

ZUSAMMENFASSUNG DER MERKMALE DES ARZNEIMITTELS

1. BEZEICHNUNG DES ARZNEIMITTELS

Cathejell Lidocain 2 % / Chlorhexidin 0,05 % - Gel

2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

1 g Gel enthält 20 mg Lidocainhydrochlorid und 0,5 mg Chlorhexidindihydrochlorid.

Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile, siehe Abschnitt 6.1.

3. DARREICHUNGSFORM

Wasserlösliches und klares, farbloses anästhesierendes Gel.

Sterile Einmalabgabeform.

4. KLINISCHE ANGABEN

4.1. Anwendungsgebiete

Zur Schleimhutanästhesie und als Gleitmittel für

- Katheterisierungen, Sondierungen und Endoskopien
- Trachealintubationen.

Cathejell wird bei Erwachsenen, Jugendlichen und Kindern (2 bis 11 Jahre) angewendet.

4.2. Dosierung und Art der Anwendung

Die Anwendung erfolgt ausschließlich durch den Arzt oder medizinisch geschultes Pflegepersonal.

Die Dosis sollte ein erfahrener Arzt individuell anpassen.

Die folgenden Dosierungsangaben sind Richtlinien. Bei der Berechnung der geeigneten Dosis sind die Erfahrung des Arztes und das Wissen um den physischen Zustand eines Patienten von Bedeutung.

Das Ausmaß der Resorption ist im Bronchialbaum besonders hoch.

Anwendung in der Harnröhre vor dem Einführen eines Katheters, Endoskops oder anderer medizinischer Instrumente

Die Faltenbalspritzen (nachfolgend als „Spritzen“ bezeichnet) enthalten 12,5 g bzw. 8,5 g Gel, wovon beim Instillieren ca. 10 g bzw. 6 g in die Harnröhre eingebracht werden.

Die zu instillierende Gelmenge richtet sich nach den anatomischen Gegebenheiten der Harnröhre.

Dosierung

Erwachsene Männer

Im Allgemeinen sind beim Mann die 12,5 g Spritzen nötig. Der Inhalt einer Spritze reicht aus, um die Urethra zu füllen; mehr als eine Spritze sollte nicht instilliert werden. Die Wirkung tritt nach 5 bis 10 Minuten ein.

Frauen, Kinder (2 bis 11 Jahre) und Jugendliche (unter 18 Jahren)

Die Wirkung von Cathejell ist nicht ausreichend nachgewiesen, die Notwendigkeit der Anwendung sollte daher vom Arzt beurteilt werden. Für diese Patientengruppen können keine speziellen Dosisempfehlungen gegeben werden.

Bei Kindern kann die systemische Resorption von Lidocain erhöht sein, dementsprechend ist Vorsicht geboten. Die Maximaldosis von 2,9 mg/kg KG Lidocainhydrochlorid sollte bei Kindern (2 bis 11 Jahre) nicht überschritten werden.

Kinder unter 2 Jahren

Bei Kindern unter 2 Jahren darf Cathejell nicht angewendet werden (siehe Abschnitt 4.3.).

Dosierungsempfehlungen für Risikopatienten

Die Dosierung sollte bei älteren, geschwächten oder akut erkrankten Patienten, sowie Patienten mit eingeschränkter Leberfunktion oder schwerer Nierendysfunktion entsprechend angepasst werden (siehe Abschnitte 4.4. und 5.2.).

Die Maximaldosis muss in mg Lidocainhydrochlorid/kg Körpergewicht errechnet werden (2,9 mg Lidocainhydrochlorid/kg KG).

Art der Anwendung

Zur Anwendung in der Harnröhre.

1. Reinigung und Desinfektion der äußeren Urethramündung.
2. Abziehen des Papiers von der Klarsichthülle bis zur Einschnürung des Blisters.
3. Abknicken der Spitze, eventuell noch in der Blisterpackung.
4. Spitze vollständig entfernen, damit ein versehentliches Einbringen in die Harnröhre ausgeschlossen ist.
5. Einen Tropfen Gel zum leichteren Einführen des Applikationskonus herausdrücken.
6. Langsames Instillieren durch mäßigen Druck auf die Spritze.

Zum einmaligen Gebrauch bestimmt, Gelreste unvollständig entleerter Spritzen verwerfen.

Anwendung in der Anästhesie allgemein und bei Trachealintubation

Dosierung

Erwachsene und Jugendliche (ab 12 Jahren)

Ca. 5 ml über das untere Drittel des Tubus gleichmäßig verteilen. Um Austrocknung zu vermeiden, wird das Gel erst unmittelbar vor der Anwendung auf das Instrument aufgebracht. Gel nicht in das Lumen des Tubus bringen. Die Maximaldosis beträgt 16 g Cathejell für Erwachsene mit normalem Körpergewicht.

Kinder (2 bis 11 Jahre)

Bei Kindern kann die systemische Resorption von Lidocain erhöht sein, dementsprechend ist Vorsicht geboten. Die Maximaldosis von 2,9 mg/kg KG Lidocainhydrochlorid sollte bei Kindern (2 bis 11 Jahre) nicht überschritten werden.

Kinder unter 2 Jahre

Bei Kindern unter 2 Jahren darf Cathejell nicht angewendet werden (siehe Abschnitt 4.3.).

Dosierungsempfehlungen für Risikopatienten

Die Dosierung sollte älteren, geschwächten oder akut erkrankten Patienten, sowie bei Patienten mit eingeschränkter Leberfunktion oder schwerer Nierendysfunktion entsprechend angepasst werden (siehe Abschnitte 4.4. und 5.2.).

Die Maximaldosis muss in mg Lidocainhydrochlorid/kg Körpergewicht errechnet werden (2,9 mg Lidocainhydrochlorid/kg KG).

Art der Anwendung

Zum Auftragen auf Sonden, Endoskope und Trachealtuben.

Zum einmaligen Gebrauch bestimmt, Gelreste unvollständig entleerter Spritzen verwerfen.

4.3. Gegenanzeigen

- Überempfindlichkeit gegen die Wirkstoffe oder einen der in Abschnitt 6.1. genannten sonstigen Bestandteile.
- Überempfindlichkeit gegen andere Lokalanästhetika vom Amid-Typ.
- Kinder unter 2 Jahren.
- Bulbocavernöser (urethro cavernöser) Reflux. Es handelt sich hierbei um eine Verletzung der dünnen Urethralschleimhaut, die zu einem Einschwemmen des Gleitmittels in den Schwellkörper und dort zur Resorption führen kann.
- Schwere Herzinsuffizienz, ausgeprägte Bradykardie, AV-Block, kardiogener oder hypovolämischer Schock.

4.4. Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

In Vollnarkose ist ein Gleitmittel ohne Lidocain vorzuziehen.

Cathejell sollte mit Vorsicht angewendet werden bei Patienten mit

- schwerer Beeinträchtigung der Leber- und Nierenfunktion (siehe auch Abschnitt 4.2.)
- kardialer oder respiratorischer Dysfunktion

Besondere Vorsicht ist geboten bei

- hoher Dosierung oder kurzen Intervallen zwischen den Dosen. Diese können zu hohen Plasmaspiegeln und schweren Nebenwirkungen führen. Das Ausmaß der Resorption durch die Schleimhäute ist unterschiedlich, 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 Krämpfe verbunden.
- älteren, geschwächten und akut erkrankten Patienten, sowie Patienten, die zu Krämpfen neigen (siehe auch Abschnitt 4.2.).

- Patienten mit Wunden, traumatisierten Schleimhäuten, ulzerierendem Gewebe bzw. Sepsis im Bereich der vorgesehenen Anwendungsstelle. Eine beschädigte Schleimhaut führt zu erhöhter systemischer Resorption.
- oropharyngealer Anwendung. Es kann dadurch zu einer Schluckbehinderung kommen und die Gefahr einer Aspiration erhöht werden. Taubheit der Zunge oder des Mundbereiches kann die Gefahr eines Bisstraumas erhöhen.
- Patienten, die mit Antiarrhythmika Klasse III (z.B. Amiodaron) behandelt werden; diese sind sorgfältig zu beobachten, es ist eine EKG-Überwachung zu erwägen, da die Wirkungen auf das Herz additiv sein können.

Cathejell ist wahrscheinlich porphyrinogen und sollte Patienten mit akuter Porphyrrie nur nach strenger Indikationsstellung verabreicht werden. Bei Patienten mit Porphyrrie sind entsprechende Vorsichtsmaßnahmen zu treffen.

Wenn mehr als die empfohlene Menge instilliert wird, eine erhebliche Menge Gel in die Harnblase eindringt, oder eine entzündete, ulzerierende Harnröhre vorliegt, kann dies generell - besonders aber bei Kindern und älteren Patienten - zu vermehrter Resorption von Lidocain und in der Folge zur Überdosierung mit zentralnervösen und kardiovaskulären Nebenwirkungen führen (siehe auch Abschnitt 4.9.).

Patienten, die an Myasthenia gravis leiden, sind auf Lokalanästhetika besonders empfindlich.

Cathejell darf nicht mit den Augen in Kontakt kommen.

4.5. Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Cathejell sollte nicht gleichzeitig mit Medikamenten angewendet werden, die Lidocainhydrochlorid oder andere Lokalanästhetika vom Amid-Typ enthalten, da dies zu einer nicht vorhersehbaren gegenseitigen Verstärkung der Wirkungen führen kann.

Aufgrund möglicher additiver Effekte auf das Herz sollte Lidocain mit Vorsicht angewendet werden bei Patienten, die gleichzeitig Antiarrhythmika wie Mexiletin und Tocainid, Betablocker (z.B. Propranolol) oder Calciumkanal-Antagonisten (z.B. Diltiazem, Verapamil) erhalten.

Propranolol, Diltiazem und Verapamil führen durch Abnahme der Lidocain-Clearance zu einer deutlichen Verlängerung der Eliminationshalbwertszeit. Arzneimittel, die die Lidocain-Clearance verringern, können zu potenziell toxischen Plasmakonzentrationen führen, wenn Lidocain über einen längeren Zeitraum wiederholt in hohen Dosen verabreicht wird. Bei einer kurzzeitigen Behandlung mit empfohlenen Dosen von Cathejell sollten solche Wechselwirkungen daher nicht von klinischer Bedeutung sein.

Spezifische Wechselwirkungsstudien mit Lidocain und Antiarrhythmika der Klasse III (z.B. Amiodaron) wurden nicht durchgeführt, es ist jedoch Vorsicht geboten (siehe auch Abschnitt 4.4.).

Vorsicht ist geboten bei gleichzeitiger Gabe des H₂-Antagonisten Cimetidin. Durch Abnahme der Leberdurchblutung und Hemmung mikrosomaler Enzyme können erhöhte Lidocain-Plasmaspiegel auftreten.

4.6. Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Schwangerschaft

Kontrollierte klinische Studien mit Schwangeren liegen nicht vor. 50 bis 60 % der maternalen Lidocain-Plasmakonzentration passieren die Placenta. Bei hoher systemischer Belastung kann es zu fetaler Depression kommen. In Tierstudien zeigten sich erst bei hohen Lidocain - Dosen nach

pränataler Exposition Nebenwirkungen bei Feten (siehe Abschnitt 5.3.). Das potenzielle Risiko für Menschen ist nicht bekannt.

Hinsichtlich Chlorhexidin in Cathejell besteht praktisch kein Risiko, da nur sehr geringe Mengen in den maternalen Kreislauf resorbiert werden.

Cathejell sollte in der Schwangerschaft nur nach sorgfältiger Nutzen-Risiko-Abwägung durch den Arzt und nach Festlegung der individuellen Dosis eingesetzt werden. Wiederholte Anwendung während der Schwangerschaft wird nicht empfohlen.

Stillzeit

Lidocain tritt nur in geringen Mengen in die Muttermilch über. Für das Kind bestehen bei ordnungsgemäßer Anwendung von Cathejell (siehe Abschnitt 4.2.) in der Stillzeit praktisch keine Bedenken zur Sicherheit.

Es gibt keine Daten zur Exkretion von Chlorhexidin in die Muttermilch. Aufgrund der sehr geringen systemischen Resorption von Chlorhexidin nach intraurethraler Instillation ist die zu erwartende Menge in der Muttermilch klinisch vernachlässigbar.

Während der Stillzeit sollte Cathejell nur angewendet werden, wenn der Bedarf und die individuelle Dosis festgestellt wurden. Zwischen der Instillierung von Cathejell und dem nachfolgenden Stillen sollte ein Zeitintervall von 12 Stunden liegen. Die wiederholte Anwendung während der Stillzeit ist nicht zu empfehlen.

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

Cathejell hat keinen oder einen zu vernachlässigenden Einfluss auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen. Ein Einfluss kann jedoch für den Fall erhöhter individueller Empfindlichkeit nicht vollständig ausgeschlossen werden.

4.8. Nebenwirkungen

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

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Häufigkeitsangaben zu Grunde gelegt:

Sehr häufig	(≥ 1 von 10)
Häufig	(≥ 1 von 100, < 1 von 10)
Gelegentlich	(≥ 1 von 1000, < 1 von 100)
Selten	(≥ 1 von 10000, < 1 von 1000)
Sehr selten	(< 1 von 10000)
Nicht bekannt	(Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar).

Nebenwirkungen treten nach der Anwendung von Cathejell selten auf, sofern das Produkt den Dosierungs- und Anwendungsempfehlungen entsprechend und unter Beachtung der notwendigen Vorsichtsmaßnahmen eingesetzt wird.

In seltenen Fällen kommt es zu lokalen und/oder systemischen Überempfindlichkeitsreaktionen auf Lidocain und/oder Chlorhexidin.

Systemische Nebenwirkungen

Systemische Nebenwirkungen können durch hohe Plasmaspiegel, durch schnelle Resorption oder durch Überdosierung sowie durch Überempfindlichkeit, Idiosynkrasie oder herabgesetzte Toleranz verursacht werden, wobei folgende Symptome auftreten können:

ZNS: Nervosität, Schwindel, verschwommener Blick, Tremor. Diese Anzeichen müssen nicht auftreten. Bei manchen Patienten äußert sich die Intoxikation durch Schläfrigkeit, Bewusstlosigkeit, Atemstillstand. Kardiovaskulär: Hypotonie, Bradykardie, Asystolie. Über die Behandlung der Intoxikation siehe Abschnitt 4.9.

Allgemeine Erkrankungen und Beschwerden am Verabreichungsort

Als lokale Reaktion kann Heiserkeit bei Anwendung als Gleitmittel für den Endotrachealtubus auftreten.

Bei urethraler Anwendung sind nur niedrige Lidocain-Blutspiegel zu erwarten; zu anderen systemischen Nebenwirkungen nach Instillation von Cathejell in die Harnröhre (siehe Abschnitte 4.4. und 4.9.) kommt es daher erwartungsgemäß nicht.

Erkrankungen des Immunsystems

Allergische Reaktionen (in den seltensten Fällen anaphylaktischer Schock) auf Lokalanästhetika vom Amidtyp sind selten. Bronchospasmus, Atemnotsyndrom, Hautläsionen, Urticaria und Ödeme können als Reaktion auf Überempfindlichkeit gegenüber Lidocain oder Chlorhexidin auftreten und sind konventionell zu behandeln.

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:

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

Bei fachgerechter Anwendung von Cathejell (siehe Abschnitte 4.2. und 4.4.) werden praktisch keine toxischen Plasmakonzentrationen $> 5 \mu\text{g/ml}$ erreicht. Allerdings kann die gleichzeitige Gabe anderer Lokalanästhetika zu additiven Effekten und in der Folge zur Überdosierung mit systemischen Toxizitätsreaktionen führen.

Symptome einer Intoxikation

Sollten Symptome einer systemischen Intoxikation wider Erwarten auftreten, so gleichen diese naturgemäß der Symptomatik, die nach anderen Applikationsformen von Lokalanästhetika (z.B. Infiltrationsanästhesie und Nervenblock) auftreten kann.

Die Intoxikation mit Lidocain verläuft in 2 Phasen:

- Stimulation: In niederen toxischen Konzentrationen wirkt Lidocain als zentrales Nervenstimulans, es kommt zu zentralnervöser Erregung mit Unruhe, Vertigo, Tremor und kardiovaskulärer Stimulation mit beschleunigter Herzfrequenz, erhöhtem Blutdruck und Rötung der Haut.

- Depression: In hohen toxischen Bereichen kommt es zur Depression im Bereich des ZNS und des kardiovaskulären Systems (Somnolenz, Sedierung, Blässe, Koma).

ZNS-Toxizitätsreaktionen gehen gewöhnlich denen des Herz-Kreislauf-Systems voraus, da erstere bei niedrigeren Plasma-Konzentrationen auftreten.

Erste Anzeichen einer Überdosierung sind zunächst exzitatorisch, die Patienten werden unruhig, klagen über Schwindel, akustische und visuelle Störungen, Kribbeln an der Zunge und im Lippenbereich, Nystagmus. Subkonvulsive Plasmaspiegel von Lidocain führen oft auch zu Schläfrigkeit und Sedierung. Schüttelfrost und Muskelzuckungen sind Vorboten eines drohenden generalisierten Krampfanfalles. Bei fortschreitender ZNS - Intoxikation kommt es zu einer zunehmenden Funktionsstörung des Hirnstammes mit den Symptomen Atemdepression bis hin zum Koma.

Blutdruckabfall und Bradykardie sind die ersten Anzeichen toxischer Effekte von Lidocain auf das kardiovaskuläre System, schließlich Myokarddepression und Anstieg der ventrikulären Aktivierungszeit. Die kardiovaskulären Effekte treten normalerweise erst bei sehr hohen Plasmakonzentrationen an Lidocain auf und sind klinisch von relativ untergeordneter Bedeutung.

Notfallmaßnahmen bei Überdosierung

Die Therapie einer Intoxikation im Bereich des ZNS (Konvulsionen, ZNS-Depression) oder des kardiovaskulären Systems erfolgt symptomatisch, z.B. durch Verabreichung von Antikonvulsiva, und/oder unterstützende kardiopulmonale Notfallmaßnahmen:

- Sofortige Unterbrechung der Zufuhr von Lidocain
- Freihalten der Atemwege
- Zufuhr von Sauerstoff bis sich alle Vitalfunktionen normalisiert haben
- Kontrolle von Blutdruck, Puls und Pupillenweiten.

Mögliche weitere Gegenmaßnahmen

Bei akut bedrohlichem Blutdruckabfall Hochlagerung der Beine und langsame i.v.-Injektion eines Beta - Sympathomimetikums (z.B. 10 bis 20 Tropfen pro Minute einer Lösung von 1 mg Isoprenalin in 200 ml Glukoselösung 5 %) und zusätzliche Volumenssubstitution.

Bei erhöhtem Vagotonus (Bradykardie) wird 0,5 bis 1,0 mg i.v. Atropin verabreicht.

Konvulsionen, die länger als 30 Sekunden dauern, werden mit einer Verabreichung eines krampflösenden Mittels (Thiopental - Natrium 1 bis 3 mg/kg i.v. oder Diazepam 0,1 mg/kg KG i.v.) behandelt.

Anhaltende Krämpfe können durch Injektion eines Muskelrelaxans (z.B. Succinylcholin (Suxamethonium) 1 mg/kg KG) kontrolliert werden.

5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

5.1. Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Lokalanästhetika, Lidocain, Kombinationen

ATC-Code: N01BB52

Wirkmechanismus

Cathejell ist ein steriles und antiseptisches Gel mit lokal anästhesierender Wirkung. Durch lokale Oberflächenanästhesie bewirkt Cathejell eine Schleimhutanästhesie und dadurch eine rasche, symptomatische Schmerzlinderung. Die Wirkung tritt bereits 5 bis 10 Minuten nach der Applikation ein und hält 20 bis 30 Minuten an. Zusätzlich zur Schmerzlinderung soll Cathejell Harnwegsinfektionen nach Katheterisierung weitgehend verhindern.

Pharmakodynamische Wirkungen

Lidocain ist ein medizinisch bewährtes Lokalanästhetikum vom Säureamid-Typ. Lidocain hemmt reversibel und örtlich begrenzt das Leitungsvermögen der sensiblen Nervenfasern. Es werden die Empfindungen in der Reihenfolge Kälte/Wärme, Berührung und Druck herabgesetzt. Der Wirkungseintritt bei Oberflächenanästhesie beträgt im Allgemeinen ca. 3 bis 5 min. Im entzündeten Gewebe ist die Wirkung aufgrund des dort sauren pH-Wertes herabgesetzt. Neben der Verwendung als Anästhetikum, wirkt Lidocain zudem auch antiarrhythmisch. Im Gegensatz zu den meisten anderen Lokalanästhetika weist Lidocain keine gefäßerweiternde Wirkung auf.

Chlorhexidin ist antimikrobiell wirksam gegen viele Gram-positive und Gram-negative Bakterien, sowie gegen eine Reihe von Pilzen und Viren. In der vorliegenden Konzentration dient es als Prophylaktikum gegen iatrogene Infektionen im lokalen Bereich der Anwendung.

5.2. Pharmakokinetische Eigenschaften

Absorption

Lidocain wird über die Schleimhaut rasch in den Blutkreislauf resorbiert. Die Absorptionsmenge nach lokaler Applikation auf Schleimhäuten ist abhängig von der Konzentration und Gesamtdosis, die verabreicht wurden sowie vom spezifischen Applikationsort und der Dauer der Anwendung. Lokalanästhetika werden im Allgemeinen nach intratrachealer und bronchialer Anwendung am raschesten resorbiert, was zu rasch steigenden oder sehr hohen Plasmakonzentrationen mit erhöhtem Risiko zu toxischen Symptomen führen kann.

Aus dem Gastrointestinaltrakt wird Lidocain rasch resorbiert, davon gelangt allerdings wegen Verstoffwechslung in der Leber („first-pass-effect“) nur wenig intakter Wirkstoff in den Kreislauf.

45 bis 60 Minuten nach intraurethraler Instillation von 10 bis 40 ml Lidocain Gel 2 % (200 bis 800 mg Lidocain) werden maximale Plasmakonzentrationen von 0,06 bis 0,2 µg/ml Lidocain erreicht. Diese Werte sind 7,5 bis 27,5mal niedriger als die für die antiarrhythmische Wirkung therapeutisch relevanten Plasmakonzentrationen von 1,5 bis 5,5 µg/ml, und liegen um den Faktor 30 unter den toxischen Plasmakonzentrationen (5 bis 8 µg/ml).

Es ist zu beachten, dass starke Entzündungen der Harnröhrenschleimhaut und Oberflächenvergrößerung infolge urethraler Dilatation zu vermehrter Resorption von Lidocain führen können.

Chlorhexidin wird nach lokaler Anwendung in nur sehr geringen Mengen absorbiert.

Verteilung

Lidocain weist ein Verteilungsvolumen von 1,3 bis 1,6 l/kg auf, es wird rasch in alle Gewebe verteilt, vor allem in reich durchblutete Organe, wie Lunge, Nieren und die Skelettmuskulatur.

Lidocain bindet zu etwa 65 % an Plasmaproteine und saure alpha-1-Glycoproteine (AAG). Da die AAG im Alter, sowie nach Traumata, Operationen, bei Krebserkrankung und chronischer Entzündung vermehrt auftreten, bzw. bei Nieren- und Lebererkrankungen verringert sind, kann die Proteinbindung in diesen Fällen entsprechend erhöht bzw. erniedrigt sein. Lidocain passiert die Blut-Hirn-Schranke.

Nach intravenöser Einzelgabe nimmt die Plasmakonzentration an Lidocain biexponentiell mit Halbwertszeiten von ca. 8 Minuten und von 1,6 Stunden ab.

Metabolisierung, Elimination

Lidocain weist einen ausgeprägten First-pass Metabolismus auf. Ca. 90 % einer Lidocain-Dosis werden rasch desalkyliert und in der Leber zu Monoethylglyncinxyloid (MEGX) oder Glyncinxyloid (GX) metabolisiert. MEGX und GX sind als Na⁺ Kanal-Blocker weniger aktiv als Lidocain. Weitere Metabolite sind 2,6-Xylidin und 4-Hydroxy-2,6-Xylidin.

Die terminale Eliminationshalbwertszeit (HWZ) von 1,8 Stunden repräsentiert einen primär hepatischen Metabolismus; sie kann im Alter auf bis zu 2,3 Stunden verlängert sein. Die HWZ der aktiven Metabolite liegt bei 0,9 Stunden.

Die totale Plasma Clearance von 0,95 l/min kann bei Patienten mit Herzinsuffizienz oder Lebererkrankung herabgesetzt sein, bei Niereninsuffizienz kann es zur Kumulierung von Metaboliten kommen.

Weniger als 5 % Lidocain werden unverändert mit dem Harn ausgeschieden.

Kinetik bei Leber-, Nieren- und Herzinsuffizienz

Aufgrund der raschen Metabolisierung von Lidocain in der Leber kann die Halbwertszeit bei Patienten mit beeinträchtigter Leberfunktion 2- bis mehrfach verlängert sein, z.B. bei chronisch alkoholgeschädigter Leber auf 4,5 bis 6 h. Bei schwerer Herzinsuffizienz kann die Eliminationshalbwertszeit auf 4 bis 10 h verlängert sein. Niereninsuffizienz kann zur Akkumulierung von Metaboliten führen.

5.3. Präklinische Daten zur Sicherheit

Toxizität nach wiederholten Gaben

Bei Ratten wurden zentralnervöse Störungen beobachtet nach Mehrfachgaben von 15 mg/kg KG Lidocain i.v., 30 mg/kg s.c., bei Hunden nach 10 mg/kg i.v. und nach 30 mg/kg s.c.

Mutagenität, Kanzerogenität

Genotoxizitätstests mit Lidocain waren negativ. Tests mit 2,6-Xylidin weisen jedoch in vitro auf ein genotoxisches Potential dieses Metaboliten von Lidocain hin.

In einer Kanzerogenitätsstudie an Ratten mit in utero und postnataler lebenslanger Einwirkung von 2,6-Xylidin wurden Tumore im Bereich der Nasenhöhlen, Subkutis und Leber beobachtet.

Die klinische Bedeutung der beobachteten tumorigenen Wirkung im Hinblick auf die intermittierende Anwendung als Lokalanästhetikum ist unbekannt, allerdings wird von einer häufigen Anwendung von hochdosiertem Lidocain abgeraten.

Reproduktionstoxikologie

In Teratogenitätsstudien an Ratten und Kaninchen wurde nach Behandlung über den Zeitraum der Organogenese keine teratogene Wirkung festgestellt. Embryotoxische Effekte bei Kaninchen traten erst in Konzentrationen auf, die für das Muttertier bereits toxisch waren. Die Behandlung von Ratten während der späten Trächtigkeit und Laktation mit Mengen, die für die Muttertiere toxisch waren, führte zu einer veränderten Tragzeit und Abnahme der Überlebensfähigkeit der Jungtiere. Nach pränataler Einwirkung von Lidocain ergab sich kein Hinweis auf Entwicklungsstörungen der Nachkommen. Die Einwirkung hoher Konzentrationen auf Feten schädigte die Uterusdurchblutung

und bewirkte Konvulsionen beim Fetus. Mögliche Verhaltensstörungen nach pränataler Exposition sind in tiereperimentellen Untersuchungen nur unzureichend dokumentiert.

Systemische Daten bei Ratten und Kaninchen liegen nicht vor, so dass sich diesbezüglich kein Vergleich zum Menschen herstellen lässt. Das potenzielle Risiko für Menschen ist nicht bekannt.

Für Chlorhexidin in Cathejell wurde kein toxikologisches Risiko festgestellt.

6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

6.1. Liste der sonstigen Bestandteile

Hydroxyethylcellulose, Glycerol, Natriumlaktatlösung, Wasser für Injektionszwecke, Natriumhydroxidlösung und Salzsäurelösung zur pH-Wert-Einstellung.

6.2. Inkompatibilitäten

Nicht zutreffend.

6.3. Dauer der Haltbarkeit

3 Jahre

6.4. Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

In der Originalverpackung (Blister im Umkarton) aufbewahren, um den Inhalt vor Licht zu schützen.

Zum einmaligen Gebrauch bestimmt, Gelreste unvollständig entleerter Spritzen verwerfen.

6.5. Art und Inhalt des Behältnisses

Das Gel ist abgefüllt in PP-Faltenbalgspritzen (Ziehharmonikaspritzen) mit PP-Ansatzstück und Abbrechspitze. Sterile Einmalabgabeform.

Die einzelnen Spritzen sind in Blisterpackungen abgepackt und dampfsterilisiert.

Das Blistermaterial besteht aus PP-Tiefziehfolie, die mit medizinischem Papier verschweißt ist.

Die Blisterpackungen werden in Umkartons zu 5 oder 25 Spritzen abgepackt.

1, 5 und 25 Faltenbalgspritzen mit 12,5 g Gel in Umkarton

5 und 25 Faltenbalgspritzen mit 8,5 g Gel in Umkarton.

6.6. Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Nicht verwendetes Arzneimittel oder Abfallmaterial ist entsprechend den nationalen Anforderungen zu beseitigen.

7. INHABER DER ZULASSUNG

Pharmazeutische Fabrik Montavit Ges.m.b.H.

A-6067 Absam/Tirol

Tel.-Nr.: +43 5223 57926 0

Fax-Nr.: +43 5223 52294

Email: pharma@montavit.com

8. ZULASSUNGSNUMMER

Z.Nr.: 1-19198

9. DATUM DER ERTEILUNG DER ZULASSUNG/VERLÄNGERUNG DER ZULASSUNG

Datum der Erteilung der Zulassung: 12. Dezember 1990

Datum der letzten Verlängerung der Zulassung: 09. Februar 2012

10. STAND DER INFORMATION

12.2018

11. REZEPTPFLICHT/APOTHEKENPFLICHT

Rezeptpflichtig, apothekenpflichtig.