

PRODUKTRESUMÉ

1 LÄKEMEDLETS NAMN

Xylocain Viskös 20 mg/ml oral lösning

2 KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

1 ml innehåller lidokainhydroklorid 20 mg.

För fullständig förteckning över hjälpämnen, se avsnitt 6.1.

3 LÄKEMEDELFORM

Oral lösning

4 KLINISKA UPPGIFTER

4.1 Terapeutiska indikationer

Xylocain Viskös är avsett för topikal anestesi hos vuxna vid:

- nedläggning av sonder och katetrar i ventrikeln, t ex vid esofagoskopi
- irriterade eller inflammerade slemhinnor i mun och farynx, t ex faryngit och stomatit
- smärtsamma sjukdomar i övre magtarmkanalen t ex esofagit

4.2 Dosering och administreringsätt

Nedanstående doser är riktlinjer och doseringen ska anpassas till den enskilda patienten. Var uppmärksam på den totala dosen vid kombination med andra läkemedel som innehåller lidokain.

Vuxna:

Nedläggning av sonder och katetrar i ventrikeln: 10-15 ml (200-300 mg lidokain) nedsväljs.
Irriterade eller inflammerade slemhinnor i munnen: 5-15 ml (100-300 mg lidokain) sköljs runt i munnen. Lösningen spottas därefter ut. I tandläkarpraxis används 10 ml lösning (200 mg lidokain). Lösningen bör spottas ut när tillräcklig anestesi är uppnådd (efter cirka en minut).

Irriterade eller inflammerade slemhinnor i farynx: 5-10 ml (100-200 mg lidokain) gurglas varefter lösningen nedsväljs långsamt.

Smärtsamma sjukdomar i övre magtarmkanalen: 5-15 ml (100-300 mg lidokain) nedsväljs snabbt i en enda sväljning.

Dygnsdosen bör ej överskrida 1200 mg, vilket motsvarar totalt 60 ml.

Då Xylocain Viskös kombineras med andra lidokainprodukter bör den totala dosen av lidokain vid ett doseringstillfälle ej överskrida 400 mg.

4.3 Kontraindikationer

Överkänslighet mot det aktiva innehållsämnet, lokalanestetika av amidtyp eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt 6.1.

Överkänslighet för metyl- och/eller propylparahydroxibensoat (metyl-/propylparaben), eller för metaboliten paraaminobensoesyra (PABA).

Läkemedelsformuleringar av lidokain som innehåller parabener ska undvikas till patienter som är allergiska mot ester-lokalanestetika eller dess metabolit PABA.

4.4 Varningar och försiktighetsmått

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.

Användning av topikala lokalanestetika i svalget kan påverka sväljförmågan och därmed öka risken för aspiration av läkemedlet. Bedövningen kan också öka risken för bitskador. Före intag av mat och dryck ska bedövningen ha släppt helt.

Slemhinneskada i närheten av applikationsstället ökar absorptionen av lidokain. För stora doser eller för korta intervall mellan doserna kan ge höga plasmakoncentrationer med allvarlig intoxikation som följd.

Om man på grund av administrerings sättet eller den givna dosen riskerar uppnå höga plasmakoncentrationer bör försiktighet iaktas hos patienter med partiellt eller totalt hjärtblock. Även äldre personer och patienter med allvarlig leversjukdom, kraftigt sänkt njurfunktion eller med generellt nedsatt allmäntillstånd kräver speciell uppmärksamhet.

Xylocain Viskös oral lösning innehåller metylparahydroxibensoat (konserveringsmedel E218) och propylparahydroxibensoat (konserveringsmedel E216), vilka kan orsaka allergisk reaktion (eventuellt fördröjd).

Xylocain Viskös oral lösning är sannolikt porfyrogen och bör endast förskrivas till patienter med akut porfyri om mycket starka skäl föreligger. Lämpliga försiktighetsåtgärder bör iaktas för alla patienter med porfyri.

4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Lidokain ska användas med försiktighet tillsammans med dental injektionsanestesi, andra lokalanestetika eller läkemedel som är strukturellt besläktade med lokalanestetika av amidtyp, t ex klass IB antiarytmika, eftersom de toxiska effekterna är additiva.

Specifika interaktionsstudier med lidokain och antiarytmika klass III (t ex amiodaron) har inte utförts men försiktighet rekommenderas. (Se även 4.4).

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).

Vid tillfälligt bruk av Xylocain Viskös under graviditet bedöms nytan uppväga eventuella risker.

Amning

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

4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Vid behandling med Xylocain Viskös påverkas inte reaktionsförmågan.

4.8 Biverkningar

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

Sällsynt ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$)	<i>Immunsystemet:</i> Allergiska reaktioner, i allvarligaste fall anafylaktisk chock.
--	---

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till (se detaljer nedan).

Läkemedelsverket
Box 26
751 03 Uppsala
www.lakemedelsverket.se

4.9 Överdoser

Toxicitet vid peroral administrering:

Mindre än 50 mg tycks ej innebära någon risk för småbarn.

Enligt fallrapporter gav 75 mg till 2-åring lindrig förgiftning, 100 mg till ett 5 månaders barn gav allvarlig förgiftning och 300 mg två gånger inom 4 timmar till 3 ½-åring gav allvarlig till mycket allvarlig förgiftning. 400-500 mg till 2-åring samt 1 gram under 12 timmar till 1-åring gav mycket allvarlig förgiftning. 600 mg samt 2 gram till vuxen gav lindrig respektive måttlig förgiftning.

Symtom:

De toxiska reaktionerna är i huvudsak centralnervösa och kardiovaskulära.

CNS-toxicitet uppstår gradvis med symtom och reaktioner av stigande allvarlighetsgrad. Initialt uppträder bedövningskänsla i läppar och tunga, parestesier runt munnen, yrsel,

hörselstörningar och öronsusningar. Synstörningar och muskelryckningar är allvarligare symtom och kan föregå mer generaliserade kramper. Medvetslöshet och grand mal-kramper kan följa på detta och kvarstå från några sekunder till flera minuter. Syrebrist och hyperkapni uppstår snabbt under kramperna beroende på ökad muskelaktivitet och otillräcklig ventilation. I allvarliga fall kan även andningsstillestånd inträffa. Acidosis förstärker de toxiska effekterna av lokalanestetika.

Kardiovaskulära effekter som AV-block, ventrikeltakykardi, ventrikelflimmer, kraftigt blodtrycksfall, bradykardi, arytmier och kardiovaskulär kollaps ses endast om höga systemkoncentrationer av lokalanestetika föreligger. Dessa effekter föregås vanligen av tecken på CNS-toxicitet.

Återhämtningen är beroende av lokalanestetikans metabolism och distribution bort från centrala nervsystemet. Detta går snabbt såvida inte mycket stora mängder läkemedel intagits.

Behandling:

Om tecken på akut systemisk toxicitet uppträder ska administreringen av lokalanestetika omedelbart avbrytas. Behandling måste ges för att upprätthålla god ventilation, syretillförsel och cirkulation. Syrgas ges alltid och vid behov kontrollerad ventilation. Om kramperna inte upphör spontant inom 15-20 sekunder ges tiopentalnatrium 1-3 mg/kg iv för att möjliggöra adekvat ventilation eller diazepam 0,1 mg/kg iv (verkar något långsammare). Långvariga kramper äventyrar patientens andning och syresättning. Injektion av muskelrelaxantia (t ex suxameton 1 mg/kg) skapar gynnsammare förutsättningar för ventilering och syresättning av patienten men fordrar erfarenhet av trakeal intubation och kontrollerad ventilation. Vid blodtrycksfall/bradykardi ges en vasopressor (t ex efedrin 5-10 mg intravenöst som kan upprepas efter 2-3 minuter).

I händelse av cirkulationsstillestånd ska hjärtlungräddning utföras omedelbart. Viktigt är att upprätthålla god syretillförsel, andning och cirkulation samt att behandla acidosis.

Vid behandling av förgiftningssymtom ska barn ges doser i proportion till sin ålder och kroppsvikt.

Kol. (Kränkingsprovokation kan vara riskabel på grund av slemhinneanestesi och risk för kramper i tidigt skede. Om ventrikeltömning är befogat bör detta ske via sond och efter endotrakeal intubation.)

5 FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: Lokalanestetika
ATC-kod: N01BB02

Xylocain Viskös är avsett för anestesi av mag-tarmkanalens övre delar. Lidokain har god ytanestetisk effekt. Lidokain blockerar impulsledningen i nerverna reversibelt genom att hämma transporten av natriumjoner genom nervmembranet. Liknande effekter kan ses på excitatoriska membran i hjärna och hjärtmuskel.

Förutom lidokainhydroklorid innehåller lösningen karmellosnatrium vilket ger en hög viskositet, låg ytspänning och mycket god spridnings- och filmbildningsförmåga. Lösningen

fördelar sig väl över slemhinnorna och penetrerar till följd av den låga ytspänningen alla veck och fickor. Den höga viskositeten medför en tillräckligt långvarig kontakt mellan läkemedel och slemhinna för att ge erforderlig anestetisk verkan.

Anestesi uppnås inom 5 minuter och kvarstår i 20-30 minuter.

5.2 Farmakokinetiska uppgifter

Absorberad mängd lidokain beror förutom den applicerade dosen också på applikationsställe och exponeringstid. Om lösningen endast sköljs runt i munnen och sedan spottas ut erhålles endast låga plasmakoncentrationer av lidokain och dess metaboliter. Om däremot lösningen nedsväljs absorberas lidokain väl i mag-tarmkanalen, men genomgår omfattande första-passagemetabolism. Biotillgängligheten vid nedsväljning är ca 35%.

Lidokain elimineras främst genom metabolism. Dealkylering till monoetylglycinoxylidid (MEGX) medieras huvudsakligen av Cytokrom P450 3A4. MEGX metaboliseras till 2,6-xylidin och glycinoxylidid (GX). 2,6-xylidin omvandlas vidare av CYP2A6 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

Reproduktionstoxicitet

I studier av embryo/fosterutveckling i råtta och kanin med dosering av lidokain under oranogenesen 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.

Gentoxicitet och karcinogenicitet

Gentoxicitetsstudier 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

Karmellosnatrium, sackarinnatrium, metylparahydroxibensoat (konserveringsmedel E218), propylparahydroxibensoat (konserveringsmedel E216), körsbärsarom, citronsyra, natriumhydroxid (pH-justerare), renat vatten.

6.2 Inkompatibiliteter

Ej relevant.

6.3 Hållbarhet

2 år.

6.4 Särskilda förvaringsanvisningar

Inga särskilda förvaringsanvisningar.

6.5 Förpackningstyp och innehåll

Plastflaska 100 ml.

6.6 Anvisningar för användning och hantering samt destruktion

Inga särskilda anvisningar.

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

4546

9 DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE

1954-06-28 / 1999-01-01

1954-06-28 / 2004-01-01

10 DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN

2018-01-31