

RESUMO DAS CARACTERÍSTICAS DO MEDICAMENTO

1. DENOMINAÇÃO DO MEDICAMENTO

Lidocaína Adrenalina Labesfal 10 mg/ml + 0.018 mg/ml Solução injectável
Lidocaína Adrenalina Labesfal 20 mg/ml + 0.018 mg/ml Solução injectável
Lidocaína Adrenalina Labesfal 36 mg/1.8 ml + 0.03 mg/1.8 ml Solução injectável

2. COMPOSIÇÃO QUALITATIVA E QUANTITATIVA

LIDOCAÍNA 1% E ADRENALINA 1/100.000

Cloridrato de Lidocaína 10mg
Excipiente q.b.p. 1ml

LIDOCAÍNA 2% E ADRENALINA 1/100.000

Cloridrato de Lidocaína 20mg
Excipiente. q.b.p. 1ml

Lista completa de excipientes, ver secção 6.1.

3. FORMA FARMACÊUTICA

Solução injectável.

4. INFORMAÇÕES CLÍNICAS

4.1. Indicações terapêuticas

- Anestésico local por infiltração em medicina, cirurgia e estomatologia.
- Anestésico regional: caudal, epidural, pléxico, troncular.
- Infiltrações simpáticas.

4.2. Posologia e modo de administração

Doses normais para adultos:

Anestesia local infiltrativa: 5 a 300mg

Anestesia regional:

Anestesia caudal:

- Analgesia obstétrica: 200 - 300mg
- Anestesia cirúrgica: 225-300mg.

Anestesia epidural:

- Lombar:
Analgesia: 250mg – 300mg
Anestesia: 225 – 300mg.
- Torácica: 200 – 300mg.

Nota: na administração através de cateter (administração intermitente), não administrar as doses máximas em intervalos inferiores a 90 minutos.

Bloqueio nervoso periférico:

- Braquial: 225mg – 300mg
- Dental: 20 – 100mg
- Intercostal: 30mg
- Paracervical: 100mg por local; se for necessário, repetir a intervalos inferiores a 90 minutos).
- Paravertebral: 30 – 50mg.
- Pudendo: 100mg

Infiltrações simpáticas (bloqueio nervoso simpático):

- Cervical (Gânglio estrelado): 50mg
- Lombar: 50 – 100mg.

Em anestesia regional epidural e do bloco troncular, a dose máxima, que não deve ser ultrapassada, é de 500mg.

Para uma anestesia local, a dose máxima é de 500mg para as doses com adrenalina.

Para as doses mais elevadas recomenda-se recorrer às formas com adrenalina, com exclusão das injeções intravasculares.

Em lactentes e crianças deve ser utilizada a concentração mais baixa possível de anestésico local e deve-se evitar a adrenalina ou não ultrapassar a concentração de 1/200 000.

Doses pediátricas normais:

Crianças com menos de 12 anos: a dose não deve exceder 4-5mg/kg.

Grávidas, idosos insuficientes renais e hepáticos:

Aconselha-se uma redução da dose média em até 50%.

- A dose deve ser ajustada de acordo com a resposta do paciente e local de administração. Deve ser utilizada a menor dose e concentração eficaz.
- O volume de solução utilizada influencia a extensão e disseminação da analgesia.
- Quando uma dose elevada vai ser administrada (ex. bloqueio epidural) deve ser utilizada uma “dose teste” prévia de 3-5ml de lidocaína com a adrenalina.
- Em caso de sintomas tóxicos (ver ponto 4.9) a administração deve ser imediatamente interrompida.

4.3. Contra-indicações

A administração intravascular encontra-se contra-indicada, devido à presença de metabissulfito de sódio. Deste modo, é obrigatório assegurar que a agulha utilizada na injeção não entra no interior do vaso sanguíneo.

- A anestesia locorregional é geralmente desaconselhada em doentes tratados com anticoagulantes (excepto a via intravenosa).
- Indivíduos alérgicos aos anestésicos locais do mesmo grupo químico ou a qualquer constituinte da solução.
- Indivíduos porfíricos.
- Problemas na condução auriculo-ventricular que necessitam de manutenção electrosistólica permanente ainda não realizada.
- Epilépticos com tratamento não controlado.
- Antecedentes de hipertermia maligna.
- A anestesia local deve ser evitada nas zonas infectadas e inflamadas.
- As formas com adrenalina são, por outro lado, contra-indicadas nos indivíduos tratados com inibidores da monoaminoxidase e antidepressores tricíclicos; em situações de hipertireoidismo; para anestesia das extremidades (dedos, pénis); em injeção intravenosa.

4.4. Advertências e precauções especiais de utilização

Anestesia local:

- Interrogatório do paciente destinado a conhecer o terreno e as terapias em curso, os antecedentes alérgicos.
- Em caso de doses elevadas, pré medicar com uma benzodiazepina.
- A injeção deve ser administrada (salvo indicação particular) estritamente fora dos vasos, após aspiração repetida.

Antes da administração de qualquer fármaco anestésico local deve assegurar-se que estão disponíveis equipamentos de reanimação, oxigenação e ventilação assistida, bem como fármacos para o tratamento de reacções tóxicas.

Anestesia regional: epidural, locorregional intravenosa, plexo braquial ou blocos tronculares:

- Efectuar prémedicação com uma benzodiazepina em dose moderada.
- Dispor de uma via venosa.
- Dispor de material de reanimação.
- Dispor de uma fonte de oxigénio e de material para praticar aspiração, intubação traqueal e ventilação assistida.
- Dispor de medicamentos anestésicos com propriedades anticonvulsivantes (benzodiazepinas, tiopental), miorrelaxantes, atropina e vasopressores.
- Realizar uma vigilância electrocardiográfica contínua (cardioscopia).
- Verificar a concentração e a dose de anestésico local e do vasoconstritor
- Efectuar uma injeção teste de 3 a 4ml; injectar lentamente reaspirando frequentemente.
- Vigiar os sinais cardiovasculares.
- Manter o contacto verbal com o paciente.

Para anestesia epidural, diminuir as doses de reinjecção em caso de insuficiência hepática e cardíaca.

Deve ter-se cuidado em pacientes com doença hepática grave já que a redução do metabolismo pode conduzir a níveis sanguíneos tóxicos

Deve ter-se precaução na utilização em doentes com HTA, hipovolémia, doença cardíaca ou cerebrovascular, alterações da função respiratória, epilepsia controlada com tratamento, doentes com alterações do equilíbrio ácido-base e em doentes medicados com antiarrítmicos de Classe III (como a amiodarona – dado o risco de toxicidade aditiva).

Este medicamento contém na sua constituição metabissulfito de sódio, que pode causar reacções alérgicas incluindo episódios asmáticos ou anafilaxia em indivíduos susceptíveis. A prevalência da sensibilidade aos sulfitos não é conhecida, mas é mais frequente em doentes asmáticos que em doentes não-asmáticos.

4.5. Interações medicamentosas e outras formas de interacção

- Beta-bloqueadores: efeito depressor ventricular e diminuição do débito sanguíneo hepático. Devem ser evitadas as doses elevadas de lidocaína, já que o seu metabolismo é hepático.

O propranolol reduz a depuração sistémica da lidocaína em mais de 40%, e neste caso o efeito é principalmente devido à inibição directa do metabolismo hepático.

- Digitálicos: riscos de bradicardia e de problemas na condução auriculo-ventricular.

- Cimetidina: diminuição do fluxo sanguíneo hepático, o que atrasa o metabolismo da lidocaína.

A administração concomitante de cimetidina (a qual inibe o metabolismo hepático), em pacientes que recebem lidocaína pode resultar num aumento das concentrações plasmáticas da lidocaína e no incremento da sua toxicidade. Pode ser necessária a redução da dose de manutenção da lidocaína nestes pacientes.

A lidocaína prolonga a duração da acção do suxametónio devido à inibição da libertação de acetilcolina e efeitos pós-juncionais.

Amiodarona (anti arrítmico): efeito aditivo, acentuando a depressão cardíaca.

Fenitoína (agente indutor enzimático): a administração prolongada destes fármacos faz com que a dose de lidocaína necessária para originar um efeito anestésico aumente, uma vez que estes agentes promovem o seu metabolismo hepático acelerando a sua eliminação.

Fármacos oxiotóxicos: o efeito vasoconstritor ou pressor da adrenalina mediado pela sua acção α -adrenérgica pode ser potenciado pela administração concomitante de fármacos com efeitos similares como a oxitocina.

4.6. Gravidez e aleitamento

LIDOCAÍNA E ADRENALINA LABESFAL deve ser utilizado na gravidez e durante o aleitamento apenas quando os benefícios superam os riscos da sua utilização.

4.7. Efeitos sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas

Não foram encontradas referências a este tipo de efeitos.

4.8. Efeitos indesejáveis

As reacções tóxicas (como no caso duma sobredosagem com anestesia local), podem aparecer em duas situações: imediatamente, por sobredosagem relativa devido a uma passagem intravenosa acidental, ou tardia por verdadeira sobredosagem devido à utilização de uma grande quantidade de anestésico. Podem ser observados relativamente ao SNC: nervosismo, agitação, sonolência, tremor, apreensão, nistagmus, logorreia, cefaleias, náuseas, zumbidos nos ouvidos. Estes sinais apelam para a necessidade de uma vigilância atenta para evitar um eventual agravamento (convulsões e depressão do SNC)

Relativamente ao sistema respiratório: taquipneia e depois apneia.

Relativamente ao sistema cardiovascular: depressão do inotropismo, hipotensão arterial. Em doses elevadas: vasodilatação, colapso, problemas na condução, bradicardia, bloqueio auriculo-ventricular.

Extrasístoles ventriculares, taquicardia e fibrilhação ventricular, paragem cardíaca.

Alterações gastrointestinais: obstipação, náuseas e vômitos.

Alterações hematológicas: metehemoglobinemia.

As concentrações plasmáticas em que podem aparecer os primeiros sinais de toxicidade neurológica são de 5,6µg/ml.

Os sinais de toxicidade cardíaca são observados para concentrações 4 vezes mais elevadas (20µg/ml).

A margem de segurança entre os riscos de acidentes cardíacos (mais graves) e neurológicos é de 4.

4.9. Sobredosagem

As manifestações de toxicidade neurológica são tratadas por injeção dum barbitúrico de curta duração de acção ou uma benzodiazepina, oxigenação e ventilação assistida.

Sinais e sintomas em caso de sobredosagem:

1. Parestesia peri-oral e dormência da língua, cefaleias ligeiras, hiperacúsia e tinnitus;
2. Alterações visuais e tremores;
3. Convulsões.

5. PROPRIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propriedades farmacodinâmicas

Classificação farmacoterapêutica: 2.2. – Anestésicos locais.

Classificação ATC: N01BB52 LIDOCAINE, COMBINATIONS

A lidocaína é principalmente utilizada como anestésico local.

Como outros anestésicos locais, a lidocaína impede a geração e condução dos impulsos nervosos por diminuição da despolarização. Isto resulta do bloqueio do aumento transitório da permeabilidade da membrana celular aos iões sódio, que se segue à despolarização inicial da membrana. A lidocaína também reduz a permeabilidade do axónio aos iões sódio e potássio. O local de acção da lidocaína é num receptor específico dos canais de sódio.

A lidocaína é mais eficaz como anestésico local nas pequenas fibras nervosas não mielinizadas. As fibras A, mielinizadas são bloqueadas antes das fibras C. O efeito da lidocaína é prolongado pelo uso dum vasoconstritor como a adrenalina.

A lidocaína exerce efeito no sistema nervoso central, produzindo agitação e tremor. Podem ocorrer convulsões. A estimulação central pode ser seguida por depressão e morte devido a insuficiência respiratória. A lidocaína tem um fraco efeito no bloqueio neuromuscular.

No coração, o principal efeito é a redução da automaticidade por diminuição da velocidade de despolarização diastólica (fase 4). A lidocaína tem pouco ou nenhum efeito sobre a condução, no sistema His-Purkinje. A duração do potencial de acção, baixa devido ao bloqueio dos canais de sódio e o período refractário efectivo é diminuído.

5.2. Propriedades farmacocinéticas

A absorção da lidocaína depende do local de injeção, da dose administrada e da presença ou não de adrenalina.

A via intravenosa origina as concentrações mais elevadas. O pico sanguíneo depende da quantidade e sobretudo da velocidade da injeção. Assim, uma injeção de 2mg/kg em 2 minutos origina uma concentração arterial de 3µg/ml após 5 minutos, e de 1µg/ml após 30 minutos.

Após injeção subcutânea, a absorção varia com a vascularização. Uma dose de 200mg injectada ao nível do antebraço, origina cerca de meia hora após a injeção, concentrações de 0,30 a 0,50µg/ml.

A distribuição, a partir do sangue, faz-se por todos os tecidos, principalmente os mais irrigados (coração, pulmão, fígado e vísceras), depois nos tecidos adiposo e muscular.

A metabolização da lidocaína é essencialmente hepática por degradação enzimática realizada pelo sistema mono-oxigenado dependente do citocromo P450. 70% da lidocaína injectada é metabolizada numa só passagem. Os metabolitos mais importantes, já que são activos, são a mono-etil-glicina-xilidina e a glicina-xilidina. Os metabolitos são eliminados na urina, excepto uma pequena parte que sofre o ciclo entero-hepático.

A passagem transplacentária faz-se por simples difusão. A relação taxa fetal/taxa maternal é 0,52 a 0,69.

5.3. Dados de segurança pré-clínica

Em modelos animais, os sinais e sintomas de toxicidade notados após administração de elevadas doses de lidocaína resultam dos efeitos no Sistema Nervoso Central e no Sistema Cardiovascular. Não ocorreram efeitos indesejáveis relacionados com a administração do medicamento em estudos de toxicidade reprodutiva, nem a lidocaína mostrou ter potencial mutagénico tanto em testes de mutagenicidade in vitro como in vivo. Não foram efectuados estudos de carcinogenicidade com a lidocaína, devido à área e à duração da terapêutica com este medicamento.

6. INFORMAÇÕES FARMACÊUTICAS

6.1. Lista de excipientes

Cloreto de sódio, Metabissulfito de sódio, Água para preparações injectáveis.

6.2. Incompatibilidades

O cloridrato de lidocaína precipita, nas suas soluções, a anfotericina, a metohexitona sódica, a sulfadiazina sódica.

6.3. Prazo de validade

2 anos.

6.4. Precauções especiais de conservação

Ampolas de 20 ml:

Conservar no frigorífico (2°C – 8°C). Manter as ampolas dentro da embalagem exterior para proteger da luz.

Restantes apresentações:

Não conservar acima de 25°C. Manter as ampolas dentro da embalagem exterior para proteger da luz.

6.5. Natureza e conteúdo do recipiente

Lidocaína 1% e Adrenalina 1/100.000 - ampolas de 5 e 20ml, frascos para injectáveis de 20ml e de 50ml.
 Lidocaína 2% e Adrenalina 1/100.000 - ampolas de 5 e 20ml, frascos para injectáveis de 20ml e de 50ml,
 “anestubos” de 1,8ml.

O acondicionamento é feito em:

- ampolas de vidro tipo I, âmbar, autoquebráveis;
- frascos de vidro tipo I, âmbar, com tampa de silicone e cápsula de alumínio inviolável.
- “anestubos”: tubos especiais de vidro tipo I, incolor, com tampa e êmbolo de silicone e cápsula de alumínio inviolável.

6.6 Precauções especiais de eliminação

Não existem requisitos especiais.

7. TITULAR DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

LABESFAL, Laboratórios Almiro S.A.
 Zona Industrial do Lagedo
 3465-157 Santiago de Besteiros
 Portugal

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

Sol. inj. 1%:1/100 000 - 6 amp. 5ml	2377893
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 12 amp. 5ml	2377992
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 50 amp. 5ml	2378099
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 100 amp. 5ml	2378198
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 6 amp. 20ml	2378297
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 12 amp. 20ml	2378396
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 50 amp. 20ml	2378495
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 100 amp. 20ml	2378594
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 1 fr. p/ inject. 20ml	2378693
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 25 fr. p/ inject. 20ml	2378792
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 50 fr. p/ inject. 20ml	2378891
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 1 fr. 50ml	2378990
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 25 fr. 50ml	2379097
Sol. inj. 1%:1/100 000 - 50 fr. 50ml	2379196
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 6 amp. 5ml	2379295
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 12 amp. 5ml	2379394
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 50 amp. 5ml	2379493
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 100 amp. 5ml	2379592
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 6 amp. 20ml	2379691
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 12 amp. 20ml	2379790
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 50 amp. 20ml	2379899
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 100 amp. 20ml	2379998
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 6 anestubos 1,8ml	2380095
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 12 anestubos 1,8ml	2380194
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 50 anestubos 1,8ml	2380293
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 100 anestubos 1,8ml	2380392
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 1 fr. p/ inject. 20ml	2380491
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 25 fr. p/ inject. 20ml	2380590
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 50 fr. p/ inject. 20ml	2380699
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 1 fr. 50ml	2380798
Sol. inj. 2%:1/100 000 - 25 fr. 50ml	2380897

APROVADO EM 29-06-2015 INFARMED

Sol. inj. 2%:1/100 000 - 50 fr. 50ml

2380996

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

Data da primeira autorização de Introdução no mercado: 29-12-1995

Data da renovação da autorização de introdução no mercado: 29-12-2005

10. DATA DA REVISÃO DO TEXTO