

# **Versão para o Mercado Privado**

**Xylestesin<sup>®</sup> 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 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 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<sup>®</sup> 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. Subseqüentes 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 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**

**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<sup>®</sup> 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 vasoconstrição e sem vasoconstrição	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