

Gebrauchsinformation und Fachinformation

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®

Zusammensetzung

1 ml Injektionslösung enthält:

Arzneilich wirksame Bestandteile

30,0 mg Prilocainhydrochlorid

0,03 I.E. Felypressin*

*Octapressin® Lizenz Sandoz AG, Basel

Sonstige Bestandteile

Natriumchlorid, Natriumhydroxid/Salzsäure zur pH-Wert-Einstellung, Wasser für Injektionszwecke

Darreichungsform und Inhalt

100 Zylinderampullen à 1,8 ml

Injektionslösung (mit Lochstopfen für das selbstaspirierende Injektionssystem)

Stoff- oder Indikationsgruppe oder Wirkungsweise

Lokalanästhetikum vom Säureamid-Typ mit Vasokonstriktorzusatz

Pharmazeutischer Unternehmer

DENTSPLY DeTrey GmbH

De-Trey-Str. 1

78467 Konstanz

Deutschland

Telefon: (07531) 5 83-0

Telefax: (07531) 5 83-104

www.dentsply.de

Hersteller

Pierrel Farmaceutici S.p.A.

Strada Statale Appia 46/48

81043 Capua

Italia

Anwendungsgebiete

Infiltrations- und Leitungsanästhesie in der Zahnheilkunde.

Mittellange zahnärztliche Routineeingriffe, z.B. Extraktionen, Amputationen und Extirpationen der Pulpa sowie Präparationen (Kronen, Brücken, Füllungen).

Gegenanzeigen

Wann darf Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® nicht angewendet werden?

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® darf nicht angewendet werden bei Patienten mit bekannter Überempfindlichkeit gegen Lokalanästhetika vom Amidtyp oder einen der sonstigen Bestandteile von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® sowie bei Patienten mit schwerer Störung des Reizbildungs- oder Reizleitungssystems am Herzen, schwerer Anämie, dekompensierter Herzinsuffizienz, kardiogenem und hypovolämischem Schock.

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® darf bei Kindern, die jünger als 6 Monate sind, nicht angewendet werden, da ein erhöhtes Risiko für das Auftreten einer Methämoglobinämie besteht.

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® ist kontraindiziert bei Patienten mit angeborener oder erworbener Methämoglobinämie sowie einem Mangel an Glucose-6-phosphatdehydrogenase.

Wann darf Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® nur mit besonderer Vorsicht angewendet werden?

Um gefährliche Nebenwirkungen zu vermeiden, darf Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® nur mit besonderer Vorsicht angewendet werden bei Patienten mit schweren Nieren- oder Leberfunktionsstörungen, Patienten mit Störungen der Blutgerinnung, Patienten mit Myasthenia gravis, Patienten mit partiellem oder vollständigem Herzblock, Patienten mit schwerer Anämie oder hochgradiger Herzdekompensation, älteren Patienten oder Patienten in schlechtem Allgemeinzustand.

Lokalanästhetika, wie Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®, sollten nicht in infizierten Arealen angewendet werden.

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® kann eine durch andere Arzneimittel (z.B. Sulfonamide, Phenobarbital, Phenytoin, Nitrite und Nitrate, Antimalariamittel) verursachte Methämoglobinbildung verstärken. Daher muss die Anwendung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® bei gleichzeitiger Anwendung dieser Arzneimittel besonders sorgfältig überwacht werden.

Was muss in der Schwangerschaft und Stillzeit beachtet werden?

Es liegen keine hinreichenden Daten für die Verwendung von Prilocain und Felypressin bei Schwangeren vor. Prilocain ist plazentagängig. Es ist nicht bekannt, ob Felypressin plazentagängig ist.

Tierversuche haben eine Reproduktionstoxizität von Prilocain gezeigt (siehe "Toxikologische Eigenschaften"). Nach versehentlicher intravasaler Applikation bei einer Mutter kann es durch den Felypressinanteil zu einer Verminderung der Uterusdurchblutung kommen. Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® darf daher in der Schwangerschaft nur nach strenger Indikationsstellung angewendet werden.

Es ist nicht bekannt, ob Prilocain oder Felypressin in die Muttermilch übertreten. Daher darf Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® in der Stillzeit nur nach strenger Indikationsstellung angewendet werden. Sollte eine Anwendung in der Stillzeit erforderlich sein, sollte das Stillen erst 24 Stunden nach der Behandlung wieder aufgenommen werden

Was ist bei Kindern und älteren Menschen zu berücksichtigen?

Bei Kindern, älteren Patienten und Patienten mit reduziertem Allgemeinzustand wird die Dosis dem Körpergewicht und dem Körperzustand angepasst (siehe "Dosierung").

Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung und Warnhinweise

Welche Vorsichtsmaßnahmen müssen beachtet werden?

Zur sicheren und wirksamen Anwendung von Lokalanästhetika sind die richtige Dosierung, die korrekte Injektionstechnik und bestimmte Sicherheitsvorkehrungen, sowie das Bereithalten von Notfallinstrumentarium unabdingbar. Intravasale Fehlapplikation ist zu vermeiden (vgl. Abschnitt "Dosierungsanleitung, Art und Dauer der Anwendung").

Patienten sollten darauf aufmerksam gemacht werden, dass Lippen, Zunge und Backentaschen noch einige Zeit nach dem Eingriff betäubt sind. Deshalb sollte Nahrung erst dann zu sich genommen werden, wenn die Betäubung vollständig abgeklungen ist.

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® sollte immer dann mit besonderer Vorsicht angewendet werden, wenn sich durch Sympathomimetika eine Verschlechterung der Kreislaufsituation ergeben kann. Dies ist z.B. der Fall bei schwerem oder unbehandeltem Bluthochdruck, schlecht kontrollierbarer Thyreotoxikose (schwerste Überfunktion der Schilddrüse), ischämischen Herzerkrankungen (Angina pectoris), paroxysmaler Tachykardie

oder hochfrequenter absoluter Arrhythmie, cerebrovaskulärer Insuffizienz, Engwinkelglaukom, Phäochromozytom oder fortgeschrittenem Diabetes.

Was müssen Sie im Straßenverkehr sowie beim Arbeiten mit Maschinen und bei Arbeiten ohne sicheren Halt beachten?

Bei Anwendung dieses Arzneimittels muss vom Zahnarzt im Einzelfall entschieden werden, ob der Patient aktiv am Straßenverkehr teilnehmen oder Maschinen bedienen darf.

Wechselwirkung mit anderen Mitteln

Welche anderen Arzneimittel beeinflussen die Wirkung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®?

Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® kann eine durch andere Arzneimittel (wie Sulfonamide, Antimalariamittel, bestimmte Nitrate) verursachte Methämoglobin-Bildung verstärken.

Bei Patienten, die gleichzeitig andere Lokalanästhetika oder strukturverwandte Substanzen (z.B. bestimmte Antiarrhythmika) erhalten, muss Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® besonders vorsichtig verwendet werden, da sich in diesen Fällen die unerwünschten Wirkungen addieren können.

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

Durch Felypressin wird die Toxizität von Prilocain nicht erhöht.

Beachten Sie bitte, dass diese Angaben auch für vor kurzem angewendete Arzneimittel gelten können.

Wichtige Inkompatibilitäten

Die Zylinderampullen dürfen nicht autoklaviert werden und auch nicht vollständig in Desinfektionslösung getaucht werden.

Dosierungsanleitung, Art und Dauer der Anwendung

In welcher Dosierung und wie oft sollte Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® angewendet werden?

Lokalanästhetika müssen für jeden Patienten individuell dosiert werden. Dabei darf niemals der Grundsatz vergessen werden, dass immer nur die kleinste Dosis gegeben werden darf, mit der eine ausreichende Anästhesie erreicht wird. Die von uns empfohlenen Dosen gelten für Erwachsene mit normalem Körpergewicht (70 kg).

Der die Anästhesie durchführende Zahnarzt legt die Dosierung entsprechend den Besonderheiten des Einzelfalles fest. Ältere Patienten und Patienten mit reduziertem Allgemeinzustand erhalten geringere Dosen.

Es gelten folgende Dosierungsrichtlinien:

Erwachsene

Indikationen	Dosierung (ml)
Infiltrationsanästhesie	0,5 – 1,5 ml
Leitungsanästhesie	1,5 – 2,0 ml

Im Allgemeinen beträgt die empfohlene Maximaldosis 180 mg Prilocainhydrochlorid (= 6 ml Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®).

Kinder

Die Dosis sollte bei Kindern unter 10 Jahren 30 – 60 mg Prilocainhydrochlorid (= 1 – 2 ml Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®) nicht überschreiten.

Wie und wann sollte Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® angewendet werden?

Grundsätzlich ist zu beachten:

1. Dosierung so niedrig wie möglich wählen!
2. Richtige Kanüle benutzen!
3. Zur Vermeidung einer intravasalen Injektion ist stets eine Aspirationskontrolle in zwei Ebenen (Drehung der Kanüle um 180°) vorzunehmen. Danach langsam injizieren!
4. Nicht in infizierte Bezirke injizieren!
5. Bei größeren Eingriffen Blutdruck kontrollieren!
6. Allgemeine und spezielle Kontraindikationen für die verschiedenen Lokal- und Regionalanästhesieverfahren beachten!
7. Felypressinhaltige Lösungen dürfen nicht sterilisiert werden!
8. Die Zylinderampullen und Stopfen sollten vor Anwendung mit einem mit Desinfektionsmittel getränkten Tuch gereinigt werden. Die Zylinderampullen nicht vollständig in Desinfektionslösung eintauchen!

Vorsicht: Niemals Kanüle in angebrochenen Lösungen belassen!

Vor der Applikation eines Lokalanästhetikums ist darauf zu achten, dass das Instrumentarium zur Wiederbelebung wie z.B. zum Freihalten der Atemwege sowie zur Sauerstoffzufuhr und die Notfallmedikation zur Therapie toxischer Reaktionen sofort verfügbar sind.

Wie lange sollte Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® angewendet werden?

Die Dauer der Anwendung bestimmt der behandelnde Zahnarzt.

Überdosierung und andere Anwendungsfehler

Was ist zu tun, wenn Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® versehentlich in zu großen Mengen oder in ungeeigneter Art und Weise angewendet wurde ?

Neurologische Symptome bis hin zu generalisierten zerebralen Krampfanfällen können als Folge einer unbeabsichtigten intravasalen Applikation oder bei abnormen Resorptions-verhältnissen auftreten. Intoxikationserscheinungen von Lokalanästhetika sind sowohl in ihrem Erscheinungsbild als auch in ihrer Behandlung unabhängig vom injizierten Präparat.

Die Zeichen einer Überdosierung lassen sich zwei qualitativ unterschiedlichen Symptomkomplexen zuordnen und unter Berücksichtigung der Intensitätsstärke gliedern:

- Zentralnervöse Symptome

Leichte Intoxikation:

Kribbeln in den Lippen und der Zunge, Taubheit im Mundbereich, Ohrensausen, metallischer Geschmack, Angst, Unruhe, Zittern, Muskelzuckungen, Erbrechen, Desorientiertheit.

Mittelschwere Intoxikation:

Sprachstörung, Benommenheit, Übelkeit, Erbrechen, Schwindel, Schläfrigkeit, Verwirrtheit, Zittern, choreiforme Bewegungen (bestimmte Form von Bewegungsunruhe), Krämpfe (tonisch-klonisch), weite Pupillenöffnung, beschleunigte

Atmung.

Schwere Intoxikation:

Erbrechen (Erstickungsgefahr), Schließmuskellähmung, Muskeltonusverlust, Reaktions- und Bewegungslosigkeit (Stupor), irreguläre Atmung, Atemstillstand, Koma, Tod.

- *Kardiovaskuläre Symptome*

Leichte Intoxikation:

Herzklopfen, erhöhter Blutdruck, beschleunigte Herzrate, beschleunigte Atmung.

Mittelschwere Intoxikation:

Beschleunigter Herzschlag, Herzrhythmusstörungen (Arrhythmie), Sauerstoffmangel, Blässe.

Schwere Intoxikation:

Starke Sauerstoffunterversorgung (schwere Zyanose), Herzrhythmusstörungen (verlangsamter Herzschlag, Blutdruckabfall, primäres Herzversagen, Kammerflimmern, Asystolie).

Es sind die folgenden Gegenmaßnahmen erforderlich:

- Sofortige Unterbrechung der Zufuhr von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®.
- Freihalten der Atemwege.
- Zusätzlich Sauerstoff zuführen; falls notwendig mit reinem Sauerstoff assistiert oder kontrolliert beatmen (zunächst über Maske und mit Beatmungsbeutel, dann erst über einen Trachealtubus). Die Sauerstofftherapie darf nicht bereits bei Abklingen der Symptome, sondern erst dann abgesetzt werden, wenn alle Vitalfunktionen zur Norm zurückgekehrt sind.
- Sorgfältige Kontrolle von Blutdruck, Puls und Pupillenweite.

Weitere mögliche Gegenmaßnahmen sind:

- Bei einem akuten und bedrohlichen Blutdruckabfall sollte unverzüglich eine Flachlagerung des Patienten mit Hochlagerung der Beine erfolgen und ein Beta-Sympathomimetikum langsam intravenös injiziert werden (z. B. 10 bis 20 Tropfen einer Lösung von 1 mg Isoprenalin in 200 ml Glukoselösung 5 %). Zusätzlich ist eine Volumensubstitution vorzunehmen (z. B. mit kristalloiden Lösungen).
- Bei erhöhtem Vagotonus (Bradykardie) wird Atropin (0,5 bis 1,0 mg i.v.) verabreicht. Bei Verdacht auf Herzstillstand sind die erforderlichen Maßnahmen durchzuführen.
- Konvulsionen werden mit kleinen, wiederholt verabreichten Dosen ultrakurz-wirkender Barbiturate (z. B. Thiopental-Natrium 25 bis 50 mg) oder mit Diazepam 5 bis 10 mg i.v. behandelt; dabei werden die Dosen fraktioniert bis zum Zeitpunkt der sicheren Kontrolle verabreicht.

Grundsätzlich ist darauf hinzuweisen, dass in vielen Fällen bei Anzeichen von Krämpfen die obligate Sauerstoffbeatmung zur Behandlung ausreicht.

Bei anhaltenden Krämpfen werden Thiopental-Natrium (250 mg) und ein kurzwirksames Muskelrelaxans verabreicht, und nach Intubation wird mit 100 % Sauerstoff beatmet.

Die Krampfschwellendosis kann beim Menschen individuell unterschiedlich sein.

Bei schweren Zwischenfällen ist es immer ratsam, zur Behandlung des Patienten einen Facharzt für Anästhesie und Wiederbelebung hinzuzuziehen.

Was müssen Sie beachten, wenn Sie zu wenig Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® angewendet oder eine Anwendung vergessen haben?

Die Behandlung wird nach den Maßgaben des Zahnarztes weitergeführt.

Was müssen Sie beachten, wenn Sie die Behandlung unterbrechen oder vorzeitig beenden?

Es sind keine Besonderheiten zu beachten.

Nebenwirkungen

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Häufigkeitsangaben zugrunde gelegt:

Sehr häufig:	mehr als 1 von 10 Behandelten
Häufig:	weniger als 1 von 10, aber mehr als 1 von 100 Behandelten
Gelegentlich:	weniger als 1 von 100, aber mehr als 1 von 1000 Behandelten
Selten:	weniger als 1 von 1000, aber mehr als 1 von 10 000 Behandelten
Sehr selten:	weniger als 1 von 10 000 Behandelten, oder unbekannt

Welche Nebenwirkungen können bei der Anwendung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® auftreten?

Die möglichen Nebenwirkungen nach Anwendung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® entsprechen weitgehend denen anderer Lokalanästhetika vom Säureamid-Typ. Trotz der erwiesenen hohen klinischen Toleranz von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® sind nach Überschreiten eines kritischen Blutspiegels toxische Nebenwirkungen nicht auszuschließen. Diese Nebenwirkungen sind methodisch (aufgrund der Anwendung) pharmakodynamisch oder pharmakokinetisch bedingt und betreffen das Zentralnerven- und das Herzkreislaufsystem.

Die sicherste Prophylaxe besteht in der genauen Einhaltung der empfohlenen Dosierung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin®, deren Wirkung unbedingt ärztlich überwacht werden muss (visueller und verbaler Patientenkontakt) sowie in sorgfältigem Aspirieren vor Injektion der Lösung.

- Methodisch bedingt

Infolge der Injektion zu großer Lösungsmengen.

Durch unbeabsichtigte Injektion in ein Blutgefäß.

Die technikabhängigen Nebenwirkungen der verschiedenen Lokal- und Regionalanästhesieverfahren sollten den entsprechenden Standardwerken entnommen werden.

- Pharmakodynamisch bedingt

In seltenen Fällen kann bei empfindlichen Patienten eine allergische Reaktion bis hin zum anaphylaktischen Schock auf Prilocainhydrochlorid oder auf einen der sonstigen Bestandteile von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® auftreten.

- Pharmakokinetisch bedingt

Als mögliche Ursache für Nebenwirkungen müssen auch eventuelle abnorme Resorptionsverhältnisse oder Störungen beim Abbau in der Leber oder bei der Ausscheidung durch die Niere in Betracht gezogen werden.

Ein Abbauprodukt des Prilocains, o-Toluidin, ist ein Methämoglobinbildner. Nach Anwendung von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® kann daher der physiologische Methämoglobinwert vorübergehend geringfügig ansteigen, wenn die applizierte Menge von Prilocain 600 mg oder mehr beträgt. Dies kann in vereinzelt Fällen zu einer leichten Zyanose (Blaufärbung der Haut) führen. Die Methämoglobinbildung ist klinisch ohne Bedeutung und wäre nur bei schwerster Anämie und hochgradiger Herzdekompensation zu beachten. Eine bereits manifestierte Methämoglobinbildung verschwindet 15 Minuten nach i.v.-Injektion von 2 - 4 mg/kg Körpergewicht Toluidinblau.

Wenn Sie Nebenwirkungen bei sich beobachten, die nicht in dieser Gebrauchsinformation aufgeführt sind, teilen Sie diese bitte Ihrem Zahnarzt, Arzt oder Apotheker mit.

Welche Gegenmaßnahmen sind bei Nebenwirkungen zu ergreifen?

Die Behandlung schwerer Intoxikationen besteht in Sicherung und Freihalten der Atemwege, Unterstützung der Atmung mit Sauerstoff und, falls notwendig, auch assistierter und kontrollierter Beatmung.

Beim Auftreten einer Kreislaufschwäche sollte ein blutdruckerhöhendes Präparat, am besten eines mit positiv inotroper Wirkung, intravenös verabreicht werden.

Bei allergischer Reaktion auf den Wirkstoff oder einen der sonstigen Bestandteile ist die Zufuhr von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® sofort abzubrechen.

Hinweis und Angaben zur Haltbarkeit des Arzneimittels

Die Haltbarkeit von Xylonest® 3% DENTAL mit Octapressin® beträgt 3 Jahre. Das Verfallsdatum dieser Packung ist auf den Zylinderampullen sowie auf der äußeren Umhüllung aufgedruckt.

Verwenden Sie diese Packung nicht mehr nach diesem Datum!

Der Inhalt der Zylinderampullen ist nur zum einmaligen Gebrauch bestimmt.

Nicht über 25°C lagern und vor Licht geschützt lagern.

Arzneimittel für Kinder unzugänglich aufbewahren!

Stand der Information

01/2007

Zusätzliche Information für Fachkreise

Verschreibungspflichtig

Pharmakologische und toxikologische Eigenschaften, Pharmakokinetik und Bioverfügbarkeit, soweit diese Angaben für die therapeutische Wirkung erforderlich sind

Pharmakologische Eigenschaften

Prilocain ist ein Lokalanästhetikum vom Säureamid-Typ.

Prilocain hemmt die Funktion erregbarer Strukturen (z.B. alle Typen von Nervenfasern (sensorische, motorische, autonome Nervenfasern)). Es hebt reversibel und örtlich begrenzt die Erregbarkeit der schmerzvermittelnden sensiblen Endorgane und das Leitungsvermögen der sensiblen Nervenfasern auf, das Schmerzempfinden ist herabgesetzt, in weiterer Reihenfolge auch Kälte- bzw. Wärme-, Berührungs- und Druckempfinden. Prilocain setzt durch Blockade der spannungsabhängigen Na⁺- Kanäle die Membranpermeabilität für Natrium herab. Dies führt konzentrationsabhängig zu einer verminderten Erregbarkeit der Nervenfasern, da der zur Ausbildung des Aktionspotentials notwendige plötzliche Anstieg der Natriumpermeabilität vermindert ist. Die Wirkung ist vom pH-Wert der Substanz und dem pH-Wert des Milieus abhängig. Die lokalanästhetische Wirkung beruht auf der protonierten Form. Im entzündeten Gewebe ist die Wirkung des Lokalanästhetikums wegen des dort niedrigeren pH-Werts herabgesetzt.

Zur Wirkungsverlängerung wird der Vasokonstriktor Felypressin (Octapressin®) zugesetzt. Felypressin ist ein synthetisches Analogon des körpereigenen Hormons Vasopressin und weist diesem gegenüber eine ähnliche vasokonstriktorische, aber eine geringere diuresehemmende Wirksamkeit auf. Durch die Vasokonstriktion wird Prilocain langsamer in den Intravasalraum aufgenommen und steht damit länger und in höherer Konzentration am Wirkort und im Gewebe zur Verfügung.

Toxikologische Eigenschaften

Zeichen der akuten Toxizität von Prilocain beim Tier sind Aktivitätsabnahme, Krämpfe, Atemnot, Zyanose und Tod durch Herzversagen.

Subkutane Injektion von 3 ml/kg Körpergewicht Prilocainhydrochlorid führte bei Ratten zu reversiblen lokalen Nekrosen. In gleicher Dosierung wurden bei Affen keine Schädigungen beobachtet.

Gabe von 60 mg/kg Körpergewicht Prilocain 5 Tage die Woche über 7 Wochen führte bei Ratten zu leichter Gewichtsabnahme.

Prilocain zeigte in Mutagenitätstests keine mutagenen Wirkungen. Hinweise auf ein mutagenes Potential beruhen auf Erkenntnissen zum Metaboliten o-Toluidin, der in verschiedenen Testsystemen *in vitro* Veränderungen des Erbmateriale und des Zellwachstums bewirkte (Chromosomenmutationen, Aneuploidien, DNA-Reparatur, Zelltransformation).

Kanzerogenitätsstudien an Ratten und Mäusen mit hohen Dosen des Metaboliten o-Toluidin zeigten erhöhte Tumorfrequenzen in Milz und Harnblase.

Eine Bedeutung beider Befunde scheint für die Menschen unter kurz dauernder therapeutischer Anwendung von Prilocain nicht gegeben zu sein, jedoch sollten aus Sicherheitsgründen hoch dosierte Gaben über längere Zeiträume unterbleiben.

Felypressin ist eng verwandt mit dem körpereigenen Peptid-Hormon Vasopressin. Aufgrund der Aminosäurezusammensetzung und Peptidstruktur ist keine mutagene oder kanzerogene Wirkung von Felypressin zu erwarten.

Prilocain hatte keinen Einfluss auf die Fertilität männlicher und weiblicher Ratten. Die postnatale Überlebensrate der Nachkommen behandelter Muttertiere war jedoch erniedrigt. In einer Embryotoxizitätsstudie an der Ratte kam es zu fetoletalen Effekten, und in den Feten traten dosisabhängig Hydronephrosen auf.

Felypressin wurde reproduktionstoxikologisch nicht untersucht.

In einer Studie mit der Kombination von Prilocain und Felypressin mit s.c.-Gabe der etwa 10fachen humantherapeutischen Dosis an Kaninchen, die heutigen Standards nicht entspricht, wurden keine embryolethalen oder teratogenen Wirkungen beobachtet.

Pharmakokinetik

Die Plasmakonzentration ist abhängig von der angewandten Technik der Regionalanästhesie. Die Plasmahalbwertszeit nach der Resorption einer epiduralen Gabe von 600 mg Prilocain beträgt 1,5 Stunden. Die Plasmaeiweißbindung beträgt ca. 55%.

Gegenwärtig liegen keine Informationen über die Pharmakokinetik von Felypressin vor, aber es wird vermutet, dass es rasch zu einzelnen Aminosäuren abgebaut wird.

Bioverfügbarkeit

Die biologische Verfügbarkeit von Prilocain am Applikationsort beträgt 100%.