



FICHA TÉCNICA	
AR 412 ANEXO 045 V00	
Nombre del producto	ROXICAINA 1% SIMPLE FRASCO VIAL
Nombre genérico	LIDOCAINA
Registro Sanitario	INVIMA 2008M-010276-R2
Titular Registro Sanitario	ROPSOHN THERAPEUTICS S.A.S.
Fabricante	ROPSOHN LABORATORIOS S.A.S.
Composición	Cada 1mL de solución inyectable contiene Lidocaína Clorhidrato Monohidrato equivalente a Lidocaína Clorhidrato 10 mg
Indicaciones	Anestésico local
Vía de administración	Subcutánea. Intradérmica. Perineural.
Forma farmacéutica	Solucion inyectable
pH (20 °C)	5,00 – 7,00
Osmolaridad (mOsmol/L)	No aplica
Presentación comercial	Frasco vial con tapón y agrafe de aluminio x 20, 50 mL. Muestra medica: Frasco vial x20 Y X50 mL. Uso institucional: Frasco vial x50 mL
Condición de venta	Venta con fórmula médica
Dosificación	De acuerdo a criterio médico.
Peso promedio/Vol. de llenado	20,0 mL – 20,6 mL 50,0 mL – 51,0 mL
Contraindicaciones	Hipersensibilidad a los componentes, pacientes con miastenia gravis, epilepsia, falla en la condición cardíaca y daño hepático.
Precauciones y advertencias	Lidocaína Clorhidrato solo debe ser utilizada por profesionales con experiencia en anestesia y en técnicas de reanimación o bajo su supervisión. En general, antes de la inyección de lidocaína, se debe asegurar que todo el equipo de reanimación de emergencia y medicamentos para el tratamiento de reacciones adversas está disponible al instante. En caso de bloqueos mayores se deberá insertar una cánula intravenosa antes de inyectar el anestésico local. 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. La inyección de Lidocaína para el tratamiento de arritmias cardíacas debe realizarse bajo supervisión constante de un médico, con una velocidad de inyección regulada.

Se debe tener precaución en el tratamiento de las siguientes categorías de pacientes:

- Pacientes de edad avanzada y debilitados de forma general.
- 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 enfermedad hepática o insuficiencia renal.
- 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), AINE 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.
- En niños menores de 4 años ya que los datos de seguridad y eficacia son limitados. No está recomendada para uso en recién nacidos.

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

La monitorización constante del ECG es esencial durante la administración de lidocaína por vía intravenosa. Ante los signos de depresión excesiva en la conductividad cardíaca, como la prolongación del intervalo PR y el complejo QRS, y el emperamiento de las arritmias, se debe interrumpir la inyección intravenosa inmediatamente.

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.

Precauciones y advertencias

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.

El bloqueo paracervical puede causar en ocasiones bradicardia o taquicardia fetal y es necesario monitorizar estrechamente la frecuencia cardíaca del feto.

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.

También debe tenerse especial precaución cuando se inyecta el anestésico local en el tejido inflamado y/o infectado debido al incremento en la absorción sistémica ocasionado por un mayor flujo sanguíneo y la disminución del efecto por el pH más bajo de tejido infectado.

Una vez retirado el torniquete después de la anestesia regional intravenosa hay mayor riesgo de reacciones adversas. Por tanto, el anestésico local debe eliminarse en varias fracciones.

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.

Raramente, las inyecciones retro-oculares pueden alcanzar el espacio subaracnoideo craneal, provocando reacciones intensas/graves que incluyen colapso cardiovascular, apnea, convulsiones y ceguera transitoria.

Las inyecciones retro y perioculares 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.

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.

<p>Reacciones adversas</p>	<p>La frecuencia y gravedad de las reacciones adversas de la lidocaína 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: $\geq 1/10$</p> <p>Frecuentes: $\geq 1/100$ a $< 1/10$</p> <p>Poco frecuentes: ($\geq 1/1,000$ a $< 1/100$)</p> <p>Raras: $\geq 1/10.000$ a $< 1/1000$</p> <p>Muy raras: $< 1/10.000$</p> <p>No conocidas: no puede estimarse la frecuencia a partir de los datos disponibles.</p> <p>Trastornos gastrointestinales</p> <p>Muy frecuentes: Náuseas, Vómitos, Disfagia.</p> <p>Trastornos psiquiátricos</p> <p>Muy frecuentes: Disforia.</p> <p>Trastornos del sistema nervioso</p> <p>Frecuentes: Síntomas neurológicos transitorios, Somnolencia, Mareos, Vértigo, Disartría, Tinnitus, Temblor, Sensación de hormigueo y parestesia (piel), Visión borrosa.</p> <p>Poco frecuentes: Síntomas de toxicidad sobre el SNC (Parestesia, Paresia hasta paraplejia de las extremidades inferiores y pérdida de control de los esfínteres (p. ej., Síndrome de la cola de caballo), Dolor de cabeza acompañado de Tinnitus y Fotofobia), Lesiones de los nervios craneales, Sordera Neurosensorial, Vértigo.</p> <p>Raras: espasmos musculares, hasta convulsiones generalizadas, disminución del nivel de conciencia hasta el coma.</p> <p>No conocidas: Síndrome de Horner</p> <p>Trastornos psiquiátricos</p> <p>Frecuentes: Confusión, Inquietud, Irritabilidad, Euforia, Alucinaciones y Depresión.</p> <p>Trastornos vasculares</p> <p>Pocos frecuentes: Hipertensión.</p> <p>Raras: Hipotensión.</p> <p>Trastornos del sistema inmunológico</p> <p>Raras: Reacciones de hipersensibilidad, urticaria, edema, broncoespasmo, dificultad respiratoria, en casos graves choque anafiláctico.</p> <p>Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración</p> <p>Raras: escalofríos.</p> <p>Lesiones traumáticas, intoxicaciones y complicaciones de procedimientos terapéuticos</p> <p>Raras: Trauma, Irritación radicular transitoria, Compresión de la médula espinal después del desarrollo de un hematoma.</p> <p>Trastornos cardíacos</p> <p>Raras: bradicardia, bloqueo auriculoventricular hasta paro cardíaco. Muy raras: taquicardia ventricular.</p> <p>Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos</p> <p>Raras: depresión respiratoria.</p>
<p>Interacciones</p>	<ul style="list-style-type: none"> • Los fármacos que inhiben el metabolismo de la Lidocaína (p.ej. Cimetidina y Propanolol) pueden provocar concentraciones plasmáticas potencialmente tóxicas cuando la lidocaína se administra repetidamente en altas dosis durante periodos de tiempo prolongados. Tales interacciones carecen de relevancia clínica durante un tratamiento con Lidocaína a corto plazo a las dosis recomendadas. • La administración conjunta de Cimetidina, Propanolol y Metoprolol puede provocar un aumento en la toxicidad de la Lidocaína, requiriendo una reducción en la dosificación de Lidocaína. • Los agentes antivirales (por ejemplo, Amprenavir, Atazanavir, Darunavir, Lopinavir) pueden provocar un aumento en los niveles séricos de lidocaína. • La lidocaína debe usarse con precaución en pacientes que reciban otros anestésicos locales o fármacos antiarrítmicos de clase IB, ya que los efectos tóxicos son acumulativos. • No se han llevado a cabo estudios específicos de interacciones con lidocaína y fármacos antiarrítmicos de clase III (como, por ejemplo, Amiodarona), pero se recomienda tener precaución. • Se recomienda precaución con el uso prolongado de medicamentos antiepilépticos (Fenitoína) y barbitúricos, debido a que pueden conducir a una menor eficacia y, por lo tanto, a un mayor requerimiento de dosis de Lidocaína.
<p>Uso en fertilidad, embarazo y lactancia</p>	<p>Embarazo: 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>Lactancia: la lidocaína se excreta en la leche materna, pero en cantidades tan bajas que en general no hay riesgo para el neonato. No existen datos sobre la excreción de epinefrina en la leche materna, pero es poco probable que afecte al neonato, por lo que lidocaína 1% con epinefrina puede utilizarse durante el periodo de lactancia.</p> <p>Fertilidad: no se dispone de datos sobre su efecto en la fertilidad.</p>

Efectos teratogénicos, carcinogénicos y mutagénicos	No se han evidenciado efectos teratogénicos ni mutagénicos, el metabolito 2,6-xilidina de lidocaína, se ha asociado con carcinogenicidad en ratas, no obstante, se desconoce el significado clínico
Efectos sobre la capacidad de conducir o manipular máquinas	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 capacidad 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
Sobredosis y toxicidad	Las manifestaciones por sobredosis de Lidocaína son vértigo, cianosis, hipotensión arterial, temblores musculares, convulsiones, coma, respiración irregular y débil, paro cardíaco y espasmo bronquial.
Manejo por intoxicación	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 cardíaco se debe iniciar medidas para resucitación cardiopulmonar. Los síntomas neurológicos graves (convulsiones, depresión del SNC) deben tratarse sintómicamente mediante respiración asistida y con la administración de fármacos anticonvulsivos.
Farmacodinamia	La Lidocaína bloquea reversiblemente la conducción nerviosa por disminución de la permeabilidad de la membrana al sodio, previniendo el inicio y la propagación del impulso nervioso. La Epinefrina actúa sobre los receptores alfa-adrenérgicos produciendo vasoconstricción, para promover la hemostasis local y reducir la absorción sistémica del anestésico local.
Farmacocinética	La absorción sistémica de Lidocaína depende de la dosis, área y del tiempo de aplicación. La Lidocaína se une a proteínas plasmáticas en un 65%, cruza la barrera placentaria y hematoencefálica, la duración de la acción anestésica es de 90 – 200 minutos, con rápido comienzo de acción. Se metaboliza en el hígado y sus metabolitos son excretados por el riñón. El metabolismo predominante de la Lidocaína es por N-de alquilación mediada por el CYP3A4, los metabolitos producidos son luego hidrolizados y excretados. El metabolito principal en la orina humana es el 4-hidroxi-2,-6 dimetilanilina. Aproximadamente el 90% de la Lidocaína administrada es excretada por el riñón en forma de metabolitos y menos del 10% es excretada de forma inalterada. La eliminación de los anestésicos locales de tipo amida está disminuida en el recién nacido, y en pacientes con enfermedad hepática y con insuficiencia renal.
Vida útil	Dos (2) años a partir de la fecha de fabricación
Condiciones de almacenamiento	Temperatura no mayor a 30 °C, en su envase y empaque original.