

Ficha técnica de producto

MEXILETINA HIDROCLORURO

Descripción del producto:

Fórmula Molecular	C ₁₁ H ₁₇ NO, HCl
Peso molecular	215,72
Número CAS	31828-71-4
Sinónimos	Hidrocloruro de 1-Metil-2-(2,6-xililoxi)etilamina.

Datos Físico-Químicos:

Polvo cristalino blanco o casi blanco. Soluble en agua y alcohol. Prácticamente insoluble en éter. La solución acuosa al 10% tiene un pH de 4.0-5.5. Su punto de fusión es: 200-204°C.

Se distribuye rápida y ampliamente por el cuerpo, debido a sus propiedades físico químicas, ya que es una amina primaria con un pKa de 8,5-9,0 y altamente lipófila.

Propiedades:

Origen	Sintético
Calidad	Cumple Farmacopea Europea
Uso	Farmacéutico

Indicaciones:

Antiarrítmico de clase IB. Relacionado estructuralmente con la lidocaína. A diferencia de la lidocaína, sufre escaso metabolismo hepático de primer paso y puede administrarse por vía oral.

Mecanismo de acción: bloquea los canales de sodio en situaciones de excesivas ráfagas de potenciales de acción (bloqueo dependiente del uso) y/o de despolarización prolongada (bloqueo dependiente del voltaje), cuando tienen lugar en tejidos afectados, con una potencia mayor que en el caso de excitabilidad fisiológica (bloqueo en reposo o tónico). Por consiguiente, mexiletina es activa sobre todo en las fibras musculares sometidas a descargas repetidas (como los músculos esqueléticos). Mejora los síntomas miotónicos al disminuir la rigidez muscular mediante la reducción del retraso de la relajación muscular.

Está indicado para el tratamiento de arritmias ventriculares que supongan un riesgo para la vida del paciente.

Usado en pediatría para el tratamiento de:

- Taquicardia ventricular sin anomalía estructural cardíaca.
- Arritmia ventricular en cardiopatías congénitas.
- Síndrome de QT largo (tipo III).
- Eritromelalgia primaria.

Dosificación:

La mexiletina hidroclouro se administra por vía oral o intravenosa.

Adultos:

Administración oral:

- **Dosis de carga:** habitual de 400 mg seguida de 200 a 250 mg tres o cuatro veces al día, comenzando 2 horas después de la dosis de carga.
- **Dosis de mantenimiento:** habitualmente de 600 a 900 mg diarios en dosis divididas; se pueden administrar dosis de hasta 1,2 g al día.

Las dosis orales deben tomarse con alimentos y tragarse con abundante líquido para evitar la ulceración esofágica.

Se han utilizado preparaciones de liberación modificada. Pueden ser necesarias dosis de carga más altas (por ejemplo, de 600 mg) en pacientes después de un infarto de miocardio para superar la absorción retardada, especialmente si han recibido un analgésico opioide.

Administración parenteral:

- **Dosis de carga:** inyección intravenosa lenta en dosis de 100 a 250 mg a una velocidad de 25 mg/minuto; seguido de una infusión a una velocidad de 250 mg durante 1 hora; 250 mg durante las siguientes 2 horas
- **Dosis de mantenimiento:** 500 µg/minuto, según la respuesta; el paciente puede ser transferido a terapia oral con dosis de 200 a 250 mg tres o cuatro veces al día.
- **Alternativamente:** dosis intravenosa inicial de 200 mg a una velocidad de 25 mg/minuto, seguida por una dosis oral de 400 mg al finalizar la inyección, y seguida con la terapia oral subsiguiente como se indicó anteriormente.

Niños: 1,4-5 mg/kg/dosis cada 8 h. Iniciar con dosis más bajas y aumentar progresivamente. Ajustar en función de la eficacia antiarrítmica/toxicidad.

Efectos secundarios:

La Mexiletina tiene un margen terapéutico estrecho.

La toxicidad es común con dosis de carga orales o parenterales cuando las concentraciones plasmáticas son altas y muchos efectos adversos son dosis-dependientes y responderán positivamente a la reducción de su dosis, pero, puede ser lo suficientemente grave como para obligar a suspender el tratamiento y administrar terapia para paliar los síntomas producidos.

Los efectos adversos más comunes son:

- Efectos sobre el sistema gastrointestinal: náuseas, vómitos, estreñimiento y diarrea; También se ha informado ulceración esofágica.
- Efectos sobre el sistema nervioso: temblor, confusión, aturdimiento, mareos, visión borrosa y otros trastornos visuales, trastornos del sueño y dificultades del habla.
- Efectos sobre el sistema cardiovascular: son hipotensión, bradicardia sinusal, bloqueo cardíaco y disociación AV, y fibrilación auricular.

Al igual que con otros antiarrítmicos la mexiletina HCl puede exacerbar arritmias.

Otros efectos adversos que se han informado incluyen erupciones en la piel, resultados de la función hepática anormal, trombocitopenia, factor antinuclear positivo y convulsiones. El síndrome de Stevens-Johnson rara vez se ha informado.

Precauciones:

La Mexiletina está contraindicada en el shock cardiogénico y en bloqueo AV de segundo o tercer grado (a menos que el paciente tenga un marcapasos).

Debe usarse con precaución en pacientes con disfunción del nodo sinusal, trastornos en la conducción, bradicardia, hipotensión, insuficiencia cardíaca, o insuficiencia hepática.

Se debe monitorizar el ECG y la presión arterial durante el tratamiento.

La absorción de Mexiletina oral puede retrasarse en situaciones donde el vaciado gástrico se ralentiza, como en el infarto agudo de miocardio.

Interacciones e Incompatibilidades:

- Potenciación de la toxicidad cardiaca con dronedarona, lidocaína, propafenona y quinidina: mayor riesgo de torsades de pointes.
- Potenciación de la toxicidad de cafeína, teofilina y aminofilina (náuseas, vómitos, cefalea, palpitaciones y, en casos graves, convulsiones).
- Etravirina, fenitoína y rifampicina: disminuyen las concentraciones de mexiletina por su efecto inductor enzimático, lo que puede reducir su eficacia antiarrítmica.
- Ritonavir: puede aumentar las concentraciones de mexiletina, lo que potencia su toxicidad (náuseas, mareos y arritmias).
- Los fármacos que acidifican o alcalinizan la orina aumentan o reducen la tasa de eliminación de mexiletina, respectivamente.
- La absorción de mexiletina puede verse modificada por fármacos que retrasen el vaciado gástrico, como los analgésicos opioides y la atropina. La tasa de absorción puede aumentar por la metoclopramida.

Ejemplos de formulación:

Mexiletina hidrocloreuro 10mg/ml suspensión oral:

Mexiletina HCl	10mg/ml
Solución Paraben conservans	1ml
Saborizante pediátrico fresa	0,8ml
Sorbitol 70%	20ml
Jarabe simple	20ml
Agua purificada	csp. 100ml

Modus operandi:

- 1) Calcular la cantidad necesaria de cada uno de los componentes de la fórmula magistral
- 2) Pesar o medir todos los ingredientes.
- 3) Mezclar la Mexiletina HCl polvo con la solución de parabenos y el saborizante.
- 4) Añadir la solución de sorbitol 70% y el jarabe simple a la mezcla anterior (3) y homogenizar.
- 5) Añadir el agua purificada hasta volumen prescrito y homogenizar.
- 6) Envasar y etiquetar.

Caducidad: 115 días

Conservación: Nevera

Bibliografía: www.compoundingtoday.com

Bibliografía:

Martindale. Guía completa de consulta farmacoterapéutica

Mexiletina | Asociación Española de Pediatría (aeped.es)

Ficha técnica de medicación extranjera

DailyMed - MEXILETINE HYDROCHLORIDE powder (nih.gov)

Última actualización: 04/2023