

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

LIDOCAÍNA HIPERBÁRICA BRAUN 5% solución inyectable

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

| | |
|---|---------------------|
| 1 ml de solución contiene | 50 mg de lidocaína |
| clorhidrato 2 ml de solución (= 1 ampolla) contiene | 100 mg de lidocaína |
| clorhidrato | |

Para excipientes, ver 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Solución inyectable.

Solución acuosa, transparente, incolora o débilmente amarillenta.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1 Indicaciones terapéuticas

Lidocaína hiperbárica Braun 5% es un anestésico indicado para anestesia subaracnoidea para:

- intervenciones quirúrgicas en el abdomen.
- anestesia espinal inferior en obstetricia: parto vaginal normal, cesárea y partos que requieran manipulación intrauterina.

4.2 Posología y forma de administración

Lidocaína hiperbárica Braun 5% debe administrarse por vía intratecal por lo que únicamente debe ser administrado por médicos especialistas en anestesia. Las funciones circulatoria y pulmonar deben ser monitorizadas constantemente y deben estar disponibles en todo momento, los

dispositivos necesarios para mantener abiertas las vías respiratorias, para la ventilación artificial y

otros dispositivos de reanimación.

La dosificación de clorhidrato de lidocaína varía según la técnica anestésica, área a anestésicar, vascularidad de los tejidos, número de segmentos neuronales a ser bloqueados, grado de anestesia y relajación muscular requerida y condición física del paciente así como de la posición en la que se encuentra durante y después de la inyección.

Se debe utilizar siempre la dosis más pequeña y la concentración más baja requerida para producir la anestesia deseada.

En adultos las dosis usuales son las siguientes :

- Intervenciones en abdomen:

75–100 mg (correspondiente a 1.5–2 ml de Lidocaína hiperbárica Braun 5%).

- Anestesia espinal inferior obstétrica:

- Parto vaginal normal: 50 mg (correspondiente a 1 ml).

- Cesárea y parto que requiera manipulación intrauterina: 50 mg (correspondiente a 1,5 ml).

En ancianos, especialmente aquellos con alteraciones de la función cardíaca, shock cardiogénico o enfermedades hepática, los requerimientos en la dosis serán menores.

En pacientes con enfermedades renales, puede ser necesario ajustar la dosis debido a una

posible acumulación de los metabolitos de la lidocaína, ya que en estos pacientes puede producirse acumulación de la glicinxilidada (metabolito mayoritario de la lidocaína) que es dependiente de la función renal.

Los pacientes con enfermedades hepáticas necesitan una tasa de infusión menor debido a la disminución de la aclaramiento hepático (ver apartado 5.2).

4.3 Contraindicaciones

Las soluciones de clorhidrato de lidocaína están contraindicadas en pacientes que presenten hipersensibilidad a lidocaína y a otros anestésicos locales tipo amida.

Existen contraindicaciones propias de la vía de administración:

- disfunción cardiovascular, sobretodo bloqueo cardíaco o shock.
- septicemia
- antecedentes de hipertermia maligna
- dolor de espalda crónico
- enfermedad activa aguda del sistema nervioso central, como meningitis, tumor, poliomielitis y hemorragia craneal.
- infección pirogénica de la piel en el lugar de la punción o en posición adyacente.
- defectos de la coagulación inducida por el tratamiento con anticoagulantes o alteraciones hematológicas
- dolor de cabeza preexistente, sobre todo si existe historial de migraña
- líquido cefalorraquídeo hemorrágico ya que existe riesgo de administración intravascular inadvertida
- hipertensión o hipotensión
- parestesias persistentes
- estenosis espinal y enfermedades como por ejemplo espondilitis o tumores, o lesión reciente (ej. fractura) de la columna vertebral

4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo

Lidocaína hiperbárica 5% Braun únicamente debe ser administrado por médicos especialistas en anestesia y deben estar disponibles en todo momento, los dispositivos necesarios para mantener abiertas las vías respiratorias, para la ventilación artificial y equipos de reanimación.

Es fundamental tener en cuenta:

- Elegir la dosis tan baja como sea posible
- Utilizar una aguja de la dimensión apropiada
- Inyectar lentamente con varias aspiraciones en dos planos (rotar la aguja 180°)
- No inyectar regiones infectadas
- Controlar la presión sanguínea con dosis elevadas
- Premedicación con benzodiazepinas a dosis moderadas.

Debe mantenerse el contacto verbal con el paciente y controlar los signos cardiovasculares. La administración debe ser discontinuada inmediatamente si se producen síntomas tóxicos. Debe tenerse en cuenta que la aparición de inquietud, ansiedad, tinnitus, mareos, visión borrosa, temblores, depresión, somnolencia pueden ser signos anticipados de una toxicidad del sistema nervioso central.

Se debe tener prudencia con las dosis en caso de hipoxia, hiperkalemia, o acidosis que aumentan el riesgo de toxicidad cardíaca de lidocaína, así como en niños menores de 12 años y en ancianos.

Se deben tener en cuenta las contraindicaciones generales y específicas para los distintos métodos de anestesia local y regional.

La anestesia subaracnoidea por debajo de la región torácica (T10), puede causar hipotensión, debido al bloqueo de las vías simpáticas vasoconstrictoras. La vasodilatación en los vasos sanguíneos esplánicos da lugar a una reducción del retorno venoso. La hipotensión puede ser prevenida o minimizada mediante una precarga con cristaloides o soluciones coloidales, o tratada con efedrina (10-15 mg IV).

Utilizar con precaución cada vez que una patología o una terapéutica concomitante (β -bloqueante) disminuyen el débito sanguíneo hepático. En pacientes con enfermedades hepáticas graves se recomienda precaución, debido a su incapacidad para metabolizar la lidocaína y un mayor riesgo de alcanzar concentraciones plasmáticas tóxicas. Igualmente, se recomienda precaución en pacientes con trastornos renales o cardiovasculares.

Advertencia a deportistas: se informa que este medicamento contiene un componente que puede establecer un resultado analítico del control del dopaje como positivo.

Advertencia a diabéticos: este medicamento contiene 7,5 g/100 ml de glucosa, por lo que deberá ser tenido en cuenta por los pacientes diabéticos.

4.5 Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Actualmente se dispone de amplia información sobre las interacciones de la lidocaína tras administración intravenosa. Sin embargo, la extrapolación de estas interacciones tras una administración subaracnoidea es muy difícil dado que el perfil farmacocinético es diferente.

El uso simultáneo de lidocaína con antiarrítmicos puede producir efectos cardíacos aditivos.

La inhibición de la transmisión neuronal que producen los anestésicos locales puede antagonizar los efectos de los antimiastrénicos en el músculo esquelético, sobre todo si se absorben grandes cantidades de anestésico.

El uso simultáneo de medicamentos que produzcan depresión del sistema nervioso central ya que puede provocar efectos depresores aditivos. Se recomienda especial precaución y prestar atención a la dosificación del fármaco. Tras la administración prolongada de antiepilépticos como por ejemplo fenitoína, benzodiazepinas o barbitúricos puede ser necesario ajustar la dosis de lidocaína.

Se debe tener especial precaución tras la administración conjunta de bloqueantes beta- adrenérgicos con lidocaína ya que el uso simultáneo puede hacer más lento el metabolismo de la lidocaína debido al menor flujo de sangre hepático.

Los efectos de bloqueantes neuromusculares pueden potenciarse cuando se emplean simultáneamente con dosis elevadas de lidocaína.

El uso simultáneo en pacientes que reciben anestésicos locales para bloqueo subaracnoideo y de inhibidores de la monoaminooxidasa debido a que aumenta el riesgo de hipotensión.

En pacientes con niveles elevado de anestésico tras la administración de analgésicos opiáceos coadyuvantes de la anestesia, los efectos vagales de fentanilo, alfentanilo también pueden ser más pronunciados.

La administración conjunta con cimetidina puede disminuir el aclaramiento de la lidocaína. Soluciones desinfectantes que contengan metales pesados, debido a que los anestésicos locales pueden liberar iones de metales pesados de estas soluciones que, si se inyectan junto con el anestésico, pueden producir una gran irritación local, hinchazón y edema.

4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia

Embarazo

El paso a través de la placenta es de particular importancia en el uso de la anestesia subaracnoidea durante el

embarazo. La lidocaína atraviesa la placenta y el porcentaje de difusión está relacionado con el gradiente de concentración entre sangre materna y sangre fetal, el gradiente de pH y con el grado de unión a proteínas plasmáticas. El grado de unión a proteínas plasmáticas fetales es menor que la unión a proteínas plasmáticas maternas.

No se han realizado estudios en humanos, sin embargo los estudios en ratas con dosis de hasta 6,6 veces la dosis máxima humana, no han mostrado que la lidocaína produzca efectos adversos en el feto (categoría B, según FDA).

En caso de empleo durante el embarazo deberá evaluarse la relación beneficio-riesgo, la dosis será la menor posible. Utilizar con mucha precaución en obstetricia, especialmente en situaciones de hipoxia fetal y acidosis.

Parto y alumbramiento: la administración subaracnoidea de lidocaína puede producir cambios en la contractibilidad uterina y/o esfuerzos de expulsión de la madre. El uso de anestésicos locales durante el alumbramiento puede aumentar la necesidad de utilizar fórceps.

Se ha demostrado que la lidocaína contrae las venas uterinas, lo que puede dar lugar a hipoxia fetal. Los bloqueantes alfa-adrenérgicos no revierten este efecto.

Postparto: Entre el primer y segundo día postparto se pueden producir perturbaciones neurológicas neonatales, tales como disminución de la fuerza y del tono muscular. Después del bloqueo paracervical se ha descrito marcada depresión del sistema nervioso central del recién nacido. La inyección intracraneal accidental en el feto durante la administración con fines de anestesia pudenda también puede producir convulsiones en el neonato.

Lactancia

Después de la administración por vía intravenosa de dos inyecciones de lidocaína y de una infusión intravenosa, la concentración de lidocaína en leche materna al cabo de 7 horas después de la inyección son negligiblemente pequeñas (0.8 mcg/ml) No se conoce con exactitud la distribución de la lidocaína en la leche materna, aunque no se han documentado problemas en humanos a este respecto. Por ello, se deberá usar con precaución en madres lactantes.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No procede.

4.8 Reacciones adversas

Las reacciones adversas generalmente son dependientes de la dosis y pueden ser resultado de dosificación excesiva o rápida absorción en el lugar de la inyección, así como menor tolerancia, de la idiosincrasia o de la hipersensibilidad de algunos pacientes. No obstante, a las dosis recomendadas y con los procedimientos anestésicos adecuados no se han observado efectos secundarios importantes.

Ocasionalmente, los efectos secundarios en raquianestesia por sobredosis o dificultades en la técnica anestésica pueden originar dolor de espalda o dolor de cabeza, incontinencia fecal y/o urinaria, hipotensión, parestesia y parálisis de las extremidades inferiores, problemas respiratorios y ritmo cardíaco lento.

Raramente, se han descrito metahemoglobinemias y reacciones como dificultad para respirar, prurito, rash cutáneo, hinchazón de la piel.

Excepcionalmente, pueden aparecer reacciones de hipersensibilidad, dermatitis alérgica, edema angioneurótico, ataque de asma e incluso shock anafiláctico.

Las complicaciones neurológicas de la anestesia subaracnoidea son poco frecuentes, y están normalmente

relacionadas con escape de fluido cerebro-espinal, traumatismo, infección, o una patología preexistente. De todas formas, los efectos adversos más relacionados con la vía de administración subaracnoidea son la aracnoiditis (proceso inflamatorio de las membranas de la médula subaracnoidea) y el denominado *síndrome "cauda equina"* que se caracteriza por una incontinencia fecal y urinaria, pérdida sensorial localizada en el área perianal y debilidad en las piernas, dolor de espalda, bradicardia, parálisis de los nervios craneales, dolor de cabeza, hipotensión, meningismus, parestesia, anestesia persistente, parálisis respiratoria, meningitis séptica e incoscienza.

Notificación de sospechas de reacciones adversas

Es importante notificar las sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a través del sistema nacional de notificación, incluido en el Sistema Español de Farmacovigilancia de Medicamentos de Uso Humano: www.notificaRAM.es

4.9 Sobredosis

Al igual que con los otros anestésicos locales, debido a una excesiva dosificación, una rápida absorción o a una inyección intravascular periférica pueden presentarse los síntomas de intoxicación que se manifiestan fundamentalmente a nivel del sistema nervioso central y del sistema cardiovascular.

- Sistema cardiovascular: bloqueo progresivo del corazón, hipotensión y asístole. Si no se recibe tratamiento puede producir hipoxia, acidosis, bloqueo cardíaco e incluso paro cardíaco.
- Sistema nervioso central: anestesia de la lengua, pérdida de conciencia ligera, desvanecimiento, visión borrosa, cefaleas, temblores, somnolencia, convulsiones e inconsciencia.

El tratamiento de la sobredosis más indicado consiste en mantener una correcta ventilación con respiración asistida. Es aconsejable realizar una monitorización respiratoria, cardiovascular y de las constantes vitales.

Si se producen efectos tóxicos, la primera medida es cesar la administración del anestésico local. El subsiguiente tratamiento consiste en parar las convulsiones y asegurar la respiración adecuada con oxígeno, si es necesario por respiración asistida. Si se producen convulsiones pueden tratarse con diazepam.

Si existe hipotensión debe administrarse vía intravenosa un vasopresor preferentemente uno de actividad inotrópica, por ejemplo efedrina y fluidos intravenosos.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propiedades farmacodinámicas

Grupo terapéutico (código ATC): N01B B: Anestésicos locales

La lidocaína 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 anestesia subaracnoidea es el resultado de una interacción del anestésico local con las estructuras nerviosas. El anestésico local ejerce su efecto por encima o por debajo del lugar de la inyección, dependiendo de la posición del paciente durante e inmediatamente después de la inyección.

5.2 Propiedades farmacocinéticas

La lidocaína administrada localmente difunde bien a través de membranas aunque la extensión de la absorción está influenciada por el lugar de administración, la técnica anestésica y vascularidad del lugar de administración.

La concentración sanguínea tras el bloqueo intratecal es menor en comparación con la obtenida en otros procesos de anestesia regional, debido a la menor dosis necesaria para la anestesia intratecal.

La farmacocinética se puede ver alterada por diferentes factores como por ejemplo las características del paciente (edad, peso y altura); por la posición del mismo durante y después de la inyección; por las características físicas de las soluciones anestésicas (densidad, peso específico, cantidad de anestésico administrada, concentración y volumen de solución inyectado), por la adición de vasoconstrictores, y por el volumen y la capacidad del espacio subaracnoideo.

Las concentraciones plasmáticas pico máximas alcanzadas tras la administración por vía subaracnoidea de una solución hiperbárica de 75 mg de lidocaína son de 444 ± 203 ng/ml. Dichas concentraciones máximas se alcanzan a las 2.0 ± 0.3 horas después de su administración.

La duración del efecto viene mediada por el ritmo de eliminación y es la distribución en el líquido cefalorraquídeo la que determina la extensión del bloqueo neural.

Tiene una unión a proteínas plasmáticas de moderada a alta, aproximadamente un 65% se encuentra unido a proteínas plasmáticas, principalmente a α_1 -ácido glicoproteínas.

El paso a través de la placenta es de particular importancia en el uso de la anestesia subaracnoidea durante el embarazo. El grado de unión a proteínas plasmáticas fetales es menor que la unión a proteínas plasmáticas maternas. La lidocaína posee una tasa F/M (fetal /maternal) de 0,52 – 0,7.

Sufre metabolismo hepático, aproximadamente el 80- 90% de la dosis es desalquilada para dar metabolitos activos monoetilglicinxilidida y glicinxilidida que pueden contribuir a los efectos terapéuticos y tóxicos. Tiene una vida media de 1 a 2 horas (alrededor de 100 minutos) que es dependiente de la dosis. La vida media del metabolito glicinxilidida es más larga por lo que puede producirse acumulación, especialmente en caso renal.

La eliminación de los metabolitos es fundamentalmente renal. La excreción renal puede ser posterior a la excreción biliar en el tracto gastrointestinal y a la reabsorción en dicho tracto. Alrededor del 10% se excreta de forma inalterada.

El aclaramiento de la lidocaína se ve considerablemente reducido en caso de disfunción hepática, pudiendo prologar la semivida de la lidocaína hasta dos veces o más.

5.3 Datos preclínicos sobre seguridad

En los estudios de toxicidad aguda realizados en ratones se alcanzaron valores de DL_{50} 292 mg/kg (vía oral), 105 mg/kg (vía intraperitoneal) y 19,5 mg/kg (vía intravenosa). Se ha observado que lidocaína afecta principalmente al sistema nervioso central y con menor frecuencia al sistema cardiovascular.

No se dispone de datos correspondientes a ensayos toxicológicos a dosis repetidas. Sin embargo, dada las indicaciones terapéuticas de la lidocaína y su administración puntual durante corto tiempo la administración crónica queda excluida.

La administración de lidocaína en ratas entre los días 3 al 17 de gestación permitió establecer una dosis mínima teratogena de 500 mg/kg/día.

Dado que el fármaco se administra durante períodos cortos de tiempo, no se han llevado a cabo estudio sobre el potencial carcinogénico de la lidocaína.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1 Lista de excipientes

Glucosa monohidrato,
Hidróxido sódico,
Agua para inyección.

6.2 Incompatibilidades

Es incompatible con dicarbazina, metohexital sódico, fenitoína sódica, cefazolina sódica, anfotericina B y sulfadiacina sódica.

La solución hiperbárica de clorhidrato de lidocaína no debe mezclarse con fármacos de pH alcalino, por el riesgo de precipitación de la base.

6.3 Período de validez

Período de validez del medicamento en su envase de venta

Tres años.

Período de validez tras dilución o reconstitución según las instrucciones

No procede.

Período de validez tras la primera apertura del envase

El contenido de las ampollas debe ser usado inmediatamente tras su apertura. Una vez abierto el envase, desechar la porción no utilizada de la solución.

6.4 Precauciones especiales de conservación

No se precisan condiciones especiales de conservación. Conservar en el envase original.

6.5 Naturaleza y contenido del envase

Envase unitario conteniendo 1 ampolla de vidrio de 2 ml. Envase clínico conteniendo 100 ampollas de vidrio de 2 ml.

6.6 Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

Manejar en las condiciones habituales de asepsia en la utilización de soluciones inyectables. Debido a que la especialidad contiene glucosa, puede aparecer caramelización durante la esterilización en autoclave. Por este motivo no debe re-esterilizarse.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

B.Braun Medical,
S.A Carretera de
Terrassa, 121
08191 Rubí. Barcelona.

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

65.440

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

Junio 2003

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Junio 2015