

RESUMO DAS CARACTERÍSTICAS DO MEDICAMENTO

DENOMINAÇÃO DO MEDICAMENTO

XILONIBSA 2% com epinefrina, solução injetável

2. COMPOSIÇÃO QUALITATIVA E QUANTITATIVA

XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável, solução injetável contém lidocaína base 31,14 mg/1,8 ml e Epinefrina base a 0,0225 mg/1,8 ml.

3. FORMA FARMACÊUTICA

Solução injectável.

4. INFORMAÇÕES CLÍNICAS

4.1. Indicações terapêuticas

Anestesia de campo (local) e Anestesia locoregional: Clínica Dentária, cirurgia maxilo-facial, pequena cirurgia.

4.2. Posologia e modo de administração

Solução anestésica local injectável, por infiltração.
Via perineural.

A dose máxima de XILONIBSA 2% com Epinefrina solução injetável é atribuída em função do peso e corresponde a 7 mg/Kg de lidocaína.

A dose varia em função da área a anestésiar, da vascularização dos tecidos e da técnica anestésica a utilizar:

Por infiltração ou anestesia terminal é geralmente suficiente 1 ml;

Em anestesia troncular poderão ser necessários 1,5 a 2 ml.

Quando for necessária uma concentração anestésica de XILONIBSA inferior a 2% pode fazer-se a diluição em soro fisiológico até obter a concentração desejada.

4.3. Contra indicações

Hipersensibilidade conhecida à lidocaína ou aos anestésicos locais do tipo amida e a qualquer dos excipientes da formulação.

XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável, solução injetável não deve ser utilizada em feridas infectadas, queimadura ou pele inflamada.

4.4. Advertências e precauções especiais de utilização

Quando a XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável, solução injetável tenha que ser injectada em regiões muito vascularizadas deve aspirar-se sempre primeiro antes de injectar, com a finalidade de evitar qualquer risco de administração intravenosa.

Deve utilizar-se com precaução em doentes com hipertensão, insuficiência cerebrovascular, tireotoxicose, doentes sujeitos a tratamento com antidepressivos tricíclicos e IMAO e na doença cardíaca, sendo os doentes com cardiopatia isquémica possuidores de um potencial risco acrescido de eventos cardiovasculares provocados pela presença de epinefrina.

Por conter metabissulfito de sódio não deverá ser administrada a indivíduos com história clínica de asma.

XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável, solução injetável não deve administrar-se por via intravenosa ou epidural.

Administrar lentamente o anestésico para facilitar a correcta difusão.

Utilizar técnica asséptica (ver secção 6.6)

4.5. Interações medicamentosas e outras

Se se utilizam concomitantemente fármacos tranquilizantes, devem usar-se doses reduzidas do anestésico.

Não deve usar-se em doentes tratados com IMAO, antidepressivos tricíclicos, fenotiazinas, beta-bloqueantes ou cimetidina.

4.6. Gravidez e aleitamento

Não existem evidências de contra-indicações durante estes períodos.

À semelhança de outros anestésicos locais, a lidocaína pode entrar no leite materno, mas em pequenas quantidades e geralmente sem risco de afectar o recém-nascido.

Como qualquer medicamento, não é aconselhável a sua administração no primeiro trimestre de gravidez.

4.7. Efeitos sobre a capacidade de conduzir e utilizar máquinas

Os efeitos secundários dos anestésicos locais podem produzir alterações visuais, enjoos, ou tonturas, pelo que antes de conduzir ou manusear máquinas deverá aguardar que desapareça o efeito do anestésico.

4.8. Efeitos indesejáveis

As reacções adversas são raras e, normalmente, são o resultado de concentrações excessivamente altas no sangue, devidas a uma injeção intravascular inadvertida, a uma dosagem excessiva, a uma absorção demasiado rápida ou ocasionalmente a hipersensibilidade, idiosincrasia ou tolerância diminuída por parte do doente. Nestas circunstâncias os efeitos sistémicos implicam o sistema nervoso central e/ou o sistema cardiovascular.

As reacções do SNC são excitação ou depressão e podem caracterizar-se por nervosismo, obnubilação, turvação da visão e tremores, seguido de sonolência, convulsões, inconsciência e possível paragem respiratória. As reacções de excitação podem ser muito breves ou podem não ocorrer. Em todo o caso, a primeira manifestação pode ser sonolência, confundindo-se paulatinamente com inconsciência e paragem respiratória.

As reacções cardiovasculares são devidas à depressão do SNC e podem caracterizar-se por hipotensão, depressão miocárdica, bradicardia e inclusivamente paragem cardíaca.

As reacções alérgicas são extremamente raras. Podem caracterizar-se por lesões cutâneas, urticária, edema ou reacções anafiláticas.

Pelo conteúdo em Metabissulfito de sódio como excipiente, a administração de XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável pode dar origem a manifestações alérgicas como dispneia, urticária, angioedema e exacerbação do broncoespasmo, especialmente em doentes com asma aguda.

4.9. Sobredosagem

Tal como outros anestésicos locais, situações de sobredosagem, ou uma injeção intravascular inadvertida podem conduzir ao aparecimento de sintomas de toxicidade, como complicações respiratórias, circulatórias e neurológicas.

Os efeitos de sobredosagem da Lidocaína manifestam-se essencialmente ao nível do SNC por sonolência, cansaço, excitação, nervosismo, enjoos, visão enevoada, náuseas, vômitos, excitação muscular e convulsões. Em última instância, a excitação do SNC é seguida de depressão com enjoo, depressão respiratória e cardiovascular com palidez, sudação e hipotensão, com eventual arritmia, paragem cardíaca e finalmente, coma.

O tratamento nestes casos é o de rotina, para os acidentes de toxicidade provocados pelos anestésicos locais: a deficiência respiratória deve obviar-se mantendo a respiração artificial, e para o tratamento das manifestações da toxicidade do sistema nervoso devem ser administrados barbitúricos de acção prolongada. Para o controlo da descida da tensão arterial, caso esta ocorra, podem ser administrados estimulantes adrenérgicos.

5 - PROPRIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propriedades farmacodinâmicas

Grupo farmaco-terapêutico: II-2 - Anestésicos locais
Classificação ATC: N01BB52

A XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável é um anestésico local do tipo amida, cuja base é a Lidocaína (Cloridrato de dietilamino-2,6-dimetil acetanilida).

O seu poder anestésico rápido intenso e duradouro faz com que seja hoje universalmente utilizado. O poder anestésico é duas a três vezes mais intenso do que outros anestésicos e, quando associado a norepinefrina ou epinefrina (vasoconstritores) a duração da sua acção é aumentada.

Utilizada nas doses apropriadas apresenta uma boa tolerância, eficácia, com excelente difusão tecidual e sem reacções alérgicas de registo, mesmo nos doentes sensíveis a procaína.

As experiências clínicas confirmam que a lidocaína tem em relação à procaína um período de indução mais curto, uma acção mais intensa e maior duração.

A principal acção farmacodinâmica da lidocaína, tal como outros anestésicos locais, é o bloqueio reversível não selectivo da propagação do impulso ao longo das fibras nervosas, por impedimento do movimento interno dos iões sódio através da membrana nervosa, ou seja, dentro dos canais de sódio da membrana nervosa.

Os anestésicos locais podem também produzir efeitos similares nas membranas excitáveis no cérebro e miocárdio. Se quantidades excessivas da droga atingem rapidamente a circulação sistémica, poderão aparecer sintomas e sinais de toxicidade, provenientes dos sistemas nervoso central e cardiovascular.

A toxicidade do sistema nervoso central, normalmente precede os efeitos cardiovasculares, uma vez que estes ocorrem a concentrações plasmáticas mais baixas.

Os efeitos directos dos anestésicos locais, no coração incluem condução lenta, inotropismo negativo e, eventualmente, paragem cardíaca.

As acções da epinefrina e norepinefrina foram largamente comparadas em múltiplos estudos, quer in vivo quer in vitro. Ambos são agonistas directos sobre as células efectoras e as suas acções diferem principalmente em relação à sua eficácia no que respeita à estimulação dos receptores α e β . A noradrenalina tem uma potência agonista α elevada e fraca acção sobre os receptores β . Porém, em termos de potência absoluta, é menos potente que a adrenalina sobre os receptores α na maioria dos órgãos.

5.2. Propriedades farmacocinéticas

A ligação proteica plasmática de lidocaína, depende da concentração da droga e a fracção ligada diminui com o aumento de concentração.

Para concentrações de 1 a 4 µg de base livre por ml, 60 a 80% da lidocaína está ligada à proteína. A ligação também depende da concentração plasmática de alfa-1-ácido glicoproteína.

A lidocaína atravessa as barreiras hemato-encefálica e placentária, presumivelmente por difusão passiva.

A lidocaína é metabolizada rapidamente no fígado e os metabolitos e droga inalterada são excretados pelos rins. A biotransformação inclui N-desalquilação oxidativa, hidroxilação, clivagem da amida, linkage e conjugação. N-desalquilação, o maior percurso da biotransformação, origina os metabolitos monoetilglicinexilidida e glicinexilidida. As acções farmacológica e toxicológica destes metabolitos são similares, mas menos potentes que as da lidocaína.

Aproximadamente 90% da lidocaína administrada é excretada na forma de metabolitos vários e menos de 10% é excretada inalterada. O principal metabolito na urina é um conjugado de 4-hidroxi-2,6-dimetilanilina.

A semi-vida de eliminação da lidocaína, após uma injeção em bólus intravenoso é de 1,5 a 2 horas.

Devido à rapidez com que a lidocaína é metabolizada, qualquer condição que afecte a função hepática pode alterar a cinética da lidocaína. A semi-vida pode duplicar ou mais em doentes com alterações hepáticas. As alterações renais não afectam a cinética da lidocaína, mas podem aumentar a acumulação dos metabolitos.

Factores tais como acidose e a utilização de estimulantes e depressivos do SNC, afectam os níveis de lidocaína no SNC, necessários para produzir efeitos sistémicos notórios. Manifestações adversas objectivas tornam-se cada vez mais notórias com o aumento dos níveis plasmáticos acima de 6,0 µg de base livre por ml.

Uma vez que a epinefrina é rapidamente oxidada e conjugada na mucosa gastrointestinal e no fígado, a sua administração oral não resulta em concentrações farmacologicamente activas. A absorção subcutânea é considerada lenta devido ao seu efeito vasoconstritor, sendo a administração intramuscular mais rápida.

A epinefrina distribui-se preferencialmente no coração, baço, tecidos glandulares e nervos adrenérgicos, ocorrendo uma ligação às proteínas de 50%. Verificou-se uma diferença arterio-venosa significativa do fármaco através do fígado e rins.

O declínio na concentração plasmática de epinefrina após perfusão IV segue uma cinética bi-exponencial com uma clearance média de 9.4 L. min⁻¹. Os tempos de semi-vida das fases exponenciais acelerada e retardada são de 3 minutos e 10 minutos respectivamente.

A epinefrina é rapidamente metabolizada no fígado, tecido neuronal, sendo a excreção urinária após dose intravenosa, superior a 90 %. Apenas 1% desta dose é excretada na forma inalterada.

5.3. Dados de segurança pré-clínica

Cloridrato de Lidocaína:

Num estudo realizado no cão, com administração de lidocaína por via intravenosa, foi observada toxicidade (tremores) após administração da dose mínima testada, 1 mg/Kg. Uma dose de 10 mg/Kg provocou convulsões, mas não mortalidade. No macaco, foram observadas convulsões em associação a concentrações plasmáticas médias de 26 µg/ml. A lidocaína não demonstrou potencial genotóxico, num conjunto de testes in vitro e in vivo. Não afectou o desenvolvimento fetal do rato, num estudo que envolveu administração do fármaco por via subcutânea.

Bitartarato de Epinefrina

Os valores de DL50, em diferentes espécies animais, variaram entre 50 a 500 µg/Kg. A epinefrina não demonstrou potencial genotóxico. Quando administrada em doses elevadas, no rato, teve efeitos teratogénicos. Estudos em coelhos, macacos, ratos e ratinhos atribuem a este fármaco um potencial efeito tóxico a nível ocular.

6 - INFORMAÇÕES FARMACÊUTICAS

6.1. Lista de excipientes

Ácido Cítrico Monohidratado, cloreto de sódio, metabissulfito de sódio e água para injetáveis.

6.2. Incompatibilidades

É incompatível com compostos alcalinos, pois precipitariam a base livre.

6.3. Prazo de validade

21 meses.

6.4. Precauções especiais de conservação

Conservar a temperatura inferior a 30°C.

Manter os cartuchos dentro da embalagem exterior para proteger da luz.

6.5. Natureza e conteúdo do recipiente

Cartuchos cilíndricos de vidro tipo I, incolor de 1,8 ml com rolha de bromobutilo e cápsula de alumínio.

Embalagens de 100 cartuchos.

6.6. - Instruções de utilização e de manipulação

XILONIBSA 2% com Epinefrina, solução injetável, solução injetável é uma solução anestésica local injectável por infiltração. Como todos os anestésicos locais deve ser administrada lentamente para facilitar uma correcta difusão.

A solução injectável não deve permanecer em contacto com partes metálicas, como agulhas hipodérmicas, por períodos prolongados, pois devido ao seu pH entre 3 e 4, adequado para estabilizar o conteúdo em vasoconstritor (Epinefrina), há possibilidade de esta incorporar iões metálicos.

Os cartuchos devem ser desinfectados antes da introdução da agulha. Para tal, deverá submergir-se a cápsula metálica (apenas) em álcool isopropílico ou em álcool a 70%. Apenas os cartuchos a usar no próprio dia devem ser submetidos a este procedimento.

Quando a XILONIBSA tenha que ser injectada em regiões muito vascularizadas deve aspirar-se sempre primeiro antes de injectar, com a finalidade de evitar qualquer administração intravenosa.

TITULAR DA AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

LABORATÓRIOS INIBSA, S.A.
SINTRA BUSINESS PARK
Zona Industrial da Abrunheira
Edifício 1 – 2º I
2710 – 089 Sintra

8. NÚMERO DE AUTORIZAÇÃO DE INTRODUÇÃO NO MERCADO

Embalagem com 100 cartuchos de 1,8 ml - AIM N.º 4894580

9. DATA DA PRIMEIRA AUTORIZAÇÃO

29/12/2003

10. DATA DA REVISÃO DO TEXTO