

Xylestesin[®]

- Sem Vasoconstritor = cloridrato de lidocaína – 1,0% e 2,0%
- Com Vasoconstritor = cloridrato de lidocaína 1,0% e 2,0% + hemitartarato de epinefrina (1: 200.000 em epinefrina)

Solução Injetável

Cristália Produtos Químicos e Farmacêuticos Ltda.

MODELO DE BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin®
cloridrato de lidocaína
1% e 2%
sem vasoconstritor
com epinefrina 1:200.000

FORMA FARMACÊUTICA:
Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

- Solução injetável sem vasoconstritor
- 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL
- 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados
- 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL
- 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados
- Solução injetável com vasoconstritor
- 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL
- 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados
- 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL
- 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados

USO INJETÁVEL – PARA ANESTESIA REGIONAL **USO ADULTO E PEDIÁTRICO**

COMPOSIÇÃO COM VASOCONSTRITOR - 1%

Cada mL contém :
cloridrato de lidocaína 10 mg
Hemitartarato de epinefrina (equivalente a 5µg de epinefrina)..... 9,1 µg
Veículo estéril q.s.p.1,0 mL

COMPOSIÇÃO COM VASOCONSTRITOR - 2%

Cada mL contém :
cloridrato de lidocaína 20 mg
Hemitartarato de epinefrina (equivalente a 5µg de epinefrina)..... 9,1 µg
Veículo estéril q.s.p.1,0 mL

Veículo **Xylestesin®** 1,0% e 2,0% com vasoconstritor: cloreto de sódio, metilparabeno, metabissulfato de sódio, bicarbonato de sódio, edetato dissódico, água para injetáveis.

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR - 1%

Cada mL contém :
cloridrato de lidocaína 10 mg
veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR - 2%

Cada mL contém :
cloridrato de lidocaína 20 mg
veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

Veículo **Xylestesin®** 1,0% e 2,0% sem vasoconstritor: cloreto de sódio, metilparabeno, água para injetáveis.

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O **Xylestesin**[®] injetável é indicado para produção de anestesia local ou regional por técnicas de infiltração como a injeção percutânea; por anestesia regional intravenosa; por técnicas de bloqueio de nervo periférico como o plexo braquial e intercostal; e por técnicas neurais centrais, como os bloqueios peridural lombar e caudal.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

As soluções injetáveis de **Xylestesin**[®] 1% e 2% com ou sem vasoconstritor contém o anestésico local cloridrato de lidocaína associado ou não à epinefrina com indicação para infiltração e bloqueios nervosos. A lidocaína estabiliza a membrana neuronal por inibição dos fluxos iônicos necessários para o início e a condução dos impulsos efetuando deste modo a ação do anestésico local.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

A lidocaína é contraindicada em pacientes com conhecida hipersensibilidade a anestésicos locais do tipo amida ou a qualquer um dos componentes da fórmula.

A epinefrina é contraindicada em pacientes com hipertiroidismo ou doença cardíaca grave, particularmente quando a taquicardia está presente. Deve-se evitar o uso de epinefrina em anestesia nas áreas do corpo supridas por artérias finais ou com comprometimento do suprimento sanguíneo, como dedos, nariz, ouvido externo, pênis, etc.

As soluções contendo epinefrina ou outros vasoconstritores não devem ser usadas para a anestesia regional intravenosa.

4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

O PRODUTO SOMENTE DEVERÁ SER ADMINISTRADO POR PROFISSIONAIS EXPERIENTES NO DIAGNÓSTICO E CONTROLE DA TOXICIDADE DOSE-DEPENDENTE EMPREGADA E DE OUTRAS EMERGÊNCIAS AGUDAS QUE POSSAM SURTIR DO TIPO DE BLOQUEIO UTILIZADO, E SOMENTE DEPOIS DE SE ASSEGURAR A DISPONIBILIDADE IMEDIATA DE OXIGÊNIO E DE OUTRAS DROGAS PARA RESSUSCITAÇÃO, DE EQUIPAMENTOS DE RESSUSCITAÇÃO CARDIOPULMONAR E DE PESSOAL TREINADO NECESSÁRIO PARA TRATAMENTO E CONTROLE DAS REAÇÕES TÓXICAS E EMERGÊNCIAS RELACIONADAS. (VER TAMBÉM REAÇÕES ADVERSAS, PRECAUÇÕES E SUPERDOSAGEM).

A FALTA OU A DEMORA NO ATENDIMENTO DA TOXICIDADE DOSE-RELACIONADA DA DROGA E DA HIPOVENTILAÇÃO, SEJA QUAL FOR O MOTIVO E/OU ALTERAÇÕES NA SENSIBILIDADE, PODERÁ LEVAR AO DESENVOLVIMENTO DA ACIDOSE, PARADA CARDÍACA E POSSÍVEL ÓBITO.

Quando apropriado, os pacientes devem ser informados anteriormente da possibilidade de perda temporária da sensação e atividade motora na metade inferior do corpo após administração de anestesia peridural.

A segurança e a eficácia da lidocaína dependem da dose correta, técnica adequada, precauções adequadas e rapidez nas emergências.

Equipamento de ressuscitação, oxigênio e outras drogas ressuscitativas devem estar disponíveis para uso imediato. (Ver Reações Adversas).

A menor dose que resultar em anestesia efetiva deverá ser usada para evitar altos níveis plasmáticos e graves reações adversas. A aspiração da seringa deve também ser realizada antes e durante cada injeção suplementar, quando for utilizada técnica com cateter. Durante a administração da anestesia peridural, recomenda-se que uma dose teste seja administrada inicialmente e que o paciente seja monitorado para a detecção de toxicidade no sistema nervoso central e toxicidade cardiovascular, bem como para os sinais de administração intratecal não intencional, antes do prosseguimento. Quando condições clínicas permitirem, deve ser considerado o uso de soluções anestésicas locais que contenham epinefrina, para a dose teste, porque alterações circulatórias compatíveis com a epinefrina podem também servir como sinal de alerta de injeção intravascular não intencional.

É possível ainda uma injeção intravascular, mesmo que a aspiração para sangue seja negativa. As repetidas doses de lidocaína podem causar aumentos significativos no nível plasmático, com cada dose repetida, devido ao lento acúmulo da droga ou de seus metabólitos.

A tolerância a níveis sanguíneos elevados varia com o estado do paciente. Pacientes idosos, debilitados, pacientes com doenças agudas e crianças, deverão receber doses reduzidas de acordo com suas idades e condições físicas.

A lidocaína deve também ser usada com precaução em pacientes em estado de choque grave ou com bloqueio cardíaco. A anestesia peridural lombar ou caudal deve ser usada com extrema precaução em pessoas com as seguintes condições: existência de doença neurológica, deformidades espinhais, septicemia e hipertensão grave. As soluções de anestésico local contendo vasoconstritor devem ser usadas prudente e cuidadosamente em quantidades limitadas em áreas do corpo supridas por artérias finais ou outro tipo de comprometimento no suprimento sanguíneo.

Pacientes com doença vascular periférica e aqueles com doença vascular hipertensiva podem exibir exagerada resposta vasoconstritora. Podem ocorrer lesões isquêmicas ou necrose. As preparações contendo vasoconstritor devem ser usadas com precaução em pacientes durante ou após a administração de agentes anestésicos gerais, pois podem ocorrer sob tais condições arritmias cardíacas.

Cuidadoso e constante monitoramento cardiovascular e respiratório (adequada ventilação), sinais vitais e o estado de consciência do paciente devem ser acompanhados após cada injeção de anestésico local. Deverá também ser lembrado em tais momentos que agitação, ansiedade, zumbido, vertigem, visão nebulosa, tremores, depressão ou sonolência podem representar os primeiros sinais de toxicidade do sistema nervoso central. Os anestésicos locais do tipo amida são metabolizados no fígado, portanto, a lidocaína deve ser usada com cuidado em pacientes com doenças hepáticas. Os pacientes com doença hepática grave devido à sua reduzida capacidade de metabolização dos anestésicos locais, oferecem maior risco para o desenvolvimento de concentrações plasmáticas tóxicas. A lidocaína deve também ser usada com cautela em pacientes com função cardiovascular alterada, devido a uma menor capacidade de compensar as mudanças funcionais associadas ao prolongamento da condução atrioventricular provocado por essas drogas.

As soluções contendo epinefrina ou outros vasoconstritores não devem ser usadas para a anestesia regional intravenosa.

A lidocaína deve ser usada com cuidado em pessoas com conhecida sensibilidade às drogas.

Pacientes alérgicos aos derivados do ácido para-aminobenzoico (procaína, tetracaína, benzocaína, etc.) não têm apresentado sensibilidade cruzada à lidocaína.

Para evitar a injeção intravascular, deverá ser realizada aspiração antes da solução anestésica ser injetada. A agulha deve ser reposicionada até que não apareça nenhum retorno de sangue na aspiração.

Entretanto, a ausência de sangue na seringa não garante que a injeção intravascular tenha sido evitada.

As soluções de anestésicos locais contendo conservantes antimicrobianos (como por exemplo metilparabeno) não devem ser usadas para anestesia peridural ou espinhal porque a segurança desses agentes não foi estabelecida em relação à injeção intratecal, intencional ou acidental.

O Xylestesin® com epinefrina contém metabissulfito de sódio, um sulfito que pode causar um tipo de reação alérgica incluindo sintomas anafiláticos e episódios asmáticos com risco de vida, ou mais moderados, em pacientes susceptíveis.

A total prevalência da sensibilidade ao sulfito na população em geral é desconhecida e provavelmente baixa. Frequentemente, a sensibilidade ao sulfito aparece mais em pessoas asmáticas do que em não asmáticas.

USO NAS REGIÕES DA CABEÇA E PESCOÇO: Pequenas doses injetadas de anestésico local em regiões da cabeça e pescoço, incluindo bloqueio retrobulbar, dental e gânglio estrelado, podem produzir reações adversas similares à toxicidade sistêmica observada com injeções intravasculares não intencionais de grandes doses. Confusão, convulsão, cegueira temporária, depressão respiratória e/ou parada respiratória e estimulação ou depressão cardiovascular têm sido relatados. Estas reações podem ser devido a injeção intra-arterial do anestésico local com fluxo retrógrado na circulação cerebral. Os pacientes que recebem estes bloqueios devem ter sua circulação e respiração monitoradas e serem constantemente observados. Equipamento de ressuscitação e pessoal treinado para tratamento das reações adversas devem estar imediatamente disponíveis. As doses recomendadas não devem ser excedidas. (Ver Posologia).

CARCINOGENICIDADE, MUTAGENICIDADE E DIMINUIÇÃO DA FERTILIDADE: Não foram realizados estudos de lidocaína em animais para a avaliação do potencial carcinogênico e mutagênico, bem como do efeito na fertilidade.

GRAVIDEZ: Categoria B

Efeitos teratogênicos: Os estudos de reprodução têm sido realizados em ratos com doses até 6,6 vezes maiores que a dose humana e não revelaram evidências de danos ao feto causados pela lidocaína. Entretanto, não existem estudos adequados e bem controlados em mulheres grávidas.

Os estudos em reprodução animal nem sempre são úteis para reproduzir as respostas humanas. Considerações gerais devem ser levadas em conta antes da administração da lidocaína em mulheres com potencial de gravidez, especialmente aquelas em início de gravidez quando ocorre a organogênese máxima.

TRABALHO DE PARTO E PARTO: Os anestésicos locais atravessam rapidamente a placenta e quando usados para a anestesia peridural, paracervical, bloqueio do pudendo ou bloqueio caudal, podem causar intensidades variáveis de toxicidade materna, fetal e no recém-nascido. O potencial tóxico depende do procedimento realizado, do tipo e quantidade da droga usada e técnica da administração da droga. As reações adversas na parturiente, feto e recém-nascido envolvem alterações no tônus vascular periférico do sistema nervoso central e na função cardíaca. A hipotensão materna é uma consequência da anestesia regional. Os anestésicos locais produzem vasodilatação por bloqueio dos nervos simpáticos.

A elevação dos membros inferiores e o decúbito lateral esquerdo da paciente ajudam a prevenir a queda na pressão sanguínea.

O ritmo cardíaco fetal também deve ser monitorado constantemente, e o monitoramento eletrônico fetal é muito aconselhável.

A anestesia peridural, espinal, paracervical ou bloqueio dos pudendos, pode alterar as contrações durante o trabalho de parto por mudanças na contratilidade uterina ou na força de expulsão.

Em um estudo do bloqueio anestésico paracervical foi associada uma diminuição na duração média do primeiro estágio do trabalho de parto e facilidade da dilatação cervical.

Entretanto, a anestesia espinal e peridural tem demonstrado prolongar o segundo estágio do trabalho de parto, removendo o reflexo de expulsão ou por interferência da função motora. O uso de anestésicos em obstetrícia pode aumentar a necessidade de fórceps.

Após o uso de anestésicos locais durante o trabalho de parto e parto pode ocorrer diminuição da força e tônus muscular durante o primeiro ou segundo dia de vida do recém-nascido.

É desconhecida a importância destes efeitos permanecerem por longos períodos. Pode ocorrer bradicardia fetal em 20% a 30% das pacientes que receberam anestesia por bloqueio através do nervo paracervical, com anestésicos locais do tipo amida, podendo estar associada com a acidose fetal.

O ritmo cardíaco fetal deve ser sempre monitorado durante a anestesia paracervical.

O médico deve analisar o potencial de risco-benefício no bloqueio paracervical em partos prematuros, toxemia da gestante e perigo fetal.

A observação das doses recomendadas é de máxima importância em bloqueio paracervical obstétrico.

Insucessos na obtenção de analgesia adequada com a dosagem recomendada deve levar à suspeita de injeção intravascular ou intracraniana fetal.

Casos de injeção não intencional intracraniana fetal, de solução anestésica local, têm sido relatados após bloqueio paracervical ou dos pudendos ou ambos.

Os bebês assim afetados apresentam depressão neonatal inexplicável imediatamente após o nascimento, que pode estar relacionada com altos níveis séricos de anestésico local, e muitas vezes manifestam apoplexia dentro de 6 horas.

O imediato uso de medidas de suporte combinado com a excreção urinária forçada do anestésico local, têm sido usados com sucesso para o controle desta complicação.

Foram relatadas convulsões maternas e colapso cardiovascular após o uso de alguns anestésicos locais para o bloqueio paracervical em gravidez prematura (anestesia para aborto eletivo), lembrando que a absorção sistêmica nestas circunstâncias pode ser rápida. A dose máxima recomendada de cada droga não deve ser excedida.

A injeção deve ser feita lentamente e com freqüente aspiração. Deve haver intervalo de 5 minutos, entre os lados.

AMAMENTAÇÃO: Da mesma forma que outros anestésicos locais, a lidocaína é excretada pelo leite materno, porém em pequenas quantidades, de tal modo que geralmente não há riscos para a criança, quando utilizada nas doses terapêuticas.

USO PEDIÁTRICO: Dosagens em crianças devem ser reduzidas, correspondentes a idade, peso corporal e condições físicas. (Ver Posologia).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração de soluções anestésicas locais contendo epinefrina ou norepinefrina a pacientes que estejam recebendo inibidores da monoaminoxidase ou antidepressivos tricíclicos, pode produzir hipertensão grave ou prolongada.

As fenotiazinas e as butirofenonas podem reduzir ou reverter o efeito pressor da epinefrina.

O uso simultâneo destes agentes deverá ser evitado. Nas situações em que a terapia simultânea for necessária, será essencial um cuidadoso monitoramento do paciente.

A administração simultânea de drogas vasopressoras, para o tratamento da hipotensão relacionada aos bloqueios obstétricos e de drogas ocitócicas do tipo Ergot, poderá causar hipertensão grave e persistente ou acidentes cerebrovasculares.

ALTERAÇÕES DE EXAMES LABORATORIAIS: A Injeção intramuscular de lidocaína pode resultar no aumento do nível de creatinina fosfoquinase. Portanto, o uso da determinação desta enzima sem separação da isoenzima, como teste de diagnóstico para a presença de infarto agudo do miocárdio, pode ficar comprometido pela injeção intramuscular de lidocaína.

“Informe ao seu médico ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento.”

“Não use medicamentos sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para sua saúde.”

5. ONDE, COMO E POR QUANTO TEMPO POSSO GUARDAR ESTE MEDICAMENTO?

Conservar o produto com vasoconstritor em temperatura ambiente controlada, entre 15 e 25°C, protegido da luz. O produto sem vasoconstritor deve ser conservado em temperatura ambiente, entre 15 e 30°C, protegido da luz. Não congelar.

O prazo de validade do produto é de 18 meses para a solução com vasoconstritor e de 36 meses para sem vasoconstritor. Após este prazo de validade o produto pode não apresentar mais efeito terapêutico. Não utilize medicamento vencido.

Os produtos parenterais deverão ser examinados visualmente quanto à presença de partículas estranhas e de alteração da cor do produto antes da administração. Não usar o produto se este contiver precipitado ou se sua coloração estiver rosada ou mais escura que levemente amarelada.

O produto com vasoconstritor não deve ser autoclavado por calor úmido e/ou seco, sob risco de decomposição da epinefrina.

Agentes desinfetantes contendo metais pesados, que causem liberação dos respectivos íons (mercúrio, zinco, cobre, etc.) não devem ser usados na desinfecção da pele ou membranas mucosas, pois têm sido relatadas incidências de inchaço e edema.

A solução não deve ser mantida em contato com metais, porque o anestésico local promove a ionização do metal, liberando íons na solução, os quais podem ocasionar irritação tissular no local da injeção.

“Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.”

“Não use medicamento com o prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original.”

Características físicas e organolépticas:

Solução límpida, essencialmente livre de partículas estranhas

“Antes de usar, observe o aspecto do medicamento. Caso ele esteja no prazo de validade e você observe alguma mudança no aspecto, consulte o farmacêutico para saber se poderá utilizá-lo.”

“Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.”

NO SENTIDO DE EVITAR ACIDENTES, NÃO SE RECOMENDA UTILIZAR FRASCOS VAZIOS DE SOLUÇÕES ANESTÉSICAS PARA ARMAZENAR QUAISQUER OUTRAS SOLUÇÕES, AINDA QUE TEMPORARIAMENTE.

É RECOMENDÁVEL ESVAZIAR E DESCARTAR FRASCOS PARCIALMENTE UTILIZADOS.

6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

A Tabela de Dosagens Recomendadas, abaixo, resume os volumes e concentrações de cloridrato de lidocaína para os vários tipos de procedimentos anestésicos. As dosagens sugeridas nesta tabela são para adultos normais saudáveis e refere-se ao uso de solução sem vasoconstritor.

Quando grandes volumes são necessários, somente soluções com vasoconstritor devem ser usadas, exceto naqueles casos em que as drogas vasopressoras são contra-indicadas.

Estas doses recomendadas servem somente como guia para a quantidade de anestésico necessária na maioria dos procedimentos de rotina. Os volumes e concentrações reais a serem usadas, depende de fatores tais como, o tipo e extensão do procedimento cirúrgico, intensidade da anestesia e extensão do relaxamento muscular necessário, duração necessária da anestesia e da condição física do paciente. Em todos os casos devem ser adotadas a mais baixa concentração e a menor dose que produzam os resultados desejáveis. As dosagens devem ser reduzidas para crianças, para pacientes idosos e debilitados e para pacientes com doenças cardíacas e/ou hepáticas.

O início da anestesia, a duração da anestesia e a extensão do relaxamento muscular são proporcionais ao volume e concentração (dose total) do anestésico local usado.

Portanto, o aumento de concentração e volume do injetável de cloridrato de lidocaína, diminui o tempo de início da anestesia, prolonga a duração da anestesia, promove uma grande extensão do relaxamento muscular e aumenta a expansão segmentar da anestesia.

Entretanto, aumentando o volume e concentração do cloridrato de lidocaína, pode resultar numa profunda queda de pressão sanguínea quando usado em anestesia peridural.

Embora a incidência de outros efeitos com lidocaína seja muito baixa, deve ser executado com cautela o emprego de grandes volumes e concentrações, visto que a incidência de outros efeitos é diretamente proporcional à dose total do agente anestésico local injetado.

Dosagens Recomendadas da Solução Injetável de cloridrato de lidocaína sem vasoconstritor (sem epinefrina)

INFILTRAÇÃO

Infiltração Percutânea: concentração: 0,5 ou 1,0 %; volume 1 a 60mL; dose total 5 a 300mg

Infiltração Regional Intravenosa: concentração: 0,5%; volume 10 a 60mL; dose total 50 a 300mg

Bloqueio Nervoso Periférico Braquial: concentração: 1,5 %; volume 15 a 20mL; dose total 225 a 300mg

Bloqueio Nervoso Periférico Dental: concentração: 2,0 %; volume 1 a 5mL; dose total 20 a 100mg

Bloqueio Nervoso Periférico Intercostal: concentração: 1,0 %; volume 3mL; dose total 30mg

Bloqueio Nervoso Periférico Paravertebral: concentração: 1,0 %; volume 3 a 5mL; dose total 30 a 50mg

Bloqueio Nervoso Periférico Pudendo (de cada lado): concentração: 1,0 %; volume 10mL; dose total 100mg

PARACERVICAL

Analgesia Obstétrica (de cada lado): concentração: 1,0 %; volume 10mL; dose total 100mg

BLOQUEIO NEURAL SIMPÁTICO

Cervical (gânglio estrelado): concentração: 1,0 %; volume 5mL; dose total 50mg

Lobar: concentração: 1,0 %; volume 5 a 10mL; dose total 50 a 100mg

BLOQUEIO NEURAL CENTRAL

Peridural* Torácico: concentração: 1,0 %; volume 20 a 30mL; dose total 200 a 300mg

Peridural* Lombar: concentração: 1,0 %; volume 25 a 30mL; dose total 250 a 300mg

Peridural* Analgesia: concentração: 1,5 %; volume 15 a 20mL; dose total 225 a 300mg

Peridural* Anestesia: concentração: 2,0 %; volume 10 a 15mL; dose total 200 a 300mg

Caudal Analgesia Obstétrica: concentração: 1,0 %; volume 20 a 30mL; dose total 200 a 300mg

Caudal Analgesia Cirúrgica: concentração: 1,5 %; volume 15 a 20mL; dose total 225 a 300mg

* A dose é determinada pelo número de dermatômos a serem anestesiados (2 a 3 mL/dermatômo).

Observação: As concentrações e volumes sugeridos servem somente como um guia. Outros volumes e concentrações podem ser usados contanto que as doses máximas recomendadas não sejam excedidas.

ANESTESIA PERIDURAL:

Para anestesia peridural, são recomendados:

1% com epinefrina 1: 200.000 até 30 mL de solução injetável de **Xylestesin**[®].

2% com epinefrina 1: 200.000 até 20 mL de solução injetável de **Xylestesin**[®].

Na anestesia peridural, várias dosagens com números de dermatômos são anestesiados (geralmente 2 a 3 mL da concentração indicada por dermatômo).

BLOQUEIO PERIDURAL CAUDAL E LOMBAR:

Como precaução para possíveis reações adversas, observadas quando da perfuração não intencional no espaço subaracnóideo, uma dose teste de 2 a 3 mL de cloridrato de lidocaína a 1,5% deve ser administrada durante no mínimo 5 minutos antes da injeção do volume total necessário para o bloqueio peridural lombar ou caudal. A dose teste deve ser repetida em pacientes em que houve deslocamento do cateter.

A epinefrina, se contida na dose teste (10 a 15 µg têm sido sugeridos), pode servir como precaução de injeção intravascular não intencional.

Se injetado dentro do vaso sanguíneo, esta quantidade de epinefrina produz uma transitória “reação epinefrina” dentro de 45 segundos, consistindo no aumento do batimento cardíaco e pressão sanguínea sistólica, palidez perioral, palpitação e inquietação no paciente não sedado.

O paciente sedado pode exibir somente um aumento na pulsação de 20 ou mais batimentos por minuto por 15 ou mais segundos.

Pacientes sob a ação de betabloqueadores podem não manifestar alterações no batimento cardíaco, mas a pressão sanguínea monitorada pode detectar um aumento leve da pressão sanguínea sistólica. Deve-se aguardar um tempo adequado para o início da anestesia após a administração de cada dose teste.

A injeção rápida de grandes volumes de **Xylestesin**[®] com vasoconstritor através de cateter deve ser evitada, e quando praticada, as doses devem ser fracionadas.

No caso de injeção conhecida de grande volume de solução de anestésico local dentro do espaço subaracnóideo, após adequada ressuscitação e se o cateter estiver posicionado, considerar a recuperação da droga por drenagem em quantidade moderada do líquor (cerca de 10 mL) através do cateter peridural.

DOSAGENS MÁXIMAS RECOMENDADAS:

• **Adultos:** Para adultos normais saudáveis, a dose máxima individual recomendada de cloridrato de lidocaína com epinefrina não deve exceder 7 mg/kg de peso corporal e em geral é recomendado que a dose máxima total não exceda 500 mg. Quando usada sem epinefrina, a dose máxima individual não deve exceder 4,5 mg/kg do peso corporal e em geral recomenda-se que a dose máxima total não exceda 300 mg.

Para anestesia peridural ou caudal contínua, a dose máxima recomendada não deve ser administrada em intervalos menores que 90 minutos.

Quando anestesia peridural lombar ou caudal contínua for usada para procedimentos não obstétricos, uma quantidade maior de droga pode ser administrada para a produção adequada de anestesia.

A dose máxima recomendada por um período de 90 minutos de cloridrato de lidocaína para bloqueio paracervical em pacientes obstétricos e não-obstétricos é de 200 mg.

Usualmente aplicam-se 50% da dose total em cada lado. Injetar lentamente esperando 5 minutos para cada lado.

• **Crianças:** É difícil a recomendação de dose máxima sobre qualquer droga para crianças, pelas variações em função da idade e peso. Para crianças com mais de 3 anos de idade que tenham uma massa corporal normal sem gordura e desenvolvimento normal do corpo, a dose máxima recomendada é determinada pela idade e o peso da criança. Por exemplo, para uma criança com 5 anos pesando cerca de 25 kg, a dose de cloridrato de lidocaína não deve exceder 75 a 100 mg (3,0 a 4,0 mg/kg).

Na prevenção contra toxicidade sistêmica, apenas pequenas concentrações e doses efetivas devem ser as usadas. Em alguns casos será necessário ter disponíveis concentrações diluídas com 0,9% de cloreto de sódio injetável para obter concentrações finais necessárias.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento. Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

“Siga corretamente o modo de usar. Em caso de dúvidas sobre este medicamento, procure orientação do farmacêutico. Não desaparecendo os sintomas, procure orientação de seu médico ou cirurgião-dentista.”

7. O QUE DEVO FAZER QUANDO EU ME ESQUECER DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

Uma vez que este medicamento é administrado por um profissional da saúde em ambiente hospitalar não deverá ocorrer esquecimento do seu uso.

“Em caso de dúvidas, procure orientação do farmacêutico ou de seu médico, ou cirurgião-dentista.”

8. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE ME CAUSAR?

SISTÊMICOS: As reações adversas após a administração de lidocaína são de natureza similar às aquelas observadas com outros agentes anestésicos locais do tipo amida. Estas reações adversas são, em geral, dose-relacionadas, podendo resultar de altos níveis plasmáticos, causados por dosagem excessiva, rápida absorção ou injeção intravascular acidental, podendo ainda resultar da hipersensibilidade, idiossincrasia ou da tolerância diminuída por parte do paciente. As reações adversas graves são geralmente de natureza sistêmica. Os tipos de reações adversas mais frequentemente relatados são os seguintes:

SISTEMA NERVOSO CENTRAL: As manifestações do SNC são excitatórias e/ou depressoras e podem ser caracterizadas por crises de ausência, nervosismo, apreensão, euforia, confusão, vertigem, sonolência, zumbido, visão nebulosa ou dupla, vômitos, sensação de calor, frio ou entorpecimento, contrações, tremores, convulsões, inconsciência, depressão e parada respiratória. As manifestações excitatórias podem ser muito breves, ou podem não ocorrer, sendo que a primeira manifestação de toxicidade poderá ser a sonolência progredindo para inconsciência e parada respiratória.

A sonolência após a administração da lidocaína é normalmente um sinal precoce de alto nível sanguíneo da droga, podendo ocorrer como consequência de sua rápida absorção.

SISTEMA CARDIOVASCULAR: Manifestações cardiovasculares são normalmente depressivas, caracterizadas por bradicardia, hipotensão e colapso cardiovascular, podendo resultar em parada cardíaca.

ALÉRGICAS: As reações alérgicas são caracterizadas por lesões cutâneas, urticária, edema ou reações anafilactóides. As reações alérgicas podem ser resultantes da sensibilidade ao agente anestésico local, aos bissulfitos ou ao metilparabeno usado como conservante em frascos de múltiplas doses. As reações alérgicas resultantes da sensibilidade à lidocaína são extremamente raras e quando ocorrem devem ser monitoradas por meios convencionais. A detecção da sensibilidade por testes na pele é de valor duvidoso.

NEUROLÓGICAS: As incidências de reações adversas associadas ao uso de anestésicos locais podem estar relacionadas à dose total administrada e dependem também da particularidade da droga usada, a via de administração e o estado físico do paciente.

Em estudo realizado com 10.440 pacientes que receberam lidocaína para anestesia espinal, a incidência de reações adversas relatadas foi de cerca de 3% para dor de cabeça postural, hipotensão e dor nas costas; 2% para tremores e menos que 1 % para sintomas nervosos periféricos, náusea, respiração inadequada e visão dupla. Muitas dessas observações podem estar relacionadas com a técnica anestésica usada, com ou sem a contribuição do anestésico local.

Na prática do bloqueio peridural caudal ou lombar pode ocorrer introdução não intencional no espaço subaracnóideo pelo cateter. Subseqüentes reações adversas podem depender particularmente da quantidade de droga administrada no espaço subaracnóideo. Isto pode incluir bloqueio espinal de grandeza variada (incluindo bloqueio espinal total), hipotensão secundária ao bloqueio espinal, perda do controle da bexiga e intestino, e perda da sensação perineal e função sexual. A persistente deficiência motora, sensorial e/ou autonômica (controle do esfíncter) de alguns segmentos espinais inferiores, com lenta recuperação (vários meses) ou incompleta recuperação, têm sido relatado raramente, quando da realização de bloqueio peridural caudal ou lombar. Dores nas costas e cefaléia têm sido observadas na utilização destes procedimentos anestésicos.

Há relatos de casos permanentes de lesões na musculatura extraocular, necessitando de cirurgia reparatória devido à administração retrobulbar.

“Informe ao seu médico, cirurgião-dentista ou farmacêutico o aparecimento de reações indesejáveis pelo uso do medicamento. Informe também à empresa através do seu serviço de atendimento.”

9. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA QUANTIDADE MAIOR DO QUE A INDICADA DESTE MEDICAMENTO?

As emergências decorrentes da administração de anestésicos locais estão geralmente relacionadas com altos níveis plasmáticos encontrados durante o uso terapêutico dos anestésicos locais, ou à injeção acidental subaracnóidea da solução anestésica.

CONDUTA NAS EMERGÊNCIAS PROVOCADAS POR ANESTÉSICOS LOCAIS

A primeira consideração é a prevenção, através de cuidadoso e constante monitoramento dos sinais vitais respiratórios e cardiovasculares, e do estado de consciência do paciente, após cada injeção do anestésico local. Ao primeiro sinal de alteração, deverá ser prontamente administrado oxigênio.

O primeiro passo no controle das convulsões, como também da hipoventilação ou apnéia decorrentes da injeção não intencional no espaço subaracnóideo, consiste no estabelecimento imediato de acesso para a manutenção das vias aéreas e de uma ventilação assistida e efetiva com oxigênio, com um sistema de liberação capaz de permitir uma pressão positiva e imediata das vias aéreas por meio do uso de máscara.

Imediatamente após a instituição dessas medidas ventilatórias, deverá ser avaliada a adequação circulatória, mantendo sempre em mente que as drogas comumente usadas para tratar as convulsões, algumas vezes deprimem a circulação quando injetadas intravenosamente.

Caso as convulsões persistam após a instituição de suporte respiratório e se o estado circulatório assim o permitir, poderão ser administrados, por via intravenosa, pequenas quantidades de barbitúricos (como tiopentona 1-3 mg/kg) de ação ultra-curta, ou um benzodiazepínico do tipo diazepam (0,1 mg/kg). O médico deverá estar familiarizado com o uso dos anestésicos locais em conjunto com essas drogas, antes de usá-las.

Se ocorrer fibrilação ventricular ou parada cardíaca, deve-se instituir tratamento de ressuscitação cardiopulmonar. O tratamento de suporte da depressão circulatória poderá necessitar de administração de fluidos por via intravenosa, e quando apropriado, um vasopressor segundo a necessidade da situação clínica.

Se não tratadas imediatamente, tanto as convulsões como a depressão cardiovascular poderão resultar em hipoxia, acidose, bradicardia, arritmias e parada cardíaca.

Uma hipoventilação ou apnéia, decorrentes da injeção subaracnóidea não intencional, pode produzir os mesmos sintomas, e também levar a uma parada cardíaca caso o suporte de ventilação não seja instituído.

A intubação endotraqueal, empregando drogas e técnicas familiares ao clínico, poderá ser indicada após administração inicial de oxigênio através de máscara, e também no caso de haver dificuldade na manutenção das vias aéreas do paciente, ou quando o suporte ventilatório prolongado, assistido ou controlado, esteja indicado.

A diálise é de pouco valor no tratamento de superdosagem aguda com lidocaína.

As emergências decorrentes da administração de anestésicos locais estão geralmente relacionadas com altos níveis plasmáticos encontrados durante o uso terapêutico dos anestésicos locais, ou à injeção acidental subaracnóidea da solução anestésica.

CONDUTA NAS EMERGÊNCIAS PROVOCADAS POR ANESTÉSICOS LOCAIS:

A primeira consideração é a prevenção, através de cuidadoso e constante monitoramento dos sinais vitais respiratórios e cardiovasculares, e do estado de consciência do paciente, após cada injeção do anestésico local. Ao primeiro sinal de alteração, deverá ser prontamente administrado oxigênio.

O primeiro passo no controle das convulsões, como também da hipoventilação ou apnéia decorrentes da injeção não intencional no espaço subaracnóideo, consiste no estabelecimento imediato de acesso para a manutenção das vias aéreas e de uma ventilação assistida e efetiva com oxigênio, com um sistema de liberação capaz de permitir uma pressão positiva e imediata das vias aéreas por meio do uso de máscara.

Imediatamente após a instituição dessas medidas ventilatórias, deverá ser avaliada a adequação circulatória, mantendo sempre em mente que as drogas comumente usadas para tratar as convulsões, algumas vezes deprimem a circulação quando injetadas intravenosamente.

Caso as convulsões persistam após a instituição de suporte respiratório e se o estado circulatório assim o permitir, poderão ser administrados, por via intravenosa, pequenas quantidades de barbitúricos (como tiopentona 1-3 mg/kg) de ação ultra-curta, ou um benzodiazepínico do tipo diazepam (0,1 mg/kg). O médico deverá estar familiarizado com o uso dos anestésicos locais em conjunto com essas drogas, antes de usá-las.

Se ocorrer fibrilação ventricular ou parada cardíaca, deve-se instituir tratamento de ressuscitação cardiopulmonar. O tratamento de suporte da depressão circulatória poderá necessitar de administração de fluidos por via intravenosa, e quando apropriado, um vasopressor segundo a necessidade da situação clínica.

Se não tratadas imediatamente, tanto as convulsões como a depressão cardiovascular poderão resultar em hipoxia, acidose, bradicardia, arritmias e parada cardíaca.

Uma hipoventilação ou apnéia, decorrentes da injeção subaracnóidea não intencional, pode produzir os mesmos sintomas, e também levar a uma parada cardíaca caso o suporte de ventilação não seja instituído. A intubação endotraqueal, empregando drogas e técnicas familiares ao clínico, poderá ser indicada após administração inicial de oxigênio através de máscara, e também no caso de haver dificuldade na manutenção das vias aéreas do paciente, ou quando o suporte ventilatório prolongado, assistido ou controlado, esteja indicado. A diálise é de pouco valor no tratamento de superdosagem aguda com lidocaína.

“Em caso de uso de grande quantidade deste medicamento, procure rapidamente socorro médico e leve a embalagem ou a bula do medicamento, se possível. Ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.”

III – DIZERES LEGAIS

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA USO RESTRITO A HOSPITAIS

MS nº 1.0298.0072 (com vasoconstritor)

MS nº 1.0298.0357 (sem vasoconstritor)

Farm. Resp.: Dr. José Carlos Módolo CRF-SP N.º 10.446

CRISTÁLIA Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Rodovia Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira-SP

CNPJ N.º 44.734.671/0001-51

“Indústria Brasileira”

Nº do lote, data de fabricação e prazo de validade: vide rótulo

SAC (Serviço de Atendimento ao Cliente): **0800 701 19 18**

“Esta bula foi aprovada pela Anvisa em (26/06/2014)”



Anexo B

Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Número do Expediente	Assunto	Data do expediente	Número do Expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP / VPS)	Apresentações relacionadas
26/06/2014		10450- SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	26/06/2014	-----	-----	10450- SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP e VPS	<u>Sem vasoconstritor</u> <ul style="list-style-type: none"> • 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL • 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados • 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL • 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados <u>Com vasoconstritor</u> <ul style="list-style-type: none"> • 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL • 1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados • 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL • 2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizado

Xylestesin[®]

Sem Vasoconstritor - cloridrato de lidocaína - 2,0%

**Com Vasoconstritor - cloridrato de lidocaína - 2,0% + hemitartarato de
norepinefrina (1:50.000 em norepinefrina)**

Solução Injetável, na apresentação Carpule

Cristália Produtos Químicos e Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® 2% sem vasoconstritor
cloridrato de lidocaína

Xylestesin® 2% com vasoconstritor
cloridrato de lidocaína + hemitartrato de norepinefrina

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

• Solução injetável sem vasoconstritor

Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL

• Solução injetável com norepinefrina 1:50.000

Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL

USO INJETÁVEL – PARA USO EM ANESTESIA REGIONAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO COM VASOCONSTRITOR

Cada mL contém:

cloridrato de lidocaína 20 mg

hemitartrato de norepinefrina (equivalente a 0,02 mg de norepinefrina)..... 0,04 mg

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

(Veículo **com vasoconstritor**: edetato dissódico, bicarbonato de sódio, cloreto de sódio, metabissulfito de sódio, metilparabeno e água para injetáveis).

Observação: cada carpule de Xylestesin® 2% com norepinefrina contém 36 mg de cloridrato de lidocaína e 0,072 mg de hemitartrato de norepinefrina (equivalente a 0,036 mg de norepinefrina)

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR

Cada mL contém:

cloridrato de lidocaína 20 mg

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

(Veículo **sem vasoconstritor**: cloreto de sódio, metilparabeno, hidróxido de sódio e água para injetáveis).

Observação: Cada carpule de Xylestesin® 2% sem vasoconstritor contém 36 mg de cloridrato de lidocaína

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O Xylestesin® 2% carpules é indicado para anestesia local em odontologia e pequenas cirurgias.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

O Xylestesin® 2% (cloridrato de lidocaína) com e sem vasoconstritor, na forma de carpules, é o anestésico odontológico mais usado devido às suas excepcionais propriedades como latência extremamente curta, grande margem de segurança e excelente tolerância clínica, local e sistêmica.

O Xylestesin® 2% (cloridrato de lidocaína), sendo um anestésico local, impede ao mesmo tempo a origem e a condução do impulso nervoso. Seu principal local de ação encontra-se na membrana celular e, aparentemente, há pouca atividade sobre a importância fisiológica na exoplasmática.

O Xylestesin® 2% bloqueia a condução do impulso nervoso por meio da interferência no processo fundamental de origem do potencial de ação do nervo, principalmente o grande aumento transitório da permeabilidade da membrana aos íons sódio produzido por leve despolarização da membrana. À medida que a ação anestésica progride num nervo, o limiar para a excitabilidade elétrica aumenta gradualmente e o fator de segurança para a condução diminui. Sendo esta ação suficientemente intensa, dá-se o bloqueio da condução.

A duração do anestésico local é proporcional ao tempo em que o anestésico se encontra em contato com os tecidos nervosos. Portanto, os processos que contribuem para localizar o medicamento no nervo concorrem para prolongar acentuadamente a duração da anestesia. Na prática clínica, a injeção de um anestésico local é geralmente acompanhada de adrenalina (1:100.000) ou de um congênera. Deste modo a adrenalina diminui a velocidade de absorção e condiciona a velocidade de sua destruição para marchar e passar com a velocidade com que é absorvida pela circulação sanguínea. O início da ação ocorre dentro de 1 a 3 minutos após a infiltração. Duração de ação: 2 a 4 horas com norepinefrina e 1 a 1 ½ hora sem vasoconstritor.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou aos outros componentes da fórmula. A norepinefrina é contraindicada em pacientes com tireotoxicose (excesso de hormônio tireoidiano seja produzido pela glândula tireoide ou não) ou doença cardíaca grave, particularmente quando a taquicardia está presente. Deve-se evitar o uso de norepinefrina em anestésias nas áreas do corpo supridas por artérias finais ou com comprometimento do suprimento sanguíneo como dedos, nariz, ouvido externo, pênis, etc.

4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

O produto com norepinefrina contém metabissulfito de sódio, o qual pode causar reações alérgicas tais como choque anafilático, crise asmática e urticária (reação cutânea alérgica, acompanhada de prurido intenso).

A sensibilidade ao sulfito é observada mais frequentemente em pessoas asmáticas. Os anestésicos locais do tipo amida são metabolizados pelo fígado. Assim, devem ser utilizados com cuidado, especialmente em doses repetidas e em pacientes com hepatopatias (doenças do fígado). Pequenas doses de anestésicos locais injetados na área da cabeça e pescoço, incluindo bloqueio retrobulbar, dental e gânglio estrelado, podem causar reações adversas similares à toxicidade sistêmica observada com injeção intravascular acidental em altas doses. Os médicos que realizam bloqueio retrobulbar devem estar informados de que existem relatos de parada cardiorrespiratória após a injeção do anestésico local. Dessa maneira, antes do bloqueio retrobulbar deve-se verificar a disponibilidade de equipamentos necessários, medicamentos e pessoal, como para outros procedimentos regionais.

Uso na Gravidez e Lactação: A lidocaína atravessa a barreira placentária e as concentrações umbilicais são menores que a encontrada na circulação materna. Pode-se assumir que a lidocaína tem sido administrada a um grande número de mulheres grávidas ou que possam vir a engravidar. Não foram relatados distúrbios específicos no processo reprodutivo, como, por exemplo, um aumento na incidência de malformações ou efeitos nocivos diretos ou indiretos no feto. A lidocaína passa para o leite materno, mas em pequenas quantidades e, geralmente, não há risco de afetar a criança nas doses terapêuticas. Como para qualquer outra droga, a lidocaína deve somente ser usada durante a gravidez ou lactação a critério médico.

Uso em Pacientes Idosos: Pacientes idosos são especialmente sensíveis aos efeitos de anestésicos parenterais locais. Por esta razão, possuem maior probabilidade de desenvolverem efeitos adversos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS:

A lidocaína deve ser usada com cuidado em pacientes tratados com antiarrítmicos, como a tocainida, pois os efeitos tóxicos são aditivos, bem como em pacientes usando betabloqueadores, cimetidina e digitálicos. As soluções que contém norepinefrina devem ser usadas com extremo cuidado em pacientes recebendo inibidores da MAO ou antidepressivos tricíclicos, pois podem provocar hipertensão prolongada.

O uso concomitante de drogas vasopressoras e drogas ocitócicas do tipo ergot (droga obtida a partir de um fungo, *Claviceps purpurea*.) pode causar hipertensão grave persistente ou acidentes cerebrovasculares.

Fenotiazínicos e butirofenonas podem reduzir ou reverter o efeito pressor da norepinefrina. Arritmias cardíacas graves podem ocorrer se preparações contendo um vasoconstritor, como a norepinefrina, são empregadas durante ou após a administração de anestésicos inalatórios como halotano e ciclopropano.

Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento.
Não use medicamentos sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para sua saúde.

5. ONDE, COMO E POR QUANTO TEMPO POSSO GUARDAR ESTE MEDICAMENTO?

O produto com vasoconstritor deve ser conservado em temperatura ambiente controlada, entre 15 e 25°C, protegido da luz. O produto sem vasoconstritor deve ser conservado em temperatura ambiente, entre 15 e 30°C, protegido da luz.

Seu prazo de validade é de 24 meses para o produto com norepinefrina, e de 36 meses para o produto sem vasoconstritor, a partir da data de fabricação. Após este prazo de validade o produto pode não apresentar mais efeito terapêutico. Não utilize medicamento vencido.

Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.

Não use medicamento com o prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original.

Características físicas e organolépticas:

Solução incolor, límpida e isenta de partículas estranhas.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Caso você observe alguma mudança no aspecto do medicamento que ainda esteja no prazo de validade, consulte o médico ou o farmacêutico para saber se poderá utilizá-lo.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Posologia para Anestesia Terminal

Bloqueio: 1,5 a 1,8 mL

Cirurgia: 3 a 5 mL

Doses Máximas Permitidas:

Xylestesin® 2% com vaso: 7mg/Kg (limite máximo de 14 carpules)

Xylestesin® 2% sem vaso: 4mg/Kg (limite máximo de 06 carpules)

Se ocorrerem sintomas tóxicos leves, a injeção deve ser interrompida imediatamente. Deve-se administrar a menor dose que produz o efeito desejado. A dose deve ser reduzida em crianças, idosos, pacientes debilitados e em pacientes com cardiopatias e hepatopatias.

Na rotina deve-se usar **Xylestesin® 2%** com norepinefrina 1:50.000.

O **Xylestesin® 2%** sem vasoconstritor deve ser reservado para uso em cardíacos e na tireotoxicose e quando há sensibilidade à norepinefrina.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento. Não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

7. O QUE DEVO FAZER QUANDO EU ME ESQUECER DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

Uma vez que este medicamento é administrado por um profissional da saúde em ambiente hospitalar não deverá ocorrer esquecimento do seu uso.

Em caso de dúvidas, procure orientação do farmacêutico ou de seu médico, ou cirurgião-dentista.

8. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE ME CAUSAR?

Reações adversas sistêmicas graves são raras, mas podem ocorrer na superdosagem ou com injeção intravascular acidental. A toxicidade causada pela lidocaína é similar à observada com outros agentes anestésicos locais. A acidose (acidez excessiva dos líquidos corporais, em decorrência de um acúmulo de ácidos) acentuada ou hipóxia (deficiência de oxigênio) podem aumentar o risco e a gravidade das reações tóxicas.

Sistema Nervoso

A incidência de reações adversas neurológicas associadas com o uso de anestésicos locais é muito baixa e pode ser em função da dose letal administrada e também dependente da droga utilizada, via de administração e estado físico do paciente. Muitos destes efeitos podem estar ligados à técnica da anestesia local, com ou sem participação da droga.

Reações Comuns (ocorre entre 1% e 10% dos pacientes que utilizam este medicamento): sonolência, vertigem.

Reações com frequência desconhecida: As reações do sistema nervoso central incluem dormência na língua, delírio, tonturas, visão turva, tremores, convulsões, inconsciência e, possivelmente, parada respiratória, parestesia (sensação de dormência, formigamento), fraqueza, paralisia dos membros inferiores e perda do controle esfinteriano.

Sistema Cardiovascular

Reações Comuns (ocorre entre 1% e 10% dos pacientes que utilizam este medicamento): hipotensão.

Reações com frequência desconhecida: depressão do miocárdio, diminuição do débito cardíaco, bloqueio cardíaco, bradicardia (batimento cardíaco lento frequência de pulso inferior a 60 batimentos por minuto), arritmias ventriculares, incluindo taquicardia ventricular e fibrilação ventricular e parada cardíaca. A hipóxia causada por convulsões e apneia (cessação temporária da respiração) pode ser um fator contribuinte nas reações cardiovasculares.

Raramente têm sido relatadas reações alérgicas (nos casos mais graves, choque anafilático).

Informe ao seu médico, cirurgião-dentista ou farmacêutico o aparecimento de reações indesejáveis pelo uso do medicamento.

Informe a empresa sobre o aparecimento de reações indesejáveis e problemas com este medicamento, entrando em contato através do Sistema de Atendimento ao Consumidor (SAC).

9. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA QUANTIDADE MAIOR DO QUE A INDICADA DESTES MEDICAMENTOS?

Se sinais da toxicidade sistêmica aguda aparecerem, a injeção do anestésico local deve ser interrompida imediatamente.

O tratamento do paciente com manifestações tóxicas consiste em assegurar a oxigenação através da ventilação, controle das convulsões e suporte hemodinâmico.

As convulsões devem ser tratadas através da administração de diazepam intravenoso 0,1 mg/kg ou tiopental sódico 1-3 mg/kg.

Considerando que o tratamento pode também causar depressão respiratória, os meios de manutenção ou controle da ventilação devem estar disponíveis.

O tratamento de suporte da depressão circulatória pode requerer a administração de fluidos intravenosos e, quando apropriado, um vasopressor conforme situação clínica.

Em caso de uso de grande quantidade deste medicamento, procure rapidamente socorro médico e leve a embalagem ou a bula do medicamento, se possível. Ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.

III - DIZERES LEGAIS

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA OU DE CIRURGIÃO DENTISTA EXCLUSIVAMENTE PARA USO PROFISSIONAL

MS n.º 1.0298.0384 (com vasoconstritor)

MS n.º 1.0298.0357 (sem vasoconstritor)

Farm. Resp.: Dr. José Carlos Módolo CRF-SP N.º 10.446

CRISTÁLIA Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Rodovia Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira-SP

CNPJ N.º 44.734.671/0001-51

“Indústria Brasileira”

Nº do lote, data de fabricação e prazo de validade: vide rótulo

SAC (Serviço de Atendimento ao Cliente): 0800 701 19 18

Esta bula foi aprovada pela Anvisa em (10/02/2015)



Anexo B

Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Número do Expediente	Assunto	Data do expediente	Número do Expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP / VPS)	Apresentações relacionadas
26/06/2014		10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	26/06/2014	-----	-----	10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP e VPS	<u>Com</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL <u>Sem</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
10/07/2014	0548611/14-4	10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	10/07/2014			10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	1) Inclusão de definição para terminologia médica do texto; 2) Adequação das reações adversas do item 8. Quais os males este medicamento pode causar?, conforme Resolução 47/2009	VP	<u>Com</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL <u>Sem</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
10/02/2015		10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	10/02/2015			10450–SIMILAR - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	2. Como este medicamento funciona? / 6. Como devo usar este medicamento?	VP	<u>Com</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL <u>Sem</u> <u>Vasoconstritor</u> Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL

Xylestesin[®] geleia 2%

cloridrato de lidocaína

2% (20mg/g) geleia

Cristália Prod. Quím. Farm. Ltda.

MODELO DE BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® Geleia 2% (20mg/g)
cloridrato de lidocaína

APRESENTAÇÕES

Geleia estéril 20 mg/g em embalagens contendo 10 bisnagas de 30g + aplicadores e caixa contendo 10 estojos Sterile-Pack® com seringas pré-enchidas com 10g.

VIA URETRAL (para procedimento urológicos)

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 5 ANOS (vide Posologia)

COMPOSIÇÃO

cloridrato de lidocaína.....20mg

veículo estéril q.s.p.1g

(Veículos: hietelose, metilparabeno, hidróxido de sódio, água para injetáveis).

Cada 5 g de geleia contém 100 mg de cloridrato de lidocaína (equivalente a 81,30 mg de lidocaína).

I - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO É INDICADO?

Xylestesin® Geleia 2% é indicada como anestésico de superfície e lubrificante para a uretra feminina e masculina durante cistoscopia, cateterização, exploração por sonda e outros procedimentos endouretrais, e para o tratamento sintomático da dor em conexão com cistite e uretrite.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

Xylestesin® Geleia 2% é um anestésico local de superfície e lubrificante que causa uma perda temporária de sensibilidade na área onde é aplicada.

Geralmente o início de ação é rápido (dentro de 5 minutos) dependendo da área de aplicação.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Você não deve utilizar **Xylestesin® Geleia 2%** se tiver alergia à lidocaína, a outros anestésicos locais ou aos outros componentes da fórmula.

Xylestesin® Geleia 2% não deve ser utilizada em pacientes com sensibilidade aumentada ao metil ou propilparabeno ou ao seu metabólito, o ácido paraminobenzóico (PABA). Formulações de lidocaína contendo parabenos devem ser evitadas em pacientes alérgicos ao anestésico local éster ou ao seu metabólito PABA.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista.

4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

Doses excessivas de lidocaína ou pequenos intervalos entre as doses podem resultar em níveis plasmáticos altos de lidocaína e reações adversas graves. Os pacientes devem seguir estritamente à posologia indicada pelo médico.

Xylestesin® Geleia 2% deve ser usada com cuidado se a mucosa estiver traumatizada no local da aplicação, em casos de sepse (infecção geral grave do organismo, causada por bactérias) ou choque grave, problemas no coração, fígado ou rins, epilepsia, pacientes idosos e pacientes debilitados.

Xylestesin® Geleia 2% é possivelmente um desencadeador de porfiria e deve ser somente prescrito à pacientes com porfiria aguda em indicações fortes ou urgentes. Precauções apropriadas devem ser tomadas para todos os pacientes porfíricos.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista.

Efeitos sobre a capacidade de dirigir veículos e operar máquinas: dependendo da dose do anestésico local, pode haver um efeito muito leve na função mental e pode prejudicar temporariamente a locomoção e coordenação.

Interações medicamentosas

Xylestesin® Geleia 2% deve ser utilizada com cuidado se você estiver utilizando os seguintes medicamentos: agentes estruturalmente relacionados aos anestésicos locais, medicamentos antiarrítmicos classe III (por exemplo amiodarona), cimetidina e betabloqueadores.

Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento.

Não use medicamento sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para a sua saúde.

5. ONDE, COMO E POR QUANTO TEMPO POSSO GUARDAR ESTE MEDICAMENTO?

Xylestesin® Geleia 2% deve ser conservada em embalagem fechada, em temperatura ambiente, entre 15° e 30°C.

O prazo de validade é de 24 meses a partir da data de fabricação impressa na embalagem.

Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.

Não use medicamento com o prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original.

Como a geleia é estéril, deve ser utilizada apenas uma vez.

Características físicas: geleia incolor isenta de bolhas de ar e partículas estranhas.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento. Caso ele esteja no prazo de validade e você observe alguma mudança no aspecto, consulte o farmacêutico para saber se poderá utilizá-lo.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Xylestesin® Geleia 2% deve ser administrada por via uretral.

A dose necessária de **Xylestesin® Geleia 2%** a ser usada deve ser calculada pelo seu médico.

Xylestesin® Geleia 2% proporciona anestesia imediata e profunda das mucosas, fornecendo anestesia efetiva de longa duração (aproximadamente 20-30 minutos). A anestesia geralmente ocorre rapidamente (dentro de 5 minutos dependendo da área de aplicação).

Como qualquer anestésico local, a segurança e eficácia da lidocaína dependem da dose apropriada, da técnica correta, precauções adequadas e facilidade para emergências.

As seguintes recomendações de dose devem ser consideradas como um guia. A experiência do clínico e conhecimento do estado físico do paciente são importantes para calcular a dose necessária.

As concentrações plasmáticas de lidocaína após a instilação da geleia na uretra intacta e bexiga, em doses de até 800 mg, são razoavelmente baixas e inferiores aos níveis tóxicos.

Em pacientes idosos, pacientes debilitados, pacientes com doenças agudas ou pacientes com sepse, deve-se adequar as doses de acordo com a idade, peso e condição física.

Em crianças com idade entre 5 a 12 anos, a dose não deve exceder 6 mg/kg.

Crianças com mais de 12 anos de idade podem receber doses proporcionais ao seu peso e idade.

Não se deve administrar mais do que quatro doses em um período de 24 horas.

Uretra Masculina (bisnaga)

A geleia deve ser instilada lentamente até que o paciente tenha a sensação de tensão ou até ter usado quase a metade do conteúdo da bisnaga. Aplica-se, então, uma pinça peniana por alguns minutos, após o qual o restante da geleia pode ser instilado. A anestesia é suficiente para cateterismos.

Quando a anestesia é especialmente importante, por exemplo, durante sondagem ou cistoscopia, pode-se instilar o restante da geleia, pedindo ao paciente que se esforce como se fosse urinar. A geleia passará à uretra posterior. Aplica-se uma pinça peniana e espera-se por 5-10 minutos.

Um pouco de geleia pode ser aplicada na sonda ou no cistoscópio servindo como lubrificante.

Uretra Masculina (seringa)

O conteúdo da seringa deve ser injetado lentamente até que o paciente tenha a sensação de tensão. Aplica-se, então, uma pinça peniana por alguns minutos, após o qual o restante da geleia pode ser instilado. A anestesia é suficiente para cateterismos.

Quando a anestesia é especialmente importante, por exemplo, durante sondagem ou cistoscopia, pode-se instilar o restante da geleia, pedindo ao paciente que se esforce como se fosse urinar. A geleia passará à uretra posterior. Aplica-se uma pinça peniana e espera-se por 5-10 minutos.

Um pouco de geleia pode ser aplicada na sonda ou no cistoscópio servindo como lubrificante.

Uretra Feminina

Instilar 3-5 g da geleia. Para obter-se a anestesia adequada, deve-se aguardar alguns minutos para realizar o exame.

O aplicador uretral e o conteúdo da bisnaga são estéreis, usar de uma só vez.

O conteúdo da seringa é estéril, usar de uma só vez.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

7. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE ME CAUSAR?

Reações adversas por ordem decrescente de gravidade.

1. Toxicidade sistêmica aguda:

A lidocaína pode causar efeitos tóxicos agudos se altos níveis sistêmicos ocorrerem devido à rápida absorção ou superdose (ver item 8. O que fazer se alguém usar uma quantidade maior do que a indicada deste medicamento?).

As reações adversas sistêmicas são raras e podem resultar de níveis sanguíneos elevados devido à dosagem excessiva, à rápida absorção, à hipersensibilidade, idiossincrasia (características próprias do paciente) ou reduzida tolerância do mesmo.

As reações podem ser:

- Reações do Sistema Nervoso Central, as quais incluem: nervosismo, tontura, convulsões, inconsciência e, possivelmente, parada respiratória.

- Reações cardiovasculares, as quais incluem: hipotensão (queda da pressão arterial), depressão miocárdica (diminuição da contração ou da força de contração do coração), bradicardia (batimentos lentos do coração) e, possivelmente, parada cardíaca.

2. Reações alérgicas:

Reações alérgicas (nos casos mais graves, choque anafilático) aos anestésicos locais do tipo amida são raras (< 0,1%).

Outros constituintes da geleia, por exemplo metilparabeno, também podem causar este tipo de reação.

Informe ao seu médico, cirurgião-dentista ou farmacêutico o aparecimento de reações indesejáveis pelo uso do medicamento. Informe também a empresa através do seu serviço de atendimento.

8. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA QUANTIDADE MAIOR DO QUE A INDICADA DESTE MEDICAMENTO?

Em caso de uso de uma quantidade de medicamento maior do que a prescrita pelo seu médico, você deve contatá-lo imediatamente.

A lidocaína pode causar toxicidade sistêmica aguda se ocorrerem níveis sistêmicos elevados devido à rápida absorção ou superdosagem (ver item 7. Quais os males que este medicamento pode me causar?). Pode ocorrer dormência dos lábios e ao redor da boca, tontura, vertigem e ocasionalmente visão turva.

Quando os primeiros sinais de superdosagem são notados e **Xylestesin® Geleia 2%** não é mais utilizada, o risco de acontecer efeitos adversos sérios diminui rapidamente. Se você notar qualquer sinal, contate imediatamente seu médico.

Efeitos não previstos podem acontecer. Se você notar qualquer efeito incomum enquanto esteja usando **Xylestesin® Geleia 2%**, deixe de usar o produto e contate o seu médico o mais cedo possível.

Em caso de uso de grande quantidade deste medicamento, procure rapidamente socorro médico e leve a embalagem ou bula do medicamento, se possível. Ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.

III - DIZERES LEGAIS

Nº lote, data de fabricação e validade: vide bisnaga/seringa/caixa.

MS nº 1.0298.0357

Farm. Resp.: Dr. José Carlos Módolo - CRF-SP nº 10.446

SAC (Serviço de Atendimento ao Cliente): 0800-7011918

CRISTÁLIA Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.
Rodovia Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira / SP
CNPJ 44.734.671/0001-51 - Indústria Brasileira

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

“Esta bula foi atualizada conforme Bula Padrão aprovada pela Anvisa em 26/06/2014”.



Anexo B

Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
<i>Data do expediente</i>	<i>Número do Expediente</i>	<i>Assunto</i>	<i>Data do expediente</i>	<i>Número do Expediente</i>	<i>Assunto</i>	<i>Data de aprovação</i>	<i>Itens de bula</i>	<i>Versões (VP / VPS)</i>	<i>Apresentações relacionadas</i>
01/04/2014		10457 – SIMILAR - Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	Todos os itens foram alterados para adequação à Bula Padrão de Xylocaina (AstraZeneca), publicada no Bulário Eletrônico da Anvisa em 14/02/2014	VP e VPS	Geleia estéril 20 mg/g em embalagens contendo 10 bisnagas de 30g e caixa contendo 10 estojos Sterile-Pack® com seringas pré-enchidas com 10g.
26/06/2014		10450 – SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula– RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	Foram inseridas bulas de outras formas farmacêuticas. A bula para forma farmacêutica geléia não sofreu alteração de texto.	VP e VPS	Geleia estéril 20 mg/g em embalagens contendo 10 bisnagas de 30g e caixa contendo 10 estojos Sterile-Pack® com seringas pré-enchidas com 10g.