

## SAMANTEKT Á EIGINLEIKUM LYFS

### 1. HEITI LYFS

Xylocain, 100 mg/ml, húðúði, lausn.

### 2. INNIHALDSLÝSING

Lídókaín 100 mg/ml, einn 100 míkrólítra skammtur svarar til 10 mg.

#### Hjálparefni með þekkta verkun

Xylocain húðúði inniheldur 241 mg af etanóli í hverjum ml.

(Sjá kafla 4.4.)

Sjá lista yfir öll hjálparefni í kafla 6.1.

### 3. LYFJAFORM

Húðúði, lausn.

Xylocain húðúði er tær eða næstum tær, fólbleik eða gulleit lausn, sem lyktar af etanóli, mentóli og banana.

### 4. KLÍNÍSKAR UPPLÝSINGAR

#### 4.1 Ábendingar

Yfirborðsdeyfig.

Ábending fyrir Xylocain húðúða, lausn, á við um fullorðna og börn  $\geq 2$  ára.

#### 4.2 Skammtar og lyfjagjöf

Einstaklingsbundnir. Úðað beint á húð eða slímhúð.

Xylocain húðúði er ætlaður til notkunar á slímhúð og veldur árangursríkri yfirborðsdeyfigu sem endist í u.þ.b. 10-15 mínútur. Verkinin kemur venjulega fram innan 1-3 mín., háð því svæði sem lyfið er notað á.

Eins og við á um önnur staðdeyfilyf byggist öryggi og verkun lídókaíns á réttri skömmtun, réttum notkunarmáta, viðeigandi varúðarráðstöfunum og aðgengilegum neyðarútbúnaði.

Líta skal á eftirfarandi ráðleggingar um skammta sem leiðbeinandi. Reynsla og þekking læknis á líkamlegu ástandi sjúklings er mikilvæg þegar skammtur er ákveðinn.

Hver virkjun skammtadællunnar gefur 10 mg af Xylocain. Fyrir úðun er ekki nauðsynlegt að þurrka svæðið sem meðhöndla á.

Xylocain húðúða má ekki nota á belgi (cuffs) á barkaslöngum (ETT) sem eru úr plasti (sjá kafla 4.4).

#### Ráðlagðir skammtar handa fullorðnum:

Svæði	Ráðlagður skammtur	Hámarksskammtur fyrir stuttar <sup>1)</sup>	Hámarksskammtur fyrir lengri <sup>2)</sup> aðgerðir
-------	--------------------	---	---

	(mg)	aðgerðir (mg)	(mg)
Aðgerðir á nefi t.d. ástungu á kinnkjálkaholu	20-60	500	600
Tannlækningar og aðgerðir í munni, t.d. fyrir ástungu	20-200	500	600
Aðgerðir í munnkoki, t.d. magaspeglun.	20-200	500	600
Aðgerðir í öndunarvegi, t.d. við innsetningu leggja eða slanga.	50-400	400	600
Aðgerðir á barkakýli, barka og berkjum	50-200	200 <sup>3)</sup>	400
Aðgerðir við fæðingar og vegna kvensjúkdóma, t.d. við fæðingu um fæðingarveg, fyrir saum á slímhúðarrifum og fyrir sýnatöku úr leghálsi.	50-200	400	600

- 1) Fyrir stuttar aðgerðir er lyfið gefið á skemmri tíma en 1 mín.
- 2) Fyrir lengri aðgerðir, þarf að gefa lyfið á lengri tíma en 5 mín.
- 3) Minnka ætti skammta við öndunarhjálp.

Þar sem frásög er breytilegt og er sérstaklega mikið frá barka og berkjum (sjá kafla 4.8 og 5.2) eru ráðlagðir hámarksskammtar mismunandi, háðir því á hvaða svæði lyfinu er úðað.

#### Börn

Hjá börnum eldri en 12 ára sem eru léttari en 25 kg á að miða skammta við þyngd og líkamlegt ástand. Hjá börnum yngri en 12 ára ætti hver skammtur ekki að vera meiri en 3 mg/kg líkamsþunga við notkun á barkakýli og barka og 4-5 mg/kg líkamsþunga fyrir notkun í nef, munn og kok. Ráðlagt er að nota þynnri lausnir af lídókaíni þegar lyfið er gefið nýburum og ungbörnum.

#### Skert nýrnastarfsemi

Gæta skal varúðar við notkun hjá sjúklingum með verulega skerta nýrnastarfsemi (sjá kafla 4.4).

#### Skert lifrarstarfsemi

Gæta skal varúðar við notkun hjá sjúklingum með verulega skerta lifrarstarfsemi (sjá kafla 4.4).

### 4.3 Frábendingar

Ofnæmi fyrir staðdeyfilyfjum af amíðflokki eða einhverju hjálparefnanna sem talin eru upp í kafla 6.1.

### 4.4 Sérstök varnaðarorð og varúðarreglur við notkun

Staðdeyfilyf geta dregið úr kyngingargetu og þar með aukið hættu á að sjúklingi svelgist á. Dofin tunga og slímhúð í munni geta aukið hættu á bitáverka. Eftir staðdeyfingu í koki á sjúklingur að vera fastandi í um það bil 2 klst., vegna hættu á kyngingarörðugleikum.

Óhófleg notkun eða notkun með stuttu millibili getur valdið hárrí plasmabéttni og alvarlegum aukaverkunum. Frásög um slímhúð er breytilegt en er sérstaklega mikið frá berkjum. Notkun þar getur leitt til hratt hækkandi eða óhóflegri plasmabéttni með aukinni hættu á einkennum eiturvekana svo sem krömpum. Xylocain húðúða skal nota með varúð hjá sjúklingum með sár, skaddaða slímhúð eða sýklasótt á því svæði sem úða á lyfinu á. Þegar slímhúð er sködduð eykst frásög út í blóðrásina. Við meðferð á alvarlegum aukaverkunum getur reynst nauðsynlegt að nota tæki til endurlífgunar, súrefni og önnur lyf til endurlífgunar (sjá kafla 4.9).

Hækkun blóðþéttni er algengari hjá sjúklingum sem eru lamaðir vegna svæfingar en hjá sjúklingum sem anda sjálfir. Sjúklingar sem ekki eru lamaðir vegna svæfingar kyngja sennilega stærri hluta af

skammti, sem síðan umbrotnar að talsverðu leyti í lifur við fyrstu hringrás eftir frásog úr meltingarvegi.

Ef skammtur eða það hvernig lyfjagjöf er háttað eru líkleg til að valda hárrí blóðþéttni og almennt þegar lídókaín er notað samhliða öðrum staðdeyfilyfjum, þurfa sumir sjúklingar sérstakt eftirlit til að fyrirbyggja alvarlegar aukaverkanir:

- Sjúklingar með hjarta- og æðasjúkdóm eða hjartabilun.
- Sjúklingar með gáttasleglarof að hluta til eða að fullu, þar sem staðdeyfilyf geta bælt leiðni hjartavöðvans.
- Aldraðir og sjúklingar með slæmt heilsufar almennt.
- Sjúklingar með verulega skerta nýrnastarfsemi.
- Sjúklingar með langt genginn lifrarsjúkdóm.
- Sjúklingar með flogaveiki, hægslátt, blóðþurrð, lost, Wolff-Parkinson-Whites heilkenni eða taugasjúkdóm.

Sjúklingar á meðferð með lyfjum við hjartsláttartruflunum af flokki III (t.d. amíódaróni) ættu að vera undir nánu eftirliti og íhuga skal eftirlit með hjartasírta, þar sem áhrif á hjarta geta verið samleggjandi.

Nota skal lyfið með varúð hjá sjúklingum með endurtekna porfýríu.

Lídókaín getur líklega valdið porfýríu og skal einungis gefa sjúklingum með bráða porfýríu ef brýna nauðsyn ber til. Gera skal viðeigandi varúðarráðstafanir hjá öllum sjúklingum með porfýríu.

Xylocain húðúða má ekki nota á belgi (cuffs) á barkaslöngum (ETT) sem eru úr plasti. Lídókaín sem kemst í snertingu við belg á barkaslöngu hvort sem hann er úr PVC eða ekki, getur skemmt belginn. Þessari skemmd er lýst eins og um göt eftir nálarstungur sé að ræða, sem getur valdið leka og leitt til þrýstingsfalls í belgnum.

Xylocain húðúði inniheldur etanól. Hann á því hvorki að nota samhliða dísulframi né metronídazoli. Þar sem lyfið inniheldur etanól skal gæta varúðar við notkun hjá áfengissjúklingum, börnum, þunguðum konum og konum með barn á brjósti sem og sjúklingum með flogaveiki eða lifrarsjúkdóm.

Xylocain húðúði inniheldur 24,1 mg af etanóli (alkóhóli) í hverri skammtaeiningu sem samsvarar 241 mg/ml. Lyfið getur valdið sviða sé það borið á skaddaða húð.

#### **4.5 Milliverkanir við önnur lyf og aðrar milliverkanir**

Lídókaín skal nota með varúð hjá sjúklingum á meðferð með öðru staðdeyfilyfi eða lyfjum sem eru byggingarlega skyld staðdeyfilyfjum af flokki amíð-lyfja, t.d. ákveðnum lyfjum við hjartsláttartruflunum, þar sem eiturverkanir eru samleggjandi.

Sérstakar rannsóknir á milliverkun lídókaíns við lyf við hjartsláttartruflunum af flokki III (t.d. amíódarón) hafa ekki verið gerðar, en ráðlagt er að gæta varúðar (sjá einnig kafla 4.4.).

Lyf sem draga úr úthreinsun lídókaíns (t.d. címetidín eða beta-blokkar) geta mögulega valdið eitrunarþéttni í plasma þegar lídókaín er gefið í endurteknum háum skömmtum í langan tíma. Slík milliverkun ætti því ekki að hafa klíníska þýðingu eftir meðferð með lídókaíni til skamms tíma með ráðlögðum skömmtum.

Fluvoxamín dregur úr úthreinsun lídókaíns um u.þ.b. 40% og lengir helmingunartíma lídókaíns úr 2,6 klst. í 3,5 klst.

Xylocain húðúði inniheldur etanól, sjá kafla 4.4.

#### **4.6 Frjósemi, meðganga og brjóstagjöf**

Meðganga:

Nota má Xylocain húðúða, lausn á meðgöngu.

Telja má að stór hópur þungaðra kvenna og kvenna á barneignaraldri hafi notað lídókaín. Ekki hefur verið greint frá neinum sérstökum truflunum á æxlun, t.d. engin tilvik vansköpunar.

Brjóstagjöf:

Konur sem hafa barn á brjósti mega nota Xylocain húðúða, lausn, þó ekki á geirvörtur rétt fyrir brjóstagjöf.

Eins og við á um önnur staðdeyfilyf getur lídókaín skilist út í brjóstamjólki, en í svo litlum mæli að almennt er engin hættu á að það hafi áhrif á barnið.

#### 4.7 Áhrif á hæfni til aksturs og notkunar véla

Staðdeyfilyf geta, háð skammti, haft mjög væg áhrif á heilastarfsemi og tímabundið skert hreyfingu og samhæfingu.

#### 4.8 Aukaverkanir

Lídókaín getur valdið bráðum eiturverkunum ef altæk þéttni þess verður há vegna hraðs frásogs, t.d. við notkun á svæðið fyrir neðan raddbönd, eða vegna ofskömmtnar (sjá kafla 5.2 og 4.9).

<b>Öndunarfæri, brjósthol og miðmæti</b> Tíðni ekki þekkt	Staðbundin erting, tímabundin særindi í hálsi, hæsi, raddleysi.*
<b>Ónæmiskerfi</b> Mjög sjaldgæfar ( $\geq 1/10.000$ til $< 1/1.000$ )	Ofnæmisviðbrögð, í alvarlegustu tilvikum bráðaofnæmislost.

\*Notkun Xylocain húðúða, lausnar, áður en barkaslöngu er komið fyrir veldur yfirborðsstaðdeyfingu en kemur ekki í veg fyrir eymsli eftir barkapræðingu.

#### Tilkynning aukaverkana sem grunur er um að tengist lyfinu

Eftir að lyf hefur fengið markaðsleyfi er mikilvægt að tilkynna aukaverkanir sem grunur er um að tengist því. Þannig er hægt að fylgjast stöðugt með sambandinu milli ávinnings og áhættu af notkun lyfsins. Heilbrigðisstarfsmenn eru hvattir til að tilkynna allar aukaverkanir sem grunur er um að tengist lyfinu til Lyfjastofnunar, [www.lyfjastofnun.is](http://www.lyfjastofnun.is).

#### 4.9 Ofskömmtnun

##### Bráðar eitranir

Eiturverkanir verða aðallega í miðtaugakerfi og hjarta- og æðakerfi.

Einkenni frá **miðtaugakerfi** (sem magnast stig af stigi hvað varðar alvarleika): Dofi í kringum munn, dofi í tungu, vönkun, ofurnæm heyrn og suð fyrir eyrum.

Sjóntruflanir og vöðvaskjálfti eru alvarlegri einkenni og fyrirboði útbreiddra krampa.

Meðvitundarleysi og krampar geta fylgt í kjölfarið, sem geta varað í fáeinar sekúndur til nokkrar mínútur. Súrefnisskortur í vefjum og koltvísýringshækkun koma fljótt í ljós við krampa vegna aukinnar virkni vöðva ásamt truflun á eðlilegri öndun. Öndunarstöðvun getur orðið í alvarlegum tilvikum. Blóðsýring eykur eiturverkanir staðdeyfilyfja.

Eiturverkanir ganga til baka vegna endurdreifingar og umbrots. Einkenni geta gengið hratt til baka nema lyfið hafi verið notað í miklu magni.

Einkenni frá **hjarta- og æðakerfi** sjást einungis í alvarlegum tilfellum. Þau eru verulegur lágþrýstingur, hægur hjartsláttur, hjartsláttartruflanir og lost, og koma fram við háa blóðþéttu. Þessi

einkenni koma venjulega fram seinna en einkenni frá miðtaugakerfi, nema sjúklingurinn sé í svæfingu eða mjög slævður af benzodíazepín-lyfjum eða barbitúrat-lyfjum.

## **Meðferð við bráðum eitrunum**

Ef einkenni útbreiddrar eitrunar koma fram, eru þau líklega svipuð að eðli og þau sem koma fram við notkun staðdeyfilyfja eftir öðrum íkomuleiðum. Eitrun af völdum staðdeyfilyfja einkennist af örvun taugakerfis og í alvarlegum tilvikum bælingu á miðtaugakerfinu og á hjarta og æðakerfi.

Alvarleg einkenni frá taugakerfi (krampar, bæling á miðtaugakerfi) á að meðhöndla eftir einkennum með stuðningi við öndun og gjöf krampaleysandi lyfja.

Við blóðrásarbilun skal strax hefja endurlífgun. Fullnægjandi súrefnismettun, loftskipti og jafnvægi á blóðrás, ásamt meðhöndlun við blóðsýringu, eru lífsnauðsynleg.

## **5. LYFJAFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR**

### **5.1 Lyfhrif**

Flokkun eftir verkun: Staðdeyfilyf, amíð, ATC flokkur: N 01 B B 02.

Xylocain húðúði er ætlaður til úðunar á slímhúðir og veldur árangursríkri yfirborðsdeyfingu, sem varir í u.þ.b. 10-15 mín. Deyfing kemur venjulega fram innan 1-3 mín., háð því svæði sem lyfinu er údað á.

Staðbundin deyfing er skilgreind sem tilfinningarleysi sem er bundið við ákveðið svæði líkamans. Öll staðdeyfilyf hafa sama verkunarhátt. Til þess að verka þurfa þau að hindra útbreiðslu taugaboða eftir taugaþráðunum. Taugaboð berast vegna hraðrar afskautunar og endurskautunar í taugaþráðum. Þessar breytingar á skautun eru vegna flæðis á natríum- og kalíumjónum um taugahimnur, í gegnum himnu taugafrumna. Staðdeyfilyf koma í veg fyrir innflæði natríumjóna sem er upphaf afskautunar og sem afleiðing þess, geta taugaþræðir ekki breitt út nein boð. Verkunarmáti sem liggur að baki virkni staðdeyfilyfja er ekki að fullu þekktur, en möguleg skýring er sú að lyfið á formi fituleysanlegs basa flæði um lípíðhimnuna og inn í frumuna. Inni í frumunni jónast hluti lyfsins á ný, fer inn í natríumgöngin og veldur truflun á innflæði natríums og þar með hindrun á boðleiðni.

### **5.2 Lyfjahvörf**

Lídókaín frásogast eftir að það er borið á slímhúð. Hraði og magn þess sem frásogast fer eftir þéttni og heildarskammti sem notaður er, á hvaða svæði lyfið er notað og hversu lengi viðkomandi svæði er útsett fyrir lyfinu. Almenn er frásogshraði staðdeyfilyfja eftir notkun á húð mestur eftir gjöf innan barka og berkja. Notkun þar getur því leitt til þess að plasmáþéttni lyfsins eykst hratt og aukinnar hættu á einkennum eitrunar eins og krampa. Lídókaín frásogast einnig vel frá meltingarvegi, en lítið magn af lyfinu finnst á óbreyttu formi í blóði vegna umbrota í lifur.

Venjulega er um 65% af lídókaíni bundið plasmapróteinum. Staðdeyfilyf af amíðflokki eru aðallega bundin alfa-1-sýru glýkópróteinum en einnig albúmíni. Alfa-1-sýru glýkóprótein hafa bindistaði með mikla sækni en bindirými er lítið. Albúmín hefur hins vegar bindistaði með litla sækni en mikið bindirými, sem skipta minna máli.

Lídókaín fer yfir blóð-heila þröskuld og fylgju, sennilega með óvirku flæði.

Aðal brotthvarfsleið lídókaíns er umbrot í lifur. Umbrot hjá mönnum felst aðallega í N-afalkýlingu í einetýlglýsín xýlidíð (MEGX), sem síðan hýdrólýserast í 2,6-xýlidín og áfram í 4-hýdroxý-2,6-xýlidín. MEGX getur einnig orðið fyrir frekari N-afalkýlingu í glýsín xýlidíð (GX). Lyfja- og eiturefnafræðileg virkni MEGX og GX er svipuð en minni en lídókaíns. GX hefur lengri helmingunartíma (um 10 klst.) en lídókaín og getur hugsanlega safnast fyrir við langvarandi notkun. Um 90% af lídókaíni sem gefið er skilst út á formi ýmissa umbrotsefna og minna en 10% útskilst á

óbreyttu formi í þvagi. Aðalumbrotsefnið í þvagi er samtengt 4-hýdroxý-2,6-xýlidín, sem er um 70-80% af útskilnaði í þvagi.

Helmingunartími lídókaíns eftir hraða gjöf í æð er venjulega 1,5-2 klst. Vegna mikils umbrotshraða lídókaíns getur hvaða ástand sem er sem hefur áhrif á lifrarstarfsemi valdið breytingu á lyfjahvörfum lídókaíns. Helmingunartími getur tvöfaldast eða meira hjá sjúklingum með skerta lifrarstarfsemi. Skert nýrnastarfsemi breytir ekki lyfjahvörfum lídókaíns en getur aukið uppsöfnun umbrotsefna.

Þættir eins og blóðsýring (acidosis) og notkun lyfja sem hafa örvandi eða slævandi áhrif á miðtaugakerfið hafa áhrif á þéttni lídókaíns í miðtaugakerfi sem þarf til að valda greinilegum altækum áhrifum. Aukaverkanir verða enn ljósari með aukinni plasmabéttni frá 6 míkróg af fríum basa á hvern ml.

### 5.3 Forklínískar upplýsingar

Í dýrarránsóknum á eiturverkunum hafa komið fram eitranir eftir stóra skammta af lídókaíni sem samstöð aðallega af verkunum á miðtaugakerfið og hjarta- og æðakerfið. Engar lyfjatengdar aukaverkanir hafa sést í ránsóknum á eiturverkunum á æxlun. Lídókaín hefur ekki heldur sýnt stökkbreytandi áhrif hvorki í *in vitro* né *in vivo* ránsóknum á stökkbreytandi verkunum. Krabbameinsránsóknir hafa ekki verið gerðar með lídókaíni, vegna þess hvernig þetta lyf er notað, bæði hvað varðar notkunarstað og meðferðarlengd.

Ránsóknir á eiturverkunum lídókaíns á erfðaefni hafa sýnt að það hefur ekki stökkbreytandi áhrif. Lídókaín umbrotsefnið 2,6-xýlidín sýndi væga verkun í nokkrum ránsóknum á eiturverkunum á erfðaefni. Umbrotsefnið 2,6-xýlidín hefur sýnt væg krabbameinsvaldandi áhrif í forklínískum ránsóknum á langvarandi útsetningu fyrir umbrotsefninu. Áhættumat, þar sem borin voru saman útreiknuð hámarksútsetning hjá einstaklingum sem nota lídókaín stöku sinnum og útsetning í forklínískum ránsóknum, bendir til þess að öryggisbil (safety margin) sé vítt við klíníska notkun.

## 6. LYFJAGERÐARFRÆÐILEGAR UPPLÝSINGAR

### 6.1 Hjálparefni

Etanól 96%, makrógól 400, bananabragðefni, mentól, sakkarín, hreinsað vatn.

### 6.2 Ósamrýmanleiki

Á ekki við.

### 6.3 Geymsluþol

3 ár.

### 6.4 Sérstakar varúðarreglur við geymslu

Má ekki geyma í kæli. Má ekki frjósa.

Ef lyfið er geymt við lægra hita en 8°C getur orðið útfelling. Útfellingin leysist aftur upp þegar lyfið nær stofuhita.

### 6.5 Gerð íláts og innihald

Fjölskammta ílát (glerflaska með pumpuventli), 1 x 50 ml (500 skammtar).

Plastúðarör (pólýprópýlen), stutt, um það bil 120 mm langt.

Plastúðaör (pólýetýlen), langt, um það bil 230 mm langt, sæft.

Í þakkingunni fylgir stutt úðarör úr plasti sem er einnota.  
Langt, sæft úðarör úr plasti sem er einnota.

Bæði stutt og löng sæfð plastúðarör eru fáanleg í 50 stk. þakkingu.

## **6.6 Sérstakar varúðarráðstafanir við förgun og önnur meðhöndlun**

Fremsti hluti úðarörsins hefur þegar verið beygður hæfilega, því er ekki þörf á að beygja það frekar fyrir notkun. Úðarörið má ekki stytta, ef það er gert hættir stauturinn að mynda úða.

Báðar gerðir af úðarörum eru einnota og henda skal þeim strax eftir notkun.

## **7. MARKAÐSLEYFISHAFI**

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

## **8. MARKAÐSLEYFISNÚMER**

MTnr 640471.

## **9. DAGSETNING FYRSTU ÚTGÁFU MARKAÐSLEYFIS/ENDURNÝJUNAR MARKAÐSLEYFIS**

Dagsetning fyrstu útgáfu markaðsleyfis: 1. október 1990.  
Nýjasta dagsetning endurnýjunar markaðsleyfis 10. desember 2010.

## **10. DAGSETNING ENDURSKOÐUNAR TEXTANS**

26. september 2023.