

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Lidocaína Lainco 20 mg/ml solución para gargarismos

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada ml de solución contiene:

- Lidocaína hidrocloreto monohidrato 20 mg

Excipientes con efecto conocido

- Parahidroxibenzoato sódico de metilo (E-219) 0,70 mg
- Parahidroxibenzoato sódico de propilo (E-217) 0,30 mg
- Etanol 1,12 mg
- Eugenol 0,0168 mg

Para consultar la lista completa de excipientes ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Solución para gargarismos.

Líquido transparente, o ligeramente amarillento.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1 Indicaciones terapéuticas

Este medicamento está indicado en adultos (mayores de 18 años) como anestésico local en:

- Tratamiento sintomático, de corta duración, del dolor por la irritación o inflamación de la mucosa en boca y faringe, por ejemplo, estomatitis, aftas, lesiones después de amigdalectomía.
- Anestesia tópica en determinados procedimientos médicos, antes de la introducción de instrumentos y catéteres en las vías respiratorias y digestivas, por ejemplo, esofagoscopia, laringoscopia, broncoscopia.

4.2 Posología y forma de administración

Al igual que con otros anestésicos locales, la seguridad y la eficacia de lidocaína dependen de la utilización de la dosis adecuada, la técnica correcta, la precaución apropiada y la velocidad de la intervención en casos críticos.

La información sobre dosificación que se recoge a continuación debe considerarse orientativa. La experiencia del facultativo y el conocimiento del estado físico del paciente son importantes para calcular la dosis adecuada.

Posología

Adultos

Consideraciones generales

- Cuando se utilice Lidocaína Lainco concomitantemente con otros productos que contengan lidocaína, deberá tenerse en cuenta la dosis total aportada por todas las formulaciones.
- El grado de absorción a partir de las mucosas es variable, pero especialmente elevado a partir del árbol bronquial.

- El grado de absorción sistémica depende de si la lidocaína es ingerida o escupida. Por lo tanto, es importante no tragar para evitar una absorción innecesaria (solo puede tragarse en el caso de procedimientos con introducción de catéteres o instrumentos).

Tratamiento sintomático, de corta duración, del dolor por la irritación o inflamación de la mucosa en boca y faringe: estomatitis, aftas, lesiones después de amigdalectomía

- La dosis debe ajustarse en función del peso corporal y la condición física del paciente.
- La dosis recomendada es de 5-10 ml de solución (100-200 mg de lidocaína hidrocloreto) en cada administración.
- No exceder 4,5 mg/kg de peso corporal (0,23 ml/kg de peso corporal) por dosis; la dosis máxima es de 15 ml de solución (300 mg de lidocaína hidrocloreto) en cada administración.
- El intervalo de dosificación es de al menos 3 horas entre dosis.
- No se debe administrar más de 6 dosis en 24 horas.
- La dosis total de lidocaína hidrocloreto en 24 horas no debe exceder de 1200 mg (60 ml de solución).
- Enjuagar la boca o la parte posterior de la faringe con la solución y posteriormente escupir (ver en esta sección Forma de administración).

Anestesia tópica antes de la introducción de instrumentos y catéteres en las vías respiratorias o digestivas superiores: esofagoscopia, laringoscopia, broncoscopia

- La dosis debe ajustarse en función del peso corporal y la condición física del paciente.
- La dosis recomendada es de 10-15 ml de solución (200-300 mg de lidocaína hidrocloreto).
- No exceder 4,5 mg/kg de peso corporal (0,23 ml/kg de peso corporal) por dosis; la dosis máxima es de 15 ml de solución (300 mg de lidocaína hidrocloreto).
- Cuando se combina con otros productos que contienen lidocaína (por ejemplo, para broncoscopia), la dosis total de lidocaína no debe superar los 400 mg.
- Hacer gárgaras con la solución y posteriormente puede tragarse (ver Forma de administración).

Tras la aplicación de lidocaína hidrocloreto, la anestesia local se consigue en 5 minutos. La duración de la anestesia es de aproximadamente 20 - 30 minutos.

Población pediátrica

Este medicamento no se debe utilizar en niños y adolescentes menores de 18 años, por motivos de seguridad y eficacia (ver sección 4.4).

Pacientes con insuficiencia renal

No se espera que la insuficiencia renal afecte significativamente a la farmacocinética de lidocaína cuando se utiliza para tratamientos de corta duración, y de acuerdo con las instrucciones de dosificación. Se recomienda precaución cuando se utilice lidocaína en pacientes con función renal gravemente alterada, ya que los metabolitos de lidocaína pueden acumularse durante el tratamiento a largo plazo (ver sección 4.4, 5.1 y 5.2).

Pacientes con insuficiencia hepática

Los anestésicos locales de tipo amida como la lidocaína deben utilizarse con precaución en pacientes con enfermedad hepática. Los pacientes con enfermedad hepática grave tienen mayor riesgo de desarrollar concentraciones plasmáticas tóxicas (ver sección 4.4).

Otras poblaciones especiales

Los pacientes debilitados, pacientes de edad avanzada, enfermos críticos y pacientes con sepsis deben recibir dosis reducidas acordes con su edad, peso corporal y condición física.

La lidocaína también debe utilizarse con precaución en pacientes con epilepsia, alteración de la conducción cardíaca, bradicardia y en shock grave (ver sección 4.4.).

Forma de administración

Uso bucofaríngeo.

Este medicamento es para uso tópico oral únicamente y no debe utilizarse para inyección.

Para evitar la absorción innecesaria, la solución debe escupirse cuando se requiera su acción analgésica en las vías respiratorias o digestivas superiores.

Debe evitarse la ingesta de alimentos durante al menos 60 minutos después de la aplicación oral o en la garganta cuando ya se haya pasado el efecto anestésico de adormecimiento. No deben ingerirse alimentos ni chicles mientras la zona de la boca o la garganta esté anestesiada.

La anestesia tópica en la boca puede dificultar la deglución y aumentar así el peligro de aspiración. El adormecimiento de la lengua o de la mucosa bucal puede aumentar el peligro de traumatismo por mordedura involuntaria.

Se incluye una jeringa dosificadora para administrar la dosis con precisión. Se debe indicar a los pacientes que utilicen esta jeringa para medir con precisión la dosis prescrita.

- Para analgesia oral (uso en la boca): enjuagar la boca con la solución y, posteriormente, escupir.
- Para analgesia oral (uso en la faringe): hacer gárgaras con la solución y, posteriormente, escupir.
- Para anestesia tópica antes de la introducción de instrumentos y catéteres en las vías respiratorias o digestivas superiores: hacer gárgaras con la solución y, posteriormente, se puede tragar.

4.3 Contraindicaciones

- Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes incluidos en sección 6.1.
- Hipersensibilidad a anestésicos locales de tipo amida.
- Trastornos graves del sistema de conducción cardíaca.
- Insuficiencia cardíaca congestiva aguda.
- Shock cardiogénico e hipovolémico.

4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo

Generales

- Este medicamento es para uso exclusivo tópico oral y no debe utilizarse para inyección.
- Debe indicarse a los pacientes que sigan estrictamente la dosis e intervalo de dosificación prescritos. Las dosis excesivas o la aplicación frecuente pueden dar lugar a niveles plasmáticos elevados y efectos adversos graves afectando al sistema nervioso central, pudiendo provocar convulsiones o afectando al corazón. Se deben utilizar dispositivos de medición para medir el volumen correcto, si procede, para garantizar la exactitud de la dosis (*ver sección 4.2*).
- El tratamiento de reacciones adversas graves puede requerir el uso de equipo de reanimación, oxígeno y, otros fármacos de reanimación (*ver sección 4.9*).
- La absorción en las superficies de la herida y las mucosas es mayor que sobre la piel sana, y especialmente alta en el árbol bronquial. Por lo tanto, dichas aplicaciones pueden dar lugar a concentraciones plasmáticas excesivas o en rápido aumento, con un mayor riesgo de síntomas tóxicos en sistema nervioso, como convulsiones o afectando al corazón.
- Se debe utilizar la dosis más baja que produzca una anestesia eficaz para evitar niveles plasmáticos elevados y efectos adversos graves. La tolerancia a niveles sanguíneos elevados varía según el estado del paciente.

- No se debe utilizar este medicamento en niños y adolescentes menores de 18 años, ya que podrían producirse efectos adversos muy graves.
- La lidocaína debe usarse con precaución en pacientes con sepsis y/o mucosa dañada en el área de aplicación, ya que en tales condiciones existe la posibilidad de una rápida absorción sistémica. En pacientes bajo anestesia general que están paralizados, pueden producirse concentraciones plasmáticas más altas que en pacientes que respiran espontáneamente. Los pacientes no paralizados tienen más probabilidades de tragar una gran proporción de la dosis, que luego sufre un considerable metabolismo hepático de primer paso después de la absorción intestinal.
- La anestesia tópica en boca o garganta, puede dificultar la deglución y aumentar el peligro de aspiración. Debe evitarse la ingesta de alimentos durante al menos 60 minutos después de la aplicación oral o en la garganta, cuando haya pasado el efecto anestésico de adormecimiento. El adormecimiento de la lengua o de la mucosa bucal puede aumentar el peligro de traumatismo por mordedura involuntaria, se produce además una depresión transitoria del reflejo deglutorio con el consiguiente riesgo de aspiración. No deben ingerirse alimentos ni chicles mientras la zona de la boca o la garganta esté anestesiada.
- Evite el contacto con los ojos.

Relacionados con efectos adversos

- Metahemoglobinemia: Se ha notificado casos de metahemoglobinemia con anestésicos locales; la metahemoglobinemia clínicamente significativa requiere tratamiento inmediato junto con la interrupción del anestésico y otros agentes oxidantes. La aparición puede ser inmediata o retardada (horas) tras la exposición al anestésico. Pacientes con deficiencia de glucosa-6-fosfato deshidrogenasa, metahemoglobinemia congénita o idiopática, compromiso cardíaco o pulmonar, exposición a agentes oxidantes o sus metabolitos, o lactantes tienen mayor riesgo.
- Hipertermia maligna familiar: Muchos fármacos utilizados durante la realización de la anestesia se consideran agentes desencadenantes potenciales de hipertermia maligna familiar. Se ha demostrado que el uso de anestésicos locales amídicos en pacientes con hipertermia maligna es seguro. Sin embargo, no hay garantías de que el bloqueo neural evite el desarrollo de hipertermia maligna durante la cirugía. También es difícil predecir la necesidad de anestesia general suplementaria. Por lo tanto, debe disponerse de un protocolo estándar para el tratamiento de la hipertermia maligna.

Relacionados con patologías específicas

Hematológicas

- La lidocaína podría desencadenar una crisis aguda de porfiria. Sólo debe prescribirse en pacientes con porfiria aguda por indicación urgente, cuando puedan ser estrechamente monitorizados. Deben tomarse las precauciones adecuadas en todos los pacientes porfíricos.

Cardiovasculares

- La lidocaína debe utilizarse con precaución en pacientes con bradicardia o deterioro de la función cardiovascular, ya que pueden ser menos capaces de compensar los cambios funcionales asociados con la prolongación de la conducción A-V producida por los anestésicos locales de tipo amida.
- Deben controlarse cuidadosamente los pacientes tratados con fármacos antiarrítmicos de clase III (p. ej., amiodarona). Debe considerarse la necesidad de llevar a cabo un control mediante ECG, ya que los efectos sobre el corazón pueden ser aditivos. El uso en pacientes con síndrome de Brugada puede aumentar el riesgo de taquicardia ventricular potencialmente mortal y muerte súbita cardíaca, por lo que Lidocaína Lainco está contraindicada en estos pacientes.

Neurológicas

- Epilepsia: El riesgo de efectos secundarios sobre el sistema nervioso central cuando se utiliza lidocaína en pacientes con epilepsia es muy bajo, siempre que se sigan las recomendaciones de dosis (*ver sección 4.2.*).
- Locomoción y Coordinación: Las formulaciones tópicas de lidocaína generalmente resultan en concentraciones plasmáticas bajas debido a un bajo grado de absorción sistémica. Sin embargo, dependiendo de la dosis, los anestésicos locales pueden tener un efecto muy leve sobre la función mental y la coordinación, incluso en ausencia de toxicidad manifiesta en el SNC, y pueden alterar temporalmente la locomoción y el estado de alerta.

Insuficiencia renal

- La lidocaína se metaboliza principalmente en el hígado. Sólo una pequeña fracción (2%) de lidocaína se excreta sin cambios en la orina. La farmacocinética de lidocaína y de su principal metabolito no se alteró significativamente en pacientes en hemodiálisis (n=4) que recibieron una dosis intravenosa de lidocaína. Por lo tanto, no se espera que la insuficiencia renal afecte significativamente a la farmacocinética de lidocaína cuando se utiliza para tratamientos de corta duración y de acuerdo con las instrucciones de dosificación. Se recomienda precaución cuando se utilice lidocaína en pacientes con función renal gravemente alterada, ya que los metabolitos de lidocaína pueden acumularse durante el tratamiento a largo plazo (*ver sección 4.2.*).

Insuficiencia hepática

- Debido a que los anestésicos locales de tipo amida como la lidocaína son metabolizados por el hígado, estos fármacos, especialmente las dosis repetidas, deben utilizarse con precaución en pacientes con enfermedad hepática. Los pacientes con enfermedad hepática grave, debido a su incapacidad para metabolizar normalmente los anestésicos locales, tienen mayor riesgo de desarrollar concentraciones plasmáticas tóxicas (*ver sección 4.2.*).

Déficit de colinesterasa

- Debe usarse con precaución en pacientes con déficit de colinesterasa, ya que estos pacientes presentan un mayor riesgo de alcanzar niveles plasmáticos tóxicos de lidocaína.

Otras poblaciones especiales

- Los pacientes debilitados, pacientes de edad avanzada, enfermos críticos y pacientes con sepsis deben recibir dosis reducidas acordes con su edad, peso y condición física, ya que pueden ser más sensibles a los efectos sistémicos debidos al aumento de los niveles sanguíneos de lidocaína tras dosis repetidas.

Población pediátrica

Este medicamento no se debe utilizar en niños y adolescentes menores de 18 años, por motivos de seguridad y eficacia.

- Se han notificado casos postcomercialización de convulsiones, parada cardiopulmonar y muerte en pacientes menores de 3 años con el uso de lidocaína debido a ingestión o sobredosis accidental.
- Se han producido múltiples casos de convulsiones (incluso mortales) en pacientes pediátricos que utilizaron lidocaína para las molestias orales, incluido el uso para el dolor de la dentición y la estomatitis.

- En lactantes y niños, se han notificado convulsiones (algunas mortales) tras la ingestión de lidocaína tópica a concentraciones séricas dentro del intervalo terapéutico de 1 a 5 mcg/ml: otros han notificado efectos tóxicos con dosis excesivas o aplicación frecuente de solución oral tópica de lidocaína que dieron lugar a concentraciones plasmáticas elevadas. Se han producido múltiples casos de convulsiones, incluso mortales, en pacientes pediátricos que utilizaron lidocaína para las molestias orales (p. ej., dolor de la dentición, gingivostomatitis herpética). **La solución oral de lidocaína no está aprobada para el tratamiento del dolor o las molestias de la dentición**; se desaconseja encarecidamente su uso fuera de indicación y debe evitarse. Los datos toxicológicos sugieren que en lactantes y niños menores de 6 años, la ingestión de tan sólo 5 ml de lidocaína puede producir toxicidad grave y debe buscarse atención médica urgente.

Advertencia sobre excipientes

- Puede provocar reacciones alérgicas (posiblemente retardadas) porque contiene parahidroxibenzoato sódico de metilo (E-219) y parahidroxibenzoato sódico de propilo (E-217).
- Este medicamento contiene 1,12 mg de alcohol (etanol) en cada ml de solución. Puede causar sensación de ardor en piel lesionada. Si se ingiriese, una dosis de 15 ml administrada a un adulto con un peso de 70 kg sería igual a la exposición a 0,239 mg/kg de etanol, que podría producir un aumento en la concentración de alcohol en sangre de aproximadamente 0,04 mg/100 ml.

En recién nacidos (bebés prematuros y recién nacidos a término), las concentraciones elevadas de etanol pueden causar reacciones locales graves y toxicidad sistémica debido a la absorción significativa a través de la piel inmadura (especialmente en caso de oclusión).

- Este medicamento contiene fragancias con eugenol. Eugenol puede provocar reacciones alérgicas.
- Este medicamento contiene menos de 1 mmol de sodio (23 mg) por cada 15 ml de medicamento; esto es, esencialmente “exento de sodio”.

4.5 Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

Cuando la lidocaína se utiliza por vía tópica, las concentraciones plasmáticas son importantes por razones de seguridad (*ver sección 4.4 y sección 4.8*). Sin embargo, con la baja exposición sistémica y la corta duración de la aplicación tópica, no se espera que las interacciones metabólicas fármaco-fármaco mencionadas a continuación sean de importancia clínica cuando se utiliza Lidocaína Lainco de acuerdo con las recomendaciones posológicas.

Interacciones farmacodinámicas

Anestésicos locales y agentes estructuralmente relacionados con los anestésicos locales de tipo amida

La lidocaína debe utilizarse con precaución en pacientes que reciben otros anestésicos locales o agentes estructuralmente relacionados con los anestésicos locales de tipo amida (por ejemplo, antiarrítmicos como la mexiletina), ya que los efectos tóxicos son aditivos.

Fármacos antiarrítmicos

Fármacos antiarrítmicos de clase I

Los fármacos antiarrítmicos de clase I (como la mexiletina) deben utilizarse con precaución, ya que los efectos tóxicos son aditivos y potencialmente sinérgicos.

Fármacos antiarrítmicos de clase III

Se recomienda precaución al utilizar fármacos antiarrítmicos de Clase III concomitantemente con lidocaína debido a las potenciales interacciones farmacodinámicas y/o farmacocinéticas con lidocaína. Un estudio de interacción farmacológica ha demostrado que la concentración plasmática de lidocaína puede aumentar tras la administración de una dosis terapéutica de lidocaína intravenosa a pacientes tratados con amiodarona (n=6). Los informes de casos han descrito toxicidad en pacientes tratados concomitantemente con lidocaína y amiodarona. Los pacientes tratados con fármacos antiarrítmicos de Clase III (por ejemplo, amiodarona) deben mantenerse bajo estrecha vigilancia y debe considerarse la monitorización del ECG, ya que los efectos cardíacos de estos fármacos y de la lidocaína pueden ser aditivos.

Interacciones farmacocinéticas

Inhibidores potentes de CYP1A2 y CYP3A4

Los citocromos CYP1A2 y CYP3A4 están implicados en la formación del metabolito farmacológicamente activo de la lidocaína MEGX.

- **Fluvoxamina:** Los inhibidores fuertes del CYP1A2, como la fluvoxamina, administrados durante la administración prolongada de lidocaína en zonas con un alto grado de absorción sistémica (por ejemplo, mucosas) pueden causar una interacción metabólica que conduzca a un aumento de la concentración plasmática de lidocaína. El aclaramiento plasmático de una dosis intravenosa única de lidocaína se redujo entre un 41 y un 60% durante la coadministración de fluvoxamina, un inhibidor selectivo y potente del CYP1A2, a voluntarios sanos.
- **Eritromicina e itraconazol:** Se ha demostrado que la eritromicina y el itraconazol, que son inhibidores potentes del CYP3A4, reducen el aclaramiento de lidocaína entre un 9 y un 18%, tras una dosis intravenosa única de lidocaína a voluntarios sanos.

Durante la coadministración combinada con fluvoxamina y eritromicina, el aclaramiento plasmático de lidocaína se redujo en un 53%.

β-bloqueantes y cimetidina

Tras una dosis intravenosa única de lidocaína, administrada a voluntarios sanos, se ha descrito que el aclaramiento de lidocaína se reduce hasta un 47% cuando se coadministra con propanolol y hasta un 30% cuando se coadministra con cimetidina. La reducción del aclaramiento de lidocaína cuando se coadministra con estos fármacos se debe probablemente a la reducción del flujo sanguíneo hepático y/o a la inhibición de las enzimas microsomales hepáticas. El potencial de interacciones clínicamente significativas con estos fármacos debe tenerse en cuenta durante el tratamiento a largo plazo con dosis altas de lidocaína.

Interacciones entre medicamentos y alimentos

No se han establecido interacciones de la lidocaína con los alimentos.

Interacciones medicamento-hierbas

No se han establecido interacciones de la lidocaína con productos herbales.

Interacciones medicamento-pruebas de laboratorio

No se han establecido interacciones de la lidocaína con pruebas de laboratorio.

4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia

Fertilidad

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

Embarazo

No existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas sobre el efecto de la lidocaína en el desarrollo del feto, por lo que no se recomienda su uso durante el embarazo, a menos que, según criterio médico, se considere que los posibles beneficios de su uso superan los riesgos potenciales para la madre y el feto.

Hasta la fecha no se han notificado alteraciones específicas del proceso reproductivo, por ejemplo, no se ha observado un aumento de la incidencia de malformaciones. Sin embargo, debe tenerse cuidado durante las primeras etapas del embarazo, cuando tiene lugar la máxima organogénesis.

Lactancia

La lidocaína y sus metabolitos se excretan en la leche materna. A dosis terapéuticas, las cantidades de lidocaína y sus metabolitos en la leche materna son pequeñas y generalmente no se espera que supongan un riesgo para el lactante.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

La capacidad para conducir o manejar máquinas puede verse negativamente afectada por las diferentes reacciones que se producen.

4.8 Reacciones adversas

Las reacciones adversas tras la administración de lidocaína son de naturaleza similar a las observadas con otros agentes anestésicos locales amídicos. Estos efectos adversos están, en general, relacionadas con la dosis y pueden ser el resultado de niveles plasmáticos elevados causados por sobredosificación o absorción rápida, o pueden ser el resultado de una hipersensibilidad, idiosincrasia o menor tolerancia por parte del paciente (*ver sección 4.2, sección 4.4, sección 4.9 y sección 5*).

La somnolencia tras la administración de lidocaína suele ser un signo temprano de un nivel plasmático elevado de lidocaína y puede producirse como consecuencia de una absorción rápida.

No puede realizarse una estimación precisa de la frecuencia de los efectos adversos debido a la falta de datos de estudios clínicos. Los efectos adversos graves suelen ser de naturaleza sistémica. En población pediátrica estos riesgos pueden estar incrementados.

Las reacciones se clasifican según su frecuencia: 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 ($<1/10.000$), frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Sistema de Clasificación de Órganos	Categoría de la frecuencia	Reacciones adversas
Trastornos del sistema inmunológico	Raras	Reacciones alérgicas que incluyen shock anafiláctico, broncoespasmo, disnea, depresión respiratoria, lesiones cutáneas, edema cutáneo, urticaria
Trastornos cardíacos	Raras	Bradicardia, hipertensión, arritmias, shock (colapso cardiovascular), asistolia debida a irritación espinal o cortical y/o depresión miocárdica

Sistema de Clasificación de Órganos	Categoría de la frecuencia	Reacciones adversas
Trastornos oculares	Frecuencia no conocida	Midriasis, visión borrosa, diplopía
Trastornos gastrointestinales	Raros	Náuseas, vómitos
Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración	Muy raros	Irritación local
Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo	Frecuencia no conocida	Espasmos musculares (incluyendo laringoespasma), temblor, astenia
Trastornos del sistema nervioso	Muy raros	Convulsiones, pérdida de consciencia, desorientación, trastorno del habla, mareos, desasosiego, parestesia circunoral, aturdimiento, aprensión, euforia, confusión, mareos, somnolencia, hiperacusia, acúfenos, visión borrosa, vómitos, sensaciones de calor, frío o entumecimiento, sacudidas, temblores, convulsiones, inconsciencia, depresión respiratoria y parada
Trastornos del oído y del laberinto	Frecuencia no conocida	Tinnitus
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	Frecuencia no conocida	Broncoespasmo, disnea, depresión respiratoria
Trastornos de la sangre y del sistema linfático	Frecuencia no conocida	Metahemoglobinemia
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	Frecuencia no conocida	Urticaria

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 Español de Farmacovigilancia de Medicamentos de Uso Humano: <https://www.notificaram.es>

4.9 Sobredosis

En dosis normales y en condiciones normales de administración, es poco probable que ocurra una sobredosis con un medicamento para uso local solamente.

Sin embargo, en caso de uso anormal (dosis mucho más altas, lesiones de las membranas mucosas), puede darse una sobredosis. Esta se manifiesta inicialmente por anestesia excesiva del tracto respiratorio superior y digestivo. Se debe tener precaución al usar el producto en combinación con anestésicos inyectables locales, ya que el riesgo de toxicidad del SNC y la toxicidad cardiovascular pueden ocurrir con altos niveles plasmáticos de lidocaína debido a una dosis excesiva o rápida absorción (*ver sección 4.4 y sección 4.8*).

La toxicidad sistémica aguda de los anestésicos locales está generalmente relacionada con los altos niveles plasmáticos encontrados durante el uso terapéutico de los anestésicos locales y se origina principalmente en los sistemas nervioso central y cardiovascular (*ver sección 4.4 y sección 4.8*). Debe tenerse en cuenta que pueden producirse interacciones farmacodinámicas clínicamente relevantes con lidocaína y otros

anestésicos locales o fármacos estructuralmente relacionados, y con fármacos antiarrítmicos de Clase I y Clase III debido a efectos aditivos (*ver sección 4.5*).

Síntomas

Las reacciones tóxicas se manifiestan, principalmente, en el SNC y el sistema cardiovascular.

La toxicidad del SNC es un proceso de varias fases con síntomas que aumentan en función de su nivel de gravedad. La alta concentración plasmática puede causar estimulación del SNC (incluyendo convulsiones) seguida de depresión del SNC (incluyendo paro respiratorio). Los primeros síntomas son parestesia perioral, entumecimiento de la lengua, somnolencia, pérdida de audición y acúfenos. Los trastornos de la visión y el temblor muscular se agravan y, en general, preceden a los ataques epilépticos. Pueden seguir pérdida de la consciencia y convulsión tónicoclónica y pueden durar desde algunos segundos hasta varios minutos. Se producen hipoxia e hipercapnia debido a la actividad muscular superior en combinación con el trastorno de la respiración normal, inmediatamente después de ataques epilépticos. En casos graves puede producirse también parada respiratoria. Una acidosis aumenta la toxicidad sistémica de los anestésicos locales. Después de redistribuir el anestésico local desde el SNC y el metabolismo y excreción posteriores, se produce la recuperación. Ésta puede producirse rápidamente si no se han utilizado grandes cantidades de lidocaína.

La toxicidad cardiovascular solo se produce como resultado de altas concentraciones sistémicas. Puede producirse hipotonía grave, bradicardia, arritmia y parada cardíaca. La toxicidad cardiovascular suele ir precedida de signos de toxicidad del SNC, excepto en pacientes con anestesia general o con sedación profunda por la administración de fármacos tales como benzodiazepinas o barbitúricos.

Medidas de urgencia

Los síntomas neurológicos graves (convulsiones, depresión del SNC) deben ser tratados de forma sintomática mediante soporte respiratorio, resucitación cardiopulmonar inmediata y administración de fármacos anticonvulsivantes. Si se produjese colapso cardiocirculatorio, debe instaurarse resucitación cardiopulmonar inmediata. La oxigenación óptima, la ventilación y el soporte circulatorio, así como el tratamiento de la acidosis son de vital importancia.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Anestésicos locales, amidas. Lidocaína.

Código ATC: N01BB02

Lidocaína es un anestésico local del tipo amida. Inhibe la función de las estructuras excitables, como las fibras nerviosas sensoriales, motoras y autónomas. La lidocaína estabiliza la membrana neuronal mediante la inhibición reversible de los flujos iónicos necesarios para el inicio y la conducción de los impulsos, ejerciendo así una acción anestésica local. Se cree que los anestésicos locales del tipo amida actúan dentro de los canales de sodio de la membrana nerviosa. Después de la sensación de dolor se reduce en este orden la sensibilidad al frío o al calor, al contacto y la presión.

Los anestésicos locales pueden tener un efecto similar en las membranas excitables del cerebro y del corazón. Si rápidamente llegan cantidades excesivas de principio activo a la circulación sistémica, se producen síntomas de intoxicación, principalmente en el SNC y el sistema cardiovascular.

Adicionalmente, presenta un ligero efecto antihistamínico y parasimpaticolítico. En contraste con la mayoría de los otros anestésicos locales, lidocaína no presenta efecto vasodilatador.

Las reacciones de toxicidad del SNC (*ver sección 4.9.*) generalmente preceden a las del sistema cardiovascular, ya que las primeras aparecen con concentraciones plasmáticas más bajas. Los efectos directos de los anestésicos locales en el corazón pueden ser, entre otros, conducción más lenta, inotropía negativa y hasta parada cardíaca.

5.2 Propiedades farmacocinéticas

Absorción

La tasa y el grado de absorción dependen de la concentración y de la dosis total administrada, del lugar específico de aplicación y de la duración de la exposición. En general, la tasa de absorción de los agentes anestésicos locales es alta, tras la aplicación tópica en las superficies de las heridas y las membranas mucosas, y se produce más rápidamente después de la administración intratraqueal y bronquial.

La lidocaína también se absorbe bien en el tracto gastrointestinal, aunque está sujeta a biotransformación en el hígado. En 17 voluntarios varones sanos, tras la ingestión de 15 ml (300 mg de lidocaína hidrocloreto) de un medicamento similar a Lidocaína Lainco en un régimen de dosis repetidas, la concentración plasmática máxima media de lidocaína fue de 0,5 µg/ml detrás la administración de la primera dosis y de 0,8 µg/ml tras la administración de la última dosis. En cambio, cuando la dosis se escupió, la concentración máxima media fue de 0,08 µg/ml y las concentraciones máximas individuales no superaron los 0,3 µg/ml. Las concentraciones de lidocaína y sus metabolitos fueron inferiores a 0,05 µg/ml 12 horas después de la última dosis.

Los efectos adversos se hacen cada vez más evidentes con el aumento de los niveles plasmáticos venosos por encima de 6,0 µg de base libre por ml.

Distribución

La lidocaína tiene un aclaramiento plasmático total de 0,95 L/min y un volumen de distribución en estado estacionario de 91 L.

La lidocaína atraviesa fácilmente la placenta alcanzándose el equilibrio con respecto al fármaco libre (no unido). Debido a que el grado de unión a proteínas plasmáticas en el feto es menor que en la madre, la concentración plasmática total será mayor en la madre, pero la concentración de fármaco libre será la misma en la madre y el feto.

La unión de lidocaína a proteínas plasmáticas depende de la concentración del fármaco, de manera que la fracción unida disminuye al aumentar la concentración. A concentraciones de 1 a 4 µg de base libre/ml, el 60 a 80% de lidocaína está unida a las proteínas plasmáticas. Los anestésicos locales de tipo amida se unen principalmente a la alfa-1-glicoproteína ácida, pero también a la albúmina.

Lidocaína atraviesa la barrera hematoencefálica y la barrera placentaria, probablemente, mediante difusión pasiva.

Biotransformación

Tras la absorción, lidocaína se metaboliza rápidamente y extensamente ((90-95% de la dosis) en el hígado por medio de las monooxigenasas CYP1A2 y CYP3A4. La mayor parte se metaboliza primero en los metabolitos activos monoetilglicinexilidida (MEGX) y después en glicinexilidida (GX) y 2,6-dimetilanilina. La lidocaína tiene un elevado índice de extracción hepática.

Los efectos farmacológicos / toxicológicos de los metabolitos son similares a los de la lidocaína, pero son más débiles. La glicinexilidida tiene una vida media más larga (10 horas aprox.) que la lidocaína y puede acumularse durante un uso prolongado.

Eliminación

La eliminación de lidocaína se debe casi en su totalidad al metabolismo hepático, y depende tanto del flujo sanguíneo hepático como de la actividad de las enzimas metabolizadoras.

Los metabolitos y el fármaco inalterado son excretados por los riñones. Sólo el 2% de la lidocaína se excreta sin cambios en orina y hasta un 70% aparece en la orina como 4-hidroxi-2,6-dimetilanilina.

La lidocaína tiene una semivida de eliminación de 1,6 h y una relación de extracción hepática estimada de 0,65.

La semivida de eliminación en neonatos (3,2 h) es aproximadamente dos veces más prolongada que en adultos.

Factores como la acidosis y el uso de sustancias que estimulan o suprimen el SNC afectan los niveles de lidocaína en el SNC en forma de efectos sistémicos notorios.

Pacientes con insuficiencia renal

La disfunción renal no afecta a la cinética de la lidocaína pero puede aumentar la acumulación de metabolitos.

Pacientes con insuficiencia hepática

La vida media puede extenderse dos o más veces en pacientes con insuficiencia hepática, p. ej. en pacientes con alteración hepática crónica derivados del consumo de alcohol es de 4,5 a 6 h.

Pacientes con insuficiencia cardíaca

En pacientes con infarto de miocardio (con o sin insuficiencia cardíaca), se prolonga la semivida de la lidocaína y la monoetilglicinexilidida (MEGX); la semivida de (GX) también puede alargarse en pacientes con insuficiencia cardíaca secundaria a infarto de miocardio. La vida media de eliminación puede prolongarse a 4-10 (-12) h con insuficiencia cardíaca severa.

5.3 Datos preclínicos sobre seguridad

Toxicidad crónica

En experimentos con animales, se observaron efectos tóxicos en el Sistema Nervioso Central y el sistema cardiovascular tras la administración de altas dosis de lidocaína. Los estudios de toxicidad reproductiva no revelaron ningún efecto secundario relacionado con el fármaco, tampoco presentaron indicios de potencial mutagénico en las pruebas de mutagenicidad *in vitro* o *in vivo* con lidocaína. Debido al campo de aplicación y la duración de uso recomendada para este producto, no se han realizado estudios para investigar el potencial carcinogénico.

Potencial mutagénico y tumorigénico

Los estudios de genotoxicidad con lidocaína no mostraron indicios de un potencial mutagénico. El metabolito, 2,6-xilidina, ha mostrado en las pruebas de genotoxicidad débiles indicios de actividad. En los estudios de toxicidad preclínicos sobre la exposición crónica, el metabolito, 2,6-xilidina, ha demostrado ser potencialmente cancerígeno. Las evaluaciones de riesgo que comparan la exposición máxima en humanos al uso intermitente de lidocaína en comparación con la exposición en estudios preclínicos indican un gran margen de seguridad en el uso clínico.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1 Lista de excipientes

- Carmelosa sódica
- Sacarina sódica
- Parahidroxibenzoato sódico de metilo (E-219)
- Parahidroxibenzoato sódico de propilo (E-217)
- Aroma de cereza (contiene etanol, agua purificada, destilado de frambuesa, destilado de cereza, vainillina, benzaldehído, acetato de isoamilo, etil acetato, etil dodecanoato, decano 1,4-lactona, eugenol)
- Ácido cítrico monohidrato (para ajuste del pH)
- Hidróxido sódico (E-524) (para ajuste del pH)
- Agua purificada.

6.2 Incompatibilidades

No procede.

6.3 Periodo de validez

2 años.

Período de validez después de la primera apertura del envase: 6 meses.

6.4 Precauciones especiales de conservación

No requiere condiciones especiales de conservación.

6.5 Naturaleza y contenido del envase

Frascos polietileno alta densidad con cierre de rosca de polipropileno, con 30 ml, 60 ml, 125 ml y 250 ml de solución. Contiene una jeringa para uso oral y obturador.

Puede que solamente estén comercializados algunos tamaños de envases

6.6 Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

Ninguna especial.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

Lainco, S.A.
Avda. Bizet, 8-12
08191 Rubí (Barcelona)
España

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

91.345

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

Junio 2026

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Junio 2026

La información detallada de este medicamento está disponible en la página web de la Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS). <http://www.aemps.gob.es/>