

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

Mesocain 1 %

injekčný roztok

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

Trimekaínium-chlorid 10 mg (1 %) v 1 ml injekčného roztoku.

Pomocná látka so známym účinkom: liek obsahuje 1,13 mmol (tzn. 26 mg) sodíka v jednej ampulke (10 ml).

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

injekčný roztok

Číry bezfarebný injekčný roztok bez mechanických nečistôt.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Topická, infiltračná, regionálna, povrchová slizničná a inhalačná, spinálna a Bierova vnútrožilová anestézia; profylaxia sympatikovej reakcie pri tracheálnej intubácii; profylaxia a terapia komorových arytmií pri akútnom infarkte myokardu a v kardiochirurgii.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Povrchová anestézia

Používa sa 1 % roztok.

Infiltračná anestézia

Používa sa 0,5 – 1 % roztok. Na dosiahnutie nižších koncentrácií sa riedi izotonickým roztokom NaCl. Môže sa pridať adrenalín 1 : 200 000 (na 100 ml roztoku Mesocainu 1 % výslednej koncentrácie sa pridá 0,5 mg adrenalínu, t.j. 0,5 ml adrenalínu koncentrácie 1 mg/ml).

V riedení 0,25 % bez adrenalínu sa môže využiť aj na modifikované vagosympatkové blokády podľa Višnevskeho.

Zvodová anestézia

Používa sa 1 % roztok s prípadnou prísadou adrenalínu 1 : 200 000.

Profylaxia a terapia komorových arytmií

Na úvod sa podá 50 - 100 mg (5 - 10 ml 1 % roztoku) pomaly (2 - 5 minút) i. v. Nasleduje dlhodobá infúzia 0,1 % roztoku (500 mg trimekaínu/500 ml nosnej infúzie izotonického roztoku NaCl) rýchlosťou 1 - 4 mg (1 - 4 ml)/min podľa reakcie pacienta. Maximálna dávka je 300 mg/hod. Pri kardiopulmocerebrálnej resuscitácii pri opakujúcej sa komorovej fibrilácii sa podáva dávka 1 mg/kg telesnej hmotnosti i. v. pred opakovanou defibriláciou.

Pri akútnom infarkte myokardu sa v prípadoch, kedy sa nejedná o A-V blok, bradykardiu a o šokový stav, podáva profylakticky 100 mg Mesocainu 1 % (10 ml 1 % roztoku) pomaly i. v. Podľa dĺžky prednemocničného transportu sa môže úvodná dávka doplniť 300 mg (30 ml 1 % roztoku) vnútrošvalovo.

Profylaxia sympatikovej reakcie pri tracheálnej intubácii

Pred tracheálnou intubáciou je možné podať 3 - 5 minút vopred 50 mg i. v. ako jednorazovú profylaktickú dávku, chrániacu exponovaných pacientov pred systémovou a vnútrošvalovou hypertenznou reakciou.

Na upokojenie bronchomotorickej reakcie je možné v tryskovom nebulizátore vytvoriť hmlu zo 4 - 5 ml roztoku na inhaláciu.

Maximálne jednotlivé dávky

Mesocain 1 % bez vazokonstrikčnej prímеси 50 ml.

Maximálna jednotlivá dávka sa nevzťahuje na podanie v oblasti hlavy a krku a na pôrodnický paracervikálny blok. V týchto prípadoch by pôsobila toxicky, je potrebná 50 % redukcia.

Spôsob podávania

Na povrchovú, infiltračnú a zvodovú anestéziu, intravenózne, intramuskulárne a inhalačné použitie.

4.3 Kontraindikácie

- Precitlivenosť na liečivo, amidové anestetiká alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1;
- malígna hypertermia v anamnéze,
- porfýria,
- hypovolémia,
- hypotenzia,
- poruchy srdcového vedenia,
- asystólia,
- kardiogénny šok.

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Pri poruche pečenej funkcie a pri predsieňových arytmiách, bradykardii, predsieňovo-komorovej blokáde, počas gravidity a vo vyššom veku sa odporúča zníženie dávkovania.

Tento liek obsahuje 26 mg sodíka v jednej ampulke (10 ml), čo zodpovedá 1,3 % WHO odporúčaného maximálneho denného príjmu 2 g sodíka pre dospelú osobu.

4.5 Liekové a iné interakcie

Plazmatickú hladinu trimekaínu zvyšujú betablokátoary, cimetidín a halotan, znižujú ju barbituráty, fenytoín a rifampicín. Miestny anestetický účinok sa takisto znižuje glukózou, kalcium a vazodilatanciami.

Vyššie dávky lokálnych anestetík amidového typu môžu zvyšovať účinnosť i toxicitu antiarytmík (chididínu a prajmalínu, pravdepodobne aj ďalších, napr. amiodarónu, dofetilidu, fenytoínu, mexiletínu, propafenónu a tocainidu), kardiotoník, vazodilatancií a antihypertenzív a zvyšovať negatívne inotropný efekt betablokátorov (napr. propranololu, metoprololu a nadololu).

Trimekaín sa neodporúča podávať s inými lokálnymi anestetikami kvôli aditívnym účinkom. Trimekaín sa musí podávať opatrne so štruktúrne podobnými látkami, ako je mexiletín.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

Počas gravidity sa odporúča nižšie dávkovanie. Trimekaín prestupuje cez placentárnu bariéru.

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Vzhľadom k možným nežiaducim účinkom, napr. poruchy nervového systému, poruchy videnia, zmätenosť, poruchy dýchania, poruchy kardiovaskulárneho systému, sa neodporúča vykonávať činnosť vyžadujúcu zvýšenú pozornosť.

4.8 Nežiaduce účinky

V nasledujúcej tabuľke sú zhrnuté nežiaduce účinky trimekaínium-chloridu rozdelené do skupín podľa terminológie MedDRA s uvedením frekvencie výskytu: veľmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); menej časté ($\geq 1/1\,000$ až $< 1/100$); zriedkavé ($\geq 1/10\,000$ až $< 1/1\,000$); veľmi zriedkavé ($< 1/10\,000$), neznáme (z dostupných údajov):

Trieda orgánových systémov podľa databázy MedDRA	Frekvencia	Nežiaduci účinok
Poruchy imunitného systému	neznáme	alergická reakcia**, anafylaktický šok**
Psychické poruchy*	neznáme	vzrušenie, nepokoj, logorea, (ľahká) zmätenosť
Poruchy nervového systému*	neznáme	nystagmus, tremor končatín, somnolencia, hyporeflexia, kóma, kŕč, rýchla strata vedomia
Poruchy oka*	neznáme	poruchy videnia
Poruchy ucha a labyrintu*	neznáme	tinnitus
Poruchy srdca a srdcovej činnosti*	neznáme	tachykardia, bradykardia až asystólia
Poruchy ciev*	neznáme	hypotenzia, obehový kolaps
Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína*	neznáme	respiračná porucha až apnoe
Poruchy gastrointestinálneho traktu*	neznáme	kovová chuť
Poruchy kože a podkožného tkaniva	neznáme	alergická kožná reakcia (kožné a slizničné alergické prejavy)**
Celkové poruchy a reakcie v mieste podania	neznáme	toxická reakcia (NOS)*

*Pri chybnom intravazálnom podaní dávky určenej na extravazálnu miestnu anestéziu vznikne toxická reakcia. Jej intenzita úzko závisí od množstva podanej látky.

Dominujú príznaky zo strany CNS, myokardu a hemodynamiky: vzrušenie, nepokoj, logorea, ľahká zmätenosť, poruchy videnia, hučanie v ušiach, kovová pachuť v ústach, nystagmus, chvenie až tras končatín.

Pri ťažkej reakcii nastúpi spavosť, hyporeflexia, kóma, poruchy dýchania až apnoe, často sprevádzané kŕčmi.

Obehová reakcia sa vyznačuje v miernom stupni hypotenziou, len prechodne spojenou s tachykardiou. Rýchlo nastupuje bradykardia až asystólia.

Nevýrazná intenzita počiatočných príznakov nemusí byť prognosticky priaznivá. Môže celkom chýbať fáza excitácie a kŕčov, nie je výnimkou rýchla strata vedomia a náhla zástava obehu.

**Alergické reakcie sú pomerne vzácne. Ich najčastejším prejavom je vývoj anafylaktického šoku alebo kožné a slizničné prejavy. Okamžitá liečba je rovnaká ako pri anafylaktických príhodách všeobecne: zvýšená poloha dolných končatín, doplnenie objemu, vazopresory, glukokortikoidy, antihistaminikum, kalcium, inhalácia kyslíka.

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie na **národné centrum hlásenia uvedené v Prílohe V**.

4.9 Predávkovanie

Príznaky pri predávkovaní sú zhodné s príznakmi toxickej reakcie, pozri časť 4.8 (chybné intravazálne podanie).

Terapia:

Mierne excitačné príznaky reagujú priaznivo na diazepam i. v. V závažných prípadoch kŕčov je navyše indikovaná svalová relaxácia s umelou ventiláciou. Hypotenzia reaguje priaznivo na doplnenie kolujúceho objemu rýchlou infúziou, na efedrín, príp. dihydroergotamín jednorazovo alebo na dopamín v infúzii. Pri náhlej zástave obehu je nutná kardiopulmocerebrálna resuscitácia.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: anestetiká, amidy
ATC kód: N01BB

Mesocain 1 % patrí k anestetikám amidovej skupiny, ktoré vyvolávajú menej alergických reakcií ako anestetiká esterové. Skrížená precitlivenosť medzi obidvomi skupinami nie je. Vyvolávajú blokádu vzniku a vedenia bolestivých podnetov i ďalších centripetálnych vzruchov, vznikajúcich tlakom, ťahom, teplom a pod. Jeho krátkodobý antiarytmický účinok nie je možné zdôvodniť zvýšením prahu fibrilácie. Je výrazne lipofilný.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Anestetický účinok nastupuje do 15 minút od podania a trvá 60 - 90 minút.

Trimekaín sa metabolizuje v pečeni a vylučuje sa obličkami v 10 % nezmenený, v 90 % vo forme metabolitov.

Biologický polčas v organizme je približne 90 minút. Účinná látka prestupuje cez hematoencefalickú a placentárnu bariéru.

Kyslé pH tkaniva pri zápale znižuje jeho účinnosť, alkaliémia jeho pôsobenie mierne zosilňuje.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Akútna toxicita (LD₅₀) trimekaínu u myši i. v. je okolo 60 mg/kg, s. c. 480 mg/kg, u potkana i. m. 450 mg/kg.

Špeciálne toxikologické štúdie, ani štúdie na reprodukčnú toxicitu sa neuskutočnili.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

chlorid sodný
voda na injekciu

6.2 Inkompatibility

Tento liek sa nesmie miešať s inými liekmi okrem tých, ktoré sú uvedené v časti 6.6.

6.3 Čas použiteľnosti

3 roky

Po otvorení bola chemická a fyzikálna stabilita pri používaní preukázaná počas 5 hodín pri izbovej teplote (15-25 °C).

Infúzny roztok 1:1, chemická a fyzikálna stabilita pri používaní bola preukázaná počas 5 hodín pri izbovej teplote (15-25 °C).

Infúzny roztok 1:10, chemická a fyzikálna stabilita pri používaní bola preukázaná počas 24 hodín pri izbovej teplote (15 – 25 °C) a pri 2 – 8 °C.

Roztok Mesocainu s adrenalínom 200:1, chemická a fyzikálna stabilita pri používaní bola preukázaná počas 8 hodín pri izbovej teplote (15-25 °C).

Z mikrobiologického hľadiska sa má liek použiť okamžite. Ak sa nepoužije okamžite, za čas a podmienky uchovávania pred použitím zodpovedá používateľ.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Uchovávajú sa pri teplote 10 – 25 °C. Ampulky uchovávajú sa vo vonkajšom obale na ochranu pred svetlom.

Pre podmienky na uchovávanie po zriedení a prvom otvorení lieku, pozri časť 6.3.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Druh obalu: zatavená ampulka z číreho skla hydrolytickej triedy I s obsahom 10 ml s označeným miestom zlomu; vložka s priehradkami, papierová škatuľka.

Veľkosti balenia: 5 ampuliek po 10 ml

10 ampuliek po 10 ml

Na trh nemusia byť uvedené všetky veľkosti balenia.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Ukázalo sa, že tento liek je kompatibilný s infúznym roztokom (Mesocain:infúzny roztok 1:1, 1:10) a s injekčným roztokom adrenalínu 1 mg/ml (Mesocain:injekčný roztok adrenalínu 200:1). Pokiaľ nie je preukázaná kompatibilita, infúzny roztok sa má vždy podávať oddelene.

Všetok nepoužitý liek alebo odpad vzniknutý z lieku sa má zlikvidovať v súlade s národnými požiadavkami.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

Zentiva, k.s.
U kabelovny 130
120 37 Praha 10 – Dolní Měcholupy
Česká republika

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

01/0024/69-CS

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDĹŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 30. decembra 1969
Dátum posledného predĺženia registrácie: 16. februára 2007

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

03/2024