



PISACAÍNA

1%, 2%, 2% CON EPINEFRINA Y 5% PESADA
CLORHIDRATO DE LIDOCAÍNA, CON Y SIN EPINEFRINA, GLUCOSA ANHIDRA

COMPOSICIÓN:

PISACAÍNA 1%: Cada ml. contiene:
Clorhidrato de lidocaína..... 10 mg.
Vehículo c.b.p..... 1 ml.

PISACAÍNA 2%: Cada 100ml contiene:
Clorhidrato de lidocaína..... 2 g.
Vehículo c.b.p..... 100 ml.

PISACAÍNA 2% CON EPINEFRINA: Cada ml. contiene:
Clorhidrato de lidocaína..... 20 mg.
Epinefrina 1x200.000..... 0.005 mg.
Vehículo c.b.p..... 1 ml.

PISACAÍNA 5% PESADA: Cada ampolleta contiene:
Clorhidrato de lidocaína..... 100 mg.
Glucosa monohidratada..... 150 mg.
Vehículo c.b.p..... 2 ml.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Anestésico local o regional por infiltración y bloqueador arrítmico cardiaco por vía intravenosa.

1. Para producir anestesia local o regional por bloqueo nervioso, por infiltración con aguja vía subcutánea o mediante bloqueos caudales o epidurales.
2. PISACAÍNA al 5% PESADA es exclusiva para uso en bloqueo subaracnoideo.
3. Administrada vía intravenosa está específicamente indicada para el tratamiento agudo de arritmias ventriculares que puedan ocurrir durante la manifestación cardiaca, así como cirugía del miocardio durante o después de un infarto agudo del miocardio.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINÁMIA:

La lidocaína actúa de dos formas principales:

1. **Como anestésico local y regional:** La lidocaína estabiliza la membrana neuronal y previene la iniciación y la transmisión de los impulsos nerviosos, provocando así un efecto anestésico local. El inicio de su acción es casi inmediato y el bloqueo

puede durar desde una hora hasta hora y media. La lidocaína, debido a su estructura, no éster, no es destoxificada por las esterasas plasmáticas circulantes. El hígado es el principal sitio de biotransformación y tanto, la forma libre como la forma conjugada de la lidocaína son excretadas por la orina. La lidocaína por lo general no produce irritación o daño tisular posterior a su administración parenteral. La acción de la anestesia se prolonga y la absorción se retarda cuando contiene epinefrina que actúa como vasoconstrictor.

2. **Como antiarrítmico cardíaco:** La lidocaína tiene un efecto antiarrítmico incrementando el umbral de la estimulación eléctrica ventricular durante la diástole. A dosis terapéuticas no produce cambios en la contractilidad miocárdica, en la presión arterial sistémica o en el período refractario absoluto. Aproximadamente el 90% de la dosis administrada es metabolizada en el hígado, el 10% restante se elimina sin cambios a través de la orina. La epinefrina actúa como vasoconstrictor para lograr una absorción más lenta de la lidocaína y por tanto, prolonga su tiempo de acción. La epinefrina es inactivada rápidamente por captación de neuronas adrenérgicas, difusión y degradación enzimática en hígado y tejidos generales. La epinefrina atraviesa la placenta y entra a la circulación fetal.

CONTRAINDICACIONES:

Se deberá evitar su empleo en casos de isquemia regional o de hipersensibilidad a la lidocaína. La lidocaína está contraindicada en todos aquellos pacientes con hipersensibilidad conocida a los anestésicos locales del tipo de las amidas, así como en estado de shock o bloqueo cardíaco. La lidocaína no deberá aplicarse cuando exista inflamación en la zona donde se va a 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 cardíaco intraventricular, atrioventricular o sinoatrial. La lidocaína con epinefrina no deberá emplearse en áreas con compromiso vascular como orejas, dedos, pene, etc., ni en forma simultánea con agentes que aumenten la excitabilidad cardíaca. La fórmula con epinefrina nunca deberá ser administrada por vía intravenosa.

PRECAUCIONES GENERALES:

Clorhidrato de Lidocaína como anestésico local: La seguridad y eficacia de la lidocaína dependerán del uso de la dosis apropiada, de la técnica correcta de aplicación y de las precauciones que se tomen para tratar alguna emergencia que se pudiera presentar secundaria a la administración. Deberá usarse la mínima dosis que de cómo resultado una efectiva anestesia para así evitar efectos sistémicos indeseables. Dosis repetidas de lidocaína pueden causar un incremento de los niveles sanguíneos, debido a la acumulación del medicamento, o sus metabolitos o a una lenta degradación metabólica. La tolerancia varía con el estado del paciente, así que si éstos son ancianos, agudamente enfermos, debilitados o niños, deberá calcularse la dosis de acuerdo a su edad o a su estado físico. Siempre que se inyecte deberá hacerse una leve aspiración para evitar o reducir al menos la posibilidad de inyección intravascular, inadvertida, ya que si ésta sucediera podrían resultar varias reacciones adversas, así como falla del anestésico. La lidocaína deberá usarse con precaución en pacientes que se sepa son hipersensibles a otros medicamentos o a otros anestésicos locales. La anestesia por bloqueo caudal o epidural deberá usarse con extremo cuidado en pacientes con problemas neurológicos, con deformidades de la columna, septicémicos o hipertensos severos y en pacientes muy jóvenes. Cuando se está utilizando lidocaína hiperbárica, deberá vigilarse la posición del paciente en forma estrecha. La decisión de

usar o no un anestésico local en las siguientes condiciones dependerá exclusivamente de la apreciación del médico en cuanto a las ventajas o a los posibles riesgos:

- a) En bloqueo paracervical cuando hay factores que predisponen daño fetal o hay daño fetal presente (toxemia, prematurez, diabetes, acidosis, etc).
- b) Cuando la dosis recomendada excede la que indica un incremento en la incidencia de bradicardia fetal. La solución que contiene epinefrina no deberá emplearse en áreas con compromiso vascular, ni en forma simultánea con agentes que aumenten la excitabilidad del miocardio.

1. **Clorhidrato de lidocaína como antiarrítmico cardiaco:** Cuando se utilice lidocaína repetidamente en un paciente por vía intravenosa, deberá tenerse suma precaución si éste presenta algún daño hepático o renal, ya que dosis acumulativas de lidocaína podrían provocar toxicidad debido a que, como ya se dijo, la lidocaína se metaboliza principalmente en el hígado y parcialmente se excreta sin cambios en muy poca cantidad por el riñón. La lidocaína deberá ser usada con precaución en pacientes con hipovolemia. Es esencial un monitoreo constante con el electrocardiograma para la administración apropiada de la lidocaína por vía intravenosa. Si presentan datos de excesiva depresión de la conductividad cardiaca como la prolongación del intervalo P-R y del complejo Q-R-S, así como la aparición o la agravación de arritmias, deberá suspenderse de inmediato su administración. Es obligado tener siempre a la mano un equipo de emergencia y otros medicamentos necesarios para corregir los efectos adversos a nivel cardiorrespiratorio o del sistema nervioso central que pudieran presentarse. El uso de la lidocaína en infantes es muy limitado. En pacientes con bradicardias sinusales, la administración intravenosa de lidocaína para eliminación de focos ectópicos ventriculares sin una previa aceleración de la frecuencia cardiaca puede empeorar la arritmia ventricular.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

La lidocaína atraviesa la placenta. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos. Sin embargo, los estudios en ratas con dosis de hasta 6.6 veces la dosis máxima no han mostrado que la lidocaína produzca efectos adversos en el feto.

No se recomienda el empleo de lidocaína durante el primer trimestre del embarazo. No se han descrito problemas en madres lactantes.

REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS:

- ❖ **Clorhidrato de Lidocaína como anestésico local:** Pueden presentarse reacciones secundarias resultantes de altos niveles plasmáticos de lidocaína debidos a una rápida absorción, a una inyección intravascular inadvertida o a un exceso de dosis usada. Otras causas de esas reacciones son la hipersensibilidad al medicamento, idiosincrasia o disminución de la tolerancia. Las reacciones debidas a una sobredosis (altos niveles plasmáticos) son sistémicas e involucran al sistema nervioso central y al sistema cardiovascular. Las primeras se caracterizan por excitación y/o depresión, nerviosismo, vértigos, visión borrosa, temblor, convulsiones, pérdida de la conciencia y puede llegar al paro respiratorio. Las segundas, incluyen depresión del miocardio, hipotensión, bradicardia y hasta paro cardiaco. Las reacciones alérgicas se caracterizan por lesiones cutáneas de inicio tardío, urticaria y otras manifestaciones de hipersensibilidad. El tratamiento de

pacientes con manifestaciones tóxicas consiste en mantener una vía aérea permeable y ventilación asistida utilizando oxígeno, si se requiere. El tratamiento de efectos adversos cardiovasculares consiste en el uso de vasopresores, preferiblemente aquellos que estimulan el miocardio, líquidos por vía intravenosa y hasta masaje cardíaco si éste fuera necesario. Las convulsiones pueden ser controladas administrando intravenosamente pequeñas cantidades de algún anticonvulsivante. La lidocaína con epinefrina aplicada en sitios con compromiso vascular puede causar isquemia y necrosis de la zona por disminución de la irrigación sanguínea.

❖ **Clorhidrato de lidocaína como antiarrítmico cardíaco:** Con el uso de clorhidrato de lidocaína como antiarrítmico se han reportado reacciones sistémicas de los siguientes tipos.

- a) Sistema Nervioso Central: mareos, vértigos, somnolencia, aprensión, euforia, tinnitus, visión borrosa, vómitos, sensación de calor, convulsiones, inconsciencia y depresión respiratoria, llegando a veces al paro respiratorio.
- b) Cardiovascular: hipotensión, colapso cardiovascular y bradicardia que pueden hacer caer al paciente hasta un paro cardíaco.

No se ha reportado sensibilidad cruzada entre la lidocaína y la procainamida o entre la lidocaína y la quinina.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

Con antiarrítmicos pueden producir efectos cardíacos aditivos. Con anticonvulsivos del grupo de la hidantoína 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. Con la cimetidina puede ocasionar aumento de la lidocaína en sangre.

Los bloqueadores neuromusculares pueden ver potenciado su efecto con el uso simultáneo de lidocaína. La epinefrina pueden potenciar el efecto de los medicamentos que aumenta la excitabilidad cardíaca.

ALTERACIONES DE LOS RESULTADOS DE PRUEBAS DE LABORATORIO:

La prueba con bentiromida se ve alterada al usar la lidocaína. Los valores de la creatininfosfoquinasa (CPK) pueden aumentar con la administración intramuscular de lidocaína.

PRECAUCIONES Y RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGÉNESIS, TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD:

No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en humanos, sin embargo, no se han reportado efectos de carcinogénesis, mutagénesis, teratogénesis ni alteraciones en la fertilidad hasta la fecha.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Clorhidrato de Lidocaína como anestésico local: En este caso la dosis es variable y va a depender del área que va a ser anestesiada, de la vascularidad de los tejidos, del número de segmentos neuronales que van a ser bloqueados. Deberá utilizarse la mínima dosis necesaria que proporcione una anestesia efectiva. La dosis inicial del clorhidrato de lidocaína en un adulto no deberá exceder de 6 mg. por kg. de peso corporal. Es recomendable el uso de concentraciones al 0.5% o al 1% de clorhidrato de lidocaína en infantes, para minimizar la posibilidad de reacciones tóxicas y la dosis

total deberá ser reducida en proporción al peso corporal o al área que se va a anestésiar.

Clorhidrato de lidocaína como antiarrítmico: La dosis usual para adulto es de 50 a 100 mg. administrados directamente por vía intravenosa a una velocidad aproximada de 25 a 50 mg/minuto. Deberá darse el tiempo suficiente para permitir que la circulación lleve el medicamento al sitio de acción. Si una inyección inicial de 50 a 100 mg no proporciona la respuesta deseada, puede repetirse una segunda dosis después de 5 minutos. Nunca deberán administrarse más de 200 a 300 mg de lidocaína durante un período de una hora. Pacientes con una función hepática alterada o un flujo hepático reducido (como en alguna falla miocárdica o después de cirugía cardíaca), o en pacientes mayores de 70 años de edad, se les proporcionará la mitad de la dosis de inicio y menores dosis de mantenimiento. En niños, la experiencia del uso de la lidocaína como antiarrítmico es muy limitada.

Para infusiones continuas intravenosas en pacientes cuyas arritmias tiendan a recurrir después de una buena respuesta temporal a una dosis única y que por alguna razón no puedan recibir terapia oral antiarrítmica, el clorhidrato de lidocaína puede ser administrado continuamente en concentraciones al 0.1 % (1 mg/ml) a una velocidad de 1 a 4 ml/minuto (20 a 50 mcg/kg/minuto en un individuo de 70 kg como promedio). Soluciones de lidocaína al 0.2% (2 mg/ml), pueden administrarse a una velocidad de 0.5 a 2 ml/minuto. La administración intravenosa continua siempre deberá ser monitorizada electrocardiográficamente para evitar una sobredosis y/o toxicidad potencial. Asimismo, deberá terminarse tan pronto como se restablezca el ritmo cardíaco normal en el paciente. Tan pronto como sea posible y cuando esto esté indicado deberá iniciarse la terapia con antiarrítmicos orales y suspender la lidocaína intravenosa. Siempre que se administre lidocaína por infusión intravenosa continua se deberá utilizar un equipo de venoclisis de precisión. Para preparar una solución de lidocaína al 0.1% (1 mg/ml) para administración intravenosa continua se deberá añadir 1 g. de clorhidrato de lidocaína en 1000 ml. de solución glucosada al 5% (solución de preferencia). Tal solución a una velocidad de 1 a 4 ml/minuto, proporcionará 1 a 4 mg/minuto.

Una solución de clorhidrato de lidocaína al 0.2% puede prepararse agregando 2 gramos de lidocaína a 1000 ml. de solución glucosada al 5%. La velocidad de administración de 0.5 a 2 ml/minuto proporcionará 1 a 4 mg/minuto.

La solución de lidocaína con epinefrina, únicamente se indica para anestesia local o regional y nunca deberá emplearse como antiarrítmico, es decir se evitara su uso por vía intravenosa.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL:

Las reacciones debidas a una sobredosis (altos niveles plasmáticos) son sistémicas e involucran al sistema nervioso central y al sistema cardiovascular. Las primeras se caracterizan por excitación y/o depresión, nerviosismo, vértigos, visión borrosa, temblor, convulsiones, pérdida de la conciencia y puede llegar al paro respiratorio. Las segundas, incluyen depresión del miocardio, hipotensión, bradicardia y hasta paro cardíaco. Las reacciones alérgicas se caracterizan por lesiones cutáneas de inicio tardío, urticaria y otras manifestaciones de hipersensibilidad. El tratamiento de pacientes con manifestaciones tóxicas consiste en mantener una vía aérea permeable y ventilación asistida utilizando oxígeno, si se requiere. El tratamiento de efectos adversos cardiovasculares consiste en el uso de vasopresores, preferiblemente aquellos que estimulan el miocardio, líquidos por vía intravenosa y hasta masaje cardíaco si éste

fuera necesario. Las convulsiones pueden ser controladas administrando intravenosamente pequeñas cantidades de un anticonvulsivante.

Con concentraciones séricas de lidocaína de 6 a 8 mg/ml: Visión borrosa o doble, náuseas, vómitos, tinnitus y temblores o contracciones musculares.

Con concentraciones séricas de lidocaína mayores de 8 mg/ml: Dificultad para respirar, mareos intensos, pérdida del conocimiento, crisis convulsivas, lentitud en la transmisión eléctrica cardíaca.

El tratamiento incluye las siguientes acciones:

1. Suspender inmediatamente la administración de lidocaína; monitorización estricta del paciente.
2. Mantenimiento de la vía aérea permeable y administración de oxígeno.
3. Para la depresión circulatoria: Administrar un vasopresor y líquidos intravenosos si son necesarios.
4. Para las crisis convulsivas: Diazepam o tiopental.

PRESENTACIONES:

PISACAÍNA 1% Frasco ampula con 50 ml.

PISACAÍNA 2% Frasco ampula con 50 ml.

PISACAÍNA 2% Frasco ampula con 10 ml. en caja x 10 ampolletas plásticas.

PISACAÍNA 2% Frasco ampula con 50 ml. con epinefrina

PISACAÍNA 5% ampolleta x 2 ml con dextrosa, caja x 50 ampolletas.

ALMACENAMIENTO:

Consérvese a temperatura ambiente a no más de 30°C. El producto con epinefrina protéjase de la luz.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN:

Literatura exclusiva para médicos. Su venta requiere receta médica. Este es un medicamento de alto riesgo. No se deje al alcance de los niños.

El empleo de este medicamento durante el embarazo y la lactancia queda bajo responsabilidad del médico.

Si no se administra todo el producto deséchese el sobrante.

No use la solución si no está transparente, si contiene partículas en suspensión o sedimentos o si el cierre ha sido violado.

Este medicamento es de empleo delicado.

La administración de este producto debe ser vigilada estrechamente por el médico.

HECHO EN MÉXICO POR:

LABORATORIOS PISA S.A. de C.V.

Calle 7 N° 1308 Zona Industrial 44940 Guadalajara, JAL. México.

IMPORTADO PARA COLOMBIA POR:

PISA FARMACÉUTICA DE COLOMBIA S.A.

CALLE 20 N° 69 B-36 Bogotá, D. C. - Colombia

Registro Sanitario: **2008M-0008556**

PISACAÍNA 2% X 50 ml.