

Xylestesin[®]
(cloridrato de lidocaína)

Solução Injetável
2% (20 mg/mL)
Isobárico, sem conservantes

Cristália Prod. Quím. Farm. Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® 2%

cloridrato de lidocaína

sem conservantes - isobárico

APRESENTAÇÃO

Embalagens contendo 40 estojos Sterile Pack® com 1 ampola de 5mL de solução injetável.

USO INJETÁVEL - VIA INTRAVENOSA E INTRAMUSCULAR

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

USO ADULTO

COMPOSIÇÃO

Cada mL contém:

cloridrato de lidocaína 20 mg*

* equivalente a 21,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado
(equivalente à 17,3072 mg de lidocaína)

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 **Xylestesin®** 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 **Xylestesin®** 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.

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?

A fim de controlar eventuais reações adversas, equipamento de ressuscitação, oxigênio e outros fármacos de ressuscitação devem estar imediatamente disponíveis quando **Xylestesin®** isobárico é usado. O profissional de saúde deve reconhecer possíveis sinais de toxicidade sistêmica para instituir os procedimentos adequados, incluindo uso de fármacos anticonvulsivantes em caso de convulsões e vasopressores em caso de depressão respiratória.

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

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

Monitoramento eletrocardiográfico constante é essencial para a administração apropriada do medicamento. Sinais de depressão excessiva da atividade elétrica cardíaca devem ser acompanhados por ajuste do fluxo e, se necessário, interrupção da infusão intravenosa deste agente.

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

O **Xylestesin® isobárico** deve ser usado com cautela no tratamento de pacientes com doenças hepáticas e renais, hipovolemia, insuficiência cardíaca congestiva grave, choque, e todas as formas de bloqueio cardíaco. Recomenda-se precaução especialmente em pacientes com bradicardia sinusal ou bloqueio cardíaco incompleto, devido ao risco de frequente e sérias arritmias cardíacas ou bloqueio cardíaco completo após administração intravenosa do medicamento.

A lidocaína deve ser usada com cautela em pacientes com predisposição genética à hipertermia maligna. Apesar de ser desconhecido a possibilidade da lidocaína desencadear esta reação, o profissional de saúde deve ter disponível um protocolo para manejo desta reação, incluindo rápida interrupção do agente desencadeante, oxigenoterapia, além de medidas de suporte e administração de dantroleno.

Gravidez – Categoria de Risco 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.

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

Trabalho de Parto e Parto

Os efeitos da lidocaína à mãe e ao feto, quando utilizada no manejo das arritmias cardíacas durante trabalho de parto e parto, não são conhecidos. Sabe-se que a lidocaína rapidamente atravessa a barreira placentária.

Amamentação

Não se sabe se a lidocaína é excretada no leite materno. Como muitos fármacos são excretados no leite materno, deve-se ter precaução quando lidocaína é administrada a lactante.

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.

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.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

O **Xylestesin® 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 farmacodinamicamente similares. O uso concomitante destes dois fármacos pode causar um aumento de reações adversas, incluindo reação no sistema nervoso central tal como convulsão.

O efeito da lidocaína para controle das arritmias cardíacas é potencializado com a administração concomitante ou prévia de propranolol. Foram analisadas as interações medicamentosas com vários beta-bloqueadores (propranolol, metoprolol, nadolol e pindolol). O pré-tratamento com propranolol, metoprolol e nadolol aumentou a concentração sérica da lidocaína. Já o pré-tratamento com pindolol não afetou a concentração sérica 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?

Conservar o medicamento em sua embalagem original, 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.

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

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

Características físicas e organolépticas

Solução límpida, essencialmente livre de partículas, incolor.

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?

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 diferente de incolor e/ou 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 antiarrítmico 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 0,050 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 mg (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 4,0 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 significativamente 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?

- Reação rara (ocorre entre 0,01% e 0,1% dos pacientes que utilizam este medicamento): anafilaxia, reação alérgica do fármaco.

- Relatos isolados: metemoglobinemia, desordem psicótica.

- Reações adversas com frequência desconhecida: porfiria intermitente aguda, reação de hipersensibilidade, miastenia grave, dor irradiada, dor transitória na coluna lombar, parada respiratória, hipotensão, colapso cardiovascular, bradicardia que pode levar a parada cardíaca, sonolência, tontura, apreensão, euforia, zumbido, visão turva ou visão dupla, vômito, sensações de calor, frio ou dormência, espasmos, tremores, convulsões, inconsciência e depressão respiratória.

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.

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

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) ou barbitúricos de ação curta (ex: pentobarbital). 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 superdose 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. Ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.

III - DIRETRIZES LEGAIS

Reg. MS N.º 1.0298.0365

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

Registrado por:

CRISTÁLIA Produtos Químicos Farmacêuticos Ltda.

Rodovia Itapira-Lindóia, km 14 - Itapira-SP

CNPJ N.º 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 n.º 44.734.671/0008-28

Indústria Brasileira

SAC (Serviço de Atendimento ao Consumidor): 0800 701 1918

**VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA
USO RESTRITO A HOSPITAIS**

R_0365_01

Anexo B
Histórico de alteração da bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do Expediente	Número Expediente	Assunto	Data do Expediente	Número Expediente	Assunto	Data de Aprovação	Itens de bula	Versões (VP / VPS)	Apresentações relacionadas
12/11/2019	-----	10450 – SIMILAR Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	I -Identificação do Medicamento	VP VPS	Embalagens contendo 40 estojos Sterile Pack® com 1 ampola de 5mL
28/08/2019	-----	10450 – SIMILAR Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	4. O que devo saber antes de usar este medicamento? 5. Onde, como e por quanto tempo posso guardar este medicamento? 6. Como devo usar este medicamento? 8. Quais os males que este medicamento pode me causar?	VP	Embalagens contendo 40 estojos Sterile Pack® com 1 ampola de 5mL
03/11/2016	2450304/16-5	10450 – SIMILAR Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	29/02/2012	0181046/12-4	10148- Similar - Alteração de Local de Fabricação do Medicamento de Liberação Convencional	11/07/2016	III- Dizeres Legais	VP	Embalagens contendo 40 estojos Sterile Pack® com 1 ampola de 5mL
			-----	-----	-----	-----	I -Identificação do Medicamento 3. Quando não devo usar este medicamento? 4. O que devo saber antes de usar este medicamento? 8. Quais os males que este medicamento pode me causar?		
10/02/2015	0128688/15-9	10450 – SIMILAR Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	6. Como devo usar este medicamento? 9. O que fazer se alguém usar uma quantidade maior do que a indicada deste medicamento?	VP	Embalagens contendo 50 ampolas de 5 mL

11/07/2014	0551453/14-3	10450 – SIMILAR Notificação de Alteração de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	1- Inclusão de definição para terminologia médica do texto; 2- Adequação das reações adversas do item 8-Quais os males este medicamento pode causar? , conforme Resolução 47/2009; 3- Atualização das Apresentações Comercializadas.	VP	Embalagens contendo 50 ampolas de 5 mL
25/06/2014	0499536/14-8	10457 – SIMILAR Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	-----	-----	-----	-----	Todos os itens foram alterados para adequação à RDC 47/09	VP	Embalagens contendo 50 ampolas de 5 mL