

**Lidokainhydroklorid i Oral Cleaner APL Munsköljvätska 5 mg/ml**

ATC-kod: N01BB02

Rikslicens

Förpackning	Receptbelagd	Förmånspris med recept (SEK)	Övriga förskrivare	Varunr
Flaska, 300 milliliter	Ja	166.34	TL	326850
Spraybehållare, 100 milliliter	Ja	161.18	TL	331488

Indikationer

Lokalanestetikum vid irriterade eller inflammerade smärtande slemhinnor i mun och farynx t ex vid stomatit, faryngit, lingua geografica, mukositer i samband med strålbehandling eller palliativ munvård.

Kontraindikationer

Överkänslighet mot det aktiva innehållsämnet, ingående hjälpämnen eller paraaminobensoesyra (PABA) metabolit till metylparahydroxibensoat (metylparaben).

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

Dosering

Lidokainhydroklorid APL 5 mg/ml i Oral Cleaner APL kan användas för munsköljning, sprayas på slemhinnan alternativt kan sårigheter baddas med en liten kompress/tops indränkt i munsköljvätskan.

1 sprayning motsvarar ca 0,6 ml munsköljvätska och 3 mg lidokainhydroklorid (monohydrat).

Nedanstående doser är riktlinjer och doseringen ska anpassas till den enskilda patienten.

Vuxna:

Munhålan sköljs vid behov med 10-15 ml lösning (50-75 mg lidokainhydroklorid (monohydrat)), gärna cirka 5 minuter före födointag. Lösningen bör spottas ut när tillräcklig anestesi är uppnådd. Vid sväljsvårigheter kombineras munsköljningen med att 10-15 ml lösning nedsväljes (utan gurgling).

Rekommenderad maxdos, vuxna:

Maximalt bör 40 ml munsköljvätska (200 mg lidokainhydroklorid (monohydrat)) användas per behandlingstillfälle, vilket motsvarar ca 66 sprayningar.

Maximalt bör 100 ml munsköljvätska (500 mg lidokainhydroklorid (monohydrat)) användas per dygn.

Vid kombination med andra läkemedel som innehåller lidokain bör den totala dosen av lidokain vid ett doseringstillfälle ej överskrida 400 mg lidokainhydroklorid (monohydrat).

Barn 1-12 år:

Rekommenderad barndos saknas. Ur säkerhetssynpunkt bör 100 % biotillgänglighet efter applicering på slemhinnor och skadad hud antagas.

Hos små barn ska tops doppas i munhålelösningen och penslas lätt på munslemhinnan, gärna cirka 5 minuter före födointag.

Rekommenderad maxdos, barn 1-12 år:

Maximalt bör 3 mg/kg kroppsvikt (0,6 ml/kg) lidokainhydroklorid (monohydrat) användas per dygn (12 ml munhålelösning motsvarande 60 mg lidokainhydroklorid (monohydrat) för ett barn som väger 20 kg).

Varningar och försiktighet

För stora doser eller för korta intervall mellan doserna kan ge höga plasmakoncentrationer med allvarlig intoxikation som följd.

Slemhinneskada ökar absorptionen av lidokain. Behandling av allvarliga symtom på toxicitet kan kräva tillgång till återupplivningsutrustning, syrgas och läkemedel till återupplivning (se Överdoserings).

Om man på grund av administrerings sättet eller den givna dosen riskerar uppnå höga plasmakoncentrationer bör försiktighet iaktas. Speciell uppmärksamhet krävs vid behandling av patienter med hjärt-kärlsjukdom, hjärtsvikt

- patienter med partiellt eller totalt hjärtblock
- äldre patienter och patienter med generellt nedsatt allmäntillstånd
- patienter med allvarlig leversjukdom
- patienter med kraftigt sänkt njurfunktion

Patienter som behandlas med antiarytmika klass III (t ex amiodaron) bör stå under noggrann övervakning och EKG-monitorering bör övervägas eftersom effekterna på hjärta är 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.

Lidokainhydroklorid APL 5 mg/ml i Oral Cleaner APL 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.

Lidokainhydroklorid APL 5 mg/ml i Oral Cleaner APL innehåller metylparahydroxibensoat (E218) som kan ge allergisk reaktion (eventuellt fördröjd).

Interaktioner

Lidokain ska användas med försiktighet tillsammans med andra lokalanestetika eller läkemedel som är strukturellt besläktade med lokalanestetika av amidtyp, t ex antiarytmika klass IB, eftersom de toxiska effekterna är additiva. Försiktighet rekommenderas även vid samtidig behandling med antiarytmika klass III, t ex amiodaron.

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

Kategori A

Adekvata data från behandling av gravida kvinnor med lidokain saknas.

Lidokain passerar placentan. 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 Lidokain i Oral Cleaner APL munsköljvätska under graviditet bedöms nyttan uppväga eventuella risker.

Amning

Grupp II

Lidokain utsöndras i bröstmjolk i små mängder. Påverkan på barnet är osannolik vid användning av rekommenderade doser.

Trafik

Lidokainhydroklorid 5 mg/ml i Oral Cleaner APL har inga eller obetydliga effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner.

Biverkningar

Sällsynta biverkningar ($\geq 1/1000$, $< 1/10000$)	<i>Immunsystemet:</i> Allergiska reaktioner, i allvarligaste fall anafylaktisk chock.
--	---

Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar. 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

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).

Farmakodynamik

Lidokain är ett lokalanestetikum, som blockerar impulsöverföringen i nerverna reversibelt genom att hämma transporten av natriumjoner via natriumkanaler i nervmembranet. Liknande effekter kan ses på exciterande membran i hjärna och hjärtmuskel.

Lidokain har god penetrationsförmåga på slemhinna och snabbt insättande effekt. Anestesi uppnås inom 1-5 minuter och kvarstår i ungefär 15-30 minuter.

Glycerol motverkar uttorkning och smörjer slemhinnorna, vilket underlättar för patienter med sväljsvårigheter.

Farmakokinetik

Absorption

Absorberad mängd lidokain beror förutom på den applicerade dosen också på applikationsställe och exponeringstid. Lidokain absorberas snabbt efter topikal administrering på slemhinnor. Lidokain absorberas väl i mag-tarmkanalen, men genomgår omfattande första-passage metabolism. Biotillgängligheten av lidokain peroralt är ca 35 %.

Distribution

Distributionsvolym vid steady state är 91 liter. Bindningen av lidokain till plasmaprotein är koncentrationsberoende. Vid koncentrationer på 1-4 mikrog/ml är ca 60-80 % av lidokain bundet till plasmaproteiner, huvudsakligen till alfa-1-glykoprotein. Lidokain passerar placentan och den obundna koncentrationen lidokain är ungefär densamma hos mamman och fostret. Den totala plasmakoncentrationen är lägre hos fostret som har en lägre proteinbindningsgrad jämfört med mamman.

Metabolism

Lidokain metaboliseras huvudsakligen i levern via CYP1A2 och CYP3A4 till monoetylglycinxyloidid (MEGX). MEGX metaboliseras till 2,6-dimetylanilin och glycinxyloidid (GX). 2,6-dimetylanilin omvandlas vidare av CYP2D6 till 4-hydroxi-2,6-dimetylanilin. GX och MEGX är farmakologiskt aktiva metaboliter.

Elimination

Eliminationshalveringstiden för lidokain är 1,5-2 timmar efter intravenös bolusdos. De aktiva metaboliterna, MEGX och GX, har halveringstider på ca 2 respektive 10 timmar. Mindre än 10 % av en intravenös dos utsöndras oförändrad i urinen.

Särskilda patientgrupper

Halveringstiden av lidokain ökar signifikant hos patienter med nedsatt leverfunktion. Nedsatt njurfunktion påverkar inte farmakokinetiken av lidokain men kan öka ackumuleringen av metaboliter.

Prekliniska uppgifter

Reproduktionstoxicitet

I studier av embryo/fosterutveckling i råttor 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.

Gentoxicitet och carcinogenicitet

Gentoxicitetsstudier av lidokain var negativa. Carcinogeniciteten av lidokain har inte studerats. Lidokains metabolit 2,6-xyloidin har genotoxisk potential *in vitro*. I en carcinogenicitetsstudie på råttor med exponering för 2,6-xyloidin *in utero*, postnalt och under hela livstiden sågs tumörer i näshålan, underhuden och levern. Den kliniska relevansen av tumörfynd vid kortvarig/intermittent användning av lidokain är okänd.

Innehåll

100 ml munsköljvätska innehåller:

500 mg lidokainhydroklorid (monohydrat) motsvarande 410 mg lidokain.

1 ml munsköljvätska innehåller:

5,0 mg lidokainhydroklorid (monohydrat) motsvarande 4,1 mg lidokain.

Hjälpämne med känd effekt: Metylparahydroxibensoat (E 218)

Hjälpämnen

Glycerol 20 g

Natriumklorid

Pepparmyntolja

Polysorbit

Renat vatten

Metylparahydroxibensoat (E 218)

Blandbarhet

Ej relevant.

Hantering, hållbarhet och förvaring

Hantering

Inga särskilda anvisningar.

Hållbarhet

36 månader (glasflaska 300 ml).
36 månader (sprayflaska 100 ml).

Förvaring

Förvaras vid högst 25°C.

Revideringsdatum

2017-03-09

Texten är baserad på produktresumé för rikslicens 2017-03-08