

RESUMEN DE LAS CARACTERISTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	LIDOCAÍNA 2%
Forma farmacéutica:	Inyección IV, IM, SC
Fortaleza:	20 mg/ml
Presentación:	Estuche por 3 ó 5 ampolletas de vidrio incoloro con 2 ml cada una. Estuche por 25 ó 100 ampolletas de vidrio incoloro con 2 ml cada una. Caja por 20 ampolletas de vidrio incoloro con 10 ml cada una. Caja por 20 ampolletas de vidrio incoloro con 20 ml cada una.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) AICA.
Número de Registro Sanitario:	1561
Fecha de Inscripción:	24 de mayo de 2000.
Composición:	
Cada mL contiene:	
Clorhidrato de lidocaína anhidra (eq. a 21,3 mg de clorhidrato de lidocaína monohidratada)	20,0 mg
Cloruro de sodio Agua para inyección	
Plazo de validez:	60 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.
Indicaciones terapéuticas:	
Anestesia por filtración.	
Bloqueo nervioso periférico.	
Bloqueo nervioso simpático.	
Bloqueo nervioso central.	

Bloqueos terapéuticos y diagnósticos.

Anestesia epidural.

Anestesia espinal.

Contraindicaciones:

Pacientes con hipersensibilidad conocida a los anestésicos locales tipo amida (articaína, mepivacaína, prilocaína).

Aunque es excepcional existe el riesgo de alergia cruzada. Anestesia de los dedos, oreja, nariz, pene.

Tirotoxicosis, septicemia, shock severo, enfermedades cardiacas, especialmente si están acompañadas por taquicardia e hipertensión, glaucoma de ángulo cerrado.

Pacientes con síndrome de Stokes – Adams.

Hipotensión arterial marcada.

No administrar en tejidos inflamados o en los que exista un proceso infeccioso, ya que puede modificarse el pH en el lugar de la aplicación y modificar así el efecto del anestésico.

No deben administrarse altas dosis a pacientes portadores de un bloqueo cardiaco intraventricular, atrioventricular o sinoatrial.

Como en cualquier técnica de bloqueo se deberán tener en cuenta las contradicciones relativas y absolutas de la aplicación de estos, encontrándose absolutamente contraindicado la aplicación del bloqueo regional en pacientes demente en estado de alerta o en pacientes con retraso mental conscientes, pacientes con terapia activa anticoagulante o discrasias sanguíneas, pacientes con infección en el área de aplicación y sepsis generalizada.

Esta solución contiene metilparabeno y propilparabeno como agentes preservativos por lo que la misma no debe ser utilizada por vía intravenosa ni para infusión intravenosa.

Precauciones:

La disponibilidad de un equipo de resucitación y medicación adecuada es necesario siempre se utilice un agente anestésico.

La seguridad y efectividad del medicamento depende de la dosis apropiada, de la técnica correcta de aplicación, de las precauciones y de la rapidez con que se actúe en las urgencias.

Embarazo: Los anestésicos locales atraviesan rápidamente la placenta. La seguridad del uso en embarazadas, excepto durante el parto no ha sido establecida. La administración epidural, caudal, paracervical o pudenda, puede producir diversos grados de toxicidad materna, fetal y neonatal, incluyendo alteraciones del SNC, del tono vascular periférico y de la función cardiaca. La incidencia y el grado de esta toxicidad dependen del procedimiento, tipo y cantidad de fármaco usado y de la técnica de administración. Después de administración paracervical en los primeros meses de embarazo (para aborto provocado) se han descrito convulsiones y colapso cardiovascular en la madre (rápida absorción sistémica); se recomienda especial atención a la dosificación y a la técnica de administración.

Parto y alumbramiento: La administración epidural, subaracnoidea, paracervical o pudenda, puede alterar la contractibilidad uterina y/o los esfuerzos de expulsión.

El bloqueo paracervical puede acortar la primera etapa del parto y facilitar la dilatación cervical; sin embargo el bloqueo epidural o subaracnoideo puede provocar la segunda etapa del parto al interferir con la función motora o eliminar el reflejo de deseo de pujar. El uso de estos fármacos

en el alumbramiento puede aumentar la necesidad de fórceps. El uso simultáneo de un vaso constrictor beta-adrenérgico puede disminuir la intensidad de las contracciones uterinas y prolongar el parto.

La Lidocaína contrae las arterias uterinas, pudiendo dar lugar a hipoxia fetal (no reversible por bloqueadores alfa/ adrenérgicos). Los vasosconstrictores usados simultáneamente también puede contraer los vasos uterinos y disminuir la circulación placentaria. Se ha descrito bradicardia fetal, asociada posiblemente a acidosis fetal, en un 20/30% con anestésicos locales tipo amida por vía paracervical. Este riesgo puede aumentar la prematuridad, hipermadurez, toxemia dravídica, distress fetal preexistente o insuficiencia útero – placentaria. En estas circunstancias evaluar la relación riesgo-beneficio. Se recomienda vigilancia de la frecuencia cardíaca fetal durante el bloqueo paracervical.

Postparto: Entre el primer y segundo día postparto se pueden producir perturbaciones neurológicas neonatales (disminución del fuerza y tono muscular). Después del bloque paracervical se ha descrito marcada depresión del SNC del neonato. La inyección intracraneal accidental en el feto también puede producir depresión y convulsiones en el neonato.

Lactancia: La lidocaína se excreta en pequeñas cantidades por la leche materna tras administración parenteral. Aunque se desconocen las posibles consecuencias en el lactante, el potencial de efectos adversos parece ser bajo (incluso menor con la administración local). La Academia Americana de Pediatría considera el uso de la lidocaína compatible con la lactancia materna, no obstante se recomienda precaución.

Tanto los ancianos como los niños pueden presentar una mayor probabilidad de que se produzca toxicidad sistémica.

Uso en niños: Se recomienda determinar la dosis de forma individual, basándose en la edad y pero de cada paciente.

Uso en anciano: Dosis repetidas pueden causar acumulación de fármaco o sus metabolitos o enlentecer el metabolismo. Se recomienda utilizar dosis reducidas, proporcionadas a su estado físico Epilepsia, puede provocar temblores y/o convulsiones.

Insuficiencia cardíaca: Puede producir intensa depresión miocárdica, así como arritmias prolongadas.

Insuficiencia hepática: Dado que se metaboliza mayoritariamente en el hígado debe ajustarse la dosis al grado de incapacidad del mismo.

Insuficiencia renal: La acidosis y una concentración reducida de proteínas plasmáticas, pueden aumentar el riesgo de toxicidad sistémica.

Porfiria: Su metabolización hepática puede potenciar la síntesis de determinadas enzimas como ALA sintetasa, que puede dar lugar a aumento de porfirinas, lo que provoca la exacerbación de la enfermedad.

Hipertermia maligna: Los anestésicos locales pueden contribuir al desarrollo de hipertermia maligna en el caso de que se requiera anestesia general suplementaria.

Hipovolemia: Riesgo de hipotensión grave durante la anestesia epidural con cualquier anestésico local.

Shock grave, bradicardia o bloqueo cardíaco: Cuando se suponga que al lugar de aplicación o a la utilización de dosis elevada, pudieron producirse concentraciones plasmáticas elevadas.

La anestesia por bloqueo caudal o epidural deberá usarse con extremo cuidado en pacientes con problemas neurológicos, con deformidades de la columna y en pacientes muy jóvenes.

La anestesia epidural y espinal debe realizarse con mucha precaución, debido a la presencia de preservos antimicrobianos, como metilparabeno, ya que no se ha establecido la seguridad de estos en la administración intratecal.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Sustancias de uso delicado que solo debe ser administradas bajo vigilancia médica.

La presencia de agentes preservativos permite utilizar repetidas veces durante un periodo de 24 horas pasado el cual la solución que quede en el bulbo debe ser desechada.

Se debe revisar visualmente la solución, si hay presencia de precipitado o cambio de coloración, se debe rechazar la solución.

Siempre que se inyecte deberá hacerse una leve aspiración para evitar o reducir al menos la posibilidad de inyección intravascular inadvertida.

En el caso de aparecer reacciones sistémicas, se debe instaurar medidas para mantener la circulación y la respiración, y para controlar las convulsiones.

Cuando se use en anestesia bucofaríngea, se aconseja no comer mientras persista la anestesia, ante el riesgo de aspiración o morderse la lengua.

Efectos indeseables:

En la mayor parte de los casos los efectos adversos están relacionados con la dosis, y pueden resultar de niveles plasmáticos altos, originados por una dosis alta, por una absorción rápida o por una inyección accidental intravascular, o también pueden de una hipersensibilidad, idiosincrasia o una tolerancia del paciente disminuida en parte.

Excitación, agitación, mareos, tinnitus, nerviosismo, vértigo, visión borrosa, parestesia, temblores, somnolencia, convulsiones, inconsciencia y paro respiratorio. Náuseas, vómitos, escalofríos, constricción pupilar u zumbido de oídos. Depresión del miocardio, hipotensión, bradicardia y paro cardíaco. Urticaria, edema y shock anafiláctico.

El entumecimiento de la lengua y de la región perioral puede ser un primer síntoma de la toxicidad sistémica. Después de la excitación puede aparecer depresión con somnolencia, depresión respiratoria y coma, incluso depresión miocárdica, hipotensión, bradicardia, arritmia y parada cardíaca.

Excepcionalmente: reacciones alérgicas (urticarias, reacción anafilactoide), metahemoglobina.

Posología y modo de administración:

Deberá usarse la misma dosis que de como resultado una efectiva anestesia, para así evitar efectos sistémicos indeseables. Dosis repetida de lidocaína pueden causar un incremento en los niveles sanguíneos debido a la acumulación de la droga, a sus metabolitos o a una lenta degradación metabólica.

La dosis a utilizar será de acuerdo con el criterio del anestesiólogo, las características de la región anatómica y la respuesta clínica del paciente.

La dosis inicial en un adulto no deberá exceder a 6 mg/kg de peso corporal.

Anestesia local en infiltración:

5 – 15mL solución 2% (producen de 75 a 90 minutos de anestesia).

Dosis máxima en adultos 4.5mg/kg /2h ó 300mg.

Anestesia regional:

40 – 50 mL solución (bazo) ó 60 mL (pierna).

Es controvertido el uso de relajantes musculares, facilitan la ventilación y decrecen la actividad muscular, pero no inhiben la actividad neural convulsiva, permaneciendo elevado el metabolismo cerebral y los requerimientos de oxígeno.

El apoyo circulatorio se realiza mediante la aplicación de cargas hídricas con cristaloides expansores del plasma, si aún no cede la hipotensión, se aplicará efedrina en bolos de 5mg a 10 mg IV.

Si no se percibe pulso carotídeo, se iniciará masaje cardíaco externo, inclusive aplicación de epinefrina 0.1 a 0.2 mg IV o intracardiaca, repitiendo las dosis cuantas veces sean necesario aplicando al mismo tiempo respiración boca a boca o intubación endotraqueal inmediata.

Para el tratamiento de la toxicidad cardiovascular, además de las medidas básicas de reanimación, puede requerir para su manejo: epinefrina, atropina si hay bradicardia, cardioversión y tratamiento de arritmias ventriculares, además de inyectar lentamente, aspirando con frecuencia.

Niños: la dosis máxima en niños no ha sido bien establecida. La dosis de lidocaína debe ser individualizada para cada paciente pediátrico en función de la edad y del peso. La dosis máxima recomendada es de 3-5 mg/kg. Con el fin de evitar la toxicidad sistémica, siempre deben usarse la menor concentración efectiva y la menor dosis efectiva.

Modo de administración: Inyección subcutánea e intramuscular.

Interacciones con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

No debe administrarse concomitantemente con:

Anticonvulsivos del grupo hidantoína, puede tener efectos aditivos de depresión cardíaca, los anticonvulsivos tipos hidantoína también pueden promover el aumento del metabolismo hepático de la lidocaína y así reducir su concentración intravenosa.

La administración simultánea de cimetidina con lidocaína puede ocasionar una disminución del aclaramiento hepático de lidocaína, lo que posiblemente produce un retraso en la eliminación y un aumento de las concentraciones sanguíneas.

Antiarrítmicos pueden producir efectos cardiacos aditivos.

El uso simultáneo de agentes bloqueadores beta-adrenérgicos (metoprolol, nadolol, propranolol), tanto sistémicos como oftálmicos puede provocar enlentecimiento del metabolismo hepático e incrementar el riesgo de toxicidad de la lidocaína.

Los bloqueadores neuromusculares (alcurinio, suxametonio), se potencia su efecto.

Ajmalina: Se ha registrado posible potenciación de la toxicidad a nivel cardiaco, por inhibición de su metabolismo hepático.

Disopiramida: Se ha reportado incremento de la fracción libre de lidocaína, por desplazamiento de su unión a proteínas plasmáticas.

Inductores enzimáticos (amiodarona, cimetidina): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de lidocaína, con posible potenciación de la acción y/o toxicidad, por inhibición de su metabolismo.

Procainamida: se ha registrado posible incremento de la toxicidad, por adición de sus efectos neurotóxicos.

Propafenona: se ha reportado posible potenciación de la toxicidad de ambos fármacos, por adición de sus efectos adversos.

Uso en embarazo y lactancia:

Embarazo: Los anestésicos locales atraviesan rápidamente la placenta. La seguridad del uso en embarazadas, excepto durante el parto no ha sido establecida. La administración epidural, caudal, paracervical o pudenda, puede producir diversos grados de toxicidad materna, fetal y neonatal, incluyendo alteraciones del SNC, del tono vascular periférico y de la función cardíaca. La incidencia y el grado de esta toxicidad dependen del procedimiento, tipo y cantidad de fármaco usado y de la técnica de administración. Después de administración paracervical en los primeros meses de embarazo (para aborto provocado) se han descrito convulsiones y colapso cardiovascular en la madre (rápida absorción sistémica); se recomienda especial atención a la dosificación y a la técnica de administración.

Lactancia: La lidocaína se excreta en pequeñas cantidades por la leche materna tras administración parenteral. Aunque se desconocen las posibles consecuencias en el lactante, el potencial de efectos adversos parece ser bajo (incluso menor con la administración local). La Academia Americana de Pediatría considera el uso de la lidocaína compatible con la lactancia materna, no obstante se recomienda precaución

Efectos sobre la conducción de vehículos /maquinarias:

No procede.-.

Sobredosis:

El tratamiento del paciente con toxicidad sistémica consiste en detener las convulsiones y asegurar una adecuada ventilación con oxígeno, si es necesario mediante ventilación asistida o controlada.

Por ejemplo, en pacientes adultos, si se presentan convulsiones el paciente debe ser tratado de forma urgente con una inyección intravenosa de tiopentona 100 mg a 200 mg, o diazepam 5 mg a 10 mg. Para la relajación muscular puede usarse succinilcolina i.v. 50 mg-100 mg, siempre que el clínico pueda realizar una intubación endotraqueal y tratar a un paciente totalmente paralizado.

Cuando se han controlado las convulsiones y se ha asegurado una ventilación adecuada de los pulmones, en general no se requiere otro tratamiento. Sin embargo, si existe hipotensión, deberá administrarse un vasopresor (preferiblemente con actividad inotrópica, tal como la epinefrina 5 mg a 10 mg).

Propiedades farmacodinámicas:

Código ATC: N01BB02

Grupo Farmacoterapéutico: Anestésicos, Anestésicos locales, Amidas.

Mecanismo de acción:

Anestésico local tipo amida con duración intermedia. Actúa estabilizando la membrana neuronal, previniendo el inicio y la propagación del impulso nervioso.

Anestésico local: Bloquea tanto la iniciación como la conducción de los impulsos nerviosos mediante la disminución de la permeabilidad de la membrana neuronal a los iones sodio y de esta manera la estabilizan reversiblemente. Dicha acción inhibe la fase de despolarización de la membrana neuronal, dando lugar a que el potencial de acción, se propague de manera insuficiente y el consiguiente bloqueo de la conducción. Tiene la característica de producir una anestesia rápida, intensa, duradera y amplia.

Anestésico local: Las acciones a nivel del sistema nervioso central (SNC) pueden producir estimulación y/o depresión de este. Las acciones sobre el sistema cardiovascular pueden producir depresión de la excitabilidad y la conducción cardíaca y, con la mayoría de ellos, vasodilatación periférica.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: Se absorbe con relativa rapidez después de su administración parenteral. Absorción sistémica completa. La velocidad de absorción depende del lugar y la vía de administración (sobre todo de la vascularización o velocidad de flujo sanguíneo en el lugar de la inyección), de la dosis total administrada (volumen y concentración), de las características físicas (tales como grado de unión a proteínas y solubilidad en los lípidos), de cada fármaco en particular y de si se utilizan o no simultáneamente vasoconstrictores.

Distribución: Penetra a través de todas las membranas, se distribuyen a todos los tejidos por la circulación general y se localiza principalmente en los riñones, pulmones, bazo, corazón y SNC.

Metabolismo: Es metabolizada en el hígado por las oxidasas microsomales de función mixta, por desalquilación a monoetilglicina y xilidida.

Tiempo hasta la concentración máxima: Generalmente de 10 a 30 minutos, depende de factores que afectan a la velocidad de absorción. Se puede producir de 1 a 3 minutos después de la inyección intravascular o trastecal.

Concentración sérica máxima: depende de factores que afectan a la velocidad de absorción en el lugar de la inyección y de la tasa metabólica y del volumen de distribución de cada anestésico en particular. Cuando se aplica a nivel intercostal se observan concentraciones plasmáticas muy altas, de aproximadamente 1.5 µg/mL por cada 100 mg inyectados, mientras que la aplicación abdominal subcutánea es la más baja con 0.5 µg/mL.

Eliminación: Principalmente por el metabolismo, seguido de excreción renal de los metabolitos (aproximadamente un 70%). Para algunos de estos fármacos la excreción renal puede ser posterior a la excreción biliar en el tracto gastrointestinal a la reabsorción en dicho tracto.

La insuficiencia renal no afecta la cinética, pero propicia la acumulación de sus metabolitos.

Cantidad de dosis excretada si metabolizar: 10%

Unión a proteínas: 65%, principalmente a la alfa -1- glucoproteína ácida.

Vida media adulto / neonato: 1.5 - 1.8 h / 3h.

A nivel del espacio peridural tiene dos vidas medias, la corta ES de 9.3 minutos mientras que la larga ES de aproximadamente 82 minutos.

Comienzo de la acción: Rápido.

Duración de la acción: Intermedia.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:-

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 31 de octubre de 2020.

