

Lidocaína Spray 10%

Hipolabor Farmacêutica Ltda.

Solução Tópica

100mg/mL

lidocaína

Medicamento genérico Lei 9.787, de 1999

NOME GENÉRICO:

lidocaína

FORMA FARMACÊUTICA:

Solução tópica

APRESENTAÇÕES:

100mg/mL - Cartucho com 01 frasco de 50mL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO - PARA ANESTESIA TÓPICA

COMPOSIÇÃO:

Cada mL solução tópica contém:

lidocaína.....100mg

Veículo q.s.p.....1mL

(álcool etílico, propilenoglicol, L-mentol cristalizado, eucaliptol, sacarina ácida, hidróxido de sódio, ácido clorídrico e água de osmose reversa)

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento: O produto é indicado como anestésico tópico para uso em mucosas.

Aspectos físicos: frasco de vidro incolor spray de 50mL.

Características organolépticas: líquido incolor, odor característico.

Cuidados de armazenamento: Conservar em temperatura ambiente (15 a 30°C). Depois de aberto o frasco, este medicamento deve ser consumido em até 6 meses.

Prazo de Validade: 24 meses a partir da data de fabricação impressa na embalagem.

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.

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.

Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento.

Não use medicamento sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para a sua saúde.

Informe seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando. A lidocaína somente deve ser administrada durante a gravidez ou amamentação quando os benefícios justificarem os riscos.

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.

Tanto a administração como a suspensão do tratamento somente deverão ser feitas sob orientação de seu médico.

Para utilizar a solução spray, basta orientar a cânula para a região a ser anestesiada e imprimir 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.

Informe 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.

Raramente ocorrem reações alérgicas, nervosismo, tontura, queda de pressão, batimento mais lento do coração. caso ocorram estas reações, informar imediatamente ao médico.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início ou durante o tratamento.

Quando os anestésicos tópicos são utilizados na boca, o paciente deve estar ciente que a produção de anestesia local pode prejudicar a deglutição e, desta forma, aumentar o perigo de aspiração, ou seja, o alimento ir para os pulmões. Por esta razão, alimentos não devem ser ingeridos nos 60 minutos seguidos do uso de preparações anestésicas na boca e na região da garganta. Isto é particularmente importante em crianças, por causa da frequência de alimentação.

O produto está contraindicado a pacientes com conhecida hipersensibilidade a anestésicos locais do tipo amida (como a lidocaína) ou aos outros componentes da fórmula. Não deve ser aplicado na laringe. Seu uso não é recomendado a crianças menores de 5 anos ou com menos de 20kg de peso.

A lidocaína solução tópica spray deve ser usada com cuidado em pacientes com epilepsia, falha na condução cardíaca, batimento lento do coração, problema grave de fígado, com ferimentos ou infecção no local da aplicação ou em pacientes tratados com medicamentos antiarrítmicos.

A dormência da língua e da boca pode aumentar o risco de machucados por mordida. Evite contato com os olhos.

Em caso de dúvidas, procure orientação do farmacêutico ou de seu médico ou cirurgião-dentista.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

CARACTERÍSTICAS

A lidocaína está indicada para ser administrado topicamente em mucosas.

A lidocaína é um anestésico de superfície, possuindo grande poder de penetração nos tecidos e grande margem de segurança.

A lidocaína estabiliza a membrana neuronal pela inibição dos fluxos iônicos necessários para o início e a condução dos impulsos, assim efetuando a ação anestésica local.

A anestesia ocorre normalmente dentro de 1 a 3 minutos e persiste por aproximadamente 10 a 15 minutos.

O excessivo nível sanguíneo pode causar alterações no débito cardíaco, na resistência total periférica e na pressão arterial média. Estas alterações podem ser atribuídas ao efeito depressor direto do agente anestésico local sobre os vários componentes do sistema cardiovascular.

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 é absorvida no trato gastrointestinal, mas pouca droga intacta aparece na circulação por causa da biotransformação no fígado, onde é metabolizada rapidamente. Os metabólitos intactos da droga são excretados pelos rins.

A principal via de eliminação da lidocaína é por metabolismo hepático. A biotransformação inclui N-dealquilação oxidativa, anel de hidroxilação, clivagem da linhagem amida e conjugação. A N-dealquilação é a maior via de biotransformação, produzindo os metabólitos monoetil-glicinaxilidina e glicinaxilidina.

As ações farmacológicas e toxicológicas destes metabólitos são similares mas menos potentes em relação à lidocaína. A glicinaxilidina tem uma meia-vida maior (cerca de 10 horas) que a lidocaína e pode se acumular durante a administração a longo prazo. Aproximadamente 90% da lidocaína administrada intravenosamente é excretada na forma de vários metabólitos e menos de 10% é excretada inalterada. O metabólito primário encontrado na urina é o conjugado de 4-hidroxi-2,6-xilidina, respondendo por cerca de 70% a 80% da dose excretada na urina.

Normalmente, cerca de 64% da lidocaína liga-se às proteínas plasmáticas. Os anestésicos locais do tipo amida ligam-se principalmente a alfa-1-glicoproteína ácida, mas também à albumina. A alfa-1-glicoproteína ácida tem sítios de afinidade e de baixa capacidade e a albumina tem quantitativamente sítios de baixa afinidade e alta capacidade de menor importância.

A lidocaína atravessa a barreira hematoencefálica e a barreira placentária, presumivelmente por difusão passiva.

Estudos do metabolismo da lidocaína após injeção de *bolus* intravenoso mostram que a meia-vida do produto (eliminação) é de 1,5 a 2,0 horas.

Devido a essa rápida velocidade com a qual é metabolizada, qualquer condição que afete o funcionamento do fígado pode alterar a cinética da lidocaína.

A meia-vida pode ser dobrada em pacientes com disfunções hepáticas. A disfunção renal não afeta a cinética da lidocaína, mas pode aumentar a concentração de metabólitos. Fatores como acidose e o uso de estimulantes e depressores do SNC influenciam os níveis de lidocaína no SNC necessários para produzir a manifestação de efeitos sistêmicos. Reações adversas objetivas tornam-se muito mais aparentes com níveis venosos plasmáticos aumentados de 5 a 10mg/L.

Dados de segurança pré-clínica

A toxicidade observada após altas doses de lidocaína consiste em efeitos no 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.

INDICAÇÕES:

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.

CONTRAINDICAÇÕES:

A lidocaína está contraindicada em pacientes com história de hipersensibilidade a anestésicos locais do tipo amida ou a outros componentes da fórmula.

A lidocaína não deve ser aplicada na laringe.

O uso do produto não é recomendado em crianças menores de 5 anos ou com menos de 20kg de peso, em vista da concentração elevada (10%) e de sua rápida absorção.

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS:

De modo a poder controlar possíveis reações adversas, equipamento de ressuscitação, oxigênio e outras drogas afins deverão estar disponíveis quando os anestésicos locais do tipo amida forem administrados em membranas mucosas.

A lidocaína deverá ser utilizada 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 mais baixa dosagem 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 da droga e seus metabólitos. A tolerância varia de acordo com o estado do paciente.

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 cuidado em paciente em choque grave ou bloqueio cardíaco. Também deve-se ter cuidado com pacientes com conhecida sensibilidade a drogas. Pacientes alérgicos a derivados do ácido para-aminobenzoico, como procaina, tetracaína e benzocaína, não têm apresentado sensibilidade cruzada à lidocaína.

A absorção através das mucosas e superfícies feridas é relativamente alta, especialmente na laringe e árvore brônquica.

Deve ser usada com cautela em pacientes com epilepsia, falha na condução cardíaca, doença cardiovascular e insuficiência cardíaca, com bloqueio cardíaco parcial ou completo, idosos ou debilitados, com baixa capacidade de ligação proteica ou síndrome nefrótica, com disfunção renal grave, bradicardia, disfunção hepática, doença hepática avançada e choque grave, se a dose ou local de administração propiciarem altos níveis sanguíneos. 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. 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 drogas antiarrítmicas classe III (ex: amiodarona) devem estar sob cuidado e monitoramento cardíaco, uma vez que os efeitos cardíacos podem ser aditivos.

Gravidez e Amamentação:

Gravidez: Categoria B – Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião dentista. 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 maléficos diretos ou indiretos no feto.

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 outra droga, a lidocaína somente deve ser utilizada durante a gravidez ou amamentação se, a critério médico, os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS:

A administração concomitante de depressores centrais pode causar efeito aditivo na depressão do SNC. O uso associado a antiarrítmicos, como a tocainida, pode aumentar os efeitos tóxicos da lidocaína. Anticonvulsivos hidantóinicos aumentam os efeitos depressores cardíacos. Bloqueadores betaadrenérgicos podem diminuir o metabolismo hepático, aumentando a toxicidade da lidocaína. 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 antimiaستênicos sobre o músculo esquelético, especialmente se grandes quantidades de anestésicos são rapidamente absorvidas; pode ser necessário o ajuste temporário da dose dos antimiaستênicos 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.

REAÇÕES ADVERSAS E ALTERAÇÃO EM EXAMES LABORATORIAIS:

Reações adversas são geralmente relacionadas com a dose de anestésicos locais e resultam de altos níveis plasmáticos causados por dosagem excessiva ou rápida absorção, bem como por tolerância reduzida do paciente, idiossincrasia ou hipersensibilidade. As reações sistêmicas podem ocorrer rapidamente ou até 30 minutos após administração. Acidose acentuada ou hipóxia podem aumentar o risco e a gravidade das reações tóxicas. São raras as reações adversas à lidocaína nas doses recomendadas. As seguintes reações adversas foram observadas com todas as vias de administração e não foram necessariamente relatadas durante seu uso tópico.

Reações Alérgicas: São extremamente raros os casos de reações alérgicas associadas a anestésicos locais do tipo amida, sendo que nos casos mais graves pode ocorrer choque anafilático. Podem ocorrer rash cutâneo, eritema, urticária, prurido, espirros, edema urticariforme na face, lábios, língua, boca ou garganta, que podem ser acompanhados por náusea com ou sem vômito. O valor dos testes cutâneos para determinação de sensibilidade é duvidoso.

Sistema Cardiovascular: As manifestações cardiovasculares são normalmente depressoras e caracterizadas por vasodilatação periférica, bradicardia, hipotensão, depressão do miocárdio, diminuição do débito cardíaco, arritmias ventriculares e colapso cardiovascular que podem levar a parada cardíaca. A hipóxia causada por convulsões e apneia pode ser um fator contribuinte nas reações cardiovasculares.

Sistema Nervoso Central: São manifestações excitatórias e/ou depressivas caracterizadas por delírio, nervosismo, apreensão, euforia, confusão, tontura, sonolência, tinido, visão turva, vômito, sensações de calor e frio, tremores, contorções, convulsões, inconsciência, depressão respiratória e colapso. As manifestações excitatórias podem ser muito breves ou podem simplesmente não ocorrer. Em alguns pacientes, especialmente crianças, a primeira manifestação de toxicidade pode ser uma sonolência, progredindo para inconsciência e parada respiratória.

Metemoglobinemia: Pode ocorrer muito raramente com anestésicos locais, porém é mais provável quando o anestésico é a prilocaína.

Interferência em 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.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificações em Vigilância Sanitária - NOTIVISA, disponível em www.anvisa.gov.br, ou para Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal.

POSOLOGIA:

Como para qualquer anestésico local, as reações e complicações são evitadas utilizando-se a mínima dose eficaz.

O cloridrato de 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 - 3 minutos, dependendo da área de aplicação.

Nos pacientes idosos ou debilitados e nas crianças, deve-se adequar as doses com a idade e as condições físicas.

Cada nebulização libera 10mg de lidocaína base. É desnecessário secar o local antes da aplicação.

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 50mg).

Otorrinolaringologia: 3 aplicações para punção da cavidade maxilar (30mg).

Durante o parto: até 20 aplicações (até 200mg).

Durante instrumentação: até 20 aplicações (200mg).

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.

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.

Modo de Usar:

Para utilizar a solução spray, basta orientar a cânula para a região a ser anestesiada e imprimir 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.

SUPERDOSAGEM:

Emergências graves consequentes aos anestésicos locais geralmente estão relacionadas com altos níveis plasmáticos do anestésico.

A primeira consideração é preventiva, com cuidadoso acompanhamento de sinais vitais respiratórios e cardiovasculares e do nível de consciência do paciente após cada administração de anestésico.

O tratamento do paciente com manifestações tóxicas consiste em assegurar a oxigenação através da ventilação, controle das convulsões e suporte hemodinâmico. As convulsões devem ser tratadas através da administração de diazepam intravenoso 0,1mg/kg ou tiopental sódico 1 - 3mg/kg. Considerando que o tratamento pode também causar depressão respiratória, os meios de manutenção ou controle da respiração 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.

Em caso de intoxicação ligue par 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações.

PACIENTES IDOSOS:

Pacientes idosos são, em geral, mais sensíveis aos efeitos tóxicos sistêmicos. O uso nesses pacientes deverá ser cauteloso e as doses deverão ser reduzidas.

DIZERES LEGAIS

MS: 1.1343.0175

Farm Resp: Dr. Renato Silva

CRF-MG: 10.042

HIPOLABOR FARMACÊUTICA Ltda.

Rod BR 262 - Km 12,3 Borges /Sabará - MG

CEP: 34.735-010

SAC 0800 031 1133

CNPJ: 19.570.720/0001-10

Indústria Brasileira

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Rev.01

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/ notificação que altera a bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data do expediente	No. expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
	NA – objeto de pleito desta notificação eletrônica	Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12					Harmonização com a bula do medicamento de referência conforme RDC 47/2009.	VP/VPS	100mg/mL – Cartucho com 01 frasco 50mL.