

RESUMO DAS CARACTERÍSTICAS DO MEDICAMENTO

1. NOME DO MEDICAMENTO

Lidonostrum Bomba-Spray 10%.

2. COMPOSIÇÃO QUALITATIVA E QUANTITATIVA

1 dose de Lidonostrum Bomba-Spray 10% contém 10 mg de lidocaína base.

Lista completa de excipientes, ver secção 6.1.

Este medicamento contém 24,1 mg de etanol por dose o que é equivalente a 241 mg/ml. Pode causar sensação de queimadura na pele danificada.

O aroma a banana de Lidonostrum Bomba-Spray 10% contém propilenoglicol que pode causar irritação na pele.

3. FORMA FARMACÊUTICA

O Lidonostrum Bomba-Spray 10% é um líquido claro, ligeiramente corado, com odor a etanol, mentol e banana. A substância ativa é dissolvida numa mistura de água, etanol e polietilenoglicol 400.

4. INFORMAÇÕES CLÍNICAS

4.1. Indicações terapêuticas

- Procedimentos nasais, por exemplo punção do seio maxilar;
- Procedimentos orais e dentais por exemplo anteriores à injeção;
- Procedimentos na orofaringe por exemplo endoscopia gastrointestinal;
- Procedimentos no trato respiratório, por exemplo inserção de instrumentos e tubos;
- Procedimentos na laringe, traqueia e brônquios;
- Procedimentos em obstetrícia e ginecologia, por exemplo parto vaginal, sutura de ruturas nas mucosas e biópsias cervicais.

4.2. Posologia e modo de administração

O Lidonostrum Bomba-Spray 10% destina-se a ser usado nas membranas mucosas e proporciona anestesia superficial eficaz durante aproximadamente 10 a 15 minutos. A ação anestésica normalmente tem início em 1 a 3 minutos dependendo do local de aplicação.

Como com qualquer anestésico local, a segurança e eficácia da lidocaína dependem do uso das doses e técnicas corretas, precauções adequadas e prontidão para a resolução de emergências.

As recomendações de dosagem que se seguem devem ser consideradas como uma orientação, sendo a experiência do clínico e o conhecimento do estado geral do doente fundamentais para a determinação da dose.

Cada pulverização aplica 10 mg de Lidocaína. Não é necessário secar o local antes da aplicação.

Área	Dose recomendada (mg)	Dose máxima para intervenções curtas ¹⁾ (mg)	Dose máxima para intervenções prolongadas ²⁾ (mg)
Intervenções nasais, p.ex. punção do seio maxilar	20-60	500	600
Intervenções orais e dentais, p.ex. antes da injeção.	20-200	500	600
Intervenções na orofaringe, p.ex. endoscopia gastrointestinal.	20-200	500	600
Intervenções no trato respiratório, p.ex. inserção de instrumentos e tubos.	50-400	400	600
Intervenções na laringe, traqueia e brônquios.	50-200	200 ³⁾	400
Intervenções em obstetrícia, p.ex. parto vaginal, suturas das mucosas e biópsias cervicais.	50-200	400	

¹⁾ Para intervenções pouco demoradas o fármaco é administrado para menos de 1 minuto

²⁾ Para intervenções prolongadas a duração da aplicação é superior a 5 minutos.

³⁾ Durante ventilação controlada a dose deve ser reduzida.

Uma vez que a absorção é variável e especialmente elevada na traqueia e brônquios (consultar os capítulos 4.8. Efeitos indesejáveis e 5.2. Propriedades Farmacocinéticas) as doses máximas recomendadas variam dependendo do local de aplicação.

População pediátrica

Nas crianças as doses não devem exceder os 3 mg/kg para uso laringotraqueal e os 4-5 mg/kg para uso nasal, oral e orofaríngeo.

Em recém-nascidos e bebés são recomendadas soluções de lidocaína menos concentradas.

4.3. Contraindicações

Hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida, à substância ativa ou a qualquer um dos excipientes mencionados na seção 6.1.

4.4. Advertências e precauções especiais de utilização

A dosagem excessiva ou curtos intervalos entre as doses podem originar níveis plasmáticos elevados e graves efeitos adversos. A absorção a partir das membranas mucosas é variável sendo particularmente elevada ao nível da árvore brônquica. Tais aplicações podem portanto resultar em rápidas elevações dos níveis plasmáticos ou em concentrações plasmáticas excessivas, com um risco aumentado de surgirem sintomas tóxicos como as convulsões. A lidocaína spray deve ser usada com precaução em doentes com feridas ou traumatismos nas mucosas no local de aplicação. Uma mucosa lesada vai permitir uma maior absorção sistémica. Perante reacções adversas graves podem ser necessários equipamento e fármacos para reanimação, incluindo oxigénio. (Consultar o capítulo 4.9. Sobredosagem).

Em doentes sob anestesia geral podem ser atingidas concentrações séricas superiores às que ocorrem em doentes com respiração espontânea, uma vez que os doentes acordados podem deglutir uma proporção significativa da solução que é significativamente metabolizada na "primeira passagem" hepática.

O uso de anestésicos tópicos na orofaringe pode interferir com a deglutição, aumentando o perigo de aspiração. A anestesia da língua e da mucosa oral podem aumentar o risco de traumatismo por mordedura.

Se a dose administrada for suscetível de originar níveis séricos elevados, alguns doentes requerem cuidados especiais de forma a prevenir o aparecimento de efeitos secundários potencialmente perigosos:

- Doentes com doença cardiovascular ou deficiência cardíaca.
- Doentes com bloqueio cardíaco parcial ou total.
- Doentes idosos ou em mau estado geral.
- Doentes com baixa capacidade de ligação proteica ou síndrome nefrótica.
- Doentes com doença hepática avançada.

Evitar o contacto com os olhos.

4.5. Interações medicamentosas e outras formas de interação

A lidocaína deverá ser usada com precaução em doentes recebendo outros anestésicos locais ou agentes estruturalmente relacionados com anestésicos locais do tipo amida, uma vez que os efeitos tóxicos são aditivos.

4.6. Fertilidade, gravidez e aleitamento

Gravidez

É razoável assumir que a lidocaína tenha sido usada num largo número de mulheres grávidas ou potencialmente grávidas. Não foram, até agora, registados distúrbios específicos no processo reprodutivo, como por exemplo aumento da incidência de malformações no feto.

Amamentação

Como os outros anestésicos locais a lidocaína é excretada no leite materno mas em quantidades tão pequenas que geralmente não há risco de afetar o lactente.

4.7. Efeitos sobre a capacidade de conduzir e a utilizar de máquinas

Dependendo da dose os anestésicos locais podem ter um efeito muito ligeiro na função mental e podem temporariamente alterar a locomoção e a coordenação.

4.8. Efeitos indesejáveis

- Reações locais

Encontram-se descritos casos de irritação no local de aplicação. No caso de aplicação na mucosa da laringe antes de intubação endotraqueal, encontram-se descritos sintomas reversíveis como "garganta inflamada", "rouquidão" e "perda de voz". A utilização de Lidonostrum Bomba-Spray 10% proporciona anestesia superficial durante os procedimentos endotraqueais mas não previne a irritabilidade pós intubação.

- Reações alérgicas

As reações alérgicas (nos casos mais graves choque anafilático) aos anestésicos locais do tipo amida são raras.

- Toxicidade sistémica aguda

A lidocaína pode causar efeitos tóxicos agudos se ocorrerem elevados níveis sistémicos devido a absorção rápida, por exemplo por aplicação em áreas situadas abaixo das cordas vocais ou por sobredosagem (consultar os capítulos 5. Propriedades farmacológicas e 4.9. Sobredosagem).

Notificação de suspeitas de reações adversas

A notificação de suspeitas de reações adversas após a autorização do medicamento é importante, uma vez que permite uma monitorização contínua da relação benefício-risco do medicamento. Pede-se aos profissionais de saúde que notifiquem quaisquer suspeitas de reações adversas diretamente ao INFARMED, I.P.:

INFARMED, I.P.

Sítio da internet: <http://www.infarmed.pt/web/infarmed/submissaoram>
(preferencialmente)

ou através dos seguintes contactos:

Direção de Gestão do Risco de Medicamentos

Parque da Saúde de Lisboa, Av. Brasil 53

1749-004 Lisboa

Tel: +351 21 798 73 73

Linha do Medicamento: 800222444 (gratuita)

e-mail: farmacovigilancia@infarmed.pt

4.9. Sobredosagem

Toxicidade sistémica aguda

As reações tóxicas são principalmente originadas no sistema nervoso central e sistema cardiovascular.

A toxicidade ao nível do SNC é uma resposta graduada com sintomas e sinais de gravidade crescente. Os primeiros sintomas são a parestesia perioral, dormência da língua, tonturas ligeiras, hiperacúsia e acufenos. Perturbações visuais e tremores musculares são complicações mais graves e que precedem o início de convulsões generalizadas. Podem suceder-se perda de consciência e convulsões do tipo grande mal que podem durar de alguns segundos a vários minutos. A hipoxia e a hipercapnia

surgem rapidamente após as convulsões devido a um aumento da atividade muscular paralelamente com interferência na respiração normal. Nos casos mais graves pode surgir apneia. A acidose aumenta os efeitos tóxicos dos anestésicos locais.

A recuperação é devida à redistribuição e metabolismo do anestésico local a partir do sistema nervoso central. A recuperação pode ser rápida a menos que tenham sido administradas grandes quantidades do fármaco.

Os efeitos cardiovasculares surgem apenas em casos em que se atingem elevadas concentrações sistêmicas. Nesses casos podem ocorrer hipotensão severa, bradicardia, arritmia e colapso cardiovascular.

Estes efeitos tóxicos cardiovasculares são normalmente precedidos por sinais de toxicidade do SNC, exceto no caso do doente estar sob anestesia geral ou fortemente sedado, por exemplo com benzodiazepinas ou barbitúricos.

Tratamento da toxicidade aguda:

Se ocorrerem convulsões é necessário tratamento urgente. Todos os fármacos e equipamento deverão estar disponíveis de imediato. Os objetivos do tratamento são manter a oxigenação, parar as convulsões e suporte circulatório. Deve administrar-se oxigénio e proceder a ventilação assistida, se necessário.

Se as convulsões não pararem espontaneamente em 15-30 segundos deve ser administrado um anticonvulsivante, como por exemplo 100-150 mg de tiopentona i.v.. Alternativamente podem ser administrados 5-10 mg de diazepam i.v. embora tenha uma ação mais lenta. O suxametónio interrompe também rapidamente as convulsões, mas requer intubação traqueal e ventilação artificial pelo que deverá somente ser usado por pessoal experiente nestas técnicas.

Se ocorrer depressão cardiovascular (hipotensão, bradicardia), deverão ser administrados 5-10 mg de efedrina i.v., e repetir, se necessário, após 2-3 minutos.

Se ocorrer paragem circulatória deverá ser imediatamente efetuada a reanimação cardiopulmonar. Para além de uma oxigenação e ventilação adequadas e um suporte circulatório, o tratamento da acidose é de vital importância, uma vez que a hipoxia e acidose aumentam a toxicidade sistémica dos anestésicos locais. A adrenalina (0,1-0,2 mg intravenosa ou intracardiaca) deverá ser administrada tão rapidamente quanto possível e repetida se necessário.

Às crianças devem ser administradas doses adaptadas ao seu peso e idade.

5. PROPRIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propriedades farmacodinâmicas

Grupo farmacoterapêutico: 13.8.2 - Anestésicos locais e antipruriginosos
Código ATC: D04AB01 - lidocaine

Efeitos farmacodinâmicos

O Lidonostum Bomba-Spray 10% destina-se a ser usado nas membranas mucosas e proporciona uma anestesia tópica eficaz, com uma duração de aproximadamente 10 a 15 minutos. A anestesia surge geralmente após 1-3 minutos, dependendo do local de aplicação.

A anestesia local é definida como uma perda de sensação numa determinada área localizada do organismo.

Mecanismo de ação

Todos os anestésicos locais possuem um mecanismo de ação comum bloqueando a propagação dos impulsos ao longo das fibras nervosas. Os impulsos nervosos são transmitidos por rápidas e sucessivas despolarizações e repolarizações nos axónios. Estas alterações na polaridade são devidas à passagem dos iões sódio e potássio através da membrana das células nervosas, pelos canais iónicos da membrana. Os anestésicos locais impedem o fluxo de iões sódio para dentro da célula, inibindo a despolarização e, conseqüentemente, a propagação dos impulsos nervosos ao longo das fibras. O mecanismo de ação dos anestésicos locais não se encontra completamente esclarecido mas uma explicação possível é que a forma básica lipossolúvel se difunda através da membrana lipídica para dentro da célula. Uma vez dentro da célula uma parte do fármaco ioniza-se novamente e entra no canal de sódio para exercer um efeito inibitório no influxo de sódio e conseqüentemente na condução do impulso.

5.2. Propriedades farmacocinéticas

Absorção

A lidocaína é absorvida após aplicação tópica nas membranas mucosas, sendo a sua taxa e extensão de absorção dependentes da concentração e da dose total administrada, do local da aplicação e da duração da exposição. Em geral a taxa de absorção de um anestésico local é maior após administração intratraqueal ou bronquial. Tais aplicações podem portanto resultar num rápido aumento das concentrações plasmáticas ou em concentrações plasmáticas excessivas, com um aumento do risco de surgirem sintomas tóxicos como as convulsões. A lidocaína é igualmente bem absorvida a partir do trato gastrointestinal, embora, após administração oral, as concentrações em circulação sejam baixas devido à biotransformação que sofre ao nível do fígado.

Distribuição

A ligação da lidocaína às proteínas plasmáticas é, normalmente, da ordem dos 64%. Os anestésicos locais do tipo amida encontram-se principalmente ligados à glicoproteína alfa-1-ácido mas também à albumina. A glicoproteína tem elevada afinidade mas poucos locais de ligação enquanto a albumina tem menor afinidade mas elevada capacidade de ligação.

A lidocaína atravessa a barreira hematoencefálica e placentária, possivelmente por difusão passiva.

Eliminação

A lidocaína é eliminada fundamentalmente por metabolização hepática, sendo a principal via de metabolismo, em humanos, a N-desalquilação em monoetilglicina xilidida (MEGX) seguida de hidrólise a 2,6-xilidina e hidroxilação a 4-hidroxi-2,6-xilidina. A MEGX pode ainda ser N-desalquilada a glicina xilidida (GX). As ações farmacológicas/toxicológicas da MEGX e GX são semelhantes mas menos potentes que as da lidocaína. A GX tem um maior tempo de semivida (cerca de 10 horas) que a lidocaína e pode acumular-se por administração prolongada. Aproximadamente 90% da lidocaína administrada é excretada na forma de vários metabolitos e menos de 10% é excretada inalterada através da urina. O principal metabolito na urina é um

conjugado da 4-hidroxi-2,6-xilidina, contribuindo para cerca de 70 a 80% da dose excretada na urina.

O tempo de semivida da lidocaína após injeção intravenosa é geralmente de 1,5 a 2 horas. Devido à elevada taxa à qual a lidocaína é metabolizada, qualquer condição que afete a função hepática pode alterar a sua cinética. A semivida pode ser prolongada para duas ou mais vezes em doentes com disfunções hepáticas. A disfunção renal não afeta a cinética da lidocaína mas pode aumentar a acumulação de metabolitos.

Fatores como a acidose e a utilização de estimulantes ou depressores do SNC afetam os níveis de lidocaína necessários para produzir efeitos sistêmicos evidentes. Manifestações adversas objetivas tornam-se crescentemente aparentes com o aumento dos níveis plasmáticos de 5 a 10 mg/L.

5.3 Dados de segurança pré-clínica

Os dados não clínicos não revelam riscos especiais para o ser humano, segundo os estudos convencionais de farmacologia de segurança, toxicidade de dose repetida, genotoxicidade, potencial carcinogénico, toxicidade reprodutiva e desenvolvimento.

6. INFORMAÇÕES FARMACÊUTICAS

6.1. Lista dos excipientes

- Etanol;
- Polietilenoglicol 400;
- Essência de banana;
- Mentol;
- Sacarina;
- Água purificada.

6.2. Incompatibilidades

Não aplicável.

6.3. Prazo de validade

36 meses.

6.4. Precauções especiais de conservação

Conservar a temperatura inferior a 25° C. Durante o armazenamento a temperaturas inferiores a 8° C pode ocorrer a formação de precipitados os quais se dissolvem quando a solução é reaquecida à temperatura ambiente.

6.5. Natureza e conteúdo do recipiente

O Lidonostrum Bomba-Spray 10% encontra-se acondicionado em frascos de vidro com um doseador em bomba spray. A embalagem inclui um aplicador em plástico.

É possível que não sejam comercializadas todas as apresentações.

6.6. Precauções especiais de eliminação e manuseamento

O aplicador não deve ser encurtado senão a função de spray é destruída. Se for necessário limpar o aplicador este pode ser completamente submerso em água fervente durante 5 minutos. Pode também ser autoclavado (20 minutos a 120° C).

Os produtos não utilizados ou os resíduos devem ser eliminados de acordo com as exigências locais.

7. TITULAR DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Sidefarma – Sociedade Industrial de Expansão Farmacêutica, S.A.
Rua da Guiné, n.º 26
2689-514 Prior Velho
Portugal

8. NÚMERO(S) DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Registo n.º 4258398, 100 mg/ml, frasco de 50 g
Registo n.º 3067899, 100 mg/ml, frasco de 80 g

9. DATA DA PRIMEIRA AUTORIZAÇÃO/RENOVAÇÃO DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Data da primeira autorização de introdução no mercado: 23 de Dezembro de 1999.

10. DATA DA REVISÃO DO TEXTO