

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV PŘÍPRAVKU

Mesocain 10 mg/ml injekční roztok

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

Jeden ml injekčního roztoku obsahuje 10 mg trimekain-hydrochloridu (1 %).

Jedna ampulka (10 ml) obsahuje 100 mg trimekain-hydrochloridu.

Pomocná látka se známým účinkem: přípravek obsahuje 1,13 mmol (26 mg) sodíku v jedné ampulce (10 ml).

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Injekční roztok.

Popis přípravku: čirý bezbarvý injekční roztok bez mechanických nečistot.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikace

Topická, infiltrační, regionální, povrchová slizniční a inhalační, spinální a Bierova nitrožilní anestezie; profylaxe sympatické reakce při tracheální intubaci; profylaxe a terapie komorových arytmií u akutního infarktu myokardu a v kardiochirurgii.

4.2 Dávkování a způsob podání

Dávkování při regionální anestezii

Povrchová anestezie

Používá se 1% roztok.

Infiltrační anestezie

Používá se 0,5 % - 1 % roztok. K dosažení nižších koncentrací se ředí izotonickým roztokem NaCl. Je možno přidat epinefrin (adrenalin) 1:200 000 (na 100 ml přípravku Mesocain výsledné koncentrace se přidá 0,5 mg epinefrinu, tj. 0,5 ml epinefrinu o koncentraci 1 mg/ml).

V ředění 0,25 % bez epinefrinu jej lze využít i k modifikovaným vagosympatickým blokádam podle Višněvského.

Svodná anestezie

Používá se 1% roztok s případnou přísadou epinefrinu 1:200 000.

Svodná anestezie u dětí

Maximální dávka anestetika je 7 mg/kg tělesné hmotnosti.

U dětí je možné provádět svodnou anestezii přibližně od věku 3 - 4 let. Vždy je třeba individuálně posoudit, zda je dítě schopno daný typ zákroku zvládnout.

Dávkování při systémovém (intravenózním) podání

Profylaxe a terapie komorových arytmií

Úvodem se podá 50 - 100 mg (5 - 10 ml 1% roztoku) pomalu (2 - 5 minut) i.v. Následuje dlouhodobá infuze 0,1% roztoku (500 mg přípravku Mesocain/500 ml nosné infuze isotonického roztoku NaCl) rychlostí 1 - 4 mg (1 - 4 ml)/min. podle reakce pacienta. Maximální dávka je 300 mg/h.

Při kardiopulmonální resuscitaci při opakující se komorové fibrilaci se podává dávka 1 mg/kg tělesné hmotnosti i.v. před opakovanou defibrilací.

Při akutním infarktu myokardu se v případech, kdy nejde o AV blok, bradykardii a o šokový stav, podává profylakticky 100 mg přípravku Mesocain (10 ml 1% roztoku) pomalu i.v. Podle délky přednemocničního transportu lze úvodní dávku doplnit 300 mg (30 ml 1% roztoku) intramuskulárně. Před tracheální intubací lze podat 3 - 5 minut předem 50 mg (5 ml 1% roztoku) i.v. jako jednorázovou profylaktickou dávku, chránící exponované pacienty před systémovou a nitrolební hypertenzní reakcí. Ke zklidnění bronchomotorické reakce lze v tryskovém nebulizéru zmlžít 4 - 5 ml roztoku k inhalaci.

Maximální jednotlivé dávky

Přípravek Mesocain bez vazokonstrikční příměsi 50 ml

Maximální jednotlivá dávka se nevztahuje na podání v oblasti hlavy a krku a na porodnický paracervikální blok. V těchto případech by působil toxicky, je třeba 50 % redukce.

4.3 Kontraindikace

- Hypersenzitivita na léčivou látku nebo na kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1
- Hypersenzitivita na amidová anestetika
- Maligní hypertermie v anamnéze
- Porfýrie
- Hypovolémie
- Hypotenze
- Poruchy srdečního vedení
- Asystolie
- Kardiogenní šok

4.4 Zvláštní upozornění a opatření pro použití

Při těžší poruše jaterních funkcí, při síňových arytmiích, bradykardii, síňokomorové blokádě a ve vyšším věku se doporučuje snížení dávkování.

Tento léčivý přípravek obsahuje 26 mg sodíku v jedné 10ml ampulce, což odpovídá 1,3 % doporučeného maximálního denního příjmu sodíku potravou podle WHO pro dospělého, který činí 2 g sodíku.

4.5 Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Plazmatickou hladinu trimekainu zvyšují betablokátory, cimetidin a halotan, snižují ji barbituráty, fenytoin a rifampicin. Místně anestetický účinek je též snižován glukózou, kalcielem a vazodilatancii. Vyšší dávky trimekainu mohou zvyšovat účinnost a i toxicitu antiarytmik, kardiotonik, vazodilatancii a antihypertenziv a zvyšovat negativně inotropní efekt betablokátorů.

Kvůli aditivním účinkům se trimekain nedoporučuje podávat s jinými lokálními anestetiky. Se strukturálně podobnými látkami, jako je mexiletin, musí být trimekain podáván s opatrností.

4.6 Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Nejsou k dispozici epidemiologické údaje o bezpečnosti trimekainu během těhotenství. Vzhledem k tomu, že prochází placentou, je doporučováno zohlednit poměr rizika možných nežádoucích účinků a prospěchu z jeho užití. V případě podání se doporučuje dávku redukovat. Na základě zkušeností se však zdá, že riziko výskytu kongenitálních malformací u dětí, které se narodily matkám, u kterých byl během těhotenství použit trimekain, je malé.

Kojení

Nejsou k dispozici epidemiologické údaje o bezpečnosti trimekainu během kojení. Protože trimekain je vylučován do mateřského mléka, je doporučováno zohlednit poměr rizika možných nežádoucích účinků a prospěchu z jeho užití. V případě podání se doporučuje dávku redukovat.

4.7 Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Vzhledem k možným nežádoucím centrálně nervovým a kardiovaskulárním účinkům se nedoporučuje vykonávat činnost vyžadující zvýšenou pozornost.

4.8 Nežádoucí účinky

V následující tabulce jsou shrnuty nežádoucí účinky trimekain-hydrochloridu rozdělené do tříd orgánových systémů podle databáze MedDRA s uvedením frekvence výskytu: velmi časté ($\geq 1/10$); časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$); méně časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$); vzácné ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$); velmi vzácné ($< 1/10\ 000$), není známo (z dostupných údajů nelze určit):

Třídy orgánových systémů podle databáze MedDRA	Frekvence	Nežádoucí účinek
Poruchy imunitního systému	Není známo	alergická reakce**, anafylaktický šok**
Psychiatrické poruchy*	Není známo	vzrušení, neklid, logorea, (lehká) zmatenost
Poruchy nervového systému*	Není známo	nystagmus, tremor končetin, somnolence, hyporeflexie, kóma, křeč
Poruchy oka *	Není známo	poruchy vidění
Poruchy ucha a labyrintu*	Není známo	tinitus
Srdeční poruchy *	Není známo	tachykardie, bradykardie až asystolie
Cévní poruchy *	Není známo	hypotenze, oběhový kolaps
Respirační, hrudní a mediastinální poruchy *	Není známo	respirační porucha až apnoe
Gastrointestinální poruchy *	Není známo	kovová chuť
Poruchy kůže a podkožní tkáň	Není známo	alergická kožní reakce (kožní a slizniční alergické projevy)**
Celkové poruchy a reakce v místě* aplikace	Není známo	toxická reakce (blíže neurčená)*

* Při chybném intravazálním podání dávky určené k extravazální místní anestézii vznikne toxická reakce. Její intenzita úzce závisí na velikosti podané dávky.

Dominují příznaky ze strany CNS, myokardu a hemodynamiky: vzrušení, neklid, logorea, lehká zmatenost, poruchy vidění, tinitus, kovová pachuť v ústech, nystagmus, chvění až třes končetin. Při těžké reakci nastoupí spavost, hyporeflexie, kóma, poruchy dýchání až apnoe, často doprovázené křečemi.

Oběhová reakce se vyznačuje v mírném stupni hypotenzí, jen přechodně sdruženou s tachykardií. Rychle nastupuje bradykardie až asystolie.

Nevýrazná intenzita počátečních příznaků nemusí být prognosticky příznivá. Může zcela chybět fáze excitace a křečí, rychlá ztráta vědomí a náhlá zástava oběhu nejsou výjimkou.

**Alergické reakce jsou poměrně vzácné. Jejich nejčastějším projevem je vývoj anafylaktického šoku

nebo kožní a slizniční projevy. Okamžitá léčba je táž jako při anafylaktických příhodách obecně: zvýšená poloha dolních končetin, doplnění objemu, vazopresory, glukokortikoidy, antihistaminikum, kalcium, inhalace kyslíku.

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv
Šrobárova 48
100 41 Praha 10
webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek

4.9 Předávkování

Príznaky při předávkování jsou shodné s příznaky toxické reakce, viz bod 4.8.

Léčba

Mírné excitační příznaky reagují příznivě na diazepam i.v. V závažných případech křečí jsou indikována navíc myorelaxancia s umělou ventilací. Hypotenze reaguje příznivě na doplnění kolujícího objemu rychlou infuzí, na efedrin, popř. dihydroergotamin jednorázově nebo na dopamin v infuzi. Při náhlé zástavě oběhu se zahájí kardiopulmonální resuscitace.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: lokální anestetikum. ATC kód: N01BB

Trimekain patří k anestetikům amidové skupiny, které vyvolávají méně alergických reakcí než anestetika esterová. Zkřížená přecitlivělost mezi oběma skupinami není. Trimekain vyvolává blokádu vzniku a vedení bolestivých podnětů i dalších centripetálních vzruchů, vznikajících tlakem, tahem, teplem apod. Jeho krátkodobý antiarytmický vliv nelze zdůvodnit zvýšením fibrilačního prahu. Je výrazně lipofilní.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Anestetický účinek nastupuje po podání do 15 minut a trvá 60 - 90 minut.

Trimekain je metabolizován v játrech a vylučuje se ledvinami z 10 % nezměněn, z 90 % ve formě metabolitů.

Biologický poločas v organismu je přibližně 90 minut. Léčivá látka prochází hematoencefalickou a placentární bariérou.

Kyselé pH tkáně při zánětu snižuje jeho účinnost, alkalémie jeho působení mírně umocňuje.

5.3 Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Akutní toxicita (LD_{50}) trimekainu u myši i.v. je okolo 60 mg/kg, s.c. 480 mg/kg, u potkana i.m. 450 mg/kg. Speciální toxikologické studie ani reprodukční toxicita nebyly prováděny.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1 Seznam pomocných látek

Chlorid sodný
Voda pro injekci.

6.2 Inkompatibility

Tento léčivý přípravek nesmí být mísen s jinými léčivými přípravky s výjimkou těch, které jsou uvedeny v bodě 6.6.

6.3 Doba použitelnosti

3 roky.

Chemická a fyzikální stabilita po otevření před použitím byla prokázána na dobu 5 hodin při pokojové teplotě (15-25 °C).

Mesocain s infuzním roztokem NaCl v poměru 1:1 - chemická a fyzikální stabilita po otevření před použitím byla prokázána na dobu 5 hodin při pokojové teplotě (15-25 °C).

Mesocain s infuzním roztokem NaCl v poměru 1:10 - chemická a fyzikální stabilita po otevření před použitím byla prokázána na dobu 24 hodin při pokojové teplotě (15-25 °C) a při teplotě 2-8 °C.

Mesocain s epinefrinem v poměru 200:1 - chemická a fyzikální stabilita po otevření před použitím byla prokázána na dobu 8 hodin při pokojové teplotě (15-25 °C).

Z mikrobiologického hlediska má být přípravek použit okamžitě. Není-li použit okamžitě, doba a podmínky uchovávání přípravku po otevření před použitím jsou v odpovědnosti uživatele.

6.4 Zvláštní opatření pro uchovávání

Uchovávejte při teplotě do 25 °C. Uchovávejte ampulky v krabičce, aby byl přípravek chráněn před světlem.

Podmínky uchovávání tohoto léčivého přípravku po prvním otevření a naředění viz bod 6.3.

6.5 Druh obalu a obsah balení

Skleněná ampulka, vložka s přepážkami, krabička.

Velikost balení: 10 ampulí po 10 ml.

6.6 Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku a pro zacházení s ním

Bylo prokázáno, že tento léčivý přípravek je kompatibilní s infuzním roztokem NaCl (Mesocain : infuzní roztok v poměru 1:1 a 1:10) a s injekčním roztokem epinefrinu o koncentraci 1 mg/ml (Mesocain : injekční roztok epinefrinu v poměru 200:1). Pokud není prokázána kompatibilita, infuzní roztok musí být vždy podáván odděleně.

Veškerý nepoužitý léčivý přípravek nebo odpad musí být zlikvidován v souladu s místními požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

Zentiva, k. s., U Kabelovny 130, 102 37 Praha 10, Česká republika

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO / REGISTRAČNÍ ČÍSLA

01/024/69-C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE / PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 1969

Datum posledního prodloužení registrace: 4. 12. 2013

10. DATUM REVIZE TEXTU

15. 9. 2023