



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>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

CETILPIRIDINIO - LIDOCAINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

TOPICA BUCAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Preparados para la garganta. Antisépticos - Anestésicos.
Código ATC: R02AA06 - R02AD02.

3.1. Farmacodinamia

Cetilpiridinio

El cetilpiridinio es un surfactante catiónico derivado de amonio cuaternario con actividad bactericida frente a diversos patógenos Gram (+) y Gram (-) comunes en los procesos infecciosos de la mucosa bucofaringea. Para los compuestos de amonio cuaternario se han propuesto diversos mecanismos de acción que incluyen la alteración estructural de la membrana celular, la desnaturalización de las proteínas y la inhibición enzimática. La evidencia experimental sugiere que el cetilpiridinio actúa sobre la pared bacteriana generando cambios en su permeabilidad que provocan la pérdida o salida de elementos intracelulares vitales y, consecuentemente, la muerte del microorganismo.

Lidocaína

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, con ello, 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

Cetilpiridinio

No existe información disponible sobre la farmacocinética del cetilpiridinio en humanos. Tras su administración tópica bucal como antiséptico de la mucosa orofaríngea se estima una absorción sistémica muy limitada y carente de importancia clínica.

Lidocaína

Absorción

Tras su administración tópica en formulaciones para afecciones bucofaringeas la lidocaína produce un efecto anestésico local apreciable en 0,5 - 2 minutos. Se absorbe sistémicamente en proporción variable y dependiente de la dosis total empleada, del





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.gov.ve>

tiempo o duración de la exposición y de las condiciones del tejido sobre el cual actúa. Una pequeña fracción es tragada y absorbida en el tracto gastrointestinal.

Distribución

Se une a proteínas plasmáticas en un 60 - 80% y se distribuye bifásicamente a los tejidos. Atraviesa la barrera hematoencefálica, la placenta y difunde en pequeña magnitud a la leche materna.

Biotransformación

Se metaboliza extensamente (90%) en el hígado dando lugar a 2 productos farmacológicamente activos.

Eliminación

Los productos resultantes de su metabolismo se eliminan, junto a menos de un 10% de lidocaína inalterada, por la orina.

Exhibe una vida media de eliminación terminal de 1 - 2 horas que se prolonga (al igual que la de sus metabolitos) en pacientes con insuficiencia cardíaca, enfermedad hepática y en pacientes de edad avanzada.

Insuficiencia renal

La disfunción renal no afecta de manera importante la farmacocinética.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Cetilpiridinio

Los ensayos realizados con compuestos de amonio cuaternario en general revelan que dichos agentes carecen de potencial carcinogénico, mutagénico, teratogénico o deletéreo sobre la fertilidad.

Lidocaína

No se han realizado estudios para evaluar el potencial carcinogénico y mutagénico 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 las afecciones infecciosas leves de boca y garganta que cursan con dolor.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos y niños mayores de 12 años

Pastilla o tableta para disolver en la boca con cetilpiridinio 2 mg y lidocaína 1,5 mg:

1 pastilla cada 3 o 4 horas.

Dosis máxima: 8 pastillas / día.





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>

Solución tópica bucal (colutorio) en spray o atomizador con cetilpiridinio 0,3 mg/mL y lidocaína 5 mg/mL:

1 o 2 aplicaciones cada 6 horas.

Dosis máxima: 8 aplicaciones / día.

5.2. Dosis máxima

Las dosis señaladas. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal / Insuficiencia hepática

La dosis usual recomendada.

Edad avanzada (≥ 65 años)

La dosis usual recomendada.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Pastillas para disolver en la boca:

Disolver la pastilla en la boca lentamente, sin masticar ni tragarla entera.

Evitar comidas y bebidas hasta 1 hora después de usado el producto.

No usar en exceso, con mayor frecuencia, ni por más tiempo del recomendado.

Solución tópica bucal (colutorio) en spray o atomizador:

Cuando se usa por primera vez, se debe presionar el dispositivo atomizador varias veces al vacío hasta obtener una dispensación regular.

Introducir el aplicador en la boca en dirección al área afectada y presionar 1 o 2 veces (según la dosis) el dispositivo atomizador.

Evitar comidas y bebidas hasta 1 hora después de la aplicación.

No aplicar en exceso, con mayor frecuencia, ni por más tiempo del recomendado.

6. REACCIONES ADVERSAS

Se han reportado con porcentajes de incidencia y severidad variables:

Trastornos del sistema inmunológico

Reacciones de hipersensibilidad (incluyendo: erupción, angioedema y anafilaxia).

Trastornos gastrointestinales

Irritación de la mucosa bucofaríngea (con el uso prolongado y/o muy frecuente), sensación punzante o de ardor en la boca, alteración del sentido del gusto, náuseas.

“Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a





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 uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: http://inhrr.gob.ve/?page_id=4493.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No existen reportes de interacción medicamentosa con la administración tópica bucal de cetilpiridinio - lidocaína. La escasa absorción sistémica de ambos, sumada a sus bajas concentraciones en el producto, hacen poco probable la ocurrencia de alguna interacción clínicamente importante.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

En condiciones normales de uso racional, la absorción al torrente sanguíneo de cetilpiridinio - lidocaína tras su aplicación tópica bucal es muy baja y, por lo tanto, poco probable la ocurrencia de efectos adversos sistémicos asociados al producto. Sin embargo, no debe descartarse la posibilidad de reacciones de hipersensibilidad.

La dosificación excesiva del producto, al igual que su empleo muy frecuente y/o por tiempo prolongado, podría generar concentraciones séricas elevadas de lidocaína y la posibilidad de reacciones adversas que involucran en su fase inicial al sistema nervioso central y, posteriormente, al sistema respiratorio y cardiovascular.

Cuando se emplea lidocaína en formulaciones de uso tópico bucal 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 cardíaca, insuficiencia hepática y en edad avanzada.

8.2. Embarazo

Aunque no existe evidencia experimental de fetotoxicidad asociada al cetilpiridinio o a la lidocaína, no se dispone de estudios clínicos adecuados que demuestren la seguridad de dichos principios activos en mujeres embarazadas. Por lo tanto, el uso de éstos durante la gestación debe limitarse a situaciones de estricta necesidad en las que el balance beneficio/riesgo, a criterio médico, 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

Tras su administración tópica bucal la lidocaína excretada en la leche materna es de escasa magnitud y pobremente absorbida por el infante. La evidencia disponible plantea que la administración del producto durante la lactancia no parece representar un problema potencial. Con relación al cetilpiridinio, se desconoce si difunde a la leche materna y si ello, en caso de ocurrir, podría significar un riesgo para el lactante. Se recomienda usar el producto con precaución en madres que amamantan a sus hijos y sólo tras la valoración previa del balance beneficio/riesgo.

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No hay estudios con el producto.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han descrito casos de sobredosificación por administración tópica bucal de la combinación cetilpiridinio - lidocaína. En principio, no cabe esperar que ocurran manifestaciones clínicamente importantes dadas la limitada absorción sistémica de los principios activos y la baja concentración de los mismos en el producto. Sin embargo, ante la ingestión de un volumen excesivo de la solución o de un muy elevado número de pastillas se debe considerar la posibilidad de reacciones adversas asociadas a la lidocaína, como: náuseas; vómitos, cefalea, mareo, ansiedad, hiperacusia, visión borrosa, espasmos musculares y, en casos extremos, arritmias cardíacas, hipotensión, trastornos respiratorios y/o convulsiones.

10.2. Tratamiento

En caso de ingestión reciente (menos de 60 minutos) de cantidades elevadas se recomiendan medidas orientadas a prevenir la absorción gastrointestinal (emesis o lavado gástrico, según la condición del paciente, más carbón activado), seguido por tratamiento sintomático y de soporte.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

Pastilla o tableta masticable

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica bucal.

INDICACIONES: Alivio sintomático de las afecciones infecciosas leves de boca y garganta que cursan con dolor.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





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):

Adultos y niños mayores de 12 años: 1 pastilla o tableta cada 3 o 4 horas.

Dosis máxima diaria: 8 pastillas.

MODO DE USO: Disuelva la pastilla en la boca lentamente, sin masticar ni tragarla entera. Evite comidas y bebidas hasta 1 hora después de usado el producto.

ADVERTENCIAS:

Si los síntomas persisten por más de 3 días o la condición se agrava con el uso de este medicamento, suspéndalo y consulte al médico.

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

En caso de niños, consulte al médico antes de usar este producto.

No exceda la dosis recomendada.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de usar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCION FACULTATIVA

Solución en spray o atomizador

VIA DE ADMINISTRACION: Tópica bucal.

INDICACIONES: Alivio sintomático de las afecciones infecciosas leves de boca y garganta que cursan con dolor.

POSOLOGIA (Dosis recomendada):

Adultos y niños mayores de 12 años: 1 o 2 aplicaciones cada 6 horas.

Dosis máxima diaria: 8 aplicaciones.

MODO DE USO:

Cuando se usa por primera vez, presione el dispositivo atomizador varias veces al vacío hasta obtener una dispensación regular.

Introduzca el aplicador en la boca en dirección al área afectada y presione 1 o 2 veces (según la dosis) el dispositivo atomizador.

Evite comidas y bebidas hasta 1 hora después de la aplicación.

ADVERTENCIAS:

Si los síntomas persisten por más de 3 días o la condición se agrava con el uso de este medicamento, suspéndalo y consulte al médico.

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

En caso de niños, consulte al médico antes de usar este producto.

No exceda la dosis recomendada.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de usar este producto, leer el prospecto interno.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





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>

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

SIN PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Julio de 2022



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel "

