

**FICHA TÉCNICA****AR 412 ANEXO 078 V00**

<b>Nombre del producto</b>	ROXICAINA® 2%
<b>Nombre genérico</b>	LIDOCAINA Y EPINEFRINA
<b>Registro Sanitario</b>	2023M-0021154
<b>Titular Registro Sanitario</b>	ROPSOHN THERAPEUTICS S.A.S.
<b>Fabricante</b>	ROPSOHN LABORATORIOS S.A.S
<b>Composición</b>	LIDOCAINA CLOHIDRATO MONOHIDRATO 21.33 MG EQUIVAMENTE A LIDOCAINA MONOHIDRATO , EPINEFRINA EPINEFRINA BITARTRATO 10.01 MCG EQUIVALENTE A EPINEFRINA.
<b>Indicaciones</b>	Anestésico local por infiltración y/o bloqueo nervioso.
<b>Vía de administración</b>	Intradermal, Perineural, Subcutanea
<b>Forma farmacéutica</b>	Solución Inyectable
<b>pH (20 °C)</b>	3,30 - 5,50
<b>Osmolaridad (mOsmol/L)</b>	NA
<b>Presentación comercial</b>	Frasco vial de vidrio tipo I x 20 mL, con tapón de caucho gris de bromobutilo, agrafe de aluminio y tapa plástica, etiqueta autoadhesiva comercial en estuche de cartón litografiado e inserto adjunto.
<b>Condición de venta</b>	Venta con formula medica
<b>Dosificación</b>	De acuerdo a criterio medico
<b>Peso promedio/Vol. de llenado</b>	20,0 mL - 20,6 mL
<b>Contraindicaciones</b>	Hipersensibilidad a los anestésicos, a la epinefrina o a cualquier otro componente del producto. Enfermedad hepática severa. Angina de pecho inestable. Infarto de miocardio reciente. Cirugía reciente de la arteria coronaria por bypass. Arritmias refractivas y taquicardia paroxística o arritmia continua de alta frecuencia. Hipertensión severa no tratada o no controlada. Insuficiencia cardíaca congestiva no tratada o no controlada. Asma bronquial severo.
<b>Precauciones y advertencias</b>	Generales <ul style="list-style-type: none"><li>• Este producto solo debe ser utilizado por profesionales con experiencia en anestesia y en técnicas de reanimación o bajo su supervisión.</li><li>• Antes de la inyección, se debe asegurar que todo el equipo de reanimación de emergencia y medicamentos para el tratamiento de reacciones adversas, esté disponible al instante.</li><li>• En caso de bloqueos mayores se deberá insertar una cánula intravenosa antes de inyectar el anestésico local.</li><li>• Como todos los agentes anestésicos locales, la lidocaína puede provocar efectos tóxicos agudos sobre el sistema cardiovascular y sistema nervioso central cuando se producen altas concentraciones en sangre, especialmente después de una administración intravascular extensa.</li><li>• Debido a que los anestésicos locales tipo amida se metabolizan en el hígado, este producto debe administrarse con precaución a pacientes con enfermedad hepática. Los pacientes que padezcan enfermedad hepática severa, presentan riesgo de desarrollar concentraciones plasmáticas tóxicas de Lidocaína debido a su incapacidad de metabolizar los anestésicos locales.</li></ul>

- Se debe tener precaución en pacientes con enfermedad renal, debido a que se puede acumular el anestésico o sus metabolitos. La acidosis y una concentración reducida de proteínas plasmáticas pueden aumentar el riesgo de toxicidad sistémica.
- El paciente debe ser alertado de la posibilidad de lesiones por mordedura involuntaria de los labios, lengua y mucosa bucal mientras estas estructuras están anestesiadas. Por tanto, la ingestión de alimentos se debe posponer hasta que reaparezca la sensibilidad.
- Debe administrarse la dosis más baja posible que produzca el efecto deseado y debe ajustarse individualmente a las particularidades de cada caso.

Se debe tener precaución en caso de:

- Pacientes de edad avanzada y debilitados de forma general.
- Pacientes con arteriosclerosis, defectos de la coagulación, diabetes mellitus.
- Pacientes con enfermedades pulmonares, especialmente asma alérgica, feocromocitoma, glaucoma de ángulo estrecho, tirotoxicosis
- Pacientes con bloqueo AV II o III puesto que el anestésico local puede reducir la conductividad del miocardio.
- Pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva, bradicardia o deterioro de la función respiratoria.
- Pacientes con epilepsia. Estos pacientes deben ser controlados cuidadosamente para detectar la aparición de síntomas del sistema nervioso central. Se debe considerar un aumento en la tendencia a las convulsiones incluso con dosis por debajo de la máxima.
- Pacientes con coagulopatía. El tratamiento con anticoagulantes (p.ej. heparina), AINEs o sustitutos de plasma, aumentan la tendencia a hemorragias. Las lesiones accidentales de los vasos sanguíneos, pueden provocar hemorragias graves. En caso necesario, se deberá comprobar el tiempo de sangrado y de tromboplastina parcial activada (TTPa), la prueba rápida y el recuento de plaquetas.
- Pacientes con miastenia gravis.
- Tercer trimestre del embarazo.

#### Precauciones y advertencias

Los pacientes tratados con fármacos antiarrítmicos de clase III (p.ej. amiodarona) deben ser vigilados estrechamente, y debe plantearse una monitorización del electrocardiograma (ECG) ya que los efectos cardíacos de Lidocaína y de los fármacos antiarrítmicos de clase III pueden ser acumulativos.

Se debe tener precaución en pacientes que estén recibiendo inhibidores de la monoaminooxidasa (IMAO), antidepresivos tricíclicos o fenotiacinas. Asimismo, se administrará con precaución a pacientes en tratamiento con beta-bloqueantes no cardioselectivos, debido al riesgo de precipitación de crisis hipertensivas y bradicardia severa.

Existen informes posteriores a la comercialización sobre casos de condrolisis en pacientes que recibieron perfusión intra-articular postoperatoria continua de anestésicos locales. En la mayoría de los casos de condrolisis referidos estaba implicada la articulación del hombro.

Debido a los múltiples factores contribuyentes y la incoherencia existente en la bibliografía científica en relación con el mecanismo de acción no se ha establecido una causalidad. La perfusión continua intra-articular no es una indicación aprobada para Lidocaína.

Las lesiones nerviosas traumáticas y/o los efectos tóxicos locales en músculos y nervios son causados principalmente por la inyección de anestésicos locales. La extensión de estas lesiones tisulares depende de la magnitud del traumatismo, la concentración del anestésico local y la duración de la exposición del tejido al anestésico local. Por esta razón, debe usarse la mínima dosis eficaz.

Se debe evitar la inyección de anestésicos locales en áreas infectadas o inflamadas, debido al incremento en la absorción sistémica ocasionado por un mayor flujo sanguíneo y la disminución del pH en el tejido debido al foco infeccioso, por lo que disminuye la potencia anestésica de la solución.

Durante los procedimientos anestésicos en la región de cuello y cabeza los pacientes están expuestos a un mayor riesgo de efectos tóxicos del fármaco en el sistema nervioso central incluso a dosis bajas.

Estas soluciones no deben administrarse por vía intraocular o retroocular, las inyecciones retrooculares pueden alcanzar el espacio subaracnoideo craneal, provocando reacciones intensas/graves que incluyen colapso cardiovascular, apnea, convulsiones y ceguera transitoria.

<p><b>Precauciones y advertencias</b></p>	<p>Las inyecciones retro y periorbitales de anestésicos locales conllevan un bajo riesgo de disfunción motora ocular persistente. Las causas principales incluyen traumatismo y/o efectos tóxicos locales en músculos y/o nervios. Lidocaína intramuscular puede aumentar las concentraciones de la creatinina fosfocinasa, que pueden interferir con el diagnóstico del infarto agudo de miocardio.</p> <p>Se ha mostrado que la Lidocaína es porfirinogénica en animales y no debe administrarse a pacientes con porfiria aguda salvo que sea absolutamente inevitable. Se deben extremar las precauciones en todos los pacientes con porfiria. No debe aplicarse en terminales como dedos, por cuanto la isquemia producida puede conducir a gangrena. La Lidocaína está indicada en adultos y niños. Sin embargo, no se recomienda su uso en niños menores de cuatro años, ya que hay datos limitados para apoyar la seguridad y eficacia de este producto en esta población.</p> <p>El metabisulfito de sodio presente en las soluciones de Lidocaína con Epinefrina, puede causar reacciones de hipersensibilidad (tipo anafiláctico y broncoespasmo), especialmente en pacientes que presenten un historial asmático o alérgico.</p> <p>La presencia de metilparabeno puede causar reacciones alérgicas (posiblemente retardadas).</p> <p><b>MÁNTENGASE FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.</b></p> <p>Para Roxicaina 2% Epinefrina:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>• Los signos vitales cardiovasculares y respiratorios (adecuación de la ventilación) y el estado de conciencia del paciente deben ser monitorizados después de cada inyección de anestésico local.</li> <li>• Las inyecciones deben hacerse lentamente o en dosis incrementales. La presión excesiva durante la inyección puede causar irritación local, dolores postoperatorios y necrosis en los tejidos.</li> <li>• Para minimizar la probabilidad de inyección intravascular, se debe realizar una aspiración antes de inyectar la solución anestésica local. Si se aspira sangre, la aguja debe reposicionarse hasta que no pueda obtenerse ningún retorno de sangre por aspiración. Sin embargo, se debe tener en cuenta que la ausencia de sangre en la jeringa no garantiza que se evitará la inyección intravascular.</li> <li>• En pacientes con acidosis o hipoxia se puede incrementar el riesgo y severidad de estas reacciones tóxicas.</li> <li>• La Lidocaína con Epinefrina debe usarse con precaución en pacientes con enfermedad vascular periférica y aquellos con enfermedad vascular hipertensiva, ya que pueden presentar una vasoconstricción excesiva, por lo que se puede producir lesiones isquémicas (lesiones exfoliativas o ulcerosas) o necrosis.</li> <li>• En algunos pacientes la inyección puede fallar, debido a una desviación en la posición del nervio, un hueso excepcionalmente grueso y compacto formará una barrera difusora y hará menos efectiva la inyección con la técnica de infiltración.</li> <li>• Un vasoconstrictor no debe ser inyectado repetidamente en el mismo sitio, porque reduce el flujo sanguíneo e incrementa el consumo de oxígeno en los tejidos afectados, pudiendo causar anoxia del tejido, retardando la cicatrización del edema o necrosis del sitio de la inyección.</li> <li>• La inyección de Lidocaína con Epinefrina, junto con otros anestésicos locales, es capaz de producir metahemoglobinemia.</li> <li>• Los anestésicos locales pueden contribuir al desarrollo de hipertermia maligna en el caso que se requiera anestesia general suplementaria.</li> <li>• Se debe tener precaución con pacientes con hipertiroidismo no controlado y con pacientes que padecen diátesis hemorrágica, particularmente con anestesia de bloqueo nervioso.</li> </ul>
<p><b>Reacciones adversas</b></p>	<p>La frecuencia y gravedad de las reacciones adversas dependen de la dosis, el método de administración y la sensibilidad individual del paciente.</p> <p>Las reacciones adversas se enumeran según su frecuencia de la siguiente manera:</p> <p>Muy frecuentes: <math>\geq 1/10</math>  Frecuentes: <math>\geq 1/100</math> a <math>&lt; 1/10</math>  Poco frecuentes: <math>(\geq 1/1,000</math> a <math>&lt; 1/100</math>  Raras: <math>\geq 1/10.000</math> a <math>&lt; 1/1000</math>  Muy raras: <math>&lt; 1/10.000</math>  No conocidas: no puede estimarse la frecuencia a partir de los datos disponibles.</p> <p><u>Trastornos gastrointestinales</u></p> <p>Frecuentes: sabor metálico.</p>

<b>Reacciones adversas</b>	<p><u>Trastornos del sistema nervioso</u></p> <p>Frecuentes: tinnitus, sensación de mareo, náuseas, vómitos, ansiedad, temblores, nistagmo, cefalea, aumento del ritmo respiratorio, síntomas neurológicos transitorios, somnolencia, migraña, disartria, sensación de hormigueo y parestesia (piel), visión borrosa.</p> <p>Raras: parestesias (pérdida de sensibilidad acompañada de quemazón) del labio y/o la lengua, inconsciencia y convulsiones, coma y paro respiratorio (en caso de sobredosis).</p> <p><u>Trastornos generales y alteraciones en el lugar de la administración</u></p> <p>Raras: reacciones de hipersensibilidad, erupción cutánea, eritema, prurito, edema de la lengua, la boca, los labios o la garganta, en casos graves choque anafiláctico, metahemoglobinemia.</p> <p><u>Trastornos cardíacos</u></p> <p>Raras: hipotensión, arritmias, bradicardia, paro cardíaco, sensación de calor, sudoración, hipertensión, angina de pecho, taquicardias, taquiarritmias.</p> <p><u>Trastornos respiratorios</u></p> <p>Raras: taquipnea seguida de bradipnea, pudiendo ocasionar apnea.</p> <p><u>Para Roxicaina 2% Epinefrina:</u></p> <p>Pueden ocurrir parestesias persistentes de labios, lengua, con recuperación lenta, incompleta o sin recuperación; estas reacciones se han presentado luego de bloqueos nerviosos en la mandíbula que han involucrado el nervio trigémino y sus ramas.</p>
<b>Interacciones</b>	<p>La administración conjunta de metropolol puede provocar un aumento en la toxicidad de la Lidocaína, requiriendo una reducción en la dosificación de Lidocaína.</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>• El uso simultáneo de bloqueantes alfa-adrenérgicos con Lidocaína puede ocasionar hipotensión y taquicardia severa.</li> <li>• Los vasodilatadores que actúan rápidamente, como los nitratos, pueden reducir la eficacia del vasoconstrictor.</li> <li>• Los efectos antihipertensivos de los diuréticos o medicamentos antihipertensivos, pueden disminuir por el uso simultaneo con vasoconstrictores.</li> <li>• El uso conjunto de levadopa u hormonas tiroideas con epinefrina a dosis elevadas, puede ocasionar toxicidad cardíaca.</li> <li>• Alteraciones con pruebas de laboratorio: la inyección intramuscular de Lidocaína puede provocar un aumento en los niveles de creatina fosfoquinasa.</li> </ul>
<b>Uso en fertilidad, embarazo y lactancia</b>	<p><u>Embarazo:</u></p> <p>No hay datos o estos son limitados relativos al uso de Lidocaína en mujeres embarazadas. Los estudios en animales no indican directamente o indirectamente efectos nocivos con respecto al embarazo, desarrollo embrionario/fetal, parto o desarrollo postnatal. Por lo tanto, no debería utilizarse durante el embarazo excepto si fuese claramente necesario.</p> <p><u>Lactancia:</u></p> <p>La Lidocaína se excreta en la leche materna en pequeñas cantidades. No se esperan efectos en recién nacidos a las dosis recomendadas. Sin embargo, se recomienda tener precaución con uso de Lidocaína durante la lactancia.</p> <p>No existen datos sobre la excreción de epinefrina en la leche materna.</p> <p><u>Fertilidad:</u></p> <p>No se dispone de datos sobre su efecto en la fertilidad.</p>

<b>Efectos teratogénicos, carcinogénicos y mutagénicos</b>	NA
<b>Efectos sobre la capacidad de conducir o manipular máquinas</b>	Dependiendo de la dosis y la forma de administración, la Lidocaína puede tener un efecto transitorio en la función motora y la coordinación, influyendo en la capa para conducir y utilizar máquinas. Se debe recomendar a los pacientes que eviten estas actividades hasta que se haya restablecido por completo la función normal.
<b>Sobredosis y toxicidad</b>	<p>El manejo de las convulsiones, como para la apnea, consiste en atención inmediata para mantener las vías del paciente y una ventilación asistida con máscara de oxígeno, inmediato a esto se debe evaluar que haya suficiente circulación, se debe tener en cuenta que muchos medicamentos anticonvulsivantes pueden causar depresión respiratoria. Si persisten los síntomas convulsivos puede administrarse por vía intravenosa Tiopental o Diazepam. El tratamiento para el soporte de la depresión circulatoria puede requerir la administración de fluidos intravenosos, siendo apropiado un vasopresor (como Efedrina). Si ocurre un paro cardiaco se debe iniciar medidas para resucitación cardiopulmonar. Los síntomas neurológicos graves (convulsiones, depresión del SNC) deben tratarse sintomáticamente mediante respiración asistida y con la administración fármacos anticonvulsivos.</p> <p>Cuando hay sobredosificación se puede presentar visión borrosa, vértigo, dificultad para respirar, mareos intensos, pérdida del conocimiento, crisis convulsivas, hipotensión arterial, temblores musculares, coma, paro cardiaco y espasmo bronquial.</p>
<b>Manejo por intoxicación</b>	Cuando hay sobredosificación se puede presentar visión borrosa, vértigo, dificultad para respirar, mareos intensos, pérdida del conocimiento, crisis convulsivas, hipotensión arterial, temblores musculares, coma, paro cardiaco y espasmo bronquial.
<b>Farmacodinamia</b>	<p>La <b>lidocaína</b>, ejerce su efecto anestésico ya que bloquea reversiblemente la conducción nerviosa al disminuir la permeabilidad de las membranas nerviosas al sodio, (también actúa a nivel de las membranas celulares en el miocardio, razón por la cual tiene efecto anti arritmico).</p> <p>El bloqueo nervioso afecta las fibras nerviosas, sin embargo, se sabe que primero actúa sobre las autonómicas, seguido de las sensoriales y por último en las motoras. La disminución de los efectos en las fibras nerviosas ocurre en orden inverso al anteriormente especificado. También se ha establecido que la pérdida de la función nerviosa clínicamente ocurre en el siguiente orden: el dolor, la temperatura, el tacto, la propiocepción y el tono del músculo esquelético. Es necesaria una penetración directa en membrana nerviosa para la anestesia efectiva, lo que se consigue mediante la aplicación tópica o la inyección por vía subcutánea, intradérmica, o submucosa alrededor de los troncos nerviosos o ganglios que abastecen el área a ser anestesiada.</p> <p>La <b>epinefrina</b>, es un potente agonista adrenérgico no selectivo, por ende, actúa a nivel de los receptores alfa (<math>\alpha 1</math> y <math>\alpha 2</math>) y beta (<math>\beta 1</math> y <math>\beta 2</math>) del cuerpo, a excepción de los que se encuentran ubicados en las glándulas sudoríparas y arterias faciales. Su efecto fisiológico depende del tipo de receptor que estimule, cuando actúa sobre los receptores alfa puede provocar principalmente vasoconstricción principalmente y disminución en la liberación de norepinefrina, a diferencia de la estimulación de los receptores beta que se manifiesta en una respuesta cronotrópica e inotrópica positiva y vasodilatación arteriolar.</p> <p>Al ser administrado conjuntamente con Lidocaína está indicado como vasoconstrictor arteriolar ya que actúa en los receptores post- sinápticos <math>\alpha 1</math> y <math>\alpha 2</math>, de esta manera al ser administrada de manera local genera una vasoconstricción y hemostasia de los vasos pequeños cercanos al sitio de administración.</p>
<b>Farmacocinética</b>	<p>Por vía intramuscular, la anestesia producida por la lidocaína empieza a manifestarse después de 5 o 15 minutos de la administración, la duración del efecto terapéutico por la misma vía es de aproximadamente 60 a 90 minutos, mientras que por vía subcutánea es de 1 a 3 horas según la concentración y dosis empleada.</p> <p>Cuando se administra por vía subcutánea y de manera repetida pueden detectarse niveles en sangre debido a la acumulación que presenta el fármaco y sus metabolitos. La lidocaína cuando entra en circulación sistémica, se metaboliza a nivel hepático en dos compuestos activos: Monoetilglicina lidida y Glicinexilidida que tienen un 100% de la potencia de lidocaína y un 25%, respectivamente.</p>
<b>Vida útil</b>	12 Meses a partir de la fecha de Fabricación.
<b>Condiciones de almacenamiento</b>	Temperatura no mayor a 30 °C, en su envase original y protegido de la luz.