

FICHAS DE INFORMAÇÃO TÉCNICA

LIDOCAÍNA BASE e CLORIDRATO DE LIDOCAÍNA

Sinónimos: Xilocaína. Lignocaína.

Dados Físico-Químicos: Lidocaína base

Pó cristalino, branco ou quase branco. Pract. insolúvel em água, solúvel em etanol a 96% e cloreto de metileno. Ponto de fusão: 68-69°C.

Fórmula Molecular: C₁₄H₂₂N₂O

Peso Molecular: 234,34

Cloridrato de lidocaína

Pó cristalino, branco ou quase branco. Altamente solúvel em água, facilmente solúvel em etanol a 96%. Ponto de fusão: 77 -78°C.

Fórmula Molecular: C₁₄H₂₃ClN₂O·H₂O

Peso Molecular: 288,82

Aprox. 1,23 g de Cloridrato de lidocaína (mono-hidrato) equivalem a 1 g de Lidocaína base.

Propriedades e usos:

A lidocaína é um anestésico local do tipo amida com duração de acção intermédia e um antiarrítmico de classe Ib. Actua estabilizando a membrana neuronal, prevenindo o início e a propagação do impulso nervoso.

A lidocaína é rapidamente absorvida através da pele lesionada (não através da pele intacta) e através do ponto de injeção no músculo. Distribui-se amplamente aos tecidos, incluindo o músculo esquelético e o tecido adiposo. Une-se em 66 % a proteínas plasmáticas. A semi-vida inicial depois de uma dose intravenosa é < 30 min. Metaboliza-se no fígado e sofre efeito de primeiro passo hepático. A semi-vida de eliminação é de 1 – 2 h. Atravessa as barreiras placentária e hematoencefálica e passa o leite materno.

Normalmente usa-se a Lidocaína base para cremes e unguentos, e o Cloridrato de lidocaína para geles e soluções.

A lidocaína como anestésico é utilizada para anestesia local tópica ou por infiltração na pele em casos de prurido e dor associada a feridas, queimaduras, abrasões, manifestações cutâneas de doenças sistémicas como o sarampo, picadelas, eczemas, episiotomia e dores dentárias e gengivais. Em forma de gel é utilizada, por exemplo: para anestesia do tracto urinário. Em forma de solução tópica é usada para a anestesia superficial de membranas mucosas da boca, garganta e outras do tracto gastrointestinal superior. Acompanhando a fluoresceína, é usada em forma de gotas oculares para as tonometrias. Também é usada em anestesia regional, anestesia epidural e anestesia espinal.

A lidocaína viscosa é um gel líquido de lidocaína usado nos tratamentos que se seguem às intervenções oncológicas e sobretudo

FICHAS DE INFORMAÇÃO TÉCNICA

em casos de mucosite.

A lidocaína como antiarrítmico é usada em taquicardias ventriculares e fibrilação ventricular, em especial as associadas a enfarte agudo do miocárdio e nos protocolos de RCP.

Finalmente, também é usada no status epilepticus refractário a outros tratamentos.

- Dosagem:** Por via tópica, a 2 – 5 % de Lidocaína base ou a 0,5 – 5 % de Cloridrato de lidocaína.
- Efeitos secundários:** Os efeitos adversos da lidocaína são em geral raros, embora moderadamente importantes. Na maior parte dos casos, os efeitos adversos estão relacionados com a dose. Ocasionalmente pode aparecer excitação, agitação, enjoos, tinidos, visão nebulosa, náuseas, vômitos, tremores e convulsões. O entorpecimento da língua e da região perioral pode ser um primeiro sintoma da toxicidade sistémica. Depois da excitação pode aparecer depressão com sonolência, depressão respiratória e coma, inclusive com depressão miocárdica, hipotensão, bradicardia, arritmias e paragem cardíaca. Excepcionalmente podem aparecer reacções alérgicas (urticária, dermatite de contacto, reacção anafilactóide) e meta-hemoglobinemia. Após a aplicação tópica, além das reacções de tipo alérgico, pode aparecer irritação cutânea, inchaço, abrasão e necrose.
- Contra-indicações:** Alergia à lidocaína ou a anestésicos locais do tipo amida.
- Cuidados:** Dever-se-á efectuar um controlo médico especial em doentes com epilepsia, bloqueio cardíaco, bradicardia, insuficiência cardíaca, porfíria, insuficiência hepática e/ou renal ou choque grave, quando se supuser que, devido ao lugar de aplicação ou à utilização de doses elevadas, poderão ocorrer concentrações plasmáticas elevadas. Não é aconselhável a aplicação sobre áreas inflamadas ou infectadas. Os idosos, crianças e doentes muito debilitados são mais susceptíveis aos efeitos tóxicos do preparado, especialmente em situações onde haja risco de absorção sistémica. Quando se usar em anestesia bucofaríngea, aconselha-se que não se coma enquanto a anestesia persistir, devido ao risco de broncoaspiração ou de mordedura da língua.
- Interacções:** O propranolol (e eventualmente outros betabloqueantes) e a cimetidina podem reduzir o metabolismo hepático e/ou o aclaramento da lidocaína. Os efeitos depressores da lidocaína são aditivos com os dos betabloqueantes e outros antiarrítmicos. A administração a longo prazo de indutores enzimáticos como fenitoína ou barbitúricos pode aumentar as doses requeridas de lidocaína. A hipocaliemia provocada pelos diuréticos antagoniza o efeito da

FICHAS DE INFORMAÇÃO TÉCNICA

lidocaína.

Incompatibilidades:

Anfotericina, sulfadiazina de sódio, metohexitona de sódio, cefazolina de sódio, ampicilina de sódio e fenitoína de sódio.

As soluções devem ser embaladas e conservadas em frascos de vidro para se evitar a adsorção de lidocaína no plástico.

A lidocaína forma uma mistura eutéctica com a prilocaína (liquefazem-se juntas), o que, mais do que uma incompatibilidade, é uma característica que se aproveita quando se trata de preparar fórmulas tópicas.

Observações:

A Lidocaína base é termossensível e fotossensível.

Conservação:

Em embalagens bem fechadas. PROTEGER DA LUZ.

Exemplos de formulação:**Creme de lidocaína e prilocaína**

Lidocaína base	2,5 %
Prilocaína base	2,5 %
Cera Lanette O	14 %
Vaselina Líquida	8 %
Tween 80	3 %
Nipagin	0,05 %
Nipazol	0,02 %
Água purificada q.s.p.	100 g

Modus operandi:

Fundir a vaselina com a cera, o Tween e o Nipazol por um lado, e por outro aquecer a água com o Nipagin. Adicionar a fase aquosa sobre a fase gorda, agitando com vareta até ao arrefecimento. Em almofariz triturar a lidocaína e a prilocaína até que se liquefaçam, e incorporar o creme pouco a pouco, homogeneizando com o pilão.

Excipiente adesivo oral com lidocaína e hidrocortisona

Cloridrato de lidocaína	2 %
Hidrocortisona	1 %
Excipiente Acofar adesivo oral	50 g

Modus operandi:

Pulverizar bem os sólidos no almofariz, humedecer com um pouco de vaselina líquida e incorporar o excipiente pouco a pouco, homogeneizando com o pilão.

Gel de lidocaína

Cloridrato de lidocaína	2 %
Carboximetilcelulose de sódio	2 %
Nipagin de sódio	0,1 %

FICHAS DE INFORMAÇÃO TÉCNICA

Água purificada q.s.p. 100 g

Modus operandi:

Dissolver o cloridrato de lidocaína e o Nipagin de sódio na água purificada, e proceder à sua gelificação (veja ficha técnica Carboximetilcelulose de sódio).

Lidocaína viscosa

Cloridrato de lidocaína 2 %
Metilcelulose 4 %
Água purificada q.s.p. 10 g

Modus operandi:

Dissolver o cloridrato de lidocaína na água purificada. Gelificar a solução (veja ficha técnica Metilcelulose).

Solução de lidocaína

Cloridrato de lidocaína 4 %
Solução hidro-alcóolica 70 % q.s.p. 100 ml

Modus operandi:

Dissolver o cloridrato de lidocaína na água, e uma vez dissolvido adicionar a parte de álcool.

Bibliografia:

- Martindale, *Guía completa de consulta farmacoterapéutica*, 1ª ed. (2003).
- *The Merck Index*, 13ª ed. (2001).
- *Monografías Farmacéuticas*, C.O.F. de Alicante (1998).
- *Formulario básico de medicamentos magistrales*, Mª. José Llopis Clavijo e Vicent Baixauli Comes (2007).