

ZUSAMMENFASSUNG DER MERKMALE DES ARZNEIMITTELS

1. BEZEICHNUNG DES ARZNEIMITTELS

Xylocain 10% - Pumpspray

2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

1 Sprühstoß (= 0,1 ml) enthält 10 mg Lidocain.

Sonstiger Bestandteil mit bekannter Wirkung: Ethanol-Wassergemisch 24,1mg pro Sprühstoß.
Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile siehe Abschnitt 6.1.

3. DARREICHUNGSFORM

Lösung zur Anwendung auf der Haut

Xylocain - Pumpspray ist eine klare oder fast klare, leicht rosa oder gelb gefärbte Lösung mit einem Geruch nach Ethanol, Menthol und Banane. Der aktive Wirkstoff ist in einer Mischung aus Wasser, Ethanol und Macrogol gelöst.

4. KLINISCHE ANGABEN

4.1 Anwendungsgebiete

Xylocain – Pumpspray wird angewendet bei Erwachsenen, Neugeborenen, Kleinkindern, Kindern und Jugendlichen

Zur Oberflächenanästhesie im Zusammenhang mit folgenden Prozeduren:

- Eingriffe im Nasenbereich, z.B. Punktierung des Sinus maxillaris
- Eingriffe im Mund- und Zahnbereich, z.B. vor einer Injektion
- Eingriffe im Oropharynx, z.B. gastrointestinale Endoskopie
- Eingriffe im Respirationstrakt, z.B. Einführen von Instrumenten und Tuben
- Eingriffe in Larynx, Trachea und Bronchien
- Eingriffe bei der Geburtshilfe und Gynäkologie, z.B. vaginale Geburt, Nähen von Rissen in der Schleimhaut und Zervikalbiopsien

4.2 Dosierung und Art der Anwendung

Dosierung

Xylocain - Pumpspray bewirkt eine rasche und starke Anästhesie der Schleimhäute für etwa 10 - 15 Minuten. Die Anästhesie setzt, abhängig vom Anwendungsort, innerhalb von 1 - 3 Minuten ein.

Mit jedem Druck auf die Pumpeinrichtung des Sprays wird eine dosierte Menge von 10 mg Lidocain versprüht. Es ist nicht notwendig, die Anwendungsstelle vor der Anwendung zu trocknen.

Xylocain - Pumpspray darf nicht auf Manschetten von Endotrachealtuben (ETT) aus Plastik verwendet werden (siehe Abschnitt 4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung).

Wie bei anderen Lokalanästhetika hängt die Sicherheit und Wirksamkeit von Lidocain von der geeigneten Dosierung, der richtigen Technik, der angemessenen Vorsicht und der Schnelligkeit des Einschreitens bei kritischen Fällen ab. Um hohe Lidocain-Plasmaspiegel zu vermeiden, soll immer die niedrigste Dosis, die einen ausreichenden Effekt gewährleistet, angewandt werden.

Die folgenden Angaben gelten als Richtlinien. Die Erfahrung des Arztes und das Wissen um den physischen Zustand eines Patienten sind bei der Berechnung der geeigneten Dosis von Bedeutung.

Dosierungsempfehlungen für Erwachsene

Anwendungsort	Empfohlene Dosis (mg)
Eingriffe im Nasenbereich, z.B. Punktierung des Sinus maxillaris	20-60
Eingriffe im Mund- und Zahnbereich, z.B. vor einer Injektion	20-200
Eingriffe im Oropharynx, z.B. gastrointestinale Endoskopie	20-200
Eingriffe im Respirationstrakt, z.B. Einführen von Instrumenten und Tuben	50-200
Eingriffe in Larynx, Trachea und Bronchien	50-200
Eingriffe bei der Geburtshilfe und Gynäkologie, z.B. vaginale Geburt, Nähen von Rissen in der Schleimhaut und Zervikalbiopsien	50-200

In der Oto-Rhino-Laryngologie, Stomatologie wie z.B. bei Affektionen der Ohrmuschel und des äußeren Gehörganges, der Parazentese des Trommelfells, im Bereich des knöchernen und knorpeligen Nasenganges (Septumaffektionen), Biopsie aus der Schleimhaut von Mundhöhle und Rachen sind meist 1 - 2 Sprühstöße ausreichend.

Empfohlene Maximaldosen:

Die Maximaldosis für Erwachsene mit normalem Körpergewicht (70 kg) entspricht 20 Sprühstößen (= ca. 200 mg Lidocain entsprechend 3mg/kg KG).

Dosierungsempfehlungen für Kinder von 2 bis 12 Jahren

Bei Kindern sollen die Dosen bei laryngotrachealer Anwendung 3 mg/kg nicht überschreiten; für nasale, orale und bei oropharyngealer Anwendung sollen die Dosen 4 - 5 mg/kg nicht überschreiten.

Dosierungsempfehlungen für Kinder bis 2 Jahre

Xylocain - Pumpspray darf wegen des Gehaltes an Menthol nicht bei Säuglingen und Kindern bis zu 2 Jahren angewendet werden.

Dosierungsempfehlungen für Jugendliche (12-18 Jahre)

Bei Jugendlichen über 12 Jahren, die weniger als 25 kg wiegen, sollte die Dosierung entsprechend ihrem Alter, Gewicht und ihrer physischen Verfassung angepasst werden.

Dosierungsempfehlungen für Risikopatienten

Bei Patienten in schlechtem Allgemeinzustand, bei älteren Patienten >65 Jahren, bei Patienten mit eingeschränkter Leberfunktion oder schwerer Nierendysfunktion soll die Dosierung entsprechend angepasst werden. Die Maximaldosis muss in mg Lidocainhydrochlorid/kg Körpergewicht errechnet werden (2,9 mg Lidocainhydrochlorid/kg Körpergewicht).

Art der Anwendung

Zum Auftragen auf die Haut und Schleimhaut durch eine Sprühkanüle.
Ein eventuell auftretendes leichtes Brennen bei der ersten Applikation verschwindet mit dem schnellen Eintritt der Oberflächenanästhesie.

Nach Entfernen der Schutzkappe und Aufstecken der Sprühkanüle ist Xylocain - Pumpspray gebrauchsfertig. Jeder Druck auf den Ventilknopf gibt jeweils ca. 100 mg Spray frei, worin 10 mg Lidocain enthalten sind.

4.3 Gegenanzeigen

Xylocain - Pumpspray darf nicht angewendet werden:

- bei Überempfindlichkeit gegen Lidocain, andere Lokalanästhetika vom Amidtyp oder einen der in Abschnitt 6.1 genannten sonstigen Bestandteile
- bei schweren Störungen des Herz-Reizleitungssystems (Herzblock)
- bei akuter dekompensierter Herzinsuffizienz
- bei kardiogenem- und hypovolämischem Schock
- bei Kindern bis 2 Jahre wegen des Gehaltes an Menthol
- bei Patienten mit Asthma bronchiale oder anderen Atemwegserkrankungen wegen des Gehaltes an Menthol auf Grund der Gefahr einer Bronchokonstriktion

4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Vorsicht ist geboten bei:

- hoher Dosierung oder kurzen Intervallen zwischen den Dosen. Um hohe Plasmaspiegel zu vermeiden, soll immer die niedrigste Dosis, die einen ausreichenden Effekt gewährleistet, in nicht zu kurzen Intervallen angewandt werden. Das Ausmaß der Resorption durch die Schleimhäute ist unterschiedlich, jedoch besonders hoch im Bronchialbaum. Anwendungen im Bronchialbaum können daher zu rasch steigenden oder erhöhten Plasmaspiegeln führen und sind mit einem erhöhten Risiko für toxische Symptome wie Konvulsionen verbunden.
- Patienten mit Wunden oder traumatisierten Schleimhäuten im Bereich der vorgesehenen Anwendungsstelle. Eine zerstörte Schleimhaut führt zu erhöhter systemischer Resorption.
- Patienten unter Vollnarkose, da höhere Blutkonzentrationen als bei spontan atmenden Patienten auftreten können. Spontan atmende Patienten verschlucken eher einen Teil des Wirkstoffes, der aber nach der Resorption im Darmtrakt einem „first-pass“-Metabolismus in der Leber unterliegt.
- oropharyngealer Anwendung. Es kann dadurch zu einer Schluckbehinderung kommen und die Gefahr einer Aspiration erhöht werden. Taubheit der Zunge oder der Mundschleimhaut kann die Gefahr eines Bisstraumas erhöhen.
- Augenkontakt ist zu vermeiden.
- Patienten, die mit Antiarrhythmika Klasse III (z.B. Amiodaron) behandelt werden, sind sorgfältig zu beobachten. Es ist eine EKG-Überwachung zu erwägen, da die Wirkungen auf das Herz additiv sein können.

Wenn die verwendete Menge oder das Anwendungsgebiet hohe Blutplasmaspiegel erwarten lässt, benötigen folgende Patienten spezielle Überwachung, um potentiell gefährliche Nebenwirkungen zu vermeiden

- Patienten mit teilweiser oder vollständiger Blockierung des kardialen Reizleitungssystems.
- Ältere Patienten oder Patienten mit schlechtem Allgemeinzustand.
- Patienten mit schwerer Nierenfunktionsstörung.
- Patienten mit schwerer Leberfunktionsstörung.

Xylocain - Pumpspray darf nicht auf Manschetten von Endotrachealtuben (ETT) aus Plastik verwendet werden. Basisches Lidocain kann bei Kontakt mit PVC und nicht-PVC-Manschetten von Endotrachealtuben zur Beschädigung der Manschette führen. Diese Beschädigung wird wie ein Nadeleinstich beschrieben, der zu einer Undichtheit und damit zu einem Druckverlust in der Manschette führen kann.

Xylocain - Pumpspray ist wahrscheinlich porphyrinogen und sollte an Patienten mit akuter Porphyrie nur bei dringender Indikationsstellung verschrieben werden. Bei allen Patienten mit Porphyrie sind entsprechende Vorsichtsmaßnahmen zu treffen.

Dieses Arzneimittel enthält 24,1 mg Alkohol (Ethanol) pro Sprühstoß.
Bei geschädigter Haut kann es ein brennendes Gefühl hervorrufen.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Lidocain sollte bei Patienten, die andere Lokalanästhetika oder zu Lokalanästhetika des Amidtyps strukturverwandte Medikamente, z.B. Antiarrhythmika wie Mexiletin und Tocainid, erhalten, mit Vorsicht angewandt werden, da die toxischen Wirkungen additiv sind.

Spezifische Wechselwirkungsstudien mit Lidocain und Antiarrhythmika Klasse III (z.B. Amiodaron) wurden nicht durchgeführt, es ist jedoch Vorsicht geboten (siehe Abschnitt 4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung).

Arzneimittel, die die Clearance von Lidocain verringern (z.B. Cimetidin oder Betablocker sowie Propanolol, Diltiazem oder Verapamil) können zu potenziell toxischen Plasmakonzentrationen führen, wenn Lidocain über einen längeren Zeitraum wiederholt in hohen Dosen verabreicht wird. Solche Wechselwirkungen sollten daher bei einer kurzzeitigen Behandlung mit empfohlenen Dosen von Lidocain (z.B. Xylocain - Pumpspray) nicht von klinischer Bedeutung sein.

4.6 Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Fertilität:

Lidocain wurde bereits von einer großen Zahl an Frauen im gebärfähigen Alter angewendet. Es gibt keinen Hinweis auf einen negativen Einfluss auf den Reproduktionsprozess. Reproduktions-Toxizitätsstudien an Tieren zeigten keine durch das Arzneimittel bedingten Nebenwirkungen.

Schwangerschaft

Lidocain sollte in der Schwangerschaft nur bei strenger Indikationsstellung angewendet werden, da keine kontrollierten Studien an Schwangeren durchgeführt wurden. Bisher liegen keine Hinweise auf angeborene Missbildungen nach Lidocainexposition in der Schwangerschaft vor. Lidocain passiert nach parenteraler Gabe die Plazenta. Untersuchungen zum plazentaren Übergang nach topischer Anwendung liegen nicht vor.

Stillzeit

Lidocain geht nach parenteraler Gabe in geringen Mengen in die Muttermilch über. Untersuchungen zum Übergang nach topischer Anwendung liegen nicht vor, jedoch ist eine Gefährdung des Säuglings unwahrscheinlich.

4.7 Auswirkungen auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen

Durch individuell auftretende unterschiedliche Reaktionen kann die Fähigkeit zur aktiven Teilnahme am Straßenverkehr oder zum Bedienen von Maschinen beeinträchtigt werden.

Bis zum Abklingen der Wirkung sollen keine Fahrzeuge gelenkt und keine Maschinen bedient werden.

4.8 Nebenwirkungen

Eine genaue Einschätzung der Nebenwirkungshäufigkeit ist auf Grund fehlender Daten aus klinischen Studien nicht möglich.

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Häufigkeiten zugrunde gelegt: Sehr häufig ($\geq 1/10$, häufig ($\geq 1/100$, $< 1/10$), gelegentlich ($\geq 1/1000$ $< 1/100$), selten ($\geq 1/10\ 000$ $< 1/1000$), sehr selten ($< 1/10\ 000$), nicht bekannt (Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar).

Erkrankungen des Immunsystems

Selten: allergische Reaktionen einschließlich allergischer Schock (zu den Symptomen können gehören: Bronchospasmus, Atemnotsyndrom, Hautläsionen, Urtikaria und Ödeme)

Herzerkrankungen

Nicht bekannt: Myokarddepression, Rhythmusstörungen, Blutdruckanstieg, Blutdruckabfall, Pulsanstieg, Bradykardie, Asystolie infolge Reizung und/oder Depression der Hirnrinde und Medulla

Augenerkrankungen

Nicht bekannt : Mydriasis

Erkrankungen des Gastrointestinaltrakts

Nicht bekannt: Erbrechen

Verletzung, Vergiftung und durch Eingriffe bedingte Komplikationen

Nicht bekannt: Reizung an der Applikationsstelle

Skelettmuskulatur-, Bindegewebs- und Knochenerkrankungen

Nicht bekannt: Muskelzuckungen

Erkrankungen des Nervensystems

Nicht bekannt: Krämpfe, Bewusstlosigkeit, Desorientiertheit, Sprachstörung, Schwindel, Unruhe

Erkrankungen der Atemwege, des Brustraums und Mediastinums

Nicht bekannt: Atemstillstand, Rachenreizung

Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen

Die Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen nach der Zulassung ist von großer Wichtigkeit. Sie ermöglicht eine kontinuierliche Überwachung des Nutzen-Risiko-Verhältnisses des Arzneimittels. Angehörige von Gesundheitsberufen sind aufgefordert, jeden Verdachtsfall einer Nebenwirkung über das nationale Meldesystem anzuzeigen.

Österreich:

Bundesamt für Sicherheit im Gesundheitswesen
Traisengasse 5
1200 WIEN
ÖSTERREICH
Fax: + 43 (0) 50 555 36207
Website: <http://www.basg.gv.at/>

4.9 Überdosierung

Symptome einer Überdosierung/Intoxikation

Toxische Reaktionen nehmen zumeist im ZNS und Herz-Kreislaufsystem ihren Ausgang.

Die ZNS-Toxizität ist ein mehrstufiger Prozess mit Symptomen, die in ihrem Schweregrad ansteigen. Die ersten Symptome sind circumorale Parästhesie, Taubheit der Zunge, Benommenheit, herabgesetztes Hörvermögen und Tinnitus. Sehstörungen und Muskelzittern sind schwerwiegender und gehen generellen Krampfanfällen voraus. Bewusstlosigkeit und Grand mal können folgen und können wenige Sekunden bis mehrere Minuten andauern. Hypoxie und Hyperkapnie treten, aufgrund der erhöhten muskulären Aktivität in Kombination mit der Beeinträchtigung der normalen Atmung, rasch nach Krampfanfällen auf. In schweren Fällen kann es auch zu Atemstillstand kommen. Eine Azidose verstärkt die systemische Toxizität lokaler Anästhetika. Nach Redistribution des Lokalanästhetikums aus dem ZNS und darauffolgendem Metabolismus und Exkretion tritt dann Erholung ein. Diese kann rasch erfolgen, wenn nicht große Mengen des Wirkstoffes appliziert wurden.

Kardiovaskuläre Toxizität tritt nur als Resultat hoher systemischer Konzentrationen auf. Schwere Hypotonie, Bradykardie, Arrhythmie und Herzstillstand können auftreten.

Der kardiovaskulären Toxizität gehen meist Zeichen von ZNS-Toxizität voraus, außer der Patient ist in Allgemeinnarkose oder ist durch Substanzen wie Benzodiazepin oder Barbiturat stark sediert.

Notfallmaßnahmen

Es wird erwartet, dass möglicherweise auftretende Symptome systemischer Toxizität ähnlich denen sind, die bei der Verabreichung von Lokalanästhetika über andere Wege auftreten können. Die Toxizität von Lokalanästhetika zeigt sich durch Symptome zentralnervöser Erregung und in schweren Fällen, zentralnervöser und kardiovaskulärer Depression.

Schwere neurologische Symptome (Krampfanfälle, ZNS Depression) müssen symptomatisch durch Unterstützung der Atmung und Verabreichung krampflösender Mittel behandelt werden.

Falls es zu einem Kreislaufstillstand kommt, sollte sofort mit den Wiederbelebensmaßnahmen begonnen werden. Optimale Sauerstoffversorgung, Beatmung und Kreislaufunterstützung sowie eine Behandlung der Azidose sind entscheidend. Die notwendigen Medikamente sowie Ausrüstung sollten unmittelbar zur Verfügung stehen. Das Ziel der Behandlung ist, die Sauerstoffversorgung zu gewährleisten, die Krämpfe zu beenden und den Kreislauf zu unterstützen. Folgende Gegenmaßnahmen sind erforderlich:

- Sofortige Unterbrechung der Zufuhr von Lidocain.
- Zusätzlich Sauerstoff zuführen; falls notwendig mit reinem Sauerstoff assistiert oder kontrolliert beatmen (zunächst über Maske und mit Beatmungsbeutel, dann erst über einen Trachealtubus).
- Krämpfe werden, wenn sie nicht spontan innerhalb von 15 bis 30 Sekunden aufhören, mit einer i.v. Verabreichung eines krampflösenden Mittels behandelt. Thiopental-Natrium 1-3 mg/kg i.v. führt rasch zu einer Lösung der Krämpfe. Alternativ kann Diazepam 0,1 mg/kg KG i.v. gegeben werden, obwohl die Wirkung langsam eintritt.
- Anhaltende Krämpfe können die Beatmung und Sauerstoffversorgung des Patienten gefährden. Wenn das der Fall ist, kann die Injektion eines Muskelrelaxans (z.B. Succinylcholin (Suxamethonium) 1 mg/kg KG) die Beatmung erleichtern, und die Sauerstoffversorgung kann kontrolliert werden. Eine frühe endotracheale Intubation muss in solchen Situationen erwogen werden.
- Bei kardiovaskulärer Depression (Hypotonie, Bradykardie) sollte Ephedrin 5-10mg i.v. verabreicht werden und die Gabe nach 2-3 min, wenn nötig, wiederholt werden. Bei Verdacht auf Herzstillstand sind die erforderlichen Maßnahmen der Reanimation durchzuführen.
- Optimale Sauerstoffversorgung, Beatmung und Kreislaufunterstützung sowie eine Behandlung der Azidose sind entscheidend, da eine Sauerstoffunterversorgung und Azidose die systemische Toxizität lokaler Anästhetika verstärkt. Adrenalin (0,1-0,2 mg i.v.) sollte so früh wie möglich als intravenöse oder intrakardiale Injektion verabreicht werden. Die Injektion sollte, wenn notwendig, wiederholt werden.
- Sorgfältige Kontrolle aller Vitalfunktionen, bis diese wieder der Norm entsprechen!

5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Lokalanästhetika, Amide, Lidocain

ATC-Code: N01BB02

Xylocain - Pumpspray bewirkt eine schnelle und starke Anästhesie der Schleimhäute. Die Anästhesie erfolgt innerhalb von 1 - 3 Minuten abhängig vom Anwendungsort. Die Wirkdauer beträgt ca. 10 - 15 Minuten.

Lidocain ist ein Lokalanästhetikum vom Typ der Säureamide. Es hemmt die Funktion erregbarer Strukturen, wie sensorische, motorische und autonome Nervenfasern sowie die Erregungsleitung des Herzens. Lidocain hebt reversibel und örtlich begrenzt das Leitungsvermögen der sensiblen Nervenfasern auf. Nach der Schmerzempfindung wird in dieser fallenden Reihenfolge die Empfindung für Kälte bzw. Wärme, für Berührung und Druck herabgesetzt.

Lidocain wirkt außerdem antiarrhythmisch. Es zeigt zusätzlich eine schwach antihistaminerge und parasympatholytische Wirkung. Im Gegensatz zu den meisten anderen Lokalanästhetika besitzt Lidocain keine gefäßerweiternde Wirkung.

Lokalanästhetika können auch auf erregbare Membranen in Gehirn und Herz eine ähnliche Wirkung ausüben. Wenn zu hohe Wirkstoffmengen rasch in den systemischen Kreislauf gelangen, treten Vergiftungssymptome auf, die hauptsächlich vom ZNS und vom kardiovaskulären System ausgehen.

ZNS-Toxizitätsreaktionen (siehe Abschnitt 4.9 Überdosierung) gehen gewöhnlich denen des Herz-Kreislauf-Systems voraus, da erstere bei niedrigeren Plasmakonzentrationen vorkommen. Direkte Auswirkungen von Lokalanästhetika auf das Herz können u. a. verlangsamte Leitung, negative Inotropie bis hin zum Herzstillstand sein.

5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Absorption

Die Absorption von Lidocain erfolgt nach lokaler Anwendung auf Schleimhäuten und ist von der Konzentration und von der Gesamtdosis, die verabreicht wurde, sowie vom spezifischen Applikationsort und der Dauer der Anwendung abhängig. Im Allgemeinen werden lokalanästhetisch wirkende Substanzen nach intratrachealer und bronchialer Anwendung am raschesten resorbiert, was zu rasch steigenden oder hohen Plasmakonzentrationen mit einem erhöhten Risiko zu toxischen Symptomen wie Konvulsionen führen kann. Lidocain wird auch aus dem Gastrointestinaltrakt gut resorbiert, obwohl wenig davon in den Kreislauf gelangt, weil Lidocain in der Leber verstoffwechselt wird.

Verteilung

Die Plasmaproteinbindung von Lidocain hängt von der Konzentration des Wirkstoffes ab, die gebundene Fraktion verringert sich mit steigender Konzentration. Bei Konzentrationen von 1 bis 4 µg freier Base/ml werden 60 bis 80 % Lidocain an Plasmaproteine gebunden. Amid-Lokalanästhetika werden vorwiegend an alpha-1-saures Glykoprotein, aber auch an Albumin gebunden.

Lidocain überschreitet wahrscheinlich durch passive Diffusion die Blut-Hirnschranke und die Plazentaschranke.

Lidocain wird nach peroraler Gabe gut resorbiert, unterliegt jedoch einem ausgeprägten "first-pass" Metabolismus. Über die Nieren werden 5 - 10 % einer parenteral verabreichten Dosis ausgeschieden.

Biotransformation

Lidocain (90 - 95 % der Dosis) wird in der Leber durch Monooxygenasen rasch metabolisiert. Haupttrichtung der Biotransformation sind die oxidative N-Dealkylierung, Ringhydroxylierung und Amidhydrolyse. Hydroxyderivate werden konjugiert. Durch N-Dealkylierung, der Haupttrichtung der Biotransformation, entstehen die Metabolite Monoethylglycinxylylidid und Glyzinxylylidid (GX). Die pharmakologischen/toxikologischen Wirkungen dieser Metabolite sind denen von Lidocain ähnlich,

jedoch schwächer. GX hat eine längere Halbwertszeit (ca. 10 Stunden) als Lidocain und kann während länger dauernder Anwendung akkumulieren.

Elimination

Lidocain und seine Metabolite werden renal eliminiert. Etwa 90 % des verabreichten Lidocains werden in Form verschiedener Metaboliten, weniger als 10 % werden unverändert über den Harn ausgeschieden. Der primäre Metabolit im Urin ist ein Konjugat von 4-Hydroxy-2,6-dimethylanilin, was einer Menge von 70 - 80 % der über den Urin ausgeschiedenen Dosis entspricht.

Die für Lidocain typische Eliminationshalbwertszeit nach intravenöser Bolusinjektion beträgt 1,5 bis 2 Stunden bei Erwachsenen.

Faktoren wie Azidose und die Verwendung von Substanzen, die das ZNS stimulieren oder unterdrücken, beeinflussen die ZNS-Spiegel von Lidocain in Form von offenkundigen systemischen Effekten. Nebenwirkungen treten in zunehmendem Maße mit steigenden venösen Plasmaspiegeln von >6 µg/ml auf.

Kinetik spezieller Patientengruppen

Leber- Nieren- und Herzinsuffizienz

Aufgrund der raschen Metabolisierung von Lidocain in der Leber kann jede Bedingung, die die Leberfunktion beeinflusst, die Lidocainkinetik verändern. Die Halbwertszeit kann bei Patienten mit beeinträchtigter Leberfunktion zwei- oder mehrfach verlängert sein, z.B. bei chronisch alkoholgeschädigter Leber auf 4,5 - 6 h. Die Eliminationshalbwertszeit kann bei schwerer Herzinsuffizienz auf 4 - 10 (-12) h verlängert sein. Eine beeinträchtigte Nierenfunktion beeinflusst die Lidocainkinetik nicht, kann jedoch die Akkumulation von Metaboliten erhöhen.

5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Chronische Toxizität

In Tierexperimenten wurden nach Gabe hoher Dosen von Lidocain toxische Effekte auf das Zentralnervensystem und das kardiovaskuläre System beobachtet. Reproduktions-Toxizitätsstudien zeigten keine durch das Arzneimittel bedingten Nebenwirkungen, ebenso ergaben weder in vitro noch in vivo-Mutagenitätstests mit Lidocain Hinweise auf mutagenes Potential. Aufgrund des Anwendungsgebietes und der empfohlenen Anwendungsdauer für dieses Produkt wurden keinen Studien zur Erforschung des krebserregenden Potentials durchgeführt.

Mutagenes und tumorerzeugendes Potential

Genotoxizitätsuntersuchungen mit Lidocain ergaben keine Hinweise auf ein mutagenes Potenzial. Der Metabolit, 2,6-Xylidin, hat in Genotoxizitätstests schwache Anzeichen von Aktivität gezeigt. In präklinischen Toxizitätsstudien zur chronischen Exposition hat sich der Metabolit 2,6-Xylidin als möglicherweise kanzerogen erwiesen. Risikobewertungen, die die maximale Exposition beim Menschen bei intermittierender Anwendung von Lidocain im Vergleich zur Exposition in präklinischen Studien vergleichen, weisen auf einen weiten Sicherheitsbereich in der klinischen Anwendung hin.

6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Saccharin, Ethanol, Bananenaroma, Macrogol, Levomenthol und gereinigtes Wasser.

6.2 Inkompatibilitäten

Nicht zutreffend.

6.3 Dauer der Haltbarkeit

3 Jahre

Nach dem Öffnen innerhalb von 3 Monaten aufbrauchen.

6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Nicht über 25°C lagern.

Bei der Lagerung unterhalb 8°C kann ein Niederschlag auftreten. Dieser löst sich jedoch bei Erwärmung auf Raumtemperatur wieder auf.

Beim Aufbewahren ist ein Lichtschutz erforderlich. Daher in der Originalverpackung aufbewahren, um den Inhalt vor Licht zu schützen.

6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

Glasflasche (farbloses Borosilikatglas Ph.Eur. Type 1) mit Sprühpumpe (Polypropylen) zu 50 ml. Die Packung enthält eine Plastik-Sprühkanüle zum einmaligen Gebrauch, die ca. 120 mm lang ist. Zusätzliche kurze Sprühkanülen können separat erworben werden.

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung und sonstige Hinweise zur Handhabung

Die Sprühkanüle ist bereits gebogen und darf vor der Verwendung nicht weiter verändert werden. Die Sprühkanüle darf nicht gekürzt werden, die Funktion des Sprays wird dadurch gestört. Die Sprühkanüle darf nicht wiederverwendet werden und sollte sofort nach Gebrauch entsorgt werden.

Lange sterile Kunststoffsprühkanülen zur einmaligen Anwendung sind separat verfügbar. Nicht verwendetes Arzneimittel oder Abfallmaterial ist entsprechend den nationalen Anforderungen zu entsorgen.

7. INHABER DER ZULASSUNG

Aspen Pharma Trading Limited
3016 Lake Drive,
Citywest Business Campus,
Dublin 24,
Irland

8. ZULASSUNGSNUMMER

Z.Nr.: 12.979

9. DATUM DER ERTEILUNG DER ZULASSUNG/VERLÄNGERUNG DER ZULASSUNG

Datum der Erteilung der Zulassung: 20. September 1965

Datum der letzten Verlängerung der Zulassung: 18. September 2006

10. STAND DER INFORMATION

August 2022

REZEPTPFLICHT/APOTHEKENPFLICHT

Rezept- und apothekenpflichtig.