

I. Denominación distintiva: CICLOFERON® XTRM**II. Denominación genérica: Aciclovir / Lidocaína****III. Forma farmacéutica y formulación**

Forma Farmacéutica: Solución

Cada 100 ml contienen:

Aciclovir ^{5g} 5g	50.00 mg
Clorhidrato de Lidocaína ^{2g} 2g	20.00 mg
Vehículo cbp100 mL	

**IV. Indicaciones terapéuticas**

Para el tratamiento de Herpes simple labial o febril y varicela aún en pacientes inmunocomprometidos.

V. Farmacocinética y farmacodinamia**Farmacocinética**

Aciclovir: En la piel intacta la absorción de aciclovir es mínima. No puede ser detectado en sangre ni orina. En la piel enferma la absorción es moderada. Se han reportado concentraciones séricas hasta de 0.28 mcg/ml en pacientes Con función renal normal y hasta 7.8 mcg/ml en pacientes con insuficiencia renal.

El aciclovir excretado en la orina osciló entre <0.02% y 9.4% de la dosis diaria. Por lo tanto, la absorción sistémica del aciclovir después de su aplicación tópica es mínima.

Lidocaína: Se absorbe después de su administración tópica, la cantidad y duración de absorción depende de la concentración y dosis total administrada, sitio específico de aplicación y duración de la exposición. En general, la tasa de absorción de los agentes anestésicos locales posterior a la aplicación tópica es más rápida después de la administración intratraqueal y bronquial. Lidocaína se absorbe bien en el tracto gastrointestinal, pero muy escasa cantidad del medicamento aparece en circulación debido a su biotransformación en hígado. Lidocaína se une a proteínas plasmáticas en 64% (primordialmente a la a-1-glucoproteína ácida, pero también a la albúmina). La a-1-glucoproteína ácida tiene sitios de alta afinidad y baja capacidad, mientras que la albúmina tiene sitios de baja afinidad y alta capacidad que cuantitativamente son menos importantes. Lidocaína sufre metabolismo hepático. La principal ruta del metabolismo en humanos es N-dealquilación a monoetilglicinaxilidina, seguida por hidrólisis a 2,6-xilidina e hidroxilación a 4-hidroxi-2,6-xilidina. monoetilglicinaxilidina puede sufrir también N-dealquilación a glicinaxilidina. La farmacología y toxicología de monoetilglicinaxilidina y glicinaxilidina son similares pero menos potentes que lidocaína. Glicinaxilidina tiene una vida media más larga (unas 10 horas) que lidocaína y podría acumularse durante la administración a largo plazo. Aproximadamente el 90% de Lidocaína administrada se excreta en forma de varios metabolitos y menos del 10% se excreta sin cambios en orina.

El principal metabolito en orina es 4-hidroxi-2,6-xilidina, se excreta en un 70 a 80%. La vida media de eliminación de Lidocaína posterior a la aplicación de un bolo intravenoso es de 1.5 a 2 horas.

Debido a que Lidocaína se metaboliza rápidamente, ninguna condición que afecte la función hepática puede alterar la cinética de Lidocaína.

La vida media puede ser prolongada dos o más veces en pacientes con insuficiencia hepática. La insuficiencia renal no afecta la cinética de Lidocaína, pero propicia la acumulación de sus metabolitos.

Factores como la acidosis y el uso de estimulantes o depresores del sistema nervioso central (SNC) afectan los niveles de lidocaína requeridos para producir efectos sistémicos manifiestos. Las manifestaciones adversas objetivas se vuelven más evidentes con el incremento de niveles plasmáticos venosos de 5.0 a 10 mg/l. Lidocaína cruza la barrera hematoencefálica y placentaria, probablemente por difusión pasiva.

Farmacodinamia

Aciclovir: Es un nucleótido sintético análogo de las purinas que posee una actividad inhibitoria tanto *in vivo* como *in vitro* en contra de los virus humanos del Herpes Simple incluyendo el Herpes Simple (VHS) tipo 1 y 2, el virus de la Varicela Zoster (VVZ) el virus de Epstein-Barr (VEB) y el Citomegalovirus (CMV). La enzima timidinocinasa (TK) que se encuentra en las células normales no infectadas, no utiliza el aciclovir como sustrato por lo cual la toxicidad en las células huésped de los mamíferos es muy baja, sin embargo la enzima celular TK codificada por el VHS, VVZ y VEB, convierten al aciclovir en monofosfato, que posteriormente se convierte en difosfato y finalmente en trifosfato, que es el que interfiere con la polimerasa del ADN viral e inhibe la replicación del DNA viral dando como resultado la terminación de la cadena siguiendo su incorporación en el DNA viral.

Lidocaína: Produce una anestesia de superficie eficiente, que dura aproximadamente de 10-15 minutos y la cual comienza por lo general en 1-3 minutos dependiendo del área de aplicación.

Lidocaína, como otros anestésicos locales, para producir su efecto debe bloquear la propagación de impulsos por las fibras nerviosas. Los impulsos se transmiten mediante despolarización y repolarización rápidas dentro de los axones nerviosos.

Estos cambios en la polaridad se deben al paso de iones sodio y potasio a través de la membrana del nervio por medio de los canales iónicos en la membrana. Lidocaina como anestésico local impide el movimiento de iones sodio hacia adentro lo cual inicia la despolarización y, en consecuencia, la fibra nerviosa no puede propagar impulsos.

Los mecanismos en que se basa la actividad de los anestésicos locales no se conocen completamente, pero una posible explicación es que la base soluble en lípidos se difunde al interior de la célula, atravesando la membrana lipídica. Una vez dentro de la célula, una parte del medicamento se ioniza y entra en el canal de sodio para ejercer el efecto inhibitorio sobre el ingreso de iones sodio y, por tanto, sobre la conducción de impulsos.

VI. Contraindicaciones

Aciclovir solución en spray está contraindicada en pacientes que desarrollen hipersensibilidad a los componentes de la fórmula o anestésicos tipo amida y deberá evitarse el contacto con los ojos.

VII. Precauciones generales

La solución en spray es para uso cutáneo exclusivamente. La dosis recomendada, la frecuencia de aplicación y la duración del tratamiento no deberán ser excedidas. La solución no deberá ser utilizada para la prevención de infecciones recurrentes por el VHS. Si bien no se ha observado una resistencia viral clínicamente significativa asociada con el uso de la solución en spray, dicha posibilidad está latente.

VIII. Restricciones de uso durante el embarazo y la lactancia

Aciclovir: Hasta el momento no existen datos suficientes del uso de aciclovir durante el embarazo, por lo tanto, se debe evaluar el beneficio del tratamiento contra el potencial riesgo que representa para el producto en desarrollo. Se ha detectado la presencia de aciclovir en la leche materna y por lo tanto deberán tomarse precauciones para su administración durante la lactancia.

Lidocaína: Atraviesa la barrera placentaria, siendo la concentración plasmática superior en el feto. Sin embargo, no se han encontrado alteraciones específicas, ni en el proceso de reproducción, ni aumento en la incidencia de malformaciones u otros efectos directos sobre el feto. Lidocaína se encuentra en la leche materna en cantidades tan pequeñas, que por lo general no representan un riesgo para el bebé.

IX. Reacciones secundarias y adversas

Aciclovir: En los estudios clínicos, aproximadamente el 28% de los pacientes pueden reportar dolor leve (incluyendo sensación de quemadura y ardor transitorias). En menor frecuencia pueden experimentar prurito (4%) y raras veces eritema cutáneo (0.3%).

El uso tópico de antivirales puede predisponer a la sensibilización de la piel, resultando reacciones de hipersensibilidad con el uso subsecuente tanto tópico como sistémico de aciclovir.

Lidocaína: En los anestésicos locales de tipo amida las reacciones alérgicas son muy raras, pero al presentarse pueden ser tan severas como un choque anafiláctico. Estas reacciones son predominantemente de sensibilidad local por contacto y rara vez sistémicas.

X. Interacciones medicamentosas y de otro género

Aciclovir: Con el uso tópico de aciclovir hasta la fecha no se han reportado.

Lidocaína: Deberá ser utilizada con precaución en aquellos pacientes, que se encuentren recibiendo fármacos estructuralmente relacionados con anestésicos locales, ya que los efectos tóxicos pueden ser aditivos.

XI. Alteraciones en los resultados de pruebas de laboratorio

Tanto con el uso tópico de aciclovir como de lidocaína hasta el momento no se han reportado.

XII. Precaución en relación a efectos de carcinogénesis, mutagénesis, teratogénesis y sobre la fertilidad

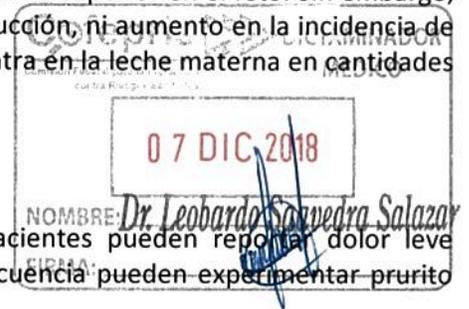
Aciclovir: La exposición sistémica después de la administración tópica de aciclovir es mínima, por lo tanto, los resultados de los estudios de carcinogénesis, mutagénesis y fertilidad no son incluidos en la información de prescripción completa.

Lidocaína: En concentraciones terapéuticas, lidocaína no es carcinogénica, teratogénica o mutagénica, ni tiene efecto sobre la fertilidad.

XIII. Dosis y vía de administración:

Vía de administración: Cutánea. No ingerible. Léase instrucciones de uso.

Dosis: Aplicar con un hisopo sobre las lesiones 5 veces al día durante 5 a 10 días. Es importante el aseo de las manos antes y después de aplicar la crema.



XIV. Manifestaciones y manejo de la sobredosificación o ingesta accidental

Aciclovir: Aún a dosis de 5 g por vía oral, es poco probable que se presenten efectos tóxicos y hasta el momento no se han reportado casos de ingestiones superiores. La hemodialisis es un recurso importante que puede remover hasta un 60% de la dosis administrada.

Lidocaína; En la vía cutánea, es poco probable una sobredosificación. En caso de ingesta accidental, se recomienda lavado gástrico y medidas comunes de soporte. Los estudios en animales han demostrado que una cantidad adecuada de carbón activado puede reducir significativamente la absorción del fármaco.

XV. Presentaciones

- Caja de cartón o envase de burbuja de PVC transparente con un frasco atomizador etiquetado con 2 mL, 5 mL, 10 mL o 15 mL con 50 mg/20 mg/mL, ~~con instructivo impreso.~~

- Caja de cartón o envase de burbuja de PVC transparente con un frasco atomizador etiquetado con 20 mL, 30 mL o 50 mL con 5 g/2 g/100mL, ~~con instructivo impreso.~~

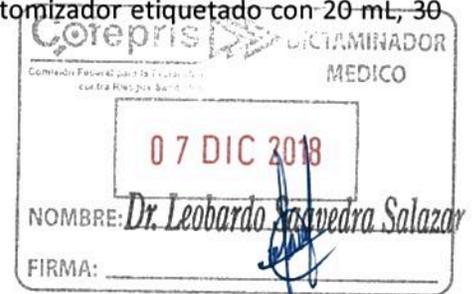
XVI. Recomendaciones sobre almacenamiento

Consérvese el frasco bien ^{cerrado} ~~tapado~~ a no más de 30° C.

XVII. Leyendas de protección

Literatura exclusiva para el médico. No se deje al alcance de los niños. Sólo para uso externo. No se administre en menores de 2 años.

Reporte las sospechas de reacción adversa al correo: farmacovigilancia@cofepris.gob.mx y farmacovigilancia@liomont.com.mx

**XVIII. Nombre y domicilio del laboratorio**

Laboratorios Liomont, S.A. de C.V.

Adolfo López Mateos No.68, Col. Cuajimalpa, C.P. 05000, ~~Deleg.~~ Cuajimalpa de Morelos, Ciudad de México, México.

XIX. Número de registro del medicamento ante la secretaria

Reg. Núm. 111M2010 SSA VI

® Marca registrada