

REZUMATUL CARACTERISTICILOR PRODUSULUI

1.DENUMIREA COMERCIALĂ A MEDICAMENTULUI

Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă.

2.COMPOZIȚIA CALITATIVĂ ȘI CANTITATIVĂ

Un mililitru soluție injectabilă conține lidocaină clorhidrat 10 mg.

Pentru lista tuturor excipienților, vezi pct. 6.1.

3.FORMA FARMACEUTICĂ

Soluție injectabilă.

Soluție limpede, incoloră sau aproape incoloră.

4.DATE CLINICE

4.1.Indicații terapeutice

Lidocaina este utilizată ca anestezic de suprafață, de conducție și de infiltrație în intervenții chirurgicale, obstetricale, de medicină internă și intervenții dentare.

Solvent pentru dizolvarea diverselor pulberi pentru soluții injectabile.

4.2.Doze și mod de administrare

Se va alege doza și concentrația minimă eficace:

-*Anestezia de suprafață:*

Infiltrație percutană: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, doza totală cuprinsă între 5-300 mg (0,5-30 ml)

- *Anestezie tronculară:*

Blocajul plexului brahial: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 200-400 mg (20-40 ml);

Segment intercostal: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 30 mg (3 ml);

Paracervical (bilateral):, 100 mg (10 ml); nu se va repeta la un interval mai mic de 90 de minute;

Paravertebral: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 30-50 mg (3-5 ml);

Pudendal (bilateral): Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 100 mg (10 ml);

- *Blocajul nervilor simpatici:*

Blocaj cervical: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 50 mg (5 ml);

Blocaj lombar: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 50-100 mg (5-10 ml);

- *Anestezie epidurală:*

Lombar: analgezie - Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 250-300 mg (25-30 ml);

Toracic: Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 200-300 mg (20-30 ml);

Caudal: analgezie obstetricală - Lidocaină clorhidrat 10 mg/ml soluție injectabilă, 200-300 mg (20-30 ml);

În cazul anesteziei epidurale continue, dozele maxime nu se vor repeta la un interval mai mic de 90 de minute;

Doza maximă admisă: 4,5 mg/kg corp sau 300 mg la adulți și 4,5 mg/kg corp la copii. Pentru copii se recomandă un regim de dozaj mai redus și o soluție mai diluată (5 mg/ml-10 mg/ml), corespunzător vârstei lor.

Doza maximă de 300 mg pentru adulți corespunde volumelor următoare:

Lidocaină HCl	Doze maxime
5mg/ml	60 ml
10 mg/ml	30 ml
20 mg/ml	15 ml



Nu se va injecta lidocaină în zonele cu infecție.

Este indicată utilizarea de ace cu lungime adecvată.

Se vor respecta principiile generale ale anesteziei loco-regionale: aspirația prealabilă după puncție, injectare lentă, controlul parametrilor vitali.

4.3. Contraindicații

Hipersensibilitate cunoscută sau presupusă la lidocaină, la alte anestezice locale de tip amidă sau la oricare dintre excipienții medicamentului. Insuficiență hepatică și renală; miastenien; șoc hipovolemic; insuficiență cardiacă; hipotensiune arterială; blocuri cardiace; bradicardie; antecedente de hipertermie malignă.

4.4. Atenționări și precauții speciale pentru utilizare

Lidocaina 10 mg/ml trebuie utilizată imediat după deschiderea ambalajului.

Se recomandă injectarea lentă, cu aspirație frecventă, pentru a se evita administrarea intravasculară rapidă accidentală, care poate fi urmată de reacții toxice. La copii, vârstnici, pacienți tratați cu afecțiuni cardiace, hepatice sau cu antecedente convulsive se vor reduce dozele de lidocaina.

Administrarea de lidocaină în cursul tratamentului digitalic impune multă prudență, din cauza riscului de bradicardie și tulburări de conducere atrioventriculară.

La pacienții aflați sub tratament cu propranolol, se vor evita dozele mari de lidocaină, deoarece metabolizarea hepatică a acesteia poate fi redusă, riscul toxicității fiind mai mare. În cazul anesteziei epidurale se recomandă inițial administrarea unei doze test de 3-5 ml lidocaină, preferabil asociată cu adrenalina, deoarece injectarea intravasculară a adrenalinei poate fi recunoscută după creșterea de scurtă durată a ritmului cardiac.

În cazul apariției semnelor de toxicitate, chiar minore, administrarea lidocainei trebuie întreruptă. Dacă este necesară existența unui blocaj prelungit, de exemplu în cazul unei administrări repetate, se va lua în considerare riscul atingerii unui nivel toxic sau riscul de a se provoca leziuni locale ale nervilor.

Anumite forme de anestezice locale pot provoca următoarele efecte grave: blocarea centrală a nervilor care poate determina deprimare cardiovasculară, în special în condițiile unei hipovolemii. Anestezia epidurală se vor aplica cu prudență pacienților care suferă de afecțiuni cardiovasculare.

Injectările la nivelul extremității cefalice aplicate accidental într-o arteră provoacă simptome cerebrale chiar în cazul unor doze reduse de lidocaină.

Pacienții tratați cu antiaritmice de clasă III (de exemplu, amiodarona) necesită supraveghere suplimentară EKG.

Anestezia epidurală poate provoca hipotensiune sau bradicardie. Pentru a reduce riscul acestor complicații este indicată o expansiune volemică cu soluții cristaloide sau coloidale, ori injectarea unui vasoconstrictor de tipul efedrinei.

Pacienții cu miastenia gravis sunt mai sensibili la acțiunea anestezicelor locale. De aceea este indicată prudență în administrarea lidocainei acestor pacienți.

4.5. Interacțiuni cu alte medicamente și alte forme de interacțiune

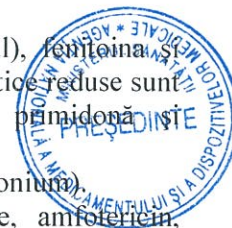
Administrarea concomitentă de beta-blocante, de tipul propranolol, metoprolol sau nadolol crește concentrația plasmatică de lidocaină.

Cimetidina (antagonist al receptorilor H₂) poate crește până la 50% concentrația plasmatică a lidocainei.

Concentrații plasmatice ridicate sunt observate în egală măsură și în cazul administrării concomitente cu: amiodarona, chinidina, diltiazemul, eritromicina, fluconazolul, fluvoxamina, itraconazolul, ketoconazolul, nifedipina, roxitromicina, acidul valproic și verapamilul.

Medicamentele inductoare enzimatic de tipul barbituricelor (mai ales fenobarbitalul), fenitoina și benzodiazepinele accelerează degradarea lidocainei. De asemenea, concentrații plasmatice reduse sunt determinate de administrarea simultană de aminoglutetimide, carbamazepină, primidonă și rifampicină.

Pe de altă parte, lidocaina accentuează efectul medicamentelor miorelaxante (suxamethonium). Lidocaina este incompatibilă în soluție de bicarbonat de sodiu, soluții alcaline, amfetamină, trometamol.



4.6.Fertilitatea, sarcina și alăptarea

Lidocaina traversează bariera placentară, dar până în prezent nu există date care să evidențieze afectarea imediată sau tardivă a fătului. Studii controlate la femei gravide nu sunt disponibile. În aceste condiții, acest medicament nu se va administra în timpul sarcinii, în special în primul trimestru, decât dacă este absolut necesar.

În cazul administrării anesteziei în vederea realizării unui blocaj anestezic paracervical poate apărea bradicardie la făt.

Lidocaina este excretată în laptele matern în cantități foarte mici în urma administrării dozelor terapeutice, astfel încât se consideră că în general nu este afectat copilul. Totuși trebuie avută în vedere posibilitatea apariției unei reacții alergice la sugar.

4.7.Efecte asupra capacității de a conduce vehicule sau de a folosi utilaje

În cazul administrării de lidocaină ca și anestezie locală, în funcție de doză, acesta poate afecta concentrarea și coordonarea, asociat unei capacități motorii diminuate tranzitoriu.

Se recomandă prudență în conducerea vehiculelor sau folosirea utilajelor dacă pacientul a primit lidocaină, datorită posibilității apariției reacțiilor adverse neurologice.

4.8.Reacții adverse

Profilul de siguranță al lidocainei este comparabil cu al oricărui alt anestezie locală cu legătură amidică. Reacțiile adverse produse pot fi clasificate în funcție de frecvența apariției lor, astfel: foarte frecvente ($>1/10$), frecvente ($>1/100$, $<1/10$), mai puțin frecvente ($>1/1000$, $<1/100$), rare ($>1/10000$, $<1/1000$), foarte rare ($<1/10000$), incluzând cazuri izolate.

Tulburări ale sistemului imunitar:

-rare: reacții alergice, reacții anafilactice, șoc anafilactic.

Tulburări ale sistemului nervos

-frecvente: parestezie, vertij.

-mai puțin frecvente: semne și simptome de toxicitate la nivelul SNC (convulsii, parestezie periorală, lipsa sensibilității la nivelul limbii, hiperacuzie, tulburări vizuale, tremurături, acufene, dizartrie, deprimare SNC)

-rare: neuropatie, leziuni ale nervilor periferici, arahnoidită.

Tulburări oculare:

-rare: diplopie

Tulburări cardiace:

-frecvente: bradicardie

-rare: stop cardiac, aritmii cardiace.

Tulburări vasculare:

-frecvente: hipotensiune arterială, hipertensiune arterială

Tulburări respiratorii, toracice și mediastinale:

-rare: deprimare respiratorie

Tulburări gastro-intestinale

-frecvente: greață, vărsături.

4.9.Supradozaj

În cazul unei injectări intravasculare accidentale de lidocaină, efectul toxic se face simțit în 1-3 minute.

În caz de supradozaj, concentrația plasmatică maximă este atinsă în 20-30 de minute, în funcție de locul de injectare. Reacțiile toxice apar în special la nivelul sistemului nervos central și al sistemului cardiovascular.

Toxicitatea la nivelul sistemului nervos central:

Se manifestă pe etaje succesive, iar simptomele și semnele cresc în intensitate. Primele semne sunt: parestezie periorală, anestezie la nivelul limbii, ușoară confuzie, hiperacuzie și acufene. Tulburările vizuale și fasciculațiile musculare sunt mai grave și preced apariția convulsiilor generalizate. Aceste semne nu trebuie confundate cu comportamentul neurotic. Ele pot fi urmate de pierderea cunoștinței, precum și de apariția unei crize de grand mal care poate dura de la câteva secunde, la câteva minute. Urmează rapid hipoxie și hipercapnie, apoi crampe datorită creșterii activității musculare. În unele cazuri poate apărea apnee. Acidoza accentuează efectul toxic al anestezicului local.

Restabilirea se face prin redistribuirea anestezicului local la nivelul sistemului nervos central și prin metabolizare. Însănătoșirea poate fi rapidă dacă cantitatea de lidocaină injectată nu este prea mare.

Toxicitatea la nivelul cardio-vascular:

În cazuri grave pot apărea efecte la nivelul sistemului cardiovascular: hipotensiune arterială, bradicardie, aritmie, chiar stop cardiac. Acestea pot apărea ca o consecință a existenței unei concentrații sistemice crescute de lidocaină.

Efectele toxice cardiovasculare sunt în general precedate de semne de toxicitate la nivelul sistemului nervos central, chiar dacă pacientul se află sub anestezie generală sau sub sedative puternice de tipul benzodiazepinelor sau barbituricelor.

Tratamentul toxicității acute:

În cazul în care apar semne de toxicitate sistemică acută, injectarea de anestezic local trebuie întreruptă imediat.

Dacă apar convulsii trebuie instituit tratament adecvat, care constă în: menținerea funcției respiratorii, întreruperea convulsiilor, susținerea circulației. Administrarea de oxigen este indispensabilă. Dacă crampele nu dispar în 15-20 de secunde este necesară injectarea unui miorelaxant i.v. Tiopentalul, în doze de 100-150 mg i.v. suprimă rapid convulsiile. Se mai poate administra diazepam. 5-10 mg, i.v., chiar dacă efectul este mai lent.

Dacă deprimarea cardiovasculară este evidentă (hipotensiune arterială, bradicardie), este indicată administrarea de 5-10 mg de efedrină i.v., administrare care se va repeta, dacă este nevoie, după 2-3 minute.

În caz de colaps circulator, este neapărat necesară reanimarea cardio-pulmonară: oxigenoterapie, ventilație, susținere circulatorie și tratamentul acidozei, deoarece acidoza accentuează toxicitatea sistemică a lidocainei. Se va administra rapid adrenalină (0,1-0,2 mg i.v.), și în mod repetat, dacă este necesar.

5.PROPRIETĂȚI FARMACOLOGICE

5.1.Proprietăți farmacodinamice

Grupa farmacoterapeutică: anestezice locale, amide. Cod ATC: N01BB02.

Mecanism de acțiune:

Lidocaina este un anestezic local de tip amidă care exercită un blocaj reversibil al conducției nervoase de-a lungul fibrelor nervoase prin inhibarea influxului de ioni de sodiu la nivelul membranei celulare a fibrelor nervoase. La nivel cardiac, lidocaina scade durata potențialului de acțiune tot prin blocarea canalelor de sodiu. Perioada refractară efectivă este astfel scurtată.

5.2.Proprietăți farmacocinetice

Absorbția:

Absorbția lidocainei din sânge depinde de locul de injectare și de vascularizarea acestuia, precum și de administrarea eventuală a vreunui vasoconstrictor.

Distribuția:

După injectare, lidocaina se distribuie rapid în țesuturi. Lidocaina se distribuie mai întâi în țesuturile puternic vascularizate, apoi în cele mai puțin vascularizate.

Lidocaina absorbită se leagă de proteinele plasmatice în proporție de 65%. Acest procent crește în caz de neoplazii sau de uremie, fiind urmată de creșterea concentrațiilor glicoproteinelor. Volumul de distribuție este de 91 l.

Lidocaina traversează bariera hemato-encefalică. Ea trece în laptele matern prin difuziune pasivă, dar în cantități mici.

Metabolizare:

80% din lidocaina absorbită este metabolizată în ficat, iar 3% se regăsește sub formă neschimbată în urină. Nu există nici un circuit entero-hepatic. Ambii metaboliți prezintă acțiune antiaritmică (10%-83% din activitatea lidocainei).

Eliminare:

Timpul de înjumătățire prin eliminare al lidocainei este de 1,6 ore. Este prelungit în caz de: insuficiență renală (2-3 ore), insuficiență cardiacă (3-8 ore) și în caz de insuficiență hepatică (3-19 ore).

Cinetica anumitor grupe de pacienți:

În cazul unor pacienți cu insuficiență renală sau hepatică se va ține cont de faptul că timpul de înjumătățire prin eliminare al lidocainei este prelungit.

5.3.Date preclinice de siguranță

Anumite studii au demonstrat la șobolani un efect mutagen al 2,6-xilidinei, un metabolit al lidocainei. Nu există însă nici o evidență conform căreia lidocaina, prin ea însăși, ar avea efecte mutagene. În cursul unui studiu de carcinogenicitate la șobolani expuși transplacental și post natal la doze mari de 2,6-xilidină timp de 2 ani, s-a observat apariția de tumori atât benigne, cât și maligne. Importanța acestei observații pentru specia umană nu a fost încă elucidată. În consecință, nu este indicată utilizarea de lidocaină în doze mari și timp îndelungat.

6.PROPRIETĂȚI FARMACEUTICE

6.1.Lista excipienților

Apă pentru preparate injectabile.

6.2.Incompatibilități

Lidocaina este incompatibilă în soluție de bicarbonat de sodiu, soluții alcaline, amfotericin, trometamol.

6.3.Perioada de valabilitate

5 ani.

6.4.Precauții speciale pentru păstrare

A se păstra la temperaturi sub 25 °C, în ambalajul original.

6.5.Natura și conținutul ambalajului

- Cutie cu 5 fiole din sticlă incoloră a câte 2 ml soluție injectabilă.
- Cutie cu 5 fiole din sticlă incoloră a câte 3,5 ml soluție injectabilă.
- Cutie cu 10 fiole din sticlă incoloră a câte 2 ml soluție injectabilă.
- Cutie cu 10 fiole din sticlă incoloră a câte 3,5 ml soluție injectabilă.
- Cutie cu 348 fiole din sticlă incoloră a câte 3,5 ml soluție injectabilă.
- Cutie cu 670 fiole din sticlă incoloră a câte 2 ml soluție injectabilă.



6.6.Precauții speciale pentru eliminarea reziduurilor

Nu este cazul.



7.DEȚINĂTORUL AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

Nume și adresă Antibiotice SA
Str. Valea Lupului Nr.1, Iași, România
Telefon: +40(232) 220 040
Fax: +40(232) 211 020
E-mail: regulatoryaffairs@antibiotice.ro

8.NUMĂRUL AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

1050/2008/01-02-03-04-05-06

9.DATA PRIMEI AUTORIZĂRI SAU A REÎNNOIRII AUTORIZAȚIEI

Autorizare-Septembrie 2008

10.DATA REVIZUIRII TEXTULUI

Octombrie 2011.