

## RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

<b>Nombre del producto:</b>	<b>BUPIVACAÍNA 0,5%</b>
<b>Forma farmacéutica:</b>	Inyección IA, SA.
<b>Fortaleza:</b>	5 mg/mL
<b>Presentación:</b>	Estuche por 25 o 36 bulbos de vidrio incoloro con 5 mL ó 10 mL cada uno.
<b>Titular del Registro Sanitario, país:</b>	Empresa Laboratorios AICA, Cuba.
<b>Fabricante, país:</b>	Empresa Laboratorios AICA. Unidad Empresarial de Base "Laboratorios Liorad", Cuba.
<b>Número de Registro Sanitario:</b>	M-14-228-N01
<b>Fecha de Inscripción:</b>	14 de noviembre de 2014
<b>Composición:</b>	
Cada mL contiene:	
Clorhidrato de bupivacaína	5,00 mg
Cloruro de sodio	9,00 mg
<b>Plazo de validez:</b>	24 meses
<b>Condiciones de almacenamiento:</b>	Almacenar por debajo de 30 °C. Protégase de la luz.

### Indicaciones terapéuticas:

Anestésico local (para infiltración). anestesia regional central por bloqueo caudal, epidural o de algunos nervios periféricos (anestesia espinal, maxilar, mandibular, oftálmica, etc.) En obstetricia.

Paliativo del dolor causado por el cáncer.

Prevención del dolor postoperatorio.

Bloqueo simpático.

### Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida a los anestésicos locales del grupo de las amidas.

Antecedentes de hipertensión maligna.

Anestesia paracervical en trabajo de parto (puede producir bradicardia y muerte fetal).

Anestesia regional i.v.

### Precauciones:

Parto y alumbramiento. Pacientes muy jóvenes y ancianos con enfermedad aguda o debilitante. Embarazo y lactancia. Usar con precaución en pacientes con daño renal y hepático. Para bloqueo epidural o raquídeo (no emplear preparaciones con persegantes): bloqueo cardíaco, hemorragia severa, hipotensión, shock, sepsis, antecedentes hipertermia maligna, inflamación o infección en el sitio de la punción, deformaciones espinales, trastornos de coagulación, cefalea o antecedentes de migraña

**Advertencias especiales y precauciones de uso:**

La disponibilidad de un equipo de resucitación y medicación adecuada es necesaria siempre que se utilice un agente anestésico.

La administración de este medicamento en niños menores de 12 años no es recomendable. No contiene agentes preservantes, una vez roto el bulbo el medicamento no utilizado debe ser desechado.

**Efectos indeseables:**

Depresión cardiovascular. Arritmias prolongadas.

Nerviosismo, vértigo, visión borrosa, temblores, somnolencia, convulsiones, inconsciencia y paro respiratorio.

Náuseas, vómitos y escalofríos, constricción pupilar y zumbido de oídos.

Depresión del miocardio, hipotensión, bradicardia y hasta paro cardíaco.

Urticaria, edema y shock anafiláctico.

**Posología y método de administración:**

Cuando se utiliza para el bloqueo caudal, epidural o nervioso, la bupivacaína al 0,5 % produce bloqueo motor y cierta relajación muscular. Con las técnicas de administración (intermitente) mediante catéter continuo, la repetición de las dosis aumenta el grado de bloqueo motor. La primera repetición de una dosis de bupivacaína al 0,5 % puede producir bloqueo motor completo.

Adultos:

Anestesia caudal:

Bloqueo motor moderado: De 37,5 a 75 mg (de 15 a 30 mL) de solución al 0,25 %, repetidos una vez cada 3 horas, según necesidades.

Bloqueo motor de moderado a completo: De 75 a 150 mg (de 15 a 30 mL) de solución al 0,5 %, repetidos una vez cada 3 horas, según necesidades.

Anestesia epidural:

Bloqueo motor de parcial a moderado: De 25 a 50 mg (de 10 a 20 mL) de solución al 0,25 %, repetidos una vez cada 3 horas, según necesidades.

Bloqueo motor de moderado a completo: De 50 a 100 mg (de 10 a 20 mL) de solución al 0,5 %, repetidos una vez cada 3 horas, según necesidades.

Infiltración local: Dosis única: Hasta 175 mg (70 mL) de solución al 0,25 %.

Bloqueo nervioso periférico: Bloqueo motor de moderado a completo: De 12,5 a 175 mg (de 5 a 70 mL) de solución al 0,25 % o de 25 a 175 mg (de 5 a 37,5 mL) de solución al 0,5 %. La dosis se puede repetir una vez cada 3 horas, si es necesario.

Bloqueo simpático: De 50 a 125 mg (de 20 a 50 mL) de solución al 0,25 %, repetidos cada 3 horas, según necesidades.

Prescripción límite usual para adultos: Hasta 175 mg como dosis única o 400 mg al día.

**Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:**

La bupivacaína no debe administrarse simultáneamente con:

Antimiasténicos, ya que la inhibición de la transmisión neuronal inducida por los anestésicos locales puede antagonizar los efectos antimiasténicos sobre el músculo esquelético, especialmente si grandes cantidades del anestésico se absorben rápidamente.

Medicamentos que producen depresión del SNC, incluyendo aquellos que se usan comúnmente como preanestésicos o suplementación de la anestesia local ya que puede provocar efectos depresores aditivos.

Soluciones desinfectantes que contienen metales pueden aumentar el riesgo de hipotensión.

Agentes bloqueadores neuromusculares, ya que la inhibición de la transmisión neural por anestésicos locales puede intensificar o prolongar la acción de los bloqueadores neuromusculares si se absorben rápidamente grandes cantidades del anestésico.

Medicamentos analgésicos opiáceos (narcóticos) adicionales a la anestesia, ya que las alteraciones en la respiración causadas por los altos niveles de bloqueo espinal o peridural

pueden agregarse a las alteraciones inducidas por los analgésicos opioides en la frecuencia respiratoria y en ventilación alveolar.

Vasoconstrictores tales como epinefrina, metoxamina o fenilefrina.

No se recomienda el uso de metoxamina en combinación con anestésicos locales para prolongar su acción en sitios locales puesto que el efecto extendido de la metoxamina puede causar restricción excesiva de la circulación y llevar a cambios de tejidos pesados, ya que los anestésicos locales pueden causar la liberación de iones de los metales pesados de estas soluciones, los cuales, si se proyectan junto con el anestésico, pueden causar irritación local severa, hinchazón y edema; tales soluciones no se recomiendan para la desinfección química del recipiente y se recomiendan medidas preventivas si se usan para la desinfección de la piel o de la membrana mucosa antes de administración del medicamento.

Guanadrel, guanetidina, mecamilamina, trimetafán, pues el riesgo de hipotensión severa y/o bradicardia puede incrementarse si se inducen niveles altos de anestesia espinal o epidural.

Inhibidores de la monoaminooxidasa, incluyendo furazolidona, pargilina y procarbazona, pues el uso concomitante en pacientes que reciben anestésicos locales por el bloqueo subaracnoideo

Otros vasoconstrictores deben usarse con precaución y en cantidades cuidadosamente seleccionadas, si es el caso, al anestesiar con anestésicos locales áreas con arterias terminales (dedos de los pies y de las manos, pene) o con cualquier otro suministro de sangre comprometido; puede producirse isquemia con gangrena.

### **Uso en Embarazo y lactancia:**

Parto y alumbramiento. Pacientes muy jóvenes anciano con enfermedad aguda o debilitada.

Embarazo y lactancia. Usar con precaución en pacientes con daño renal y hepático. Para bloqueo epidural o raquídeo (no emplear preparaciones con preservantes): bloqueo cardíaco, hemorragia severa, hipotensión, shock, sepsis, antecedentes hipertermia maligna, inflamación o infección en el sitio de la punción, deformaciones espinales, trastornos de coagulación, cefalea o antecedentes de migraña

### **Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:**

No se ha encontrado ningún informe sobre este aspecto

### **Sobredosis:**

Emergencias por el uso de anestésicos locales están relacionadas generalmente con altos niveles plasmáticos encontrados durante el uso terapéutico de un anestésico local o por una inyección accidental subaracnoidea de una solución con anestésicos locales.

El primer paso en el manejo de reacciones de toxicidad sistémica, así como hipoventilación o apnea debidas a una inyección subaracnoidea accidental, consiste en atención inmediata para establecer y mantener las vías aéreas paciente permeable y una ventilación efectiva controlada o asistida con oxígeno al 100 % proporcionado con un sistema capaz de permitir una presión positiva mediante una máscara. Esto puede prevenir las convulsiones si es que éstas no han ocurrido

### **Propiedades farmacodinámicas:**

Mecanismo de acción:

Anestésicos locales: Bloquean tanto la iniciación como la conducción de los impulsos nerviosos mediante la disminución de la permeabilidad de la membrana neuronal a los iones sodios y de esta manera la estabilizan reversiblemente. Dicha acción inhibe la fase de despolarización de la membrana neuronal, dando lugar a que el potencial de acción se propague de manera insuficiente y el consiguiente bloqueo de la conducción.

Vasoconstrictor: Actúa sobre los receptores alfa adrenérgicos de la vasculatura de la piel, membranas mucosas, conjuntiva y vísceras para producir vasoconstricción, disminuyendo así el flujo de sangre en el lugar de la inyección. La reducción de la velocidad de

aclaramiento local de los anestésicos locales que resulta, prolonga la duración de la acción, rebaja la concentración sérica máxima, disminuye el riesgo de toxicidad sistémica y aumenta la frecuencia de bloqueos totales de la conducción con concentraciones bajas de anestésico local. Los vasoconstrictores también pueden reducir la hemorragia cuando se inyectan en el lugar donde se lleva a cabo la cirugía.

Otras acciones:

Anestésicos locales: Las acciones a nivel del sistema nervioso central (SNC) pueden producir estimulación y/o depresión de éste. Las acciones sobre el sistema cardiovascular pueden producir depresión de la excitabilidad y la conducción cardíaca y, con la mayoría de ellos, vasodilatación periférica.

**Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):**

Absorción: Absorción sistémica completa. La velocidad de absorción depende del lugar y la vía de administración (sobre todo de la vascularización o velocidad del flujo sanguíneo en el lugar de inyección), de la dosis total administrada (volumen y concentración), de las características físicas (tales como grado de unión a proteínas y solubilidad en lípidos), de cada fármaco en particular y de si se utilizan o no simultáneamente vasoconstrictores.

Metabolismo:

Amidas: Hepático.

Tiempo hasta la concentración máxima: Generalmente de 10 a 30 minutos; depende de factores que afectan a la velocidad de absorción. Se puede producir de 1 a 3 minutos después de la inyección intravascular o transteal.

Concentración sérica máxima: Depende de factores que afectan a la velocidad de absorción en el lugar de la inyección y de la tasa metabólica y del volumen de distribución de cada anestésico en particular.

Eliminación: Principalmente por el metabolismo hepático, seguido de excreción renal de los metabolitos. Para alguno de estos fármacos la excreción renal puede ser posterior a la excreción biliar en el tracto gastrointestinal y a la reabsorción en dicho tracto.

Cantidad de dosis excretada sin metabolizar: 6 %.

Unión a proteínas: Muy alta, 95 %

Vida media adulto/neonato: 2,7-3,5 h / 6-10 h.

Comienzo de la acción: De intermedio a lento.

Duración de la acción: Larga.

**Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:**

Los productos elaborados en nuestro laboratorio son clasificados según la Resolución 32/2005 y Resolución 4/2006 como pertenecientes a la Clase I, es decir sin impacto significativo sobre el medio ambiente, por otro lado el análisis de nuestros residuos por el CIMAB, en la revisión inicial para la implantación del sistema de Gestión ambiental, no evidencia efecto sobre las aguas examinadas en los puntos de muestreo, no obstante como medida de nuestra entidad se decidió la colecta de las muestras residuales y su posterior disposición final, por encapsulamiento o cualquier otro método aprobado por la legislación ambiental en vigencia. La entidad cuenta con licencia para el manejo de los desechos peligrosos y permiso de bioseguridad.

**Fecha de aprobación/ revisión del texto:** 30 de noviembre de 2015.