



FICHA TÉCNICA O RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

PROCAÍNA SERRA 20 mg/ml solución inyectable, ampollas de 5 ml
PROCAÍNA SERRA 20 mg/ml solución inyectable, ampollas de 10 ml

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

	<u>1 ml de solución</u>	<u>5 ml de solución</u>	<u>10 ml de solución</u>
	<u>20 mg/ml</u>	<u>20 mg/ml</u>	<u>20 mg/ml</u>
Contenido de procaína hidrocloreuro	20 mg	100 mg	200 mg

Para lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Solución inyectable.
Solución transparente e incolora.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1 Indicaciones terapéuticas

Anestesia local por infiltración (dolor asociado a heridas, cirugía menor, quemaduras, abrasiones), anestesia por bloqueo nervioso periférico.

4.2 Posología y forma administración

Vía de administración: Vía subcutánea, intramuscular.

Posología:

Anestesia local por infiltración: En general, la dosificación dependerá de la acción anestésica requerida, de la extensión de la zona a anestesiar, etc. La dosis máxima, en 24 horas, en anestesia por infiltración, es de 1 gramo en adultos. Usualmente las dosis son, en anestesia por infiltración y en la práctica odontológica, 1 ó 2 ml de PROCAÍNA SERRA 20 mg/ml solución inyectable.

Anestesia por bloqueo nervioso periférico: La dosificación dependerá de la acción anestésica requerida, de qué plexos, nervios o fibras se van a bloquear, del estado físico del paciente, etc. Las dosis usual en anestesia por bloqueo nervioso periférico es de 500 mg de Procaína, en solución 20 mg/ml (equivalentes a inyectar 25 ml de solución 20 mg/ml). En ocasiones se ha administrado dosis hasta 1 gramo.



Para reducir el riesgo de administración intravascular accidental, la solución de Procaína debe inyectarse lentamente, realizando frecuentes aspiraciones, antes de cada inyección y durante la misma.

En los ancianos y pacientes con enfermedades agudas o debilitados y en aquellos que presenten enfermedad cardíaca o hepática, se deben emplear dosis más bajas. También se requieren dosis más bajas cuando se repiten las inyecciones y para bloqueos nerviosos de áreas muy vascularizadas, para evitar concentraciones plasmáticas excesivamente elevadas.

Pacientes pediátricos: No se recomienda su uso en niños, pueden presentar mayor probabilidad de que se produzca toxicidad sistémica y no disponerse información suficiente sobre la relación entre la edad y los efectos de la Procaína. Se deben emplear dosis más bajas.

4.3 Contraindicaciones

No debe administrarse a pacientes con sensibilidad a la procaína, PABA, parabenos (sulfamidas, conservantes del tipo hidroxibenzoato) o a anestésicos locales tipo éster (tetracaína, etc.) debido al riesgo de alergia cruzada.

4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo

En insuficiencia hepática: por su metabolismo hepático, debe ajustarse la dosis al grado de incapacidad del mismo.

En insuficiencia renal: la acidosis y una concentración reducida de proteínas plasmáticas, pueden aumentar el riesgo de toxicidad sistémica.

En epilepsia: puede provocar temblores y/o convulsiones.

En insuficiencia cardíaca: puede producir intensa depresión miocárdica así como arritmias prolongadas.

Hipertermia maligna: puede contribuir al desarrollo de hipertermia maligna en el caso de que se requiera anestesia general suplementaria.

Hipovolemia: ya que hay riesgo de hipotensión grave durante la anestesia epidural con cualquier anestésico local.

Shock grave, bradicardia o bloqueo cardíaco: cuando se suponga que debido al lugar de aplicación o a la utilización de dosis elevadas pudieran producirse concentraciones plasmáticas elevadas.

No es aconsejable la aplicación sobre áreas inflamadas o infectadas, ya que puede modificarse el pH en el lugar de aplicación y modificar así el efecto del anestésico.

En caso de aparecer reacciones sistémicas se deben instaurar medidas para mantener la circulación y la respiración, y para controlar las convulsiones.

Uso en niños



Los niños pueden presentar una mayor probabilidad de que se produzca toxicidad sistémica. No se dispone de información suficiente sobre la relación entre la edad y los efectos de la procaína. No se recomienda su uso.

Uso en ancianos

Los ancianos presentan mayor probabilidad de que se produzca toxicidad sistémica; además dosis repetidas pueden causar acumulación del fármaco o sus metabolitos o endentecer el metabolismo. Se recomienda utilizar dosis reducidas proporcionadas a su estado físico. Uso con precaución.

Embarazo y lactancia

Ver sección 4.6.

Insuficiencia renal

La administración de Procaína hidrocloreto en pacientes con insuficiencia renal, disminuye la eliminación de sus metabolitos a través de la orina.

Deportistas

Este medicamento contiene un componente que puede producir un resultado positivo en el control de dopaje.

4.5 Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Después de la absorción de la Procaína, ésta es rápidamente hidrolizada por la colinesterasa plasmática a ácido p-aminobenzoico y dietilaminoetanol.

Debido a la formación del ácido p-aminobenzoico, la Procaína es incompatible (antagonista) con las sulfamidas y viceversa.

El empleo de anticolinesterasas y, especialmente, de ecotiopato en oftalmología, da lugar a una menor capacidad de hidrólisis de la Procaína, por lo que es peligrosa su asociación.

Por desplazamiento de los relajantes musculares de sus lugares de unión con las proteínas plasmáticas y, en algunos casos, por competencia metabólica, los anestésicos locales, en general, potencian la acción de los relajantes musculares.

El aumento en la concentración de Ca^{2+} disminuye la acción de los anestésicos locales.

La administración de Procaína concomitantemente con acetazolamida (diurético), aumenta la vida media plasmática de la Procaína.

La incorporación de un vasoconstrictor en la misma formulación o aplicada por separado, aumenta el tiempo de acción del anestésico local.

No se conocen interacciones con alimentos o bebidas.

4.6 Embarazo y lactancia

Embarazo

Categoría C de la FDA. Los anestésicos locales atraviesan rápidamente la placenta. La seguridad del uso en embarazadas, excepto durante el parto, no ha sido establecida; estudios retrospectivos con anestésicos locales al principio de embarazo en casos de cirugía de urgencia, no registraron efectos

teratógenos; no obstante, no se pudo excluir la posibilidad de otros efectos adversos fetales. La administración epidural, cervical, paracervical o pudenda, puede producir diversos grados de toxicidad materna, fetal y neonatal, incluyendo alteraciones del sistema nervioso central, del tono vascular periférico y de la función cardíaca. La incidencia y el grado de esta toxicidad dependen del procedimiento, tipo y cantidad de fármaco usado y de la técnica de administración.

Parto y alumbramiento: la administración epidural, subaracnoidea, paracervical o pudenda puede alterar la contractibilidad uterina y/o los esfuerzos de expulsión. El bloqueo paracervical puede acortar la 1ª etapa del parto y facilitar la dilatación cervical; sin embargo, el bloqueo epidural o subaracnoideo puede prolongar la 2ª etapa del parto al interferir con la función motora o eliminar el reflejo de deseo de empujar. El uso de este fármaco en el alumbramiento puede aumentar la necesidad de fórceps. El uso simultáneo de un vasoconstrictor beta-adrenérgico puede disminuir la intensidad de las contracciones uterinas y prolongar el parto.

Durante la anestesia regional se puede producir hipotensión materna por bloqueo nervioso simpático que da lugar a vasodilatación.

Después de administración paracervical en los primeros meses de embarazo (para aborto provocado) se han descrito convulsiones y colapso cardiovascular en la madre (rápida absorción sistémica); se recomienda especial atención a la dosificación y a la técnica de administración.

Otros fármacos relacionados contraen las arterias uterinas, pudiendo dar lugar a hipoxia fetal (no reversible por bloqueantes alfa-adrenérgicos). Los vasoconstrictores usados simultáneamente también pueden contraer los vasos uterinos y disminuir la circulación placentaria.

Se ha descrito bradicardia fetal, asociada posiblemente a acidosis fetal, en un 20-30% con anestésicos locales tipo amida por vía paracervical. Este riesgo puede aumentar en prematuridad, hipermadurez, toxemia gravídica, distress fetal preexistente o insuficiencia útero-placentaria. En estas circunstancias, evaluar la relación riesgo-beneficio. Se recomienda vigilancia de la frecuencia cardíaca fetal durante el bloqueo paracervical.

Postparto: entre el 1º y 2º día postparto se pueden producir perturbaciones neurológicas neonatales (disminución de fuerza y tono muscular). Después del bloqueo paracervical se ha descrito marcada depresión del sistema nervioso central del neonato. La inyección intracraneal accidental en el feto también puede producir depresión y convulsiones en el neonato.

Lactancia

Se ignora si los anestésicos locales son excretados con la leche materna, y si ello pudiese afectar al niño; no obstante, no se han descrito problemas en humanos. Uso con precaución.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar maquinaria

La Procaína puede alterar temporalmente la función locomotora y la coordinación, según el área anestesiada. Se recomienda informar al paciente sobre dichos efectos.

4.8 Reacciones adversas

Los efectos adversos de Procaína son, en general, infrecuentes aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos están relacionados con la dosis, y pueden resultar de niveles plasmáticos altos originados por una dosis alta, por una absorción rápida o por una inyección intravascular, o también pueden resultar de una hipersensibilidad, idiosincrasia o una tolerancia del paciente disminuida en parte.

Las reacciones adversas se enumeran a continuación por órganos y sistemas de acuerdo con las categorías de frecuencia siguientes:

- Muy frecuente ($\geq 1/10$)
- Frecuente ($\geq 1/100$, $<1/10$)
- Poco frecuente ($\geq 1/1.000$, $<1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $<1/1.000$)
- Muy raras ($<1/10.000$, incluyendo notificaciones aisladas)

Alteraciones de la sangre y del sistema linfático	Poco frecuente: metahemoglobinemia.
Alteraciones del sistema nervioso	Frecuentes: excitación, agitación, mareos, tintineo de oídos, visión borrosa, temblores y convulsiones, entumecimiento de la lengua y de la región perioral, depresión con somnolencia y coma.
Alteraciones cardiovasculares	Frecuentes: depresión miocárdica, hipotensión, bradicardia, arritmia y parada cardíaca.
Alteraciones del sistema respiratorio	Frecuente: depresión respiratoria.
Alteraciones gastrointestinales	Frecuentes: náuseas y vómitos.
Alteraciones de la piel y del tejido subcutáneo	Frecuente: urticaria debido a reacción alérgica.
Lesiones traumáticas, intoxicaciones y complicaciones de procedimientos terapéuticos	Frecuente: reacción anafilactoide.

4.9 Sobredosis

A las dosis usuales, la intoxicación debida a la Procaína hidrocloreuro es muy rara. El entumecimiento de la lengua y de la región perioral pueden ser un primer síntoma de la toxicidad sistémica. Otros signos y síntomas que pueden aparecer son excitación, agitación, mareos, tintineo de oídos, visión borrosa, temblores y convulsiones. Con dosis más elevadas, el periodo de excitación puede cesar para dar lugar a depresión con somnolencia, depresión respiratoria y coma, depresión miocárdica, hipotensión, bradicardia, arritmia y parada cardíaca.

En caso de sobredosis local accidental, la absorción del anestésico puede reducirse aplicando un torniquete. Los problemas respiratorios pueden necesitar respiración asistida. Las convulsiones deben controlarse con barbitúricos de acción corta, tales como Tiopentona sódica. El descenso de la presión sanguínea podrá tratarse con nor-adrenalina. Los accidentes debidos a la hipersensibilidad alérgica, como los anteriores, son muy poco probables; en caso de presentarse, deben tratarse como todos los accidentes alérgicos: con adrenalina y antihistamínicos.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS



5.1 Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: anestésicos locales, ésteres del ácido aminobenzoico, código ATC: N01B1A

Mecanismo de acción: La procaína bloquea tanto la iniciación como la conducción de los impulsos nerviosos mediante la disminución de la permeabilidad de la membrana neuronal a los iones sodio y de esta manera la estabiliza reversiblemente. Dicha acción inhibe la fase de despolarización de la membrana neuronal, dando lugar a que el potencial de acción se propague de manera insuficiente y al consiguiente bloqueo de la conducción.

La Procaína hidrocloreto es un anestésico local de tipo éster. Debido a su pobre penetración (difunde con dificultad) en contacto con las membranas mucosas, no es aplicable en superficie. La administración será pues, siempre, por vía subcutánea o intramuscular. Su acción es rápida y de poca duración. Su gran importancia terapéutica radica en la menor toxicidad, comparándola con otros anestésicos locales.

La incorporación o administración de una sustancia vasoconstrictora simultáneamente, aumenta la duración del efecto anestésico de la Procaína hidrocloreto. El vasoconstrictor realiza un doble servicio: al disminuir la velocidad de absorción, no sólo localiza el anestésico en el sitio deseado, sino que también permite que la velocidad con la cual se destruye en el organismo sea compatible con la velocidad con la que se absorbe en la circulación. Esto reduce por tanto su toxicidad sistémica y aumenta la duración del efecto anestésico del fármaco.

5.2 Propiedades farmacocinéticas

Vías de administración: Vía subcutánea, intramuscular.

Absorción sistémica completa. Después de la absorción de la Procaína, ésta es rápidamente hidrolizada por la colinesterasa plasmática a ácido p-aminobenzoico y dietilaminometanol. Sólo un 6% aproximadamente se liga a las proteínas plasmáticas. La semivida de eliminación es de 0,1 horas. Alrededor del 80% del ácido p-aminobenzoico es excretado libre o conjugado por orina. Mientras que el 30% aproximadamente del dietilaminoetanol formado se excreta también por orina, el resto es metabolizado por el hígado.

El tiempo de aparición de los efectos y su duración dependen de la dosis administrada, la vía de administración, del uso concomitante o no de vasoconstrictores así como de las propiedades intrínsecas del fármaco (potencia, pKa y solubilidad lipídica). La procaína es un anestésico local de potencia baja, el tiempo de comienzo de acción es 10 minutos y la duración de los efectos es de 0,7 a 1 horas.

5.3 Datos preclínicos sobre seguridad

En estudios de toxicidad aguda en ratones se ha visto que la dosis letal 50 por vía subcutánea es 300 mg/kg y por vía intravenosa 45 mg/kg. En la rata, la dosis letal 50 por vía subcutánea es 600 mg/kg. La administración intravenosa rápida o la sobredosificación puede provocar convulsiones, hipotensión, depresión respiratoria y muerte. Existe la posibilidad de reacciones de hipersensibilidad. Tras la absorción desde vías de administración parenterales, la procaína estimula el sistema nervioso central produciendo agitación y temblores debidos a convulsiones clónicas. Tras la fase de



estimulación sigue una fase de depresión del sistema nervioso central que puede causar la muerte por parada respiratoria. En raras ocasiones dosis bajas de procaína han producido fallo cardiovascular.

La procaína a mostrado no ser genotóxica ni mutagénica en estudios *in vitro*.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1 Lista de excipientes

Ácido clorhídrico (para ajuste del pH)
Agua para preparaciones inyectables

6.2 Incompatibilidades

Químicamente, la Procaína hidrocloreuro es incompatible con hidróxidos alcalinos y sus carbonatos. Es así mismo, incompatible con la Penicilina G, debido a la formación de una sal insoluble. Los anestésicos locales, tales como la Procaína hidrocloreuro, precipitan con Anfotericina B.

6.2 Periodo de validez

5 años.

Utilizar inmediatamente una vez abierto el envase y desechar las soluciones sobrantes.

6.4 Precauciones especiales de conservación

Conservar en lugar fresco y seco, protegido de la luz.

La especialidad es estéril por autoclavado. No contiene ningún tipo de conservador ni bactericida, por lo que las ampollas abiertas y no utilizadas inmediatamente deberán rechazarse.

6.5 Naturaleza y contenido del recipiente

Ampolla de vidrio de tipo I (borosilicato de alta resistencia) conteniendo 5 ó 10 ml.

Presentaciones: Envase 1 ampolla 5 ml.
Envase 1 ampolla 10 ml.
Envase clínico 100 ampollas 5 ml.
Envase clínico 100 ampollas 10 ml.

6.6 Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con las normativas locales.

La acción anestésica local de la Procaína, es de inicio lento y de corta duración (entre 30 y 60 minutos). Su duración puede alargarse, asociándola a vasoconstrictores locales (solución de adrenalina).



7. **TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE LA COMERCIALIZACIÓN**

LABORATORIOS SERRA PAMIES S.A.
Carretera de Castellvell, 24
43206 - REUS (TARRAGONA)

8. **NÚMERO DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN**

PROCAÍNA SERRA 20 mg/ml solución inyectable, ampollas de 5 ml: N° Reg. 37.925
PROCAÍNA SERRA 20 mg/ml solución inyectable, ampollas de 10 ml: N° Reg. 37.926

9. **FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN / RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN**

Renovación de la autorización: 2.002

10. **FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO**

Junio de 2007

 Laboratorios Serra Pamies S.A.