



PRODUTOS QUÍMICOS FARMACÊUTICOS LTDA.

**Xylestesin®
(cloridrato de lidocaína)**

**Solução Injetável, 2%
Isobárico, sem conservantes**

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xyletesin® 2%
cloridrato de lidocaína
sem conservantes - isobárico

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução Injetável

APRESENTAÇÃO:

Embalagens contendo 50ampolas de 5 mL

USO INJETÁVEL - VIA INTRAVENOSA E INTRAMUSCULAR

(Via intravenosa, tanto por injeção como por infusão contínua ou via intramuscular)

USO ADULTO

COMPOSIÇÃO:

Cada mL da Solução Injetável contém:

cloridrato de lidocaína 20 mg
Veículo Estéril qsp 1 mL
(Veículo: cloreto de sódio, hidróxido de sódio e água para injetáveis).

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O Xyletesin® isobárico é uma solução estéril de cloridrato de lidocaína, sem conservante. Quando administrado por via intravenosa ou intramuscular está especialmente indicado no controle das arritmias ventriculares agudas como aquelas que ocorrem relacionadas ao infarto agudo do miocárdio ou durante a manipulação cardíaca, em cirurgias cardíacas.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

Exerce sua ação como antiarrítmico diminuindo a despolarização, o automatismo e a excitabilidade nos ventrículos durante a fase diastólica mediante uma ação direta sobre os tecidos, especialmente a rede de Purkinje, sem envolver o sistema autônomo. A lidocaína é absorvida com rapidez através das membranas mucosas até a circulação geral, com dependência da vascularização e velocidade do fluxo sanguíneo no local da aplicação e da dose total administrada. Sua absorção através da pele intacta é escassa, aumentando quando aplicada sobre pele traumatizada ou desgastada. A absorção sistêmica é praticamente completa e a velocidade de absorção depende do local e via de administração, da dose total administrada e da utilização ou não de vasoconstritores de forma simultânea. O metabolismo é principalmente hepático (90%); seus metabólitos são ativos e tóxicos, porém menos que o medicamento inalterado, e 10% são excretados sem modificação pelo rim.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

O Xyletesin® isobárico está contraindicado em pacientes com conhecida hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou a qualquer um dos componentes da fórmula.

O medicamento não deve ser usado em pacientes com a síndrome de Stoke-Adams (estado de alteração da consciência causado por uma diminuição do fluxo de sangue ao cérebro), Wolff-Parkinson-White (anormalidade do ritmo cardíaco, que se manifesta como taquicardia supraventricular) ou com graus severos de bloqueios sinoatrial, atrioventricular ou bloqueio intraventricular na ausência de um marca-passo artificial.

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

A segurança e eficácia da lidocaína dependem da dose correta, da técnica adequada, de precauções adequadas e rapidez nas emergências. Repetidas doses de lidocaína podem causar aumento significativo nos níveis sanguíneos e a tolerância varia de

caso a caso. Pacientes idosos e debilitados, doentes graves e crianças deverão ter doses reduzidas de acordo com seu estado. A lidocaína deverá ser usada com cuidado em pacientes com conhecida reação de hipersensibilidade.

A toxicidade sistêmica pode resultar em manifestações de depressão do sistema nervoso central (sedação) ou irritabilidade, os quais podem progredir em convulsões acompanhadas por depressão e/ou parada respiratória. O reconhecimento precoce dos sinais premonitórios, da segurança da oxigenação adequada e, quando necessário, do estabelecimento de vias aéreas artificiais com suporte ventilatório são essenciais para o controle destes problemas. Se as convulsões persistirem apesar da terapia ventilatória com oxigênio, podem ser usados medicamentos anticonvulsivantes por via intravenosa.

Exemplos desses agentes incluem os benzodiazepínicos (ex: diazepam 0,1 mg/kg), barbitúricos de ação ultracurta ex: tiopental. Se o paciente estiver sob anestesia, um relaxante muscular de ação curta (ex: succinilcolina) pode ser usado. Medicamentos de ação longa devem ser usados somente quando as convulsões recorrentes são evidenciadas.

Se ocorrer depressão circulatória, vasopressores podem ser usados.

Monitoramento eletrocardiográfico constante é essencial para a administração apropriada do medicamento. Sinais de depressão excessiva da atividade elétrica cardíaca como disfunção do nódulo sinusal, prolongamento do intervalo P-R e complexo QRS ou o aparecimento ou agravamento de arritmias devem ser acompanhados por ajuste do fluxo e, se necessário, parada da infusão intravenosa deste agente.

Ocasionalmente, aceleração da taxa ventricular pode ocorrer quando o medicamento é administrado em pacientes com flutter atrial ou fibrilação.

Deve-se tomar cuidado ao administrar o medicamento em pacientes com doenças hepáticas e renais, devido ao acúmulo do medicamento ou de seus metabólitos.

O **Xylestesin® isobárico** deve ser usado com cuidado no tratamento de pacientes com hipovolemia, insuficiência cardíaca congestiva grave, choque, e todas as formas de bloqueio cardíaco. Em pacientes com bradicardia sinusal ou bloqueio cardíaco incompleto, a administração do medicamento por via intravenosa para a eliminação dos batimentos ectópicos ventriculares, sem aceleração precedente na velocidade cardíaca (ex: pela atropina, isoproterenol ou medição elétrica), pode promover frequente e sérias arritmias cardíacas ou bloqueio cardíaco completo.

A segurança dos anestésicos locais do tipo amida em pacientes com predisposição genética à hipertermia não tem sido plenamente assegurada e, portanto, a lidocaína deve ser usada com cuidado em tais pacientes.

Por não se saber se os anestésicos locais do tipo amida podem desencadear esse tipo de reação e porque a necessidade de anestésico geral suplementar não pode ser prevista com antecipação, sugere-se a disponibilidade de um protocolo padrão para o monitoramento.

Não se sabe se a lidocaína pode ser o agente causador desta reação, entretanto, doses elevadas resultando em concentração plasmática significante, como pode ser realizado por infusão intravenosa, apresentam risco potencial a estes indivíduos. O reconhecimento precoce de sinais inexplicáveis de taquicardia, taquipneia, pressão sanguínea lâbil e acidose metabólica pode preceder a elevação da temperatura. O sucesso do resultado é dependente do diagnóstico precoce, da imediata descontinuação do agente causador e da instituição do tratamento incluindo terapia com oxigênio, medidas de suporte e a administração de dantroleno.

Gravidez: Categoria B

Efeitos teratogênicos: Não existem estudos adequados e bem controlados em mulheres grávidas. Pelo fato dos estudos em reprodução animal nem sempre serem úteis para reproduzir as respostas humanas, este medicamento deve ser usado durante a gravidez somente se claramente necessário.

Trabalho de Parto e Parto: A lidocaína atravessa a barreira placentária e quando utilizada para anestesia epidural, paracervical, pudental ou bloqueio caudal, pode causar diferentes graus de toxicidade na mãe e no feto.

Amamentação: A lidocaína é excretada pelo leite materno, porém em pequenas quantidades. Avise o seu médico se estiver amamentando. Os riscos-benefícios devem ser considerados.

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

Uso Pediátrico: A segurança e eficácia do medicamento em crianças, não foram estabelecidas por estudos clínicos controlados.

Uso em condições especiais

A presença de algumas doenças pode afetar o uso da lidocaína especialmente na insuficiência cardíaca congestiva, doença renal e hepática.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

O Xyletesin® isobárico deve ser usado com cautela em pacientes com intoxicação digitalica acompanhada por bloqueio atrioventricular. O uso concomitante de agentes beta-bloqueadores ou cimetidina pode reduzir o fluxo sanguíneo hepático e com isso reduzir o clearance da lidocaína.

A lidocaína e a tocainida são farmacodinâmicalemente similares. O uso concomitante destes dois agentes pode causar um aumento de reações adversas, incluindo reação no sistema nervoso central tal como convulsão.

Alterações de Exames Laboratoriais:

O uso simultâneo de indutores enzimáticos hepáticos como barbitúricos, fenitoína ou rifampicina pode diminuir os níveis séricos da lidocaína.

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 em temperatura ambiente, entre 15 e 30°C, protegido da luz.

O prazo de validade é de 36 meses a partir da data de fabricação, sendo que 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. Para sua segurança, mantenha o medicamento na embalagem original.

Características físicas e organolépticas

Solução límpida, essencialmente livre de partículas, incolor.

**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.**

É importante manter o produto em sua embalagem original, não devendo ser transferido para outra embalagem. O transporte deve obedecer aos requisitos para produtos dessa natureza.

6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Antes da administração, os produtos parenterais deverão ser examinados visualmente quanto à presença de partículas estranhas e de alteração da cor do produto. Não usar o produto se a coloração estiver rosada ou mais escura que levemente amarelada, ou ainda, contendo precipitado.

Quando os anestésicos locais do tipo amida são utilizados, equipamento de ressuscitação, oxigenação e outros medicamentos afins deverão estar disponíveis.

O medicamento é administrado como agente antiarritmico por injeção intravenosa direta, infusão intravenosa contínua e injeção intramuscular.

POSOLOGIA

Adultos

Injeção Intravenosa Direta: 1 a 1,5 mg/Kg podendo repetir a intervalos de 8-10 minutos até dose máxima de 3 mg/Kg.

Infusão Intravenosa Contínua: após a administração direta pode seguir-se a infusão intravenosa contínua com velocidade inicial de 1 a 4 mg/min do cloridrato de lidocaína (0,014 a 0,057 mg/kg/min). A velocidade da infusão intravenosa deverá ser avaliada tão logo que o ritmo cardíaco do paciente estabilize ou ao menor sinal de toxicidade. Raramente será necessário continuar com infusão de lidocaína por períodos prolongados.

As soluções para infusão intravenosa podem ser preparadas pela adição de 1 g (ou 2 g) de cloridrato de lidocaína para um litro de solução de glicose 5% em água, usando técnicas assépticas. Aproximadamente uma solução de 0,1% (ou 0,2%) resultará deste procedimento; que seja cada mililitro conterá aproximadamente 1 (ou 2 mg) de cloridrato de lidocaína. Nos casos em que a restrição de líquido é clinicamente apropriada, pode ser preparada uma solução mais concentrada.

O produto tem se mostrado quimicamente estável por 24 horas após diluição em glicose 5% em água. Entretanto, como com todas as misturas intravenosas, a diluição da solução deve ser feita exatamente antes de sua administração.

Injeção Intramuscular: A dose recomendada de cloridrato de lidocaína por via intramuscular é de 4 mg/kg. O músculo deltoide é recomendado como o local preferido da injeção, desde que os níveis sanguíneos terapêuticos da lidocaína ocorram rapidamente e o pico do nível sanguíneo é显著mente maior seguido de administração deltoide como comparado à injeções na coxa ou glúteos. As injeções devem ser feitas com aspiração frequente para evitar possível injeção intravascular inadvertidamente.

Assim que possível, e quando indicado, as injeções dos pacientes devem ser trocadas por infusão intravenosa. Entretanto, se necessário, uma injeção intramuscular adicional pode ser feita após um intervalo de 60-90 minutos.

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?

Geralmente as reações adversas estão relacionadas à dose e são resultantes de altos níveis plasmáticos dos anestésicos causados pela alta dosagem ou rápida absorção. Podem ainda ser devidas à hipersensibilidade, idiossincrasia (reação individual a uma substância em função de uma suscetibilidade incomum) ou tolerância diminuída por parte do paciente. As reações mais comuns são as seguintes:

Sistema Nervoso Central

As manifestações do SNC são excitatórias e/ou depressoras.

Reações comuns (ocorre entre 1% e 10% dos pacientes que utilizam este medicamento): sonolência, vertigem (sensação de se mover em giros no espaço).

Reações com frequência desconhecida: Nervosismo, apreensão, euforia, confusão, visão turva ou dupla, vômitos, sensação de calor, frio ou tremores, convulsões, inconsciência, depressão, parada respiratória e colapso (retração anormal das paredes dos órgãos. Súbita exaustão, decorrente da diminuição da circulação sanguínea).

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.

Sistema Cardiovascular

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

Reações com frequência desconhecida: bradicardia (batimento cardíaco lento), colapso cardiovascular, podendo resultar em parada cardíaca.

Alérgicas: As reações alérgicas são caracterizadas por lesões cutâneas, urticária, edema ou reações anafiláticas. As reações alérgicas podem ocorrer como resultado tanto de sensibilidade como do próprio agente. As reações alérgicas resultantes da sensibilidade à lidocaína são extremamente raras e quando ocorrem devem ser monitoradas por meios convencionais.

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 DESTE MEDICAMENTO?

Emergências graves consequentes dos anestésicos locais geralmente estão relacionadas com altos níveis plasmáticos encontrados durante o uso dos anestésicos. A monitorização dos sinais vitais cardiovasculares e respiratórios e o estado de consciência do paciente após administração do anestésico local são de grande importância e demandam atenção. Ao primeiro sinal de mudança deve-se administrar oxigênio.

A superdose do medicamento geralmente resulta em sinais de toxicidade do sistema nervoso central ou cardiovascular. Se houver convulsões ou sinais de depressão e parada respiratória, a desobstrução das vias aéreas e adequação da ventilação devem ser asseguradas imediatamente.

Se as convulsões persistirem apesar da terapia ventilatória com oxigênio, podem ser usados agentes anticonvulsivantes por via intravenosa.

Exemplos desses agentes incluem os benzodiazepínicos (ex: diazepam 0,1 mg/kg), barbitúricos de ação ultracurta ex: tiopental. Se o paciente estiver sob anestesia, um relaxante muscular de curta ação (ex: succinilcolina) pode ser administrado.

Se ocorrer depressão circulatória, vasopressores podem ser usados. Se ocorrer parada cardíaca, devem ser instituídos procedimentos padrão de ressuscitação cardiopulmonar.

A diálise é de valor negligenciável no tratamento da superdosagem aguda do medicamento.

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

III - DIRETRIZES LEGAIS

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA USO RESTRITO A HOSPITAIS

MS N.º 1.0298.0365

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