



CITOCAÍNA® 3%

cloridrato de prilocaína
com felipressina 0,03 UI/mL

FORMA FARMACÉUTICA:

Solução Injetável - 1,8 mL.

APRESENTAÇÃO:

Caixa contendo 25 e 50 carpules de 1,8 mL.
Caixa contendo 40 carpules de 1,8 mL em estojos esterilizados.

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO:

Cada mL contém:
cloridrato de prilocaína 30 mg
felipressina 0,03 UI
veículo estéril q.s.p. 1 mL
(Veículo: cloreto de sódio, metilparabeno e água para injetáveis).

INFORMAÇÃO TÉCNICA:

Conservar a embalagem fechada, em temperatura ambiente controlada, entre 15°C e 25°C, e protegida da luz.

O prazo de validade do produto é de 24 meses a partir da data de fabricação, impressa na embalagem, sendo que após este prazo, o produto pode não apresentar mais efeito terapêutico.

O médico ou o dentista deve estar ciente da ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término, bem como se a paciente está amamentando.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

CARACTERÍSTICAS

A CITOCAÍNA® 3% contém prilocaína, que é um anestésico do tipo amida com potência similar a lidocaína, e felipressina, que é uma alternativa adequada para a epinefrina como agente local desde que a isquemia local não seja necessária.

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

Apresenta menor toxicidade que a lidocaína. As doses necessárias para produção de sintomas tóxicos do SNC são 30-50% maiores com prilocaína que com lidocaína. No entanto, os anestésicos locais podem ter efeito similar em membranas excitáveis no cérebro e no miocárdio. Se quantidades excessivas do fármaco alcançarem rapidamente a circulação sistêmica, aparecerão sinais e sintomas de toxicidade, originados principalmente 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. Os efeitos diretos dos anestésicos locais no coração incluem condução lenta, inotropismo negativo e, eventualmente, parada cardíaca.

A felipressina é um hormônio sintético do lobo pituitário posterior caracterizado por propriedades vasoconstritoras usada em soluções anestésicas odontológicas. A felipressina possui baixa toxicidade e é bem tolerada pelos tecidos.

A prilocaína tem ligação de 40% a 55% com proteínas plasmáticas, principalmente à alfa-1-glicoproteína ácida.

A prilocaína é metabolizada no fígado, rins e pulmões. Um dos metabólitos é a o-toluidina, a qual induz um aumento na quantidade de metahemoglobina no sangue.

Apenas pequena proporção de prilocaína (menos do que 5%) é excretada inalterada pela urina.

A meia-vida média de eliminação após injeção I.V. de prilocaína é de aproximadamente 1,6 hora. A prilocaína atravessa as barreiras hematoencefálica e placentária.

Insuficiência hepática ou renal pode afetar a eliminação de prilocaína e levar ao acúmulo de prilocaína e/ou seus metabólitos.

A CITOCAÍNA® 3% apresenta uma excepcional eficácia anestésica em diversos tipos de bloqueios odontológicos, sendo que a duração da anestesia nos tecidos moles da cavidade oral (mucosa da gengiva, língua) é muito menor do que nos tecidos dentários propriamente ditos. Isto traz uma vantagem evidente ao dentista, pois a sensação de "boca inchada" após bloqueio anestésico odontológico dura muito menos.

A felipressina é um novo vasoconstritor de natureza polipeptídica agindo na porção vascular do leito capilar e que não apresenta reações colaterais sistêmicas, tais como taquicardia e mal estar, comum com o emprego da adrenalina.

Deste modo, a CITOCAÍNA® 3% apresenta uma notável tolerância clínica, não provocando reações alérgicas e sendo especialmente indicada para pacientes sensíveis a epinefrina.

As características clínicas da prilocaína como baixa toxicidade, boa duração do efeito anestésico, reduzido tempo de latência e duração de efeito mais prolongado para o dente que para os tecidos moles; uma potente ação vasoconstritora local com baixíssima incidência de efeitos colaterais sistêmicos torna a CITOCAÍNA® 3% com felipressina o anestésico local ideal para a anestesia regional odontológica.

INDICAÇÕES:

A CITOCAÍNA® 3% está indicada para anestesia de bloqueio nervoso regional em odontologia.

Anestesia de infiltração em odontologia, onde não há necessidade de isquemia profunda na área injetada.

CONTRAINDICAÇÕES:

Hipersensibilidade conhecida a anestésicos locais do tipo amida, a felipressina ou a outros componentes da fórmula, e em casos

de metahemoglobinemia congênita ou idiopática. Pacientes que apresentem hipertermia maligna (hiperpirexia). Pacientes com doença hepática avançada, grave disfunção renal ou tireotoxicose (hipertireoidismo).

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS:

A segurança e eficácia do agente anestésico local (cloridrato de prilocaína) dependem de dose apropriada, técnica correta de injeção, precauções adequadas e prontidão para ocorrência de emergências.

Embora quase livre de efeitos adversos quando associado a prilocaína, a felipressina pode causar um aumento na pressão sanguínea ou constrição coronária, se uma superdosagem for administrada.

Antes da administração de um anestésico local, deve-se verificar a disponibilidade de equipamentos para oxigenação e ventilação assistida, monitorização cardíaca e medicamentos utilizados no tratamento das reações adversas.

O paciente deve ser avisado para ter cuidado para não traumatizar os lábios, língua, mucosa da bochecha ou palato mole quando estas estruturas forem anestesiadas. A ingestão de alimentos deve ser adiada até a volta da função e sensibilidade normais.

Nas áreas da cabeça e pescoço, incluindo retrobulbar, dental e bloqueio do gânglio estrelado devido à proximidade do SNC, a injeção intravascular de pequenas doses de anestésicos locais pode causar reações adversas similares àquelas observadas após a injeção intravascular inadvertida de altas doses em outras áreas do corpo.

Acidose ou hipóxia podem aumentar o risco e a gravidade das reações adversas. Tais reações envolvem o Sistema Nervoso Central e o Sistema Cardiovascular.

Apesar da dose de CITOCAÍNA® 3% (cloridrato de prilocaína - felipressina) empregada usualmente em odontologia ser pequena, alguns pacientes necessitam de atenção especial para reduzir o risco de efeitos adversos graves:

- Pacientes com bloqueio cardíaco parcial ou completo devido à possibilidade de depressão miocárdica pelos anestésicos locais.
- Pacientes idosos e pacientes debilitados.
- Pacientes com hipertensão grave ou não tratada, doença cardíaca grave, diabetes avançada, anemia grave ou distúrbio circulatório de qualquer origem, ou qualquer outra condição patológica.
- Os anestésicos locais devem ser evitados quando há infecção na região da injeção.

Pode ocorrer metahemoglobinemia após a administração de prilocaína, conforme mostra o item reações adversas.

- Pacientes jovens, pacientes portadores de metahemoglobinemia congênita ou idiopática ou pacientes com deficiência de glicose-6-fosfato são mais suscetíveis a metahemoglobinemia.

Dependendo da dose, os anestésicos locais podem ter um pequeno efeito na função mental e podem prejudicar temporariamente a locomoção e coordenação.

Pacientes pediátricos

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

Carcinogenicidade, mutagenicidade e diminuição da fertilidade
Estudos realizados em animais com o uso de prilocaína para avaliar o potencial carcinogênico e mutagênico ou efeitos sobre a fertilidade ainda não foram conduzidos.

Gravidez e Lactação

Categoria de risco na gravidez: B

O cloridrato de prilocaína e felipressina estão contraindicados em mulheres grávidas visto que a felipressina exerce ação no útero e a prilocaína atravessa facilmente a placenta e concentrações plasmáticas livres são semelhantes no feto e na mãe.

Não é conhecido se o cloridrato de prilocaína e a felipressina são excretadas no leite materno.

Como para qualquer outro fármaco, a prilocaína e a felipressina somente devem ser usadas durante a gravidez ou lactação se, a critério médico, os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS:

A prilocaína está associada ao desenvolvimento de metahemoglobinemia e deve ser empregada com cautela em pacientes que fazem uso de fármacos indutores de metahemoglobinemia como: sulfonamidas, acetaminofeno, benzocaina, cloroquina, dapsona, nitratos e nitritos, nitrofurantoina, nitroglicerina, nitroprussiato, pamaquina, ácido para-amino-salicílico, fenacetina, fenobarbital, fenitoína, primaquina e quinina. Devido à baixa toxicidade aguda, felipressina não aumenta a toxicidade da solução de prilocaína.

A felipressina, nas doses usadas na CITOCAÍNA® 3% (cloridrato de prilocaína - felipressina), não interage com os antidepressivos tricíclicos.

REAÇÕES ADVERSAS/COLATERAIS E ALTERAÇÕES DE EXAMES LABORATORIAIS:

As reações a CITOCAÍNA® 3% (cloridrato de prilocaína - felipressina) são muito raras em procedimentos dentários nas doses recomendadas e são similares às observadas com outros anestésicos locais. As reações adversas são geralmente dose-dependentes e podem ser resultado de uma concentração plasmática elevada por dose excessiva, injeção intravascular acidental, absorção rápida ou hipersensibilidade.

As reações psicogênicas são comuns antes ou durante os procedimentos odontológicos e podem mimetizar os sintomas de reações aos anestésicos locais como síncope, hiperventilação, náuseas, vômitos, alterações nos batimentos cardíacos e

pressão arterial.

SNC :

A incidência de complicações neurológicas (ex.: déficit neurológico persistente) associadas ao uso de anestésicos locais é muito baixa. Reações neurológicas dependem do fármaco utilizado, técnicas de bloqueio, via de administração e estado físico do paciente.

Os sinais e sintomas clínicos iniciais de toxicidade do SNC são de origem excitatória, tais como sinais de fala difícil, calafrios, contração muscular, tremores dos músculos da face e extremidades distais, sintomas de sensação de pele quente e ruborizada, delírio, tonturas, distúrbios visuais como visão dupla ou turva, distúrbio auditivo como zumbido, sonolência e desorientação.

A presença de parestesia bilateral de língua e região perioral e episódio convulsivo tônico-crônico generalizado são sinais de reação tóxica por altos níveis de anestésicos locais.

Sistema Cardiovascular:

Sinais e sintomas da depressão cardiovascular podem comumente resultar de reação vasovagal, particularmente se o paciente estiver na posição ereta. As reações adversas dose-dependentes podem resultar em hipotensão, depressão miocárdica, bradicardia e, possivelmente, parada cardíaca.

Sistema respiratório

Em níveis inferiores a superdosagem possui uma ação relaxante direta sobre o músculo liso brônquico; em níveis de superdosagem podem produzir parada respiratória em consequência da depressão generalizada do SNC.

Reações alérgicas

- São caracterizadas por lesões cutâneas, urticária, edema ou reações anafiláticas.

- Pacientes alérgicos aos derivados do ácido para-amino-benzóico (procaína, tetracaína, benzocaína, etc.) não demonstram sensibilidade cruzada a prilocaína.

Parestesias

Anestesia prolongada ou parestesia da língua e lábios são riscos para realização de procedimentos cirúrgicos como extrações, embora elas possam ocorrer após procedimentos não-cirúrgicos. Parestesia persistente com duração de semanas a meses e em casos raros com duração de anos foram reportados.

Toxicidade aguda sistêmica

A prilocaína pode causar efeitos tóxicos agudos se ocorrerem níveis sistêmicos altos devido à injeção intravascular acidental, absorção rápida ou superdosagem.

Metahemoglobinemia

A administração repetida de prilocaína, mesmo em doses relativamente pequenas, pode levar a manifestação clínica da metahemoglobinemia (cianose). A conversão da hemoglobina em metahemoglobina é causada pelos metabólitos da prilocaína, orto-toluidina, que apresentam uma meia-vida longa e tendem a acumular, e converter a 4- e 6-hidroxitoluidina. A cianose ocorre quando a concentração de metahemoglobina no sangue atinge 1-2 g/100 mL (6-12% da concentração normal de hemoglobina) e deve ser avaliada caso ocorra em 2-4 horas após a administração de prilocaína. A metahemoglobinemia pode ser revertida quando indicada, por administração endovenosa de azul de metileno na dosagem de 1-2 mg/kg em um período de 5 minutos.

A ocorrência de metahemoglobinemia é remota com as dosagens de prilocaína empregadas em procedimentos odontológicos (1 - 5 mL de CITOCAÍNA® 3%, isto é, 30 - 150 mg de cloridrato de prilocaína 3% com felipressina 0,54 µg/mL).

Entretanto, superdosagem durante procedimentos odontológicos tem sido relatada como causadora de metahemoglobinemia.

Nota: Mesmo baixas concentrações de metahemoglobina podem interferir na leitura oximétrica do pulso, indicando uma falsa baixa saturação de oxigênio.

Alterações de exames laboratoriais

A injeção intramuscular de cloridrato de prilocaína pode resultar em um aumento nos níveis da creatino 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 do exame.

POSOLOGIA:

Deve-se usar a menor dose eficaz. A dose também depende da área da cavidade bucal a ser anestesiada, da vascularização do tecido, da tolerância individual e da técnica anestésica. A dose total deve ser ajustada de acordo com a idade, tamanho e estado físico do paciente.

Doses recomendadas para a maioria dos procedimentos odontológicos:

Adultos normais saudáveis: 1-5 mL (30-150 mg de cloridrato de prilocaína), o que equivale na prática a 1-3 carpules. Não deve exceder uma dose de 10 mL (= 300 mg de cloridrato de prilocaína) de CITOCAÍNA® 3% para os procedimentos odontológicos.

Crianças menores de 10 anos: 1-2 mL (30-60 mg de cloridrato de prilocaína), o que equivale na prática 0,5 - 1 carpule.

A CITOCAÍNA® 3% (cloridrato de prilocaína - felipressina) tem um rápido início de ação após anestesia de infiltração, em média de 2-3 minutos. O bloqueio do nervo alveolar inferior requer 5 minutos ou mais para obter o efeito completo. A duração da anestesia efetiva varia conforme o indivíduo e depende do tipo de bloqueio. A duração média da anestesia útil após infiltração é de 45 minutos. Após bloqueio regional de sucesso, ex. bloqueio do nervo alveolar inferior, a anestesia dura de 2 horas ou mais.

Modo de usar

- A infiltração do anestésico deve sempre ser feita lentamente com aspiração cuidadosa antes e intermitentemente durante a infiltração para evitar injeção intravascular inadvertida e minimizar a incidência

de efeitos colaterais e falha anestésica.

- Visando evitar danos traumáticos aos nervos que acarretem em parestesia associada ao bloqueio nervoso deve-se usar uma técnica não traumática.

- A desinfecção da borracha do carpule dental ou de toda a parte externa do carpule deve ser feita através de uma limpeza com um pedaço de algodão umedecido com álcool etílico a 70%. Os carpules não devem ser mergulhados em álcool ou em qualquer outra solução desinfetante.

- Os carpules de CITOCAÍNA® 3% não devem ser autoclavados. Este produto reage com certos metais (zinco, cobre, mercúrio, etc) e causa liberação dos seus respectivos íons, os quais, se injetados, podem causar irritação local grave e inchaço na área injetada. Deve-se tomar cuidado para evitar contato prolongado entre a solução e a superfície de metais como cânulas e seringas com partes metálicas.

- Não utilizar o produto se houver presença de partículas em suspensão, precipitação, turvação e alteração na coloração.

- Não utilizar o produto após o vencimento do prazo de validade.

SUPERDOSAGEM:

A prilocaína é o anestésico local amino-amida de menor toxicidade particularmente útil em situações onde uma maior dosagem de anestésico local pode ser necessária. Esta vantagem deve ser considerada em relação ao risco de causar metahemoglobinemia.

Emergências agudas são, em geral, doses-relacionadas e podem ser resultado de altos níveis plasmáticos causados por dose excessiva, absorção rápida (isto é, aumento da taxa de concentração plasmática) ou injeção intravascular involuntária, ou pode resultar de hipersensibilidade ou tolerância diminuída pelo paciente.

Toxicidade sistêmica aguda

Reações do SNC são excitatórias ou depressoras e podem ser caracterizadas por nervosismo, tino, espasmos musculares, euforia, sonolência, visão embaçada ou turva, vertigem, convulsões, inconsciência e possivelmente parada respiratória. As reações excitatórias podem ser muito breves ou podem não ocorrer no todo. A primeira manifestação de toxicidade é sonolência que pode evoluir para inconsciência e até mesmo parada respiratória.

As reações cardiovasculares são depressoras e podem ser caracterizadas por hipotensão, depressão miocárdica, bradicardia e possivelmente parada cardíaca. Sinais e sintomas de depressão da função cardiovascular podem comumente resultar de uma reação vasovagal, particularmente se o paciente estiver na posição ortostática. Menos frequentemente, os sinais ou sintomas podem ocorrer por um efeito direto do fármaco. Falha no reconhecimento de sinais indicativos tais como sudorese, sensação de desmaio, alterações no pulso, ou sensoriais podem resultar em hipóxia cerebral progressiva ou colapso cardiovascular.

Efeitos cardiovasculares geralmente ocorrem nos casos graves e são normalmente precedidos por sinais de toxicidade no Sistema Nervoso Central.

Acidose ou hipóxia nos pacientes podem aumentar o risco e a gravidade das reações tóxicas. Estas reações envolvem os sistemas nervoso central e cardiovascular.

Tratamento da Toxicidade aguda

A) Colocar o paciente em decúbito dorsal horizontal. Elevar as pernas a 30° - 45° acima do nível horizontal.

b) Garantir uma ventilação adequada das vias aéreas. Se a ventilação estiver inadequada, ventile o paciente com oxigênio uma vez que a toxicidade aumenta com a acidose.

c) O tratamento das convulsões consiste em garantir uma ventilação adequada das vias aéreas e interromper as crises. Se as convulsões persistirem apesar da ventilação adequada, devem ser administrados intravenosamente diazepam 0,1 mg/kg ou tiopentona sódica 1-3 mg/kg.

Considerando que o tratamento pode também causar depressão respiratória, os meios de manutenção ou controle da ventilação devem estar disponíveis.

d) Tratamento de suporte da depressão circulatória pode requerer a administração de fluidos intravenosos e, quando apropriado, um vasopressor (por ex. efedrina 5 - 10 mg intravenosa, repetir após 2 - 3 min, se necessário), conforme a situação clínica.

e) Se o paciente não for responsivo e o pulso carotídeo estiver totalmente ausente, devem ser instituídas as manobras de reanimação cardíaca.

Tratamento da metahemoglobinemia aguda

A manifestação clínica de metahemoglobinemia pode ser revertida através de administração intravenosa de solução azul de metileno 1%, 1 a 2 mg/kg de peso corpóreo, durante um período de 5 minutos. A cianose pode desaparecer em aproximadamente 15 minutos. Esta dose não deve ser repetida porque o azul de metileno em altas concentrações age como um oxidante de hemoglobina.

PACIENTES IDOSOS:

É prudente administrar uma dose do produto abaixo da dose máxima, visto que pacientes idosos podem apresentar algum comprometimento hepático ou cardiovascular.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA OU DE CIRURGIÃO DENTISTA EXCLUSIVAMENTE PARA USO PROFISSIONAL

Nº do Lote, Data da Fabricação e Prazo de Validade: Vide Rótulo/Caixa. MS Nº 1.0298.0330

Farm. Resp.: Dr. José Carlos Módolo – CRF-SP N.º 10.446

SAC (Serviço de Atendimento ao Cliente): 0800 7011918

CRISTÁLIA

PRODUTOS QUÍMICOS FARMACÊUTICOS LTDA.

Rod. Itapira-Lindóia, km 14 – Itapira - SP

CNPJ nº 44.734.671/0001-51 – Indústria Brasileira

Cód.

22.2104

III / 15