

Xylestesin[®] Pesada
(cloridrato de lidocaína monoidratado + glicose)

Solução Injetável
5,0% + 7,5%

Cristália Produtos Químicos e Farmacêuticos Ltda.

BULA PARA O PACIENTE

I - IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

Xylestesin® Pesada

cloridrato de lidocaína 5,0% + glicose 7,5%

FORMA FARMACÊUTICA

Solução injetável

APRESENTAÇÃO:

Caixa 50 estojos estéreis contendo 1 ampola de 2 mL.

VIA INTRATECAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO ACIMA DE 16 ANOS

COMPOSIÇÃO:

Cada 1 mL de Solução Injetável contém:

cloridrato de lidocaína 50 mg*

* equivalente à 53,33 mg de cloridrato de lidocaína monoidratado

glicose 75 mg

água para injetáveis q.s.p. 1 mL

** Pode conter hidróxido de sódio qsp. pH

II - INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. PARA QUÊ ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

Este medicamento é indicado na raquianestesia.

2. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

A solução injetável de **Xylestesin® 5% Pesada** contém o anestésico local cloridrato de lidocaína, anestésico local do tipo amida, associado à glicose 7,5%. A lidocaína estabiliza a membrana neuronal por inibição dos fluxos iônicos necessários para o início e condução dos impulsos efetuando deste modo à ação anestésica local.

O início da ação é rápido. A duração da anestesia perineal proporcionada por 1 mL (50 mg) de Xylestesin® 5% Pesada atinge em média 100 minutos, com um estado de analgesia prolongando-se por um período de 40 minutos. A duração da anestesia cirúrgica proporcionada por 1,5 a 2 mL (75 a 100 mg) do produto é de aproximadamente duas horas.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

A lidocaína está contraindicada em pacientes com conhecida hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou aos componentes da fórmula.

As seguintes condições impedem a aplicação da raquianestesia:

- Hemorragia grave, hipotensão grave, choque e arritmias, bloqueio cardíaco completo, com débito cardíaco gravemente comprometido.
- Infecção local na área onde se pretende fazer a punção lombar.
- Septicemia (presença de bactérias patogênicas no sangue).
- Doenças cérebro-espinhais, tais como meningite, tumores, poliomielite e hemorragia cerebral. Artrite, espondilite e outras doenças da coluna que tornem impossível a punção; também é contraindicado na presença de tuberculose ou lesões metastáticas na coluna.
- Anemia perniciosa com sintomas medulares.
- Descompensação cardíaca, derrame pleural maciço e aumento acentuado da pressão intra-abdominal como ocorre em ascites maciças e tumores.
- Infecção piogênica (que produz pus) da pele no local ou adjacente ao local da punção.
- Hipotensão acentuada, como ocorre em choque cardiogênico (resultante da incapacidade de manter o aporte sanguíneo ao sistema circulatório e tecido, devido a um débito cardíaco inadequado) ou choque hipovolêmico (condição que ocorre quando há um volume insuficiente de sangue).
- Alterações da coagulação ou sob tratamento com anticoagulante.

4. O QUE DEVO SABER ANTES DE USAR ESTE MEDICAMENTO?

Xylestesin® 5% Pesada deve ser administrado apenas por profissionais bem treinados no diagnóstico e manejo da toxicidade relacionada a dose e outras emergências agudas que podem surgir na raquianestesia. A segurança e a eficácia da lidocaína dependem da dose correta, técnica adequada, precauções adequadas e da rapidez no atendimento das emergências. Equipamento de ressuscitação, oxigênio e medicamentos para reanimação devem estar disponíveis para uso imediato (Ver Cuidados e Reações Adversas e Superdosagem). A demora na conduta correta da toxicidade relacionada a dose, hipoventilação de qualquer causa e/ou sensibilidade alterada podem levar ao desenvolvimento de acidose, parada cardíaca e possivelmente óbito. O paciente deverá estar recebendo líquidos por via intravenosa, através de cateter, para assegurar esta via de acesso. A menor dose que resultar em anestesia efetiva deverá ser usada para evitar altos níveis plasmáticos e graves reações adversas.

Quando apropriado, os pacientes devem ser informados da possibilidade de perda temporária da sensação e atividade motora na metade inferior do corpo, após administração da raquianestesia.

Também quando apropriado o médico deverá discutir com os pacientes outras informações como as reações adversas da lidocaína hiperbárica.

A solução de **Xylestesin® 5% Pesada** não contém conservante.

As repetidas doses de lidocaína podem causar aumentos significativos no nível sanguíneo, com cada dose repetida, devido ao lento acúmulo do fármaco ou dos seus metabólitos. A tolerância aos níveis sanguíneos elevados varia de acordo com o estado do paciente. Pacientes idosos, debilitados, pacientes com doenças agudas e crianças, deverão receber doses reduzidas de acordo com a idade e condições físicas. A lidocaína deve também ser usada com precaução em pacientes em estado de choque grave ou com bloqueio cardíaco.

As seguintes condições poderão impedir o uso da raquianestesia, dependendo da avaliação médica, da situação e da capacidade de lidar com as complicações que possam ocorrer:

- Doenças preexistentes do sistema nervoso central, tais como aquelas atribuíveis à anemia perniciosa, poliomielite, paralisia decorrente de lesão nervosa, sífilis ou tumores.
- Alterações hematológicas que pré-disponham a coagulopatias ou pacientes em anticoagulação. O trauma de vasos sanguíneos durante a condução da raquianestesia pode levar em algumas circunstâncias a hemorragias incontroláveis no sistema nervoso central ou hemorragias nos tecidos moles.
- Extremos de idade.
- Dor crônica nas costas e cefaleia pré-operatória.
- Hipotensão e hipertensão.
- Artrites ou deformidades da coluna.
- Problemas de ordem técnica como parestesias (sensação de dormência, ou formigamento, a sensibilidade fica exacerbada) persistentes, sangramentos persistentes).
- Psicoses ou outras causas que signifiquem falta de cooperação por parte do paciente.

O cuidadoso e constante monitoramento cardiovascular e respiratório (adequada ventilação), sinais vitais e o estado de consciência do paciente, devem ser acompanhados após cada injeção de anestésico local. Deverá também ser lembrado em tais momentos que a agitação, ansiedade, zumbido, vertigem (sensação de se mover em giros, tonteira.), visão turva, tremores, depressão ou sonolência podem representar os primeiros sinais de toxicidade do sistema nervoso central.

Os anestésicos locais do tipo amida são metabolizados pelo fígado, portanto, a lidocaína deve ser usada com cuidado em pacientes com doenças hepáticas. Os pacientes com doença hepática grave devido à sua reduzida capacidade de metabolização dos anestésicos locais oferecem maior risco para o desenvolvimento de concentrações plasmáticas tóxicas. A lidocaína deve também ser usada com cautela em pacientes com função cardiovascular alterada, devido a uma menor capacidade de compensar as mudanças funcionais associadas ao prolongamento de condução atrioventricular provocado por esses fármacos.

É absolutamente pouco provável o desenvolvimento de hipertermia maligna com agentes anestésicos locais. Entretanto, em pacientes com histórico familiar é recomendável a existência de um protocolo padrão para monitoramento do paciente.

Sinais precoces de taquicardia (rapidez anormal da ação cardíaca, frequência superior a 100 batimentos por minutos), taquipneia (rapidez anormal da respiração), labilidade da pressão sanguínea (oscilações da pressão arterial) e acidose metabólica (acidez excessiva dos líquidos corporais). Poderão preceder a elevação da temperatura. O sucesso da reversão

da síndrome dependerá de um diagnóstico precoce, da rápida suspensão do agente ou agente suspeito de desencadeamento e do início imediato de tratamento, incluindo oxigenoterapia, medidas de suporte cabíveis e administração de dantroleno.

A lidocaína deverá ser usada com cuidado em pessoas com conhecida sensibilidade ao fármaco. Pacientes alérgicos aos derivados do ácido para-aminobenzoico (procaína, tetracaína, benzocaína, etc.) não têm apresentado sensibilidade cruzada à lidocaína.

Metahemoglobinemia

Casos de metaemoglobinemia foram relatados em associação com o uso de anestésico local. Procure atendimento médico imediato se você apresentar algum dos seguintes sinais ou sintomas: pele de cor pálida, cinza ou azul (cianose); dor de cabeça; ritmo cardíaco acelerado; falta de ar; tontura; ou fadiga.

Injeção intra-articular

Infusões intra-articulares de anestésicos locais após artroscopia e outros procedimentos cirúrgicos não são aprovadas, e há relatos de condrólise em pacientes que receberam tais infusões. Seu médico deverá fazer aspiração antes de injetar o anestésico para evitar injeção intravascular.

Os anestésicos não devem ser injetados durante a contração uterina, já que o fluxo do líquido espinhal poderá levar o anestésico a uma dispersão cefálica além da desejada.

Déficits Neurológicos

Foram relatados déficits neurológicos com o uso de agulhas de pequeno calibre e microcateteres para raquianestesia com lidocaína.

Estudos em animais sugerem que a mistura de cloridrato de lidocaína 5%, com um volume igual de líquido cefalorraquidiano ou uma solução sem conservantes 0,9% de solução salina pode reduzir o risco de lesão do nervo devido ao acúmulo do anestésico local concentrado.

Carcinogenicidade, Mutagenicidade e Diminuição da Fertilidade

Não foram realizados estudos de lidocaína em animais para a avaliação do potencial carcinogênico e mutagênico, bem como seu efeito sobre a fertilidade.

Gravidez: Categoria de Risco B

Efeitos teratogênicos: 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.

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

Trabalho de parto e parto

A hipotensão materna é uma consequência da anestesia regional.

Os anestésicos locais produzem vasodilatação por bloqueio dos nervos simpáticos. Elevar as pernas da paciente e posicioná-la de lado ajudará na prevenção da diminuição da pressão sanguínea. O débito cardíaco fetal deverá também ser monitorado de maneira contínua, e o monitoramento fetal eletrônico é altamente aconselhável.

A **raquianestesia** poderá alterar as contrações durante o parto, por mudanças na contratilidade uterina, ou força de expulsão.

Há informações de que a lidocaína prolonga a segunda fase do trabalho de parto, por remoção do reflexo de expulsão ou por interferência com a função motora. O uso de anestesia obstétrica pode aumentar a necessidade de fórceps.

Amamentação

Não se sabe se o fármaco é excretado no leite materno. Precauções deverão ser tomadas na administração de lidocaína em mulheres em fase de amamentação.

Uso Pediátrico

Ainda não foram estabelecidas a segurança e eficácia em crianças com menos de 16 anos de idade.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

A administração de soluções anestésicas locais contendo epinefrina e norepinefrina a pacientes que estejam recebendo inibidores da monoaminoxidase, antidepressivos tricíclicos ou fenotiazinas, pode produzir hipotensão grave ou hipertensão. O uso simultâneo desses agentes deverá ser evitado. Nas situações em que a terapia simultânea for necessária, será essencial um cuidadoso monitoramento do paciente.

A administração simultânea de fármacos vasopressores, para o tratamento da hipotensão relacionada ao bloqueio espinhal, e de fármacos ocitócicos do tipo ergot (obtidas a partir do fungo *Claviceps purpúrea*), poderá causar hipertensão grave e persistente ou acidentes cerebrovasculares.

Os pacientes que recebem anestésicos locais têm maior risco de desenvolver metemoglobinemia quando expostos simultaneamente aos seguintes medicamentos, incluindo outros anestésicos locais:

Nitratos/Nitritos: óxido nítrico, nitroglicerina, nitroprusseto, óxido nítrico.

Anestésicos locais: articaína, benzocaína, bupivacaína, lidocaína, mepivacaína, prilocaína, procaína, ropivacaína, tetracaína.

Antineoplásicos: ciclofosfamida, flutamida, hidroxureia, ifosfamida, rasburicase.

Antibióticos: dapsona, nitrofurantoina, ácido para-aminossalicílico, sulfonamidas.

Antimaláricos: cloroquina, primaquina.

Anticonvulsivantes: fenobarbital, fenitoína, valproato sódico.

Outros fármacos: acetaminofeno, metoclopramida, quinina, sulfalazina.

Informe ao seu médico ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento. Não use medicamentos sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para sua saúde.

5. ONDE, COMO E POR QUANTO TEMPO POSSO GUARDAR ESTE MEDICAMENTO?

Conservar o produto em temperatura ambiente controlada, entre 15 e 25°C, protegido da luz. O prazo de validade é de 18 meses a partir da data de fabricação, sendo que após este prazo de validade o produto 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 límpida, essencialmente livre de partículas visíveis, incolor a levemente amarelada.

Observação: Os produtos parenterais deverão ser examinados visualmente em busca de partículas estranhas e de alteração da cor do produto antes da administração. O produto não deverá ser usado se qualquer alteração for detectada.

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?

POSOLOGIA

Na raquianestesia com **Xylestesin® Pesada 5%** poderá ser induzida na posição reclinada em lateral direita ou esquerda, e na posição sentada. Sendo uma solução hiperbárica, o anestésico tenderá a se deslocar na direção na qual a mesa estiver posicionada. Após ter atingido o nível desejado de anestesia e o anestésico lidocaína ter sido fixado, geralmente após 5 ou 10 minutos, o paciente deverá ser posicionado de acordo com as necessidades do cirurgião ou do obstetra.

As injeções deverão ser feitas lentamente.

Consultar bibliografia específica para definição das técnicas corretas para raquianestesia.

A distribuição do anestésico no espaço subaracnóideo pode ser facilitada pela utilização de uma agulha de calibre apropriado. Se a técnica for devidamente utilizada no espaço subaracnoideo, uma injeção adicional é raramente necessária.

Um bloqueio incompleto ou irregular não responsivo ao reposicionamento do paciente pode indicar má colocação ou distribuição inadequada do fármaco. Para evitar o acúmulo excessivo do fármaco, doses adicionais de lidocaína não devem ser administradas com o mesmo posicionamento da agulha.

Doses Recomendadas

Adultos Sadios: As doses recomendadas a seguir serão para adultos normais sadios e servem somente como guia para a quantidade de anestésico necessário na maior parte dos procedimentos de rotina. Em todos os casos a menor dose que produzir o efeito desejado, deverá ser a usada.

Se a técnica for usada corretamente, e se a agulha estiver posicionada corretamente no espaço subaracnóideo, não será necessário administrar mais do que uma ampola (100 mg).

Bloqueio Espinhal Baixo ou Bloqueio em Sela – Obstetrícia:

A dosagem recomendada para parto vaginal é de aproximadamente 1 mL (50 mg).

Para cirurgia cesariana que necessite de manipulação intra-uterina, 1,5 mL (75 mg) são geralmente suficientes.

Anestesia Cirúrgica: A dose recomendada para anestesia abdominal é de 1,5 mL a 2 mL (75 a 100 mg).

Crianças: A dose recomendada para adolescentes sadios de idade igual ou superior a 16 anos, é a mesma que a recomendada para adultos normais sadios.

Não existem dados suficientes em crianças com idade inferior a 16 anos para serem feitas recomendações de dosagem (Ver Precauções).

Soluções remanescentes que não forem utilizadas deverão ser descartadas após o seu uso.

Em preparações que contenham glicose, pode ocorrer caramelização sob aquecimento prolongado, e em algumas circunstâncias também sob armazenamento prolongado.

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.

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?

As reações adversas após a administração de lidocaína são de natureza similar àquelas observadas com outros agentes anestésicos locais do tipo amida. Estas reações estão de maneira geral relacionadas com a dose, podendo resultar de altos níveis plasmáticos causados por excesso de dosagem, rápida absorção ou injeção intravascular acidental, podendo também resultar de hipersensibilidade, idiossincrasia (reação individual a substância, em função de uma suscetibilidade incomum) ou diminuição da tolerância por parte do paciente. As reações adversas graves são geralmente de natureza sistêmica.

As frequências estão definidas como: muito comum ($\geq 1/10$); comum ($\geq 1/100$ a $< 1/100$); incomum ($\geq 1/1.000$ a $< 1/100$); rara ($\geq 1/10.000$ a $< 1/1.000$), muito raro ($< 1/10.000$) ou desconhecido (que não pode ser estimada a partir dos dados disponíveis).

Reação muito comum ($>1/10$): Dor transitória na coluna lombar, dor irradiada.

Reação comum ($>1/100$ e $<1/10$): Dor nas costas, sonolência, vertigem, hipotensão.

Reação incomum ($>1/1.000$ e $<1/100$): Depressão respiratória.

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

Relatos isolados: Parada respiratória.

Reações adversas com frequência desconhecida (não pode ser estimada a partir dos dados disponíveis): Porfíria aguda intermitente, miastenia grave, dormência na língua, delírio, nervosismo, tonturas, apreensão, euforia, confusão, letargia, zumbidos, visão dupla, vômitos, sensação de calor, frio ou dormência, contrações, tremores, convulsões, inconsciência, fala indistinta, visão turva, depressão do miocárdio, diminuição do débito cardíaco, bloqueio cardíaco, bradicardia, arritmias ventriculares, incluindo taquicardia ventricular e fibrilação ventricular e parada cardíaca, lesões cutâneas, urticária, edema ou reações anafilactóides.

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?

As emergências decorrentes da administração de anestésicos locais estão geralmente relacionadas com altos níveis plasmáticos durante o uso terapêutico dos anestésicos locais, ou de injeção acidental subaracnóidea da solução anestésica. A primeira consideração é a prevenção, através da monitorização cuidadosa e constante dos sinais vitais cardiovasculares e respiratórios e do estado de consciência do paciente depois de cada injeção de anestésico local. Ao primeiro sinal de mudança, oxigênio deve ser administrado.

Buscar tratamento de suporte às condições neurológicas, cardiovasculares e ventilatórias.

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 N.º 1.0298.0385

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



R_0385_02