

1. BEZEICHNUNG DER ARZNEIMITTEL

Ultracain® 1 % 5 ml
10 mg/ml Injektionslösung

Ultracain® 1 % 20 ml
10 mg/ml Injektionslösung

Ultracain® 2 % 5 ml
20 mg/ml Injektionslösung

Ultracain® 2 % 20 ml
20 mg/ml Injektionslösung

Wirkstoff: Articainhydrochlorid

2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

Ultracain 1 % 5 ml/Ultracain 1 % 20 ml:
1 ml Injektionslösung enthält 10 mg Articainhydrochlorid.

Ultracain 2 % 5 ml/Ultracain 2 % 20 ml:
1 ml Injektionslösung enthält 20 mg Articainhydrochlorid.

Sonstige Bestandteile mit bekannter Wirkung:
Enthält Natriumchlorid (siehe Abschnitt 4.4).

Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile siehe Abschnitt 6.1.

3. DARREICHUNGSFORM

Injektionslösung.
Klare, farblose Lösung.

4. KLINISCHE ANGABEN

4.1 Anwendungsgebiete

Ultracain ist angezeigt zur lokalen und regionalen Nervenblockade.

4.2 Dosierung und Art der Anwendung

Grundsätzlich gilt, dass nur die kleinste Dosis verabreicht werden darf, mit der die gewünschte Anästhesie erreicht wird. Die Dosierung ist entsprechend den Besonderheiten des Einzelfalles individuell vorzunehmen.

Bei Kindern und älteren Patienten muss eine Dosisanpassung vorgenommen werden.

Empfohlene Dosis für Erwachsene mit einer durchschnittlichen Körpergröße:

Empfohlene Höchstdosen: 5–6 mg/kg Körpergewicht, total 400 mg.

Ultracain	1 %	2 %
Plexus-brachialis-Blockade:	10–30 ml	10–15 ml
IVRA (intravenöse Regionalanästhesie):	30–40 ml	
Periduralanästhesie:	10–30 ml	10–15 ml

Art der Anwendung

Ultracain wird in Abhängigkeit vom jeweiligen Anästhesieverfahren zur Regionalanästhesie intravenös oder zur rückenmarksnahen Leitungsanästhesie peridural injiziert, in einem umschriebenen Bezirk in das Gewebe eingespritzt (Infiltration) oder in Abhängigkeit von den anatomischen Verhältnissen nach gezielter Punktion lokal appliziert.

4.3 Gegenanzeigen

- Ultracain darf nicht angewendet werden bei
- Überempfindlichkeit gegen Articain, andere Lokalanästhetika vom Säureamidtyp oder einen der in Abschnitt 6.1 genannten sonstigen Bestandteile,
 - schweren Störungen des Reizbildungs- oder Reizleitungssystems am Herzen (z. B. AV-Block II. oder III. Grades, ausgeprägte Bradykardie),
 - akuter dekompensierter Herzinsuffizienz (akutes Versagen der Herzleistung),
 - schwerer Hypotonie, Schock.

4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Bei Patienten mit einem Cholinesterasemangel muss die Indikation streng gestellt werden, da mit verlängerter und unter Umständen verstärkter Wirkung zu rechnen ist.

Ultracain darf nur mit besonderer Vorsicht angewendet werden bei

- Angina Pectoris,
- Arteriosklerose,
- Störungen der Blutgerinnung,
- schweren Nieren- oder Leberfunktionsstörungen,
- anamnestisch bekannter Epilepsie (siehe Abschnitt 4.8).

Von einer Injektion in entzündetes (infiziertes) Gebiet wird abgeraten (verstärkte Aufnahme von Ultracain bei herabgesetzter Wirksamkeit).

Zur Vermeidung von Nebenwirkungen sollten folgende Punkte beachtet werden:

- bei Risikopatienten und bei Verwendung höherer Dosierungen (mehr als 25 % der maximalen Einzeldosis) intravenösen Zugang für Infusion legen,
- Dosierung so niedrig wie möglich wählen,
- vor Injektion sorgfältig in zwei Ebenen aspirieren (Vermeidung von versehentlich intravaskulärer Injektion),
- regelmäßige Vitalparameterkontrolle (Herz-Kreislauf-Bewusstseinskontrolle).

Zur Anwendung am Auge sowie bei rückenmarksnaher Anästhesie darf Ultracain nur aus frisch geöffneten Ampullen verwendet werden (Injektionslösung ohne Konservierungsmittel).

Ultracain 1 %

1 ml enthält 0,12 mmol (2,76 mg) Natrium. Eine Dosis von 30 ml enthält 3,6 mmol (83 mg) Natrium. Dieses ist bei Personen unter natriumkontrollierter (natriumarmer/kochsalzreicher) Diät zu berücksichtigen.

Ultracain 2 %

1 ml enthält 0,09 mmol (2,07 mg) Natrium. Eine Dosis von 15 ml enthält 1,35 mmol (31 mg) Natrium. Dieses ist bei Personen unter natriumkontrollierter (natriumarmer/kochsalzreicher) Diät zu berücksichtigen.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Kombinationen verschiedener Lokalanästhetika rufen additive Wirkungen am kardiovaskulären System und ZNS hervor.

Es ist zu beachten, dass unter Behandlung mit blutgerinnungshemmenden Arzneimitteln (wie z. B. Heparin oder Acetylsalicylsäure) eine versehentliche Gefäßpunktion im Rahmen der Lokalanästhesie zu ernsthaften Blutungen führen kann und auch die Blutungsneigung bei diesen Patienten allgemein erhöht ist.

4.6 Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Schwangerschaft

Für Articain liegen keine Erfahrungen an exponierten Schwangeren vor außer zum Zeitpunkt der Geburt. Tierexperimentelle Studien lassen nicht auf direkte oder indirekte schädliche Auswirkungen von Articain auf Schwangerschaft, embryonale/fetale Entwicklung, Geburt oder postnatale Entwicklung schließen (siehe Abschnitt 5.3). Articain passiert die Plazentaschranke in geringerem Ausmaß als andere Lokalanästhetika. Bei Neugeborenen wurden Articain-Serumkonzentrationen von ca. 30 % der mütterlichen Spiegel gemessen. Während der Schwangerschaft sollte eine Behandlung mit Ultracain nur nach strenger Nutzen-Risiko-Abwägung erfolgen. Bei der geburts-hilflichen Anästhesie sind keine negativen Auswirkungen von Articain auf das Neugeborene bekannt geworden.

Stillzeit

Infolge des raschen Abfalls der Serumspiegel und der schnellen Ausscheidung werden in der Muttermilch keine klinisch relevanten Mengen von Articain gefunden. Bei kurzfristiger Anwendung ist eine Unterbrechung des Stillens in der Regel nicht erforderlich.

Fertilität

Tierexperimentelle Studien mit Articain 40 mg/ml + Epinephrin 0,01 mg/ml haben keinen Effekt auf die Fertilität gezeigt (siehe Abschnitt 5.3). In therapeutischen Dosen sind keine negativen Effekte auf die menschliche Fertilität zu erwarten.

4.7 Auswirkungen auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen

Nach Anwendung von Ultracain muss vom Arzt entschieden werden, wann der Patient wieder aktiv am Straßenverkehr teilnehmen oder Maschinen bedienen darf. Erwartungsangst und Operationsstress können zu einer Veränderung der Leistungsfähigkeit führen, obwohl die Lokalanästhesie mit Articain in entsprechenden Tests keine feststellbare Abweichung von der normalen Verkehrstüchtigkeit bewirkte.

4.8 Nebenwirkungen

Bei den Häufigkeitsangaben zu Nebenwirkungen werden folgende Kategorien zugrunde gelegt:

Sehr häufig ($\geq 1/10$)
Häufig ($\geq 1/100$ bis $< 1/10$)
Gelegentlich ($\geq 1/1.000$ bis $< 1/100$)
Selten ($\geq 1/10.000$ bis $< 1/1.000$)
Sehr selten ($< 1/10.000$)
Nicht bekannt (Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar)

Erkrankungen des Immunsystems

Häufigkeit nicht bekannt: allergische oder allergieähnliche Überempfindlichkeitsreaktionen. Diese können sich äußern als ödematöse Schwellung und/oder Entzündung an der Injektionsstelle, daneben unabhängig von der Injektionsstelle als Rötung, Juckreiz, Konjunktivitis, Rhinitis, Gesichtsschwellung (Angioödem) mit Schwellung von Ober- und/oder Unterlippe und/oder Wangen, Glottisödem mit Globusgefühl im Rachen und Schluckbeschwerden, Urtikaria und Atembeschwerden bis hin zum anaphylaktischen Schock.

Erkrankungen des Nervensystems

Häufig: Parästhesie, Hypästhesie.

Gelegentlich: Schwindel.

Häufigkeit nicht bekannt:

Dosisabhängig (besonders bei zu hoher Dosierung oder bei versehentlicher intravaskulärer Injektion) können zentralnervöse Störungen auftreten: Unruhe, Nervosität, Stupor, Benommenheit bis zum Bewusstseinsverlust, Koma, Atemstörungen bis zum Atemstillstand, Muskelzittern und Muskelzuckungen bis zu generalisierten Krämpfen.

Augenerkrankungen

Häufigkeit nicht bekannt: Sehstörungen (verschommenes Sehen, Doppeltsehen, Mydriasis, Blindheit) können während oder kurz nach der Injektion von Lokalanästhetika im Kopfbereich auftreten. Diese sind im Allgemeinen vorübergehend.

Herz- und Gefäßerkrankungen

Häufigkeit nicht bekannt: Hypotonie, Bradykardie, Herzversagen und Schock (unter Umständen lebensbedrohlich).

Während geburtshilflicher Analgesie können – insbesondere bei Paracervicalblockaden (PCB) – Bradykardien des Fetus auftreten. Es ist angezeigt, die kindlichen Herz-töne sorgfältig zu kontrollieren.

Erkrankungen des Gastrointestinaltrakts

Häufig: Übelkeit, Erbrechen.

Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen

Die Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen nach der Zulassung ist von großer Wichtigkeit. Sie ermöglicht eine kontinuierliche Überwachung des Nutzen-Risiko-Verhältnisses des Arzneimittels. Angehörige von Gesundheitsberufen sind aufgefordert, jeden Verdachtsfall einer Nebenwirkung dem

Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte

Abt. Pharmakovigilanz

Kurt-Georg-Kiesinger-Allee 3

D-53175 Bonn

Website: www.bfarm.de

anzuzeigen.

4.9 Überdosierung

a) Symptome einer Überdosierung

Stimulation des ZNS: Unruhe, Angst, Verwirrtheit, Hyperpnoe, Tachykardie, Blutdruckanstieg mit Rötung des Gesichts, Übelkeit, Erbrechen, Tremor, Zuckungen, tonisch-klonische Krämpfe.

Depression des ZNS: Schwindel, Hörstörungen, Verlust der Sprechfähigkeit, Stupor,

Bewusstlosigkeit, Atonie, Vasomotorenlähmung (Schwäche, Blässe), Dyspnoe, Tod durch Atemlähmung.

Herz- und Kreislaufdepression: Bradykardie, Arrhythmie, Kammerflimmern, Blutdruckabfall, Zyanose, Herzstillstand.

b) Notfallmaßnahmen und Gegenmittel

Treten erste Nebenwirkungs- oder Intoxikationszeichen, wie z.B. Schwindelgefühl, motorische Unruhe oder Benommenheit, während der Injektion auf, so ist sie abbrechen und der Patient ist in Horizontallage zu bringen. Die Atemwege sind frei zu halten, Puls und Blutdruck sind zu kontrollieren.

Es empfiehlt sich, einen intravenösen Zugang – auch bei nicht schwerwiegend erscheinenden Symptomen – zu legen, um bei Bedarf eine sofortige intravenöse Injektion vornehmen zu können.

Bei Atemstörungen werden je nach Schweregrad die Verabreichung von Sauerstoff und, falls notwendig, künstliche Beatmung empfohlen bzw. gegebenenfalls endotracheale Intubation und kontrollierte Beatmung.

Muskelzuckungen oder generalisierte Krämpfe sind mit intravenöser Injektion eines schnell wirkenden Spasmolytikums (z.B. Suxamethoniumchlorid, Diazepam) aufhebbar. Ebenso wird eine künstliche Beatmung (Sauerstoffzufuhr) empfohlen.

Blutdruckabfall, Tachykardie oder Bradykardie können häufig allein durch Horizontallagerung oder leichte Kopftief Lagerung kompensiert werden.

Bei schweren Kreislaufstörungen und Schock – gleich welcher Genese – sind nach Abbruch der Injektion folgende Sofortmaßnahmen zu ergreifen:

- Horizontal- bzw. Kopftief Lagerung und Freihalten der Atemwege (Sauerstoffsufflation),
- Anlegen einer intravenösen Infusion (Voll-elektrolytlösung),
- intravenöse Anwendung eines Glukokortikoids (z. B. 250 bis 1.000 mg Prednisolon oder die äquivalente Menge eines Derivates, z. B. Methylprednisolon),
- Volumensubstitution (evtl. zusätzlich, wenn notwendig, Plasmaexpander, Humanalbumin).

Bei drohendem Kreislaufversagen und zunehmender Bradykardie wird sofort Epinephrin (Adrenalin) i.v. gegeben. Nach Verdünnen von 1 ml einer handelsüblichen Epinephrin-Lösung 1 : 1.000 auf 10 ml oder unter Verwendung einer Epinephrin-Lösung 1 : 10.000 wird zunächst davon 0,25 bis 1 ml (= 0,025 bis 0,1 mg Epinephrin) unter Puls- und Blutdruckkontrolle langsam injiziert (Vorsicht: Herzrhythmusstörungen!). Als intravenöse Einzeldosis soll 1 ml (0,1 mg Epinephrin) nicht überschritten werden. Bei weiterem Bedarf soll Epinephrin mit der Infusionslösung gegeben werden (Tropfgeschwindigkeit einstellen nach Pulsfrequenz und Blutdruck).

5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Lokalanästhetika; Amide,
ATC-Code: N01BB08.

Ultracain ist ein Infiltrationsanästhetikum. Es besitzt eine nur sehr geringe oberflächenanästhetische Wirkung. In allen Anwendungstechniken zeichnet sich Ultracain durch rasch eintretende (Latenzzeit 1 bis 11 Minuten) und zuverlässige Wirkung aus mit auffallend stark analgetischem Effekt. Die Wirkungsdauer beträgt bei den Lösungen ohne Zusatz von Vasokonstringens 60 bis 225 Minuten.

Als Wirkmechanismus des Articains wird die Hemmung der Reizleitung an den Nervenfasern durch eine Blockade spannungsabhängiger Na⁺-Kanäle an der Zellmembran vermutet.

5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Articain wird im Serum zu 95 % an Plasmaproteine gebunden. Articain wird in der Leber zu 10 % metabolisiert, jedoch hauptsächlich durch Plasma- und Gewebe-Esterasen. Articain wird anschließend renal ausgeschieden, hauptsächlich als Articainsäure.

Bei gesunden Probanden wurden 20 bis 40 Minuten nach i.m. Injektion die Blutspiegel-Maxima erreicht, die Eliminationshalbwertszeit betrug 39,8 ± 3,1 min.

5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Basierend auf den konventionellen Studien zur Sicherheitspharmakologie, chronischen Toxizität, Reproduktionstoxizität und Genotoxizität lassen die präklinischen Daten keine besonderen Gefahren für den Menschen bei therapeutischen Dosen erkennen. In höheren als therapeutischen Dosen besitzt Articain kardiodepressive Eigenschaften und kann vasodilatierende Wirkungen haben.

In Embryotoxizitätsstudien mit Articain wurden bei Tagesdosen bis zu 20 mg/kg Körpergewicht (Ratte) und 12,5 mg/kg Körpergewicht (Kaninchen) i.v. weder eine gesteigerte fetale Sterberate noch Missbildungen beobachtet.

In Embryofetotoxizitätsstudien mit Articain und Epinephrin wurden keine vermehrten Missbildungen bei einer s.c. Tagesdosis von Articain bis zu 80 mg/kg (Ratte) und 40 mg/kg (Kaninchen) beobachtet. In einer Studie zur Fertilität und frühen embryonalen Entwicklung bei Ratten wurden unter parental toxischen Dosen keine unerwünschten Wirkungen auf die männliche oder weibliche Fertilität festgestellt.

6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Natriumchlorid, Wasser für Injektionszwecke.

6.2 Inkompatibilitäten

Mit alkalisch reagierenden Lösungen sind die Ultracain-Zubereitungen nicht kompatibel.

6.3 Dauer der Haltbarkeit

5 Jahre.

Angebrochene Ampullen dürfen nicht weiter verwendet werden.

6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Für diese Arzneimittel sind keine besonderen Lagerungsbedingungen erforderlich.

6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

Ultracain 1 % 5 ml/Ultracain 2 % 5 ml:
Ampullen aus Glas.
Packung mit 6 × 5 ml Injektionslösung.

Ultracain 1 % 20 ml/Ultracain 2 % 20 ml:
Ampullen aus Glas.
Packung mit 5 × 20 ml Injektionslösung.

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Keine besonderen Anforderungen.

7. INHABER DER ZULASSUNG

Sanofi-Aventis Deutschland GmbH
65926 Frankfurt am Main

Postanschrift:
Postfach 80 08 60
65908 Frankfurt am Main

Telefon: (01 80) 2 22 20 10*
Telefax: (01 80) 2 22 20 11*
E-Mail: medinfo.de@sanofi.com

8. ZULASSUNGSNUMMERN

Ultracain 1 % 5 ml: 6085516.00.00
Ultracain 1 % 20 ml: 6449883.00.00
Ultracain 2 % 5 ml: 6085516.01.00
Ultracain 2 % 20 ml: 6449883.01.00

9. DATUM DER ERTEILUNG DER ZULASSUNG/VERLÄNGERUNG DER ZULASSUNG

18.02.2004

10. STAND DER INFORMATION

Oktober 2014

11. VERKAUFSABGRENZUNG

Verschreibungspflichtig.

* 0,06 €/Anruf (dt. Festnetz); max. 0,42 €/min (Mobilfunk).

Zentrale Anforderung an:

Rote Liste Service GmbH

Fachinfo-Service

Mainzer Landstraße 55
60329 Frankfurt