

1. Bezeichnung des Arzneimittels

Locastad® gegen Halsschmerzen 2 mg/0,6 mg/1,2 mg Honig & Zitronengeschmack Lutschtabletten

2. Qualitative und quantitative Zusammensetzung

Jede Lutschtablette enthält:

Lidocainhydrochlorid	2,00 mg
Amylmetacresol	0,60 mg
2,4-Dichlorbenzylalkohol	1,20 mg

Sonstige Bestandteile mit bekannter Wirkung:

Jede Lutschtablette enthält 1.495,33 mg Saccharose, 1.016,82 mg Glucose-Sirup, 0,01 mg Gelborange S und 1,5 mg Minzöl.

Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile siehe Abschnitt 6.1.

3. Darreichungsform

Lutschtablette

Locastad® gegen Halsschmerzen 2 mg/0,6 mg/1,2 mg Honig & Zitronengeschmack Lutschtabletten sind gelbe, bikonvexe, zylindrische Lutschtabletten mit Honig-Zitronengeschmack und einem Durchmesser von 19 mm.

4. Klinische Angaben

4.1 Anwendungsgebiete

Zur Symptomlinderung von Halsschmerzen bei Erwachsenen und Jugendlichen über 12 Jahren.

4.2 Dosierung und Art der Anwendung

Erwachsene und Jugendliche über 12 Jahre
1 Lutschtablette alle 2–3 Stunden und, falls nötig, bis zu 8 Lutschtabletten innerhalb von 24 Stunden (maximal 4 Lutschtabletten für Jugendliche).

Kinder und Jugendliche unter 12 Jahren
Dieses Arzneimittel ist nicht zur Anwendung bei Kindern und Jugendlichen unter 12 Jahren geeignet.

Art der Anwendung

Anwendung in der Mundhöhle.

Man sollte die Lutschtablette langsam in der Mundhöhle, nicht in der Wangentasche zergehen lassen.

Dieses Arzneimittel darf nicht vor einer Mahlzeit oder einem Getränk angewendet werden.

Die längerfristige Anwendung dieses Arzneimittels für mehr als 5 Tage wird nicht empfohlen (siehe Abschnitt 4.4).

Ältere Patienten

Eine Dosisanpassung ist nicht erforderlich.

Patienten mit Nieren- und/oder Leberinsuffizienz

Es gibt keine verfügbaren Daten über die Anwendung von Locastad® bei Nieren- und/oder Leberinsuffizienz.

4.3 Gegenanzeigen

- Überempfindlichkeit gegen die Wirkstoffe, Levomenthol, Minzöl, Gelborange S oder einen der in Abschnitt 6.1 genannten sonstigen Bestandteile.

Aufgrund seines Lidocain-Gehalts ist dieses Arzneimittel kontraindiziert für Kinder unter 12 Jahren.

4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Die angegebene Dosierung sollte eingehalten werden: Da es durch den Blutfluss weitergeleitet wird, kann dieses Arzneimittel – in größeren Mengen oder wiederholt angewendet – das zentrale Nervensystem beeinflussen, wodurch es möglicherweise zu Krampfanfällen oder Störungen der Herzfunktion führt.

Die längere Anwendung dieses Arzneimittels über mehr als 5 Tage wird nicht empfohlen, da dies das natürliche mikrobielle Gleichgewicht des Mund-/Rachenbereichs verändern kann.

Wenn die Symptome länger als 2 Tage anhalten, sich verstärken oder weitere Symptome auftreten, wie z.B. hohes Fieber, Kopfschmerzen, Übelkeit oder Erbrechen und Hautausschlag, muss der klinische Allgemeinzustand auf eine mögliche bakterielle Infektion (Angina, Tonsillitis) hin untersucht werden.

Dieses Arzneimittel sollte akut erkrankten oder gebrechlichen älteren Patienten unter Vorsicht verabreicht werden, da sie anfälliger für Nebenwirkungen dieses Arzneimittels sind.

Bei akut bestehenden größeren Wunden im Mund- und Rachenbereich sollte dieses Arzneimittel nicht angewendet werden.

Die durch dieses Arzneimittel verursachte Betäubung des Rachenbereichs kann zu Aspirationspneumonie führen (Husten während des Essens, es entsteht der Eindruck, die Person würde ersticken). Es ist deswegen dringend erforderlich, dass dieses Arzneimittel nicht vor dem Essen oder Trinken angewendet wird. Asthmatiker dürfen dieses Arzneimittel ausschließlich unter ärztlicher Beobachtung anwenden.

Locastad® kann ein Taubheitsgefühl auf der Zunge verursachen und damit das Risiko für Bissverletzungen erhöhen. Deshalb ist beim Essen und Trinken heißer Lebensmittel Vorsicht angesagt. Dem Patienten sollte bewusst sein, dass die Anwendung topischer Anästhetika das Schlucken erschweren und dadurch die Gefahr des „Sich-Verschluckens“ erhöht sein kann. Darum sollte direkt nach Anwendung von topischen Anästhetika im Mund- oder Rachenbereich keine Nahrungsaufnahme erfolgen.

Patienten, die auf Lokalanästhetika des Amid-Typs allergisch sind, sollten sich einer Gefahr der Kreuzallergie auf Lidocain bewusst sein (Abschnitt 4.5).

Locastad® gegen Halsschmerzen 2 mg/0,6 mg/1,2 mg Honig & Zitronengeschmack Lutschtabletten enthält Glucose

Patienten mit der seltenen Glucose-Galactose-Malabsorption sollten Locastad® nicht einnehmen. 1 Lutschtablette enthält 1.016,82 mg Glucose-Sirup, entsprechend ca. 0,08 Broteinheiten (BE). Dies ist bei Patienten mit Diabetes mellitus zu berücksichtigen.

Locastad® gegen Halsschmerzen 2 mg/0,6 mg/1,2 mg Honig & Zitronengeschmack Lutschtabletten enthält Saccharose

Patienten mit der seltenen hereditären Fructose-Intoleranz, Glucose-Galactose-Malabsorption oder Saccharase-Isomaltase-Mangel sollten Locastad® nicht einnehmen. 1 Lutschtablette enthält 1.495,33 mg Saccharose (Zucker), entsprechend ca. 0,12 Broteinheiten (BE). Dies ist bei Patienten mit Diabetes mellitus zu berücksichtigen.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Die gleichzeitige oder nachfolgende Anwendung von anderen Antiseptika wird aufgrund der möglichen Wechselwirkungen (Antagonismus, Deaktivierung) nicht empfohlen.

Obwohl der Lidocaingehalt dieses Arzneimittels gering ist, muss Folgendes beachtet werden:

- Beta-Adrenorezeptorenblocker reduzieren den hepatischen Blutfluss und vermindern dadurch die Geschwindigkeit, mit der Lidocain metabolisiert wird. Dies führt zu einem größeren Toxizitätsrisiko.
- Cimetidin kann den Metabolismus von Lidocain in der Leber hemmen. Dies führt zu einem größeren Toxizitätsrisiko.
- Lidocain kann zu einer Kreuzallergie mit anderen Lokalanästhetika des Amid-Typs führen.
- Klasse-III-Antiarrhythmika, wie z.B. Mexiletin und Procainamid, sollten wegen möglicher pharmakokinetischer oder pharmakodynamischer Interaktionen vorsichtig angewendet werden.
- Die Isoenzyme CYP1A2 und CYP3A4 des Cytochroms P450 sind bei der Entstehung von MEGX, dem pharmakologisch aktiven Metaboliten von Lidocain, beteiligt. Deswegen können andere Wirkstoffe, wie z.B. Fluvoxamin, Erythromycin und Itraconazol die Plasmakonzentration von Lidocain erhöhen.

4.6 Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Schwangerschaft

Die Sicherheit von Locastad® in der Schwangerschaft ist nicht belegt. Eine große Datenmenge bezüglich der lokalen Anwendung während der Schwangerschaft weist nicht auf ein erhöhtes Risiko kongenitaler Missbildungen hin. Lidocain passiert die Plazenta; allerdings findet aufgrund der kleinen Dosis nur eine sehr geringe Absorption statt. Tierstudien weisen nicht auf Reproduktionstoxizität hin (siehe Abschnitt 5.3).

Es gibt keine Daten bezüglich der Anwendung von Amylmetacresol und 2,4-Dichlorbenzylalkohol als pharmakologisch aktive Wirkstoffe während der Schwangerschaft. Aufgrund fehlender Erfahrungswerte wird die Anwendung von Locastad® in der Schwangerschaft nicht empfohlen.

Stillzeit

Die Sicherheit von Locastad® in der Stillzeit ist nicht belegt. Lidocain wird in kleinen Mengen in die Muttermilch ausgeschieden. Aufgrund der geringen Dosis werden keine Auswirkungen von Lidocain auf den Säug-

ling erwartet. Es gibt keine Daten bezüglich der Ausscheidung von Amylmetacresol und 2,4-Dichlorbenzylalkohol in die Muttermilch. Es muss dementsprechend entschieden werden, ob abgestellt werden soll oder die Behandlung mit Locastad® abgebrochen bzw. gar nicht erst begonnen werden soll. Dabei muss zwischen dem Nutzen des Stillens für den Säugling und dem Nutzen der Therapie für die Frau abgewogen werden.

Fertilität

Es gibt keine Daten bezüglich des Effekts von Lidocain, Amylmetacresol und 2,4-Dichlorbenzylalkohol auf die Fertilität.

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

Dieses Arzneimittel hat keinen oder einen zu vernachlässigenden Einfluss auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen.

4.8 Nebenwirkungen

Während der Anwendung traten folgende Nebenwirkungen für die Kombination der Wirkstoffe dieses Arzneimittels auf:

Erkrankungen des Immunsystems

Selten ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$): Überempfindlichkeitsreaktionen (Brennen, Juckreiz), Angioödem, Stechen im Rachenbereich und unangenehmer Geschmack.

Gelborange S kann allergische Reaktionen hervorrufen.

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, jedem 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

Es werden keine Schwierigkeiten bezüglich einer Überdosierung erwartet. Für den Fall einer systemischen Absorption kann es zu einer transitorischen Stimulation des ZNS kommen, gefolgt von einer ZNS-Dämpfung (Benommenheit, Bewusstlosigkeit) und Depression des kardiovaskulären Systems (Hypotonie, langsamer oder unregelmäßiger Herzschlag).

Die längere Anwendung dieses Arzneimittels (über mehr als 5 Tage) wird nicht empfohlen, da dies das natürliche mikrobielle Gleichgewicht des Mund-/Rachenbereichs verändern kann.

Kinder und Jugendliche

Die Anwendung großer Dosen und über einen längeren Zeitraum bei Kindern unter 6 Jahren kann Krampfanfälle auslösen.

Symptome

Eine Überdosierung ist aufgrund der niedrigen Wirkstoffmengen unwahrscheinlich. Im Falle einer anormalen Anwendung (sehr viel höhere Dosen, Schleimhautverletzungen) kann eine Überdosierung auftreten. Dieses manifestiert sich zunächst hauptsächlich durch eine ausgeprägte Anästhesie der oberen Atemwege und des Verdauungstrakts. Systemische Reaktionen können aufgrund der Absorption von Lidocain auftreten. Die gravierendste Wirkung von Lidocain besteht unter anderem in einer Intoxikation des zentralen Nervensystems (Schlaflosigkeit, Unruhe, Erregung und Atemdepression) und des kardiovaskulären Systems; darüber hinaus kann auch eine Methämoglobinämie auftreten.

Behandlung

Im Fall einer Überdosierung kann die Möglichkeit eines induzierten Erbrechens und/oder eine Magenspülung (innerhalb einer Stunde) bei einer potenziell ersten Intoxikation in Betracht gezogen werden. Zusätzliche Maßnahmen erfolgen nur unterstützend und symptomatisch.

5. Pharmakologische Eigenschaften

5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Hals- und Rachen therapeutika; Antiseptika, Verschiedene

ATC-Code: R02AA20

2,4-Dichlorbenzylalkohol und Amylmetacresol haben antiseptische Eigenschaften.

Lidocain ist ein Lokalanästhetikum vom Amidtyp.

5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Lidocain hat eine Halbwertszeit von 1 bis 2 Stunden (ca. 100 Minuten), die von der Dosis abhängt. Die Halbwertszeit des Metaboliten Glycinylidid (GX) ist länger und deswegen kann eine Akkumulation auftreten, insbesondere bei renaler Ausscheidung.

Es gibt weder Daten bezüglich der Pharmakokinetik von 2,4-Dichlorbenzylalkohol noch von Amylmetacresol, außer einer Bioverfügbarkeitsstudie anderer Lutschtabletten mit diesen Wirkstoffen. Diese Studie ermittelte eine schnelle Freisetzung beider Antiseptika im Speichel, mit Erreichen des maximalen Levels innerhalb von 3–4 Minuten nach Lutschen der Tablette.

Nach 120 Minuten wurden im Speichel ca. 50% der verabreichten Menge von 2,4-Dichlorbenzylalkohol und Amylmetacresol gefunden.

Bei Patienten mit Myokardinfarkt (mit oder ohne Herzinsuffizienz) ist die Halbwertszeit von Lidocain und Monoethylglycinylidid (MEGX) erhöht; die Halbwertszeit von GX kann ebenfalls bei Patienten mit einer Herzinsuffizienz infolge eines Myokardinfarkts erhöht sein.

Eine erhöhte Halbwertszeit von Lidocain wurde auch bei Patienten mit kongestiver Herzinsuffizienz oder Lebererkrankung festgestellt und kann nach einer Dauerinfusion (i.v.) von mehr als 24 Stunden länger anhalten. Auch die Ausscheidung von MEGX

kann bei Patienten mit kongestiver Herzinsuffizienz vermindert sein.

Lidocain wird leicht über die Schleimhäute aufgenommen. Die Plasma-Eliminationshalbwertszeit beträgt ca. 2 Stunden. Einmal absorbiert unterliegt es einem signifikanten First-Pass-Metabolismus in der Leber und wird schnell zu dem aktiven Metaboliten Monoethylglycinylidid deethyliert, der dann zu verschiedenen Metaboliten hydrolysiert wird, einschließlich Glycinylidid. Weniger als 10% werden unverändert durch die Nieren ausgeschieden. Die Metaboliten werden ebenfalls in den Urin ausgeschieden.

5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Nichtklinische Daten bezüglich 2,4-Dichlorbenzylalkohol und Amylmetacresol ergaben kein besonderes Gefährdungspotenzial für den Menschen. Diese Daten stammen aus konventionellen Studien zur Toxizität von Einmal- und wiederholter Gaben, Genotoxizität und Reproduktionstoxizität. Studien zur Sicherheitspharmakologie und zum kanzerogenen Potenzial wurden nicht durchgeführt.

Genotoxizitätsstudien mit Lidocain waren negativ. Das kanzerogene Potenzial von Lidocain wurde nicht getestet. Der Lidocain-metabolit 2,6-Xylidin zeigte *in vitro* genotoxisches Potenzial. In einer Karzinogenitätsstudie mit Ratten, die *in utero*, nach der Geburt und während ihrer Lebensphase 2,6-Xylidin ausgesetzt waren, wurden Tumore der Nasenhöhle, subkutane Tumore und Lebertumore festgestellt. Die klinische Relevanz dieser Tumorbefunde in Bezug auf die Kurzzeit- bzw. sporadische Behandlung mit Lidocain ist nicht bekannt.

Tierstudien zur Reproduktionstoxizität ergaben keine Hinweise auf teratogene Effekte oder Anzeichen für Nebenwirkungen in Bezug auf die physische Entwicklung der Nachkommen nach einer pränatalen Behandlung mit Lidocain. Allerdings beeinflusste eine fetale Exposition von hohen Lidocain-Dosen den uterinen Blutfluss und verursachte fetale Krampfanfälle.

Ansonsten tragen die nicht-klinischen Daten bezüglich Lidocain keinerlei relevante Informationen zur bereits bestehenden klinischen Erfahrung bei.

6. Pharmazeutische Angaben

6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Minzöl, Chinolingelb (E 104), Saccharin-Natrium, Weinsäure (Ph.Eur.), Sucrose, Glucose-Sirup, Gelborange S (E 110), Zitronen-Aroma, Honig-Aroma.

6.2 Inkompatibilitäten

Nicht zutreffend.

6.3 Dauer der Haltbarkeit

27 Monate

6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Nicht über 30 °C lagern.

6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

PVC-PVCD/Aluminiumblister

Originalpackung mit 24 Lutschtabletten.

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Nicht verwendetes Arzneimittel oder Abfallmaterial ist entsprechend den nationalen Anforderungen zu beseitigen.

7. Inhaber der Zulassung

STADA GmbH
Stadastraße 2 – 18
61118 Bad Vilbel
Telefon: 06101 603-0
Telefax: 06101 603-259
Internet: www.stada.de

8. Zulassungsnummern

90493.00.00

9. Datum der Erteilung der Zulassung/ Verlängerung der Zulassung

16. September 2015

10. Stand der Information

Februar 2016

11. Verkaufsabgrenzung

Apothekenpflichtig

Diese Arzneimittel enthalten eine Zubereitung aus drei Stoffen, deren Wirkung in Kombination (Zur Symptomlinderung von Halsschmerzen bei Erwachsenen und Jugendlichen über 12 Jahren.) in der medizinischen Wissenschaft noch nicht allgemein bekannt ist.

Anforderung an:

Satz-Rechen-Zentrum Berlin

Fachinformationsdienst

Postfach 11 01 71

10831 Berlin