

Riassunto delle caratteristiche del prodotto

Agenzia Italiana del Farmaco

1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

LIDOCAINA CLORIDRATO AGENZIA INDUSTRIE DIFESA 10 mg/ml soluzione iniettabile

2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

1 ml di soluzione iniettabile contiene:

Principio attivo: Lidocaina cloridrato 10 mg (equivalente a 8,6 mg di lidocaina base)

Per gli eccipienti, vedere 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICA

Soluzione iniettabile per infiltrazione

4. INFORMAZIONI CLINICHE

4.1 Indicazioni terapeutiche

Anestesi periferiche e loco-regionali.

4.2 Posologia e modo di somministrazione

La dose massima consigliata è di 200 mg di lidocaina cloridrato (pari a 20 ml di una soluzione da 10 mg/ml).

La posologia deve essere opportunamente ridotta nei bambini, negli anziani e nei pazienti debilitati.

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

4.3 Controindicazioni

Ipersensibilità al principio attivo (vedere 4.4) o ad uno qualsiasi degli eccipienti.

La lidocaina è inoltre controindicata in pazienti con una storia nota di ipersensibilità verso gli anestetici locali di tipo amidico.

Sindrome di Adam-Stokes, Sindrome di Wolff-Parkinson-White, nonché gradi severi di blocco senoatriale, atrio-ventricolare o intraventricolare.

Soggetti affetti da porfiria.

Antecedenti di ipertermia maligna.

Epilettici in trattamento non controllato.

4.4 Avvertenze speciali e opportune precauzioni d'impiego

L'uso di lidocaina per infiltrazione richiede sempre l'immediata disponibilità di un idoneo equipaggiamento dei farmaci e del personale idonei al trattamento di emergenza, poiché sono stati riportati, sia pure raramente, casi di reazioni gravi e talora con esito infausto, dopo impiego di anestetici locali, anche in assenza di ipersensibilità.

La sicurezza d'impiego della Lidocaina dipende da un opportuno dosaggio, da una corretta tecnica di utilizzazione e dall'adozione di misure precauzionali.

Nei pazienti sottoposti a blocco maggiore o che ricevono dosi elevate di farmaco deve essere inserito, prima della somministrazione dell'anestetico locale, un catetere endovenoso. Il medico deve avere effettuato un training completo e adeguato sul tipo di tecnica da utilizzare e deve essere esperto nella diagnosi e trattamento di effetti indesiderati, tossicità sistemica o altre complicanze (vedere paragrafi 4.8 e 4.9).

Il prodotto deve essere pertanto usato al dosaggio minimo efficace, che deve essere determinato tenendo conto dell'età e dello stato fisico dei pazienti come nei bambini, negli anziani e negli ammalati in forma acuta.

Usare massima cautela in pazienti con affezioni cardiovascolari e specialmente in caso di shock, di turbe della conduzione atrioventricolare o di bradicardia sinusale.

In corso di anestesia locale la soluzione deve essere iniettata lentamente e con frequenti aspirazioni; l'iniezione di dosi ripetute di lidocaina può determinare significativi aumenti del suo tasso plasmatico

dovuto all'accumulo della sostanza o dei suoi metaboliti. La sonnolenza rappresenta il primo segno di elevato tasso plasmatico che si può verificare anche in caso di assorbimento troppo rapido o di accidentale iniezione endovenosa.

Le metodiche di anestesia loco-regionale debbono essere eseguite con prudenza quando il tessuto o la regione scelta per l'iniezione presentano segni di infezione o di infiammazione. Particolari cautele devono essere necessariamente adottate a seconda delle regioni interessate. L'anestesia epidurale, subaracnoidea o caudale deve essere eseguita con estrema attenzione nei bambini e nei portatori di malattie neurologiche, di deformità spinali, di stati settici o di ipertensione. Occorre usare cautela nei soggetti trattati con farmaci IMAO o antidepressivi triciclici.

Sebbene l'anestesia regionale sia frequentemente un'ottima tecnica anestetica, alcuni pazienti richiedono un'attenzione particolare al fine di ridurre il rischio di pericolosi effetti indesiderati:

- pazienti anziani o in condizioni generali precarie,
- pazienti con blocco cardiaco parziale o completo in quanto gli anestetici locali possono deprimere la conduzione cardiaca (vedere paragrafo 4.3),
- pazienti con patologie epatiche in stadio avanzato o gravi alterazioni della funzionalità renale,
- pazienti in trattamento con farmaci antiaritmici di classe III (ad es. amiodarone) devono essere sottoposti a stretta sorveglianza e va considerata l'opportunità del monitoraggio ECG in quanto gli effetti a livello cardiaco possono essere additivi (vedere paragrafo 4.5),
- pazienti con porfiria acuta. Lidocaina cloridrato soluzione iniettabile è probabilmente porfirinogenica e nei pazienti con porfiria acuta deve essere prescritta esclusivamente nei casi in cui è marcatamente o urgentemente indicata. Appropriate precauzioni devono essere adottate per l'uso di Lidocaina cloridrato in tutti i pazienti con porfiria (vedere paragrafo 4.3),

Nell'infanzia il prodotto deve essere usato solo in caso di necessità e sotto il diretto controllo del medico.

Alcune tecniche di anestesia locale possono essere associate a reazioni avverse severe, indipendentemente dall'anestetico locale utilizzato, quali:

Blocco nervoso centrale che può provocare depressione cardiovascolare specialmente in presenza di ipovolemia, l'anestesia epidurale deve essere utilizzata con cautela in pazienti con ridotta funzionalità cardiovascolare;

Iniezioni retro bulbari: possono, in casi molto rari, raggiungere lo spazio subaracnoideo cerebrale provocando cecità temporanea, collasso cardiovascolare specialmente in presenza di ipovolemia,

Iniezioni retro e peribulbari di anestetici locali comportano un basso rischio di disfunzione muscolare persistente a livello oculare. Cause primarie includono traumi e/o effetti tossici locali a carico di muscoli e/o nervi. La gravità di tali reazioni a carico dei tessuti è correlata all'entità del trauma, alla concentrazione di anestetico locale e alla durata di esposizione tissutale all'anestetico locale. Come per tutti gli anestetici locali, è quindi necessario usare le dosi e le concentrazioni più basse che possano consentire di ottenere l'effetto ricercato. I vasocostrittori possono aggravare le reazioni a carico dei tessuti e devono essere utilizzati solamente se indicati;

Iniezioni intraarteriose accidentali nella regione cranica e cervicale possono provocare gravi sintomi anche a basse dosi;

Il blocco paracervicale può talvolta provocare bradicardia/tachicardia fetale. È quindi necessario un attento monitoraggio della frequenza cardiaca fetale.

4.5 Interazioni con altri medicinali ed altre forme d'interazione

Lidocaina deve essere usata con cautela nei pazienti in trattamento con altri anestetici locali o sostanze strutturalmente correlate agli anestetici locali di tipo amidico, ad esempio certi antiaritmici come mexiletina e tocainide in quanto gli effetti tossici sistemici sono additivi. Si consiglia cautela nei pazienti trattati con antiaritmici di classe III (ad es. amiodarone) nonostante l'assenza di studi specifici di interazione con tale classe di farmaci (vedere paragrafo 4.4).

Occorre usare assoluta cautela nei soggetti in trattamento con farmaci IMAO o antidepressivi triciclici (vedere paragrafo 4.4).

Le seguenti interazioni sono state riportate con l'uso della lidocaina:

Betabloccanti: il propranololo aumenta il rischio di tossicità della lidocaina

Farmaci anti-ulcera peptica: la cimetidina inibisce il metabolismo della lidocaina con aumento della concentrazione plasmatica e conseguente aumento del rischio di tossicità

Diuretici: l'effetto della lidocaina viene antagonizzato dall'ipopotassiemia causata da acetazolamide, diuretici dell'ansa e tiazidi

Antibatterici: aumento del rischio di aritmie ventricolari con quinupristin+dalfopristin (evitare l'uso concomitante)

Antivirali - Inibitori delle proteasi: amprenavir e atazanavir possono aumentare la concentrazione plasmatica della lidocaina con conseguente aumento del rischio di tossicità (evitare l'uso concomitante)

Miorilassanti: la lidocaina aumenta e prolunga l'effetto del suxametonio.

La somministrazione di lidocaina in pazienti sotto trattamento con digitalici può aumentare il rischio di bradicardia e di disturbi della conduzione atrio-ventricolare.

4.6 Gravidanza ed allattamento

Gravidanza

L'anestesia paracervicale può essere seguita da bradicardia e da acidosi fetale. Altri possibili rischi sono rappresentati da insufficienza utero-placentare e da alterazioni comportamentali del neonato.

Pertanto, in gravidanza il prodotto deve essere usato solo in caso di effettiva necessità.

Allattamento

La lidocaina, anche se in piccole quantità, viene escreta nel latte materno.

Durante l'allattamento il prodotto deve essere usato solo in caso di effettiva necessità.

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

Alle dosi consigliate il farmaco non influenza significativamente e per lungo tempo la capacità di attenzione.

Gli anestetici locali, oltre all'effetto anestetico diretto, possono avere un effetto molto lieve sulla funzione mentale e sulla coordinazione, anche in assenza di evidente tossicità del sistema nervoso centrale e possono temporaneamente influire in modo negativo sulla locomozione e sul grado di vigilanza.

4.8 Effetti indesiderati

Generali

Generalmente gli effetti indesiderati da lidocaina sono dovuti ad ipersensibilità oppure ad un elevato tasso plasmatico per eccessivo dosaggio, rapido assorbimento o iniezione intravasale accidentale.

I seguenti effetti indesiderati sono stati riportati con l'uso di lidocaina:

Disordini del sistema immunitario: le reazioni di ipersensibilità (edemi, orticaria, prurito fino allo shock anafilattico) sono state riportate raramente.

Disordini del sistema nervoso centrale: cefalea, vertigini, sonnolenza, turbe della visione, ansietà, iperacusia, tinnito, disartria, euforia, parestesie, tremori seguiti da modificazioni dello stato di coscienza, convulsioni ed arresto respiratorio.

Disordini dell'apparato cardiovascolare: bradicardia, ipotensione, depressione miocardica fino all'arresto cardiaco.

Disturbi vascolari: ipotensione, ipertensione

Disturbi gastrointestinali: nausea, vomito

Disturbi respiratori: depressione respiratoria

Tossicità sistemica acuta

Le reazioni sistemiche tossiche coinvolgono primariamente il sistema nervoso centrale (SNC) e il sistema cardiovascolare (SCV). Queste reazioni sono causate da un'alta concentrazione ematica di anestetico locale che può essere provocata da un'iniezione intravascolare accidentale, da sovradosaggio o da un assorbimento eccezionalmente rapido da un'area molto vascolarizzata (vedere punto 4.9) I segni di tossicità del sistema nervoso centrale generalmente precedono gli effetti tossici cardiovascolari, tranne nei casi in cui il paziente sia stato sottoposto ad anestesia generale o sia stato profondamente sedato con farmaci quali benzodiazepine o barbiturici.

La sonnolenza può essere la prima manifestazione di tossicità di un livello elevato nel sangue del farmaco e può verificarsi in conseguenza di un rapido assorbimento.

La tossicità a carico del sistema nervoso centrale si manifesta gradualmente, con sintomi e segni di gravità crescente. I primi sintomi sono parestesia nella regione circumorale, insensibilità della lingua, sensazione di testa vuota, iperacusia, tinnito e disturbi visivi. Disartria, contrazioni e tremori muscolari sono manifestazioni più gravi e precedono l'instaurarsi di convulsioni generalizzate. Questi segni non devono essere confusi con comportamenti eretistici. Possono seguire incoscienza e crisi convulsive che possono durare da alcuni secondi a parecchi minuti. Dopo le convulsioni, a causa dell'aumentata attività muscolare, di una interferenza con la normale respirazione e della mancata pervietà delle vie aeree, si manifestano rapidamente ipossia e ipercapnia. Nei casi gravi si può manifestare apnea. Acidosi iperkalémica, l'ipocalcemia e l'ipossia aumentano ed estendono gli effetti tossici degli anestetici locali.

Il ritorno del paziente alle condizioni cliniche iniziali è conseguente alla redistribuzione dell'anestetico locale dal sistema nervoso centrale e al metabolismo ed escrezione. Il recupero può essere rapido se non sono state somministrate grandi quantità di farmaco.

Nei casi gravi si possono manifestare effetti tossici a carico del sistema cardiovascolare che sono generalmente preceduti da segni di tossicità del sistema nervoso centrale.

Trattamento della tossicità acuta

La somministrazione dell'anestetico locale deve essere sospesa immediatamente se compaiono segni di tossicità sistemica acuta ed i sintomi del sistema nervoso centrale (convulsioni, depressione del sistema nervoso centrale) devono essere prontamente trattati con appropriati supporti della ventilazione/respirazione e con la somministrazione di anticonvulsivanti.

Se dovesse manifestarsi un arresto circolatorio, deve essere effettuata immediatamente la rianimazione cardiopolmonare. È di vitale importanza garantire una ottimale ossigenazione, la ventilazione, supportare la circolazione e trattare l'acidosi.

4.9 Sovradosaggio

Sintomatologia:

I sintomi dovuti a sovradosaggio del farmaco sono caratterizzati da:

- manifestazioni neuroeccitatorie con tremori, convulsioni, seguite da depressione; insufficienza respiratoria e coma
- alterazioni cardiovascolari con ipotensione e bradicardia

Trattamento

E' essenzialmente sintomatico

Al primo segno di allarme, occorre interrompere la somministrazione, porre il paziente in posizione orizzontale ed assicurargli la pervietà delle vie aeree.

In caso di grave dispnea si consiglia di somministrare ossigeno o, se necessario, di effettuare la ventilazione assistita.

Eventuali convulsioni possono essere controllate con l'uso di benzodiazepine (e.g. diazepam) o, se le condizioni circolatorie lo consentono, con la somministrazione endovenosa di barbiturici a breve durata d'azione (e.g. tiopentale).

Il trattamento della depressione circolatoria, prevede la somministrazione endovenosa di liquidi e, se necessario, l'impiego di farmaci ad azione vasocostrittrice (e.g. efedrina, metaraminolo etc).

5. PROPRIETÀ FARMACOLOGICHE

5.1 Proprietà farmacodinamiche

Categoria farmacoterapeutica: Anestetici locali, codice ATC: N01BB02.

La lidocaina è un anestetico locale di tipo amidico, con un breve periodo di latenza ed una buona attività anestetica profonda e di superficie. Bloccando il passaggio di ioni attraverso la membrana cellulare, impedisce la trasmissione dell'impulso nervoso.

5.2 Proprietà farmacocinetiche

Distribuzione

La lidocaina, impiegata in vari tipi di blocco, raggiunge il picco mediamente entro 15 minuti dalla somministrazione. Il farmaco si distribuisce nei fluidi e nei tessuti dell'organismo ed ha un'emivita di circa 2 ore. Il legame con le proteine plasmatiche dipende dalla concentrazione plasmatica del farmaco ed è circa del 70%.

La lidocaina attraversa la barriera emato-encefalica e la placenta per diffusione passiva.

Metabolismo ed escrezione

Il metabolismo della lidocaina è prevalentemente epatico: meno del 10% di una dose viene escreto immodificato nelle urine, il restante 90% viene escreto in forma di metaboliti. L'escrezione urinaria della lidocaina è aumentata dall'acidificazione delle urine.

La lidocaina è escreta nel latte materno e il rapporto latte materno: plasma è 0,4.

5.3 Dati preclinici di sicurezza

I dati preclinici rivelano assenza di rischi per gli esseri umani sulla base di studi convenzionali di farmacologia di sicurezza, e di tossicità riproduttiva.

6. INFORMAZIONI FARMACEUTICHE

6.1 Elenco degli eccipienti

Sodio Cloruro, Acqua per preparazioni iniettabili.

6.2 Incompatibilità

Non pertinente.

6.3 Periodo di validità

2 anni

6.4 Precauzioni particolari per la conservazione

Questo medicinale non richiede alcuna particolare condizione di conservazione.

6.5 Natura e contenuto del contenitore

Fiale di vetro giallo da 5 ml tipo I (Ph. Eur.).

Confezione da 10 fiale.

6.6 Istruzioni per l'impiego e la manipolazione

Nessuna istruzione particolare.

Il prodotto non utilizzato ed i rifiuti derivati da tale medicinale devono essere smaltiti in conformità ai requisiti di legge locali.

7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO

Agenzia Industrie Difesa - Stabilimento Chimico Farmaceutico Militare
Via XX Settembre, 123/A
00187 Roma

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

AIC n. 036455018

9. DATA DELLA PRIMA AUTORIZZAZIONE/ RINNOVO DELL' AUTORIZZAZIONE

13/12/2005 (data prima autorizzazione)

10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO

Determinazione AIFA del 7/11/2011

Agenzia Italiana del Farmaco