

The benzocaine, as well as other local anesthetics, causes the reversible blockade of the propagation of the nervous pulse along the nerve fibers through the inhibition of the sodium ions movement to the interior of the nervous membranes. It is supposed that local anesthetics act inside of the sodium channels of the nervous membranes.

Local anesthetics can also have a similar effect in the excitable membranes of the brain and myocardium. If excessive amounts of the active principle reach the systemic circulation, signs and symptoms of toxicity can appear, from the cardiovascular and central nervous systems.

The toxicity in the central nervous system usually precedes the cardiovascular effects, once it happens in lower plasmatic levels. Direct effects of the local anesthetics in the heart include slow conduction, negative inotropism and, finally, cardiac arrest.

The benzocaine is absorbed after the topical application in mucous membranes and the velocity and the extension of the absorption depends on the total dose and the concentration administered, on the application place and on the exposure duration. The local anesthetics of the ester type, like benzocaine, are inactivated by hydrolysis in the liver, as well as in the sanguine plasma. Their metabolites and the small unchanged fraction of the drug are eliminated through the kidneys, facilitated by the acidification of the urine. Biliary and lung excretion is little significant.

## 2. Efficacy Results

Clinical trials have been evaluating the capacity of the anesthetics to block the conduction in the axons of the peripheral nervous system (Friedman PM and others: Comparative study of the efficacy of four topical anesthetics, Dermatol Surg 25:12, 1999/Buckley, J.A.; Rosivack, RG; Koenigsberg, SR; Maxwell, KC: An analysis of the effectiveness of two topical anesthetics, Anesth Prog 37:290-292, 1990).

## 3. Indications

The use of BENZOTOP is indicated for topical anesthesia of the oral mucosa previous to the local anesthesia by infiltration or even, in clinical procedures as impressions taken, X-ray, prosthesis positioning and dental tartar removal.

## 4. Contraindications

BENZOTOP is contraindicated in patients with a known history of hypersensitivity to benzocaine, to other local anesthetics of the ester type or to any other substance present in formula.

## 5. Administration and storage conditions after opening cartridge

This product should be kept in its original package, at room temperature (between 15°C and 30°C). Protect from light.

## 6. Dosage

Apply amounts of approximately 0.5 g, until the desired effect is reached. The maximum dose recommended is 2.0 g.

## 7. Warnings

Benzocaine overdoses or small intervals between applications, can result in high plasmatic levels and in serious adverse reactions. The absorption through skin and mucous membranes lesions is relatively high. Therefore, it should be used carefully in patients with traumatized mucous membranes and/or sepsis in the application area. The oral use of anesthetic agents can interfere in the deglutition and increases the risk of aspiration. The tongue or oral mucous membrane numbness can increase the risk of lesion due to bites.

If administration cause high plasmatic levels, the following patients will probably require special care, in order to avoid potentially harmful adverse effects:

Patients with total or partial cardiac blockade.

Elderly patients and patients with precarious health.

Patients with advanced hepatic disease or serious kidneys disturbances.

Patients with bradycardia.

Patients with epilepsy.

## 8. Use in elderly, children and other risk groups

Nothing contraindicates the use of Benzotop in elderly patients, since the patient's physical conditions are carefully evaluated, as well as the risks and the benefits of the treatment.

As occurs to other local anesthetics, benzocaine is excreted in human milk in small quantities and normally do not offer risks to neonates. As to any other drug, it is recommended that the use of benzocaine is done under the guidance of the health care professional and where the potential risks overcome the possible risks.

## 9. Drug Interactions

Benzotop should be administered with caution in patients receiving compounds structurally related to local anesthetic, since toxic effects are addictive.

## 10. Adverse reactions

Serious systemic adverse reactions are rare and are normally the result of high plasma levels caused by excessive dosage, rapid absorption, hypersensitivity, idiosyncrasy or reduced tolerance on the part of the patient. Reactions in the CNS may be characterized by irritability, dizziness, convulsions, loss of consciousness and in some cases, respiratory arrest. Cardiovascular reactions are normally characterized by hypotension, myocardium depression, bradycardia and eventually cardiac arrest.

## 11. Overdose

The airway must be assured and convulsions must be controlled. Oxygen tank and mask should be available. In case of convulsion, inject 5 to 15 mg of diazepam. In case of heart fibrillation, inject epinephrine in repeated doses and sodium bicarbonate.

## 12. 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 is equivalent to 24 months after manufacturing date.

**Lot #, manufacturing date and expire date: See product box.**

## Fabricado e distribuído por / Fabricado y distribuido por / Manufactured and distributed by:

DFL Indústria e Comércio S.A.

Estrada do Guerenguê, 2059 - Rio de Janeiro, RJ, Brasil

CEP/Código Postal/Postal Code: 22713-002

CNPJ: 33112665/0001-46

SAC: 0800 602 68 80 - Fax: 55-21-3342-4009

www.novadfl.com.br - sac@dfi.com.br

Indústria Brasileira / Industria Brasileña / Made in Brazil

## Farmacêutica Responsável/Farmacéutica

Responsible/Pharmacist in Charge:

Renata Caroline CRF-RJ - 21674

ANVISA/MS No: 101770027

Esta bula foi aprovada pela Anvisa em 30/05/2005.



Rev. 6



## BENZOTOP 200mg/g

Benzocaína

Português

SOMENTE PARA USO PROFISSIONAL

## Forma Farmacêutica - Gel

Exclusivamente para uso tópico em mucosas

Apresentação - Pote com 12 g no sabor Tutti-Frutti

## USO PEDIÁTRICO E/OU ADULTO

## COMPOSIÇÃO:

Cada g do gel sabor tutti-fruti contém:

Benzocaína..... 0,2 g

Excipientes q.s.p..... 1,0 g

Excipientes: Sacarina Sódica, Polietilenoglicol 4.000, Polietilenoglicol 400, Aroma Tutti-Frutti e Corante Color Red No. 28 CI 45410.

Contém: 12 g.

## INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

### 1. Características farmacológicas

Benzotop promove a anestesia rápida e profunda na mucosa bucal. Sua composição na forma de gel hidrossolúvel de alta viscosidade e baixa tensão superficial, proporciona contato íntimo e prolongado do anestésico com o tecido, produzindo anestesia eficiente de longa duração (aproximadamente 20-30 minutos). Geralmente o início da ação é rápido e se dá em aproximadamente 15 segundos quando aplicado sobre a mucosa bucal.

A benzocaína, assim como outros anestésicos locais, causa o bloqueio reversível da propagação do impulso nervoso ao longo das fibras nervosas através da inibição do movimento de ions sódio para o interior das membranas nervosas. Presume-se que os anestésicos locais atuem dentro dos canais de sódio das membranas nervosas.

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

A toxicidade no sistema nervoso central normalmente 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, conseqüentemente, parada cardíaca.

A benzocaína é absorvida após a aplicação tópica em membranas mucosas. A velocidade e a extensão da absorção depende da dose total administrada e da concentração, do local de aplicação e da duração da exposição. Os anestésicos locais tipo éster (benzocaína) são inativados por hidrólise no fígado bem como no plasma sanguíneo. Seus metabólitos e a pequena fração inalterada da droga são eliminados através dos rins, facilitada pela acidificação da urina. Excreção biliar e pulmonar são pouco significativas.

### 2. Resultados de eficácia

Estudos clínicos têm comprovado 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.; Rosivack, RG; Koenigsberg, SR; Maxwell, KC: An analysis of the effectiveness of two topical anesthetics, Anesth Prog 37:290-292, 1990).

### 3. Indicações

Benzotop é indicado como anestésico tópico na mucosa oral previamente à anestesia infiltrativa e ainda em procedimentos clínicos como tomada de impressões, radiografias, posicionamento de próteses e remoção de tártaro dental, entre outros.

### 4. Contra-indicações

O produto está contra-indicado em pacientes com hipersensibilidade à benzocaína ou a outros componentes da fórmula ou ainda, a anestésicos locais do tipo éster.

### 5. Modo de usar e cuidados de conservação depois de aberto

O produto deve ser conservado em sua embalagem original, em temperatura ambiente (entre 15° e 30°C). Proteger da luz.

### 6. Posologia

Fazer aplicações de 0,5 g para que seja alcançado o efeito desejado até a dose máxima recomendada que é de 2 g.

### 7. Advertências

Doses excessivas de benzocaína ou pequenos intervalos entre as aplicações podem resultar em níveis plasmáticos altos e em reações adversas graves. A absorção através de lesões de pele e mucosas é relativamente alta. Portanto, deve ser usada com cuidado em pacientes com mucosas traumatizadas e/ou sépsis no local da aplicação.

O uso oral de agentes anestésicos pode interferir na deglutição e aumenta o risco de aspiração. A dormência da língua ou da mucosa oral pode aumentar os riscos de lesão por mordida.

Se a administração resultar em altos níveis plasmáticos é provável que alguns pacientes necessitem de atenção especial para evitar-se efeitos adversos potencialmente perigosos:

Pacientes com bloqueio cardíaco total ou parcial.

Pacientes idosos e pacientes com saúde precária.

Pacientes com doenças hepáticas avançadas ou disfunção renal grave.

Pacientes com bradicardia.

Pacientes com epilepsia.

### 8. Uso em idosos, crianças e outros grupos de risco

Nada contra-indica o uso do produto em pacientes idosos, desde que as condições físicas do paciente sejam analisadas cuidadosamente e avaliados os riscos e benefícios.

Dobra 2

Dobra 2

Dobra 1

Dobra 1

Da mesma forma que outros anestésicos locais, a benzocaína passa para o leite materno, em pequenas quantidades e geralmente não apresenta riscos aos neonatos. Como para qualquer outra droga, recomenda-se que a benzocaína só seja utilizada a critério médico, e quando os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

#### 9. Interações medicamentosas

Benzotop deve ser utilizado com precaução em pacientes recebendo agentes estruturalmente relacionados aos anestésicos locais, uma vez que os efeitos tóxicos são aditivos.

#### 10. Reações adversas a medicamentos

Reações adversas sistêmicas graves são raras e podem resultar de níveis plasmáticos elevados devido a dosagem excessiva, rápida absorção, hipersensibilidade, idiosincrasia ou a reduzida tolerância do paciente. As reações do sistema nervoso central (SNC) incluem nervosismo, tontura, convulsões, inconsciência e em alguns casos parada respiratória. As reações cardiovasculares geralmente incluem: hipotensão, depressão miocárdica, bradicardia e eventualmente parada cardíaca.

#### 11. Superdose

O tratamento do paciente consiste em assegurar a ventilação e controlar as convulsões. Manter sempre à mão máscara e balão de oxigênio. Nos casos onde houver convulsões, injetar de 5 a 15 mg de diazepam. Se houver fibrilação do músculo cardíaco, injetar epinefrina em doses repetidas e bicarbonato de sódio.

#### 12. Armazenagem

O produto deve ser conservado em sua embalagem original, em temperatura ambiente (entre 15° e 30°C). Proteger da luz. O prazo de validade do produto é de 24 meses, contados a partir da data de fabricação.

#### PRODUTO DE USO EXCLUSIVAMENTE PROFISSIONAL

Número do lote, data de fabricação e prazo de validade: Vide cartucho.

## BENZOTOP 200mg/g Benzocaína Español

### EXCLUSIVO PARA USO PROFESIONAL

#### Forma Farmacéutica - Gel

Para ser usado exclusivamente em las mucosas.

Presentación - Pote con 12 g en el sabor Tutti-Frutti

#### USO PEDIÁTRICO Y/O ADULTO

#### COMPOSICIÓN:

Cada gramo de Benzotop Tutti-frutti contiene:

Benzocaína.....0,2 g

Excipientes c.s.....1,0 g

Excipientes: Sacarina sódica, polietilenglicol 4000, Polietilenglicol 400, Aroma Tutti-Frutti y colorante Color Red número 28 CI 45410.

Contiene: 12 g.

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

##### 1. Características farmacológicas

Benzotop promueve una anestesia rápida y profunda de la mucosa bucal. Gracias a su presentación en forma de gel hidrosoluble de alta viscosidad y baja tensión superficial se consigue un contacto íntimo y prolongado del anestésico con el tejido, y así, una anestesia eficiente de larga duración (aproximadamente 20-30 minutos). Generalmente la acción comienza en forma rápida, ocurre en aproximadamente 15 segundos cuando se aplica sobre la mucosa bucal.

La benzocaína, del mismo modo que otros anestésicos locales, causa el bloqueo reversible de la propagación del impulso nervioso a lo largo de las fibras nerviosas por inhibición del transporte de iones de sodio hacia el interior de las membranas nerviosas. Se supone que los anestésicos locales actúan en los canales de transporte de sodio de las membranas nerviosas.

Es probable que los anestésicos locales tengan un efecto similar sobre las membranas excitables del cerebro y del miocardio. Si una cantidad significativa del principio activo llega a la circulación sistémica pueden aparecer señales y síntomas de toxicidad provenientes del sistema cardiovascular y del nervio central.

La toxicidad en el sistema nervioso central normalmente precede los efectos cardiovasculares ya que ocurre en niveles plasmáticos más bajos. Los efectos directos de los anestésicos locales en el corazón se manifiestan como conducción lenta, inotropismo negativo y, como consecuencia, parada cardíaca.

La benzocaína se absorbe después de la aplicación tópica sobre las membranas mucosas. La velocidad y la extensión de la absorción dependen de la dosis total administrada y de la concentración, del lugar de aplicación y de la duración de la exposición. Los anestésicos locales del tipo éster (benzocaína) son metabolizados por hidrólisis en el hígado y en el plasma sanguíneo. Sus metabolitos y la pequeña fracción del fármaco no alterada se eliminan por los riñones, acción facilitada por la acidez de la orina. La excreción biliar y pulmonar son poco significativas.

##### 2. Resultados de comprobación de su eficacia

Estudios clínicos han comprobado 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.; Rosivack, RG; Koenigsberg, SR; Maxwell, KC: An analysis of the effectiveness of two topical anesthetics, Anesth Prog 37:290-292, 1990).

##### 3. Indicaciones

Benzotop se indica como anestésico tópico de la mucosa oral previo a la anestesia por infiltración y también para la realización de algunos procedimientos clínicos como toma de impresiones, radiografías, colocación de prótesis y limpieza del tártaro dental, entre otros.

##### 4. Contraindicaciones

Su uso está contraindicado para pacientes con conocida hipersensibilidad a los componentes de la fórmula o a anestésicos locales del tipo éster.

##### 5. Modo de usar y cuidados de conservación después de abierto

El producto debe ser conservado en su envase original, en temperatura ambiente (entre 15°C y 30°C). Proteger de la luz.

##### 6. Posología

Para lograr el efecto deseado hacer aplicaciones de 0,5 g hasta la dosis máxima recomendada que es de 2 g.

##### 7. Advertencias

Las dosis excesivas de benzocaína o las aplicaciones en intervalos muy pequeños pueden dar como resultado altos niveles plasmáticos o reacciones adversas graves. La absorción a través de lesiones de la piel o de las mucosas es relativamente alta. Por lo tanto, el fármaco se debe administrar con precaución en pacientes con lesiones en las mucosas y/o sepsis en el lugar de la aplicación.

El uso oral de los agentes anestésicos puede interferir en la deglución y elevar el riesgo de la aspiración. La dormencia de la lengua o de la mucosa oral puede aumentar el riesgo de lesiones por mordidas.

Los casos en los que la administración del fármaco ocasione altos niveles plasmáticos requieren que se preste atención especial al paciente para evitar efectos adversos potencialmente peligrosos; por ejemplo:

Pacientes con bloqueo cardíaco total o parcial.

Pacientes ancianos o con precario estado de salud.

Pacientes con enfermedades hepáticas en estado avanzado o con disfunción renal grave.

Pacientes con bradicardia.

Pacientes con epilepsia.

##### 8. Uso en ancianos, niños y otros grupos de riesgo.

No existen contraindicaciones para el uso del producto en pacientes con edad avanzada desde que sus condiciones físicas sean cuidadosamente analizadas y se evalúen los riesgos y los beneficios.

Del mismo modo que otros anestésicos locales la benzocaína pasa a la leche materna en pequeñas cantidades pero generalmente no representa ningún riesgo para los neonatos. Como en el caso de cualquier otra droga se recomienda usar la benzocaína bajo supervisión médica y cuando los presuntos beneficios superen los riesgos potenciales.

##### 9. Interacciones medicamentosas

Benzotop se debe utilizar con precaución en pacientes que están haciendo un tratamiento con sustancias de estructura relacionada con los anestésicos locales debido a que los efectos tóxicos son acumulativos.

##### 10. Acciones adversas a medicamentos

Las reacciones adversas sistémicas graves son raras y pueden ser el resultado de niveles plasmáticos elevados debido a una dosis excesiva, rápida absorción, hipersensibilidad, o a la idiosincrasia o la reducida tolerancia del paciente. Las reacciones del sistema nervioso central (SNC) pueden ser nerviosismo, mareos, convulsiones, pérdida del conocimiento y, en algunos casos, parada respiratoria. Las reacciones cardiovasculares generalmente son: hipotensión, depresión miocárdica, bradicardia y eventualmente parada cardíaca.

##### 11. Sobredosis

El tratamiento del paciente consiste en asegurarle la ventilación y controlarle las convulsiones. Siempre se deben tener a mano la máscara y el tubo de oxígeno. En el caso en que el paciente tenga convulsiones se le deben inyectar de 5 a 15 mg de diazepam. Si se presenta un cuadro de fibrilación del músculo cardíaco se deben inyectar dosis de epinefrina y bicarbonato de sodio.

##### 12. 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 de la fecha de fabricación.

#### PRODUTO DE USO EXCLUSIVAMENTE PROFESIONAL

Número do lote, fecha de fabricação y validez (mes/año): Ver el cartucho.

## BENZOTOP 200mg/g Benzocaine English

### PROFESSIONAL USE ONLY

#### Pharmaceutical form - Gel

Presentation - Pot containing 12 g, available in Tutti-Frutti flavor

Exclusively for topical use in mucous membranes

#### FOR ADULT AND/OR PEDIATRIC USE

#### COMPOSITION:

Each g of the tutti-frutti flavored gel contains:

Benzocaine..... 0,2 g

Excipients e.f..... 1,0 g

Excipients: Sodium Saccharin, Polyethylene glycol 4000, Polyethylene glycol 400, Tutti-Frutti Flavor and Color Red # 28 CI 45410.

Net weight: 12 g.

#### TECHNICAL INFORMATION FOR THE HEALTH CARE PROFESSIONALS

##### 1. Pharmacological characteristics

Benzotop promotes a quick and deep anesthesia in the oral mucous membrane. Its solubility in water, high viscosity and low superficial tension gel formulation, provides an intimate and longstanding contact of the anesthetic and the tissue, providing a long lasting efficient anesthesia (approximately 20-30 minutes). Usually the beginning of the action is quick and occurs in approximately 15 seconds after application on the oral mucous membrane.

-----  
Dobra 2  
-----

-----  
Dobra 1  
-----

-----  
Dobra 2  
-----

-----  
Dobra 1  
-----