



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

LIDOCAINA – EPINEFRINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

INFILTRACION LOCAL O BLOQUEO NERVIOSO

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Anestésicos locales
Código ATC: N01BB.52

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.

La epinefrina es una amina simpatomimética cuyo efecto agonista sobre los receptores alfa-adrenérgicos vasculares provoca una vasoconstricción en la zona de aplicación que enlentece la absorción sistémica de la lidocaína, prolongando su permanencia en el sitio y, con ello, generando un efecto anestésico local más duradero, a la vez que permite una mejor visualización del campo quirúrgico por disminución del sangrado local.

La combinación de de ambos agentes se formula como solución inyectable de lidocaína en concentraciones de 0.5 a 2% con epinefrina en concentraciones de 0.002 a 0.02 mg/ml (1:500.000 a 1:50.000).

3.2. Farmacocinética

Luego de su inyección la lidocaína produce un efecto anestésico cuyo inicio y duración dependerán 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.

Una vez absorbida sistémicamente 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,





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>

monoetilglicinaxilidida (MEGX) y glicinexilidida (GX), farmacológicamente activos que se eliminan, junto a un 10% de lidocaína inalterada, por la orina. Tanto la vida media de la lidocaína como la de sus metabolitos (MEGX: 2 horas y GX: 10 horas), se prolongan en pacientes con insuficiencia cardíaca, enfermedad hepática y en ancianos.

La epinefrina absorbida es degradada en el hígado y otros tejidos por las enzimas monoaminooxidasa y catecol-o-metiltransferasa y excretada en la orina como metabolitos inactivos y en pequeñas cantidades como fármaco intacto.

3.3. Información preclínica 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

Anestesia local.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

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 menos concentración que permita lograr el efecto deseado.

La dosis en adultos (referida a lidocaína) no debe exceder de 7 mg/kg o la dosis total de 500 mg.

5.2. Dosis máxima diaria

La dosis usual establecida.

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.

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.





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>

5.4. Modo de empleo o forma de administración

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

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.

6. REACCIONES ADVERSAS

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

Con lidocaína:

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

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 o agravamiento de arritmias preexistentes, alteraciones del electrocardiograma, bloqueo y paro cardíaco.

Trastornos respiratorios: Disnea, depresión respiratoria y paro respiratorio.

Trastornos del oído y laberinto: Tinnitus; vértigo.

Trastornos oculares: Visión borrosa 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.

Con epinefrina:

Las reacciones adversas asociadas a la epinefrina son muy raras a las concentraciones presentes en los anestésicos locales que la contienen.





Sin embargo, en algunos pacientes se han descrito casos de hipertensión, taquicardia y trastornos del ritmo cardíaco.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Con lidocaína:

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.

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.

Con epinefrina:

Las fenotiazinas pueden reducir o revertir el efecto vasopresor de la epinefrina.

Los antidepresivos tricíclicos y los inhibidores de la monoaminoxidasa pueden incrementar el efecto vasopresor de la epinefrina y dar lugar a hipertensión. Con alcaloides del ergot puede ocurrir hipertensión severa y persistente, con posibilidad de accidente cerebrovascular.

La coincidencia de epinefrina con bloqueantes beta-adrenérgicos puede dar lugar a una actividad alfa-adrenérgica sin oposición con riesgo de hipertensión y bradicardia excesiva.

El uso conjunto de lidocaína + epinefrina y anestésicos generales halogenados (como halotano y enflurano) puede generar arritmias cardíacas.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

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 con entrenamiento en el uso de anestésicos, así





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 en el diagnóstico y manejo adecuado de las reacciones tóxicas y emergencias relacionadas (No aplicable a productos de uso odontológico).

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.

Durante la administración del producto 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.

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.

La inyección de lidocaína en una zona inflamada o infectada puede modificar el pH en el sitio y alterar el efecto anestésico.

La lidocaína se debe 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.

Debido al contenido de epinefrina también se debe usar con precaución en pacientes con enfermedad isquémica cardíaca, hipertensión severa, arritmias ventriculares, hipertiroidismo, tirotoxicosis, diabetes mellitus, arterioesclerosis, feocromocitoma e insuficiencia vascular cerebral.

No es recomendable el uso de lidocaína con epinefrina para anestesia local en áreas o zonas corporales distales irrigadas por arterias terminales (como dedos, pabellón auricular, nariz o pene) o con irrigación sanguínea comprometida, debido a la posibilidad de necrosis isquémica (No aplicable a productos de uso odontológico). Las soluciones de lidocaína con epinefrina no deben ser usadas por vía IV.

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





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>

su existencia a menos que a criterio médico el balance riesgo-beneficio 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.
- Síndrome de Stokes-Adams.
- Bloqueo cardíaco sino-auricular, aurículo-ventricular o intraventricular.
- Shock severo.
- Inflamación y/o infección en el sitio de la inyección.
- Taquicardia paroxística (por el contenido de epinefrina).
- Glaucoma de ángulo estrecho (por el contenido de epinefrina).
- Administración por vía intravenosa (por el contenido de epinefrina).

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis de lidocaína puede generar 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. 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>

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

USO HOSPITALARIO Y EN CONSULTORIO ODONTOLÓGICO

VIA DE ADMINISTRACION: Infiltración local o bloqueo nervioso.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: 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.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

Administración por vía intravenosa.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

