



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

ARTICAINA - EPINEFRINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

INFILTRACION SUBMUCOSA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Anestésicos locales. Amidas.

Código ATC: N01BB58.

3.1. Farmacodinamia

La articaína es un agente anestésico local del 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 conduce 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.

La epinefrina es una amina simpatomimética cuyo efecto agonista sobre los receptores alfa-adrenérgicos vasculares produce una vasoconstricción en la zona de aplicación que enlentece la absorción sistémica de la lidocaína, prolongando así su permanencia en el sitio y la consecuente duración del efecto anestésico local.

3.2. Farmacocinética

Posterior a su inyección submucosa la articaína (en solución al 4% combinada con epinefrina 1:100.000) provoca un efecto anestésico local apreciable entre 1 y 6 minutos que persiste por aproximadamente 1 hora. Se absorbe en la circulación sistémica generando concentraciones pico en 22 - 25 minutos y se une a proteínas plasmáticas en un 60 - 80%. Es biotransformada por enzimas carboxiesterasas séricas, y en escasa magnitud (5 - 10%) por el citocromo P-450, en metabolitos inactivos que se excretan por la orina junto a un 2% de articaína intacta. Exhibe una vida media de eliminación aproximada de 40 minutos.

La epinefrina sistémicamente absorbida es degradada en el hígado y otros tejidos por las enzimas monoaminoxidasa y catecol-o-metiltransferasa a productos inactivos que se eliminan por vía renal, junto a pequeñas cantidades de fármaco inalterado.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

3.2. Información preclínica sobre seguridad

No se han realizado estudios a largo plazo en animales para evaluar el potencial carcinogénico de la articaína y las pruebas de mutagenicidad practicadas (ensayos *in vivo* de micronúcleos de ratón con y sin epinefrina, ensayo *in vitro* de aberración cromosómica en células ováricas de hámster chino y test de Ames) resultaron negativas.

Los estudios de reproducción en conejos hembras expuestas durante la gestación a dosis de articaína 4% y epinefrina 1:100.000 equivalentes a 4 veces la dosis máxima recomendada en humanos (DMRH) mostraron una incidencia elevada de mortalidad fetal y anomalías esqueléticas que fueron atribuidas a toxicidad materna. De hecho, en ensayos similares, pero con dosis de la combinación 2 veces superiores a la DMRH en conejos y ratas, no se observó la toxicidad embriofetal. Tampoco se reportaron efectos adversos sobre la fertilidad

4. INDICACIONES

Anestesia local por infiltración en procedimientos odontológicos.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Aplicable a la presentación: Articaína 4% (40 mg/mL) - Epinefrina 1:100.000 (0,010 mg/mL). Solución inyectable en ampollas.

La dosis del producto varía según la técnica anestésica a emplear, el área a anestésiar (su extensión), la duración estimada del procedimiento odontológico a realizar, la profundidad de anestesia requerida, la concentración del producto, la edad, peso y estado del paciente y su respuesta clínica al fármaco. Por lo general, se recomienda administrar la menor dosis posible que produzca el efecto anestésico deseado.

La dosis usual en adultos de la articaína no debe exceder de 7 mg/kg o un total de 500 mg (equivalente a 12,5 mL de la solución inyectable).

En niños a partir de 4 años, similar al caso anterior, la dosis debe individualizarse según necesidad y no exceder de 7 mg/kg.

5.2. Dosis máxima

La dosis señalada (7 mg/kg). El uso en exceso no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

Dado que no se ha estudiado la dosificación del producto en estos pacientes, se recomienda usar con precaución y emplear la dosis efectiva más baja posible.

Insuficiencia hepática

Dado que no se ha estudiado la dosificación del producto en estos pacientes, se recomienda usar con precaución y emplear la dosis efectiva más baja posible.

Edad avanzada (≥ 65 años)

Dado que no se ha estudiado la dosificación del producto en estos pacientes, se recomienda usar con precaución y emplear la dosis efectiva más baja posible.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Articaína 4% (40 mg/mL) - Epinefrina 1:100.000 (0,01 mg/mL) - solución inyectable

Administrar mediante técnica apropiada de infiltración submucosa para anestesia dental.

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

Injectar la solución lentamente (en 30 a 60 segundos) para reducir el dolor asociado al procedimiento.

6. REACCIONES ADVERSAS

Aplicable a la combinación de articaína clorhidrato 4% y epinefrina 1:100.000 en solución inyectable.

Las reacciones se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Infecciones e infestaciones

Frecuentes: Gingivitis.

Trastornos del sistema inmunológico

Raras: Reacciones de hipersensibilidad (anafilácticas y anafilactoides).



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Trastornos psiquiátricos

Raras: Nerviosismo, ansiedad.

Frecuencia no conocida: Euforia.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea, neuralgia (dolor neuropático), hipoestesia/entumecimiento (oral y perioral), hiperestesia, disestesia (oral y perioral) que incluyen: disgeusia, ageusia, alodinia y termohiperestesia.

Poco frecuentes: Sensación de ardor.

Raras: Trastorno nervioso facial (parálisis y paresia), síndrome de Horner (ptosis palpebral, enoftalmos, miosis), somnolencia, nistagmo.

Muy raras: Parestesia (hipoestesia persistente y pérdida del gusto) tras el bloqueo nervioso mandibular o alveolar inferior.

Trastornos oculares

Raras: Diplopía, alteraciones visuales (ceguera temporal), ptosis, miosis, enoftalmos.

Trastornos del oído y del laberinto

Raras: Hiperacusia, acúfenos.

Trastornos cardiacos

Frecuentes: Bradicardia, taquicardia.

Raras: Palpitaciones.

Frecuencia no conocida: Trastornos de conducción (bloqueo auriculo-ventricular).

Trastornos vasculares

Frecuentes: Hipotensión (con posibilidad de colapso circulatorio).

Poco frecuentes: Hipertensión.

Raras: Sofoco.

Frecuencia no conocida: Hiperemia local/regional, vasodilatación, vasoconstricción.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Raras: Broncoespasmo/asma, disnea.

Frecuencia no conocida: Disfonía (ronquera).

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Hinchazón de la lengua, los labios y las encías.

Poco frecuentes: Estomatitis, glositis, náuseas, vómitos, diarrea.

Raras: Exfoliación/ulceración gingival o de la mucosa oral.

Frecuencia no conocida: Disfagia, hinchazón de las mejillas, glosodinia.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Erupción, prurito.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Raras: Angioedema, urticaria.
Frecuencia no conocida: Eritema, hiperhidrosis.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo

Poco frecuentes: Dolor de cuello.
Raras: Contracción muscular.
Frecuencia no conocida: Empeoramiento de las manifestaciones neuromusculares del síndrome Kearns-Sayre, trismus.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Poco frecuentes: Dolor en el sitio de inyección.
Raras: Exfoliación/necrosis en el lugar de inyección, fatiga, astenia, escalofríos.
Frecuencia no conocida: Hinchazón local, sensación de calor, sensación de frío.

"Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita a los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: www.inhrr.gob.ve".

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

El uso concomitante de articaína/epinefrina y anestésicos generales halogenados (como halotano y enflurano) puede provocar arritmias cardíacas.

La administración de sedantes (por ejemplo: benzodiazepinas) en pacientes que reciben anestésicos locales como la articaína puede conducir a un efecto depresor aditivo sobre el sistema nervioso central (SNC).

Los antidepresivos tricíclicos, los bloqueantes beta-adrenérgicos no selectivos y los inhibidores de la enzima monoaminoxidasa pueden incrementar el riesgo de hipertensión asociado a la epinefrina. Con alcaloides del ergot puede ocurrir hipertensión severa y persistente, con posibilidad de accidente cerebrovascular.

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

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No descritas.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Durante la anestesia con articaína/epinefrina 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.

Tras la administración de articaína/epinefrina se debe vigilar de manera constante la función cardíaca y respiratoria, así como el estado de conciencia del paciente. Si se presentan mareos, inquietud, ansiedad, desorientación, tinnitus, visión borrosa, temblor y/o depresión se debe considerar la posibilidad de toxicidad asociada al producto.

La inyección del producto en un área inflamada o infectada puede reducir el efecto anestésico.

Se recomienda usar con precaución en pacientes con disfunción renal y/o hepática severa, función respiratoria alterada, trastornos cardiovasculares (como: insuficiencia cardíaca, bloqueo cardíaco, infarto de miocardio reciente, arritmias cardíacas o hipertensión), miastenia gravis, epilepsia, porfiria y en ancianos.

Debido al contenido de epinefrina, el producto debe usarse también con precaución en pacientes con diabetes, tirotoxicosis, hipertensión, susceptibilidad al glaucoma de ángulo cerrado, feocromocitoma, insuficiencia cerebrovascular y, en general, cualquier condición que pudiese agravarse por la acción de la epinefrina.

La eficacia y seguridad del producto en niños menores de 4 años no han sido establecidas.

8.2. Embarazo

Aunque en los ensayos experimentales no hubo evidencias de toxicidad embrionofetal con dosis de articaína/epinefrina hasta 2 veces superiores a la DMRH, no existen estudios clínicos adecuados que demuestren la seguridad del uso combinado de dichos fármacos (para anestesia bucal) en mujeres embarazadas. Por lo tanto, la aplicación del producto durante la gestación debe limitarse a situaciones de real necesidad, en las que el balance riesgo/beneficio, a criterio del odontólogo, sea favorable.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si la articaína se excreta en la leche materna y no se dispone de información sobre la seguridad de su uso durante la lactancia, se recomienda extraer y descartar la leche durante las 5 horas siguientes a la administración del producto y restablecer la lactancia después.

8.4. Fertilidad

Los estudios preclínicos con dosis de articaína/epinefrina 2 veces superiores a la DMRH no mostraron trastornos o alteraciones de la capacidad reproductiva en los animales estudiados.

8.5. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No aplicable.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la articaína, a otros anestésicos de tipo amida y a los excipientes de la fórmula.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis del producto puede dar lugar a manifestaciones que incluyen: trastornos del SNC (como: cefalea, inquietud, agitación, confusión, vértigo, mareo, temblor, alteraciones del habla, estupor, pérdida del equilibrio, síncope, coma y convulsiones), trastornos oculares (como: visión borrosa, midriasis y problemas de acomodación), trastornos respiratorios (como: bradipnea, taquipnea, depresión respiratoria y apnea) y trastornos cardiovasculares (como: hipotensión severa, bradicardia, arritmias y paro cardíaco).

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático con mantenimiento de vía aérea permeable, oxigenación y medidas de soporte respiratorio (en caso necesario), control de convulsiones y vigilancia sostenida de la función cardiovascular. En caso de convulsiones manejar con diazepam o barbitúricos (con precaución ante la posibilidad de depresión respiratoria). Si se presenta hipotensión grave administrar fluidos IV y, si la situación lo amerita, agentes vasopresores.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

USO EN CONSULTORIO ODONTOLÓGICO.

VIA DE ADMINISTRACION: Infiltración submucosa.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia odontológica.

Antes de usar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Marzo de 2025