75% va evitato nell'anestesia peridurale in ostetricia. Tale concentrazione va riservata a quelle procedure chirurgiche in cui siano necessarie un alto grado di rilassamento muscolare e ed un effetto prolungato. Il prodotto è controindicato di massima nei cardiopatici, nelle gravi arteriopatie, negli ipertesi, nei soggetti con manifestazioni ischemiche di qualsiasi tipo o emicrania essenziale, nei neuropatici, negli ipertiroidi. Il prodotto è assolutamente controindicato nel blocco paracervicale e nell'anestesia intravenosa regionale (Bier Block).

4.4 Speciali avvertenze e precauzioni d'uso

Il prodotto deve essere usato con assoluta cautela in soggetti in corso di trattamento con farmaci IMAO o antidepressivi triciclici.

E' necessario avere la disponibilità immediata dell'equipaggiamento, dei farmaci e del personale idonei al trattamento di emergenza, poiché in casi rari sono stati

riferiti, a seguito dell'uso di anestetici locali, reazioni gravi, talora ad esito infausto, anche in assenza di ipersensibilità individuale nell'anamnesi.

Attenzione: le fiale non contengono eccipienti parasettici, vanno utilizzate per una sola somministrazione. Eventuali rimanenze andranno scartate.

La posologia totale deve essere corretta in relazione alle condizioni generali, all'età ed ai dati anamnestici di rilievo del paziente. Il peso specifico di Bupicain® 2,5 mg/ml e 5 mg/ml è di 1,006 a 20° C e di 0,997 a 37 °C. Quello di Bupicain® 10 mg/ml, iperbarica è, rispettivamente di 1,045 e 1,035. Qualora si praticino infiltrazioni per anestesia locale in zone sprovviste di possibilità di circolo collaterale (dita, radice del pene, ecc.) è norma cautelativa usare l'anestetico senza vasocostrittore per evitare necrosi ischemica. Prima dell'uso il medico deve accertarsi dello stato delle condizioni circolatorie dei soggetti da trattare. 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. E' consigliabile usare un'adeguata dose-test possibilmente in associazione con adrenalina, al fine di evitare tempestivamente un'accidentale iniezione endovenosa o intratecale. 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. Il paziente deve essere mantenuto sotto accurato controllo sospendendo immediatamente la somministrazione al primo segno di allarme (p.e. modificazioni del sensorio).

4.5 Interazioni con altri medicinali e altre forme di interazione

Non sono note eventuali interazioni con altri farmaci. Occorre però usare cautela nei soggetti trattati con farmaci IMAO o antidepressivi triciclici (vedere avvertenze speciali).

4.6 Gravidanza e allattamento.

Non impiegare il farmaco in stato di gravidanza accertato o presunto.

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

Alle dosi consigliate il farmaco non influenza significativamente e per lungo tempo le capacità di reazione.

4.8 Effetti indesiderati

Si possono avere reazioni tossiche e reazioni allergiche. Fra le prime vengono riferiti fenomeni di stimolazione nervosa centrale con eccitazione, tremori, disorientamento, vertigine, midriasi, aumento del metabolismo e della temperatura corporea e, per dosi molto elevate, trisma e convulsioni; se è interessato il midollo allungato, si ha compartecipazione dei centri cardiovascolare, respiratorio ed emetico con sudorazione, aritmie, ipertensione, tachipnea, broncodilatazione, nausea e vomito. Effetti di tipo periferico possono interessare l'apparato cardiovascolare con bradicardia e vasodilatazione. Le reazioni allergiche si verificano per lo più in soggetti ipersensibili, ma vengono riferiti molti casi con assenza di ipersensibilità individuale all'anamnesi. Le manifestazioni a carattere locale comprendono eruzioni cutanee di tipo vario, orticaria, prurito; quelle a carattere generale broncospasmo, edema laringeo fino al collasso cardiorespiratorio da shock anafilattico.

4.9 Sovradosaggio

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 (pallone di Ambu). 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 dosi 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 alfa-beta stimolanti ad azione vasocostrittrice (mefentermina, metaraminolo ed altri) o di solfato di atropina. Come antiacidifico può essere impiegato il bicarbonato di sodio in concentrazione mirata, per via endovenosa.

5. PROPRIETÀ FARMACOLOGICHE

5.1 Proprietà farmacodinamiche

Bupicain® è un anestetico locale, di tipo amidico, a lunga durata d'azione. Ricerche sperimentali condotte nel topo, nella cavia e nel coniglio hanno dimostrato la maggior potenza analgesica e durata d'azione della bupivacaina rispetto agli altri anestetici locali. L'anestesia indotta da Bupicain® dura, a seconda delle condizioni di impiego, da 4 a 20 ore. Al termine dell'anestesia vera e propria perdura a lungo una diminuzione della sensibilità dolorifica che consente di ridurre sensibilmente nelle 24 ore successive la somministrazione di analgesici.

5.2 Proprietà farmacocinetiche

Il picco ematico della bupivacaina dipende da vari fattori: tipo di blocco, concentrazione della soluzione, presenza o assenza di adrenalina. Impiegata senza vasocostrittore a dosi di 125-150 mg, le massime concentrazioni (0,64 µg/ml) nel sangue intero venoso si ottengono a 15-30 minuti dal blocco peridurale e caudale. Nel sangue arterioso prelievi simultanei danno concentrazioni mediamente più elevate del 20-40%. La bupivacaina si distribuisce nei fluidi e nei tessuti dell'organismo e la sua emivita plasmatica è di oltre 2 ore. Metabolizzata a livello epatico, la bupivacaina è escreta prevalentemente per via renale, sia come tale che sotto forma di metabolita.

5.3 Proprietà tossicologiche

La tossicità acuta è stata studiata nel topo, nella cavia e nel coniglio. La DL₅₀ della bupivacaina è pari a 7,8 mg/kg per e.v. e 82 mg/kg per s.c. nel topo, mentre nella cavia è di 50 mg/kg per i.p.. Nel preparato con vasocostrittore (adrenalina 1:200.000) la DL₅₀ è pari a 2,1 mg/kg per e.v. e 95 mg/kg per s.c. nel topo, mentre nel coniglio è di 50 mg/kg per s.c.. La somministrazione prolungata nel ratto per 4 settimane di 12 mg/kg per s.c. di bupivacaina e di 10 mg/kg per s.c. di bupivacaina + adrenalina non ha provocato manifestazioni patologiche a carico dei vari organi né calo ponderale. Nessuna differenza significativa rispetto ai controlli si è avuta nei ratti trattati per 90 giorni con 10 mg/kg per s.c. di bupivacaina. Nessun danno a livello materno e fetale è stato osservato in ratti e conigli trattati per tutto il periodo della gestazione con 15 mg/kg /die s.c. di bupivacaina.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Lista degli eccipienti

Bupicain® 2,5 mg/ml e 5 mg/ml: sodio cloruro, acqua per preparazioni iniettabili.

Bupicain® 10 mg/ml iperbarica: glucosio monoidrato, acqua per preparazioni iniettabili.

6.2 Incompatibilità

Nessuna nota

6.3 Validità

La validità del prodotto a confezionamento integro in tutte le sue presentazioni è di:

- 60 mesi per Bupicain® 2,5 mg/ml e 5 mg/ml;
- 48 mesi per Bupicain® 10 mg/ml iperbarica.

6.4 Speciali precauzioni per la conservazione

Nessuna.

6.5 Natura e capacità del contenitore

Fiala in vetro neutro da ml 2 - 5 - 10.

7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

MONICO S.p.A. - Via Ponte di Pietra 7 - VENEZIA/MESTRE.

8. NUMERO DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

Bupicain® 2,5 mg/ml	10 fiale 5 ml	A.I.C.: 034485 021
Bupicain® 2,5 mg/ml	10 fiale 10 ml	A.I.C.: 034485 045
Bupicain® 5 mg/ml	10 fiale 5 ml	A.I.C.: 034485 060
Bupicain® 5 mg/ml	10 fiale 10 ml	A.I.C.: 034485 084
Bupicain® 10 mg/ml, iperbarica	10 fiale 2 ml	A.I.C.: 034485 108

9. DATA DI PRIMA AUTORIZZAZIONE DELL'AUTORIZZAZIONE

8/7/2000

10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO

8/7/2005.

Agenzia Italiana del Farmaco