

Versão para o Mercado Privado

Xylestesin[®] Sem Vasoconstritor
(cloridrato de lidocaína monoidratado)

Solução Injetável (Frasco-Ampola)
1,0% e 2,0%

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin®
cloridrato de lidocaína
1% e 2%
sem vasoconstritor

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

Solução injetável sem vasoconstritor

1% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados

2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL em estojos esterilizados

2% - caixa com 10 frascos-ampola de 20 mL

USO PARENTERAL

ANESTESIA LOCORREGIONAL

NÃO ESTÁ INDICADO PARA RAQUIANESTESIA

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR - 1%

Cada mL contém :

cloridrato de lidocaína.....10 mg*

* equivalente a 10,66 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

Excipientes: cloreto de sódio, metilparabeno, hidróxido de sódio, água para injetáveis.

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR - 2%

Cada mL contém :

cloridrato de lidocaína 20 mg*

* equivalente a 21,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

Excipientes: cloreto de sódio, metilparabeno, hidróxido de sódio, água para injetáveis.

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O Xylestesin® (cloridrato de lidocaína) solução 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 epidural lombar e caudal.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

As soluções injetáveis de cloridrato de lidocaína 1% e 2% sem vasoconstritor contém o anestésico local cloridrato de lidocaína 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.

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?

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 OUTROS MEDICAMENTOS 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 DO FÁRMACO 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 epidural.

A lidocaína deve ser usada com cuidado em pessoas com conhecida sensibilidade à ela.

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

GRAVIDEZ:

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

AMAMENTAÇÃO:

Da mesma forma que outros anestésicos locais, a lidocaína é excretada pelo leite materno, porém em pequenas quantidades, de tal modo que geralmente o risco é mínimo para a criança, quando utilizada nas doses terapêuticas.

Segundo a Academia Americana de Pediatria e a Organização Mundial de Saúde a utilização de lidocaína pela mãe é compatível com a amamentação.

USO PEDIÁTRICO:

Dosagens em crianças devem ser reduzidas, correspondentes à idade, peso corporal e condições físicas. (Ver 6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

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

ALTERAÇÕES DE EXAMES LABORATORIAIS: A injeção intramuscular de cloridrato 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 cloridrato de lidocaína.

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

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

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?

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

O prazo de validade do produto é de 36 meses. 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.

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, incolor, essencialmente livre de partículas visíveis.

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?

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 os fármacos vasopressores são contraindicadas.

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 dependem 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 injetável, 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 injetável, pode resultar numa profunda queda de pressão sanguínea quando usado em anestesia epidural.

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

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

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

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

Epidural* 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.

BLOQUEIO EPIDURAL 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 epidural 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.

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 do medicamento por drenagem em quantidade moderada do líquido (cerca de 10 mL) através do cateter epidural.

DOSAGENS MÁXIMAS RECOMENDADAS:

• **Adultos:** Lidocaína 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 epidural ou caudal contínua, a dose máxima recomendada não deve ser administrada em intervalos menores que 90 minutos.

Quando anestesia epidural lombar ou caudal contínua for usada para procedimentos não obstétricos, uma quantidade maior de fármaco pode ser administrado 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 fármaco 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.

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?

As reações adversas listadas a seguir foram obtidas de dados de farmacovigilância e na literatura médica. Como estas reações são reportadas voluntariamente a partir de uma população de tamanho incerto, nem sempre é possível estimar com segurança sua frequência ou relação causal com a exposição do medicamento.

Reação muito comum (>1/10): Eritema (vermelhidão da pele) e petéquias (pontos vermelhos).

Reação comum (>1/100 e <1/10): Edema (inchaço) e prurido (coceira).

As Reações muito comuns e comuns foram descritas em adultos e crianças não graves.

Reações adversas com frequência desconhecida: Cefaleia (dor de cabeça), sensação de ardência nos olhos, hiperemia conjuntiva (olho vermelho) e alteração no epitélio córneo (superfície dos olhos).

Sistêmicos: hipersensibilidade, idiossincrasia ou da tolerância diminuída por parte do paciente.

Sistema nervoso central: 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.

Sistema cardiovascular: bradicardia (alteração do batimento cardíaco), hipotensão (diminuição da pressão arterial) e colapso cardiovascular, podendo resultar em parada cardíaca.

Alérgicas: lesões cutâneas (lesões de pele), urticária (coceira), edema (inchaço) ou reações anafilactóides (reações similares as alérgicas).

Neurológicas: 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. Subsequentes reações adversas podem depender particularmente da quantidade de medicamento administrada no espaço subaracnóideo (dentro do espaço da medula espinal). 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, tem sido relatada raramente, quando da realização de bloqueio epidural caudal ou lombar. Dores nas costas e cefaleia 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 DESTES MEDICAMENTO?

Uma vez que este medicamento é administrado por um profissional da saúde em ambiente hospitalar não deverá ocorrer uso de uma quantidade maior do que a indicada deste produto, porém em caso de contato inadequado com esta medicação fora do ambiente hospitalar o paciente deve ser encaminhado prontamente ao serviço de pronto socorro mais próximo.

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 1.0298.0357

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

Registrado por:

CRISTÁLIA - Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Rod. Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira - SP

CNPJ 44.734.671/0001-51 - Indústria Brasileira

Fabricado por:

CRISTÁLIA - Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Av. Nossa Senhora da Assunção, 574 - Butantã - São Paulo - SP

CNPJ 44.734.671/0008-28 - Indústria Brasileira

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



RM_0357_01

Anexo B
Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
09/03/2021	Pendente	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	9. Reações Adversas (VigiMed)	VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
23/09/2019	2238059/19-1	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
16/08/2018	0810471/18-9	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	6. Como devo usar este medicamento?	VP	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
22/02/2018	0164876/18-4	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Bula do Paciente: I – Identificação do Medicamento Bula do Profissional: I – Identificação do Medicamento 4- Contraindicações 5 – Advertências e precauções	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
28/09/2017	2035869/17-5	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	22/10/2015	0929998/15-0	Alteração de Local de Fabricação do Medicamento de Liberação Convencional com Prazo de Análise	23/11/2015	I – Identificação do Medicamento III – Dizeres Legais	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML
01/04/2014	0241821/14-5	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML

Versão para o Mercado Público

**Xylestesin[®] Sem Vasoconstritor
(cloridrato de lidocaína monoidratado)**

**Solução Injetável (Frasco-Ampola)
2,0%**

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin®
cloridrato de lidocaína
2%
sem vasoconstritor

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

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

USO PARENTERAL

ANESTESIA LOCORREGIONAL

NÃO ESTÁ INDICADO PARA RAQUIANESTESIA

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR - 2%

Cada mL contém :

cloridrato de lidocaína 20 mg*

* equivalente a 21,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

Excipientes: cloreto de sódio, metilparabeno, hidróxido de sódio, água para injetáveis.

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O Xylestesin® (cloridrato de lidocaína) solução 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 epidural lombar e caudal.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

As soluções injetáveis de cloridrato de lidocaína 2% sem vasoconstritor contém o anestésico local cloridrato de lidocaína 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.

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?

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 OUTROS

MEDICAMENTOS 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 DO FÁRMACO 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 epidural.

A lidocaína deve ser usada com cuidado em pessoas com conhecida sensibilidade à ela.

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

GRAVIDEZ:

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

AMAMENTAÇÃO:

Da mesma forma que outros anestésicos locais, a lidocaína é excretada pelo leite materno, porém em pequenas quantidades, de tal modo que geralmente o risco é mínimo para a criança, quando utilizada nas doses terapêuticas.

Segundo a Academia Americana de Pediatria e a Organização Mundial de Saúde a utilização de lidocaína pela mãe é compatível com a amamentação.

USO PEDIÁTRICO:

Dosagens em crianças devem ser reduzidas, correspondentes à idade, peso corporal e condições físicas. (Ver 6. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?).

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

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

ALTERAÇÕES DE EXAMES LABORATORIAIS: A injeção intramuscular de cloridrato 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 cloridrato de lidocaína.

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

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

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?

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

O prazo de validade do produto é de 36 meses. 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.

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, incolor, essencialmente livre de partículas visíveis.

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?

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 os fármacos vasopressores são contraindicadas.

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 dependem 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 injetável, 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 injetável, pode resultar numa profunda queda de pressão sanguínea quando usado em anestesia epidural.

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

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

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

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

Epidural* 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.

BLOQUEIO EPIDURAL 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 epidural 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.

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 do medicamento por drenagem em quantidade moderada do líquido (cerca de 10 mL) através do cateter epidural.

DOSAGENS MÁXIMAS RECOMENDADAS:

• **Adultos:** Lidocaína 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 epidural ou caudal contínua, a dose máxima recomendada não deve ser administrada em intervalos menores que 90 minutos.

Quando anestesia epidural lombar ou caudal contínua for usada para procedimentos não obstétricos, uma quantidade maior de fármaco pode ser administrado 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 fármaco 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.

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?

As reações adversas listadas a seguir foram obtidas de dados de farmacovigilância e na literatura médica. Como estas reações são reportadas voluntariamente a partir de uma população de tamanho incerto, nem sempre é possível estimar com segurança sua frequência ou relação causal com a exposição do medicamento.

Reação muito comum (>1/10): Eritema (vermelhidão da pele) e petéquias (pontos vermelhos).

Reação comum (>1/100 e <1/10): Edema (inchaço) e prurido (coceira).

As Reações muito comuns e comuns foram descritas em adultos e crianças não graves.

Reações adversas com frequência desconhecida: Cefaleia (dor de cabeça), sensação de ardência nos olhos, hiperemia conjuntiva (olho vermelho) e alteração no epitélio córneo (superfície dos olhos).

Sistêmicos: hipersensibilidade, idiossincrasia ou da tolerância diminuída por parte do paciente.

Sistema nervoso central: 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.

Sistema cardiovascular: bradicardia (alteração do batimento cardíaco), hipotensão (diminuição da pressão arterial) e colapso cardiovascular, podendo resultar em parada cardíaca.

Alérgicas: lesões cutâneas (lesões de pele), urticária (coceira), edema (inchaço) ou reações anafilactóides (reações similares as alérgicas).

Neurológicas: Em estudo realizado com 10.440 pacientes que receberam lidocaína para anestesia espinhal, 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. Subsequentes reações adversas podem depender particularmente da quantidade de medicamento administrada no espaço subaracnóideo (dentro do espaço da medula espinhal). Isto pode incluir bloqueio espinhal de grandeza variada (incluindo bloqueio espinhal total), hipotensão secundária ao bloqueio espinhal, 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 espinhais inferiores, com lenta recuperação (vários meses) ou incompleta recuperação, tem sido relatada raramente, quando da realização de bloqueio epidural caudal ou lombar. Dores nas costas e cefaleia 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 DESTES MEDICAMENTOS?

Uma vez que este medicamento é administrado por um profissional da saúde em ambiente hospitalar não deverá ocorrer uso de uma quantidade maior do que a indicada deste produto, porém em caso de contato inadequado com esta medicação fora do ambiente hospitalar o paciente deve ser encaminhado prontamente ao serviço de pronto socorro mais próximo.

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

VENDA PROIBIDA AO COMÉRCIO

MS nº 1.0298.0357

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

Registrado por:

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

Fabricado por:

CRISTÁLIA - Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.
Av. Nossa Senhora da Assunção, 574 - Butantã - São Paulo - SP
CNPJ 44.734.671/0008-28 - Indústria Brasileira

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



RM_0357_00

Anexo B
Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
08/11/2022	Pendente	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	DIZERES LEGAIS	VP	2%: 10 EST FA X 20 ML
09/03/2021	0920373217	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	9. Reações Adversas (VigiMed)	VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
23/09/2019	2238059/19-1	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
16/08/2018	0810471/18-9	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	6. Como devo usar este medicamento?	VP	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
22/02/2018	0164876/18-4	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Bula do Paciente: I – Identificação do Medicamento Bula do Profissional: I – Identificação do Medicamento 4- Contraindicações 5 – Advertências e precauções	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
28/09/2017	2035869/17-5	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	22/10/2015	0929998/15-0	Alteração de Local de Fabricação do Medicamento de Liberação Convencional com Prazo de Análise	23/11/2015	I – Identificação do Medicamento III – Dizeres Legais	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML

01/04/2014	0241821/14-5	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP/VPS	1%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML 2%: 10 EST FA X 20 ML 10 FA X 20 ML
------------	--------------	---	---	---	---	---	---	--------	--

**Xylestesin[®] Sem Vasoconstritor
(cloridrato de lidocaína monoidratado)**

**Solução Injetável (Carpule)
2,0%**

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

**Xylestesin® 2% sem vasoconstritor
cloridrato de lidocaína**

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

Solução injetável 20 mg/mL sem vasoconstritor

Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL

USO PARENTERAL

ANESTESIA LOCORREGIONAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO SEM VASOCONSTRITOR

Cada mL contém:

cloridrato de lidocaína 20 mg*

* equivalente a 21,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

veículo estéril q.s.p. 1,0 mL

Excipientes: 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® (cloridrato de lidocaína) 2% carpule é indicado para anestesia local em odontologia e pequenas cirurgias.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

O cloridrato de lidocaína, na forma de carpule, 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 cloridrato de lidocaína carpule proporciona uma anestesia instalada entre 1 a 3 minutos com duração de ação de 1 a 1 ½ hora.

A lidocaína, substância ativa do Xylestesin®, é um anestésico local que age estabilizando a membrana neuronal por inibição dos fluxos iônicos necessários para o início e a condução dos impulsos nervosos.

Hemodinâmica

O efeito depressor direto do agente anestésico local nos vários componentes do sistema cardiovascular e/ou a ação estimulante da epinefrina (quando presente) nos receptores beta-adrenérgicos podem causar mudanças no ritmo cardíaco, na resistência periférica total e na pressão arterial resultantes de níveis sanguíneos excessivos.

Farmacocinética e Metabolismo

A lidocaína é completamente absorvida após administração parenteral, sendo que o índice de absorção depende de vários fatores, tais como, local da administração e a presença ou não de um agente vasoconstritor.

A ligação da lidocaína a proteínas plasmáticas depende da concentração do fármaco, sendo que a fração ligada diminui com o aumento da concentração. Em concentrações de 1 a 4 µg de base livre por mL, 60% a 80% de lidocaína liga-se às proteínas. A ligação também depende da concentração plasmática da alfa-1-glicoproteína ácida.

A lidocaína atravessa as barreiras cerebral e placentária, possivelmente por difusão passiva.

Sua metabolização ocorre rapidamente pelo fígado; o fármaco inalterado e seus metabólitos são excretados pelos rins.

Aproximadamente 90% da lidocaína administrada é excretada na forma de vários metabólitos e menos que 10% é excretada inalterada.

A meia-vida de eliminação da lidocaína após injeção intravenosa em bolus ocorre entre 1,5 a 2,0 horas. Justamente pelo seu rápido índice de metabolização, qualquer condição que afete a função do fígado poderá alterar a cinética da lidocaína.

A meia-vida poderá ser prolongada em dobro, ou mais, em pacientes com disfunção hepática. As disfunções renais não afetam a cinética da lidocaína, porém podem aumentar o acúmulo de metabólitos. Os fatores como acidose e o uso de estimulantes e depressores do SNC afetam os níveis de lidocaína no SNC, necessários para produzir efeitos sistêmicos evidentes. As manifestações adversas tornam-se aparentes com o aumento dos níveis plasmáticos venosos acima de 6 µg de base livre por mL.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou aos outros componentes da fórmula.

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?

Dentistas que utilizam anestésicos locais devem ser conhecedores do diagnóstico e manejo das emergências que possam surgir da sua utilização. Equipamento de ressuscitação, oxigênio e outros fármacos para ressuscitação devem estar disponíveis para uso imediato.

Para minimizar o risco de injeção intravascular, deve ser feita aspiração antes da solução de anestésico local ser injetada. A agulha deve ser reposicionada até não haja retorno de sangue provocado por aspiração. Contudo, a ausência de sangue na seringa não assegura que a injeção intravascular será evitada.

Procedimentos com anestésicos locais devem ser realizados com precaução em caso de sepse e/ou inflamação no local da injeção.

A lidocaína é capaz de causar metahemoglobinemia (síndrome clínica causada pelo aumento da concentração de metemoglobina no sangue; forma da hemoglobina incapaz de ligar-se ao oxigênio). Os sintomas relacionados a esta desordem incluem cianose (caracterizada por coloração azulada) das unhas e lábios, fadiga e fraqueza. Se a metahemoglobinemia não responder a administração de oxigênio, é recomendado administrar de 1 a 2 mg/kg de azul de metileno ao longo de 5 minutos.

Deve-se ter cautela ao administrar lidocaína em pacientes com doença cardíaca isquêmica, choque grave, bloqueio cardíaco, função cardiovascular prejudicada ou doença hepática. Pacientes com doença hepática tem um risco maior de desenvolver concentrações plasmáticas tóxicas, devido a sua inabilidade de metabolizar normalmente os anestésicos locais.

A eficácia e segurança da lidocaína dependem da dose e técnica corretas, precauções adequadas e prontidão para manejo das emergências.

Deve ser utilizada a menor dose de lidocaína que resulta em anestesia efetiva para evitar altos níveis plasmáticos e reações adversas graves. Doses repetidas de lidocaína podem causar aumento significativo dos níveis sanguíneos com cada dose repetida devido ao acúmulo lento do fármaco ou seus metabólitos. A tolerância a níveis sanguíneos elevados varia com a condição do paciente. Doses reduzidas devem ser administradas a pacientes debilitados, idosos e crianças de acordo com sua idade e condição física.

Se forem utilizados sedativos para reduzir a apreensão do paciente, doses reduzidas de Xylestesin® 2% devem ser usadas, já que os anestésicos locais, como sedativos, são depressores do sistema nervoso central, que em combinação podem ter um efeito aditivo.

Os sinais vitais cardíacos e respiratórios e o estado da consciência do paciente devem ser monitorados após a administração do anestésico local. O clínico deve estar atento aos possíveis sinais e sintomas de toxicidade do sistema nervoso central (vide item “10.SUPERDOSE”).

Muitos medicamentos usados durante a condução da anestesia são considerados agentes potenciais para desencadear hipotermia maligna familiar (desordem caracterizada por taquicardia, rigidez muscular e aumento da temperatura corporal). Uma vez que não se sabe se os anestésicos locais do tipo amida podem desencadear esta reação, e uma vez que a necessidade de anestesia geral complementar não pode ser prevista com antecedência, sugere-se que um protocolo padrão para manejo desta doença deva estar disponível. O resultado bem-sucedido é dependente de diagnóstico precoce,

rápida interrupção do agente desencadeante e tratamento imediato, incluindo a terapia de oxigênio, dantroleno e outras medidas de suporte.

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, depressão respiratória e/ou parada respiratória e estimulação ou depressão cardiovascular têm sido relatados. Estas reações podem ser causadas 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.

Informações ao paciente

O paciente deve ser informado sobre a possibilidade de perda temporária da sensação e função muscular após infiltração ou injeções de bloqueio nervoso.

É recomendado que o dentista oriente o paciente a ter cautela para evitar trauma acidental nos lábios, língua, mucosa das bochechas ou palato mole quando esses locais são anestesiados. A ingestão de comida deve ser adiada até o retorno das funções normais. O paciente deve ser orientado a consultar o dentista se a anestesia persistir ou se desenvolver erupção cutânea.

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.

Carcinogênese, Mutagênese e Diminuição da Fertilidade

Não foram conduzidos estudos de lidocaína em animais para avaliar seu potencial carcinogênico e mutagênico.

A lidocaína atravessa a placenta, contudo não está associada com aumento do risco de malformações. Em estudos com animais, a lidocaína não foi teratogênica. No entanto, devido à falta de informações em humanos, a lidocaína deve ser utilizada em gestantes apenas se o benefício potencial ultrapassar o risco para o feto.

Gravidez (categoria de risco B)

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.

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

Lactação

A lidocaína é excretada pelo leite materno, mas em pequenas quantidades e, geralmente, não há risco de afetar a criança quando utilizada nas doses terapêuticas. Contudo, é recomendado cautela ao utilizar o fármaco em mulheres que estão amamentando.

Embora alguma quantidade de lidocaína apareça no leite materno após administração intravenosa, a concentração não é considerada farmacologicamente significativa. Qualquer quantidade encontrada no leite materno é ainda mais reduzida pela baixa biodisponibilidade oral ao lactente.

Uso Pediátrico

As doses na população pediátrica devem ser reduzidas, de acordo com a idade, peso e condição física do paciente.

Uso em 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 tocinida, pois os efeitos tóxicos são aditivos, bem como em pacientes usando betabloqueadores, cimetidina e digitálicos. Efeitos cardíacos aditivos podem ocorrer quando a lidocaína é administrada com fenitoína intravenosa; no entanto, o uso a longo prazo de fenitoína e outros indutores enzimáticos pode aumentar as necessidades de dose de lidocaína. Hipocalemia (baixa concentração de potássio no sangue) produzida por acetazolamida, diuréticos de alça e tiazidas antagonizam o efeito da lidocaína.

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?

Xylestesin®(cloridrato de lidocaína) carpule deve ser conservado 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. Após este prazo de validade o medicamento 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 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?

A dose de cloridrato de lidocaína depende da condição física do paciente, da área da cavidade oral que será anestesiada, da vascularidade dos tecidos orais e da técnica anestésica utilizada. O menor volume de solução que resulta em anestesia eficaz deve ser administrado e deve haver tempo entre as injeções para observar se o paciente manifesta alguma reação adversa.

Cloridrato de lidocaína deve ser reservado para uso em cardíacos e na tireotoxicose e quando há sensibilidade à norepinefrina.

Posologia para anestesia terminal

Adultos

Bloqueio: 1,5 a 1,8 mL

Cirurgia: 3 a 5 mL

Dose Máxima Permitida: 4mg/kg (limite máximo de 06 carpules)

Se ocorrerem sintomas tóxicos leves, a injeção deve ser interrompida imediatamente.

Crianças

A dose deve ser individualizada de acordo com o peso e idade da criança. Não ultrapassar a dose máxima permitida de 4 mg/kg.

A dose deve ser reduzida em idosos, pacientes debilitados e em pacientes com cardiopatias e hepatopatias.

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?

Reação muito comum (>1/10): eritema e petéquias

Reação comum (>1/100 e <1/10): edema, contusão, sangramento no local da aplicação, dor no local da aplicação, prurido, náuseas, cefaleia postural, tremores e vômitos.

Reação incomum (>1/1.000 e <1/100): lesão do nervo periférico, tontura, depressão respiratória.

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 DESTES MEDICAMENTOS?

Sinais e Sintomas

Se sinais de toxicidade sistêmica aguda aparecerem, a injeção do anestésico local deve ser interrompida imediatamente. Sintomas como inquietação, ansiedade, tontura, visão borrada, tremores, depressão ou sonolência são possíveis indicadores de toxicidade do sistema nervoso central.

Emergências são geralmente relacionadas a altos níveis plasmáticos encontrados durante o uso terapêutico de anestésicos locais ou devido a injeção intratecal inadvertida de uma solução de anestésico local.

Tratamento

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

Para o manejo das convulsões, deve-se manter as vias aéreas desobstruídas, ou controlar a respiração com oxigênio e um sistema capaz de permitir a pressão positiva imediata das vias respiratórias utilizando máscara. Se as convulsões persistirem apesar do suporte respiratório adequado, devem ser administrado 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.

Se não forem tratadas imediatamente, tanto as convulsões como a depressão cardiovascular podem resultar em hipóxia, acidose, bradicardia, arritmias e parada cardíaca. Se ocorrer parada cardíaca, devem ser instituídas medidas padrão de ressuscitação cardiopulmonar.

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

MS n.º 1.0298.0357

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

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



RM_0357_01

Anexo B
Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
09/03/2021	Pendente	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	9. Reações Adversas (VigiMed)	VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
23/09/2019	2238059/19-1	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VP/ VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
22/02/2018	0145412/18-9	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento III- Dizeres Legais	VP/ VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
28/09/2017	2035869175	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados, devido ao desmembramento das bulas de Xylestesin carpule com vasoconstricção e sem vasoconstricção	VP/ VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
09/02/2015	0121425/15-0	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Bula do Paciente: 2. Como este medicamento funciona? 6. Como devo usar este medicamento? Bula do Profissional: 3. Características farmacológicas 8. Posologia	VP/ VPS	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	-	-	-	-	Bula do Paciente: 8. Quais os males este medicamento pode causar? Bula do Profissional: 9. Reações adversas	VP/ VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL
01/04/2014	0241821/14-5	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP/ VPS	Caixa contendo 50 carpules de 1,8 mL

**Xylestesin[®] Sem Vasoconstritor
(cloridrato de lidocaína monoidratado)**

**Geléia
2% (20mg/g)**

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® Geleia 2% (20mg/g)

cloridrato de lidocaína

APRESENTAÇÕES

Embalagens contendo 10 bisnagas de 30g + aplicadores e caixa contendo 10 estojos Sterile-Pack® com seringas preenchidas com 10g.

USO URETRAL

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

COMPOSIÇÃO

cloridrato de lidocaína.....20mg*

* equivalente a 21,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

Cada 5 g de geleia contém 106,65 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado (equivalente a 86,5 mg de lidocaína)

veículo estéril q.s.p.1g

Excipiente: hietelose, metilparabeno, hidróxido de sódio, água para injetáveis.

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO É INDICADO?

Xylestesin® (cloridrato de lidocaína) 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?

Cloridrato de lidocaína 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 este medicamento se tiver alergia à lidocaína, a outros anestésicos locais ou aos outros componentes da fórmula.

Cloridrato de lidocaína 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 parabeno 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.

Cloridrato de lidocaína 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.

Cloridrato de lidocaína é possivelmente um desencadeador de porfíria e deve ser somente prescrito à pacientes com porfíria 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

Cloridrato de lidocaína 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® (cloridrato de lidocaína) geleia 2% deve ser conservado 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?

Cloridrato de lidocaína deve ser administrada por via uretral.

A dose necessária de cloridrato de lidocaína a ser usada deve ser calculada pelo seu médico.

Cloridrato de lidocaína 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

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 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 dose 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 superdose (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 superdose são notados e cloridrato de lidocaína 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 cloridrato de lidocaína, 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

MS nº 1.0298.0357

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

CRISTÁLIA Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Rodovia Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira / SP

CNPJ 44.734.671/0001-51 –

Indústria Brasileira

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

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA



R_0357_00

Anexo B
Histórico de Alteração da Bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
09/03/2021	Pendente	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	9. Reações Adversas (VigiMed)	VPS	10 BG X 30 G 10 EST SER PREEN X 10G
23/09/2019	2238059/19-1	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VP/VPS	10 BG X 30 G 10 EST SER PREEN X 10G
05/10/2017	2084608/17-8	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VP/VPS	10 BG X 30 G 10 EST SER PREEN X 10G
01/04/2014	0241821/14-5	10457 - SIMILAR - Inclusão Inicial de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados para adequação à Bula Padrão de Xylocaína (AstraZeneca), publicada no Bulário Eletrônico da Anvisa em 14/02/2014	VP/VPS	10 BG X 30 G 10 EST SER PREEN X 10G

**Xylestesin[®] Sem Vasoconstritor
(lidocaína)**

**Solução Spray
10% (100mg/mL)**

Cristália Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I – IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® 10% Spray

Lidocaína

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução spray

APRESENTAÇÃO:

Solução spray 100 mg/mL

Frasco nebulizador com 50 mL

USO TÓPICO – PARA ANESTESIA TÓPICA

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO

Cada mL contém:

lidocaína100 mg

veículo q.s.p. 1,0 mL

Excipientes: sacarina sódica, edetato dissódico, propilenoglicol, aroma cereja/menta, álcool etílico e água purificada.

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

O Xylestesin® (lidocaína) 10% Spray é indicado como anestésico tópico na prevenção da dor associada com:

Otorrinolaringologia

-Punções dos seios maxilares

-Anestesia da orofaringe para prevenir náuseas e vômitos durante instrumentação

Obstetrícia

Durante o estágio final do parto e antes da episiotomia e sutura perineal, como adjuvante no controle da dor.

Odontologia

Antes de injeções, impressões dentárias, radiografias, remoção de tártaro.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

Lidocaína, na forma de spray, é destinado ao uso em mucosas e proporciona eficaz anestesia de superfície, que ocorre normalmente dentro de 1 a 5 minutos, dependendo da área de aplicação e persiste por aproximadamente 10 a 15 minutos.

Propriedades farmacodinâmicas

A lidocaína, princípio ativo de Xylestesin®, causa um bloqueio reversível da propagação do impulso ao longo das fibras nervosas, impedindo o movimento de entrada dos íons sódio através da membrana neuronal. Os anestésicos locais do tipo amida agem dentro dos canais de sódio da membrana e podem ter efeitos similares nas membranas excitáveis do cérebro e miocárdio.

Propriedades farmacocinéticas

A lidocaína pode ser absorvida logo após a aplicação tópica na membrana mucosa, e seu grau de absorção e porcentagem da dose absorvida dependem da dose total e da concentração administrada, do local da aplicação e do tempo de exposição ao anestésico.

Geralmente, o grau de absorção do anestésico local logo após a aplicação ocorre mais rapidamente após a aplicação endotraqueal.

A lidocaína atravessa a barreira hematoencefálica e a barreira placentária, presumivelmente por difusão passiva. Sua principal via de eliminação é por metabolismo hepático.

A meia-vida da lidocaína seguida de uma injeção intravenosa em bolus é de 1,5 a 2,0 horas. Devido a essa rápida velocidade com a qual é metabolizada, qualquer condição que afete o funcionamento hepático pode alterar a cinética da

lidocaína. A meia-vida pode ser prolongada em pacientes com disfunções hepáticas. A disfunção renal não afeta a cinética da lidocaína, mas pode aumentar o acúmulo de metabólitos.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou aos outros componentes da fórmula.

Lidocaína não deve ser aplicado na laringe.

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?

Equipamento de ressuscitação, oxigênio e outros fármacos afins deverão estar disponíveis quando os anestésicos locais do tipo amida forem administrados em membranas mucosas.

Lidocaína deverá ser utilizado com extremo cuidado se houver infecção ou se a área da aplicação estiver traumatizada, pois sob tais condições, há uma rápida absorção sistêmica.

Deve ser usada a dose mais baixa que resulte em anestesia efetiva, para evitar altos níveis séricos e efeitos adversos.

A segurança e eficácia da lidocaína dependem da dose correta, da técnica, precauções adequadas e rapidez nas emergências. Repetidas doses de lidocaína podem causar significativo aumento dos níveis sanguíneos devido à lenta acumulação do fármaco e seus metabólitos. A tolerância varia de acordo com o estado do paciente. A absorção através das mucosas e superfícies feridas é relativamente alta, especialmente na laringe e árvore brônquica.

Lidocaína 10% spray não deve ser usado em balonetes (cuff) de tubos endotraqueais feitos de plástico. A lidocaína base, pode causar danos em contato com balonetes de PVC e não-PVC de tubos endotraqueais. Este dano é descrito como orifícios que podem causar vazamento, levando a perda de pressão do balonete.

A absorção da lidocaína depende da vascularização local.

Dados de segurança pré-clínica

A toxicidade observada após altas doses de lidocaína consiste em efeitos no sistema nervoso central (SNC) e sistema cardiovascular. Em estudos de toxicidade reprodutiva, nenhuma relação do fármaco com os efeitos foi observada, nem a lidocaína mostrou potencial mutagênico nos testes de mutagenicidade *in vitro* ou *in vivo*.

Não foram feitos estudos de câncer com lidocaína, devido ao local e duração do uso do fármaco.

Populações especiais

Pacientes idosos e debilitados, doentes graves e crianças deverão ter doses reduzidas de acordo com a idade e estado físico.

A lidocaína deve ser usada com precaução em pacientes que tenham conhecida sensibilidade a formulação do medicamento.

O uso do produto não é recomendado em crianças menores de 5 anos ou com menos de 20 kg de peso, em vista da concentração elevada (10%) e de sua rápida absorção.

Se a dose ou a administração resultar em altos níveis sanguíneos, é provável que alguns pacientes necessitem de atenção especial para prevenir efeitos adversos potencialmente perigosos: pacientes com epilepsia, doença cardiovascular e insuficiência cardíaca, bloqueio cardíaco parcial ou completo, com disfunção renal grave, bradicardia, doença hepática avançada, choque grave, idosos ou debilitados.

A anestesia tópica da orofaringe pode interferir com a deglutição e causar perigo de aspiração. Isto é particularmente importante em crianças, devido à frequência da alimentação. Por esta razão, alimentos não devem ser ingeridos aos 60 minutos seguidos do uso de preparações anestésicas na boca e na região da garganta. A dormência da língua e da mucosa bucal pode aumentar o risco de trauma por mordida. Evitar o contato com os olhos.

Pacientes tratados com fármacos antiarrítmicos classe III (ex:amiodarona) devem estar sob cuidado e monitoramento cardíaco, uma vez que os efeitos cardíacos podem ser aditivos.

Em pacientes paralisados sob anestesia geral, podem ocorrer concentrações sanguíneas maiores do que em pacientes que estão respirando espontaneamente. Pacientes não paralisados são mais propensos de ingerir uma grande parte da dose que sofre considerável metabolismo hepático de primeira passagem após absorção intestinal.

Lidocaína 10% spray é um provável porfirinogênico e deve ser prescrito a pacientes com porfiria aguda apenas se estritamente necessário. Devem ser tomadas precauções apropriadas para todos os pacientes porfíricos.

Gravidez – Categoria de risco B

A lidocaína atravessa a barreira placentária, podendo penetrar nos tecidos fetais. A lidocaína tem sido administrada a um grande número de mulheres grávidas ou que possam vir a engravidar. Não têm sido relatados distúrbios específicos no processo de reprodução, como aumento de incidência de malformações ou outros efeitos maléficis diretos ou indiretos no feto.

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

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.

Como qualquer outro fármaco, a lidocaína somente deve ser utilizada durante a gravidez ou amamentação se, a critério médico, os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

Efeito na capacidade de dirigir veículos e operar máquinas

Dependendo da dose, os anestésicos locais podem ter um efeito muito leve na função mental e podem prejudicar temporariamente a locomoção e coordenação.

Alterações de exames laboratoriais

Determinação da função pancreática usando bentiromida: a administração de lidocaína 3 dias antes deste teste pode invalidar seu resultado, devido ao aumento aparente do PABA.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração concomitante de depressores centrais pode causar efeito aditivo na depressão do SNC. O uso associado a antiarrítmicos, como a tocinida, pode aumentar os efeitos tóxicos da lidocaína. Anticonvulsivos hidantoínicos aumentam os efeitos depressores cardíacos. Bloqueadores beta-adrenérgicos podem diminuir o metabolismo hepático, aumentando a toxicidade da lidocaína quando esta é administrada em doses altas e repetida por um longo período de tempo. A administração simultânea de cimetidina pode provocar diminuição da depuração hepática da lidocaína. A metoxamina prolonga a restrição da circulação e pode causar necrose. A inibição da transmissão neuronal por anestésicos locais pode antagonizar os efeitos dos antimastênicos sobre o músculo esquelético, especialmente se grandes quantidades de anestésicos são rapidamente absorvidas; pode ser necessário o ajuste temporário da dose dos antimastênicos no controle da miastenia gravis. A inibição da transmissão neuronal por anestésicos locais pode aumentar ou prolongar a ação de agentes bloqueadores neuromusculares se grandes quantidades do anestésico forem rapidamente absorvidas.

Deve-se ter precaução na administração de lidocaína com fármacos antiarrítmicos classe III (ex: amiodarona).

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?

Xylestesin® (lidocaína) 10% Spray deve ser conservado 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. Após este prazo de validade o medicamento 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?

Como para qualquer anestésico local, a eficácia e segurança da lidocaína depende da dose apropriada, técnica correta, precauções adequadas e prontidão para atendimento das emergências.

lidocaína é destinado ao uso em mucosas e proporciona eficaz anestesia de superfície, que dura aproximadamente 10 a 15 minutos. A anestesia geralmente ocorre dentro de 1-5 minutos, dependendo da área de aplicação.

Modo de Usar

É desnecessário secar o local antes da aplicação.

Para utilizar a solução spray, basta orientar a cânula para a região a ser anestesiada e realizar uma leve pressão sobre o botão.

Aconselha-se, após o uso, retirar o botão com a cânula e conservá-los em solução alcoólica, de modo a evitar uma possível deposição de cristais.

Posologia

A experiência do clínico e conhecimento do estado físico do paciente são importantes para calcular a dose necessária. Nos pacientes idosos ou debilitados, pacientes com doenças agudas ou sepse e em crianças, deve-se adequar as doses de acordo com a idade, peso e condições físicas.

Em adulto, não se deve fazer mais de 20 nebulizações para se alcançar a anestesia desejada. O número de nebulizações depende da extensão da área a ser anestesiada.

Odontologia: 1 a 5 aplicações (10 a 50 mg).

Otorrinolaringologia: 3 aplicações para punção da cavidade maxilar (30 mg).

Durante o parto: até 20 aplicações (até 200 mg).

Durante instrumentação: até 20 aplicações (200 mg) para procedimentos orofaríngeos.

Para pequenos procedimentos, o medicamento deve ser administrado por não menos que 1 minuto.

Para grandes procedimentos, a duração da aplicação é de não mais que 5 minutos.

Cada nebulização libera 100 mg de spray que corresponde a 10 mg de lidocaína.

Uma vez que a absorção é variável e especialmente alta na traqueia e nos brônquios, a dose máxima recomendada varia dependendo da área de aplicação.

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?

- Reação comum (>1/100 e <1/10): Zumbido.

- Reação rara (>1/10.000 e <1.000): Reação alérgica ao fármaco, anafilaxia.

- Relatos isolados: Broncoespasmo, metemoglobinemia.

- Reações adversas com frequência desconhecida: Porfíria aguda intermitente, miastenia grave, reação de hipersensibilidade.

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?

Toxicidade sistêmica aguda

Sinais e Sintomas

Reações tóxicas originam-se principalmente dos Sistemas Nervoso Central e Cardiovascular.

Toxicidade no SNC é uma resposta gradativa com sinais e sintomas de gravidade ascendente. Os primeiros sintomas são parestesia perioral, dormência da língua, tonturas, hiperacusia e zumbido. Distúrbios visuais e tremores musculares são mais graves e precedem o aparecimento de convulsões generalizadas. Inconsciência e convulsões do tipo grande mal podem aparecer em seguida e, podem durar alguns segundos até vários minutos. Hipóxia e hipercarbina ocorrem rapidamente após as convulsões devido ao aumento da atividade muscular, junto com interferência na respiração normal. Em casos graves pode ocorrer apneia. A acidose aumenta os efeitos tóxicos dos anestésicos locais.

A recuperação é devido à redistribuição e metabolismo do anestésico local a partir do SNC. A recuperação pode ser rápida, a não ser que grandes quantidades do fármaco tenham sido administradas.

Os efeitos cardiovasculares são observados somente em casos com altas concentrações sistêmicas. Hipotensão grave, bradicardia, arritmia e colapso cardiovascular podem ser os resultados em tais casos.

Os efeitos tóxicos cardiovasculares são geralmente precedidos por sinais de toxicidade no SNC, a menos que o paciente esteja recebendo um anestésico geral ou esteja fortemente sedado com fármacos, tais como: benzodiazepínicos ou barbitúricos.

Tratamento

O tratamento da toxicidade aguda deve ser instituído quando iniciarem as contrações musculares. Os fármacos e equipamentos necessários devem estar disponíveis imediatamente. Os objetivos do tratamento são manter a oxigenação, interromper as convulsões e dar suporte a circulação.

Deve-se manter a oxigenação e, se necessário, ventilação assistida (máscara e balão).

Um anticonvulsivante deve ser administrado pela via intravenosa (IV) se as convulsões não pararem espontaneamente em 15-30 segundos. O tiopental sódico 1-3 mg/kg IV, abortará rapidamente as convulsões. Como alternativa pode-se administrar diazepam 0,1 mg/kg de peso corpóreo IV, embora sua ação seja lenta. Convulsões prolongadas podem comprometer a ventilação e oxigenação dos pacientes. Se isso acontecer, um relaxante muscular injetável (ex.: succinilcolina 1 mg/kg de peso corpóreo) facilitará a ventilação, e a oxigenação pode ser controlada. Intubação endotraqueal primária pode ser considerada nestas situações.

Se for evidente depressão cardiovascular (hipotensão, bradicardia), deve ser administrada efedrina 5-10 mg intravenosa e sua administração pode ser repetida, se necessário, após 2-3 minutos.

Se ocorrer parada circulatória, deve-se instituir imediatamente ressuscitação cardiopulmonar. Oxigenação ótima, ventilação e manutenção da circulação, como também, tratamento da acidose, são de vital importância, já que hipóxia e acidose aumentariam a toxicidade sistêmica de anestésicos locais. A epinefrina (0,1-0,2 mg na forma de injeção intravenosa) deve ser administrada assim que possível e repetida, se necessário, seguida de bolus de fluido.

Em crianças, devem ser administradas doses proporcionais a idade e peso.

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

MS n.º 1.0298.0357

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

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

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA



RM_0357_00

Anexo B
Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
09/03/2021	Pendente	10450 - SIMILAR – Notificação de Alteração de Texto de Bula - RDC 60/12	-	-	-	-	9. Reações Adversas (VigiMed)	VPS	FR X 50 ML
03/03/2018	0164876/18-4	10450 - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	Bula do Paciente: 6. Como devo usar este medicamento? Bula do Profissional: 8. Posologia e modo de usar	VP/VPS	FR X 50 ML
22/02/2018	0145412/18-9	10450 - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	Bula do Paciente: 6. Como devo usar este medicamento? Bula do Profissional: 8. Posologia e modo de usar	VP/VPS	FR X 50 ML
05/10/2017	2084608/17-8	10450 - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	I – Identificação do Medicamento	VP/VPS	FR X 50 ML
28/09/2017	2035869/17-5	10450 - Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-	-	-	-	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP/VPS	FR X 50 ML