

LIDOCAÍNA 2%

LIDOCAÍNA CLORHIDRATO

ANESTÉSICO/ANTIARRÍTMICO TIPO IB

COMPOSICIÓN:

Cada 10 ml de solución inyectable contiene:

Principio activo:

Lidocaína clorhidrato monohidrato.....213.3 mg.

Equivalente a lidocaína clorhidrato.....200.0 mg.

Excipientes: Cloruro de sodio, agua destilada.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Anestésico por infiltración o bloqueo: Anestesia local por infiltración, anestesia regional intravenosa, bloqueos nerviosos y es el fármaco de elección para la anestesia epidural y raquídea; es muy útil en caso de cirugías superficiales, procedimientos odontológicos y procedimientos de cirugía menor.

Por vía parenteral: Indicado en el tratamiento agudo de arritmias ventriculares tales como taquicardia ventricular y fibrilación ventricular secundarias a infarto del miocardio o manipulación cardíaca; también es utilizada para la terapéutica de abordaje de pacientes con status epiléptico refractario a otros tratamientos.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Se absorbe fácilmente desde los lugares de punción e infiltración, incluyendo el músculo y el tracto gastrointestinal, las membranas mucosas y la piel lesionada; se absorbe poco a través de la piel intacta. Después de una dosis intravenosa las concentraciones plasmáticas caen rápidamente, la tasa de absorción se ve afectada tanto por la vascularización como por la presencia de tejido y grasa, debido a una unión de la lidocaína en tejidos particulares.

Distribución: El volumen de distribución determinado para la lidocaína al 2%® es de 0.7 a 1.5 L /kg. Se distribuye por toda el agua corporal y en general los órganos más perfundidos mostrarán concentraciones más altas del principio activo, motivo por el cual el mayor porcentaje de este fármaco se encontrará en el músculo esquelético. Adicionalmente es importante establecer la capacidad de difusión de la lidocaína, ya que atraviesa las barreras hematoencefálica y placentaria probablemente por un proceso de difusión pasiva.

Unión a proteínas: El porcentaje de unión a proteínas es aproximadamente del 60 al 80%, se une de forma marcada de la glucoproteína ácida alfa-1, una proteína de fase aguda que está elevada en condiciones traumáticas, quirúrgicas o inflamatorias crónicas.

Metabolismo: El 90% de la Lidocaína al 2%® se metaboliza rápidamente a través del hígado, la biotransformación incluye N-dealquilación oxidativa a monoetilenglicina xilidida y glicina xilidida y estos metabolitos poseen actividad anestésica local.

Vida media: Posee una vida media inicial de menos de 30 minutos, una vida media de eliminación de 1 a 2 horas.

Excreción: Aproximadamente <10% es excretado a través de la orina, como fármaco inalterado, 90% como metabolitos, el aclaramiento renal está inversamente relacionado con su afinidad de unión a proteínas y el pH de la orina.

FARMACODINAMIA:

Lidocaína al 2% es un anestésico local de tipo amida, perteneciente al grupo farmacoterapéutico N01B, provoca una pérdida reversible de la sensibilidad, evitando o reduciendo la conducción de los impulsos de los nervios sensoriales en las proximidades de su lugar de acción, siendo el lugar primario de acción la membrana celular. Esta acción se debe a su directa interacción con los canales de sodio, cuyo principal mecanismo probablemente está relacionado con la interacción del principio activo con uno o más de los lugares de unión específicos para los canales de sodio. Además de su acción anestésica local, la lidocaína al 2% y los compuestos similares, pueden interferir con la función de sistemas en los que se produce una conducción o transmisión de impulsos nerviosos, como lo son el sistema nervioso central y cardiovascular.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Intradérmica, subcutánea, intravenosa, intraósea, endotraqueal, epidural, periarticular o intraarticular, intravesical.

POSOLOGÍA:

La dosis se ajusta según la respuesta, condición física del paciente, el procedimiento, el grado de anestesia necesario, la vascularización del tejido, la duración de la anestesia requerida y del paciente.

Infiltración cutánea: Máximo 4,5 mg/kg/dosis que no exceda los 300 mg, no repetir administración dentro de 2 horas.

Endotraqueal: De 2 a 3.75 mg/kg (Dosis equivalente a 2 veces la dosis IV recomendada); Diluir en 5 a 10 ml de agua estéril.

Intraóseo: De 1 a 1,5 mg / kg en bolo.

Fibrilación ventricular o taquicardia ventricular sin pulso (Después de intentos de desfibrilación, RCP y epinefrina): Inicial: IV 1 a 1,5 mg / kg en bolo. Si hay fibrilación ventricular refractaria o taquicardia ventricular sin pulso repita el bolo de 0.5 a 0.75 mg / kg cada 5 a 10 minutos (Dosis acumulativa máxima: 3 mg / kg). Siga con infusión continua (1 a 4 mg / minuto) después del retorno de la perfusión.

Taquicardia ventricular monomórfica hemodinámicamente estable IV: 1 a 1,5 mg / kg; repita con 0.5 a 0.75 mg / kg cada 5 a 10 minutos según sea necesario (Dosis acumulativa máxima: 3 mg / kg). Siga con una infusión continua de 1 a 4 mg / minuto (o 14 a 57 mcg / kg / minuto).

La duración máxima del tratamiento no debe superar los 2 días.

NO OBSTANTE, LA DOSIS Y LA DURACIÓN DEL TRATAMIENTO DEBEN SER DEFINIDAS POR EL MÉDICO EN FUNCIÓN DEL ESTADO DEL PACIENTE.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a la lidocaína o cualquier componente de la formulación; hipersensibilidad a otro anestésico local del tipo amida; síndrome de Adam-Stokes; síndrome de Wolff-Parkinson-White; grados severos de bloqueo cardíaco atrioventricular o sinuatrial, intraventricular (Excepto en pacientes con un marcapasos artificial en funcionamiento).

Se deberá evitar su uso en casos de isquemia regional, estado de shock cardigénico o hipovolémico, disfunción hepática, enfermedad renal, no deberá aplicarse cuando exista inflamación en la zona donde se va a infiltrar para obtener anestesia local.

PRECAUCIONES DE USO:

Debe usarse con precaución en pacientes con epilepsia, hipovolemia, bloqueo atrioventricular u otros trastornos de la conducción, bradicardia o función respiratoria deteriorada. La lidocaína se metaboliza en el hígado y debe administrarse con precaución en pacientes con la función hepática deteriorada. La vida media plasmática de la lidocaína puede prolongarse en condiciones en que se reduce el flujo sanguíneo hepático, tales como fallo cardíaco y circulatorio. Los metabolitos de la lidocaína pueden acumularse en pacientes con deterioro renal.

Los pacientes con deficiencia de glucosa-6-fosfato deshidrogenasa, metahemoglobinemia congénita o idiopática, exposición a agentes oxidantes o sus metabolitos, o bebés <6 meses son más susceptibles y deben ser monitoreados de cerca para detectar signos y síntomas de metahemoglobinemia.

Debe corregirse antes del uso y durante toda la terapia: Los trastornos electrolíticos, especialmente la hipocalcemia o la hipomagnesemia, cualquier causa subyacente de arritmias ventriculares; además vigilar de cerca los signos y síntomas de toxicidad del SNC, es necesaria una monitorización constante del ECG durante la administración IV. La infusión intraarticular continua de anestésicos locales después de procedimientos artroscópicos u otros procedimientos quirúrgicos no es un uso aprobado.

REACCIONES ADVERSAS:

Al igual que otros anestésicos locales, las reacciones adversas a la lidocaína son raras y normalmente se producen como resultado de concentraciones sanguíneas excesivamente elevadas debidas a inyección intravascular inadvertida, dosis excesivas, rápida absorción o, ocasionalmente, a hipersensibilidad, idiosincrasia o tolerancia disminuida por parte del paciente.

Más frecuentes: Dolor de cabeza (posicional después de la anestesia espinal) temblores (después de la anestesia espinal), náuseas, vómitos, disfagia.

Menos frecuentes: bradicardia, arritmia cardíaca, shock circulatorio, vasoespasmo de la arteria coronaria, edema, enrojecimiento, bloqueo cardíaco, hipotensión (incluida la anestesia espinal), tromboflebitis local, insuficiencia vascular (inyecciones periarticulares), agitación, ansiedad, aprensión, síndrome de la cola de caballo (después de la anestesia espinal), coma, confusión, desorientación, mareos, somnolencia, euforia, alucinación, hiperestesia, hipoestesia, intolerancia a la temperatura, letargo, pérdida del conocimiento, sabor metálico, nerviosismo, parestesia, neuropatía periférica (después de la anestesia espinal), psicosis, convulsiones, dificultad para hablar, espasmos, reacción anafilactoide, anafilaxia, reacción de hipersensibilidad, temblor, debilidad, tinnitus, broncoespasmo, disnea, depresión respiratoria, insuficiencia respiratoria (después de la anestesia espinal). Raros: asistolia, reacción dermatológica, diplopía (después de la anestesia espinal), metahemoglobinemia.

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.

ADVERTENCIAS ESPECIALES DE USO:

Embarazo: Categoría B: 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 per sin efectos teratogénicos.

Lidocaína 2% atraviesa la placenta rápidamente, por lo tanto, concentraciones elevadas de lidocaína en el plasma sanguíneo de la madre, por consiguiente, en neonatos con niveles plasmáticos elevados puede causar depresión del sistema nervioso central, alteraciones del tono

vascular periférico y la función cardíaca en el feto / recién nacido, consecuentemente coeficiente Apgar disminuido. Se recomienda valorar el balance beneficio-riesgo cuando se use a corto plazo durante el embarazo y el parto. Por lo tanto, se debe monitorizar estrechamente la frecuencia cardíaca del feto. En general, en obstétrica se prefiere el uso de lidocaína en concentraciones de 10 mg/ml.

Lactancia: Lidocaína al 2% se excreta en la leche materna en pequeñas cantidades, es improbable que se produzca un riesgo para los niños si se administra a dosis terapéuticas, por lo tanto, se puede continuar con el tratamiento con lidocaína durante la lactancia.

Pediatría: El comportamiento del niño debe monitorizarse estrechamente durante el tratamiento. La dosis media se encuentra en el rango de 20 mg a 30 mg de lidocaína por sesión. No se debe superar el equivalente de 5 mg de hidrocloreto de lidocaína por kilogramo de peso corporal. Para prevenir la toxicidad sistémica en niños siempre debe usarse la concentración efectiva más baja, se debe utilizar con especial precaución en niños menores de cuatro años, ya que hay datos limitados para apoyar la seguridad y eficacia de este producto. Lidocaína inyectable no está recomendada para uso en recién. En este grupo de edad se desconoce la concentración óptima de lidocaína en suero necesaria para evitar efectos tóxicos tales como convulsiones y arritmias cardíacas.

Geriatría: Este grupo etario podría ser propenso al incremento de los efectos secundarios del sistema nervioso central y cardiovascular; por lo tanto, se debe tener precaución en pacientes de edad avanzada y mantener una adecuada ventilación y oxigenación; restaurar el volumen intravascular en pacientes hipovolémicos (por ej. deshidratados, sepsis, hemorragia) e hipervolémicos (por ej. en insuficiencia cardíaca) y normalizar las variables hemodinámicas (TA, FC, CO).

Precauciones al conducir vehículos u operar maquinaria: En función de la dosis y el lugar de administración, los anestésicos locales pueden afectar la función mental y alterar temporalmente la locomoción y la coordinación. Cuando se administre este medicamento el médico debe valorar en cada caso particular si la capacidad de reacción está comprometida y si el paciente puede conducir o utilizar máquinas.

USTED DEBE INFORMAR AL MÉDICO TODOS LOS MEDICAMENTOS QUE CONSUME, INCLUSIVE LOS QUE OBTIENE SIN RECETA.

INTERACCIONES:

Lidocaína 2% incrementa los efectos tóxicos y neuromusculares de los antiarrítmicos, hialuronidasa, bupivacaína, lacosamida, prilocaína y nitrito de sodio; aumenta riesgo de hipotensión con IMAO; incrementa los efectos vagales del fentanilo y alfentanilo; aumenta riesgo de irritación y edema con desinfectantes de metales pesados; disminuye efecto diagnóstico del tecnecio 99. La dapsona, disopiramida y saquinavir incrementa el efecto adverso de la lidocaína; la etravina y el tabaco reducen la concentración sérica.

Evitar mezclar con fármacos estables a pH ácido; informar al médico los medicamentos que se consume los recetados incluso los de venta libre, vitaminas y productos herbales.

SOBREDOSIFICACIÓN:

La administración intravenosa accidental de anestésicos locales puede propiciar el desarrollo de eventos de toxicidad sistémica inmediata (Un periodo de tiempo que va desde segundos a unos pocos minutos). El desarrollo de signos de toxicidad sistémica por sobredosis se da entre 15-60 minutos posteriores a la administración, 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, los signos de toxicidad que se presenten serán dependientes de las concentraciones séricas del principio activo.

El desarrollo de efectos tóxicos sistémicos con concentraciones séricas de lidocaína de 6 a 8 mg/ml, propicia el desarrollo de síntomas como: Visión borrosa o doble, náuseas, vómito, tinnitus, temblores o contracciones musculares. C

El desarrollo de efectos tóxicos sistémicos con concentraciones séricas de lidocaína mayores de 8 mg/ml, propicia el desarrollo de síntomas como: Dificultad para respirar, mareos intensos, pérdida del conocimiento, crisis convulsivas, lentitud en la transmisión eléctrica cardíaca.

TRATAMIENTO DE EMERGENCIA:

El tratamiento del paciente con toxicidad por lidocaína es multidisciplinario, el punto más esencial en el manejo es mantener ventilada la vía aérea, si es necesario mediante ventilación asistida o controlada y abordar sintómicamente al paciente. Si la toxicidad sistémica genera convulsiones, estas deben detenerse. La presencia de síntomas del sistema nervioso central o del sistema cardiovascular en el abordaje implica: Suspender de inmediato la administración del anestésico local, mantener las vías respiratorias abiertas, adicionalmente, suministrar oxígeno, de ser necesario aplicar ventilación artificial con oxígeno puro, asistida o controlada, inicialmente a través de mascarilla y bolsa de aire y después por intubación. 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. Se debe asegurar la volemia mediante el suministro de líquidos por vía intravenosa, dobutamina y si fuera necesario noradrenalina.

PRESENTACIONES:

Caja con 1, 12 y 50 viales de 10 ml; caja con 1, 12 y 50 viales de 20 ml; caja con 1 y 10 viales de 50 ml.

CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:

Conservar en su envase original a temperatura no mayor a 30°C para evitar alteraciones que repercutan en la acción terapéutica del producto.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Guarde este medicamento en su envase original en un lugar fresco, protegido de la luz y la humedad. No use este producto después de la fecha de vencimiento indicada en el envase.

- *Consultar al médico en caso de requerir más información o tenga cualquier inquietud adicional.*
- *En caso de que los síntomas continúen, consultar al médico.*
- *Conservar el prospecto para futura información que se requiera.*



Kronos Laboratorios C. Ltda.

km 8.5 Vía Daule · Teléfonos: 2253143 - 2251445

Q.F. responsable: **Dr. Luis Carlo Paredes.**

www.kronoslaboratorios.com - info@kronoslaboratorios.com

Guayaquil - Ecuador