

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	LIDOCAÍNA 2 %
Forma farmacéutica:	Inyección SC, IM
Fortaleza:	20 mg/mL
Presentación:	Estuche por 25 bulbos de vidrio incoloro con 5 mL cada uno.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, LA HABANA, CUBA.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) "LABORATORIOS JULIO TRIGO", LA HABANA, CUBA.
Número de Registro Sanitario:	M-17-076-N01
Fecha de Inscripción:	29 de mayo de 2017
Composición:	
Cada mL contiene:	
Clorhidrato de lidocaína	20,0 mg
Cloruro de sodio	
Metilparabeno	
Propilparabeno	
Agua para inyección	
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C.

Indicaciones terapéuticas:

Anestesia local por infiltración; regional central por bloqueo epidural, lumbar o caudal.; subaracnoideo (con dextrosa para obtener solución hiperbárica); bloqueo de nervio periférico; paracervical, pudiendo, bloqueo retrobulbar, bloqueo simpático. Anestesia transtraqueal.

Anestesia regional i.v. (con torniquete adecuado y sin epinefrina)

Antiarrítmico: Arritmias ventriculares.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a la lidocaína o anestésicos de tipo amida.

Hipovolemia, bloqueo completo de rama, uso concomitantes con soluciones que contienen adrenalina.

Los preparados con epinefrina no deben usarse en áreas de circulación arterial terminal (dedos, pene) o con afectación del riego arterial.

Infección local en la zona de tratamiento.

Traumas de la mucosa.

Precauciones:

Embarazo: Categoría de riesgo: B. Lactancia materna: Compatible.

Niño: pueden ser más sensibles a toxicidad sistémica con estos medicamentos.

Adulto mayor: ajuste de dosis.

Daño renal y daño hepático.

Insuficiencia cardíaca congestiva, hipovolemia, *shock*, bloqueo cardíaco incompleto, bradicardia sinusal y síndrome de Wolf –Parkinson-White.

Pacientes debilitados pueden ser más sensibles a las dosis estándar.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Cuando se administran anestésicos locales debe disponerse de instalaciones para la reanimación.

Pequeñas dosis de anestésicos locales inyectados en la cabeza y el cuello, incluyendo bloqueos retrobulbares, dentales y del ganglio estrellado, pueden producir reacciones adversas similares a la toxicidad sistémica observada con inyecciones intravasculares accidentales de dosis más altas.

Efectos indeseables:

Relacionadas con dosis excesivas o administración intravascular inadvertida. Ocasionales: reacciones alérgicas con dificultad respiratoria, prurito, erupción cutánea; en altas dosis o por administración intravenosa: depresión cardiovascular, arritmias, convulsiones, visión borrosa, diplopía, náuseas, vómitos, zumbido en los oídos, temblores, ansiedad, nerviosismo, mareos, vértigo, sensación de frialdad, entumecimiento de las extremidades, escozor, picazón, sensibilidad anormal al dolor no existente con anterioridad al tratamiento, enrojecimiento, hinchazón de la piel, boca o garganta.

Raras: hematuria, aumento de la sudación, hipotensión arterial.

Posología y método de administración:

La dosis se ajustará de acuerdo con el proceder anestésico, preferiblemente diluida. Formulación parenteral al 2 % con epinefrina o sin ella: infiltración: 225-300 mg.

Anestesia regional central: epidural y caudal: 200-300 mg.

Bloqueo de nervio periférico: las dosis varían y debe ser individual.

Bloqueo retrobulbar: 120-200 mg.

Bloqueo simpático: 50-100 mg.

Anestesia transtraqueal: 80-120 mg.

Anestesia regional IV: no exceder 4 mg/kg.

Arritmias ventriculares (formulación sin epinefrina): adultos, 1 mg/kg IV, entre 50 y 100 mg a una velocidad aproximada de 25 a 50 mg/min bajo control electrocardiográfico continuo, repetir la dosis si no se obtuvo respuesta después de 5 min. Dosis máxima en 1 h: 300 mg. Tan pronto como sea posible deberá iniciarse la terapia con antiarrítmicos orales y suspender la lidocaína IV.

En niños la información es limitada, se administran 30 µg/kg/min.

Antiarrítmico.

Adultos:

La dosis usual para pacientes adulto es de 50 a 100 mg administrados directamente por vía intravenosa a una velocidad aproximada de 25 a 50 mg / min. Deberá darse el tiempo suficiente para permitir que la circulación lleve a la droga al sitio de acción. Si una inyección inicial de 50 a 100 mg no proporciona la respuesta deseada, puede repetirse una dosis después de 5 minutos.

Nunca deberá administrarse más de 200 a 300 mg de Lidocaína durante un periodo de una hora.

Niños:

La experiencia del uso de la Lidocaína como antiarrítmico en niños es muy limitada.

Pacientes con una función hepática alterada o un flujo hepático reducido (como en alguna falla miocárdica o después de cirugía cardíaca), o en pacientes mayores de 70 años de edad, se les proporcionará la mitad de la dosis de inicio y menores dosis de mantenimiento.

Para infusiones continuas intravenosas en pacientes cuyas arritmias tiendan a recurrir después de una buena respuesta temporal a una dosis única y que por alguna razón no puedan recibir terapia oral antiarrítmica, el clorhidrato de Lidocaína puede ser administrado continuamente en concentraciones al 0,1% (1mg/mL) a una velocidad de 1 a 4 mL/min. (20 a 50 mcg/Kg /min en un individuo de 70 Kg como promedio). Para evitar que se demore el alcance del estado estacionario, se puede administrar una dosis de aproximadamente 1 mg/Kg intravenosamente por 2 minutos al inicio.

Soluciones de Lidocaína al 0,2 % (2 mg/mL) pueden administrarse a una velocidad de 0,5 a 2 mL/min. La administración intravenosa continúa siempre deberá ser monitorizada electrocardiográficamente para evitar una sobredosis y/o toxicidad potencial. Así mismo deberá terminarse tan pronto como se restablezca el ritmo cardíaco normal en el paciente.

Debe adicionarse en la infusión IV, en modo de preparación: Desde el punto de vista microbiológico, el producto debe utilizarse inmediatamente. Si no se usa inmediatamente, el tiempo de almacenamiento de la solución lista para su uso y las condiciones previas al uso son responsabilidad del manipulador y, normalmente, no serían más de 24 horas a 2-8°C, a menos que la reconstitución/dilución (etc.) se haya llevado a cabo en condiciones asépticas validadas y controladas.

Tan pronto como sea posible deberá iniciarse terapia con antiarrítmicos orales y suspender la Lidocaína intravenosa.

Siempre que se administre Lidocaína por infusión intravenosa continua se deberá utilizar un equipo de venoclisis de precisión.

En niños si se emplea infusión intravenosa continua (usualmente siguiendo una dosis de carga) esta es de 30 mcg por Kg de peso corporal por minuto.

Para preparar una solución de Lidocaína al 0,1 % (1 mg/mL) para administración intravenosa continua se deberá añadir 1g de clorhidrato de Lidocaína en 1000 mL de solución glucosada al 5 %. Tal solución a una velocidad de 1 a 4 mg / min.

Una solución de clorhidrato de al 0,2 % puede prepararse agregando 2 gramos de Lidocaína a 1000 mL de solución glucosada al 5 %. La velocidad de administración de 0,5 a 2 mL/min proporcionará 1 a 4 mg/min

Anestésico Local: La dosis a utilizar será variable y será de acuerdo con el criterio del anestesiólogo y va a depender del área que va a ser anestesiada, de la vascularidad de los tejidos y del número de segmentos neuronales que van a ser bloqueados.

Deberá utilizarse la mínima dosis necesaria que proporcione una anestesia efectiva.

La dosis máxima para adultos no deberá exceder de 200 mg. La dosis inicial de clorhidrato de Lidocaína en adultos no deberá exceder de 6 mg por Kg de peso corporal.

Es recomendable el uso de concentraciones al 0,5 % o al 1 % de clorhidrato de Lidocaína en niños, para minimizar la posibilidad de reacciones tóxicas y la dosis total deberá ser reducida en porción al peso corporal o al área que se va a anestesiarse.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Antiarrítmicos: su empleo en conjunto con la lidocaína puede producir efectos cardíacos aditivos.

Anticonvulsivos tipo hidantoína: reducen su concentración plasmática.

Betabloqueadores y cimetidina: aumento de las concentraciones séricas.

Depresores del SNC: pueden presentar efectos aditivos.

Opiáceos: pueden aumentar efectos depresores respiratorios en anestesia espinal alta.

Bloqueadores neuromusculares: pueden prolongar su efecto bloqueador.

IMAO, furazolidona, procarbazona, selegilina: se incrementa el riesgo de toxicidad.

Soluciones desinfectantes: pueden causar liberación de metales pesados de estas soluciones y producir irritación cutánea.

El clorhidrato de lidocaína se ha reportado que es incompatible en solución con anfotericina B, sulfadiazina de sodio, metohexital sodio, cefazolina sódica o fenitoína sódica. Medicamentos ácidos estables, tales como el clorhidrato de adrenalina, tartrato ácido de noradrenalina o isoprenalina pueden comenzar a deteriorarse dentro de varias horas luego de mezclar con clorhidrato de lidocaína, como soluciones de lidocaína pueden elevar el pH de la solución final por encima del pH máximo para su estabilidad. Tales mezclas extemporáneas deben utilizarse inmediatamente después de la preparación.

Uso en Embarazo y lactancia:

Debe tenerse cuidado cuando se prescribe a mujeres embarazadas, especialmente durante los primeros meses del embarazo cuando tiene lugar la máxima organogénesis. Los datos en un número limitado de mujeres embarazadas no mostraban evidencia de anomalías congénitas. En estudios en animales se observaron algunas evidencias de cambios de conducta nerviosa pero sin efectos teratogénicos.

En obstetricia la lidocaína no debe usarse en concentraciones mayores del 1%.

La anestesia epidural está contraindicada en obstetricia con amenaza o existencia de hemorragias.

La lidocaína cruza la placenta rápidamente. En neonatos con niveles plasmáticos elevados, la lidocaína puede provocar depresión del SNC y un coeficiente Apgar disminuido.

El uso de lidocaína en el bloqueo paracervical puede llevar a taquicardia fetal o bradicardia en un 20- 30% de los pacientes. La inyección accidental en el subcutis fetal durante el bloqueo nervioso paracervical es un riesgo de amenaza para la vida del neonato, que conduce a apnea, hipotonía y convulsiones.

Aunque la lidocaína pasa a la leche materna, es improbable que se produzca un riesgo para los niños si se administra a dosis terapéuticas.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No se ha encontrado ningún informe sobre este aspecto

Sobredosis:

Las manifestaciones por sobredosificación de Lidocaína son vértigo, cianosis, hipotensión arterial, temblores musculares, convulsiones, coma, respiración irregular y débil, paro

cardíaco y espasmo bronquial. El manejo consiste en limitar la absorción del sitio de inyección mediante torniquete y paquetes de hielo. Mantener vías aéreas permeables con administración de oxígeno, controlar las convulsiones con diacepam, 0,1 mg/Kg./intravenoso y administración de azul de metileno, 1 % 0,1 mg/intravenoso, durante más de 10 minutos.

Toxicidad Sistémica Aguda: as reacciones tóxicas sistémicas involucran principalmente el sistema nervioso central (SNC) y el sistema cardiovascular (SCV). Estas reacciones son causadas por altas concentraciones de un anestésico local en la sangre, que pueden presentarse debido a una (accidental) inyección intravascular, sobredosis o una excepcional rápida absorción desde áreas altamente vascularizadas. Las reacciones del SNC son similares con todos los anestésicos locales de tipo amida, mientras que las reacciones cardíacas son más dependientes del medicamento, tanto cuantitativamente como cualitativamente. Los signos de toxicidad del sistema nervioso central generalmente anteceden a los efectos tóxicos cardiovasculares, a menos que el paciente se encuentre recibiendo anestesia local o se encuentre altamente sedado con medicamentos como benzodiacepinas o barbitúricos. La toxicidad del Sistema Nervioso Central es una respuesta gradual con síntomas y signos de gravedad creciente. Los primeros síntomas generalmente son, parestesia peri bucal, parestesia lingual, mareos, hiperacusia, tinnitus y alteraciones visuales. Disartria, espasmos musculares o temblores son más serios y preceden el inicio de convulsiones generalizadas. Estos signos no deben confundirse con un comportamiento neurótico. La inconsciencia y convulsiones gran mal pueden presentarse posteriormente con una duración desde algunos segundos hasta varios minutos. La hipoxia e hipercapnia se presentan rápidamente después de las convulsiones debido al aumento de la actividad muscular, junto con interferencia en la respiración posible pérdida del funcionamiento de las vías respiratorias. En casos graves puede presentarse apnea. La acidosis, hiperpotasemia, hipocalcemia e hipoxia aumentan y prolongan los efectos tóxicos de los anestésicos locales. La recuperación es secundaria a la redistribución del anestésico local del sistema nervioso central y el metabolismo posterior y excreción. La recuperación puede ser rápida a pesar de que hayan sido inyectadas grandes cantidades del medicamento. La toxicidad del sistema cardiovascular puede observarse en casos graves y generalmente está precedida de signos de toxicidad en el sistema nervioso central. En pacientes bajo sedación profunda o que reciben un anestésico general puede haber ausencia de síntomas prodrómicos del SNC. Pueden presentarse hipotensión, bradicardia, arritmia y un paro cardíaco como resultado de elevadas concentraciones sistémicas de anestésicos locales, pero rara vez se ha presentado paro cardíaco sin efectos prodrómicos del SNC. En los niños, los signos tempranos de toxicidad anestésica pueden detectarse difícilmente cuando el bloqueo se aplica durante la anestesia general.

Tratamiento de la toxicidad aguda: Si aparecen signos de toxicidad sistémica aguda, deberá interrumpirse inmediatamente la inyección del anestésico local y los síntomas del SNC (convulsiones, depresión del SNC) deberán ser tratados rápidamente con un apoyo adecuado de las vías respiratorias/ asistencia respiratoria y la administración de medicamentos anticonvulsivos. Si se presenta paro circulatorio, deberá aplicarse reanimación cardiopulmonar inmediata. Son de vital importancia la óptima oxigenación y el apoyo ventilatorio y circulatorio así como el tratamiento de la acidosis. Si se presenta depresión cardiovascular (hipotensión, bradicardia), deberá considerarse el tratamiento adecuado con líquidos intravenosos, agentes vasopresores, cronotrópicos y/o inotrópicos. A los niños se administrarán dosis acorde a su edad y peso.

Propiedades farmacodinámicas:

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 éste. 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 del flujo sanguíneo en el lugar de inyección), de la dosis total administrada (volumen y concentración), de las características físicas (tales como grado de unión a proteínas y solubilidad en 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 transteal.

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 alguno de estos fármacos la excreción renal puede ser posterior a la excreción biliar en el tracto gastrointestinal y a la reabsorción en dicho tracto.

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

Cantidad de dosis excretada sin metabolizar: 10 %.

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

Vida media adulto/neonato: 1,5 - 1,8 h / 3 h.

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:

Los productos elaborados en nuestro laboratorio son clasificados según la Resolución 32/2005 y Resolución 4/2006 como pertenecientes a la Clase I, es decir sin impacto significativo sobre el medio ambiente, por otro lado el análisis de nuestros residuos por el CIMAB, en la revisión inicial para la implantación del sistema de Gestión ambiental, no

evidencia efecto sobre las aguas examinadas en los puntos de muestreo, no obstante como medida de nuestra entidad se decidió la colecta de las muestras residuales y su posterior disposición final, por encapsulamiento o cualquier otro método aprobado por la legislación ambiental en vigencia. La entidad cuenta con licencia para el manejo de los desechos peligrosos y permiso de bioseguridad.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 29 de mayo de 2017.