

**Laboratorios Clarben S.A**  
**Tl: (34) (91) 445.85.95**  
**Fax: (34) (91) 446.15.08**

## **ARTICAINA CON 1,0 mg % de EPINEFRINA**

## **ARTICAINA CON 0,5 mg % de EPINEFRINA**

### **FICHA TÉCNICA**

**MEGANEST 1:100.000**  
**MEGANEST 1:200.000**

### **2. - COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA**

Cada carpúl de 1,8 ml contiene:

	MEGANEST 1:100.000		MEGANEST 1:200.000	
ARTICAINA (D.C.I.)	72 mg	4 %	72 mg	4%
EPINEFRINA (ADRENALINA)	18 µg	1 mg %	9µg	0,5 mg %

### **3. - FORMA FARMACÉUTICA:**

Solución inyectable.

### **4. - DATOS CLÍNICOS**

#### **4. 1. INDICACIONES TERAPÉUTICAS**

**MEGANEST** está indicado para la anestesia local en odontoestomatología, por infiltración o bloqueo troncular.

**MEGANEST 1:200.000:** Indicado para la mayoría de las intervenciones dentales de duración inferior a 45 minutos.

**MEGANEST 1:100.000:** Indicado para las intervenciones dentales de duración mayor a 1 hora, especialmente en intervenciones de tejidos blandos y óseos en los que se requiere una isquemia más acentuada.

Estas formulaciones están indicadas únicamente para su utilización en odontoestomatología.

#### **4. 2. POSOLOGIA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN**

**MEGANEST** debe ser administrado lentamente. Para conseguir una buena anestesia pulpar, la inyección deberá realizarse a nivel del ápice radicular (anestesia infiltrativa) o a nivel del tronco del nervio dentario inferior o superior (anestesia troncular). Es conveniente realizar una aspiración mientras se inyecta la solución para evitar su introducción en vasos sanguíneos.

#### **Adultos:**

No sobrepasar el equivalente de 7 mg de clorhidrato de Articaína por kilo de peso; lo que corresponde a 6 cartuchos de 1,8 ml para una persona de 65 Kg. No sobrepasar la dosis de 500 mg en total como máximo.

En esta tabla reproducimos las dosis aconsejada y máxima para cada uno de los preparados y para un adulto tipo de 65 Kg. de peso.

	Dosis aconsejada		Dosis máxima	
	Volumen (ml)	Nº de carpules	Volumen (ml)	Nº de carpules
<b>MEGANEST 1:200.000</b>	0,5 – 5,1	1/3 a 3	11,4	6
<b>MEGANEST 1:100.000</b>	0,5 – 5,1	1/3 a 3	11,4	6

#### **Niños:**

- ☒ No administrar a niños menores de 4 años.
- ☒ La cantidad de producto a inyectar debe calcularse en función
- ☒ . del peso del niño. En niños con edades comprendidas entre 4 y 12 años no superar la dosis de 5 mg de articaína clorhidrato por kilo de peso.

#### **En niños que pesen entre 20-30 Kg.**

Es suficiente con una dosis de 0,25 a 1 ml (nº de carpules: 1/6 a 1/2)  
No sobrepasar la dosis de 1,5 ml durante la intervención y la dosis de 2,5 ml en 24 horas.

#### **En niños que pesen entre 30-45 Kg.**

Es suficiente con una dosis de 0,5 a 2 ml (nº de carpules: 1/3 a 1)  
No sobrepasar la dosis de 2 ml durante la intervención y la dosis de 5 ml en 24 horas.

### 4. 3. CONTRAINDICACIONES

Ver también apartado 4.4. (Advertencias y precauciones especiales de empleo)

#### CONTRAINDICACIONES DEBIDAS A LA ARTICAÍNA.

- ☒ Pacientes con hipersensibilidad a anestésicos locales de tipo amida.
- ☒ Pacientes con metahemoglobinemia congénita o idiopática.

## CONTRAINDICACIONES DEBIDAS A LA EPINEFRINA (ADRENALINA).

No debe administrarse en pacientes con afecciones cardiovasculares graves: infarto de miocardio reciente o afectados de angina de pecho; taquicardia paroxística; arritmia completa de alta frecuencia. Tampoco debe usarse en casos de glaucoma de ángulo cerrado, diabetes e hipertiroidismo.

## CONTRAINDICACIONES DEBIDAS A LOS EXCIPIENTES

El producto no deberá administrarse a personas asmáticas que presenten hipersensibilidad a los sulfitos.

### 4. 4. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES ESPECIALES DE EMPLEO

**MEGANEST** debe ser utilizado sólo para anestesia local en odontoestomatología, no para otro tipo de anestesia local.

Cuando los anestésicos locales se administran a dosis adecuadas y en el lugar anatómico apropiado, resultan relativamente seguros para anestesia dental. No obstante es importante considerar las advertencias siguientes.

Como para todos los anestésicos locales, especialmente si contienen epinefrina (adrenalina), debe **evitarse la inyección intravascular absolutamente**. Por tanto es imperativo cerciorarse de que la aguja no se ha introducido en un vaso sanguíneo. Conviene por tanto realizar aspiraciones antes y durante la inyección.

Deberá administrarse con precaución en pacientes:

- ⊗ con disfunción hepática debido a la menor metabolización del compuesto
- ⊗ con disfunción renal ya que puede acumularse el anestésico y sus metabolitos
- ⊗ en ancianos y niños.
- ⊗ con epilepsia, shock, alteraciones de la conducción cardíaca o miastenia gravis
- ⊗ con lesiones miocárdicas, hipertiroidismo y en la hipertensión arterial grave, debido a la presencia de epinefrina (adrenalina).

Administrar con precaución cuando el lugar de inyección esté inflamado o infectado ya que puede modificarse el pH en el lugar de aplicación y disminuir así el efecto de la articaina.

**Aviso importante:** Los anestésicos locales sólo deben utilizarse por profesionales con experiencia y debe tenerse acceso inmediato a equipo y medicamentos de reanimación. Consultar el apartado correspondiente a las contraindicaciones.

### 4. 5. INTERACCIÓN CON OTROS MEDICAMENTOS Y OTRAS FORMAS DE INTERACCIÓN.

Las principales interacciones debidas a los componentes de **MEGANEST** se pueden producir con los siguientes fármacos:

- ⊗ IMAO al evitar la metabolización de la epinefrina (adrenalina).
- ⊗ Antidepresivos tricíclicos debido a que disminuyen la recaptación de la epinefrina (adrenalina).
- ⊗  $\beta$ -bloqueantes. Al existir antagonismo con el componente vasodilatador de la adrenalina (que es un efecto) no puede descartarse la aparición de vasoconstricción (hipertensión) en pacientes que estén recibiendo  $\beta$ -bloqueantes.
- ⊗ Fármacos que modifican las propiedades eléctricas del corazón: antiarrítmicos, especialmente del grupo I, así como digitálicos y otros inotrópicos, al aumentar la posibilidad de producción de arritmias ventriculares.

Los anestésicos locales pueden potenciar los efectos de los gangliopléjicos y relajantes neuromusculares.

#### 4. 6. EMBARAZO Y LACTANCIA

No se ha establecido una seguridad de uso de Meganest con respecto a los posibles efectos adversos sobre el desarrollo fetal. Antes de la administración debe tenerse en cuenta un potencial embarazo, especialmente durante los primeros meses.

#### 4.7. EFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD PARA CONDUCIR Y UTILIZAR MAQUINARIA

No se han estudiado.

#### 4. 8. REACCIONES ADVERSAS

##### REACCIONES ADVERSAS DEBIDAS A LA ARTICAINA

Las reacciones adversas más frecuentes de este grupo de fármacos son el resultado de la alta concentración plasmática y del rápido paso al cerebro, debido a su liposolubilidad.

Pueden aparecer como resultado de una inyección intravascular accidental, o tras una sobredosis por inyectar una cantidad excesiva de solución anestésica; pudiendo aparecer las siguientes reacciones adversas:

Sistema nervioso central: Las reacciones sobre el SNC se caracterizan por excitación o depresión. La primera manifestación es de nerviosismo seguido de insomnio, visión borrosa, mareos, convulsiones, estado de inconsciencia y posiblemente parada respiratoria. Ya que la excitación puede ser transitoria o inexistente, la primera manifestación puede ser somnolencia, a veces unida a inconsciencia y parada respiratoria.

Otros efectos sobre el SNC pueden ser náuseas, vómitos, escalofríos o constricción de las pupilas.

Sistema cardiovascular: Las manifestaciones cardiovasculares pueden afectar a la presión arterial (hipotensión) o directamente al corazón (depresión del miocardio o disminución de la frecuencia del pulso).

La metahemoglobinemia es un potente efecto secundario de la administración de elevadas dosis de Articaina. Esta reacción se ha detectado al administrarla intravenosamente, en anestesia regional. Hasta ahora, no se ha dado ningún caso al administrar articaina en la práctica dental.

Las reacciones alérgicas caracterizadas por lesiones cutáneas, edema e inclusive shock anafiláctico son raras con la articaina, aunque no debe descartarse esta posibilidad.

#### REACCIONES ADVERSAS DEBIDAS A LA EPINEFRINA (ADRENALINA)

Pueden aparecer reacciones adversas graves por sobredosificación o bien por la administración de una dosis ordinaria si la inyección ha sido accidentalmente intravenosa.

Se observan reacciones adversas debidas a la epinefrina (adrenalina) en personas susceptibles, especialmente en neuróticos e hipertensos. Dichos trastornos pueden ser nerviosos y/o cardiovasculares.

- ⊗ Trastornos nerviosos: ansiedad, cefaleas pulsante, temblores y mareos.
- ⊗ Trastornos cardiovasculares: taquicardia, palpitaciones, palidez, elevación (discreta) de la presión arterial.

#### REACCIONES ADVERSAS DEBIDA A LOS SULFITOS

Debido a la presencia de sulfitos, pueden producirse, en casos aislados, especialmente en asmáticos, reacciones de hipersensibilidad que pueden manifestarse por vómitos, diarreas, sibilancias, crisis aguda de asma, alteración de la conciencia y shock.

#### 4.9 SOBREDOSIFICACION

La sobredosificación se puede producir como resultado de una inyección intravascular accidental o por inyectar una cantidad excesiva de solución anestésica. Las posibles consecuencias se detallan en el apartado de EFECTOS ADVERSOS.

Los efectos tóxicos de los anestésicos locales requieren un tratamiento sintomático, no existiendo una cura específica.

En caso de aparición de síntomas en el sistema nervioso central, respiratorio o cardiovascular, es indispensable aplicar las siguientes medidas:

- ⊗ Cesar inmediatamente el aporte de Meganest.
- ⊗ Mantener libres las vías respiratorias.
- ⊗ Aplicar una ventilación asistida o controlada utilizando oxígeno (100%) por medios tales como una mascarilla, antes de inyectar cualquier producto o intubar. Continuar la terapia con oxígeno hasta unos momentos después de la desaparición de los síntomas.
- ⊗ Controlar cuidadosamente la tensión arterial, la frecuencia del pulso y la dilatación de las pupilas.
- ⊗ En caso de depresión circulatoria aguda y severa de la tensión, colocar la cabeza del paciente en posición baja e inyectar lentamente, por vía intravenosa, un vasopresor que estimule preferentemente al miocardio (adrenalina).
- ⊗ Administrar además una solución cristaloides para restitución volumétrica.

- ⊗ En caso de aumento del tono vagal (bradicardia), administrar atropina (0,5 - 1,0 mg) por vía intravenosa.
- ⊗ Adoptar las medidas necesarias en caso de paro cardiaco (masaje cardiaco, respiración asistida...)
- ⊗ En caso de convulsiones tónico-clónicas, tratarlas administrando repetidamente pequeñas dosis de barbitúricos de efecto muy breve (Tiopental sódico 25 - 50 mg) o una benzodiacepina (Diazepan 5 - 10 mg/ kg. de peso) por vía intravenosa en dosis fraccionadas hasta llegar a controlar la situación.

Generalmente la administración de oxígeno es suficiente para tratar los síntomas de las convulsiones. Si éstas persisten y es posible la intubación del paciente, intubar, ventilar con oxígeno al 100% y administrar Tiopental sódico (250 mg) y succinilcolina base (1 mg/Kg.). En caso de intoxicación por anestésicos locales, los analgésicos que actúan sobre el sistema nervioso central están contraindicados.

Por consiguiente, los dentistas que utilicen algún anestésico local deben tener a su disposición para uso inmediato, los siguientes elementos:

- ⊗ Un equipo de reanimación que permita la ventilación controlada o asistida con oxígeno 100%.
- ⊗ Agentes vasopresores por vía intravenosa que estimulen el miocardio (adrenalina).
- ⊗ Atropina inyectable.
- ⊗ Fármacos anticonvulsionantes:
  - Barbitúricos como Tiopental sódico.
  - Benzodiacepinas tales como Diazepan.
  - Relajantes musculares de acción rápida tales como la Succinilcolina base.

## **5. - PROPIEDADES FARMACOLOGICAS**

### **5. 1. PROPIEDADES FARMACODINAMICAS**

Anteriormente denominada carticaina, la articaina suprime la sensibilidad dolorosa por bloqueo de la conducción de los impulsos aferentes desde la superficie corporal al sistema nervioso central. Esta acción es reversible, recuperando el nervio su función cuando desaparece el fármaco. Bloquea la permeabilidad de la membrana al ión sodio. De esta manera estabiliza reversiblemente la membrana neuronal y, como consecuencia de ello, inhibe la despolarización por impedir la entrada del ión sodio, impidiendo tanto la generación como la conducción de los impulsos nerviosos.

El efecto anestésico de la articaina se ve potenciado por la asociación con la epinefrina (adrenalina) como vasoconstrictor.

#### Mecanismo de acción

La articaina disminuye la permeabilidad de la membrana a los iones Na<sup>+</sup>, evitando que se genere un potencial de acción y por tanto la membrana no se despolariza. Como consecuencia la transmisión del impulso nervioso queda bloqueado.

**MEGANEST** contiene un segundo principio activo: epinefrina (adrenalina), cuya acción vasoconstrictora permite que, al ser menos retirada por el flujo sanguíneo, la articaina permanezca más tiempo en el lugar de acción.

**MEGANEST** presenta un periodo de latencia de 1 a 3 minutos.

En la siguiente tabla se detallan los tiempos de acción anestésica.

	<b>MEGANEST 1:100.000</b>		<b>MEGANEST 1:200.000</b>	
	Infiltrativa	Troncular	Infiltrativa	Troncular
ANESTESIA EN TEJIDO BLANDO	270 minutos	318 minutos	156 minutos	258 minutos
ANESTESIA PULPAR	75 minutos		45 minutos	

## 5. 2. PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS

### ARTICAINA

#### Absorción y distribución:

Se absorbe rápidamente. Al añadir epinefrina (adrenalina) se limita dicha absorción y retarda su desaparición.

Una vez absorbido pasa a sangre donde se combina con la albúmina plasmática en un 95%  
La vida media es de 120 minutos.

#### Biotransformación

La metabolización se produce en el hígado, por saponificación del grupo carboxilato obteniéndose ácido carboxílico. En este punto la reacción puede seguir varios caminos; ruta del ácido carboxílico, formación de un grupo amida y reacciones de oxidación.

#### Excreción

La vía de excreción es vía renal. Aproximadamente el 10 % inalterado en orina y el 90 % en forma de metabolitos (un 87 % de M1 y un 2 % de M2).

### EPINEFRINA (ADRENALINA)

#### Absorción y distribución

La absorción por vía subcutánea no es muy rápida y la acción no es muy potente debido esencialmente a una vasoconstricción que se produce. Esta absorción es algo más veloz y activa por vía intramuscular.

La epinefrina (adrenalina) desaparece rápidamente de la circulación con una vida media extremadamente corta de tal solo 20 segundos, se distribuye por todos los tejidos. Se acepta actualmente que la rápida terminación de la acción de la epinefrina (adrenalina) se debe esencialmente a la captación de dicha sustancia, sobre todo por las vesículas sinápticas

granulosas o gránulos de las terminaciones nerviosas simpáticas, de donde se libera lentamente.

### Biotransformación

La metabolización de la epinefrina lleva a su inactivación farmacológica, a través de los siguientes procesos metabólicos: La metabolización es realizada por las COMT y por las MAO, conjugación y oxidaciones.

### Excreción

La epinefrina (adrenalina) se excreta por riñón en forma conjugada o como metabolitos. Solo un 5 % como epinefrina no transformada. El 50% de la dosis administrada, se excreta en 6 horas y el resto en 18 horas. Solo una cantidad muy pequeña es excretada por heces.

## 5. 3. DATOS PRECLINICOS SOBRE SEGURIDAD

El valor de toxicidad relativa de la articaina con respecto a la procaina es de 1,65 (De acuerdo con los estudios de Muschaveck 1974). (La toxicidad que se le otorga a la procaina es de 1 sirviendo este valor como referencia para el cálculo de las toxicidades relativas de los diferentes anestésicos locales).

La DL50 presenta un valor de 7,58 mg/Kg. en ratón, intermedio entra la lidocaina y la novocaína. En todos los tipos de animales de ensayo y todas las vías de inyección, los síntomas tóxicos consistieron principalmente en espasmos tónico clónicos. La muerte apareció a los 2 minutos tras administración intravenosa, y a los 20 minutos tras una inyección intramuscular.

Los ensayos realizados en animales (rata y perro) después de 4 a 5 semanas de administración por vía intravenosa o intramuscular diaria han demostrado que las dosis sin efecto tóxico son las siguientes:

- ⊗ 6 mg/Kg./día i.v. en rata
- ⊗ 10 mg/Kg./día i.v. en perro
- ⊗ 25 mg/Kg./día i.v. en rata y perro.

A dosis elevadas, los síntomas de toxicidad son convulsiones, espasmos y parada respiratoria.

La dosis máxima aceptada para la articaina es de 500 mg.

## **6. - DATOS FARMACÉUTICOS**

### 6. 1. RELACIÓN DE EXCIPIENTES por ml:

Cloruro sódico..... 1.0 mg  
metalbisulfito sódico..... 0,5 mg  
Ácido cítrico. 1,2 mg  
Hidróxido sódico o

Ácido clorhídrico. Hasta ajuste de pH  
Agua para inyectables. c.s.p. 1,0 ml

## 6. 2. INCOMPATIBILIDADES

No se conocen.

## 6. 3. PERÍODO DE VALIDEZ

2 años.

## 6. 4. PRECAUCIONES ESPECIALES DE CONSERVACIÓN

Conservar entre 15°C y 30°C.

## 6. 5. NATURALEZA Y CONTENIDO DEL RECIPIENTE

**MEGANEST 1:100.000** y **MEGANEST 1:200.000**, cuya forma farmacéutica es una solución inyectable, se presenta en carpúl de 1,8 ml de vidrio tipo I, con émbolo de goma y un tapón no rotativo de aluminio sellado al vapor.

Para su correcta diferenciación, **MEGANEST 1:100.000** y **MEGANEST 1:200.000** presentan en material de acondicionamiento de colores diferentes.

## 6. 6. INSTRUCCIONES DE USO / MANIPULACIÓN

Antes de usar un carpúl de MEGANEST se debe esterilizar la tapa de metal con alcohol etílico al 70% o alcohol isopropílico al 90%.

Los carpules no deben ser almacenados o esterilizados con germicidas de amonio cuaternario (cloruro de benzalconio), ya que estos agentes reaccionan con el aluminio de la tapa. Los agentes que contienen mercurio u otros iones metálicos tampoco están recomendados.

## 6.7. NOMBRE O RAZÓN SOCIAL Y DOMICILIO DEL TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN

### **LABORATORIOS CLARBEN S.A.**

C/ Asura 111. Local 1 y 4

Madrid- 28038

Tel: (34)-(91) 445. 85. 95

Fax: (34)-(91) 446.15.08