

## 14274 ALPHACAINE - BULA PEI

**ALPHACAINE 1:80.000 / 1:100.000**  
cloridrato de lidocaína + epinefrina  
*PORTUGUÊS*

### APRESENTAÇÃO:

- Solução estéril injetável de Cloridrato de lidocaína 2% (20mg/mL) +Epinefrina 12,5µg /mL acondicionada em tubetes de vidro de 1,8 mL. Cada embalagem contém 50 tubetes.  
- Solução estéril injetável de Cloridrato de lidocaína 2% (20mg/mL) +Epinefrina 10µg /mL acondicionada em tubetes de vidro de 1,8 mL. Cada embalagem contém 50 tubetes.

### PARA USO EXCLUSIVO POR INFILTRAÇÃO OU POR BLOQUEIO DE NERVO VIA SUBMUCOSA E INTRAGENGIVAL.

#### USO ADULTO E PEDIÁTRICO

**COMPOSIÇÃO:**  
Cada mL da solução injetável de ALPHACAINE 1:80.000 contém:  
Cloridrato de Lidocaína.....20,0mg  
Epinefrina base.....12,5µg  
Excipientes q.s.p.....1,0mL  
Excipientes: Bissulfito de Sódio, Cloreto de Sódio e Água para Injeção.

Cada mL da solução injetável de ALPHACAINE 1:100.000 contém:  
Cloridrato de Lidocaína.....20,0mg  
Epinefrina base.....10,0µg  
Excipientes q.s.p.....1,0mL  
Excipientes: Bissulfito de Sódio, Cloreto de Sódio e Água para Injeção.

### INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

**1. INDICAÇÕES**  
O produto é indicado para a anestesia local por bloqueio de nervo ou por infiltração, para intervenções odontológicas em geral, extrações múltiplas, próteses imediatas e procedimentos endodônticos e procedimentos periodontais simples e complexos.

**2. RESULTADOS DE EFICÁCIA**  
Estudos clínicos têm avaliado a capacidade dos anestésicos de bloquear a condução nos axônios do sistema nervoso periférico (Friedman, P.M. and others: Comparative study of the efficacy of four topical anesthetics, Dermatol Surg 25:12, 1999/Buckley, J.A.; Ciancio, S.G.; Mc Mullen, J.A.: Efficacy of epinephrine concentration in local anesthesia during periodontal surgery, J. Periodontol 55:653-657, 1984) e sua eficácia no controle da dor quando associados a diferentes vasoconstritores (Jacob, W.: Local anaesthesia and vasoconstrictive additional components, Newsletter Int Fed Dent Anesthesiol Soc 2(1):3, 1989/Bennett, C.R.: Monheim's local anaesthesia and pain control in dental practice, ed 7, St. Louis, 1983, Mosby-Year Book).

**3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS**  
Cloridrato de Lidocaína  
**Classificação:** Amida  
**Sinónimos:** Lignocaina, Xilocaína  
**Fórmula química:** Cloridrato de 2-dietilamino-2',6-acetoxilidida  
**Potência:** 2 (procaína = 1)  
**Toxicidade:** 2 (em comparação com a procaína).

**Modo de Ação:** Estabiliza a membrana neuronal inibindo o fluxo de íons necessários ao início e condução dos impulsos, causando por isto um efeito de anestesia local.  
**Absorção:** A lidocaína é completamente absorvida seguindo-se a administração parenteral e sua margem de absorção depende do local da administração e da presença ou não de vasoconstritores. A ligação a proteínas plasmáticas é dependente da concentração da droga e a fração ligada decresce conforme o aumento da concentração. Atravessa as barreiras hematoencefálica e placentária, presumivelmente por difusão passiva.

**Metabolismo:** É metabolizada no fígado, por oxidases microssômicas até monoetilglicerina e xilidida; a xilidida é um anestésico local potencialmente tóxico.  
**Excreção:** Se dá pelos rins; menos de 10% inalterados, mais de 80% na forma de vários metabólitos.

**Propriedade vasodilatadora:** Consideravelmente menor que a da procaina, entretanto, maior do que a da prilocaína ou a da mepivacaína.

**Início da ação:** Rápido (2 a 3 minutos).

**Meia-vida anestésica:** 1,6 hora.

**Ação anestésica tópica:** Sim, nas concentrações clinicamente aceitáveis.

Epinefrina  
**Sinónimo:** Adrenalina  
É uma amina simpaticomimética, sendo quimicamente conhecida como álcool 3,4-dihidroxi (metilamino) metil benzílico. Atua nos receptores alfa e beta adrenérgicos, predominando os efeitos beta. Tem sido usada em concentrações mínimas que permitem um efeito anestésico prolongado necessário para longas cirurgias e/ou quando ocorre um sangramento importante.

**4. CONTRAINDICAÇÕES**  
O uso do produto em pacientes com conhecida hipersensibilidade aos componentes da fórmula ou que estejam fazendo uso de medicamentos que sabidamente provocam alterações na pressão sanguínea, como inibidores da monoaminoxidase (IMAO), antidepressivos tricíclicos e fenotiazinas, é contraindicado.

**5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES**  
A segurança e a eficácia dos anestésicos locais dependem da dosagem recomendada, da técnica correta, de uma anamnese previamente realizada, das precauções adequadas e da rapidez e habilidade do profissional na intervenção nos casos emergenciais. Deve-se usar a menor dosagem capaz de proporcionar uma anestesia eficaz.

A administração de doses frequentes de lidocaína pode causar acentuado aumento nos níveis plasmáticos devido à absorção sistêmica, ao aumento da quantidade de droga e seus metabólitos ou ainda devido à lenta degradação metabólica. A tolerância pode variar de acordo com o estado do paciente já que pacientes debilitados, com idade avançada e portadores de doenças graves e crianças devem receber doses reduzidas, calculadas de acordo com a idade e suas condições físicas.

Recomenda-se cuidado especial na administração frequente em pacientes com distúrbios hepáticos ou renais graves, uma vez que o metabolismo nestes pacientes está comprometido. Atenção especial deve ser tomada na administração de anestésicos locais em pacientes com histórico de sensibilidade ou alergia aos componentes da fórmula.

Pacientes com hipertensão arterial, distúrbios coronarianos ou cardiovasculares (principalmente se relacionados a uma seqüela de febre reumática aguda) devem evitar o uso de anestésicos contendo vasoconstritores, como ALPHACAINE. Em pacientes com doenças vasculares periféricas há um pequeno risco potencial de vasoconstritores, como a epinefrina, causarem isquemia ou necrose local. A presença de bissulfito de sódio na formulação deve ser levada em conta para pacientes com quadro de asma. Os responsáveis por crianças ou pacientes com distúrbios mentais devem ser alertados para observar os mesmos, a fim de evitar possíveis traumas indesejados nos lábios. Este produto não deve ser utilizado se a solução estiver amarelada ou

com presença de partículas. Em pacientes idosos, nos quais as funções metabólicas, renais e hepáticas encontram-se geralmente diminuídas, deve-se ter o cuidado de administrar a menor dose necessária e suficiente para proporcionar uma anestesia específica eficaz. ALPHACAINE deve ser administrado com cautela em pacientes com disfunção hepática, disfunção renal e em pacientes asmáticos. O uso em crianças menores de 10 anos deve seguir as recomendações do item Posologia.

Como ainda não estão disponíveis estudos adequados e bem controlados em pacientes grávidas e que estão amamentando o uso de ALPHACAINE neste grupo de risco deve ser feito com cautela sob supervisão do profissional responsável. Não há dados ainda disponíveis sobre a possível excreção da lidocaína no leite humano e, como muitos fármacos são excretados desta forma, recomenda-se especial cautela quando este produto for ministrado em mães durante o período da amamentação.

**6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS**  
Segundo estudos de P. Henry e J. Van der Driesche do laboratório de farmacologia do Centro Hospitalar Universitário de Rennes, o uso de anestésico local associado ao consumo de álcool e medicamentos tranquilizantes, interfere diretamente na eficiência do anestésico, podendo aumentar ou diminuir seu tempo de ação, bem como sua potência. ALPHACAINE não deve ser usado em pacientes que estejam fazendo uso de medicamentos que sabidamente provocam alterações na pressão sanguínea, como inibidores da monoaminoxidase (IMAO), antidepressivos tricíclicos e fenotiazinas. Sérias arritmias cardíacas podem ocorrer se preparações contendo vasoconstritores forem empregadas em pacientes durante ou após a administração de halotano, tricloretileno, ciclopropano ou clorofórmio. A administração simultânea de drogas vasopressoras e de drogas oxitóicas do tipo ergot pode causar hipertensão severa persistente ou acidentes vasculares cerebrais.

**7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO**  
O produto deve ser conservado em sua embalagem original, em temperatura ambiente (entre 15° e 30°C). Proteger da luz. O prazo de validade desse produto é de 24 meses, contados a partir da data de fabricação.  
**Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.**  
**Não use medicamento com prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original.**  
**Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.**  
**Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.**

**8. POSOLOGIA E MODO DE USAR**  
Como ocorre com todos os anestésicos locais, a dosagem varia e depende da área a ser anestesiada, da vascularização dos tecidos, do número de segmentos nervosos a serem bloqueados, da tolerância individual e da técnica anestésica usada. Deve-se usar a menor dose necessária e suficiente para proporcionar uma anestesia específica. A dosagem necessária deve ser determinada em bases individuais. A dose máxima sugerida pelo Conselho de Terapêutica Odontológica da Associação Americana de Odontologia e pela Convenção da USP é de 4,4 mg/Kg, com ou sem vasoconstritor. Esta dose ainda permite o uso de um volume significativo da droga para se obter uma anestesia clínica profunda, com um risco um pouco menor de reações tóxicas (superdosagem). A dose máxima recomendada para crianças com menos de 10 anos, com peso e desenvolvimento normal, deve ser determinada através de fórmula pediátrica padrão (ex.: Regra de Clark). A dose máxima recomendada de epinefrina é de 0,2 mg (8,8 carpules de ALPHACAINE 80 ou 11 carpules de ALPHACAINE 100) para pacientes adultos saudáveis. A dose máxima recomendada para os indivíduos sensíveis à epinefrina, como determinados pacientes ASA III ou ASA IV e pacientes clinicamente hipertireóides, é de 0,04 mg por consulta (1 e ½ carpule de ALPHACAINE 80 ou 2 carpules de ALPHACAINE

100). Na infiltração oral e/ou bloqueio mandibular, a dose inicial usualmente efetiva é de 1 a 5 mL de lidocaína (½ a 2 e ½ carpules). Em crianças menores de 10 anos raramente é necessário administrar mais que 0,9 a 1,0 mL (½ carpule) de lidocaína por procedimento, para alcançar anestesia local envolvendo um único dente. Durante a aplicação, recomenda-se fazer aspiração para evitar os riscos da injeção intravascular.

### Doses máximas: 4,4 mg de cloridrato de lidocaína/Kg 0,2 mg de epinefrina/consulta (Cada carpule de 1,8 mL contém 36 mg de cloridrato de lidocaína)

| peso (Kg) | Nº Carpules ALPHACAINE 80 | Nº Carpules ALPHACAINE 100 |
|-----------|---------------------------|----------------------------|
| 10        | 1 (44 mg)                 | 1 (44 mg)                  |
| 20        | 2 (88 mg)                 | 2 (88 mg)                  |
| 30        | 3,5 (132 mg)              | 3,5 (132 mg)               |
| 40        | 4,5 (176 mg)              | 4,5 (176 mg)               |
| 50        | 6 (220 mg)                | 6 (220 mg)                 |
| 60        | 7 (264 mg)                | 7 (264 mg)                 |
| 70        | 8 (308 mg)                | 8 (308 mg)                 |
| 80        | 8 (308 mg)                | 8 (308 mg)                 |
| 90        | 8 (308 mg)                | 8 (308 mg)                 |
| 100       | 8 (308 mg)                | 8 (308 mg)                 |

As doses indicadas são o máximo sugerido para indivíduos saudáveis normais; as doses devem ser reduzidas nos pacientes debilitados ou idosos.

Aconselha-se desinfectar a capa do carpule (tubete) que entrará em contato com a agulha com algodão embebido em álcool a 70%. Não imergir os carpules (tubetes) em hipótese nenhuma, qualquer que seja a solução. Durante a administração, recomenda-se realizar aspiração, para evitar os riscos de injeção intravascular. Para realizar a aspiração, a agulha deve ser reposicionada até que não ocorra nenhum retorno de sangue com a aspiração. Contudo, deve-se observar que a ausência de sangue na seringa não garante que a injeção intravascular foi evitada e uma dupla aspiração é sempre recomendada. Carpules parcialmente usados não deverão ser reaproveitados.

**9. REAÇÕES ADVERSAS**  
Os efeitos colaterais são similares àqueles observados com outros anestésicos locais do tipo amida. As reações adversas são em geral relativas a dosagem e podem ser resultantes de altos níveis plasmáticos causados por dosagem excessiva, absorção rápida ou injeção intravascular não intencional, ou ainda podem resultar de uma hipersensibilidade, idiossincrasia ou tolerância reduzida por parte do paciente. Podem ocorrer efeitos que envolvem o sistema cardiovascular e o SNC. As manifestações no SNC são excitatórias e/ou depressivas e podem ser caracterizadas por fotofobia, nervosismo, apreensão, euforia, confusão, tontura, sonolência, zumbidos, visão borrada, vômitos, sensação de calor, frio ou dormência, tremores, perda da consciência, depressão e parada respiratória. As manifestações cardiovasculares são normalmente depressivas e caracterizadas por bradicardia, hipotensão e colapso cardiovascular, que pode levar a uma parada cardíaca. Sinais e sintomas de uma função cardiovascular depressiva podem comumente ser resultado de uma reação vasovagal, mas podem eventualmente ser o resultado e um efeito direto da droga. Tratamentos de suporte para estas manifestações devem estar ao alcance do profissional para uma rápida ação. Equipamentos de ressuscitação, oxigênio e outras drogas para ressuscitação devem estar disponíveis para uso imediato. A alergia a anestésicos locais do tipo amida praticamente inexistente. Embora possíveis, as reações alérgicas documentadas e reprodutíveis são extremamente raras. As manifestações alérgicas brandas podem incluir lesões cutâneas, urticária e edema. Reações anafiláticas são extremamente raras. As manifestações neurológicas, como por exemplo, deficiência neurológica persistente, associada ao uso de anestésicos locais pode estar relacionada com a técnica utilizada, a dose total de anestésico administrada, a rota da administração e as condições

físicas do paciente. Pode ocorrer parestesia com o uso de ALPHACAINE.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificação de Eventos Adversos a Medicamentos - VIGIMED, disponível em <http://portal.anvisa.gov.br/vigimed>, ou para a Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal.

### 10. SUPERDOSE

Reações generalizadas do SNC ou reações cardiovasculares são geralmente relacionadas com altos níveis plasmáticos, devido à injeção intravascular acidental ou superdosagem (Veja Advertências e Reações Adversas). Os primeiros sinais e sintomas da intoxicação por lidocaína podem incluir sonolência, que pode levar à perda da consciência e parada respiratória. Nestes casos deve-se proceder da seguinte forma:

- Coloque o paciente em posição supina. Eleve as pernas 30° a 45° acima do nível horizontal.  
- Deve-se assegurar a passagem de ar. Se a ventilação for inadequada, ventile o paciente com oxigênio, se possível.

- Se o pulso for baixo (< 40) ou não determinável, inicie massagem cardíaca externa.

- O tratamento de suporte da deficiência circulatória pode requerer a administração de soluções parenterais (soro).

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

### VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA PRODUTO DE USO EXCLUSIVAMENTE PROFISSIONAL

**Essa bula foi aprovada pela ANVISA em 21/05/2013.**

**ALPHACAINE 1:80.000 / 1:100.000**  
**Cloridrato de Lidocaína + Epinefrina**  
*ESPAÑOL*

### PRESENTACIÓN:

- Solución estéril inyectable de Cloridrato de lidocaína 2% (20mg/ml) + Epinefrina 12,5µg /ml envasado en carpules de vidrio de 1,8 mL. Cada embalaje contiene 50 carpules.  
- Solución estéril inyectable de Cloridrato de lidocaína 2% (20mg/ml) + Epinefrina 10µg /ml envasado en carpules de vidrio de 1,8 mL. Cada embalaje contiene 50 carpules.

### PARA USO EXCLUSIVO POR INFILTRAÇÃO O POR BLOQUEO DEL NERVO VÍA SUBMUCOSA Y INTRAGINGIVAL

#### USO ADULTO Y PEDIÁTRICO

**COMPOSIÇÃO:**  
Cada mL de la solución inyectable de ALPHACAINE 1:80.000 contiene:  
Cloridrato de Lidocaína.....20,0mg  
Epinefrina base.....12,5 µg  
Excipientes c.s. ....1,0 mL  
Excipientes: Bissulfito de sodio, cloruro de sodio y agua.

Cada mL de la solución inyectable de ALPHACAINE 1:100.000 contiene:  
Cloridrato de lidocaína.....20,0mg  
Epinefrina base.....10,0 µg  
Excipientes c.s.....1,0 mL  
Excipientes: Bissulfito de sodio, cloruro de sodio y agua.

### INFORMACIONES TÉCNICAS PARA LOS PROFESIONALES DEL ÁREA DE LA SALUD

### 1. INDICACIONES

El producto está indicado para anestesia local por bloqueo del nervio o infiltración, para intervenciones dentales en general, extracciones múltiples, prótesis inmediatas y procedimientos endodónticos y periodontales simples y complejos.

**2. RESULTADOS DE COMPROBACIÓN DE SU EFICACIA**  
Estudios clínicos han evaluado la capacidad que tienen los anestésicos para bloquear la conducción por los axones del sistema nervoso periférico (Friedman, P.M. and others: “Comparative study of the efficacy of four topical anesthetics”, Dermatol Surg 25:12, 1999/Buckley, J.A.; Ciancio, S.G.; Mc Mullen, J.A.: “Efficacy of epinephrine concentration in local anesthesia during periodontal surgery”, J. Periodontol 55:653-657, 1984) y su eficacia en el control del dolor cuando están asociados a diferentes vasoconstrictores (Jacob, W.: “Local anaesthesia and vasoconstrictive additional components”, Newsletter Int Fed Dent Anesthesiol Soc 2(1):3, 1989/Bennett, C.R.: Monheim's local anaesthesia and pain control in dental practice, ed 7, St. Louis, 1983, Mosby-Year Book).

### 3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Cloridrato de Lidocaína  
**Classificación:** Amida  
**Sinónimos:** Lignocaina, Xilocaína  
**Fórmula química:** Cloridrato de 2-dietilamino-2',6-acetoxilidida

**Potencia:** 2 (procaína = 1)  
**Toxicidad:** 2 (en comparación con la procaína).

**Modo de Acción:** Estabiliza la membrana neuronal por inhibición del flujo de iones necesarios para iniciar la conducción de los impulsos, causando así un efecto de anestesia local.

**Absorción:** La lidocaína se absorbe completamente después de ser administrada en forma parenteral; su margen de absorción depende del lugar de la administración y de la presencia o no de vasoconstritores. La unión a proteínas plasmáticas depende de la concentración del fármaco y la fracción unida disminuye en función del aumento de la concentración. Atraviesa la barrera hematoencefálica y la placenteria probablemente por difusión pasiva.

**Metabolismo:** Se metaboliza en el hígado, por oxidasas microsómicas, hasta monoetilglicerina y xilidida; éste es un anestésico local potencialmente tóxico.

**Excreción:** Se excreta por los riñones, más del 10 % sin alteración y más del 80 % en la forma de varios metabolitos.

**Propiedad vasodilatadora:** Es considerablemente menor que la de la procaína pero mayor que la de la prilocaína o de la mepivacaína.

**Inicio de la acción:** Rápido (2 a 3 minutos).

**Vida media del anestésico:** 1,6 horas.

**Acción anestésica tópica:** Presenta en las concentraciones clinicamente aceptables.

Epinefrina

**Sinónimo:** Adrenalina  
Es una amina simpaticomimética, cuya nomenclatura química es alcohol 3,4-dihidroxi (metilamino) metil benzílico. Actúa sobre los receptores α y β adrenérgicos con predominancia de los efectos β. Se la ha usado en concentraciones mínimas que permiten obtener un efecto anestésico prolongado, necesario para largas cirurgias, y/o cuando ocurre un sangramiento importante.

### 4. CONTRAINDICACIONES

Su uso está contraindicado para pacientes con conocida hipersensibilidad a los componentes de la fórmula o que estén haciendo uso de medicamentos que comprobadamente provocan alteraciones de la presión sanguínea, como inibidores de la monoaminooxidase (IMAO), antidepressivos tricíclicos y fenotiacinas.

### 5. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

La seguridad y la eficacia de los anestésicos locales dependen de la dosificación recomendada, de la técnica correcta, de una anamnese previa, de las precauciones adecuadas y de la rapidez y habilidad del profesional para intervenir en los casos de emergencia. Se debe usar la menor dosis que permita obtener una anestesia eficaz.

La administración de dosis frecuentes de lidocaína puede causar un acentuado aumento en los niveles plasmáticos debido a la absorción sistémica, al aumento de la cantidad del fármaco y sus metabolitos o a la lenta degradación metabólica. La tolerancia puede variar de acuerdo con el estado del paciente, ya que pacientes debilitados, de edad avanzada, portadores de enfermedades graves o a niños se les deben suministrar dosis reducidas, calculadas de acuerdo con la edad y las condiciones físicas.

Se recomienda tomar cuidados especiales en el caso de administración frecuente a pacientes con trastornos hepáticos o renales graves, ya que su metabolismo está perjudicado. También se debe prestar atención especial al administrar anestésicos locales a pacientes con antecedentes de sensibilidad o alergia a los componentes de la fórmula.

Los pacientes con hipertensión arterial, dolencias coronarias o cardiovasculares (principalmente se relacionados con una secuela de fiebre reumática aguda) deben evitar el uso de anestésicos que contienen vasoconstritores, como ALPHACAINE. Existe un pequeño riesgo de que los vasoconstritores causen isquemia o necrosis local en pacientes con enfermedades vasculares periféricas. Se debe tener en cuenta que el bisulfito de sodio está presente en la fórmula cuando se administra el anestésico en pacientes que presentan un cuadro de asma. En pediatría o en pacientes con algún disturbio mental se debe advertir a los responsables de la observación del paciente a fin de evitar traumas labiales. Este producto no se puede utilizar si la solución está amarillenta o se observa la presencia de partículas.

En pacientes ancianos, cuyas funciones metabólicas, renales y hepáticas generalmente se encuentran disminuidas, se debe tener el cuidado de administrar la menor dosis necesaria y suficiente para proporcionar una anestesia específica y eficaz. En pacientes con disfunción hepática, disfunción renal y en pacientes asmáticos ALPHACAINE se debe administrar con cautela.

El uso en niños menores de 10 años debe obedecer las recomendaciones del item Posología.

Cómo no hay disponibles estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas y en período de amamentación, el uso de ALPHACAINE en este grupo de riesgo debe ser hecho con cuidado bajo supervisión de un profesional del área de la salud. No se dispone de datos sobre la posible excreción de la lidocaína a través de la leche humana y, como muchos fármacos se excretan por esa vía, se recomienda cuidado especial cuando se administra ALPHACAINE a mujeres en período de amamentación.

**6. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:**  
Segundo estudios de P. Henry e J. Van der Driesche, del Laboratorio de Farmacología del Centro Hospitalario de la Universidad de Rennes, el uso de anestésicos locales asociado al consumo de alcohol y de medicamentos tranquilizantes interfiere directamente en la eficiencia del anestésico ya sea aumentando o disminuyendo su tiempo de acción o afectando su potencia. ALPHACAINE no se debe usar en pacientes que hagan uso de medicamentos provocan alteraciones de la presión arterial como inibidores de la monoaminooxidase (MAO), antidepressivos tricíclicos y fenotiacinas. Pueden ocurrir serias arritmias cardíacas si se emplean preparaciones con vasoconstritores durante o después de la administración de halotano, tricloretileno, ciclopropano o clorofórmio. La administración simultánea de fármacos vasopresores y de drogas oxitóicas del tipo ergot puede causar hipertensión severa persistente o accidentes vasculares cerebrales.

**7. CUIDADO DE ALMACENAMIENTO**  
El producto debe ser conservado en su envase original, en temperatura ambiente (entre 15°C y 30°C). Proteger de la luz. El plazo de validez del producto es de 24 meses, contados a partir



# 14274 ALPHACAINE - BULA PEI

de la fecha de fabricación.

**Número de lote y fecha de fabricación y plazo de validez: ver embalaje.**

**No use medicamento después de su plazo de validez.**

**Guárdelo en su embalaje original.**

**Antes de usar, observe el aspecto del producto.**

**Todo medicamento se debe mantener fuera del alcance de los niños.**

## 8. POSOLOGÍA Y MODO DE USAR

Como ocurre con todos os anestésicos locales, la dosis varía y depende del área a ser anestesiada, de la vascularización de los tejidos, del número de segmentos nerviosos a ser bloqueados, de la tolerancia individual y de la técnica anestésica usada. Se debe usar la menor dosis necesaria y suficiente para proporcionar una anestesia específica. La dosis necesaria se debe determinar en función del estado de cada individuo. La dosis máxima sugerida por el Consejo de Terapéutica Odontológica de la Asociación Americana de Odontología y por la Convención de la USP es de 4,4 mg/kg, con o sin vasoconstrictor. Esta dosis permite, además, el uso de una cantidad significativa del fármaco para obtener una anestesia clínica profunda con un riesgo un poco menor de reacciones tóxicas (superdosificación). La dosis máxima recomendada para niños menores de 10 años, con peso y desarrollo normales, se debe determinar por medio de la fórmula pediátrica standard (ej.: Regla de Clark). La dosis máxima recomendada de epinefrina es de 0,2 mg (8,8 Carpules de **ALPHACAINE 80** o 11 Carpules de **ALPHACAINE 100**) para pacientes adultos sanos. La dosis máxima recomendada para los individuos sensibles a la epinefrina, como determinados pacientes ASA III o ASA IV y pacientes clínicamente hipertiroideos, es de 0,04 mg por consulta (1 y ½ Carpule de **ALPHACAINE 80** o 2 Carpules de **ALPHACAINE 100**). En la infiltración oral y/o bloqueo mandibular, la dosis inicial usualmente efectiva es de 1 a 5 ml de lidocaína (½ a 2 e ½ Carpules). En niños menores de 10 años raramente se necesita administrar más que 0,9 a 1,0 ml (½ Carpule) de lidocaína por procedimiento para conseguir anestesia local para un único diente. Se recomienda aspirar durante la aplicación para evitar el riesgo de una inyección intravascular.

**Dosis máximas: 4,4 mg de clorhidrato de lidocaína/kg  
0,2 mg de epinefrina/kg  
(Cada Carpule de 1,8 ml contiene 36 mg de clorhidrato de lidocaína)**

| Peso (Kg) | Nº Carpules <b>ALPHACAINE 80</b> | Nº Carpules <b>ALPHACAINE 100</b> |
|-----------|----------------------------------|-----------------------------------|
| 10        | 1 (44 mg)                        | 1 (44 mg)                         |
| 20        | 2 (88 mg)                        | 2 (88 mg)                         |
| 30        | 3,5 (132 mg)                     | 3,5 (132 mg)                      |
| 40        | 4,5 (176 mg)                     | 4,5 (176 mg)                      |
| 50        | 6 (220 mg)                       | 6 (220 mg)                        |
| 60        | 7 (264 mg)                       | 7 (264 mg)                        |
| 70        | 8 (300 mg)                       | 8 (300 mg)                        |
| 80        | 8 (300 mg)                       | 8 (300 mg)                        |
| 90        | 8 (300 mg)                       | 8 (300 mg)                        |
| 100       | 8 (300 mg)                       | 8 (300 mg)                        |

Las dosis indicadas representan lo máximo sugerido para individuos sanos normales; para pacientes debilitados o ancianos deben ser menores.

Se aconseja desinfectar la tapa del carpule que entra en contacto con la aguja con algodón embebido en alcohol al 70%. No inmergir los carpules bajo ningún concepto, cualquiera que sea la solución.

Se recomienda aspirar durante la aplicación para evitar el riesgo de una inyección intravascular. Para aspirar, la aguja debe ser posicionada hasta que no ocurra ninguno retorno de sangre con la aspiración. Sin embargo, se debe observar que la ausencia de sangre en la jeringa no garantiza que se evitó la inyección intravascular y siempre se recomienda una doble aspiración. No se deben reaprovechar los Carpules parcialmente usados.

## 9. REACCIONES ADVERSAS

Los efectos colaterales son similares a los observados con otros anestésicos locales del tipo amida. Las acciones adversas, en general, están relacionadas con la dosificación y pueden resultar de altos niveles plasmáticos causados por dosis excesiva, absorción rápida, o inyección intravascular accidental, o también pueden ser el resultado de hipersensibilidad, idiosincrasia o tolerancia reducida por parte del paciente. Pueden ocurrir efectos sobre el sistema cardiovascular y el SNC. Las manifestaciones del SNC pueden ser de excitación o depresión, como fotofobia, nerviosismo, aprensión, euforia, confusión, mareos, somnolencia, zumbidos, visión borrosa, vómitos, sensación de calor, frío, hormigueo, temblores, pérdida de la conciencia, depresión y parada respiratoria. Las manifestaciones cardiovasculares normalmente son de depresión del sistema y caracterizadas por bradicardia, hipotensión y colapso cardiovascular, que pueden conducir a una parada cardíaca. Las señales y los síntomas de una función cardiovascular deprimida comúnmente pueden ser el resultado de una reacción vasovagal pero, eventualmente, pueden ser el resultado de un efecto directo de la droga. Los tratamientos de auxilio para estas manifestaciones deben estar al alcance del profesional para el caso de ser necesaria una acción rápida. Prácticamente no existe la alergia a los anestésicos locales del tipo amida.; a pesar de que sean factibles son extremadamente raras las reacciones alérgicas documentadas y reproducibles. Las manifestaciones alérgicas suaves se caracterizan por lesiones cutáneas, urticaria, edema. Las reacciones anafilácticas son sumamente raras. Las manifestaciones neurológicas, por ejemplo deficiencia neurológica persistente, asociadas al uso de anestésicos locales pueden estar relacionadas a la técnica utilizada, la dosis total de anestésico administrada, la vía de administración y las condiciones físicas del paciente. Puede ocurrir parestesia con el uso de **ALPHACAINE**.

En casos de eventos adversos, notifique al Sistema de Notificación de Eventos Adversos de Medicamentos – VIGIMED, disponible en <http://portal.anvisa.gov.br/vigimed>, o para la Vigilancia Sanitaria del Estado o del Municipio.

## 10. SOBREDOSIS

Reacciones generalizadas del SNC o reacciones cardiovasculares generalmente están relacionadas con altos niveles plasmáticos por causa de una inyección intravascular accidental o sobredosis. (Ver Advertencias y Acciones Adversas). Los primeros señales y síntomas de la intoxicación por lidocaína pueden incluir somnolencia lo que puede llevar a la pérdida de la conciencia y parada respiratoria. En estos casos se debe proceder de la siguiente manera:

- Coloque al paciente en posición supina. Levántele las piernas con una inclinación de 30° a 45° sobre la horizontal.

- Asegúrese de que haya pasaje de aire. Si la ventilación es inadecuada, ventile al paciente con oxígeno (si es posible).

- Si el pulso está bajo (<40) o no lo puede determinar, comience a hacerle masaje cardíaco externo.

- El tratamiento de auxilio de la deficiencia circulatoria puede necesitar la administración de líquidos por vía intravenosa (suero).

**En caso de intoxicación llame al 0800 722 6001, si necesitar más ayuda.**

## VENTA BAJO PRESCRIPCIÓN MÉDICA PRODUCTO DE USO EXCLUSIVAMENTE PROFESIONAL

**Aprobada por ANVISA en 21/05/2013.**

**ALPHACAINE 1:80,000 / 1:100,000  
Lidocaine Hydrochloride + Epinephrine  
ENGLISH**

## PRESENTATIONS:

- Sterile injectable solution of Lidocaine Hydrochloride 2% (20mg/mL) +EPINEPHRINE 12.5µg /mL packaged in glass cartridge of 1,8 mL. Each package contains 50 cartridges.

- Sterile injectable solution of Lidocaine Hydrochloride 2% (20mg/mL) +EPINEPHRINE 10µg /mL packaged in glass cartridge of 1,8 mL. Each package contains 50 cartridges.

## USE ONLY IN INFILTRATION OR NERVE BLOCK VIA SUBMUCOSA AND INTRAORAL.

## FOR ADULT AND PEDIATRIC USE

## COMPOSITION:

Epinephrine  
**Other chemical names:** Adrenaline

It is a sympathomimetic amine, being chemically recognized as 3,4-dihydroxi (methylamino) methyl benzilic alcohol. It acts on both α- and β-adrenergic receptors, where β effects predominate. It has been used in minimal concentrations which permit a prolonged anaesthetic effect, necessary for lengthy surgical interventions or where major bleeding occurs.

Each mL of **ALPHACAINE 1:80,000** injection contains:  
Lidocaine hydrochloride.....20.0 mg  
Epinephrine .....12.5µg  
Excipients e.f.....1.0 mL  
Excipients: Sodium Bisulfite, Sodium Chloride and Water for Injection.

Each mL of **ALPHACAINE 1:100,000** injection contains:  
Lidocaine hydrochloride.....20.0 mg  
Epinephrine .....10.0µg  
Excipients e.f.....1.0 mL  
Excipients: Sodium Bisulfite, Sodium Chloride and Water for Injection.

## TECHNICAL INFORMATION FOR HEALTH CARE PROFESSIONALS

## 1. INDICATIONS

The product is indicated for local anesthesia by nerve block or infiltration, for general dental interventions, multiple extractions, immediate dentures and endodontic and periodontal procedures simple and complex.

## 2. EFFICACY RESULTS

Several clinical studies have been conducted in order to evaluate the ability of anesthetics to block conduction in nerve axons of the peripheral nervous system (Friedman, P.M. and others: Comparative study of the efficacy of four topical anesthetics, Dermatol Surg 25:12, 1999;Buckley, J.A.; Ciancio, S.G.; Mc Mullen, J.A.: Efficacy of epinephrine concentration in local anesthesia during periodontal surgery, J. Periodontol 55:653-657, 1984) and its efficacy in provide anesthesia when associated to several vasoconstrictor (Jacob, W.: Local anaesthesia and vasoconstrictive additional components, Newslett Int Fed Dent Anesthesiol Soc 2(1):3, 1989;Bennett, C.R.: Monheim's local anesthesia and pain control in dental practice, ed 7, St. Louis, 1983, Mosby-Year Book).

## 3. PHARMACOLOGY

Lidocaine Hydrochloride  
**Classification:** Amide  
**Other names:** Xyllocaine  
**Chemical formula:** 2-Diethylamino 2',6-acetoxyilidide hydrochloride.

**Potency:** 2 (procaine = 1)

**Toxicity:** 2 (in comparison with procaine)

**Mechanism of action:** Promotes local anesthesia through the stabilization of neuronal membranes, inhibiting the ionic flux required for the onset and conduction of impulses.

**Absorption:** Lidocaine is completely absorbed following parenteral administration and its margin of absorption depends on the site of administration and the presence or otherwise of vasoconstrictors. The link between plasma and lidocaine depends on the concentration of the drug and the linked fraction decreases

in accordance with the increase of concentration. It crosses the blood-brain and placental barriers, presumably via passive diffusion.

**Metabolism:** It is metabolized in the liver by the microsomal fixed-functions oxidases, to monoethylglycine and xylidide; xylidide is a local anesthetic and potentially toxic.

**Excretion:** Via the kidneys; less than 10% unchanged, more than 80% various metabolites.

**Vasodilating properties:** Considerably less than those of procaine; however, more than those of prilocaine or mepivacaine.

**Onset of action:** Rapid (2 to 3 minutes).

**Anesthetic half-life:** 1.6 hours.

**Topical anesthetic action:** Yes (in clinically acceptable concentrations).

Epinephrine

**Other chemical names:** Adrenaline

It is a sympathomimetic amine, being chemically recognized as 3,4-dihydroxi (methylamino) methyl benzilic alcohol. It acts on both α- and β-adrenergic receptors, where β effects predominate. It has been used in minimal concentrations which permit a prolonged anaesthetic effect, necessary for lengthy surgical interventions or where major bleeding occurs.

## 4. CONTRAINDICATIONS

**ALPHACAINE** is contraindicated in patients with a known history of hypersensitivity to local anesthetics of the amide type or to any other substance present in formula and in patients receiving drugs known to produce blood pressure alterations, as MAO inhibitors, tricyclic antidepressants and phenothiazines.

## 5. WARNINGS AND PRECAUTIONS

The safety and efficacy of local anesthetics depend on the recommended dosage, the correct technique employed, the previous anamnesis, the appropriate precautions taken and the fastness and qualification of the health care professional during emergencies. It should be used the lowest doses that are able to provide efficient anesthesia.

The administration of frequent doses of lidocaine may cause a sharp increase of levels in the blood with each additional dose, due to the increase of the drug, its metabolites or to slow metabolic breakdown. Tolerance may vary depending on the patient's state, those debilitated by old age or serious illnesses or children should be given reduced doses, calculated in accordance with their age and physical condition.

Special care is recommended in frequent application in patients with serious kidney or liver problems due to their inability to normally metabolize the anesthetic drug, thereby being subject to the risk of toxic concentrations in the plasma. Special care should be taken in the administration of local anesthetics in patients with known drug sensitivities or allergies to any of the substances in the formula.

Patients with hypertension, coronary or cardiovascular problems (particularly related to sequela of acute rheumatic fever), must avoid the use of anesthetics containing vasoconstrictors as **ALPHACAINE**. In patients with peripheral vascular disease, there is a little potential risk that vasoconstrictors cause ischemic injury or local necrosis. The presence of Sodium Bisulfite in the formula must be taken into account when treating patients who are susceptible to asthma. Parents should be advised, as well as people liable for patients with mental disturbance, to observe them, in order to avoid possible inadvertent trauma to the lips. This product is not to be used if the solution is yellowish or with particles.

In elderly patients, in who the metabolic, renal and hepatic functions are usually diminished, care must be taken in terms of administering the smallest necessary dose that is enough for providing a specific kind of anesthesia. Care should be taken in the use of **ALPHACAINE** in patients with liver or kidney problems and in patients susceptible to asthma.

The use in children under 10 years old should follow the recommendations described in Dosage.

There aren't available adequate and well-controlled studies in

pregnant and breastfeeding women so **ALPHACAINE** must be used, in this risk group, carefully and under professional supervision.

There is no data available on the possible excretion of lidocaine in human milk and as many drugs are excreted in this way, it is recommended special caution when this product is administered to mothers during the breastfeeding period.

## 6. DRUG INTERACTIONS

According to studies undertaken by P. Henry and J. Van der Driessche of the pharmacology laboratory of the Rennes University Hospital Center, the use of local anesthetic associated with the consumption of alcohol and/or tranquilizing medication directly interferes in the efficiency of the anesthetic, potentially increasing or decreasing its time of action and potency. **ALPHACAINE** should not be used in patients in treatment with drugs known to affect blood pressure, as monoamine oxidase inhibitors, tricyclic antidepressants or phenothiazines. Serious cardiac arrhythmia may occur if preparations containing vasoconstrictors are used in patients during or after the administration of halotane, trichloroethylene, cyclopropane or chloroform. Concurrent administration of vasopressor drugs and ergot-type oxytocic drugs may cause severe, persistent hypertension or cerebrovascular accidents.

## 7. STORAGE CONDITIONS

This product should be kept in its original package, at room temperature (between 15°C and 30° C). Protect from light. The expiry date of this product is equivalent to 24 months after manufacturing date.

**Batch number and manufacturing and expiry date: see product box.**

**Do not use medicine with expiry date. Store in its original package.**

**Before use, observe the medicine aspect.**

**Every drug should be kept out of the reach of children.**

## 8. DOSAGE AND HOW TO USE

As occurs with all local anesthetics, dosages vary and depend on the area to be anesthetized, the vascularity of tissues, the number of nerve segments to be blocked, the individual tolerance and the technique of anesthesia. The least volume of injection that results in effective local anesthesia should be administered. The necessary dosage must be determined on an individual basis. The maximum dosage suggested by the Council on Dental Therapeutics of the American Dental Association and the USP Convention is 4.4 mg/kg for lidocaine with or without a vasoconstrictor additive. This dose still allows for a significant volume of drug to be used to achieve profound clinical anesthesia with a somewhat diminished risk of development of toxic (overdose) reactions. For children of less than ten years who have a normal lean body mass and normal body development, the maximum dose may be determined by the application of one of the standard pediatric drug formulas (e.g., Clark's rule). The maximum recommended dosage of epinephrine is 0.2 mg (8.8 cartridges of **ALPHACAINE 80** or 11 cartridges of **ALPHACAINE 100**) for healthy adult patients. The maximum recommended dosage for epinephrine-sensitive patients, such as ASA III and ASA IV and clinically hyperthyroid patients, is 0.04 mg of epinephrine (1 and ½ cartridge of **ALPHACAINE 80** or 2 cartridges of **ALPHACAINE 100**) per appointment. In oral infiltration and/or mandibular block, initial dosages of 1.0-5.0 ml of lidocaine (1/2 to 21/2 cartridges of **ALPHACAINE**) are usually effective. In children under 10 years of age it is rarely necessary to administer more than one-half cartridge of **ALPHACAINE** (0.9 to 1.0 ml of lidocaine) per procedure, to achieve local anesthesia for a procedure involving a single tooth. During administration, it is recommended to perform a slight aspiration in order to avoid the risks of intravenous injection.

**Maximum dose: 4.4 mg of lidocaine hydrochloride/kg and  
0.2 mg of epinephrine/kg**

**(Each 1.8 ml cartridge contains 36 mg of lidocaine**

| Weight (kg) | hydrochloride)                            |  |
|-------------|---|--|
|             | Number of <b>ALPHACAINE 80</b> Cartridges | Number of <b>ALPHACAINE 100</b> Cartridges |
| 10          | 1 (44 mg)                                 | 1 (44 mg)                                  |
| 20          | 2 (88 mg)                                 | 2 (88 mg)                                  |
| 30          | 3,5 (132 mg)                              | 3,5 (132 mg)                               |
| 40          | 4,5 (176 mg)                              | 4,5 (176 mg)                               |
| 50          | 6 (220 mg)                                | 6 (220 mg)                                 |
| 60          | 7 (264 mg)                                | 7 (264 mg)                                 |
| 70          | 8 (300 mg)                                | 8 (300 mg)                                 |
| 80          | 8 (300 mg)                                | 8 (300 mg)                                 |
| 90          | 8 (300 mg)                                | 8 (300 mg)                                 |
| 100         | 8 (300 mg)                                | 8 (300 mg)                                 |

Doses indicated are the maximum suggested for normal healthy individuals: they should be decreased for debilitated or elderly patients.

It is recommended that chemical disinfection of the cartridge cap be accomplished by wiping it thoroughly with a pledget of cotton that has been moistened with 70% ethyl alcohol just prior to use. Immersion is not recommended. During administration, it is recommended to perform a slight aspiration in order to avoid the risks of an undesirable intra-vascular injection. However, it should be noted that the absence of blood in the syringe does not guarantee that intravascular injection was avoided and a double aspiration is always recommended. Cartridges partially used should not be reused.

## 9. ADVERSE REACTIONS

Side effects following lidocaine administration are similar to those observed in other amide-based anesthetics. Adverse reactions are normally the result of high plasma levels caused by excessive dosage, rapid absorption or unintentional intra-vascular injection, or may result from hypersensitivity, idiosyncrasy, or reduced tolerance on the part of the patient. Effects involving cardiovascular and central nervous systems may occur. Reactions in the CNS are exciting and/or depressing and may be characterized by photo-phobia, irritability, apprehension, euphoria, confusion, dizziness, drowsiness, ringing in the ears, blurred vision, vomiting, burning sensation, cold or numbness, loss of consciousness, respiratory depression and arrest. Cardiovascular reactions are normally depressive and characterized by bradycardia, hypertension and cardiovascular collapse, which may lead to cardiac arrest. Signs and symptoms of a depressed cardiovascular system are commonly the result of a vasovagal reaction but may also be the result of a direct effect of the drug. The health care professional should have support treatments for these reactions available within easy reach so as to effect a rapid response if, and when, necessary. Resuscitative equipment, oxygen, and other resuscitative drugs should be available for immediate use. Allergy to amide local anesthetics is virtually nonexistent; true, documented and reproducible allergic reactions are extremely rare, though possible. Mild allergic reactions may include cutaneous lesions, itchiness and edema. Anaphylactic reactions are extremely rare. Neurological reactions, as persistent neurological deficiency, associated with the use of local anesthetics may be related to the technique used, the total dose of anesthetic administered, the route of administration and the patient's physical condition. Paresthesia may occur using **ALPHACAINE**.

In case of adverse events, notify the Drug Adverse Event Reporting System – VIGIMED, available at <http://portal.anvisa.gov.br/vigimed>, or the Health Surveillance of State or City.

## 10. OVERDOSE

Generalized reactions in the central nervous system or cardiovascular reactions are generally related to high plasmatic levels due to accidental intravenous injection or overdose (See Warnings and Adverse Reactions). The first signs and symptoms of lidocaine overdose may be drowsiness, leading to a loss of consciousness and respiratory arrest.

In such cases, the following procedure should be followed:

- Place the patient in the supine position. Raise the legs 30-45 above horizontal level.

- The passage of air must be ensured. If the ventilation is inadequate, ventilate the patient with oxygen if possible.

- If the pulse is weak (<40) or non-determinable, initiate external cardiac massage.

- Support treatment of circulatory deficiency may require the intravenous administration of parenteral solutions (saline).

**In case of poisoning call 0800 722 6001, if you need further informations.**

## SALES UNDER MEDICAL PRESCRIPTION FOR PROFESSIONAL USE ONLY

**Approved by ANVISA in 21/05/2013.**

## SALES UNDER MEDICAL PRESCRIPTION FOR PROFESSIONAL USE ONLY

**Approved by ANVISA in 21/05/2013.**

## SALES UNDER MEDICAL PRESCRIPTION FOR PROFESSIONAL USE ONLY

**Approved by ANVISA in 21/05/2013.**

## SALES UNDER MEDICAL PRESCRIPTION FOR PROFESSIONAL USE ONLY

**Approved by ANVISA in 21/05/2013.**

## SALES UNDER MEDICAL PRESCRIPTION FOR PROFESSIONAL USE ONLY

**Approved by ANVISA in 21/05/2013.**

**Fabricado e distribuído por/ Fabricado e distribuído por/  
Manufactured and distributed by:**  
DFL Indústria e Comércio S.A.  
Estrada do Guereguê, 2059  
Rio de Janeiro - RJ - Brasil  
CEP: 22713-002  
CNPJ: 33112665/0001-46  
Indústria Brasileira/ Indústria Brasileira/ Made in Brazil  
SAC: 0800 602 68 80  
[www.dfl.com.br](http://www.dfl.com.br) - [sac@df.com.br](mailto:sac@df.com.br)

**Farmacêutica Responsável  
Farmacêutica Responsable/ Pharmacist in Charge:**  
Renata Caroline - CRF-RJ Nº 21674

**Registro ANVISA Nº: 101770016**

In case of adverse events, notify the Drug Adverse Event Reporting System – VIGIMED, available at <http://portal.anvisa.gov.br/vigimed>, or the Health Surveillance of State or City.



Rev. 0 14274