

Lidostesim® 3%

cloridrato de lidocaína e hemitartrato de norepinefrina

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução estéril injetável de cloridrato de lidocaína 3% (30 mg/ml) em associação com hemitartrato de norepinefrina.

VIA DE ADMINISTRAÇÃO:

Parenteral, com injeção intra-óssea, conjuntival e intracanal.

APRESENTAÇÃO:

Cada cartucho contém 50 carpules de plástico de 1,8 ml cada.

Uso pediátrico e adulto

COMPOSIÇÃO:

Cada carpule com 1,8 ml contém:

Cloridrato de Lidocaína54,000 mg

Hemitartrato de Norepinefrina *0,072 mg

Excipientes (Cloreto de Sódio, Metilparabeno, Metabissulfito de Sódio, Ácido Cítrico Anidro e Hidróxido de Sódio para ajuste de pH)

Água para injetáveisq.s.p1,800 ml

* 0,072 mg de Hemitartrato de Norepinefrina = 0,036 mg de Norepinefrina

Informações técnicas aos profissionais de saúde

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Os anestésicos locais (AL) impedem a geração e a condução de um impulso nervoso, ocasionando perda da sensibilidade sem perda de consciência. O mecanismo de ação está baseado na teoria do receptor específico, a qual propõe que os anestésicos locais atuam através da sua ligação direta a receptores específicos no canal de sódio, bloqueando-os, ocasionando uma redução ou eliminação da permeabilidade do canal aos íons sódio, interrompendo a condução nervosa (bloqueio nervoso não despolarizante). Os AL podem atuar também, através de antagonismo competitivo, com os íons cálcio, deslocando os íons cálcio do receptor do canal de sódio, permitindo a ligação do AL a este receptor. Os AL produzem uma redução muito pequena, praticamente insignificante na condutância dos íons potássio. O cloridrato de lidocaína (cloridrato de 2-dietilamino-2',6'-acetoxilidida) é um AL do tipo amida, sendo relativamente resistente à hidrólise. Apresenta um PKa de 7,9 e uma ligação protéica de 65%. Apresenta um rápido início de ação (2 a 3 min) e um tempo de meia-vida de 90 minutos para o cloridrato de lidocaína. Os AL tipo amida atravessam facilmente a barreira hematoencefálica, placenta e entram no sistema circulatório do feto em desenvolvimento. O local primário da biotransformação dos AL do tipo amida é o fígado, pelas oxidases de função mista microsossomais, sendo a monoetilglicina e xilidina (potencialmente tóxico) os principais produtos de biotransformação.

acompanhada de um monitoramento dos sinais vitais cardiorespiratórios e da consciência do paciente após cada injeção de AL. A qualquer sinal de alteração, aconselha-se a administração de oxigênio. A primeira medida no controle de convulsões é manter o nível de oxigenação do paciente. Caso a convulsão persista, deve ser administrado um barbitúrico de ação ultra-rápida ou um benzodiazepínico intravenoso. O profissional deve estar familiarizado com esses fármacos anticonvulsivantes antes do uso de AL. Tratamento auxiliar pode ser necessário para controlar a depressão cardiovascular, tal como a administração intravenosa de fluidos e vasopressores. Caso não seja tratado imediatamente, ambos, convulsão e depressão cardiovascular podem resultar em hipóxia, bradicardia, arritmias e parada cardíaca. Caso ocorra parada cardíaca, procedimento padrão de ressuscitação cardiopulmonar deve ser instituído. Diálise não apresenta valor no tratamento de toxicidade aguda do cloridrato de lidocaína. Em camundongos fêmea a DL₅₀ intravenosa de cloridrato de lidocaína é 26 (21-31 mg/Kg) e a DL₅₀ subcutânea é de 264 (203-304 mg/Kg). XYLOCAINE® DENTAL Prescribing information. Dentsply Pharmaceutical, PM-CS-PI-0001 Rev.10/01.

ARMAZENAGEM

Conservar à temperatura ambiente de 15 a 30°C e ao abrigo da luz.

USO PROFISSIONAL

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS

Fabricado e Embalado por:

DLA Pharmaceutical Ltda.

Rua Igarapava, 436 Jardim Alpino

15810-255 - Catanduva S.P

CNPJ: 45.841.137/0001-07

www.dentsply.com.br

Central de Relacionamento: 0800 721 1200

Registro MS nº 1.0993.0003.002-3

Farmacêutico Responsável:

Dr. Pedro Clapis Lomba - CRF/SP: 21496

Indústria Brasileira



devido aos altos níveis de AL. A lidocaína pode produzir inicialmente uma sedação leve ou sonolência, podendo desenvolver-se em lugar dos sinais excitatórios. Assim, a excitação ou sedação entre 5 a 10 minutos após a administração de um AL deve servir como aviso para o clínico de um nível sanguíneo crescente do AL e da possibilidade de um episódio convulsivo tônico-clônico generalizado caso os níveis plasmáticos continuem a se elevar.

Como a epinefrina, a norepinefrina não apresenta ações de estimulação do SNC nas doses terapêuticas habituais, e suas propriedades de estímulo do SNC são mais proeminentes após a superdosagem.

Sistema cardiovascular: Miocárdio: Os AL produzem uma depressão do miocárdio relacionada com o nível plasmático do AL (superdose). A ação do AL reduz a excitabilidade elétrica do miocárdio, reduz a velocidade de condução e reduz a força de contração. Rede vascular periférica: Os AL produzem vasodilatação periférica, através do relaxamento do músculo liso das paredes dos vasos sanguíneos, resultando em leve grau de hipotensão, um aumento do fluxo sanguíneo de entrada e saída no local de administração do AL, com conseqüente aumento da velocidade de absorção do AL e diminuição da duração da ação do AL, aumento do sangramento na área de tratamento, aumento dos níveis sanguíneos do AL e aumento da possibilidade de superdose. A depressão do miocárdio associada à vasodilatação periférica resultam em hipotensão.

Sistema respiratório: Em níveis inferiores à superdosagem possuem uma ação relaxante direta sobre o músculo liso brônquico; em níveis de superdosagem podem produzir parada respiratória em conseqüência da depressão generalizada do SNC.

Reações alérgicas: São caracterizadas por lesões cutâneas, urticária, edema ou reações anafiláticas.

Reações Psicogênicas: Eventos desencadeados por ansiedade estão entre as reações adversas mais comuns associadas aos AL. Podem ser manifestadas por vários sintomas como síncope, hiperventilação, náusea, vômitos, alterações nos batimentos cardíacos e pressão sanguínea.

Parestesias: Anestesia prolongada ou parestesia da língua e lábios sabidamente são riscos dos procedimentos cirúrgicos como extrações, embora elas possam ocorrer após procedimentos não-cirúrgicos. Muitas dessas reações são transitórias e desaparecem dentro de 8 semanas, embora algumas reações possam ser permanentes.

Com relação aos efeitos adversos do hemitartrato de norepinefrina, estes geralmente estão associados à superdose e normalmente envolvem a estimulação do SNC. Níveis excessivos de norepinefrina no sangue produzem elevação acentuada das pressões sistólica e diastólica, com aumento do risco de acidente vascular cerebral hemorrágico, cefaléia, episódios de angina em pacientes susceptíveis e arritmias cardíacas.

HAAS, D. *An update on Local Anesthetics in Dentistry. Journal of the Canadian Dental Association*, v. 68 nº 9, October, 2002 e MALAMED, SF. *Manual de Anestesia Local*. 5ª. Ed. Elsevier, 2005.

SUPERDOSE

Emergências relacionadas aos AL são geralmente uma conseqüência de altas concentrações plasmáticas. Dessa forma, a melhor conduta é a prevenção,

Aproximadamente 80% de uma dose de cloridrato de lidocaína injetada sofrem biotransformação em pacientes com função hepática normal e cerca de 10 % é excretado inalterado na urina. Em LIDOSTESIM 3% o cloridrato de lidocaína está associado ao hemitartarato de norepinefrina, um vasoconstritor simpatomimético de ação direta quase que exclusivamente nos receptores alfa-adrenérgicos (90%), entretanto também estimula os receptores beta no coração (10%). Assim, os vasoconstritores são úteis em odontologia uma vez que: através da constrição dos vasos sanguíneos, reduzem o fluxo sanguíneo para o local da injeção, tornando mais lenta a absorção do AL pela corrente sanguínea, o que aumenta a duração dos AL e diminui o risco de superdose de AL e reduzindo o sangramento no local da injeção. O pH de uma solução anestésica e o pH do tecido no qual é injetada tem grande influência sobre sua ação de bloqueio nervoso. A acidificação do tecido reduz a eficácia da anestesia local. Há uma anestesia inadequada quando os anestésicos locais são injetados em áreas infectadas ou inflamadas. LIDOSTESIM 3% causa redução do fluxo sanguíneo para a área de injeção. Além do menor nível sanguíneo de lidocaína, há menor sangramento no local da injeção. Os tempos esperados de duração da ação anestésica são: 60 minutos para anestesia pulpar e de 3 a 5 horas para anestesia tecidual. *MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

RESULTADOS DE EFICÁCIA

Hoje o cloridrato de lidocaína é usado como padrão de comparação para verificar a eficácia de outros anestésicos locais. *MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

INDICAÇÕES

LIDOSTESIM 3% está indicado para a anestesia local em odontologia e cirurgia.

CONTRA-INDICAÇÕES

Os AL tipo amida são contra-indicados a pacientes que apresentem hipertermia maligna (hiperpirexia). A insuficiência hepática é uma contra-indicação relativa à administração de anestésicos locais. Isto inclui pacientes submetidos à diálise renal e aqueles com nefrite túbulo intersticial crônica. Insuficiência hepática e cardiovascular significativas e a tireotoxicose (hipertireoidismo) são contra-indicações relativas ao uso dos AL. A hipersensibilidade aos AL do tipo amida e a quaisquer componentes presentes na composição de LIDOSTESIM 3% (em especial os parabenos e bissulfitos) é uma contra-indicação absoluta. *MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

MODO DE USAR E CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO DEPOIS DE ABERTO

Carregue um carpule na seringa-carpule. Perfure o local a ser anestesiado. Realize aspiração antes da injeção da solução anestésica a fim de minimizar a probabilidade de injeção intravascular. Retire a seringa, destrua a agulha e descarte o carpule após o uso, mesmo que o conteúdo não tenha sido utilizado totalmente.

POSOLOGIA

Como para todos os AL, a dose varia e depende da região a ser anestesiada, da vascularização dos tecidos, da tolerância individual e da técnica de anestesia. Deve ser administrada a menor dose necessária para produzir anestesia eficaz. A dose máxima é de 4,4 mg/Kg sem ultrapassar 300 mg (equivalente a 5 carpules para adultos saudáveis normais); a dose deve ser reduzida em pacientes clinicamente comprometidos, debilitados ou idosos. Recomenda-se que pacientes

sensíveis ao hemitartarato de norepinefrina recebam apenas 2 carpules por consulta. *MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

Doses máxima em carpules para pacientes saudáveis (4,4 mg de cloridrato de lidocaína / Kg - cada carpule de 1,8 ml contém 54 mg de cloridrato de lidocaína).

Peso do Paciente (em Kg)	10	20	30	40	50	60	70	80	igual ou acima de
									90

* N° de Carpules	0,5	1,5	2,0	3,0	4,0	4,5	5,5	5,5	5,5
------------------	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----	-----

* nº de carpules = arredondado para meio carpule

ADVERTÊNCIAS

Os carpules não devem ser autoclavados. Caso o dentista deseje realizar uma assepsia externa do carpule, deve-se aplicar um lenço umedecido com álcool isopropílico a 91% ou álcool etílico a 70% ao diafragma de borracha. Os carpules não devem ser mergulhados em álcool ou em qualquer outra solução desinfetante. Os dentistas que utilizam anestésicos locais em seus consultórios devem conhecer o diagnóstico e tratamento de emergências que podem surgir. Assim, deve existir equipamento de reanimação, de oxigenação e fármacos de reanimação para uso imediato. Os pacientes devem ser informados sobre a possibilidade de perda temporária de sensação e função muscular após a injeção infiltrativa e de bloqueio. Os pacientes devem ser avisados para estarem atentos enquanto estruturas como língua, lábios, mucosas e palato estiverem anestesiadas, a fim de evitar traumas nessas estruturas. A alimentação deve ser suspensa até a recuperação da função normal dessas estruturas. O prazo de validade de LIDOSTESIM 3% é de 18 meses. Nenhum medicamento deve ser usado após estar vencido o seu prazo de validade. Lembrar-se de que a presença de precipitação, partículas em suspensão, turvação e alteração na coloração do produto torna inconveniente seu uso. As condições sistêmicas do paciente devem ser previamente analisadas antes de qualquer intervenção odontológica a fim de se evitar efeitos adversos. Lembrar-se de que a administração de qualquer solução anestésica local deve ser feita lentamente. *MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

“Para evitar vazamento da solução durante a injeção, certifique-se da penetração da agulha no centro do diafragma de borracha durante o carregamento da seringa. Uma penetração fora do centro produz uma punção de formato oval que pode permitir o vazamento ao redor da agulha. Outras causas de vazamento e quebra incluem seringas desgastadas, seringas sem aspiração, seringas com arpão torto e seringas não projetadas para carpules de 1,8mL”.

USO EM IDOSOS, CRIANÇAS E OUTROS GRUPOS DE RISCO

Grávidas e mulheres em período de amamentação: Segundo Haas (2002) os AL e vasoconstritores usados em odontologia podem ser administrados às gestantes (o cloridrato de lidocaína está na categoria B do FDA), visto que a concentração de norepinefrina presente na solução anestésica é tão baixa que não é provável que afete significadamente o fluxo sanguíneo uterino. Entretanto, deve-se sempre fazer a aspiração antes da injeção do anestésico a fim de evitar a injeção intravascular. Não se sabe se o cloridrato de lidocaína é excretado no leite

materno.

Crianças: A principal preocupação com pacientes pediátricos é a relativa facilidade de induzir uma superdose. Assim, antes da administração do AL à criança, o dentista deve determinar o peso da criança e calcular a máxima dose. Aconselha-se selecionar a solução contendo a menor concentração de AL e vasoconstritor.

Idosos: É prudente administrar uma dose de AL bem abaixo da dose máxima, visto que pacientes idosos podem apresentar algum comprometimento hepático e/ou cardiovascular. *HAAS, D. An update on Local Anesthetics in Dentistry. Journal of the Canadian Dental Association, v. 68 nº 9, October, 2002.*

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Interações com medicamentos: Em geral, os depressores do SNC como narcóticos, opióides, ansiolíticos, fenotiazínicos, barbitúricos e anti-histamínicos, quando empregados em conjunto com AL, levam à potencialização das ações cardiorespiratórias dos AL. O uso conjunto de AL e drogas que compartilham uma via metabólica comum pode produzir reações adversas. Os fármacos que induzem a produção de enzimas microssomais hepáticas, como os barbitúricos, podem alterar a velocidade de metabolização dos AL com ligação amida. Assim, o aumento da indução das enzimas microssomais hepáticas, aumentará a velocidade de metabolismo do AL.

AL associados à vasoconstritores simpatomiméticos, como a epinefrina e a norepinefrina podem interagir com beta-bloqueadores não-seletivos, inibidores da monoamina oxidase e antidepressivos tricíclicos. *HAAS, D. An update on Local Anesthetics in Dentistry. Journal of the Canadian Dental Association, v. 68 nº 9, October, 2002 e MALAMED, SF. Manual de Anestesia Local. 5°. Ed. Elsevier, 2005.*

Interações com exames: A injeção intramuscular de cloridrato de lidocaína pode resultar em um aumento nos níveis da creatina fosfoquinase. Dessa forma, a determinação dessa enzima como diagnóstico da presença de infarto agudo do miocárdio, sem a separação da isoenzima, pode comprometer o resultado deste exame. XYLOCAINE® DENTAL Prescribing information. Dentsply Pharmaceutical, PM-CS-PI-0001 Rev.10/01 .

REAÇÕES ADVERSAS A MEDICAMENTOS

Reações adversas após a administração de cloridrato de lidocaína são similares em natureza das reações observadas com os outros anestésicos locais do tipo amida. Essas reações são, geralmente, dose-dependentes e podem ser resultado de uma concentração plasmática elevada. Os seguintes efeitos são os mais freqüentemente relatados:

SNC: Os sinais e sintomas clínicos iniciais de toxicidade no SNC são de natureza excitatória.

Com o aumento do nível sanguíneo de um AL acima de seu valor terapêutico, serão observadas reações adversas. Os sinais e sintomas clínicos iniciais da superdosagem (toxicidade) têm origem no SNC e são de origem excitatória, tais como: sinais de fala difícil, calafrios, contração muscular, tremores dos músculos da face e extremidades distais e sintomas de sensação de pele quente e ruborizada, delírio generalizado, tontura, distúrbios visuais como incapacidade de focalizar, distúrbio auditivo como zumbido, sonolência e desorientação. Parestesia bilateral da língua e região perioral é sinal de uma reação tóxica,