

## RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

<b>Nombre del producto:</b>	LIDOCAÍNA 2%
<b>Forma farmacéutica:</b>	Inyección IM, IV, SC
<b>Fortaleza:</b>	20 mg/mL
<b>Presentación:</b>	Estuche por 3, 5, 25, ó 100 ampollas de vidrio incoloro con 2 mL cada una. Caja por 20 ampollas de vidrio incoloro con 10 mL cada una. Caja por 20 ampollas de vidrio incoloro con 20 mL cada una.
<b>Titular del Registro Sanitario, ciudad, país:</b>	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
<b>Fabricante (s) del producto, ciudad (es), país (es):</b>	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) AICA. Producto terminado.
<b>Número de Registro Sanitario:</b>	1561
<b>Fecha de Inscripción:</b>	24 de mayo de 2000
<b>Composición:</b>	
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	
<b>Plazo de validez:</b>	60 meses
<b>Condiciones de almacenamiento:</b>	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.

### Indicaciones terapéuticas:

Anestésico: Anestesia por infiltración.  
Bloqueo nervioso periférico.  
Bloqueo nervioso simpático.  
Bloqueo nervioso central.  
Anestesia epidural, anestesia espinal  
Antiarrítmico: La lidocaína intravenosa es el fármaco de elección en el tratamiento de urgencia de las arritmias ventriculares, como aquellas que resultan de un infarto agudo de miocardio, toxicidad por digital, cirugía cardiaca o cateterismo cardíaco.

### Contraindicaciones:

Pacientes con hipersensibilidad conocida a los anestésicos locales.  
Hipotensión arterial marcada.  
No administrar en tejidos inflamados o en los que exista un proceso infeccioso, ni a través de éstos.

La lidocaína no debe ser usada cuando el paciente presente síndrome de Adams-Stokes, bloqueo cardíaco severo, incluyendo los bloqueos auriculoventriculares, intraventricular o sinoauricular.

No debe ser utilizada en pacientes con hipovolemia, bloqueo cardíaco completo.

### **Precauciones:**

Debe evaluarse la relación riesgo-beneficio (usar con precaución) si el paciente presenta:

Insuficiencia cardíaca congestiva, bradicardia sinusal.

Depresión respiratoria.

Disfunción hepática ya que se metaboliza en el hígado.

Síndrome de Wolf-Parkinson-White.

En pacientes con insuficiencia cardíaca y respiratoria. En pacientes con trastornos en la generación de impulsos cardíacos y alteraciones de la conducción cardíaca, ya que la anestesia local puede disminuir la conductividad del miocardio.

La vida media plasmática de la Lidocaína puede prolongarse provocando reducción del flujo sanguíneo hepático.

Los metabolitos de Lidocaína pueden acumularse en pacientes con disfunción renal, con un aclaramiento de creatinina inferior a 10 mL/min.

En pacientes epilépticos deben controlarse cuidadosamente para detectar la aparición de síntomas sobre el sistema nervioso central.

La hipopotasemia, la hipoxia y los trastornos del equilibrio ácido-base deben corregirse antes del tratamiento con lidocaína intravenosa.

Sensibilidad cruzada: Los pacientes que no toleran la tocainida u otros anestésicos de tipo amida pueden no tolerar tampoco la Lidocaína.

Embarazo: La Lidocaína atraviesa la placenta. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos.

Geriatría: En los pacientes de más de 65 años, la dosis y la velocidad de infusión se deben reducir a la mitad y ajustar lentamente, según necesidades y tolerancia.

Durante la anestesia espinal se debe controlar la presión arterial. La anestesia epidural puede provocar hipotensión y bradicardia. Este riesgo se puede reducir precargando la circulación con soluciones cristaloides o coloidales. La hipotensión debe tratarse inmediatamente. Siempre se debe tener precaución en pacientes con deterioro de la función cardiovascular.

El bloqueo paracervical a veces puede causar bradicardia o taquicardia fetal y es necesario un control cuidadoso de la frecuencia cardíaca fetal.

Las inyecciones en las regiones de cabeza y cuello pueden realizarse inadvertidamente en una arteria causando síntomas cerebrales incluso a dosis bajas.

Las inyecciones retro bulbares raras veces pueden alcanzar el espacio subaracnoideo craneal, causando reacciones serias/graves, que incluyen colapso cardiovascular, apnea, convulsiones y ceguera temporal.

Las inyecciones retro y peribulbares de anestésicos locales conllevan un bajo riesgo de disfunción motora ocular persistente. Las causas principales incluyen traumas y/o efectos tóxicos locales en los músculos y/o los nervios.

La gravedad de tales reacciones tisulares está relacionada con el grado del trauma, la concentración del anestésico local y la duración de la exposición del tejido al anestésico local. Por esta razón, se deben usar la concentración y la dosis efectiva más bajas del anestésico local.

El efecto puede reducirse si la inyección lleva a cabo en un área inflamada o infectada.

La lidocaína intramuscular puede aumentar las concentraciones de creatinina fosfoquinasa que pueden interferir con el diagnóstico de infarto agudo de miocardio. Se ha demostrado que la lidocaína es porfirinogénica en animales y debe evitarse en personas que padecen porfiria.

Ha habido informes posteriores a la comercialización de condrólisis en pacientes que recibieron perfusión intraarticular continua postoperatoria de anestésicos locales. La mayoría

de los casos reportados de condrólisis han involucrado a la articulación del hombro. Debido a múltiples factores contribuyentes e inconsistencia en la literatura científica sobre el mecanismo de acción, la causalidad no ha sido establecida. La perfusión intraarticular continua no es una indicación aprobada para la lidocaína.

La solución de lidocaína inyectable no se recomienda para su uso en neonatos. Se desconoce la concentración sérica óptima de lidocaína requerida para evitar la toxicidad, como convulsiones y arritmias cardíacas, en este grupo de edad.

### **Advertencias especiales y precauciones de uso:**

No se debe conducir después de administrar el medicamento a menos que sea absolutamente necesario.

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

No contiene agentes preservativos por lo que el medicamento no utilizado debe ser desechado.

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

### **Efectos indeseables:**

La frecuencia y gravedad de las reacciones adversas de la lidocaína dependen de la dosis, el método de administración y la sensibilidad individual del paciente.

Se considera que los efectos adversos asociados al método de administración sistémico están más frecuentemente asociados al uso de lidocaína como agente antiarrítmico. Los posibles efectos adversos tras la administración de lidocaína como anestésico local son generalmente los mismos que los producidos por otros anestésicos locales de tipo amida.

Muy frecuentes

Trastornos gastrointestinales:

Náuseas, vómitos, disfagia.

Trastornos psiquiátricos:

Disforia.

Frecuentes

Trastornos del sistema nervioso

Síntomas neurológicos transitorios Somnolencia, mareos, vértigo, disartria, tinnitus, sensación de hormigueo y parestesia (piel), visión borrosa.

Otros síntomas subjetivos del SNC incluyen desorientación y sensación ocasional de amodorramiento. Los signos objetivos de toxicidad en el SNC son normalmente excitatorios e incluyen temblores, contracciones musculares que inicialmente se producen en los músculos de la cara y de las partes distales de las extremidades. Finalmente se presentan convulsiones generalizadas de naturaleza tónico-clónica. Si se administra una dosis suficientemente elevada los signos iniciales de excitación del SNC son rápidamente seguidos por un estado de depresión generalizada del SNC. Cesa la actividad convulsiva y puede presentarse una depresión respiratoria que puede conducir finalmente a un paro respiratorio.

Trastornos psiquiátricos

Confusión, inquietud, irritabilidad, euforia, alucinaciones y depresión.

Poco frecuente

Trastornos del sistema nervioso:

Síntomas de toxicidad sobre el SNC (parestesia, paresia hasta paraplejia de las extremidades inferiores y pérdida de control de los esfínteres (p. ej., síndrome de la cola de caballo), dolor de cabeza acompañado de tinnitus y fotofobia) Lesiones de los nervios craneales sordera neurosensorial y vértigo.

Trastornos vasculares

Hipertensión.

Raras

Trastornos del sistema inmunológico:

Reacciones de hipersensibilidad, urticaria, edema, broncoespasmo, dificultad respiratoria, en casos graves choque anafiláctico.

Trastornos del sistema nervioso:

Espasmos musculares, hasta convulsiones generalizadas, disminución del nivel de conciencia hasta el coma.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración:

Escalofríos.

Lesiones traumáticas, intoxicaciones y complicaciones de procedimientos terapéuticos: Trauma, irritación radicular transitoria, compresión de la médula espinal después del desarrollo de un hematoma.

Trastornos vasculares, puede ocurrir hipotensión como una respuesta al bloqueo de nervios centrales.

Trastornos cardíacos:

Bradicardia, bloqueo auriculoventricular hasta paro cardíaco. Las reacciones cardiovasculares son depresoras y pueden caracterizarse por vasodilatación periférica, hipotensión, depresión miocárdica, bradicardia y posible paro cardíaco. La hipotensión también

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos:

Depresión respiratoria

Efectos indeseables: El uso de Lidocaína puede ocasionar raramente reacción alérgica que se manifiesta con dificultad respiratoria, picazón, rash cutáneo.

Se pueden presentar síntomas de sobredosis, cuando las concentraciones de Lidocaína en suero sean de 6 a 8 mcg/mL, que pueden ser visión borrosa o doble, náuseas o vómitos, zumbido en los oídos, temblores, sensaciones de vértigo, entumecimiento de los labios y la lengua, mal funcionamiento de la oída y dislalia.

Síntomas que necesitan atención médica sólo si continúan o son molestos: dolor en el lugar de la inyección, ansiedad, nerviosismo, mareos, vértigo, sensación de frialdad, entumecimiento.

Las reacciones alérgicas son muy raras. Pueden caracterizarse por lesiones cutáneas, urticaria, edema o reacciones anafilácticas. La detección de la sensibilidad mediante test cutáneos es de valor dudoso.

### **Posología y modo de administración:**

Lidocaína 2 % solo debe ser utilizada por médicos con experiencia en anestesia regional y en técnicas de reanimación o bajo su supervisión.

Debe haber disponibles equipos de reanimación cuando se administren anestésicos locales.

Debe administrarse la dosis más baja posible que produzca el efecto deseado.

La dosis debe ajustarse individualmente a las particularidades de cada caso.

Anestésico local: La dosis a utilizar será de acuerdo con el criterio del anesthesiólogo.

Preparación de la solución para infusión intravenosa:

Agregue 1 g de Lidocaína (50 mL de Lidocaína al 2 %) a 1 litro de dextrosa inyectable al 5 %; la concentración resultante debe ser 1 mg por mililitro.

Dosis usual para adultos:

Antiarrítmico: Infusión intravenosa continua (usualmente siguiendo a una dosis de carga), de 20 a 50 mcg (0,02 a 0,05 mg) por kg de peso corporal en un rango de 1 a 4 mg por minuto.

Inyección intravenosa directa: 1 a 1.5 mg por kg de peso corporal (usualmente 50 a 100 mg) como dosis de carga en un rango de 25 a 50 mg por minuto, la dosis debe ser repetida después de 5 minutos si es necesario; usualmente seguido por una infusión intravenosa continua de Lidocaína para mantener los efectos antiarrítmicos.

En situaciones de emergencia, puede administrarse por inyección intramuscular en el deltoide con una dosis de 300 mg, repetida si es necesario después de 60 a 90 minutos.

Poblaciones especiales:

Pacientes geriátricos tienen una mayor sensibilidad a los efectos de la dosis usual para adultos. En pacientes de edad avanzada, la dosis debe ser calculada individualmente de acuerdo con la edad del paciente y el peso corporal. Puede ser necesaria la reducción de la dosis en esta población, ya que el gasto cardíaco y el flujo sanguíneo hepático disminuyen en edades avanzadas, produciendo una disminución de la eliminación de lidocaína

Insuficiencia cardíaca e insuficiencia hepática

La dosis debe ser reducida en pacientes con insuficiencia cardíaca e insuficiencia hepática, debido a una reducción en el aclaramiento de la lidocaína

Insuficiencia renal

La insuficiencia renal como norma general no requiere ajuste especial de dosis. Sin embargo, estos pacientes deben ser monitorizados para los efectos tóxicos causados por la acumulación de metabolitos. En caso de insuficiencia renal severa, puede ser necesario ajustar la dosis

Prescripción límite para adultos: Hasta 300 mg (cerca de 4,5 mg por kg de peso corporal) en un período de 1 hora.

Dosis pediátrica usual:

Antiarrítmico: Infusión intravenosa continua (usualmente siguiendo a una dosis de carga), 30 mcg (rango, de 20 a 50 mcg) (0,03 mg; rango, 0,02 a 0,05 mg) por kg de peso corporal por minuto.

La seguridad y la eficacia del uso de lidocaína en niños todavía no ha sido totalmente establecida. No se recomienda el uso de lidocaína en recién nacidos. La dosis inicial de lidocaína en niños es de 0,5- 1 mg/kg. Esta dosis puede ser repetida de acuerdo con la respuesta del paciente, pero la dosis total no debe exceder 3-5 mg/kg de peso. Si es necesario un mantenimiento, se puede administrar una perfusión i.v. 10 - 50 µg/kg/min utilizando una bomba de perfusión.

Para el soporte vital cardiovascular avanzado en niños, se recomienda una dosis inicial rápida i.v. o una inyección intraósea (en bolo) de 1 mg/kg de peso corporal hasta una dosis máxima de 100 mg.

Si la taquicardia ventricular o la fibrilación ventricular no son corregidas mediante desfibrilación (o cardioversión) y la dosis inicial de lidocaína recomendada, se debe administrar una perfusión intravenosa o intraósea a una velocidad de 20-50 µg/kg de peso por minuto.

Inyección intravenosa directa: 1 mg por kg de peso corporal como dosis de carga en un rango de cerca de 25 a 50 mg por minuto, la dosis debe ser repetida 5 minutos después si es necesario sin exceder la dosis total de 3 mg por kg; usualmente seguido por una infusión intravenosa continua de Lidocaína para mantener los efectos antiarrítmicos.

Modo de administración: Inyección IV, IM, SC.

Terapia anestésica

La forma de administración de lidocaína varía en función del procedimiento de anestesia que se utilice (anestesia por infiltración, anestesia regional intravenosa, bloqueo nervioso o anestesia epidural).

Lidocaína se puede administrar vía intramuscular, subcutánea, intradérmica, perineural, epidural o vía intravenosa (en anestesia local intravenosa o bloqueo de Bier).

Tratamiento de arritmias ventriculares severas

Vía intravenosa. Vía intraósea.

Administrar como inyección intravenosa lenta o como perfusión intravenosa después de la dilución con una solución apropiada. Debido a la relativa corta duración de la acción de la lidocaína, a la inyección le debería seguir una perfusión continua, si es posible, utilizando una bomba de perfusión. Se recomienda una monitorización continua del ECG, presión sanguínea, estado de conciencia y respiración durante la administración de lidocaína.

### **Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:**

El efecto cardíaco depresivo de la Lidocaína es aditivo con los de los betabloqueadores y

otros antiarrítmicos. Los efectos cardíacos aditivos también pueden ocurrir cuando la Lidocaína se administra con Fenitoína intravenosa. Sin embargo, el uso a largo plazo de Fenitoína y otros inductores enzimáticos puede incrementar la dosis requerida de Lidocaína. La hipocalemia producida por la Acetazolamida, diuréticos de asa y las tiazidas, antagonizan el efecto de la Lidocaína.

Se ha reportado delirio en pacientes que han recibido Lidocaína con procainamida.

El uso de anticonvulsivos del grupo hidantoína simultáneamente con la Lidocaína también puede promover el aumento del metabolismo hepático de la Lidocaína y así reducir su concentración intravenosa.

Con el uso de Propranolol puede ocurrir un incremento significativo de la concentración de Lidocaína en plasma debido a una reducción en el aclaramiento de Lidocaína desde el plasma. Puede ocurrir una interacción similar con Nadolol y Metoprolol. El metabolismo hepático de la lidocaína puede reducirse como resultado de una falla en el flujo sanguíneo hepático asociado con una salida cardíaca reducida o causado directamente por la inhibición de enzimas microsomales hepáticas.

La Cimetidina reduce el metabolismo hepático de la lidocaína al igual que reduce el aclaramiento por disminución del flujo sanguíneo hepático pueden provocar concentraciones plasmáticas potencialmente tóxicas cuando la lidocaína se administra repetidamente en altas dosis durante periodos de tiempo prolongados. En estos casos se recomienda una disminución de las dosis o un monitoreo del paciente debido a los riesgos de toxicidad.

El uso simultáneo de agentes bloqueadores beta-adrenérgicos, tanto sistémicos como oftálmicos puede provocar enlentecimiento del metabolismo hepático e incrementar el riesgo de toxicidad de la Lidocaína.

Si la lidocaína se administra como agente antiarrítmico, la medicación con epinefrina o norepinefrina de forma adicional puede potenciar los efectos adversos cardíacos.

Agentes antiarrítmicos de Clase I

La administración simultánea de lidocaína con otros agentes antiarrítmicos de clase I se debería evitar ya que hay riesgo de efectos adversos cardíacos graves.

Otros agentes antiarrítmicos

Si la lidocaína se utiliza en combinación con otros agentes antiarrítmicos como betabloqueantes o bloqueantes de canales de calcio, el efecto inhibitorio en la conducción aurículo-ventricular e intraventricular y en la contractibilidad se podrían ver incrementados.

Medicamentos que pueden disminuir el umbral de convulsiones

Dado que la lidocaína en si misma disminuye el umbral de presentar convulsiones la coadministración con otros medicamentos que disminuyan este umbral de presentar convulsiones (p.ej. Tramadol o Bupropiona) puede incrementar el riesgo de convulsiones.

### **Uso en Embarazo y lactancia:**

Embarazo:

La Lidocaína atraviesa la placenta. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos.

No hay datos o estos son limitados relativos al uso de lidocaína en mujeres embarazadas. No existen evidencias de que lidocaína cause alteraciones del proceso reproductivo, como una mayor incidencia de malformaciones. No obstante, no se ha investigado a fondo el riesgo para los seres humanos.

Los estudios realizados en animales han mostrado toxicidad para la reproducción con la administración subcutánea de altas dosis de lidocaína.

La lidocaína atraviesa la placenta. Por lo tanto, concentraciones elevadas de lidocaína en el plasma sanguíneo de la madre puede causar depresión del sistema nervioso central, alteraciones del tono vascular periférico y la función cardíaca en el feto / recién nacido.

Se recomienda valorar el balance beneficio-riesgo cuando se use a corto plazo durante el embarazo y el parto. El bloqueo paracervical o el bloqueo pudendo con lidocaína aumenta el riesgo de reacciones adversas tales como bradicardia/taquicardia en el feto. Por lo tanto, se debe monitorizar estrechamente la frecuencia cardíaca del feto.

La lidocaína se debe utilizar durante el embarazo solo si hay una indicación imperativa. En este caso, la dosis debe ser tan baja como sea posible.

En general, en obstétrica se prefiere el uso de lidocaína en concentraciones de 10 mg/mL.

#### Lactancia

No se han reportado efectos adversos en lactantes cuyas madres han recibido lidocaína. La lidocaína se excreta en la leche materna en pequeñas cantidades. No se esperan efectos en recién nacidos a las dosis recomendadas. Por lo tanto, se puede continuar con el tratamiento con lidocaína durante la lactancia.

#### Fertilidad

No se dispone de datos sobre el efecto de la lidocaína en la fertilidad.

### **Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:**

Dependiendo de la dosis y la forma de administración, la lidocaína puede tener un efecto transitorio en la función motora y la coordinación, influyendo en la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Se debe recomendar a los pacientes que eviten estas actividades hasta que se haya restablecido por completo la función normal.

### **Sobredosis:**

#### Medidas generales.

Las inyecciones intravasculares accidentales de anestésicos locales pueden causar toxicidad sistémica inmediata (desde segundos a unos minutos). Los signos de toxicidad sistémica por sobredosis aparecen más tarde (15-60 minutos tras la inyección) como resultado de un aumento más lento de la concentración del anestésico local en la sangre. Si aparecen signos de toxicidad sistémica, la inyección debe interrumpirse inmediatamente. Dependiendo de la sensibilidad individual, se pueden producir reacciones adversas a partir de concentraciones plasmáticas que oscilan entre 5 y 9 mg de lidocaína por litro en sangre. Concentraciones plasmáticas superiores a 9 mg por litro están frecuentemente asociadas con efectos tóxicos sobre el SNC. La concentración plasmática letal para los seres humanos está en el rango de 6 a 33 mg de lidocaína por litro.

#### Síntomas

Efectos sobre el SNC Las dosis tóxicas bajas de lidocaína estimulan el SNC. Una sobredosis importante, que genera concentraciones tóxicas altas en el plasma, deprime las funciones centrales. Pueden distinguirse dos fases de intoxicación con lidocaína:

#### Estimulación

Al comienzo de la intoxicación con anestésicos locales los pacientes muestran principalmente síntomas de excitación: inquietud, vértigo, trastornos auditivos y de la visión, sensaciones desagradables peribucales, agitación, alucinaciones, euforia, parestesias (por ejemplo, parestesia peribucal y entumecimiento de la lengua), mareos, tinnitus, visión borrosa, náuseas, vómitos, disartria. Los escalofríos y las fasciculaciones musculares pueden ser signos de ataques inminentes de convulsión generalizada. Las concentraciones plasmáticas subconvulsivas de lidocaína a menudo también producen somnolencia y sedación. Como un signo de la estimulación inicial del sistema nervioso simpático puede aparecer taquicardia, hipertensión y enrojecimiento.

#### Depresión

Durante la evolución tóxica del SNC aumenta la alteración de las funciones del tronco encefálico en forma de depresión respiratoria y coma, llegando incluso a la muerte.

Efectos sobre la circulación cardiovascular: Pulso no detectable, palidez, hipotensión, bradicardia, arritmias, colapso cardiovascular, fibrilación ventricular, paro cardíaco. El primer signo de toxicidad cardiovascular por lidocaína suele ser hipotensión súbita. La hipotensión es causada principalmente por una deficiencia o por el bloqueo de la conducción del impulso cardíaco. Estos efectos tóxicos, sin embargo, son menos importantes que los de los SNC.

#### Tratamiento de emergencia y antídotos

La presencia de síntomas del sistema nervioso central o del sistema cardiovascular precisa el siguiente tratamiento de urgencia:

Suspender de inmediato la administración del anestésico local.

Mantener las vías respiratorias abiertas.

Adicionalmente, suministrar oxígeno. Si es necesario aplicar ventilación artificial con oxígeno puro, asistida o controlada, inicialmente a través de mascarilla y bolsa de aire y después por intubación, si es necesario.

Debe continuarse el tratamiento con oxígeno hasta que todas las funciones vitales recuperen la normalidad.

Controlar cuidadosamente la presión arterial, el pulso y el tamaño de la pupila.

Mantener la circulación mediante el suficiente suministro de líquidos por vía intravenosa, dobutamina y, si fuera necesario, noradrenalina, aumentando según sea necesario, con monitorización hemodinámica en los casos más graves. También se puede utilizar efedrina.

Comienzo inmediato de la reanimación cardio-pulmonar, si es necesario. Estas medidas también deben aplicarse en caso de anestesia lumbar total accidental, manifestada inicialmente como inquietud, voz susurrante y somnolencia. Ésta última puede producir pérdida del conocimiento y parada respiratoria.

Carbón activado en caso de sobredosis por vía oral (la provocación del vómito puede ser peligrosa debido a la anestesia en la mucosa y el riesgo de convulsiones en un estadio temprano. Si se requiere un lavado gástrico, este se deberá realizar a través de un tubo y tras la intubación endotraqueal).

Otras medidas terapéuticas incluyen lo siguiente:

La hipotensión severa aguda debe tratarse con vasopresores por vía intravenosa. La bradicardia causada por el incremento de tono vago, debe tratarse con atropina por vía intravenosa. Las convulsiones que no reaccionen suficientemente a la oxigenación deben tratarse con benzodiacepina o barbitúricos intravenosos de acción ultracorta. Están contraindicados los analépticos de acción central. No existe un antídoto específico. La diálisis es de escaso valor en el tratamiento de la sobredosis aguda de lidocaína.

### **Propiedades farmacodinámicas:**

Código ATC: N01BB02.

C01BB01

Grupo farmacoterapéutico: N: Sistema nervioso, N01: Anestésicos, N01B: Anestésicos locales, N01BB: Amidas

C01BB01. C: Sistema cardiovascular, C01: Terapia cardíaca, C01B: Antiarrítmicos de clase I y III. C01BB: Antiarrítmicos de clase Ib.

Mecanismo de acción:

La lidocaína es un anestésico local de tipo amida.

La lidocaína reduce la permeabilidad de las membranas celulares a los cationes, en particular, los iones de sodio, a concentraciones más altas incluso para los iones potasio. Esto produce, según la concentración de lidocaína, una menor excitabilidad de las fibras nerviosas por el aumento de la permeabilidad al sodio que hace que el potencial activo disminuya. Desde el interior de la célula la molécula de lidocaína accede al canal abierto de sodio y lo bloquea uniéndose a un receptor específico. Mucho menos importante es un efecto directo de la incorporación de lidocaína a la membrana celular.

Puesto que la lidocaína, antes de alcanzar su lugar de acción, ha de pasar a la célula, su efecto depende de su pKa y del pH ambiental, es decir, de la proporción de base libre que es la fracción que migra predominantemente a través de las membranas lipófilas de las fibras nerviosas.

En un tejido inflamado el efecto anestésico local disminuye debido al menor pH en estas regiones.

Tras su absorción, la lidocaína puede provocar la estimulación del SNC y seguidamente su depresión, y en el sistema cardiovascular actúa principalmente sobre el miocardio, donde puede reducir la excitabilidad eléctrica, la velocidad de conducción y la fuerza de contracción. Presenta un rápido inicio de acción (alrededor de un minuto después de la inyección intravenosa y quince minutos después de la inyección intramuscular) y se extiende

rápidamente por los tejidos circundantes. La lidocaína inhibe el funcionamiento de las estructuras excitables como las fibras nerviosas sensitivas, motoras y autonómicas y el sistema cardiaco de conducción de impulsos. La lidocaína inhibe reversiblemente la conducción en las fibras nerviosas sensitivas en la región de aplicación. El efecto dura unos diez a veinte minutos después de la inyección intravenosa y unos sesenta a noventa minutos después de la inyección intramuscular.

Anestésico local: Vasoconstrictor. La vaso actividad intrínseca puede influir en la velocidad de remoción del sitio de acción y en consecuencia, en la duración de la acción.

Efecto terapéutico El efecto anestésico local de la lidocaína depende de la vía de administración y dura entre 30 minutos (ej. anestesia por infiltración) y 3 horas (ej. anestesia vía epidural).

Antiarrítmico: La Lidocaína disminuye la despolarización, automatismo y excitabilidad en los ventrículos durante la fase diastólica mediante acción directa sobre los tejidos, especialmente en la red de His Purkinje, sin involucrar al sistema autónomo. Con las dosis terapéuticas habituales no se alteran la contractilidad la presión arterial sistólica, la velocidad de conducción auriculoventricular (AV) ni el período refractario absoluto. En la clasificación de los antiarrítmicos de "Vaughan Williams" se considera a la Lidocaína como fármaco clase Ib.

El efecto de la lidocaína se ve incrementado cuando el potencial en reposo es menos negativo, p.ej. en hipercalemia y/o isquemia de miocardio. En situaciones de hiperpolarización, p.ej debido a hipocalemia, el efecto de la lidocaína se ve reducido.

Las concentraciones plasmáticas terapéuticas deben situarse entre 1,5 y 5 mg/l. Por encima de 5 mg/l, cabe esperar efectos tóxicos sobre el SNC y el sistema cardiovascular. Los pacientes con una función deteriorada del nódulo sinusal pueden responder de forma especialmente marcada al efecto supresor de la conducción de la lidocaína.

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

Distribución: Rápida; el volumen de distribución es aproximadamente de 1 litro por peso corporal (pero se reduce en pacientes con insuficiencia cardiaca).

La lidocaína atraviesa la barrera placentaria, y la concentración de lidocaína no unida será la misma en la madre y en el feto. No obstante, la concentración total en plasma será inferior en el feto debido al menor grado de unión a proteínas.

Unión a proteínas: De moderada a alta (de 60 a 80 %, dependiendo de la concentración del fármaco).

Metabolismo: 90%, hepático; los metabolitos activos, como monoetilglicinxilidida y glicinxilidida, pueden contribuir a los efectos terapéuticos y tóxicos, especialmente después de infusiones de 24 horas de duración o más.

Vida media: Inicial de menos de 30 minutos. La vida media de eliminación es de 1 a 2 horas (media alrededor de 100 minutos); es dependiente de la dosis (tiende a ser bifásica con una fase de distribución de 7 a 9 minutos que causa la corta duración de acción que sigue a la dosis intravenosa de carga); aumenta durante infusiones intravenosas prolongadas (más de 24 horas).

Comienzo de la acción:

Intravenosa: Inmediato (45 a 90 segundos).

Duración de la acción:

Intravenosa: De 10 a 20 minutos.

Eliminación: Renal, el 10 % inalterado.

La eliminación de lidocaína se efectúa sobre todo a través del metabolismo, principalmente por desalquilación a monoetilglicina xilidida (MEGX), que es mediada por CYP1A2 y CYP3A4. MEGX es metabolizada a 2,6-dimetilanilina y glicinexilidida (GX). La 2,6-dimetilanilina se convierte después, mediante CYP2A6, en 4-hidroxi-2,6dimetilanilina, que es el metabolito principal en la orina (80%) y se excreta en forma de conjugado. MEGX posee una actividad convulsiva similar a la de lidocaína mientras que GX carece de actividad

convulsiva. MEGX parece estar presente en concentraciones plasmáticas similares a las de la sustancia original. La velocidad de eliminación de lidocaína y MEGX tras una dosis en bolo intravenoso es de aprox. 1,5-2 horas y 2,5 horas, respectivamente.

Poblaciones especiales

Insuficiencia hepática

La farmacocinética de la lidocaína se puede ver influenciada por estados que afecten a la función hepática debido a su rápido metabolismo. La semivida puede aumentar 2 o más veces en pacientes con disfunción hepática.

Insuficiencia renal

El deterioro de la función renal no tiene ningún efecto en la farmacocinética de la Lidocaína, pero puede provocar la acumulación de sus metabolitos.

Pacientes de edad avanzada La semivida de eliminación y el volumen de distribución parecen ser más larga o mayor, respectivamente, en los pacientes de edad avanzada debido al rendimiento cardíaco y/o al flujo sanguíneo hepático reducidos.

Población pediátrica En recién nacidos los niveles de la  $\alpha$ -1-glicoproteína ácida son bajos y la unión a proteínas puede ser menor. Puesto que la fracción libre puede ser mayor, no se recomienda el uso de lidocaína en recién nacidos.

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

Deseche el sobrante.

**Fecha de aprobación/ revisión del texto:** 31 de marzo de 2025.