

**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