

1. LEGEMIDLETS NAVN

Xylocain liniment 3 %

2. KVALITATIV OG KVANTITATIV SAMMENSETNING

Virkestoff: 1 ml liniment inneholder 30 mg lidokain.

For fullstendig liste over hjelpestoffer se pkt. 6.1.

3. LEGEMIDDELFORM

Liniment.

Klart ufarget liniment til topikal applikasjon.

4. KLINISKE OPPLYSNINGER

4.1 Indikasjoner

Smerte- og kløstillende ved f.eks. solforbrenning, manetforbrenning, mindre brannså, insektstikk, Herpes zoster m.m.

Xylocain liniment 3 % er indisert til voksne og barn i alle aldre.

4.2 Dosering og administrasjonsmåte

Lidokain liniment absorberes når den brukes på sprukken hud eller slimhinner. Slik som ved bruk av andre lokalanestetika avhenger sikkerhet og effekt av rett dose, riktig teknikk, samt at en tar tilstrekkelige forholdsregler og er forberedt på krisesituasjoner. Følgende doseregime skal betraktes som en veiledning. Legens erfaring og kjennskap til pasientens fysiske status er viktig for å beregne riktig dosering.

Linimentet smøres direkte på huden.

Mindre brannså avkjøles først i vann i minst et kvarter.

Maksimaldose: Voksne: 1 g lidokain (30 ml liniment) over en periode på 24 timer.

Svake og eldre pasienter samt barn over >12 år: Dosen må vurderes individuelt.

Barn <12 år: 5 mg lidokain/kg kroppsvekt (0,15 ml liniment/kg kroppsvekt) som enkeltdose. Denne dosen bør ikke doseres mer enn tre ganger i løpet av 24 timer. Preparatene må brukes med største forsiktighet på åpne sår eller ved alvorlige forbrenninger (se pkt. 4.4).

I slike tilfeller bør følgende doser ikke overskrides pga betydelig absorpsjon og derved fare for systemiske bivirkninger: Voksne: 200 mg lidokain (6,5 ml liniment), barn <12 år: 2,5 mg/kg kroppsvekt (0,075 ml liniment/kg kroppsvekt.)

4.3 Kontraindikasjoner

Overfølsomhet overfor virkestoffet, lokalanestetika av amid type eller overfor ett eller flere av hjelpestoffene.

4.4 Advarsler og forsiktighetsregler

Store doser eller korte opphold mellom hver dose kan føre til høyt plasmanivå og alvorlige bivirkninger. Pasientene bør informeres om at de må følge de anbefalte doseringene nøye.

Behandling av alvorlige bivirkninger kan kreve bruk av utstyr til gjenopplivning, oksygen og andre legemidler til gjenopplivning (se pkt. 4.9).

Svake eller syke pasienter, pasienter med sepsis, alvorlig leversykdom eller hjertesvikt og barn >12 år som veier mindre enn 25 kg skal gis doser som står i forhold til deres vekt og fysiologiske tilstand.

Absorpsjon fra såroverflater er relativt høy. Preparatet er ikke beregnet for bruk i åpne sår eller ved alvorlige forbrenninger.

Pasienter som blir behandlet med antiarytmikum klasse III (for eksempel amiodaron) bør overvåkes nøye og monitorering av EKG bør vurderes, siden effektene på hjertet er additive.

4.5 Interaksjon med andre legemidler og andre former for interaksjon

Ved bruk av store doser lidokain bør man være oppmerksom på risikoen for additiv systemisk effekt hos pasienter som får andre lokalanestetika eller substanser som strukturelt ligner disse.

Spesifikke interaksjonsstudier med lidokain og antiarytmika klasse III (for eksempel amiodaron) er ikke utført, men forsiktighet bør utvises når pasienter behandles.

Legemidler som senker clearance av lidokain (for eksempel cimetidin eller beta-blokkere) kan potensielt føre til toksiske plasmakonsentrasjoner når lidokain blir gitt gjentatte ganger i store doser over lengre tid. Denne type interaksjon bør derfor ikke være klinisk viktig etter korttidsbruk av lidokain (for eksempel Xylocain liniment).

4.6 Graviditet og amming

Graviditet

Lidokain passerer placenta i mennesket. Kliniske studier og lang klinisk erfaring indikerer ingen økt risiko for skadelige effekter på svangerskapsforløpet, fosteret eller det nyfødte barnet.

Amming

Lidokain går over i morsmelk, men ved topisk applikasjon er det lite sannsynlig at barn som ammes påvirkes.

4.7 Påvirkning av evnen til å kjøre bil eller bruke maskiner

Legemiddelet antas ikke å påvirke evnen til å kjøre bil eller betjene maskiner.

4.8 Bivirkninger

Sjeldne (<1/1000):

Allergiske reaksjoner (i de verste tilfellene anafylaktisk sjokk) ved bruk av lokalbedøvende midler av amid type. Reaksjonene er hovedsakelig lokal kontakt-sensitivitet og sjeldent systemiske.

Topikale produkter som inneholder propylenglykol kan føre til hudirritasjon.

Melding av mistenkte bivirkninger

Melding av mistenkte bivirkninger etter godkjenning av legemidlet er viktig. Det gjør det mulig å overvåke forholdet mellom nytte og risiko for legemidlet kontinuerlig. Helsepersonell oppfordres til å melde enhver mistenkt bivirkning. Dette gjøres via meldeskjema som finnes på nettsiden til Statens legemiddelverk: www.legemiddelverket.no/meldeskjema.

4.9 Overdosering

Lidokain kan føre til akutt toksisk effekt ved høye systemiske nivåer som følge av rask absorpsjon eller overdosering.

Tegn på systemisk toksisitet er ventet å ligne effekter sett ved bruk av lokalanestetika via andre administrasjonsruter. Symptomer: Eksitasjon av nervesystemet. Ved alvorlige tilfeller: Hemmende effekt på det sentralnervøse- og kardiovaskulære system.

Vanligvis oppstår symptomer på sentralnervøs toksisitet før de kardiovaskulære virkningene ettersom dette forekommer ved lavere plasmakonsentrasjoner. Direkte virkninger av lokalanestetika på hjertet er bradykardi, hypotensjon og til slutt eventuelt hjertestans.

Alvorlige neurologiske symptomer (kramper, CNS-hemming) må behandles symptomatisk ved respiratorisk assistanse og bruk av krampestillende medikamenter.

5. FARMAKOLOGISKE EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiske egenskaper

Farmakoterapeutisk gruppe: Lokalanestetika til dermatologisk bruk, ATC-kode: D04A B01

Lidokain absorberes ved applikasjon på slimhinner og skadet hud.

Virkningsmekanisme: Slik som andre lokalanestetika, forårsaker lidokain en reversibel blokkering av impulsoverføring langs nervefibrene ved å hindre passasje av natriumioner over nervemembranen.

Lokalanestetika kan også ha lignende effekter på stimulerbare membraner i hjernen og myokard. Hvis for store mengder av legemidlet raskt når den systemiske sirkulasjonen vil symptomer og tegn på toksisitet forekomme, hovedsakelig fra det sentralnervøse- og kardiovaskulære-systemet (se pkt. 4.9).

5.2 Farmakokinetiske egenskaper

Lidokain absorberes ved topisk administrasjon på slimhinner. Absorpsjonshastighet og -omfang avhenger av konsentrasjon og totaldose applisert, samt applikasjonssted og lengden av eksponering. Vanligvis er absorpsjonshastighet ved topikal bruk av lokalanestetika, høyest etter intratrakeal-og bronkial administrasjon. Lidokain absorberes også lett fra mave- og tarmkanalen, men små mengder av legemidlet når sirkulasjonen på grunn av biotransformasjon i leveren.

Plasma proteinbinding av lidokain avhenger av legemiddelkonsentrasjonen. Bindingsgraden minker ved økende konsentrasjon. Ved konsentrasjoner på 1 til 4 mikrogram fri base pr. ml, er 60 til 80 % lidokain proteinbundet. Binding er også avhengig av plasmakonsentrasjonen av alfa-1-syre glykoprotein.

Lidokain krysser blod-hjernebarrieren og placenta, mest sannsynlig ved passiv diffusjon.

Lidokain metaboliseres raskt i leveren. Metabolitter, samt uforandret legemiddel skilles ut av nyrene. Biotransformasjonen inkluderer oksidativ N-avalkylering, ringhydroksylering, spaltning av amidbindingen og konjugering. N-dealkylering, et viktig ledd i biotransformasjonen, gir metabolittene monoetylglycinoxylidin og glycinoxylidin. De farmakologiske/toksiske effektene av disse metabolittene ligner de man ser for lidokain, men er ikke så uttalte. Ca. 90 % av administrert lidokain skilles ut i form av forskjellige metabolitter, og mindre enn 10 % skilles ut uforandret. Hovedmetabolitten i urin er konjugert 4-hydroks-2, 6-dimetylanilin. Elimineringshalveringstiden til lidokain etter en intravenøs bolus injeksjon er vanligvis 1,5 til 2 timer. På grunn av den raske metabolismen av lidokain kan ethvert forhold som påvirker leverfunksjonen endre lidokains kinetikk. Halveringstiden kan forlenges to ganger eller mer ved nedsatt leverfunksjon. Nedsatt nyrefunksjon påvirker ikke lidokains kinetikk, men kan øke akkumuleringen av metabolitter.

Faktorer slik som acidose og bruk av CNS-stimulerende og –depressive legemidler påvirker CNS-nivåene av lidokain som behøves for å gi systemisk effekt. Objektive tegn på bivirkninger blir mer tydelig ved økende venøs plasma konsentrasjoner over 6,0 mikrogram fri base per ml.

5.3 Prekliniske sikkerhetsdata

Prekliniske data indikerer ingen spesiell fare for menneske basert på konvensjonelle studier av reproduksjonstoksisitet og gentoksisitet.

Dyrestudier av akutt og gjentatt-dose-toksisitet har vist effekter på CNS og det kardiovaskulære systemet etter høye, subkutane eller intravenøse doser av lidokain.

Gentoksisitetstester med lidokain har ikke gitt bevis på mutagent potensiale. En metabolitt for lidokain, 2,6-xylidine, har gitt positivt utslag på enkelte *in vitro* og *in vivo* gentoksisitetstester. 2,6-xylidine har vist å ha karsinogent potensiale i studier på rotte, men med høy sikkerhetsmargin i forhold til human eksponering.

6. FARMASØYTISKE OPPLYSNINGER

6.1 Fortegnelse over hjelpestoffer

Metylcellulose
Etanol 96 %
Bitrex (denatonium benzoat)
Propylenglykol
Renset vann

6.2 Uforlikeligheter

Ingen kjente.

6.3 Holdbarhet

3 år

6.4 Oppbevaringsbetingelser

Oppbevares ved høyst 25 °C

6.5 Emballasje (type og innhold)

Plastflaske

6.6 Spesielle forholdsregler for destruksjon

Ikke anvendt legemiddel samt avfall bør destrueres i overensstemmelse med lokale krav.

7. INNEHAVER AV MARKEDSFØRINGSTILLATELSEN

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

8. MARKEDSFØRINGSTILLATELSESNUMMER

6271

9. DATO FØRSTE MARKEDSFØRINGSTILLATELSE/SISTE FORNYELSE

24.11.77 / 29.10.2010

10. OPPDATERINGSDATO

31.01.2018