

Modelo de Bula - AstraZeneca

D) IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

XYLOCAÍNA[®] Pomada 5%

lidocaína

Sabor Laranja

FORMA FARMACÊUTICA, VIA DE ADMINISTRAÇÃO E APRESENTAÇÃO COMERCIALIZADA

Pomada. Via de administração: aplicação tópica sobre mucosa oral. Embalagem com bisnaga contendo 25 g.

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO

Cada g contém:

lidocaína 50 mg

Excipientes q.s.p. 1 g

Excipientes: óleo de laranja, corante amarelo crepúsculo CI 15985, sacarina sódica, butilhidroxianisol, propilenoglicol e macrogol.

II) INFORMAÇÕES AO PACIENTE

1. COMO ESTE MEDICAMENTO FUNCIONA?

O uso de **XYLOCAÍNA Pomada** que é um anestésico local, causa uma perda temporária de sensibilidade na área onde é aplicada. **XYLOCAÍNA Pomada** também é efetiva quando aplicada em mucosas e pele danificada, mas não quando for aplicada a pele intacta.

XYLOCAÍNA Pomada tem seu início de ação dentro de 0,5 a 5 minutos após a aplicação.

2. POR QUE ESTE MEDICAMENTO FOI INDICADO?

XYLOCAÍNA Pomada é indicada para anestesia tópica de mucosa oral.

3. QUANDO NÃO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Contra-indicações

Você não deve utilizar **XYLOCAÍNA Pomada** nas seguintes situações:

- Alergia a lidocaína, a outros anestésicos locais ou aos outros componentes da fórmula.
- Não deve ser aplicada nos olhos.

Advertências

XYLOCAÍNA Pomada deve ser utilizada com cuidado nas seguintes situações:

- Em pacientes com mucosa traumatizada, pacientes debilitados ou pacientes com doenças agudas, pacientes com sépsis, doença hepática grave ou insuficiência cardíaca e crianças com mais de 12 anos de idade que pesam menos que 25 kg, as doses são de acordo com o peso e condição fisiológica do paciente.
- Quando **XYLOCAÍNA Pomada** é usada na boca ou região da garganta, o paciente deve estar ciente que a aplicação do anestésico tópico pode prejudicar a deglutição e, portanto, intensificar o perigo de aspiração. O entorpecimento da língua ou mucosa da boca pode aumentar o perigo de trauma por mordida.
- Em pacientes em uso de medicamentos para o tratamento de arritmias cardíacas (ex.: amiodarona), uma vez que os efeitos cardíacos são aditivos.

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

O uso de XYLOCAÍNA Pomada não é recomendado em crianças menores de 5 anos de idade. O uso também não é recomendado em crianças com menos de 20 kg de peso.

Informe ao médico ou cirurgião-dentista o aparecimento de reações indesejáveis.

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.

Precauções

Dependendo da dose, os anestésicos locais podem ter um pequeno efeito na função mental e na coordenação. Nas doses recomendadas é pouco provável que ocorram reações adversas.

Interações medicamentosas

XYLOCAÍNA Pomada deve ser utilizada com cuidado nas seguintes situações:

- Em pacientes em uso dos medicamentos antiarrítmicos, betabloqueadores, cimetidina e outros anestésicos locais.

4. COMO DEVO USAR ESTE MEDICAMENTO?

Aspecto físico

XYLOCAÍNA Pomada é apresentada na forma de pomada de cor laranja.

Características organolépticas

Ver aspecto físico.

Dosagem

Adultos:

Não se recomenda utilizar mais do que 20 g da pomada a cada período de 24 horas.

Recomendações e dose única máxima de XYLOCAÍNA Pomada em adultos por tipo de aplicação

Área	Dose recomendada de pomada (g)	Dose máxima de pomada (g)
Procedimentos orais e dentais	1-5	10

Crianças entre 5 a 12 anos de idade e maiores que 20 kg de peso:

A dose única não deve exceder 0,1 g/kg de peso corpóreo (corresponde a 5 mg de lidocaína/kg de peso corpóreo). O intervalo de dose mínimo em crianças deve ser de 8 horas.

Em pacientes debilitados ou idosos e em crianças maiores de 12 anos e menos de 25 kg, pacientes com doenças agudas ou pacientes com sépsis, as doses deverão ser adequadas à idade, ao peso e às condições físicas do paciente.

Como usar

Use a menor quantidade necessária de **XYLOCAÍNA Pomada** para controlar os sintomas. Aplique uma pequena camada, usando o suficiente para cobrir a área afetada, e reaplique quando preciso em intervalos toleráveis.

Em odontologia deve-se secar a mucosa antes da aplicação. Espere 0,5-5 minutos para a ação anestésica tornar-se efetiva.

Siga a orientação de seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Não use o medicamento com o prazo de validade vencido. Antes de usar observe o aspecto do medicamento.

5. QUAIS OS MALES QUE ESTE MEDICAMENTO PODE CAUSAR?

Reações adversas por ordem decrescente de gravidade.

1. As reações adversas sistêmicas são raras e podem resultar de níveis sanguíneos elevados devido a excesso de dose, por rápida absorção ou por hipersensibilidade, características próprias do paciente ou reduzida tolerância do paciente. Sendo as mesmas:

- As reações do Sistema Nervoso Central incluem: nervosismo, tontura, convulsões, inconsciência e, possivelmente, parada respiratória.
- As reações cardiovasculares incluem: queda da pressão arterial, diminuição da contração ou da força de contração do coração, batimentos lentos do coração e, possivelmente, parada cardíaca.

2. Reações de natureza alérgica (nos casos mais graves choque anafilático) associadas à anestésicos locais do tipo amino-amida são raras (< 0,1%). As reações são predominantemente de sensibilidade no local de contato e são raramente sistêmicas.

3. Produtos tópicos que contém propilenoglicol podem causar irritação na pele.

6. O QUE FAZER SE ALGUÉM USAR UMA GRANDE QUANTIDADE DESTE MEDICAMENTO DE UMA SÓ VEZ?

Em caso de administração de uma quantidade de medicamento maior do que a prescrita pelo seu médico, você deve contatá-lo imediatamente.

A lidocaína pode causar reações tóxicas agudas se ocorrerem níveis sistêmicos elevados devido à rápida absorção ou superdosagem. Com o uso das doses recomendadas de **XYLOCAÍNA Pomada** não tem sido relatados efeitos tóxicos.

Efeitos não previstos podem acontecer. Se você notar qualquer efeito incomum enquanto esteja usando a **XYLOCAÍNA Pomada**, deixe de usar a pomada e contate o seu médico o mais cedo possível.

7. ONDE E COMO DEVO GUARDAR ESTE MEDICAMENTO?

XYLOCAÍNA Pomada deve ser mantida em temperatura entre 15°C e 25°C.

Todo medicamento deve ser mantido em sua embalagem original até o momento do uso.

Depois de aberta a bisnaga, este medicamento deve ser mantido na sua embalagem original e deverá ser consumido em até 3 meses.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

III) INFORMAÇÕES TÉCNICAS

1. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Propriedades Farmacodinâmicas

A lidocaína é absorvida após a aplicação da **XYLOCAÍNA Pomada** nas mucosas e pele danificadas. É inativa quando for aplicada à pele íntegra. A absorção ocorre mais rapidamente após administração intratraqueal. O início de ação é 0,5 – 5 minutos em mucosas.

A lidocaína, como outros anestésicos locais, causa um bloqueio reversível da propagação do impulso ao longo das fibras nervosas através da prevenção do movimento de íons sódio para dentro das membranas nervosas. Presume-se que anestésicos locais do tipo amida atuem dentro dos canais de sódio das membranas nervosas.

Anestésicos locais podem também ter efeitos similares nas membranas excitáveis do cérebro e do miocárdio. Se quantidades excessivas do fármaco atingirem a circulação sistêmica rapidamente, sinais e sintomas de toxicidade poderão aparecer, provenientes dos sistemas cardiovascular e nervoso central.

A toxicidade no Sistema Nervoso Central geralmente precede os efeitos cardiovasculares, uma vez que ela ocorre em níveis plasmáticos mais baixos. Efeitos

diretos dos anestésicos locais no coração incluem condução lenta, inotropismo negativo e, eventualmente, parada cardíaca.

A lidocaína na forma de pomada diminui significativamente a dor de injeções dentais quando comparado ao placebo. A lidocaína pomada aplicada ao tubo endotraqueal antes da intubação diminui a ocorrência de dor de garganta pós-operatória. Estudos controlados demonstram sua eficácia como um analgésico pós-operatório em odontologia, em otorrinolaringologia e depois de circuncisão.

Além do seu efeito de anestesia local, a lidocaína tem propriedades antibacteriana e antivirótica em concentrações acima de 0,5–2%, dependendo das espécies. A lidocaína em concentrações de 1–4% induz uma inibição concentração-dependente de crescimento geralmente em uma variedade de patógenos encontrada em infecções de ferida, como *Enterococcus faecalis*, *Escherichia coli*, *Pseudomonas aeruginosa* e *Staphylococcus aureus*. A maior sensibilidade é mostrada através de organismos gram-negativos. A lidocaína em concentrações de 2–4% inibe o crescimento de um número de *S. aureus* meticilina-resistente e *Enterococci* vancomicina-resistente de cepas isoladas.

Propriedades Farmacocinéticas

A lidocaína é absorvida após aplicação tópica em mucosas. A velocidade e a extensão da absorção dependem da dose total administrada e da concentração, do local de aplicação e da duração da exposição. Geralmente, a velocidade de absorção de agentes anestésicos locais após aplicação tópica é mais rápida após administração intratraqueal e bronquial. A lidocaína também é bem absorvida no trato gastrointestinal, mas pouco fármaco intacto aparece na circulação por causa da biotransformação no fígado.

Após a inserção de um tubo endotraqueal lubrificado com em média de 1,26 g (0,49 – 2,45) de **XYLOCAÍNA Pomada** em pacientes entre 18 e 80 anos, o pico de concentração plasmática de lidocaína foi 0,45 (0,2 – 0,9) mcg/ml e normalmente foi observado dentro de 15 minutos. Um aumento de dose de 1 g de pomada resultou em um aumento em média da concentração plasmática de 0,22 mcg/ml.

A ligação da lidocaína às proteínas plasmáticas é dependente da concentração e a fração de ligação diminui com o aumento da concentração. Nas concentrações de 1 a 4 mcg de base livre por ml, 60 a 80% da lidocaína é de ligação protéica. A ligação é também dependente da concentração plasmática de alfa-1-glicoproteína ácida.

A lidocaína atravessa as barreiras hematoencefálica e placentária, presumivelmente por difusão passiva.

A lidocaína é rapidamente metabolizada no fígado e os metabólitos e a droga inalterada são excretados pelos rins. A biotransformação inclui N-desalquilação oxidativa, hidroxilação cíclica, clivagem da ligação amídica e conjugação. N-desalquilação, uma via principal de biotransformação produz os metabólitos monoetilglicinexilidida e glicinexilidida. As ações farmacológicas/toxicológicas destes metabólitos são semelhantes, mas menos potentes do que aqueles da lidocaína. Aproximadamente 90% da lidocaína administrada é excretada na forma de vários metabólitos e menos do que 10% é excretado inalterado. O metabólito primário na urina é um conjugado de 4-hidroxi-2,6-dimetilanilina.

A meia-vida de eliminação da lidocaína seguida de uma injeção intravenosa em *bolus* é tipicamente 1,5 a 2 horas. Devido à rápida velocidade em que a lidocaína é metabolizada, qualquer condição que afete a função hepática pode alterar a cinética da lidocaína. A meia-vida pode ser prolongada duas vezes ou mais em pacientes com disfunção hepática. A disfunção renal não afeta a cinética da lidocaína, mas pode aumentar o acúmulo 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 superiores à 6,0 mcg de base livre por ml.

Dados de segurança pré-clínica

A toxicidade observada após altas doses de lidocaína em estudos com animais consiste em efeitos no Sistema Nervoso Central e Sistema Cardiovascular. Em estudos de toxicidade reprodutiva nenhuma relação da droga 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 a duração do uso desta droga.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

Kuo MJ *et al.*, realizaram um estudo prospectivo randomizado sobre o uso e eficácia da lidocaína na forma pomada 5% em comparação com o uso de vaselina no tratamento da dor causada pelo uso de tampão nasal pós-cirurgia septal. Os pacientes foram avaliados através da escala analógica visual de dor e os resultados demonstraram que o uso de lidocaína diminuiu significativamente a dor nas primeiras 3 horas ($P < 0,05$) sendo que nas 6 horas seguintes e na remoção do tampão ocorreu uma diminuição importante da dor, mas não significativa. Os autores concluem que o uso tópico de lidocaína na forma pomada é segura e alivia a dor pós-operatória causada pelo tampão nasal (Kuo MJ *et al.* Clin Otolaryngol 1995; 20(4): 357-9).

3. INDICAÇÕES

Anestesia tópica de mucosa oral.

4. CONTRA-INDICAÇÕES

Hipersensibilidade aos anestésicos locais do tipo amida ou aos outros componentes da fórmula.

Não deve ser aplicada nos olhos. O seu uso não é recomendado em crianças menores de 5 anos de idade. O uso também não é recomendado em crianças com menos de 20 kg de peso.

5. MODO DE USAR E CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO DEPOIS DE ABERTO

Modo de Usar

A pomada é de aplicação tópica de mucosa oral.

Em odontologia deve-se secar a mucosa antes da aplicação. Espere 0,5-5 minutos para a ação anestésica tornar-se efetiva.

Cuidados de conservação depois de aberto

Depois de aberta a bisnaga, este medicamento deve ser mantido na sua embalagem original e deverá ser consumido em até 3 meses. Conservar em temperatura entre 15°C e 25°C.

Todo medicamento deve ser mantido em sua embalagem original até o momento do uso.

6. POSOLOGIA

A lidocaína pomada é absorvida após a aplicação a mucosas ou pele danificada, mas não quando for aplicada à pele intacta. A absorção ocorre mais rapidamente após administração intratraqueal. Após administração tópica da **XYLOCAÍNA Pomada** na mucosa oral, o início de ação ocorre dentro de 30 segundos a 5 minutos.

Como qualquer anestésico local, a segurança e a eficácia da lidocaína dependem da dose apropriada, da técnica correta, precauções adequadas e facilidade para emergências.

As seguintes recomendações de dose devem ser consideradas como um guia. A experiência do clínico e conhecimento do estado físico do paciente são importantes para calcular a dose necessária.

Recomendações e dose única máxima de XYLOCAÍNA Pomada em adultos por tipo de aplicação

Área	Dose recomendada de pomada (g)	Dose recomendada de lidocaína base (mg)	Dose máxima de pomada (g)	Dose máxima de lidocaína base (mg)
Procedimentos orais e dentais	1-5	50-250	10	500

Não se recomenda utilizar mais do que 20 g da pomada a cada período de 24 horas em pacientes saudáveis. **XYLOCAÍNA Pomada** pode ser usada em pacientes idosos sem redução de dose. **XYLOCAÍNA Pomada** pode ser usada com cautela em pacientes com mucosas traumatizadas. Pacientes debilitados ou intensamente doentes, pacientes com sepsis, doença hepática grave ou insuficiência cardíaca, em crianças com mais de 12 anos de idade e menos de 25 kg as doses devem ser mensuradas de acordo com o peso e condições físicas.

Não há dados disponíveis de concentração plasmática em crianças. Consequentemente, por razões de segurança, em crianças entre 5 e 12 anos de idade, mais de 20 kg, deve ser assumida 100 % de biodisponibilidade após a aplicação nas mucosas e pele danificada e uma dose única não pode exceder 0,1 g de pomada/kg de peso corpóreo (correspondendo a 5 mg de lidocaína/kg de peso corpóreo). O intervalo de dose mínimo em crianças deve ser de 8 horas.

7. ADVERTÊNCIAS

Doses excessivas de lidocaína ou pequenos intervalos entre as doses podem resultar em níveis plasmáticos altos de lidocaína e reações adversas graves. Os pacientes devem ser instruídos a aderir estritamente a posologia indicada. O controle de reações adversas graves pode requerer o uso de aparelho ressuscitador, oxigênio e outras drogas ressuscitadoras.

Pacientes debilitados ou pacientes com doenças agudas, com mucosa traumatizada, pacientes com sépsis, doença hepática grave ou insuficiência cardíaca e crianças com mais de 12 anos de idade que pesam menos que 25 kg, as doses são de acordo com o peso e condição fisiológica do paciente.

A absorção da lidocaína através de superfícies feridas e das mucosas é relativamente alta, especialmente na árvore brônquica. Isto deverá ser levado em consideração especialmente quando a pomada for utilizada em crianças no tratamento de grandes áreas.

Pacientes tratados com drogas antiarrítmicas classe III (ex.: amiodarona) devem ser monitorados e o monitoramento do ECG deve ser considerado, uma vez que os efeitos cardíacos podem ser aditivos.

Quando **XYLOCAÍNA Pomada** é usada na boca ou região da garganta, o paciente deve estar ciente que a aplicação do anestésico tópico pode prejudicar a deglutição e, portanto, intensificar o perigo de aspiração. O entorpecimento da língua ou mucosa da boca pode aumentar o perigo de trauma por mordida.

Outros locais de administração não recomendados devem ser evitados devido aos efeitos indesejáveis desconhecidos.

Efeitos sobre a capacidade de dirigir veículos e operar máquinas: dependendo da dose, os anestésicos locais podem ter um pequeno efeito na função mental e na coordenação, até mesmo na ausência de toxicidade evidente do Sistema Nervoso Central e pode prejudicar temporariamente a locomoção e a agilidade. Nas doses recomendadas é pouco provável que ocorram reações adversas.

Uso durante a gravidez e lactação:

Categoria de risco na gravidez: B.

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

A lidocaína atravessa a barreira placentária e pode penetrar nos tecidos fetais. É razoável presumir que a lidocaína tem sido administrada a um grande número de mulheres grávidas ou que possam vir a engravidar. Não foram relatados distúrbios específicos do processo reprodutivo, como por exemplo, uma maior incidência de más-formações ou outros efeitos nocivos diretos ou indiretos ao 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 para qualquer outra droga, a lidocaína somente deve ser usada durante a gravidez ou lactação se, a critério médico, os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

8. USO EM IDOSOS, CRIANÇAS E OUTROS GRUPOS DE RISCO

Ver item Posologia.

9. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Quando a lidocaína é usada em altas doses, deve-se considerar o risco adicional de toxicidade sistêmica em pacientes recebendo outros anestésicos locais ou agentes relacionados estruturalmente com anestésicos locais, por exemplo, antiarrítmicos como a mexiletina e tocinida.

Estudos de interações específicas com lidocaína e drogas antiarrítmicas classe III (ex.: amiodarona) não foram realizados, porém deve-se ter cuidado.

Drogas que reduzem a depuração plasmática de lidocaína (ex.: cimetidina ou betabloqueadores) podem causar concentrações plasmáticas potencialmente tóxicas quando a lidocaína é administrada em altas doses e repetidamente por um longo período. Tais interações, entretanto, não tem importância clínica relevante durante o tratamento a curto prazo com lidocaína (ex.: **XYLOCAÍNA Pomada**) com as doses recomendadas.

10. REAÇÕES ADVERSAS A MEDICAMENTOS

Reações adversas por ordem decrescente de gravidade.

1. As reações adversas sistêmicas são raras e podem resultar de níveis plasmáticos elevados devido a excesso de dose, por rápida absorção ou por hipersensibilidade, idiosincrasia ou reduzida tolerância do paciente. Sendo as mesmas:

- As reações do SNC incluem: nervosismo, tontura, convulsões, inconsciência e, possivelmente, parada respiratória.
- As reações cardiovasculares incluem: hipotensão, depressão miocárdica, bradicardia e, possivelmente, parada cardíaca.

2. Reações de natureza alérgica (nos casos mais graves choque anafilático) associadas à anestésicos locais do tipo amino-amida são raras (< 0,1%). As reações são predominantemente de sensibilidade no local de contato e são raramente sistêmicas.

3. Produtos tópicos que contém propilenoglicol podem causar irritação na pele.

11. SUPERDOSE

A lidocaína pode causar reações tóxicas agudas se ocorrerem níveis sistêmicos elevados devido à rápida absorção ou superdosagem. Com o uso das doses recomendadas de **XYLOCAÍNA Pomada** não têm sido relatados efeitos tóxicos.

Se ocorrer toxicidade sistêmica, os sinais são de natureza similar àqueles encontrados na administração de anestésicos locais por outras vias.

A toxicidade dos anestésicos locais se manifesta por sintomas de excitação do sistema nervoso e, em casos mais graves, depressão cardiovascular e do Sistema Nervoso Central.

Os sintomas neurológicos graves (convulsões, depressão do SNC) devem ser tratados sintomaticamente por meio de suporte respiratório e administração de fármacos anticonvulsivantes.

Tratamento da toxicidade aguda

Se convulsões ocorrerem, os objetivos do tratamento são manter a ventilação e oxigenação e dar suporte a circulação.

Deve-se manter a oxigenação e, se necessário, ventilação assistida (máscara e balão ou intubação traqueal). Se as convulsões não pararem espontaneamente em 15-20 segundos, um anticonvulsivante deve ser administrado por via i.v. para facilitar a adequada ventilação e oxigenação.

A tiopentona sódica 1-3 mg/kg intravenosa é a primeira escolha. Como alternativa pode-se administrar diazepam 0,1 mg/kg intravenoso, embora sua ação seja lenta. Convulsões prolongadas podem comprometer a ventilação e a oxigenação dos pacientes. Se isso ocorrer, um relaxante muscular injetável (ex.: succinilcolina 1 mg/kg de peso corpóreo) irá facilitar a ventilação e a ventilação pode ser controlada. Intubação endotraqueal primária pode ser considerada nestas situações.

Se for evidente depressão cardiovascular (hipotensão, bradicardia), um simpatomimético ex.: efedrina 5-10 mg intravenosa deve ser administrada e sua administração pode ser repetida, se necessário, após 2-3 minutos.

Se ocorrer parada circulatória, deve-se instituir imediatamente ressuscitação cardiopulmonar. Oxigenação ótima ininterrupta, ventilação e manutenção da circulação, como também, tratamento da acidose, são de vital importância.

12. ARMAZENAGEM

Conservar em temperatura entre 15°C e 25°C.

IV) DIZERES LEGAIS

ANVISA/MS - 1.1618.0101.007-5

Farm. Resp.: Dra. Daniela M. Castanho - CRF-SP nº 19.097

Fabricado por: **AstraZeneca do Brasil Ltda.**

Rod. Raposo Tavares, km 26,9 - Cotia - SP - CEP 06707-000

CNPJ 60.318.797/0001-00

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Indústria Brasileira

Nº do lote, data de fabricação e data de validade: vide cartucho.

Todas as marcas nesta embalagem são propriedade do grupo de empresas AstraZeneca.

Logo do SAC: 0800- 0145578

CDS 02.02.05

Outubro/05