

FACHINFORMATION

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

2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

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

Sonstige Bestandteile mit bekannter Wirkung:
Enthält 2,76 mg Natrium pro ml.

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

Sonstige Bestandteile mit bekannter Wirkung: Enthält 2,07 mg Natrium pro ml.

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 ausreichende 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.

Um eine intravaskuläre Injektion zu vermeiden, ist vor der Injektion grundsätzlich ein Aspirationstest durchzuführen. Der Injektionsdruck muss der Empfindlichkeit des Gewebes angepasst werden.

Gleichzeitige Anwendung von Beruhigungsmitteln:

Bei Patienten, die Beruhigungsmittel erhalten, sollte eine Verringerung der Dosis von Lokalanästhetika in Betracht gezogen werden, da diese eine additive zentral dämpfende Wirkung haben (siehe Abschnitt 4.5).

4.3 Gegenanzeigen

Ultracain darf nicht angewendet werden bei

- Überempfindlichkeit gegen Articain (oder andere Lokalanästhetika vom Amidtyp) 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,
- Patienten mit unzureichend behandelter Epilepsie.

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 1 % und Ultracain 2 % dürfen nur mit besonderer Vorsicht bei Patienten angewendet werden mit:

- Angina Pectoris,
- Arteriosklerose,
- Störungen der Blutgerinnung,
- schweren Nieren- oder Leberfunktionsstörungen,
- anamnestisch bekannter Epilepsie (siehe Abschnitt 4.8),
- Myasthenia gravis, die mit Acetylcholinesterasehemmern behandelt werden: Es sollte die niedrigste Dosis, die für eine wirksame Anästhesie ausreichend ist, angewendet werden.
- Porphyrie: Ultracain 1 % und Ultracain 2 % sollten bei Patienten mit akuter Porphyrie nur dann angewendet werden, wenn keine sicherere Alternative zur Verfügung steht. Bei allen Patienten mit Porphyrie sollten geeignete Vorsichtsmaßnahmen getroffen werden, da dieses Arzneimittel eine Porphyrie verschlimmern kann.

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

Bei Hypoxie, Hyperkaliämie und metabolischer Azidose muss die Dosis reduziert werden.

Unerwünschte Ereignisse wie Unruhe, Angst, Nervosität, Muskelzittern oder -zucken, Tinnitus, verschwommenes oder doppeltes Sehen oder Sprachstörungen (Dysarthrie, Logorrhö) können Anzeichen einer ZNS-Depression sein (siehe Abschnitt 4.9).

Unter Behandlung mit blutgerinnungshemmenden Arzneimitteln (wie z. B. Heparin oder Acetylsalicylsäure) ist die Blutungsneigung im Allgemeinen erhöht, so dass eine versehentliche Gefäßpunktion im Rahmen der Lokalanästhesie zu ernsthaften Blutungen führen kann.

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 versehentlicher 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 %

Ultracain 1 % enthält 27,6 mg Natrium pro 10 ml, entsprechend 1,4 % der von der WHO für einen Erwachsenen empfohlenen maximalen täglichen Natriumaufnahme mit der Nahrung von 2 g.

Ultracain 2 %

Ultracain 2 % enthält 20,7 mg Natrium pro 10 ml, entsprechend 1,1 % der von der WHO für einen Erwachsenen empfohlenen maximalen täglichen Natriumaufnahme mit der Nahrung von 2 g.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Andere Lokalanästhetika:

Kombinationen verschiedener Lokalanästhetika rufen additive Wirkungen am kardiovaskulären System und ZNS hervor. Die Toxizität von Lokalanästhetika ist additiv, unabhängig von der Dosis. Bei der Anwendung von mehr als einem Lokalanästhetikum ist Vorsicht geboten. In solch einem Fall kann es erforderlich sein, die Dosis der Lokalanästhetika zu reduzieren.

Beruhigungsmittel (mit zentral dämpfender Wirkung, z. B. Benzodiazepine, Opioide):

Bei Patienten, die Beruhigungsmittel erhalten, sollte eine Verringerung der Dosis von Lokalanästhetika in Betracht gezogen werden, da diese eine additive zentral dämpfende Wirkung haben (siehe Abschnitt 4.2).

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 geburtshilflichen 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

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: Hypästhesie.

Gelegentlich: Schwindel.

Nicht bekannt: Parästhesie¹ (persistierende Hypästhesie, Ageusie und Dysgeusie) nach mandibulärer Nervenblockade oder Blockade des Nervus alveolaris inferior. 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.

Psychiatrische Erkrankungen

Nicht bekannt: Nervosität, Angst, euphorische Stimmung.

Augenerkrankungen

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

Erkrankungen des Ohrs und des Labyrinths

Nicht bekannt: Hyperakusis, Tinnitus

Herz- und Gefäßerkrankungen

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 Herztöne sorgfältig zu kontrollieren.

Erkrankungen des Gastrointestinaltrakts

Häufig: Übelkeit, Erbrechen.

Nicht bekannt: Schwellung von Zunge, Lippe, Zahnfleisch oder Gesicht, Exfoliation (Schuppung)/Ulzeration der Mundschleimhaut, Stomatitis, Glossitis, Glossodynie, Dysphagie, Diarrhö.

Erkrankungen der Atemwege, des Brustraums und Mediastinums

Nicht bekannt: Bronchospasmus, Asthma, Dyspnoe, Dysphonie (Heiserkeit).

Skelettmuskulatur-, Bindegewebs- und Knochenkrankungen

Nicht bekannt: Nackenschmerzen, Verschlimmerung neuromuskulärer Manifestationen beim Kearns-Sayre-Syndrom, Trismus.

Beschreibung ausgewählter Nebenwirkungen

¹ Diese neuronalen Funktionsstörungen können mit verschiedenen Missempfindungen auftreten. Parästhesien können als spontane, ungewöhnliche, normalerweise nicht schmerzhaft empfundene Empfindung definiert werden (z. B., Brennen, Stechen, Kribbeln oder Jucken), die über die voraussichtliche Dauer der Anästhesie hinaus auftreten. Die meisten Fälle von Parästhesien, von denen nach Zahnbehandlungen berichtet wurde, sind vorübergehend und verschwinden innerhalb von Tagen, Wochen oder Monaten. Persistierende Parästhesien, meist als Folge einer mandibulären Nervenblockade, sind durch langsame, unvollständige oder ausbleibende Genesung gekennzeichnet.

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

Arten einer Überdosierung

Die Überdosierung von Lokalanästhetika wird häufig als Bezeichnung für folgende Fälle verwendet:

- absolute Überdosierung,
- relative Überdosierung, zum Beispiel:
 - unbeabsichtigte intravaskuläre Injektion oder
 - ungewöhnlich rasche Resorption in das Kreislaufsystem oder
 - verzögerter Metabolismus und verzögerte Elimination der Wirkstoffe.

Im Fall einer relativen Überdosierung treten die Symptome beim Patienten in der Regel innerhalb der ersten Minuten auf, während bei absoluter Überdosierung – je nach Injektionsstelle – Anzeichen einer Toxizität zu einem späteren Zeitpunkt nach der Injektion auftreten.

Symptome einer Überdosierung

Im Fall einer Überdosierung (absolut oder relativ), kann eine Erregtheit vorübergehend oder nicht vorhanden sein. Erste Anzeichen können daher Schläfrigkeit mit Übergang in Bewusstlosigkeit und Atemstillstand sein.

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

Depression des ZNS: Schwindel, Hörstörungen, Verlust der Sprechfähigkeit, Stupor, tiefe ZNS-Depression, Bewusstlosigkeit, Koma, Atonie, Vasomotorenlähmung (Schwäche, Blässe), Dyspnoe, Tod durch Atemlähmung.

Weitere neurologische Manifestationen: Präsynkope, Synkope, Kopfschmerz, Erregung, Verwirrtheit, Desorientiertheit, Sprachstörungen (z. B. Dysarthrie, Logorrhö), Gleichgewichtsstörungen (Ungleichgewicht).

Respiratorische Manifestationen: Apnoe (Atemstillstand), Bradypnoe, Tachypnoe, Gähnen, Atemdepression.

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

Augenmanifestationen (Mydriasis, verschwommenes Sehen, Akkommodationsstörungen).

Azidosen verstärken die toxische Wirkung von Lokalanästhetika.

Behandlung einer Überdosierung

Vor der Anwendung des Lokalanästhetikums ist eine entsprechende Notfallausrüstung mit geeigneten Geräten und Arzneimitteln zur Durchführung einer Wiederbelebung bereitzustellen, um eine sofortige Behandlung bei Atemwegs- und Herz-Kreislauf-Notfällen zu ermöglichen.

Die Schwere der Symptome einer Überdosierung sollte Ärzte/Zahnärzte veranlassen, Protokolle zu implementieren, die die Notwendigkeit einer rechtzeitigen Sicherung der Atemwege und einer unterstützten Beatmung vorsehen.

Der Bewusstseinszustand des Patienten sollte nach jeder Lokalanästhesie-Injektion überwacht werden. Wenn Anzeichen einer akuten systemischen Toxizität auftreten, muss die Lokalanästhesie sofort beendet werden.

Falls erforderlich, ist der Patient in die Rückenlage zu bringen.

ZNS-Symptome (Kramfanfälle, ZNS-Depression) müssen umgehend durch eine angemessene Unterstützung der Luftzufuhr/Beatmung und die Gabe von Antikonvulsiva behandelt werden.

Die optimale Versorgung des Blutes mit Sauerstoff, eine ausreichende Luftzufuhr, die Unterstützung des Kreislaufsystems sowie die Behandlung einer Azidose sind lebenswichtige Maßnahmen und können einen Herzstillstand verhindern.

Bei einer kardiovaskulären Depression (Hypotonie, Bradykardie) sollte eine geeignete Behandlung durch die Gabe intravenöser Flüssigkeiten, eines Vasopressors und/oder Inotropikums in Erwägung gezogen werden.

Kinder sollten eine dem Alter und Gewicht angemessene Dosis erhalten.

Bei einem Herzstillstand sind unverzüglich Wiederbelebungsmaßnahmen (kardiopulmonale Reanimation) einzuleiten.

Diese Reanimationsmaßnahmen sollten bei einer Lokalanästhetika-Intoxikation über längere Zeit fortgesetzt werden. Die frühzeitige Gabe einer Lipidemulsion als unspezifisches Antidot sollte bei einer Lokalanästhetika-Intoxikation in Erwägung gezogen werden.

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 $39,8 \pm 3,1$ 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 Körpergewicht (Ratte) und 40 mg/kg Körpergewicht (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

3 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 5 x 5 ml Injektionslösung.

Packung mit 6 x 5 ml Injektionslösung.

Ultracain 1 % 20 ml/Ultracain 2 % 20 ml:

Ampullen aus Glas.

Packung mit 5 x 20 ml Injektionslösung.

Packung mit 6 x 20 ml Injektionslösung.

Es werden möglicherweise nicht alle Packungsgrößen in den Verkehr gebracht.

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Keine besonderen Anforderungen.

7. INHABER DER ZULASSUNG

Septodont GmbH
Felix-Wankel-Str. 9
D-53859 Niederkassel

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. Februar 2004

10. STAND DER INFORMATION

August 2022

11. VERKAUFSABGRENZUNG

Verschreibungspflichtig.