

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Lidocaína Kabi 10 mg/ml solución inyectable EFG

Lidocaína Kabi 20 mg/ml solución inyectable EFG

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Lidocaína Kabi 10 mg/ml solución inyectable:

Cada ml de solución inyectable contiene 10 mg de hidrocloreuro de lidocaína (como monohidrato) correspondiente a 8,11 mg de lidocaína.

Cada 5 ml de solución inyectable contienen 50 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Cada 10 ml de solución inyectable contienen 100 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Cada 20 ml de solución inyectable contienen 200 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Lidocaína Kabi 20 mg/ml solución inyectable:

Cada ml de solución inyectable contiene 20 mg de hidrocloreuro de lidocaína (como monohidrato) correspondiente a 16,22 mg de lidocaína.

Cada 5 ml de solución inyectable contienen 100 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Cada 10 ml de solución inyectable contienen 200 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Cada 20 ml de solución inyectable contienen 400 mg de hidrocloreuro de lidocaína.

Excipiente(s) con efecto conocido

Lidocaína Kabi 10 mg/ml solución inyectable:

Cada ml de solución inyectable contiene aproximadamente 0,124 mmol de sodio.

Lidocaína Kabi 20 mg/ml solución inyectable:

Cada ml de solución inyectable contiene aproximadamente 0,093 mmol de sodio.

Para consultar la lista completa de excipientes ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Solución inyectable.

Solución acuosa, transparente e incolora, prácticamente libre de partículas visibles.

pH de la solución 5,0 – 7,0.

Osmolalidad de la solución 280 – 340 mOsm.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1 Indicaciones terapéuticas

Anestesia local por infiltración superficial, regional (bloqueo nervioso menor y mayor), vías epidural y caudal, anestesia dental, ya sea solo o en combinación con adrenalina.

4.2 Posología y forma de administración

Posología

La dosis se ajusta según la respuesta del paciente y el lugar de administración. Debe administrarse la menor concentración y la dosis más pequeña que produzca el efecto requerido. La dosis máxima para adultos sanos no debe sobrepasar los 200 mg.

El volumen de la solución utilizado juega un papel en el tamaño del área de diseminación de la anestesia. En caso de que se desee administrar un volumen mayor con una concentración menor, la solución estándar debe diluirse con una solución salina (NaCl 0.9%). Esta dilución debe prepararse justo antes de la administración.

Adultos y adolescentes (12 - 18 años de edad)

Las dosis únicas de lidocaína (para anestesia que no sea espinal) no deben exceder los 4,5 mg/kg (con un máximo de 200 mg) en adultos o en adolescentes.

Para la anestesia espinal, se pueden administrar hasta 100 mg del fármaco. Para la anestesia epidural o caudal continua, la dosis máxima no debe repetirse a intervalos de menos de 1,5 horas. Para el bloqueo paracervical de la analgesia obstétrica (incluido el aborto), la dosis máxima recomendada (200 mg) no debe repetirse a intervalos de menos de 1,5 horas. Para la anestesia regional IV en adultos que usen una solución de 5 mg/ml, la dosis administrada no debe superar los 4 mg/kg.

Para anestesia epidural o caudal se usan soluciones de hidrocloreuro de lidocaína 10 mg/ml (sin conservante). Para prevenir la inyección intravascular o subaracnoidea de una dosis epidural importante de lidocaína, se debe inyectar una dosis de prueba de 2-5 ml al menos 5 minutos antes de administrar la dosis total.

En la anestesia epidural generalmente se requieren 2-3 ml de solución de 10 mg/ml para cada dermatoma a ser anestesiado.

En el bloqueo caudal para la producción de analgesia obstétrica o en el bloqueo torácico epidural, se pueden utilizar 20-30 ml de una solución de 10 mg/ml (200-300 mg) del fármaco. Para la anestesia lumbar epidural, la dosis es de 25-30 ml (250-300 mg) de una solución de 10 mg/ml.

Para el bloqueo del nervio intercostal: 3 ml de una solución de 10 mg/ml (30 mg).

Para el bloqueo del nervio paravertebral: 3-5 ml de una solución de 10 mg/ml (30-50 mg).

Para el bloqueo del nervio pudendo (en cada lado): 10 ml de una solución de 10 mg/ml (100 mg).

Para el bloqueo del nervio paracervical (en cada lado) para la analgesia obstétrica: 10 ml de una solución de 10 mg/ml (100 mg).

Para los bloqueos del nervio simpático: bloqueo del nervio cervical (ganglio estrellado): 5 ml de una solución de 10 mg/ml (50 mg).

Bloqueo del nervio lumbar: 5-10 ml de una solución de 10 mg/ml (50-100 mg).

Para la anestesia por infiltración percutánea: 1-60 ml de una solución de 5 mg/ml o de 0,5 a 30 ml de una solución de 10 mg/ml (5-300 mg).

Para anestesia regional IV: 10-60 ml de solución de 5 mg/ml (50-300 mg).

Población pediátrica

Generalmente, la dosis en niños debe reducirse. Para minimizar la posibilidad de reacciones tóxicas, los niños deben recibir soluciones de hidrocloreuro de lidocaína en concentraciones de 5 mg/ml o 10 mg/ml. Para niños menores de 12 años, la lidocaína por infiltración local no debe exceder los 3 mg/kg y no debe repetirse en intervalos de menos de 4 horas.

Poblaciones especiales

La dosis debe reducirse en pacientes con edad avanzada y pacientes debilitados.

Forma de administración

Lidocaína Kabi debe administrarse mediante inyección intravenosa, intramuscular, subcutánea o epidural. No destinado al uso en los ojos.

La forma de administración de lidocaína varía en función del procedimiento de anestesia que se utilice (anestesia regional intravenosa, anestesia por infiltración, bloqueo nervioso o anestesia epidural).

Para la dilución de Lidocaína Kabi solución inyectable ver la sección 6.6.

4.3 Contraindicaciones

Hipersensibilidad al principio activo, a los anestésicos tipo amida o a cualquiera de los excipientes incluidos en la sección 6.1.

Lidocaína Kabi está contraindicada en pacientes con:

- bloqueo cardíaco completo
- hipovolemia

4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo

La lidocaína debe ser administrada por personas con habilidades para la reanimación, y los equipos y las instalaciones para la reanimación deben estar disponibles cuando se administren anestésicos locales.

Al igual que con todos los agentes anestésicos locales, la lidocaína puede causar efectos tóxicos agudos, para el sistema nervioso central, y cardiovasculares cuando su uso produce altas concentraciones en la sangre, particularmente después de una administración intravascular extensa.

La lidocaína debe administrarse con precaución:

- en pacientes con trastornos en la generación de impulsos cardíacos y alteraciones de la conducción cardíaca, ya que la anestesia local puede disminuir la conductividad del miocardio (ver también la sección 4.3).
- en pacientes tratados con fármacos antiarrítmicos de clase III (por ejemplo, amiodarona). Estos pacientes deben vigilarse estrechamente y debe plantearse una monitorización del ECG, ya que los efectos cardíacos pueden ser acumulativos (ver sección 4.5).
- en pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva o, bradicardia o después de una cirugía cardíaca.
- en pacientes con shock grave.
- en pacientes con función respiratoria deteriorada.
- en pacientes con trastornos convulsivos cerebrales.
- en pacientes con miastenia gravis.
- en pacientes con coagulopatía. El tratamiento con anticoagulantes (p. Ej., Heparina), AINEs o sustitutos del plasma causa una mayor tendencia a la hemorragia. La lesión accidental de los vasos sanguíneos puede provocar hemorragias graves. Si es necesario, se debe verificar el tiempo de sangrado y el tiempo de tromboplastina parcial activada (aPTT), el Quick Test y el recuento de plaquetas.
- en personas de edad avanzada y generalmente debilitadas.
- en pacientes con alteración de la función hepática, ya que se metaboliza en el hígado.
- en pacientes con insuficiencia renal con un aclaramiento de creatinina inferior a 10 ml/min.

La hipopotasemia, la hipoxia y los trastornos del equilibrio ácido-base deben corregirse antes del tratamiento con lidocaína intravenosa.

Durante la anestesia espinal se debe controlar la presión arterial. La anestesia epidural puede provocar hipotensión y bradicardia. Este riesgo se puede reducir precargando la circulación con soluciones

cristaloides o coloidales. La hipotensión debe tratarse inmediatamente. Siempre se debe tener precaución en pacientes con deterioro de la función cardiovascular.

El bloqueo paracervical a veces puede causar bradicardia o taquicardia fetal y es necesario un control cuidadoso de la frecuencia cardíaca fetal (ver sección 4.6).

Las inyecciones en las regiones de cabeza y cuello pueden realizarse inadvertidamente en una arteria causando síntomas cerebrales incluso a dosis bajas.

Las inyecciones retrobulbares raras veces pueden alcanzar el espacio subaracnoideo craneal, causando reacciones serias/graves, que incluyen colapso cardiovascular, apnea, convulsiones y ceguera temporal.

Las inyecciones retro y peribulbares de anestésicos locales conllevan un bajo riesgo de disfunción motora ocular persistente. Las causas principales incluyen traumas y/o efectos tóxicos locales en los músculos y/o los nervios.

La gravedad de tales reacciones tisulares está relacionada con el grado del trauma, la concentración del anestésico local y la duración de la exposición del tejido al anestésico local. Por esta razón, se deben usar la concentración y la dosis efectiva más bajas del anestésico local.

El efecto puede reducirse si la inyección lleva a cabo en un área inflamada o infectada.

La lidocaína intramuscular puede aumentar las concentraciones de creatinina fosfoquinasa que pueden interferir con el diagnóstico de infarto agudo de miocardio. Se ha demostrado que la lidocaína es porfirinogénica en animales y debe evitarse en personas que padecen porfiria.

Ha habido informes posteriores a la comercialización de condrólisis en pacientes que recibieron perfusión intraarticular continua postoperatoria de anestésicos locales. La mayoría de los casos reportados de condrólisis han involucrado a la articulación del hombro. Debido a múltiples factores contribuyentes e inconsistencia en la literatura científica sobre el mecanismo de acción, la causalidad no ha sido establecida. La perfusión intraarticular continua no es una indicación aprobada para la lidocaína.

La solución de lidocaína inyectable no se recomienda para su uso en neonatos. Se desconoce la concentración sérica óptima de lidocaína requerida para evitar la toxicidad, como convulsiones y arritmias cardíacas, en este grupo de edad.

Pacientes con dietas controladas de sodio

Lidocaína Kabi 10 mg/ml solución inyectable

Este medicamento contiene 85 mg (aproximadamente 3,72 mmol) de sodio por dosis. Esto es equivalente al 4,25% de la ingesta diaria máxima recomendada por la OMS de 2 g de sodio para un adulto. Estos datos deben tenerse en cuenta en el caso de pacientes con una dieta controlada de sodio.

Lidocaína Kabi 20 mg/ml solución inyectable

Este medicamento contiene 32 mg (aproximadamente 1,39 mmol) de sodio por dosis. Esto es equivalente al 1,6 % de la ingesta diaria máxima recomendada por la OMS de 2 g de sodio para un adulto. Estos datos deben tenerse en cuenta en el caso de pacientes con una dieta controlada de sodio.

4.5 Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Efectos de lidocaína en otros medicamentos

La lidocaína debe usarse con precaución en pacientes que reciban otros anestésicos locales o agentes estructuralmente relacionados con anestésicos locales de tipo amida (por ejemplo, antiarrítmicos, como mexiletina y tocainida), ya que los efectos sistémicos son acumulativos.

No se han realizado estudios de interacción específicos con lidocaína y fármacos antiarrítmicos de clase III (por ejemplo, amiodarona), pero se recomienda precaución. Puede haber un riesgo incrementado de bloqueo neuromuscular intensificado y prolongado en pacientes tratados simultáneamente con relajantes musculares (por ejemplo, suxametonio).

Efecto de otros medicamentos en lidocaína

Los fármacos que inhiben el metabolismo de la lidocaína (por ejemplo, cimetidina, fluvoxamina, propranolol) pueden causar concentraciones plasmáticas potencialmente tóxicas cuando la lidocaína se administra repetidamente a dosis elevadas durante largos períodos de tiempo. Debido a que la lidocaína posee una ventana terapéutica estrecha, las dosis de lidocaína pueden necesitar ajustarse en consecuencia.

También puede producirse un aumento en los niveles séricos de lidocaína con agentes antivirales (por ejemplo, amprenavir, atazanavir, darunavir, lopinavir).

Por el contrario, las concentraciones reducidas de lidocaína sérica pueden ser el resultado de fármacos que pueden estimular el metabolismo hepático de la lidocaína (por ejemplo, fenitoína, terapia de reemplazo hormonal oral). Se pueden requerir dosis más altas de lidocaína.

La coadministración de fármacos antiarrítmicos, betabloqueantes y antagonistas del calcio puede causar un efecto inhibitorio aditivo sobre la conducción AV, la conducción intraventricular y la contractilidad.

Puede haber un mayor riesgo de arritmia ventricular en pacientes tratados simultáneamente con antipsicóticos que prolongan o pueden prolongar el intervalo QT (p. Ej. Pimozida, sertindol, olanzapina, quetiapina, zotepina), prenilamina, adrenalina (si se inyecta accidentalmente por vía intravenosa) o antagonistas de 5HT₃ (ej. tropisetron, dolasetron).

La administración concomitante de fármacos vasoconstrictores conduce a una acción de mayor duración de la lidocaína.

Si bien la adrenalina (epinefrina), cuando se usa junto con la lidocaína, puede disminuir la absorción vascular, aumenta enormemente el riesgo de taquicardia ventricular y fibrilación si se inyecta accidentalmente por vía intravenosa.

La administración concomitante de lidocaína y alcaloides del centeno (por ejemplo, ergotamina) puede causar una disminución grave de la presión arterial.

La administración intravenosa de fenitoína puede aumentar el efecto cardiodepresivo de la lidocaína.

Se ha informado del colapso cardiovascular después del uso de bupivacaína en pacientes en tratamiento con verapamilo y timolol; la lidocaína está estrechamente relacionada con la bupivacaína.

Debe evitarse el uso concomitante de quinupristina/dalfopristina ya que el uso de este antibiótico con lidocaína puede conducir a una mayor concentración de lidocaína.

La hipopotasemia causada por diuréticos puede antagonizar la acción de la lidocaína si se administra concomitantemente (ver sección 4.4).

Se debe tener precaución en el uso de sedantes que también afectan la función del sistema nervioso central y pueden alterar el efecto de los anestésicos locales.

La dopamina y la 5 hidroxitriptamina reducen el umbral convulsivo a la lidocaína.

Los narcóticos probablemente sean proconvulsivos y esto reforzaría la evidencia de que la lidocaína reduce el umbral convulsivo al fentanilo en humanos.

La combinación opioide-antiemético utilizada a veces para la sedación en niños podría reducir el umbral convulsivo a la lidocaína y aumentar el efecto depresor del SNC.

El efecto analgésico de los anestésicos locales puede ser potenciado por los opioides y la clonidina.

El alcohol etílico, especialmente el abuso crónico, puede disminuir el efecto de los anestésicos locales.

La lidocaína está fuertemente ligada a la glucoproteína alfa-1 ácida (AAG). Las concentraciones de AAG pueden ser reducidas por los estrógenos que conducen a una mayor fracción libre de lidocaína en las mujeres que en los hombres y la fracción libre aumenta aún más durante el embarazo y en las mujeres que toman anticonceptivos orales o terapia de reemplazo hormonal.

4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia

Embarazo

La lidocaína atraviesa la placenta. No hay evidencia de que la lidocaína cause alteraciones en el proceso reproductivo, como una mayor incidencia de malformaciones, o que tenga un efecto directo o indirecto en el feto. Los estudios en animales no revelaron evidencias de daño al feto.

Sin embargo, no debe administrarse durante el embarazo a menos que se considere que los beneficios superen los riesgos.

La lidocaína administrada por bloqueo epidural o paracervical, especialmente a dosis elevadas, o por infiltración perineal local antes del parto, pasa rápidamente a la circulación fetal. Los niveles elevados de lidocaína pueden persistir en el recién nacido durante al menos 48 horas después del parto. Puede darse bradicardia fetal o bradicardia neonatal, hipotonía o depresión respiratoria.

Lactancia

La lidocaína se excreta en la leche materna en pequeñas cantidades. Por lo tanto, se recomienda precaución cuando Lidocaína Kabi se usa a las dosis recomendadas para mujeres lactantes, sin embargo, no hay necesidad de interrumpir la lactancia.

Fertilidad

No se dispone de datos en humanos sobre el efecto de la lidocaína en la fertilidad.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Debido a los efectos de la lidocaína en el sistema nervioso central, Lidocaína Kabi tiene una influencia temporal en la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

Por lo tanto, cuando la anestesia ambulatoria afecta áreas del cuerpo involucradas en la conducción o el manejo de maquinaria, se debe advertir a los pacientes que eviten estas actividades hasta que se restablezca por completo la función normal.

4.8 Reacciones adversas

Las reacciones adversas se enumeran según su frecuencia de la siguiente manera:

Muy frecuentes ($\geq 1/10$),

Frecuentes ($\geq 1/100$ a $< 1/10$),

Poco frecuentes ($\geq 1/1.000$ a $< 1/100$),

Raras ($\geq 1/10.000$ a $< 1/1.000$),

Muy raras ($< 1/10.000$),

No conocidas (no puede estimarse la frecuencia a partir de los datos disponibles).

Al igual que otros anestésicos locales, las reacciones adversas a la lidocaína son raras y normalmente se producen como resultado de concentraciones plasmáticas elevadas debidas a una inyección intravascular accidental, una dosificación excesiva o una absorción rápida de áreas altamente vascularizadas o pueden ser consecuencia de hipersensibilidad, idiosincrasia o tolerancia disminuida por parte del paciente. La

toxicidad sistémica afecta principalmente al sistema nervioso central y/o el sistema cardiovascular (ver también 4.9).

Después del bloqueo regional, como cuando se inyecta lidocaína por vía intratecal o extradural, se pueden observar hipotensión, hipoventilación, síndrome de Horner e hipoglucemia. El grado de estos efectos dependerá de la dosis y la altura del bloqueo. La retención urinaria puede ocurrir después de un bloqueo epidural sacro o lumbar. No debería durar más que la duración del bloqueo. La apnea y la hemiparesia pueden ocurrir después del bloqueo del ganglio estrellado. La causa probable es una inyección directa de lidocaína en las arterias vertebrales o carótidas.

Clasificación por órganos y sistemas	Muy frecuentes ≥ 1/10	Frecuentes ≥ 1/100 a < 1/10	Poco frecuentes ≥ 1/1.000 a < 1/100	Raras ≥ 1/10.000 a < 1/1.000	Frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles)
Transtornos de la sangre y del sistema linfático					metahemoglobinemia
Transtornos del sistema inmune				Reacciones de hipersensibilidad ^o , urticaria, erupción, angioedema, broncoespasmo, en casos graves shock anafiláctico	
Transtornos del sistema nervioso [#]		parestesia, mareo	síntomas de toxicidad del sistema nervioso central (convulsiones, parestesia circumoral, entumecimiento de la lengua, hiperacusia, trastornos visuales, pérdida de la conciencia, temblor, somnolencia, aturdimiento, tinnitus, sensación de intoxicación, disartria)	neuropatía, lesiones del nervio periférico, aracnoiditis	nerviosismo, coma
Transtornos oculares				visión borrosa, diplopía y amaurosis transitoria, amaurosis bilateral*	
Trastornos del oído y del laberinto					tinnitus, hiperacusia
Transtornos cardíacos		bradicardia		parada cardíaca, arritmia	
Transtornos vasculares	hipotensión	hipertensión			

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos				depresión respiratoria	disnea, paro respiratorio
Transtornos gastrointestinales	náuseas	vómitos			

° Las pruebas cutáneas para la alergia a la lidocaína no se consideran fiables.

* La amaurosis bilateral también puede ser una consecuencia de la inyección accidental de la cubierta del nervio óptico durante los procedimientos oculares. La inflamación orbital y la diplopía han sido reportadas después de una anestesia retro o peribulbar.

Las complicaciones neurológicas de la anestesia espinal incluyen síntomas neurológicos transitorios, como dolor en la parte inferior de la espalda, las nalgas y las piernas. Estos síntomas generalmente se desarrollan dentro de las veinticuatro horas posteriores a la anestesia y se resuelven en unos pocos días. Se han notificado casos aislados de aracnoiditis o síndrome de la cola de caballo, con parestesia persistente, disfunción intestinal y urinaria o parálisis de las extremidades inferiores después de la anestesia espinal con lidocaína y otros agentes similares. La mayoría de los casos se han asociado con concentraciones hiperbáricas de lidocaína o perfusión espinal prolongada.

Notificación de sospecha de reacciones adversas

Es importante notificar 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 Español de Farmacovigilancia de Medicamentos de Uso Humano: www.notificaRAM.es.

4.9 Sobredosis

Síntomas de toxicidad sistémica aguda

La toxicidad del sistema nervioso central se presenta con síntomas de gravedad creciente. Los pacientes pueden presentar inicialmente parestesia circunmoral, entumecimiento de la lengua, aturdimiento, hiperacusia y tinnitus. Las alteraciones visuales y los temblores musculares o espasmos musculares son más graves y preceden al inicio de las convulsiones generalizadas. Estos signos no deben confundirse con un comportamiento neurótico. Pueden seguir inconciencia y convulsiones de gran mal, que pueden durar desde unos pocos segundos hasta varios minutos. La hipoxia y la hipercapnia se producen rápidamente después de las convulsiones debido al aumento de la actividad muscular, junto con la interferencia con la respiración normal y la pérdida de las vías respiratorias. En casos graves, puede ocurrir apnea. La acidosis aumenta los efectos tóxicos de los anestésicos locales.

En casos graves pueden verse efectos en el sistema cardiovascular. Puede darse hipotensión, bradicardia, arritmia y paro cardíaco como resultado de concentraciones sistémicas elevadas, con un desenlace potencialmente fatal.

La recuperación se produce como consecuencia de la redistribución del fármaco anestésico local desde el sistema nervioso central y del metabolismo, y puede ser rápida a menos que se hayan inyectado grandes cantidades del fármaco.

Tratamiento de la toxicidad aguda

Si aparecen signos de toxicidad sistémica aguda, la inyección del anestésico debe suspenderse de inmediato.

El tratamiento será necesario si se producen convulsiones y depresión del SNC y cardiotoxicidad. Los objetivos del tratamiento son mantener la oxigenación, detener las convulsiones y dar soporte circulatorio. Se debe establecer una vía respiratoria permeable y administrar oxígeno, junto con ventilación asistida (máscara y bolsa) si es necesario. La circulación debe mantenerse con perfusiones de plasma o líquidos intravenosos. Cuando se requiera un tratamiento de soporte adicional de la depresión circulatoria, se puede considerar el uso de un agente vasopresor, aunque esto implica un riesgo de excitación del sistema nervioso central. Si las convulsiones no cesan espontáneamente en 15-20 segundos, pueden controlarse con la administración intravenosa de diazepam (0.1 mg/kg p.c. i.v.) o tiopentona sódica (1-3 mg/kg p.c. i.v.), teniendo en cuenta que los medicamentos anticonvulsivos también pueden deprimir la respiración y la circulación.

Las convulsiones prolongadas pueden poner en peligro la ventilación y oxigenación del paciente y se debe considerar la intubación endotraqueal temprana. Si se produce un paro cardíaco, deben realizarse procedimientos de reanimación cardiopulmonar estándar. El mantenimiento óptimo continuo de la oxigenación y la ventilación y el soporte circulatorio, así como el tratamiento de la acidosis son de vital importancia.

La diálisis es de valor insignificante en el tratamiento de la sobredosis aguda con lidocaína.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: anestésicos, locales, amidas. Código ATC: N01BB02

La lidocaína es un anestésico local de acción corta del tipo amida. Se utiliza para proporcionar anestesia local mediante bloqueo nervioso en varios sitios del cuerpo y en el control iónico de las disritmias. Actúa inhibiendo los flujos iónicos requeridos para la iniciación y conducción de impulsos, estabilizando así la membrana neuronal. Además de bloquear la conducción en los axones nerviosos en el sistema nervioso periférico, la lidocaína tiene efectos importantes sobre el sistema nervioso central y el sistema cardiovascular. Después de la absorción, la lidocaína puede causar estimulación del SNC seguida de depresión, y en el sistema cardiovascular actúa principalmente en el miocardio, donde puede producir disminuciones en la excitabilidad eléctrica, la tasa de conducción y la fuerza de contracción. Tiene un inicio de acción rápido (aproximadamente un minuto después de la inyección intravenosa y quince minutos después de la inyección intramuscular) y se disemina rápidamente a través de los tejidos circundantes. El efecto dura aproximadamente de diez a veinte minutos y aproximadamente de sesenta a noventa minutos después de la inyección intravenosa e intramuscular, respectivamente.

5.2 Propiedades farmacocinéticas

Absorción

La lidocaína se absorbe en los sitios de inyección, incluido el músculo, y su velocidad de absorción está determinada por factores como el sitio de administración y la vascularización tisular. Excepto por la administración intravascular, los niveles sanguíneos más altos ocurren después de las concentraciones del bloqueo nervioso intercostal (aproximadamente 1,5 µg/ml por cada 100 mg inyectados) y los más bajos después de la administración subcutánea (aproximadamente 0,5 µg/ml por cada 100 mg inyectados).

Distribución

La lidocaína se une a las proteínas plasmáticas, incluida la glucoproteína alfa-1 ácida (AAG) y la albúmina. El grado de enlace es variable, pero es aproximadamente del 66%. El medicamento atraviesa las barreras hematoencefálica y placentaria probablemente como resultado de la difusión pasiva. El nivel plasmático de AAG en recién nacidos es bajo y la fracción libre de lidocaína biológicamente activa en neonatos es relativamente alta.

Biotransformación

La lidocaína se metaboliza en el hígado y aproximadamente el 90% de una dosis sufre una N-desalquilación para formar monoetilglicinaxilidida (MEGX) y glicinaxilidida (GX), que pueden contribuir a los efectos terapéuticos y tóxicos de la lidocaína. Los efectos farmacológicos y tóxicos de MEGX y GX son comparables pero de menor intensidad que los de la lidocaína. La glicinaxilidida tiene una semivida más larga (aproximadamente 10 horas) que la lidocaína y puede acumularse con la administración crónica. Se produce un metabolismo adicional y los metabolitos se excretan en la orina con menos del 10% de lidocaína inalterada.

Eliminación

Después de una inyección en bolo intravenosa, la semivida de eliminación de la lidocaína es de una a dos horas, pero puede prolongarse en pacientes con disfunción hepática. La vida media de eliminación de GX es de aproximadamente 10 horas y la de MEGX es de 2 horas. La alteración de la función renal no tiene ningún efecto sobre la farmacocinética de la lidocaína, pero puede conducir a la acumulación de sus metabolitos.

Poblaciones especiales

La farmacocinética de la lidocaína puede estar influenciada por condiciones que afectan la función hepática debido a su rápido metabolismo. La vida media se puede ver incrementada por un factor de 2 o más en pacientes con disfunción hepática.

La alteración de la función renal no tiene ningún efecto sobre la farmacocinética de la lidocaína, pero puede conducir a la acumulación de sus metabolitos.

En recién nacidos, los niveles de glicoproteína alfa-1 ácida son bajos y la unión a proteínas puede verse reducida. Como la fracción libre puede ser más alta, no se recomienda el uso de lidocaína en recién nacidos.

5.3 Datos preclínicos sobre seguridad

Toxicidad en la reproducción

En estudios de desarrollo embrionario/fetal en ratas y conejos con administración de lidocaína durante la organogénesis, no se observaron efectos teratogénicos. La embriotoxicidad fue observada en conejos a dosis tóxicas para la madre. Las ratas jóvenes tratadas con dosis tóxicas para la madre durante la última etapa del embarazo y la lactancia mostraron una supervivencia posnatal reducida.

Genotoxicidad y carcinogenicidad

Los estudios de genotoxicidad de la lidocaína fueron negativos. La carcinogenicidad de la lidocaína no ha sido estudiada. Se ha demostrado que el metabolito de la lidocaína, 2,6-xilidina (2,6-dimetilanilina) tiene potencial genotóxico *in vitro*. En un estudio de carcinogenicidad de ratas con exposición a 2,6-xilidina en el útero, postnatalmente y a lo largo de su vida, se observaron tumores en las fosas nasales, subdérmicos y en el hígado. La relevancia clínica de estos hallazgos para el uso de lidocaína a corto plazo/intermitentemente no se conoce.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1 Lista de excipientes

Cloruro sódico

Ácido hidrociorhídrico (para ajuste de pH)

Hidróxido de sodio (para ajuste de pH)

Agua para preparaciones inyectables

6.2 Incompatibilidades

La lidocaína es incompatible con soluciones que contienen anfotericina B, sulfadiazina sódica, metohexital sódico, cefazolina sódica, fenitoína, trinitrato de glicerilo y otras soluciones alcalinas. Por lo tanto, no es aconsejable mezclar Lidocaína Kabi con otros agentes.

Los fármacos estables en medios ácidos como el hidrocioruro de adrenalina, el tartrato de ácido de noradrenalina o la isoprenalina pueden deteriorarse después de mezclarse con el clorhidrato de lidocaína y las soluciones de lidocaína pueden elevar el pH por encima del pH máximo para su estabilidad.

Este medicamento no debe mezclarse con otros medicamentos, excepto los mencionados en la sección 6.6.

6.3 Periodo de validez

Periodo de validez del envase original sin abrir:

3 años.

Periodo de validez después de la abertura del envase:

El medicamento debe usarse inmediatamente después de la primera apertura.

La estabilidad química y física en uso se ha demostrado durante 24 horas a 25 °C. Desde el punto de vista microbiológico, el producto debe usarse inmediatamente. Si no se usa inmediatamente, los tiempos y condiciones de almacenamiento antes de su uso son responsabilidad del usuario y normalmente no deberían exceder las 24 horas a una temperatura de 2 a 8 °C, a menos que la dilución se haya realizado en condiciones asépticas controladas y validadas.

Periodo de validez después de la dilución:

Si se diluye en solución de cloruro sódico 9 mg/ml (0,9%) o solución de glucosa 50 mg/ml (5%) hasta un intervalo final de concentración de lidocaína de 2 mg/ml a 5 mg/ml en condiciones asépticas estrictas, la solución también debe ser utilizada de inmediato.

Sin embargo, si la solución diluida no se usa inmediatamente, no la guarde durante más de 12 horas en condiciones asépticas estrictas por debajo de los 25 °C.

Para la dilución de Lidocaína Kabi solución inyectable, ver sección 6.6.

6.4 Precauciones especiales de conservación

Este medicamento no requiere condiciones especiales de conservación.

Para las condiciones de conservación del medicamento abierto/diluido, ver sección 6.3.

6.5 Naturaleza y contenido del envase

Ampollas de polietileno de baja densidad con sistema de apertura de tapa de media vuelta (“twist off”).

Tamaños de envase

Ampollas de 5 ml en envases de 5, 10, 20, 50 o 100.

Ampollas de 10 ml en envases de 5, 10, 20, 50 o 100.

Ampollas de 20 ml en envases de 5, 10, 20, 50 o 100.

Puede que solamente estén comercializados algunos tamaños de envase.

6.6 Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

Usar inmediatamente después de abrir y solo los contenedores no dañados. Para un solo uso.

No lo use si la ampolla está dañada o rota.

Compatibilidad

Lidocaína Kabi solución inyectable puede diluirse en solución de cloruro sódico 9 mg/ml (0,9%) o glucosa 50 mg/ml (5%).

La solución diluida debe inspeccionarse visualmente y no debe usarse en presencia de opalescencia, partículas visibles o precipitados.

Todo medicamento o material de desecho que no haya sido utilizado se debe eliminar de acuerdo con los requisitos locales.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

Fresenius Kabi España, S.A.U.

C/Marina 16-18

08005 Barcelona
España

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

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

Marzo 2019

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Mayo 2018