

## RIASSUNTO DELLE CARATTERISTICHE DEL PRODOTTO

### 1. DENOMINAZIONE DEL MEDICINALE

Lidocaina cloridrato INTES 40 mg/ml collirio, soluzione

### 2. COMPOSIZIONE QUALITATIVA E QUANTITATIVA

1 ml di soluzione contiene:

Principio attivo: Lidocaina cloridrato 40 mg

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

### 3. FORMA FARMACEUTICA

Collirio, soluzione.

### 4. INFORMAZIONI CLINICHE

#### 4.1 Indicazioni terapeutiche

Anestesia oculare locale per interventi di cataratta.

Anestesia della superficie oculare (estrazione di corpi estranei o medicazioni dolorose).

Anestesia della superficie oculare in tonometria.

#### 4.2 Posologia e modo di somministrazione

*Adulti e adolescenti (da 12 a 18 anni)*

*Anestesia oculare locale per interventi di cataratta*

Una - due gocce ogni 2 minuti da ripetere fino a 5 volte.

*Anestesia della superficie oculare*

Una - due gocce.

*Anestesia della superficie oculare in tonometria*

Una - due gocce.

La dose può essere aumentata a giudizio dello specialista.

#### 4.3 Controindicazioni

Ipersensibilità al principio attivo o agli anestetici locali di tipo amidico.

Gravidanza e allattamento.

Bambini fino a 12 anni di età.

#### 4.4 Avvertenze speciali e precauzioni di impiego

Il medicinale è per esclusivo uso oftalmico.

È 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 all'anamnesi.

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.

È 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).

L'uso ripetuto ed incontrollato di anestetici nell'occhio, può provocare lesioni della cornea con conseguente riduzione della vista.

Occorre particolare cautela nella somministrazione del medicinale in soggetti con funzionalità epatica e cardiocircolatoria alterata.

Durante il periodo dell'anestesia, l'occhio non deve essere toccato e deve essere protetto dalla polvere e da eventuali contaminazioni batteriche.

Come per tutti gli anestetici locali, il medicinale deve essere somministrato solo dal medico, unicamente al momento dell'intervento.

#### **4.5 Interazioni con altri medicinali ed altre forme di interazione**

La cimetidina e i beta-bloccanti (come il propanololo) rallentano il catabolismo epatico degli anestetici locali; i digitalici aumentano il rischio di bradicardia e di disturbi della conduzione auricolo-vestibolare.

Lidocaina cloridrato INTES non va utilizzata insieme con sulfadiazina sodica e metoexitone sodico.

#### **4.6 Fertilità, gravidanza e allattamento**

Il medicinale è controindicato nei casi di gravidanza accertata o presunta.

#### **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. 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.

##### *Patologie dell'occhio*

Sensazione di bruciore, dolore, iperemia congiuntivale.

##### *Disturbi del sistema immunitario*

In seguito alla somministrazione di anestetici locali di tipo amidico (procaina, tetracaina, benzocaina, ecc.) sono raramente riportate reazioni allergiche (e nei casi più gravi shock anafilattico).

La Lidocaina collirio quando somministrata nelle modalità previste viene assorbita solo in piccole quantità con minimi effetti sistemici. Di seguito vengono comunque elencate le reazioni avverse dovute a un effetto sistemico del medicinale.

##### *Patologie del sistema nervoso*

Manifestazioni di eccitazione o di depressione associate a vertigini, sonnolenza, turbe della visione, ansietà, tremori seguiti da modificazioni dello stato di coscienza, convulsioni ed arresto respiratorio.

##### *Patologie cardiache*

Bradicardia, ipotensione, depressione miocardica fino all'arresto cardiaco.

##### **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 tramite l'Agenzia Italiana del Farmaco all'indirizzo

## 4.9 Sovradosaggio

A causa del raggiungimento di elevati livelli sistemici, dovuti a rapido assorbimento o a sovradosaggio, la lidocaina cloridrato può causare effetti tossici acuti.

I sintomi di sovradosaggio sono caratterizzati da manifestazioni neuroeccitatorie (tremori, convulsioni seguite da depressione, insufficienza respiratoria e coma) e da alterazioni cardiovascolari con ipotensione e bradicardia.

Il trattamento è sintomatico. 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.

## 5. PROPRIETA' FARMACOLOGICHE

### 5.1 Proprietà farmacodinamiche

Categoria farmacoterapeutica: oftalmologici, anestetici locali – codice ATC: S01HA07

La lidocaina influenza l'azione anestetica locale stabilizzando la membrana neuronale e inibendo il flusso ionico necessario per l'inizio e la conduzione degli impulsi. L'effetto anestetico si manifesta entro 1-2 minuti dall'instillazione del farmaco e perdura per 15-20 minuti nei tessuti morbidi.

### 5.2 Proprietà farmacocinetiche

La lidocaina quando instillata nell'occhio può essere assorbita a livello sistemico, la velocità e il grado di assorbimento dipende dalla durata dell'esposizione, dalla concentrazione e dose totale instillata.

La lidocaina viene velocemente metabolizzata dal fegato e i suoi metaboliti o la sostanza tal quale vengono escreti dal rene. La sua biotrasformazione include la N-dealchilazione N-ossidativa, la idrolizzazione dell'anello, la rottura del legame aminico e coniugazione.

La N-dealchilazione, il più importante processo di biotrasformazione, genera i metaboliti monoetilglicinxilidide e glicinxilidide.

L'attività farmacologia 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.

Il 65% del farmaco è legato alle proteine plasmatiche (tra queste la  $\alpha$ 1-glicoproteina acida (AAG)); questo valore tende ad aumentare in caso di neoplasia e di uremia.

Tale legame dipende anche dalla concentrazione plasmatica dell' $\alpha$ 1-glicoproteina acidica.

La lidocaina attraversa la barriera emato-encefalica 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.

Il 90% di una dose parenterale viene dealchilato a livello epatico con formazione di monoetilglicinxilidide (MEGX) e di glicinxilidide (GX), entrambi farmacologicamente attivi. L'emivita dei due metaboliti è più lunga rispetto a quella della lidocaina. MEGX e GX tendono ad accumularsi, soprattutto dopo infusioni prolungate e in caso di insufficienza renale, causando tossicità a livello del SNC. Ulteriori processi metabolici prevedono una idrolisi della glicinxilidide con formazione di 2,6-xilidina e una 5-idrossilazione dell'anello benzenico della lidocaina e della monoetilglicinxilidide. I metaboliti vengono escreti nelle urine insieme a circa il 10% di farmaco immodificato. La lidocaina attraversa con facilità la barriera ematoencefalica e la placenta. L'anestetico si ritrova nel latte materno.

Siccome la lidocaina viene velocemente metabolizzata, qualsiasi patologia epatica può modificare la cinetica della sostanza; la sua emivita, infatti, può raddoppiarsi nei 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

DL<sub>50</sub> - 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 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 idrossido, acqua depurata.

### 6.2 Incompatibilità

La Lidocaina è incompatibile con amfotericina, sulfadiazina sodica, cefazolina sodica, fenitoina sodica, mefentermina cloridrato, alcali, metalli pesanti, agenti ossidanti, tannino, aria e luce.

### 6.3 Periodo di validità

36 mesi

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

Non conservare a temperatura superiore ai 25°C.

Conservare nel contenitore originale per riparare il medicinale dalla luce.

### 6.5 Natura e contenuto del contenitore

100 contenitori monodose in polietilene da 0,5 ml cadauno e un foglio illustrativo per astuccio.

### 6.6 Precauzioni particolari per lo smaltimento

Nessuna precauzione in particolare.

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

**7. TITOLARE DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO**

ALFA INTES Industria Terapeutica Splendore S.r.l. - Via F.lli Bandiera, 26 - 80026 Casoria (NA)

**8. NUMERO DELL'AUTORIZZAZIONE ALL'IMMISSIONE IN COMMERCIO**

030977 058

**9. DATA DELLA PRIMA AUTORIZZAZIONE/RINNOVO DELL'AUTORIZZAZIONE**

Dicembre 1999 – Dicembre 2008

**10. DATA DI REVISIONE DEL TESTO**

MM/AAAA

Agenzia Italiana del Farmaco