

Xylocain[®] utan konserveringsmedel

M R EF

Aspen Nordic

Gel 2 %

(klar till nästan klar, svagt färgad gel)

Lokalanestetikum för ytanestesi

Aktiv substans:

Lidokain

ATC-kod:

N01BB02

Läkemedel från Aspen Nordic omfattas av Läkemedelsförsäkringen.

Texten nedan gäller för:

Xylocain[®] gel 2 %;

Xylocain[®] utan konserveringsmedel gel 2 %

FASS-text: *Denna text är avsedd för vårdpersonal.*

Texten är baserad på produktresumé: 2023-05-25.

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.

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 ska undvikas till patienter som är allergiska mot ester-lokalanestetika som även de har PABA som metabolit.

Dosering

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.

Pediatrisk population

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.

Varningar och försiktighet

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 Interaktioner)

För stora doser lidokain eller för korta intervall mellan doseringstillfällena kan leda till höga plasmakoncentrationer och akuta centralnervösa och kardiovaskulära toxiska effekter (se Överdoserings). 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.

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 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.

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.

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

Amning

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

Trafik

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

Biverkningar

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

Immunsystemet:

Sällsynta (>1/10 000, <1/1000): Allergiska reaktioner, i allvarigaste 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 Överdoserings).

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 Läkemedelsverket, men alla kan rapportera misstänkta biverkningar till Läkemedelsverket, www.lakemedelsverket.se. Postadress

Läkemedelsverket
Box 26
751 03 Uppsala

Överdoserings

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 intoxication. 600 mg till vuxen gav lindrig, 2 g till vuxen gav måttlig intoxication.

Parenteral administrering: 50 mg i.v. till 1 mån barn gav mycket allvarlig intoxication. 200-400 mg infiltration till vuxen gav allvarlig, 500 mg till 80-åring och 1 g i.v. till vuxna gav mycket allvarlig intoxication.

Topikal administrering: 8,6-17,2 mg/kg till småbarn gav vid applikation på brännskadad hud allvarlig intoxication.

Symtom

Först CNS-excitation, senare CNS- depression. Vid stora doser kan snabbt debuterande kramper vara första symtomet. Oro, yrsel, synstörningar, periorala parestesier, illamående. Därefter ataxi, hörsel förändringar, eufori, förvirring, talsvårigheter, blekhet, svettning, tremor, kramper, koma, andningsstillestånd. Arytmier, framförallt bradyarytmier, men vid stora doser även ventrikeltakykardi, ventrikelflimmer, QRS-breddökning, AV-block. Hjärtsvikt, blodtrycksfall. (Methemoglobinemi beskriven i enstaka fall).

Behandling

Kol vid peroral överdosering. (Kränkingsprovokation 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.

Farmakodynamik

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 högviskösa, 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 excitoriska membran i hjärna och hjärtmuskel.

Farmakokinetik

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

Lidokain elimineras främst genom metabolism. Dealkylering till monoetylglycinxylylidid (MEGX) medieras huvudsakligen av cytokrom P450 3A4. MEGX metaboliseras till 2,6-xylylidin och glycinxylylidid (GX). 2,6-xylylidin omvandlas vidare av CYP2A6 till 4-hydroxi-2,6-xylylidin 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 ackumulering en av metaboliter.

Prekliniska uppgifter

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-xylylidin har genotoxisk potential in vitro. I en karcinogenicitetsstudie på råtta med exponering för 2,6-xylylidin 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.

Innehåll

Plastspruta: 1 g gel utan konserveringsmedel innehåller:

Lidokainhydroklorid 20 mg, hypromellos, natriumhydroxid och/eller saltsyra till pH 6,2-6,8, renat vatten.

Tuber: 1 g gel med konserveringsmedel innehåller: Lidokainhydroklorid 20 mg, hypromellos, metylparahydroxibensoat (E 218), propylparahydroxibensoat, natriumhydroxid, saltsyra till pH 6,2-6,6, vatten för injektionsvätskor.

Miljöpåverkan

Lidokain

Miljörisk: Risk för miljöpåverkan av lidokain kan inte uteslutas då ekotoxikologiska data saknas.

Nedbrytning: Det kan inte uteslutas att lidokain är persistent, då data saknas.

Bioackumulering: Det kan inte uteslutas att lidokain kan bioackumuleras, då data saknas.

Hållbarhet, förvaring och hantering

Hållbarhet: 2 år

Förvaras vid högst 25°C. Får ej frysas.

Användaranvisning

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 instillation en 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.

Egenskaper hos läkemedelsformen

Plastsprutor innehåller inte något konserveringsmedel och är avsedda för engångsbruk.

Förpackningsinformation

XYLOCAIN®

Gel 2 % (klar till nästan klar, svagt färgad gel)

10 x 30 gram tub (fri prissättning), EF, Övriga förskrivare: sjuksköterska, tandläkare

30 gram tub (fri prissättning), *tillhandahålls ej*

XYLOCAIN® UTAN KONSERVERINGSMEDEL

Gel 2 % (klar till nästan klar, svagt färgad gel)

10 x 10 gram förfylld spruta (fri prissättning), EF, Övriga förskrivare: sjuksköterska, tandläkare

10 x 20 gram förfylld spruta (fri prissättning), *tillhandahålls ej*