Dirección: Cra. 53 N° 50-09
Guarne (Antioquia) COLOMBIA.
Teléfono: (574) 550 00 00
Fax: (574) 551 31 34

FICHA TÉCNICA: LIDOCAINA 2% CON EPINEFRINA
FTAL32-002

1 GENERALIDADES DEL PRODUCTO

Lidocaina 2% con Epinefrina
Soluciones Inyectables Anestésicas de Uso Odontológico

La Lidocaína 2% con Epinefrina en sus diferentes concentraciones y presentaciones son soluciones inyectables (parenterales de pequeño volumen) usadas como anestésico dental, indicadas para producir anestesia local, aplicadas por técnicas de infiltración o bloqueo nervioso. Estos productos deben ser utilizados por personal profesional, capacitado para tal fin.

1.1 Nombre Comercial y denominación común internacional:

Lidocaina 2% con Epinefrina E-50
Lidocaina 2% con Epinefrina E-80
Lidocaina 2% con Epinefrina E-100
Newcaina 2%® :Lidocaina 2% con Epinefrina 1:50.000
Newcaina 2%® :Lidocaina 2% con Epinefrina 1:80.000

Epinefrina: 1,2-Benzenediol, 4-[1-Hidroxi-2-(metilamino) etil]-, (R).
Lidocaina:Acetamida, 2-(Dietilamino)-N-(2,6-Dimetilfenil)-2-(Dietilamino)-2´6´-acetoxilidina.

1.2 Fórmula química estructural, molecular y/o empírica de los principios activos:

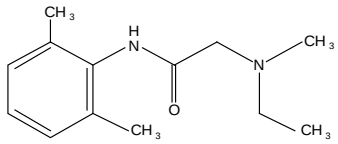
1.2.1 Lidocaina

Formula molecular: $C_{14}H_{22}N_2O$
Peso molecular: 234.34 g/mol
Designación IUPAC: Acetamida, 2-(Dietilamino)-N-(2,6-Dimetilfenil)-2-(Dietilamino)-2´6´-acetoxilidina.
Número CAS: 137-58-6

Formula estructural

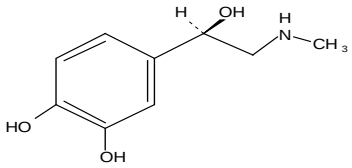
Dirección: Cra. 53 N° 50-09
Guarne (Antioquia) COLOMBIA.
Teléfono: (574) 550 00 00
Fax: (574) 551 31 34

FICHA TÉCNICA: LIDOCAINA 2% CON EPINEFRINA
FTAL32-002



1.2.2 Epinefrina
Formula molecular: $C_9H_{13}NO_3$
Peso molécular: 183.21 g/mol
Designación IUPAC: 1,2-Benzenediol, 4-[1-Hidroxi-2-(metilamino) etil]-, (R).
Número CAS: 51-43-4

Formula estructural:



2 INFORMACIÓN DE COMPOSICIÓN

Cada Carpul dental de 1.8mL contiene:

Lidocaina con Epinefrina 1:50.000(Lidocaina 2% E-50)

- Lidocaína Base : 0.036g
- Epinefrina Base: 0.000036g
- Excipientes c.s.p. 1.8mL

Lidocaina con Epinefrina 1:80.0000(Lidociana 2% E-80)

- Lidocaína Base : 0.036g
- Epinefrina Base: 0.0000225g
- Excipientes c.s.p. 1.8mL

Dirección: Cra. 53 N° 50-09
Guarne (Antioquia) COLOMBIA.
Teléfono: (574) 550 00 00
Fax: (574) 551 31 34

Lidocaina con Epinefrina 1:100.000(Lidocaina 2% E-100)

- LidocaínaClorhidrato : 0.036g
- Epinefrina Base: 0.000018g
- Excipientes c.s.p. 1.8mL

Newcaina 2%®: Lidocaina 2% con Epinefrina 1:50.000

- LidocaínaClorhidrato : 0.036g
- Epinefrina Base: 0.000036g
- Excipientes c.s.p. 1.8mL

Newcaina 2%®: Lidocaina 2% con Epinefrina 1:80.000

- LidocaínaClorhidrato : 0.036g
- Epinefrina Base: 0.0000225g
- Excipientes c.s.p. 1.8mL

3 PROPIEDADES DEL PRODUCTO

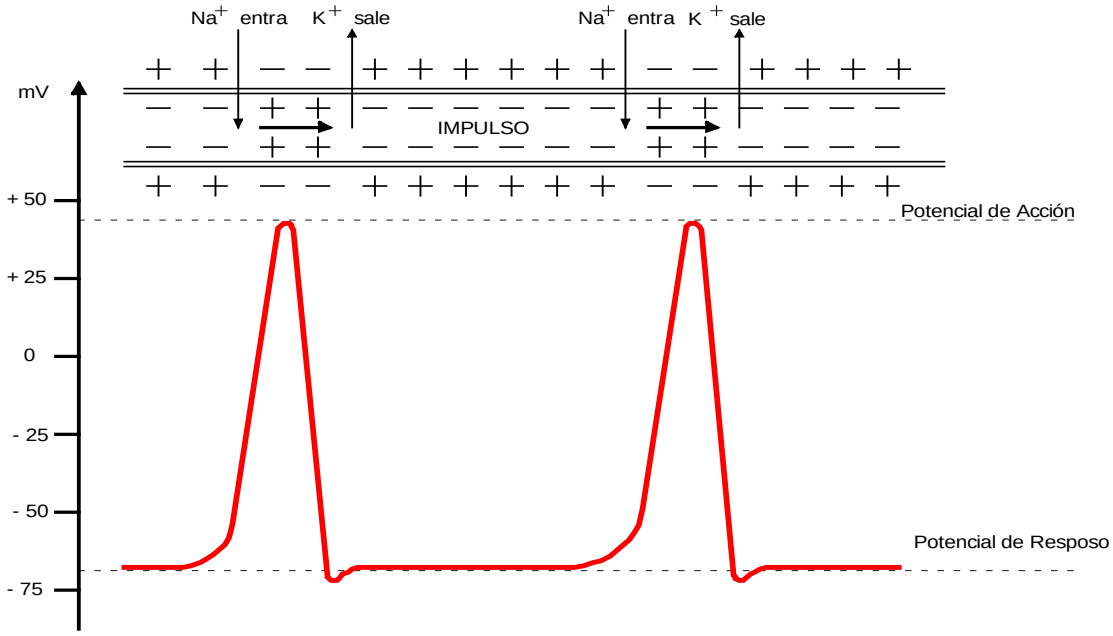
Para ejercer su acción anestésica, la lidocaína estabiliza la membrana de la neurona, por inhibición del flujo iónico requerido para la iniciación y conducción del impulso nervioso (figura N° 1).La Epinefrina causa vasoconstricción local, lo que limita la absorción del anestésico, prolongando su acción y disminuyendo su toxicidad sistémica.

La Lidocaína suministra anestesia sumamente rápida, profunda y extensa. Permite trabajar en los procedimientos más delicados como la preparación de muñones en dientes vivos, pulpectomias y el tratamiento quirúrgico de la periodontitis.

La actividad de la Lidocaína es mucho más que el doble de la Procaína, siendo la intensidad de la anestesia y el área anestesiada dos veces mayor que la de la Procaína, en igual concentración. Debido a su estructura química amino amida la cual la hace tan diferente de la estructura de la Procaína y de los anestésicos locales, la lidocaína puede ser el anestésico de elección de las personas que son

sensibles a la Procaína. La lidocaína es completamente atoxica y la reacciones adversas son raras cuando la lidocaína es usada como anestésico local y es administrada correctamente.

Figura N° 1 Variaciones de polaridad y potencial en la conducción de los Impulsos de una fibra nerviosa



METABOLISMO

Aproximadamente el 90% de la lidocaína es metabolizada en el hígado y es eliminada en forma de varios metabolitos atreves del riñón. Sólo 10% es excretado sin alteración.

La Epinefrina se inactiva rápidamente en el organismo. El hígado produce dos enzimas para la destrucción de la Epinefrina circulante.La acción del hígado es importante aunque no indispensable en el proceso de degradación de la lidocaína. La mayor parte se excreta en metabolitos por la orina.

Dirección: Cra. 53 N° 50-09
Guarne (Antioquia) COLOMBIA.
Teléfono: (574) 550 00 00
Fax: (574) 551 31 34

FICHA TÉCNICA: LIDOCAINA 2% CON EPINEFRINA
FTAL32-002

4 USO Y APLICACIONES

La Lidocaína 2% con Epinefrina es un anestésico local indicado en procedimientos dentales de infiltración o bloqueo nervioso. La adición de epinefrina retarda la reabsorción y alarga la acción anestésica de la lidocaína la cual debe ser más larga para ciertos procedimientos dentales.

4.1 Advertencias

Los equipos de reanimación deben estar disponibles inmediatamente cuando se administra anestésicos locales, a fin de proporcionar una buena aireación y ventilación en caso de posibles reacciones tóxicas.

Pequeñas dosis de anestésicos locales inyectadas por vía intravascular en la cabeza y en el cuello pueden producir reacciones adversas sistémicas similares a las observadas con inyecciones intravasculares accidentales de dosis más altas.

En pacientes con acidosis o hipoxia se puede incrementar el riesgo y severidad de las reacciones tóxicas. Dichas reacciones involucran el sistema nervioso central y cardiovascular. Los anestésicos locales deben administrasen con cuidado en pacientes con anemia, cardiopatias severas o insuficiencia circulatoria de cualquier tipo. El efecto de los anestésicos locales puede ser reducido si la inyección se realiza en un área inflamada o un absceso.

Las soluciones que contienen un vasoconstrictor, deben ser usadas prudentemente y en cantidades prescritas cuidadosamente. No debe aplicarse en sitios terminales del cuerpo porque la isquemia producida puede conducir a gangrena. En procedimientos dentales, un vasoconstrictor no debe ser inyectado repetidamente en el mismo sitio porque reduce el flujo sanguíneo e incrementa el consumo de oxigeno en los tejidos afectados, pudiendo causar anoxia del tejido, retardando la cicatrización del edema o necrosis en el sitio de la inyección.

4.2 Precauciones

Sensibilidad cruzada y/o problemas relacionados raramente puede ocurrir con otros anestésicos local tipo amida.

Embarazo: Estudios en animales no han mostrado efectos adversos en el feto. Puede causar constricción de la arteria uterina.

Los anestésicos locales de tipo amida son metabolizados por el hígado, por lo que el anestésico debe ser usado con precaución en pacientes con daño hepático.

4.3 Contraindicaciones

Se debe evitar su empleo en caso de isquemia regional, disfunsión hepática, enfermedad renal o hipersensibilidad a la Lidocaína.

La Lidocaína está contraindicada a todos aquellos pacientes con hipersensibilidad conocida a todos los anestésicos locales del tipo de las amidas, así como en el estado de shock o bloqueo cardíaco.

La Lidocaína no deberá aplicarse cuando existe inflamación en la zona donde se va infiltrar para obtener anestesia local. La administración intravenosa de la Lidocaína está contraindicada en pacientes con síndrome de Stokes-Adams o con grados severos de bloqueo cardiaco intraventricular, atrioventricular o sinuatrial.

El uso de soluciones comerciales de lidocaína que contienen sulfitos incrementa el riesgo de reacciones anafilácticas o broncoespasticas. En el hipertiroidismo; se produce estimulación cardiaca perjudicial en estos pacientes.Está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad al bisulfito

A excesivas dosis se producen altas concentraciones en plasma, depresión del sistema cardiovascular (hipotensión, latido lento o irregular, palidez inusual, transpiración incrementada y/o paro cardíaco); toxicidad del sistema nervioso central (visión doble o borrosa, confusión, convulsión, mareo o aturdimiento, sensación de calor, frío, escalofríos, ansiedad, excitación, nerviosismo o inquietud).

4.4 Reacciones Adversas

Rara vez se producen reacciones al anestésico Lidocaína 2% con Epinefrina si se utiliza como un anestésico local y se emplea correctamente en los procedimientos dentales.Si existen reacciones adversas, son similares en características a las observadas con otros anestésicos locales.

Las reacciones adversas son en general debido a niveles en plasma elevados por dosis excesiva, inyecciones rápidas o inyección intravascular inadvertida, o puede resultar de una hipersensibilidad, idiosincrasia o disminución de la tolerancia por parte del paciente. Usualmente no causa estimulación del S.N.C antes de una depresión del S.N.C.

Las reacciones a nivel del sistema nervioso central (SNC) son excitatorias y/o depresoras, y pueden ser caracterizadas por nerviosidad, mareo, visión borrosa y temblores, seguidos de malestar, convulsiones, inconsciencia y posiblemente paro respiratorio. Las reacciones a nivel cardiovascular son depresoras y se caracterizan por hipotensión, depresión miocárdica, bradicardia y posible paro cardíaco.

Las reacciones alérgicas son raras. Se caracterizan por lesiones cutáneas tardías, urticaria, edema y otras manifestaciones alérgicas. Asimismo, puede producir hormigueo y adormecimiento de labios y boca.

4.5 Tratamiento En Caso De Sobredosis

El tratamiento de los pacientes con manifestaciones tóxicas consiste en:

Acostar el paciente boca arriba, levantar las piernas 30°- 45° por encima del nivel horizontal, asegurar y mantener una oxigenación apropiada. Si la ventilación es inadecuada, ventilar al paciente, con oxígeno si es posible.

Si la frecuencia del pulso es baja (< 40) o no registrable, comenzar un masaje cardíaco externo. Si el paciente esta inconsciente y/o la ventilación es inadecuada después de haber tomado las medidas anteriormente mencionadas, proceder con el tratamiento de las convulsiones y aplicar ventilación mecánica.

Para convulsiones: El tratamiento de las convulsiones consiste en asegurar una oxigenación apropiada y detener las convulsiones. Si las convulsiones continúan a pesar de una ventilación adecuada, debe administrarse benzodiazepinas tales como diazepam (en 2.5 mg incrementados) o un barbitúrico de acción ultra corta tal como el tiopental sódico (en 50 a 100 mg incrementados) por vía intravenosa cada 2 o 3 minutos es recomendado, para detener las convulsiones. Los agentes, especialmente los barbitúricos pueden causar depresión circulatoria cuando son administrados intravenosamente. Según la situación clínica, la depresión

circulatoria puede ser tratada con soluciones i.v. y un vasopresor, si fuera necesario (por ejemplo, efedrina).

Este tratamiento puede también producir depresión respiratoria, se debe disponer de los medios para apoyar o controlar la ventilación mecánicamente.

El uso de agentes bloqueantesneuromusculares pueden ser también usados para disminuir las manifestaciones musculares de convulsiones persistentes. El uso de respiración artificial es obligatorio en el uso de estos agentes.

Para metahemoglobinemia: Si esta no responde a la administración de oxígeno, administrar Azul de Metileno (intravenoso, 1 a 2 mg por Kg. de peso corporal (mg/Kg.) de una solución al 1% sobre un período de unos 5 minutos) es recomendado.

Pueden ocurrir raramente reacciones alérgicas como lesiones cutáneas, urticaria, edema y sintomatología tipo anafilactoide.Estos síntomas deben ser manejados con terapia convencional.

4.6 Interacciones Con Drogas o Problemas Relacionados

La Lidocaína con antiarrítmicos puede producir efectos cardiacos aditivos, con anticonvulsivos del grupo de la hidantoina tiene efectos depresivos sobre el corazón y se metaboliza más rápidamente la Lidocaína.Con los bloqueadores β-adrenérgicos puede aumentar la toxicidad de la Lidocaína. El uso de cimetidina aumenta los niveles de Lidocaína en sangre.

Los bloqueantes neuromusculares pueden ver potenciado su efecto con el uso simultáneo con Lidocaína.

El uso de lidocaína puede interferir con ciertas de pruebas de laboratorio. La prueba con bentiromida se ve alterada al usar Lidocaína; los valores de la creatinin-fosfoquinasa (cpk) pueden aumentar con la administración intramuscular de la Lidocaína.

El uso de vasoconstrictoressimpaticomiméticos como la Epinefrina puede producir toxicidad aditiva. El riesgo de un efecto sistemático significativo resultante de la interacción entre algunos de los siguientes medicamentos y un vaso-constrictor

que contenga una solución de anestésico local depende de la dosis total (volumen y concentración) del vasoconstrictor administrado y de los factores que afectan el promedio de absorción del vasoconstrictor (lugar y vía de administración, y potencial de la administración intravascular).

La eficacia del agente vasoconstrictor puede ser disminuida por el uso de bloqueadores alfa adrenérgicos comoLabetalol, Fenoxibenzamina, Fentolamina, Prazosin, Tioxantenos, o vasodilatadores que actúan rápidamente, como los nitratos.

Pacientes que reciben Epinefrina, levonordefrina o norepinefrina; pero no fenilefrina, el bloqueo alfa adrenergico puede convertirse en una actividad beta adrenergica con riesgo de hipotensión y taquicardias severas.

Los vasoconstrictores pueden disminuir los efectos terapéuticos de los vasodilatadores, incluyendo los efectos de los nitratos contra la angina de pecho.

Los anestésicos hidrocarburados (cloroformo, ciclopropano, halotano o tricloroetileno y en mucho menor grado, euflurane, isoflurane o metoxiflurane), pueden sensibilizar el corazón para los efectos de una vasoconstricción simpaticomimetica; el uso asociado con un vasoconstrictor puede causar arritmia cardíaca.

Los antidepresivos triciclicos o maprotilene en combinación con lidocaína puede incrementar los efectos cardiovasculares del vasoconstrictor y como resultante producir arritmias, taquicardia, hipertensión grave o hiperpirexia.

Antihipertensivos o diuréticos usados como antihipertensivos: los efectos antihipertensivos pueden disminuir por los vasoconstrictores(se recomienda controlar la presión arterial).

4.7 Incompatibilidades Medicamentosas

La administración de soluciones de anestésico local que contienen epinefrina a pacientes en tratamiento con medicamentos que producen alteraciones en la presión sanguínea (ej. inhibidores de la monoaminooxidasa (IMAO), antidepresivos tricíclicos o fenotiazinas.), puede producir hipotensión o hipertensión prolongada.

La Lidocaína clorhidrato con amfotericina causa precipitación, y ocasionalmente (dependiendo del pH y el vehículo) es incompatible con ampicilina sódica.

El uso concomitante de vasopresores y de medicamentosoxitóxicos del tipo ergotamina puede causar hipertensión persistente o accidentes cerebrovasculares.

Con alimentos no se encuentra reportada ninguna incompatibilidad.

5 ASEGURAMIENTO DE CALIDAD DEL PRODUCTO

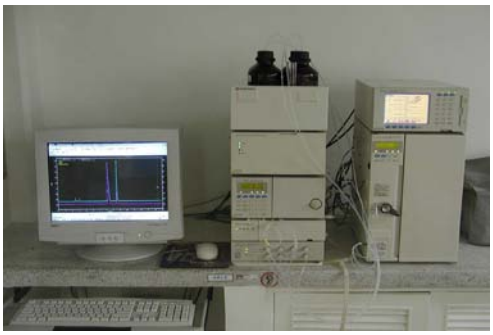
El producto Lidocaina 2% con Epinefrina se fabrica bajo los más estrictos controles técnicos y de calidad. Su proceso productivo se lleva a cabo en áreas especiales de manufactura que cuentan con controles ambientales,microbiológicos y operacionales realizados por personal capacitado y entrenado. Los insumos empleados son previamente verificados y aprobados de acuerdo a las exigencias de las farmacopeas vigentes. El proceso de control incluye el control de materiales de empaque y envase. Todas las materias primas son adquiridas a proveedores calificados.



El producto Lidocaina 2% con epinefrina en sus diferentes presentaciones cumple con los requisitos especificados en las Farmacopeas Vigentes de acuerdo a los requerimientos establecidos por las entidades reguladoras según aplique. Estas

especificaciones incluyen aspecto, característicasfísicas, contenido de principio activo y controles microbiológicos.Estos parámetros son verificados durante las diferentes etapas del proceso de fabricación con el uso de equipos de alta tecnología, procedimientos estandarizados, áreas especiales de análisis, personal profesional capacitado y entrenado.





6 INSTRUCCIONES DE USO

Lidocaína al 2% (20mg/ml; 36mg/1.8ml) con Epinefrina, en sus diferentes concentraciones y según criterio medico puede ser usada en:

Adultos: La dosis máxima para adultos sanos no debe exceder de 6.6 mg/kg. de peso corporal o 300 mg por intervención.

Dosis pediátrica: La dosis debe ser determinada individualmente por el profesional basado en el peso y la edad del paciente.

Para administración a pacientes pediátricos en concentraciones más bajas que las comercialmente existentes, diluir la concentración disponible con la cantidad de inyección de cloruro de sodio al 0.9% necesario para obtener la concentración final de la solución anestésica local.

La dosis del anestésico local depende de los siguientes aspectos: estado físico del paciente, el área de la cavidad oral a ser anestesiada, la vascularidad de los tejidos orales y la técnica de anestesia empleada.

Dirección: Cra. 53 N° 50-09
Guarne (Antioquia) COLOMBIA.
Teléfono: (574) 550 00 00
Fax: (574) 551 31 34

FICHA TÉCNICA: LIDOCAINA 2% CON EPINEFRINA
FTAL32-002

El menor volumen de la solución que resulte en anestesia efectiva local deberá ser administrada, observando en el paciente manifestaciones de alguna reacción adversa.

Soluciones con Epinefrina pueden ser usadas cuando se requerien mayores tiempos de acción de la Lidocaína en el sitio. Una reducción en la dosis de la Lidocaína o un incremento en los intervalos entre dosis, pueden ser necesarios en pacientes con disminución del flujo sanguíneo hepático o falla de la función hepática.

Se debe tener en cuenta:

Inyección en áreas infectadas:
La capacidad tampón de los tejidos normalmente causará estabilización de pH a nivel del tejido. Inyecciones en las áreas infectadas, algunas veces producen anestesia incompleta, porque el foco infeccioso produce ácidos residuales que bajan normalmente la capacidad tampón de los tejidos. Un pH ácido bajará la potencia anestesiante de una solución inyectada.

Variaciones anatómicas:
En algunos pacientes, la inyección puede fallar debido a una desviación en la posición del nervio, un hueso excepcionalmente grueso y compacto formará una barrera difusora y hará menos efectiva una inyección con la técnica de infiltración.

Inyección Intravenosa:
Si toda o parte de la solución ha sido inyectada intravascularmente, no habrá o se presentará poco efecto anestésico local respectivamente. Se pueden presentar efectos simpaticomiméticos indeseables (taquicardia, hipertensión) e incremento de la toxicidad propia del anestésico local.

Inyecciones muy Rápidas:
La presión excesiva durante la inyección puede causar irritación local y dolores postoperatorios. Una inyección muy rápida puede causar también necrosis en los tejidos del paladar, debido a la firmeza del ligamento con el hueso.

Desinfección de los cárpules.
Los cárpules no deben ser colocados en soluciones hechas con tabletas anticorrosivas o soluciones de sales de amonio cuaternario tal como cloruro de

benzalconio. Ciertos iones metálicos (como mercurio, zinc y cobre) son contenidos por soluciones desinfectantes y pueden causar inflamación después de la anestesia, por lo tanto los cárpules no se deben sumergir en éstas soluciones.

Para la desinfección química de la superficie del cárpul se recomienda alcohol isopropilico al 91% o alcohol etílico al 70% sin desnaturalizantes; las soluciones que contengan metales pesados no son recomendadas.

No se debe usar el producto si la solución está coloreada (de rosado o parduzco) o contiene un precipitado.

El anestésico Lidocaína con Epinefrina no debe someterse a un proceso de esterilización por autoclavado, debido a descomposición térmica de la epinefrina (termolábil).

Cualquier porción sobrante del cárpul debe ser desechada.

7 PRESENTACIONES COMERCIALES

El producto Lidocaína 2% con Epinefrina se comercializa en las siguientes presentaciones comerciales:

Envase Primario

Cárpul de Vidrio: Cartuchos cilíndricos de vidrio Tipo I (borosilicato).
Cárpul de Plástico: Cartuchos cilíndricos de polipropileno virgen.

Ambas presentaciones tienen los mismos tipos de pistón y de agrafe: Pistón de caucho natural y agrafe con diafragma, de aluminio y caucho natural.

Envase Secundario

Se tienen varias presentaciones de comercialización, en cuanto al envase secundario se refiere:

Blister en caja de cartón, por 50 cárpules.
Caja plástica por 50 cárpules.



8 CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO Y PRESERVACIÓN

El producto inyectable Lidocaína 2% con Epinefrinadebe ser almacenado en un lugar fresco y seco, protegido de la incidencia directa de luz y calor o fuentes luminosas intensas. Se recomienda almacenar entre 15 y 30,0 °C.

9 TIEMPO DE VIDA ÚTIL

De acuerdo a las pruebas de estabilidad, el producto tiene un tiempo de vida útil de dos (2) años a partir de la fecha de fabricación.