PRODUKTRESUMÉ

1 LÄKEMEDLETS NAMN

Xylocain 2% gel med konserveringsmedel
Xylocain 2% gel utan konserveringsmedel

2 KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

1 g gel innehåller:
Lidokainhydroklorid 20 mg

Beträffande hjälpämnen se 6.1.

3 LÄKEMEDELSFORM

Gel

Klar till nästan klar, svagt färgad gel.

4 KLINISKA UPPGIFTER

4.1 Terapeutiska indikationer

Ytanestesi av uretra vid kateterisering, sondering samt andra endouretrala ingrepp. Ytanestesi vid ano-, rekto- och sigmoidoskopi samt vid rektal palpation. Smärtsamma cystiter.

Xylocain gel är avsett för vuxna och barn i alla åldrar.

4.2 Dosering och administreringssätt

Följande dosering ska ses som en rekommendation. Den enskilda patientens ålder, vikt och hälsotillstånd får avgöra läkarens val av dos.

För effektiv gelanestesi av uretra krävs att hela uretra fylls ända upp i blåshalsen. 20 ml är normal åtgång för manlig uretra (vid särskilt stora krav på anestesi rekommenderas 30–40 ml som instilleras i 3–4 portioner). För kvinnlig uretra rekommenderas att 5–10 ml instilleras före ingreppet.

För effektiv gelanestesi vid anorektal användning instilleras 5–10 ml genom anus. Efter det att gelen instillerats, vänta några minuter för fullgod anestesi.

1 ml motsvarar ungefär 1 g.

<u>Pediatrisk population</u>
Vid behandling av barn under 12 år bör dosen inte överstiga 6 mg/kg.
Barn över 12 år bör ges doser i proportion till ålder och vikt.
Mer än fyra doser ska inte ges under ett dygn.

4.3 Kontraindikationer

Överkänslighet för lokalanestetika av amidtyp eller för något av gelens innehållsämnen.

Xylocain gel med konserveringsmedel ska inte användas vid överkänslighet för metyl- och/eller propylparahydroxibensoat (metyl-/propylparaben), eller för metaboliten paraaminobensoesyra (PABA).

Xylocain gel med konserveringsmedel undvikas till patienter som är allergiska mot ester-lokalanestetika som även de har PABA som metabolit.

4.4 Varningar och försiktighetsmått

Försiktighet bör iakttas vid behandling av följande patientkategorier:

- Äldre, samt patienter med generellt nedsatt allmäntillstånd
- Patienter med AV-block II eller III, eftersom lokalanestetika kan försämra myokardiets överledningsförmåga
- Patienter med allvarlig leversjukdom eller kraftigt sänkt njurfunktion
- Patienter som behandlas med antiarytmika klass III (t ex amiodaron) bör stå under noggrann övervakning och EKG-monitorering övervägas, eftersom hjärteffekterna av lidokain och klass III antiarytmika kan vara additiva. (Se även 4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner)

För stora doser lidokain eller för korta intervall mellan doseringstillfällena kan leda till höga plasmakoncentrationer och akuta centralnervösa och kardiovaskulära toxiska effekter (se 4.9 Överdosering). Patienterna bör uppmanas att noga följa de rekommenderade doserna.

Xylocain gel bör användas med försiktighet hos patienter med skadad slemhinna och/eller sepsis i det tänkta applikationsområdet.

Xylocain gel är sannolikt porfyrogen och bör endast förskrivas till patienter med akut porfyri om mycket starka skäl föreligger. Lämpliga försiktighetsåtgärder bör iakttas för alla patienter med porfyri.

4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Lidokain ska användas med försiktighet tillsammans med andra lokalanestetika eller klass IB antiarytmika, då de toxiska effekterna är additiva.
Specifika interaktionsstudier med lokalanestetika och antiarytmika klass III (t ex amiodaron) har inte utförts men försiktighet rekommenderas. (Se även 4.4 Varningar och försiktighet).

Läkemedel som hämmar metabolismen av lidokain (t ex cimetidin och betablockerare) kan orsaka potentiellt toxiska plasmakoncentrationer när lidokain ges upprepat i höga doser över en lång tidsperiod. Sådana interaktioner är inte av klinisk relevans efter korttidsbehandling med lidokain i rekommenderade doser.

4.6 Graviditet och amning

Graviditet
Adekvata data från behandling av gravida kvinnor med lidokain saknas.

Lidokain passerar placenta. Det är rimligt att förmoda att lidokain har använts hos ett stort antal gravida kvinnor och kvinnor i fertil ålder. Det finns inga hållpunkter för att lidokain kan orsaka störningar i reproduktionsprocessen såsom ökad missbildningsfrekvens eller direkt eller indirekt fosterpåverkan. Riskerna för människa är dock inte fullständigt utredda.

Djurstudier är ofullständiga vad gäller effekter på graviditet, embryo/fosterutveckling, förlossning och utveckling efter födseln (se 5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter).

Vid tillfälligt bruk av Xylocain gel under graviditet bedöms nyttan uppväga eventuella risker.

Amning
Lidokain utsöndras i bröstmjölk i små mängder. Påverkan på barnet är osannolik vid användning av rekommenderade doser Xylocain gel. Amning kan därför fortsätta vid behandling med Xylocain gel.

4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Xylocain gel har inga eller obetydliga effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner.

4.8 Biverkningar

Biverkningar i egentlig mening av lokalanestetika förekommer hos mindre än 1/1000 behandlade.

Immunsystemet:
Sällsynta (>1/10 000, <1/1000): Allergiska reaktioner, i allvarligaste fall anafylaktisk chock

Akut systemisk toxicitet
Lidokain kan ge akut toxiska effekter om höga systemiska nivåer nås på grund av snabb absorption eller överdosering. (se 4.9 Överdosering).

4.9 Överdosering

Toxicitet
P.o. administrering: Mindre än 50 mg tycks ej innebära risk för småbarn. 75 mg till 2-åring gav lindrig, 100 mg till 5 mån barn gav allvarlig, 300 + 300 mg inom 4 tim till 3½-åring gav allvarlig till mycket allvarlig, 400–500 mg till 2-åring samt 1 g under 12 tim till 1-åring gav mycket allvarlig intoxikation. 600 mg till vuxen gav lindrig, 2 g till vuxen gav måttlig intoxikation.
Parenteral administrering: 50 mg i.v. till 1 mån barn gav mycket allvarlig intoxikation. 200–400 mg infiltration till vuxen gav allvarlig, 500 mg till 80–åring och 1 g i.v. till vuxna gav mycket allvarlig intoxikation.
Topikal administrering: 8,6–17,2 mg/kg till småbarn gav vid applikation på brännskadad hud allvarlig intoxikation.

Symtom
Först CNS-excitation, senare CNS- depression. Vid stora doser kan snabbt debuterande kramper vara första symtomet. Oro, yrsel, synsstörningar, periorala parestesier, illamående. Därefter ataxi, hörselförändringar, eufori, förvirring, talsvårigheter, blekhet, svettning, tremor, kramper, koma, andningsstillestånd. Arytmier ffa bradyarytmier men vid stora doser även

ventrikeltakykardi, ventrikelflimmer, QRS-breddökning, AV-block. Hjärtsvikt, blodtrycksfall. (Methemoglobinemi beskriven i enstaka fall.)

Behandling
Kol vid peroral överdosering. (Kräkningsprovokation kan vara riskabel pga slemhinneanestesi och risk för kramper i tidigt skede. Om ventrikeltömning är befogat bör detta ske via sond och efter endotrakeal intubation.) Vid kramper diazepam. Syrgas. Vid behov intubation och kontrollerad andning (ev med hyperventilation). Vid bradykardi atropin. Vid cirkulationssvikt vätska i.v., dobutamin och ev. noradrenalin (initialt 0,05 µg/kg/min, ökas vid behov med 0,05 µg/kg/min var 10:e min.), i svårare fall med ledning av hemodynamisk monitorering. Efedrin kan också prövas. Vid cirkulationsstillestånd kan återupplivningsåtgärder under flera timmar vara befogat.

5 FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: Lokalanestetika
ATC-kod: N01BB02.

Xylocain gel är en beredningsform för ytanestesi. Den har hög ytanestetisk effekt och låg toxicitet. Effekten uppnås inom ca 5 minuter. Effektiv ytanestesi kvarstår under ca 20-30 minuter. Gelen består av en högviskös, klar lösning av lidokainklorid.
Xylocain gel är också ett glidmedel som minskar friktionen. Gelen hindrar inte sikten vid cystoskopering eller ano-, rekto- och sigmoidoskopi.

Lidokain blockerar impulsledningen i nerverna reversibelt, genom att förhindra transporten av natriumjoner in genom nervmembranet. Lokalanestetika kan också ge liknande effekter på excitatoriska membran i hjärna och hjärtmuskel.

5.2 Farmakokinetiska uppgifter

Absorberad mängd lidokain beror förutom på den applicerade dosen också på applikationsställe och exponeringstid.

Lidokain elimineras främst genom metabolism. Dealkylering till monoetylglycinxylidid (MEGX) medieras huvudsakligen av cytokrom P450 3A4. MEGX metaboliseras till 2,6-xylidin och glycinxylidid (GX). 2,6-xylidin omvandlas vidare av CYP 2A6 till 4-hydroxi-2,6-xylidin som utgör huvudmetabolit i urin (80%) och utsöndras som konjugat.
MEGX har en konvulsiv aktivitet motsvarande den för lidokain medan GX saknar konvulsiv aktivitet. MEGX förefaller förekomma i liknande plasmakoncentrationer som modersubstansen. Eliminationshalveringstiden av lidokain och MEGX efter en intravenös bolusdos är ca 1,5-2 respektive 2,5 timmar.

Plasmaproteinbindningen sker i huvudsak till alfa-1-syra glykoprotein. På grund av den snabba levermetabolismen är kinetiken känslig för all leverpåverkan. Halveringstiden kan mer än fördubblas hos patienter med nedsatt leverfunktion. Nedsatt njurfunktion påverkar ej kinetiken men kan öka ackumuleringen av metaboliter.

5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter

Reproduktionstoxikologi

I studier av embryo/fosterutveckling i råtta och kanin med dosering av lidokain under organogenesen sågs inga teratogena effekter. Embryotoxicitet sågs i kanin vid modertoxisk dos. Avkomman till råttor som behandlats med modertoxisk dos under sen dräktighet och laktation visade minskad postnatal överlevnad.

Genotoxicitet och karcinogenicitet
Genotoxicitetsstudier av lidokain var negativa. Karcinogeniciteten av lidokain har inte studerats. Lidokains metabolit 2,6-xylidin har genotoxisk potential in vitro. I en karcinogenicitetsstudie på råtta med exponering för 2,6-xylidin in utero, postnatalt och under hela livstiden sågs tumörer i näshålan, underhuden och levern. Den kliniska relevansen av tumörfynden vid kortvarig/intermittent användning av lidokain är okänd.

6 FARMACEUTISKA UPPGIFTER

6.1 Förteckning över hjälpämnen

Gel med konserveringsmedel: Hypromellos, metylparahydroxibensoat (E218), propylparahydroxibensoat, natriumhydroxid, saltsyra till pH 6.2-6.6, vatten för injektionsvätskor
Gel utan konserveringsmedel: Hypromellos, natriumhydroxid och/eller saltsyra till pH 6.2-6.8, renat vatten

6.2 Inkompatibiliteter

Ej relevant.

6.3 Hållbarhet

2 år

6.4 Särskilda förvaringsanvisningar

Förvaras vid högst 25°C. Får ej frysas.

6.5 Förpackningstyp och innehåll

Plastspruta (10 resp. 20 g): polypropen
Tub (30g): aluminium

Förpackningsstorlek:
Gel med konserveringsmedel: 1x30 g respektive 10x30 g
Gel utan konserveringsmedel: steril plastspruta för engångsbruk 10x10 g respektive 10x20 g

6.6 Anvisningar för användning och hantering samt destruktion

Plastsprutor innehåller inte något konserveringsmedel och är avsedda för engångsbruk.

Engångssprutor (sterilförpackade)
Riv av skyddspappret. Skruva fast sprutkolven medurs i den grå gummiproppen, fortsätt att skruva tills gummiproppen roterar. Vrid och dra samtidigt för att bryta förseglingen. Inspektera förseglingen för att säkerställa att den är avlägsnad i sin helhet. Inspektera sprutan för att säkerställa att inget plastfragment finns i gelen. Sprutan är nu klar att användas. Pressa ut luften, så att gel når sprutspetsen innan instillationen görs.

Tuber (sterilförpackade) för engångsbruk
Den medföljande sterila plastspetsen skruvas på tuben och införs i uretramynningen eller i anus. Pressa ut luften, så att gel når sprutspetsen innan instillationen görs.

Bruksanvisning finns tryckt på förpackningen.

7 INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

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

8 NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING

Gel med konserveringsmedel: 4114
Gel utan konserveringsmedel: 10445

9 DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE

Gel med konserveringsmedel: 1953-01-02 / 2008-08-29
Gel utan konserveringsmedel: 1986-08-29 / 2008-08-29

10 DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

2023-05-25