



NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO (DCI)

LIDOCAINA

2. VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Vía intravenosa (IV), infiltración, bloqueo nervioso periférico y raquídea (espinal).

3. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Antiarrítmicos de clase I y III
Código ATC: C01BB.01

Grupo farmacoterapéutico: Anestésicos locales
Código ATC: N01BB.02

3.1. Farmacodinamia

Como antiarrítmico:

La lidocaína es un agente anestésico local de tipo amida, usada también como antiarrítmico. De acuerdo al esquema de clasificación Vaughan Williams es considerada como antiarrítmico clase Ib. Inhibe el flujo de sodio por los canales rápidos de membrana en las células miocárdicas, prolongando el período de recuperación tras una repolarización.

Suprime el automatismo y disminuye el período refractario efectivo y la duración del potencial de acción en el sistema de His-Purkinje a concentraciones que no afectan el automatismo del nodo sino-auricular. En dosis terapéuticas no genera cambios importantes en la presión arterial ni en la contractilidad miocárdica. Suprime las despolarizaciones ventriculares espontáneas durante la diástole por inhibición de los mecanismos de re-entrada. El tejido auricular es poco sensible a su acción.

La lidocaína actúa predominantemente sobre el tejido isquémico; no parece afectar la excitabilidad del tejido cardíaco normal.

Como anestésico:

Bloquea de manera reversible la generación y conducción de los impulsos a través de las fibras nerviosas (autonómicas, sensoriales y motoras). Se postula que dicha acción es debida a una disminución de la permeabilidad de la





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

membrana neuronal a los iones sodio que da lugar a una reducción de la tasa de despolarización y, consecuentemente, al aumento del umbral de excitabilidad eléctrica y a la inhibición de la propagación del potencial de acción a lo largo de la fibra.

3.2. Farmacocinética

Luego de la administración en bolo IV de una dosis de 50-100 mg la lidocaína produce una respuesta antiarrítmica a los 45-90 segundos que persiste por 10 a 20 minutos. La concentración plasmática necesaria para mantener el efecto se ubica en el rango de 1.5-5 mcg/ml. Niveles superiores se asocian con toxicidad.

Cuando se emplea como anestésico la lidocaína produce una acción casi inmediata cuya duración dependerá de la magnitud de la dosis administrada, del sitio de aplicación, del tiempo de contacto con el tejido y de la vascularización de la zona. Usada para bloqueo epidural en solución al 2% genera un efecto que se mantiene por aproximadamente 100 minutos. En bloqueo caudal con solución al 1-2% la duración del efecto se ubica en el rango de 75-135 minutos. En anestesia espinal 1 ml de la solución al 5% produce bloqueo motor por 100 minutos y bloqueo sensorial adicional por 40 minutos. La administración de 1.5-2 ml de la misma solución genera anestesia espinal por 2 horas.

Se absorbe desde su sitio de aplicación a la circulación sistémica y, al igual que ocurre tras su administración IV, se une a proteínas plasmáticas en un 60-80% y se distribuye de manera bifásica; primero a tejidos de alta perfusión, como: riñones, pulmón, hígado y corazón (vida media inicial: 7-30 minutos) y en una segunda fase, más lenta, a tejido adiposo y músculo esquelético (vida media terminal: 1.5-2 horas). Atraviesa la placenta, la barrera hemato-encefálica y se excreta en la leche materna.

Se metaboliza rápida y extensamente (90%) en el hígado dando lugar a 2 productos, monoetilglicinaxilidida (MEGX) y glicinexilidida (GX), farmacológicamente activos que se eliminan, junto a un 10% de lidocaína inalterada, por la orina. Tanto su vida media como la de sus metabolitos (MEGX: 2 horas y GX: 10 horas), se prolongan en pacientes con insuficiencia renal, enfermedad hepática y en ancianos.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

No se han realizado estudios para evaluar el potencial mutagénico y carcinogénico de la lidocaína, ni sus efectos sobre la fertilidad. En los ensayos de reproducción no se evidenció teratogénesis ni fetotoxicidad.





4. INDICACIONES

- Tratamiento agudo de arritmias ventriculares.
- Anestesia local por infiltración o bloqueo nervioso.
- Anestesia raquídea

5. POSOLOGÍA

5.1. Dosis

Como antiarrítmico:

- Adultos: Dosis inicial de 1-1.5 mg/kg en bolo IV a una velocidad de 25-50 mg/minuto, con repeticiones cada 5-10 minutos (en caso necesario) hasta lograr el control de la arritmia y sin exceder los 200-300 mg en 1 hora, seguido por mantenimiento con infusión IV de 20-50 mcg/kg a velocidad de 1-4 mg/minuto (20-50 mcg/kg/minuto).

El tratamiento debe mantenerse hasta lograrse el restablecimiento y estabilización del ritmo cardíaco normal del paciente, lo cual ocurre en la mayoría de los casos antes de las 24 horas. De ser necesario su uso por más tiempo, se deberá reducir en un 50% la velocidad de infusión.

Como anestésico:

La dosis varía según el procedimiento o técnica anestésica a emplear, el área a anestesiar, la profundidad y duración de anestesia requerida, la concentración del producto y la condición del paciente y su respuesta clínica al fármaco. Por lo general se recomienda usar la más baja dosis efectiva posible y la menor concentración que permita lograr el efecto deseado.

Anestesia local por infiltración o bloqueo nervioso:

- Adultos: 2.5-4.5 mg/kg. No exceder la dosis total de 300 mg.
- Niños: 1.45 mg/kg. No exceder la dosis total de 3 mg/kg.

Anestesia raquídea:

- Adultos: 50 mg/dosis. Dosis máxima: 100mg/dosis.

5.2. Dosis máxima diaria

Las dosis usuales establecidas.





5.3. Dosis en pacientes especiales

Como antiarrítmico:

- **Insuficiencia renal:** No se requieren ajustes de dosificación. Sin embargo, dado que se ha descrito la posibilidad de acumulación de uno de los metabolitos activos de la lidocaína (la glicinexilidida) en pacientes con función renal comprometida, se recomienda usar con precaución.
- **Insuficiencia hepática:** Reducir en un 50% la dosis inicial en bolo IV y la velocidad de infusión de la dosis de mantenimiento.
- **Ancianos:** Reducir en un 50% la dosis inicial en bolo IV y la velocidad de infusión de la dosis de mantenimiento.

Como anestésico:

No es recomendable disminuir la dosis debido a que podría producirse una anestesia insuficiente. Sin embargo, y dada la susceptibilidad de estos pacientes a las reacciones adversas asociadas al fármaco, se debe procurar usar la dosis y concentración más bajas que permitan lograr el efecto deseado.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Como antiarrítmico:

Para la administración de lidocaína por infusión IV se recomiendan soluciones al 0.1% (1mg/ml) ó 0.2% (2 mg/ml).

Para preparar la solución al 0.1% (1 mg/ml) se diluye 1 g de lidocaína en 1000 ml de solución de dextrosa al 5%. Para la solución al 0.2% (2 mg/ml) se diluyen 2 g de lidocaína en 1000 ml de solución de dextrosa al 5%. Ambas soluciones mantienen su estabilidad por 24 horas a temperatura ambiente.

La solución de lidocaína al 0.1% (1 mg/ml) infundida a velocidad de 1-4 ml/minuto, aporta 1-4 mg/minuto. Por su parte, la solución al 0.2% (2 mg/ml) administrada a velocidad de 0.5-2 ml/minuto, proporciona 1-4 mg/minuto.

Como anestésico:

Administrar mediante técnica apropiada de infiltración o bloqueo nervioso, según el objetivo de la anestesia.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Para evitar una inyección intravascular accidental del anestésico deberán realizarse aspiraciones repetidas antes y durante la administración de la dosis. Si aparece sangre en la jeringa, la aguja debe ser reposicionada.

Para niños se recomienda el uso de soluciones con concentración de 0.5-1% a objeto de minimizar la posibilidad de reacciones tóxicas. En caso de ser necesaria su administración en concentraciones menores, diluir con solución de cloruro de sodio al 0.9% hasta la concentración deseada y administrar de inmediato.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas asociadas al uso de lidocaína como antiarrítmico o como anestésico son poco comunes, de corta duración y, por lo general, dependientes de la dosis e involucran al sistema nervioso central (SNC) y sistema cardiovascular. Se han descrito con porcentajes de incidencia y severidad variables:

- **Trastornos del sistema nervioso:** Mareo, confusión, desorientación, estupor, obnubilación, disartria, euforia, decaimiento, agitación, nerviosismo, aprensión, parestesia, ataxia, cansancio, alucinaciones visuales y/o auditivas, sensación de frío o calor, desvanecimiento, inconsciencia, espasmos musculares, temblor y convulsiones.
- **Trastornos cardiovasculares:** Hipotensión, bradicardia, arritmias cardíacas o agravamiento de arritmias pre-existentes, alteraciones del electrocardiograma, bloqueo AV, depresión de la contractilidad y paro cardíaco.
- **Trastornos respiratorios:** Disnea, depresión respiratoria y paro respiratorio.
- **Trastornos del oído y laberinto:** Tinnitus y vértigo.
- **Trastornos oculares:** Visión borrosa, nistagmo y diplopía.
- **Trastornos del sistema inmunológico:** Lesiones dermatológicas, urticaria, edema y reacciones anafilactoides.
- **Trastornos generales:** Dolor, inflamación y sensación de ardor en el sitio de la inyección.





7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

- La cimetidina (por disminución del metabolismo hepático) y el propranolol (presumiblemente debido a una disminución del flujo sanguíneo hepático) pueden disminuir el aclaramiento sistémico de la lidocaína y aumentar consecuentemente sus niveles séricos y riesgos de toxicidad.
- Su co-administración con otros antiarrítmicos (como: procainamida, disopiramida o quinidina) puede generar un efecto depresor cardíaco aditivo.
- La inhibición de la transmisión neuronal que producen los anestésicos locales puede antagonizar el efecto de los inhibidores de colinesterasa (antimiastécicos) sobre el músculo esquelético, en especial si se absorben cantidades elevadas del anestésico.
- La lidocaína IV en dosis elevadas puede potenciar el efecto bloqueante neuromuscular de la succinilcolina.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

- Durante la administración del producto por cualquier vía se debe vigilar de manera constante la función cardíaca y respiratoria, así como el estado de conciencia del paciente. La ocurrencia de mareo, cansancio, ansiedad, tinitus, visión borrosa, temblor y depresión deben ser considerados como signos precoces de toxicidad por lidocaína.
- Para el uso de la lidocaína se debe contar con condiciones y facilidades que garanticen la disponibilidad inmediata de oxígeno, medicamentos y equipos para reanimación cardiopulmonar, además de médicos especializados en el diagnóstico y manejo adecuado de las reacciones tóxicas y emergencias relacionadas.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Como antiarrítmico:

- Si durante la administración IV de lidocaína como antiarrítmico se presentan alteraciones en el electrocardiograma (como prolongación del intervalo PR o del complejo QRS), o si aparecen arritmias o se agravan las pre-existentes, se deberá suspender de inmediato la administración.
- Cuando se emplea lidocaína como antiarrítmico en pacientes con enfermedad hepática, insuficiencia cardíaca, shock cardiogénico y en ancianos (mayores de 70 años) se debe ajustar la dosificación reduciendo en un 50% la dosis inicial en bolo IV y la velocidad de infusión de la dosis de mantenimiento.
- El metabolismo de la lidocaína puede reducirse en presencia de un flujo sanguíneo hepático limitado, como sucede en pacientes con insuficiencia cardíaca o tras un infarto al miocardio. En tales casos, el consecuente aumento de los niveles séricos de lidocaína puede generar toxicidad.
- Usar con precaución en pacientes con enfermedad hepática y/o renal, insuficiencia cardíaca, síndrome de Wolff-Parkinson-White, hipovolemia, hipoxia, depresión respiratoria severa, bradicardia sinusal, miastenia gravis, epilepsia, porfiria y en ancianos.

Como anestésico:

- Durante la anestesia con lidocaína la inyección intravascular accidental puede dar lugar a reacciones adversas de consideración, como: depresión cardiopulmonar y del SNC, convulsiones, coma y paro respiratorio. Para minimizar dicha posibilidad, se debe inyectar la solución lentamente y realizarse aspiraciones repetidas antes y durante la administración a objeto de reposicionar la aguja si se observa sangre en la jeringa.
- Se debe evitar la inyección de lidocaína en una zona inflamada o infectada debido a que puede modificar el pH en el sitio y alterar el efecto anestésico.

8.2. Embarazo

Aunque no se ha evidenciado teratogenicidad en los ensayos experimentales con la lidocaína, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance riesgo-beneficio sea favorable.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

8.3. Lactancia

Dado que la lidocaína se excreta en la leche materna y no se dispone de información sobre su seguridad durante la lactancia, se debe evitar su empleo en ese período. En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

9. CONTRAINDICACIONES

- Hipersensibilidad a la lidocaína, a otros anestésicos de tipo amida y a los excipientes de la fórmula.
- Síndrome de Stokes-Adams.
- Bloqueo cardíaco sino-auricular, aurículo-ventricular o intraventricular.
- Shock severo.
- Inflamación y/o infección en el sitio de la inyección.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis de lidocaína puede generar reacciones sobre el SNC que incluyen: cefalea, parestesia lingual, mareos, desvanecimiento, hiperacusia, visión borrosa, espasmos musculares, convulsiones e inconsciencia. Posterior a las convulsiones pueden aparecer hipoxia e hipercapnia debidas al aumento de la actividad muscular, seguidas por falla respiratoria y, en casos graves, apnea. Si no se recibe tratamiento pueden presentarse complicaciones cardiovasculares como: hipotensión severa, bradicardia, arritmias, bloqueo cardíaco y paro.

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte, con mantenimiento de la vía aérea permeable, oxigenación y medidas de soporte respiratorio (en caso necesario), control de las convulsiones y vigilancia constante de la función cardiovascular. En caso de convulsiones manejar con diazepam o barbitúricos de acción ultracorta (como tiopental) con precaución extrema ante la posibilidad de depresión respiratoria. Si se presenta depresión circulatoria o hipotensión grave administrar fluidos IV y, si la situación lo amerita, agentes vasopresores (preferentemente uno de actividad inotrópica, como la efedrina). La hemodiálisis es de utilidad limitada.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

TEXTO DE ESTUCHE Y ETIQUETAS

USO HOSPITALARIO

Vía de administración: Intravenosa, infiltración local, bloqueo nervioso periférico y raquídea.

Indicaciones y posología: A juicio del facultativo.

Advertencias:

- Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.
- Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

