



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

LIDOCAINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA TOPICA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Anestésicos locales

Código ATC: N01BB.02

3.1. Farmacodinamia

La lidocaína es un agente anestésico local de tipo amida. Bloquea de manera reversible la generación y conducción de los impulsos a través de las fibras nerviosas (autónomas, sensoriales y motoras). Se postula que dicha acción es debida a una disminución de la permeabilidad de la 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

La absorción sistémica de la lidocaína posterior a su administración tópica es variable y dependiente de la dosis total empleada, del área o sitio específico tratado, del tiempo o duración de la exposición y de las condiciones del tejido sobre el cual se aplica.

Por lo general su absorción es escasa a través de la piel intacta, pero significativa cuando se aplica sobre piel erosionada, quemaduras o heridas. Se absorbe bien y rápidamente cuando se aplica sobre membranas mucosas. Dosis excesivas, uso muy frecuente o su empleo por períodos prolongados pueden dar lugar a niveles plasmáticos elevados y a la posibilidad de reacciones adversas. Concentraciones séricas superiores a 5 mcg/ml se asocian con toxicidad.

Tras su administración en mucosa oral produce un efecto anestésico apreciable en 0.5-2 minutos. En mucosa genital y ano-rectal (hemorroides) la acción se evidencia antes de los 5 minutos, similar a lo observado con la aplicación en otras zonas.

Una vez absorbida sistémicamente la lidocaína se une a proteínas plasmáticas en un 60-80% y se distribuye bifásicamente a los tejidos corporales mostrando una vida media terminal de 1.5-2 horas. Atraviesa la barrera hemato-encefálica, la placenta y se excreta en la leche materna.





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

- Alivio sintomático de afecciones dermatológicas superficiales como prurito y dolor asociados a quemaduras menores y picaduras de insectos.
- Anestesia genitourinaria para intervenciones superficiales menores y uretrales, citoscopia, cateterismo, cistitis, uretritis y exploración de sondeo.
- Tratamiento de las afecciones dolorosas de la mucosa bucofaringea.
- Tratamiento del dolor de muelas persistente de carácter pulsátil.
- Tratamiento de las molestias gingivales asociadas a la dentición en lactantes.
- Anestesia tópica bucal previa a procedimientos odontológicos.
- Tratamiento del dolor neuropático localizado.
- Tratamiento del dolor neuropático asociado a infección previa por herpes zoster.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Afecciones dermatológicas superficiales:

- Pomada al 5%
Adultos: 1 aplicación en la zona afectada 2-3 veces al día.
- Ungüento al 2%
Adultos: 1 aplicación en la zona afectada 2-3 veces al día.
- Solución al 10%
Adultos: 1 aplicación en la zona afectada 2-3 veces al día.

Anestesia genitourinaria:

- Gel al 2%
Adultos: 5-10ml (100-200 mg) intrauretral en hombres ó 3-5 ml (60-100 mg) en mujeres. No exceder los 30 ml (600 mg) en un período de 12 horas.





Afecciones dolorosas de la mucosa bucofaríngea:

- Gel al 0.5%
Adultos: 1 ó 2 aplicaciones 2-3 veces al día.
- Solución viscosa al 2%
Adultos: 5-10 ml como enjuague bucal o gargarismo.

Dolor de muelas:

- Solución al 1%
Adultos: Aplicar mediante algodón impregnado con 1-2 gotas de la solución y mantener contacto por 1 minuto, 4 veces por día.

Molestias gingivales asociadas a la dentición en lactantes:

- Gel al 0.5%
Niños mayores de 3 meses: 1 ó 2 aplicaciones 2-3 veces al día.

Anestesia tópica bucal previa a procedimientos odontológicos:

- Ungüento hidrosoluble al 5%:
Adultos: 1 aplicación en la zona a tratar.

Dolor neuropático localizado:

- Parches 5%
Adultos: 1-3 parches (sobre piel intacta) en la zona afectada por 12 horas continuas, seguido por un período de 12 horas sin tratamiento.

Dolor neuropático asociado a infección previa por herpes zoster:

- Parches 5%
Adultos: 1-3 parches (sobre piel intacta) en la zona afectada por 12 horas continuas, seguido por un período de 12 horas sin tratamiento.

5.2. Dosis máxima diaria

Las dosis usuales establecidas. El uso excesivo o más frecuente no genera beneficios adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en pacientes especiales

Insuficiencia renal: No se requieren ajustes de dosificación.

Insuficiencia hepática: No se requieren ajustes de dosificación.

Ancianos: No se requieren ajustes de dosificación





5.4. Modo de empleo o forma de administración

- Pomada al 5%, Ungüento al 2% y Solución al 10%:
Aplicar con masaje suave una capa delgada del producto suficiente para cubrir la zona afectada.
- Solución viscosa al 2%:
Enjuagar la cavidad bucal o hacer gárgaras con 5-15 ml de la solución por 10-15 segundos y escupir después. No tragar. Evitar comidas y/o bebidas hasta 1 hora después de usado el producto.
- Gel al 2% (para anestesia uretral):
Instilar 5-10ml (en hombres) ó 3-5 ml (en mujeres) intrauretral en pequeñas porciones unos minutos antes del procedimiento.
- Solución al 1% (para dolor de muelas):
Adultos: Aplicar mediante algodón impregnado con 1-2 gotas de la solución y mantener contacto por 1 minuto, 4 veces por día.
- Gel al 0.5% (para molestias gingivales asociadas a la dentición):
Aplicar y frotar con la yema del dedo en el área a anestésiar.
- *Ungüento hidrosoluble al 5%* (para anestesia local previa a procedimientos odontológicos):
Aplicar y frotar con la yema del dedo en el área a anestésiar.
- Parches 5%:
1-3 parches en el área afectada por 12 horas continuas, en un período de 24 horas. Antes de usar el parche lavar y secar bien el área donde será aplicado. Los parches pueden ser cortados con tijera en trozos pequeños para ajustarlos al área afectada. Aplicar los parches sólo sobre piel intacta; evitar su colocación sobre lesiones o heridas. Pegar o adherir el parche con presión sobre el área afectada. No deben usarse más de 3 parches por dosis.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas asociadas al uso tópico de lidocaína son poco comunes, transitorias, dependientes de la dosis y, en su mayoría, circunscritas al sitio de aplicación, a excepción de las inmunológicas que podrían incluir en algunos casos el shock anafiláctico. Se han reportado con porcentajes de incidencia y severidad variables:

- **Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo:** Lesión cutánea, erupción, escozor, irritación, eritema, edema local, alteraciones sensoriales en la percepción de temperatura.





- **Trastornos del sistema inmunológico:** Reacciones anafilactoides (urticaria, dermatitis por contacto, angioedema, laringoespasma, disnea, broncoespasmo y shock).
- **Trastornos generales:** Visión borrosa, tinnitus, sabor metálico, náuseas, vómito, astenia, metahemoglobinemia.

Es posible la ocurrencia de reacciones sistémicas por niveles sanguíneos elevados debidos a una dosificación excesiva y/o a una rápida absorción, en cuyo caso cabe esperar manifestaciones similares a las observadas con la administración por vía parenteral, que incluyen:

- **Trastornos del sistema nervioso:** Mareo, confusión, desorientación, decaimiento, agitación, nerviosismo, aprensión, parestesia, cansancio, sensación de frío o calor, estupor, desvanecimiento, inconsciencia, espasmos musculares, temblor y convulsiones.
- **Trastornos cardiovasculares:** Hipotensión, bradicardia, arritmias cardíacas, alteraciones del electrocardiograma, bloqueo y paro cardíaco.
- **Trastornos respiratorios:** Depresión respiratoria y paro respiratorio.
- **Trastornos generales:** Visión borrosa, tinnitus, sabor metálico, náuseas, vómito, astenia.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Aunque es poco probable la ocurrencia de interacciones medicamentosas con la administración tópica de lidocaína en las dosis recomendadas, no puede descartarse su posibilidad. En tal sentido, se debe considerar que:

- 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 antiarrítmicos (como: procainamida, disopiramida o quinidina) puede generar un efecto depresor cardíaco aditivo.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.





8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

- La dosificación excesiva de lidocaína tópica o su aplicación en áreas extensas, al igual que su empleo muy frecuente y/o por tiempo prolongado, puede generar concentraciones séricas elevadas del fármaco y la posibilidad de reacciones adversas que involucran, en su fase inicial, al sistema nervioso central y, posteriormente, al sistema respiratorio y cardiovascular. La ocurrencia de cefalea, mareo, cansancio, ansiedad, tinnitus, visión borrosa, temblor y depresión durante el tratamiento deben ser considerados como signos precoces de toxicidad por lidocaína. En tales casos, se deberá suspender el uso y aplicar las medidas de soporte y manejo sintomático que correspondan.
- La aplicación de lidocaína sobre mucosas o piel erosionada, hemorroides sangrantes, quemaduras o heridas abiertas aumenta la posibilidad de absorción sistémica y riesgos de toxicidad.
- La aplicación en una zona inflamada o infectada puede modificar el pH en el sitio y alterar el efecto anestésico.
- Evitar el contacto con los ojos. En caso de ocurrir, lavar con abundante agua fresca. (No aplicable a la presentación *Parches 5%*).
- El metabolismo de la lidocaína puede reducirse en presencia de un flujo sanguíneo hepático limitado, como sucede en pacientes con insuficiencia cardíaca o que reciben bloqueantes beta-adrenérgicos como el propranolol. En tales casos, el consecuente aumento de los niveles séricos de lidocaína puede generar toxicidad.
- Cuando se emplea lidocaína en aerosol, solución, pastillas o gel en boca y garganta, la pérdida temporal de sensibilidad en la zona puede dar lugar a lesiones en la mucosa oral, paladar, lengua o labios en pacientes que ingieren y/o mastican alimentos, o bien tener alteraciones de la deglución con el riesgo implícito de aspiración bronquial. Por ello, se debe evitar comer o beber por lo menos 1 hora después de la medicación.
- Usar con precaución en pacientes con enfermedad hepática y/o renal grave, insuficiencia cardíaca, bradicardia, bloqueo cardíaco total o parcial, epilepsia y en ancianos.

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. Por lo tanto, su empleo durante la gestación debe limitarse a situaciones de estricta necesidad en las que el balance riesgo/beneficio, a criterio médico, sea favorable.

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.
- Heridas y/o infección en el sitio de aplicación.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosificación de lidocaína tópica (por uso excesivo, muy frecuente y/o por tiempo prolongado) puede dar lugar a concentraciones séricas elevadas y, consecuentemente, a la ocurrencia de toxicidad. Casos graves pueden cursar con reacciones sobre el sistema nervioso central que incluyen: cefalea, parestesia lingual, mareo, ansiedad, depresión, 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. En caso de metahemoglobinemia tratar con azul de metileno al 1% 0.1 mg/kg IV por 10 minutos. La hemodiálisis es de poca utilidad.





11. TEXTO DE ETIQUETA Y EMPAQUE

11.1. PARA ADMINISTRACION POR VIA TOPICA

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, ni durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

Evite el contacto con los ojos. En caso de ocurrir, enjuague con abundante agua fresca. (No aplicable a la presentación *Parches 5%*).

No exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

11.2. SOLO PARA LA PRESENTACION GEL AL 0.5% DE USO EN ADULTOS

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica bucal.

INDICACIONES: Tratamiento de las afecciones dolorosas de la mucosa bucofaríngea.

POSOLÓGIA (Dosis recomendada): Adultos: 1 ó 2 aplicaciones 2 a 3 veces al día.

ADVERTENCIA:

Si está embarazada o en período de lactancia, consulte al médico antes de usar este producto.

Si los síntomas persisten con el uso de este medicamento, suspéndalo y consulte al médico.

No debe aplicarse en tejidos infectados.

No usar por tiempo prolongado.

No exceda la dosis recomendada.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

11.3. SOLO PARA LA PRESENTACION GEL AL 0.5% DE USO EN NIÑOS MAYORES DE 3 MESES

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica bucal.

INDICACIONES: Alivio del dolor de las encías causado por la dentición.





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>

POSOLOGIA (Dosis recomendada): Niños mayores de 3 meses: 1 o 2 aplicaciones
2 a 3 veces al día.

ADVERTENCIAS:

Si los síntomas persisten con el uso de este medicamento, suspéndalo y consulte al médico.

No debe aplicarse en tejidos infectados.

No usar por tiempo prolongado.

No exceda la dosis recomendada.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCION FACULTATIVA

11.4. SOLO PARA LA PRESENTACION UNGÜENTO HIDROSOLUBLE AL 0.5%

USO ODONTOLOGICO.

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica bucal.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIA:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia del odontólogo y/o médico.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

