

1. Bezeichnung des Arzneimittels

Fenistil® Gel
Dimetindenmaleat 1 mg/g

2. Qualitative und quantitative Zusammensetzung

1 g Fenistil Gel enthält 1 mg Dimetindenmaleat.

Enthält Methyl-4-hydroxybenzoat (Paraben) als Konservierungsmittel und Propylenglycol.

Die vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile siehe Abschnitt 6.1.

3. Darreichungsform

Gel
Geruch- und farbloses Gel

4. Klinische Angaben

4.1 Anwendungsgebiete

Zur kurzfristigen Linderung von Juckreiz bei kleinen juckenden Insektenstichen auf intakter Haut.

Juckreiz bei Hauterkrankungen wie chronischem Ekzem, Urtikaria und andere allergisch bedingte Hautkrankheiten; Verbrennungen 1. Grades, Sonnenbrand.

4.2 Dosierung, Art und Dauer der Anwendung

Bis zu 3-mal täglich dünn auf die betroffenen Hautstellen auftragen und leicht verreiben.

Zur Anwendung auf der Haut.

Verbände sollten nicht angelegt werden.

4.3 Gegenanzeigen

- Überempfindlichkeit gegenüber Dimetindenmaleat, Methyl-4-hydroxybenzoat oder einem der sonstigen Bestandteile.
- zur großflächigen Anwendung.
- auf geschädigter Haut.

4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Umfangreich behandelte Hautareale nicht über längere Zeit direktem Sonnenlicht aussetzen.

Das Präparat ist nicht zur Anwendung auf großen, insbesondere verletzten oder entzündeten Hautflächen vorgesehen, dies gilt speziell für Säuglinge und Kleinkinder.

Zur Therapie von bekannter Insektengiftallergie stehen systemische Darreichungsformen zur Verfügung.

Methyl-4-hydroxybenzoat (E 218) kann Überempfindlichkeitsreaktionen, auch Spätreaktionen, hervorrufen.

Propylenglycol kann Hautreizungen hervorrufen.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Studien zu Wechselwirkungen wurden nicht durchgeführt. Da jedoch die systemische Absorption von Dimetindenmaleat bei topischer Anwendung sehr gering ist, sind solche Wechselwirkungen sehr unwahrscheinlich.

4.6 Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Schwangerschaft
Tierversuche mit Dimetinden ergaben kein teratogenes Potential, noch weisen sie auf direkte oder indirekte schädliche Effekte hinsichtlich Schwangerschaft, embryonale bzw. fötale Entwicklung, Entbindung oder postnatale Entwicklung hin (siehe Abschnitt 5.3).

Fenistil Gel sollte während der Schwangerschaft nicht auf großflächige Hautareale aufgetragen werden, vor allem nicht auf verletzte oder entzündete Haut.

Stillzeit
Für den Menschen liegen keine ausreichenden Erfahrungen mit der Anwendung in der Stillzeit vor. Dimetinden geht bei der Ratte in die Milch über, nach topischer Anwendung ist jedoch nur mit einer geringen systemischen Verfügbarkeit zu rechnen.

Stillende sollten das Präparat nicht großflächig, vor allem nicht auf verletzte oder entzündete Haut, auftragen und nicht an der Brustwarze anwenden.

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

Keine bekannt.

4.8 Nebenwirkungen

Die am häufigsten berichteten Nebenwirkungen während der Behandlung sind leichte und vorübergehende Hautreaktionen an der Auftragstelle.

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Kategorien zugrunde gelegt:

- Sehr häufig (≥ 1/10)
- Häufig (≥ 1/100 bis < 1/10)
- Gelegentlich (≥ 1/1.000 bis < 1/100)
- Selten (≥ 1/10.000 bis < 1/1.000)
- Sehr selten (< 1/10.000)

Nicht bekannt (Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar)

Erkrankungen der Haut und des Unterhautzellgewebes
Gelegentlich: Trockenheit der Haut und Brennen auf der Haut.

Die nachfolgend genannte Häufigkeit wurde mit Hilfe des Spontanmeldesystems geschätzt:

Sehr selten: allergische Dermatitis.

Methyl-4-hydroxybenzoat (E 218) kann Überempfindlichkeitsreaktionen, auch Spätreaktionen, hervorrufen.

4.9 Überdosierung

a) Symptome der Intoxikation

Bei versehentlicher oraler Aufnahme großer Gelmengen oder bei längerfristiger, großflächiger lokaler Anwendung unter erleichterten Resorptionsbedingungen (Okklusion, geschädigte Haut) können Vergiftungssymptome wie bei Überdosierung der oralen und parenteralen Formen nicht ausgeschlossen werden.

Die Vergiftung verläuft dreiphasig: Sedation, Erregung, Koma mit kardio-respiratorischer Insuffizienz.

Beim Kind sind die zentral erregenden und anticholinergen Wirkungen deutlicher ausgeprägt als beim Erwachsenen.

Vergiftungsbild

Sedierung, Mattigkeit, Schwindelgefühl, Kopfschmerzen, Ohrensausen, teilweise Blässe; auch rotes, geschwollenes Gesicht.

Gastrointestinale Erscheinungen wie Obstipation, Diarrhoe, Erbrechen, Übelkeit. Mundtrockenheit, Miktionshemmung, Blutdruckabfall oder -anstieg, Muskelzittern, Reflexsteigerung, in anderen Fällen Reflexabschwächung. Mydriasis, träge Pupillenreaktion, verschwommenes Sehen.

Bei Kleinkindern und Kindern zentralnervöse Symptome. Exzitation evtl. mit Halluzinationen möglich, Desorientiertheit, Unkoordiniertheit, Muskelzuckungen, Hyperpyrexie, tonisch-klonische Krämpfe möglich. Bei großen Dosen: Koma, Herz- und Kreislaufversagen.

b) Therapie bei Intoxikationen

Bei Intoxikationen sollte eine symptomatische Behandlung eingeleitet werden, wobei insbesondere auf Stabilisierung der Atmung und des Herz-Kreislauf-Systems geachtet werden muss.

Allgemeine Richtlinien für die Behandlung
Wenn frühzeitige Dekontamination möglich: Gabe von Ipecacuanha-Sirup, sonst Magenspülung, anschließend Gabe von Kohle und Glaubersalz, symptomatische Therapie, bei Exzitation und Krämpfen Diazepam-Gabe.

Antidote und spezielle Möglichkeiten der Gifentfernung
Weder die forcierte Diurese noch die Peritoneal- oder Hämodialyse fördern die Ausscheidung in nennenswertem Maß.

Ein spezifisches Antidot ist nicht bekannt.

Bei Koma und Krämpfen kann Physostigminsalicylat versucht werden.

Besonders zu beachten:
Bei dem sehr seltenen hyperkinetischen Syndrom (extrapyramidale Symptomatik) ist Gabe von Biperidenlactat 0,04 mg/kg i.m. oder sehr langsam i.v. in 5%iger Traubenzuckerlösung angezeigt.

5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Antihistaminika zur topischen Anwendung
ATC-Code: D04AA13

Fenistil Gel wirkt durch das enthaltene Antihistaminikum Dimetindenmaleat und den Kühleffekt der Hydrogel-Formulierung Juckreiz lindernd. Der Kühleffekt führt zu einer kurzfristigen Juckreizstillung. Die Hemmung der Histaminwirkung durch Dimetindenmaleat setzt nach wenigen Minuten ein und erreicht ihr Maximum nach 1 bis 4 Stunden.

Aufgrund der lokalen Anwendung auf der Haut werden die bekannten unten aufgeführten Wirkungen von Dimetindenmaleat relativiert.

Dimetindenmaleat, ein Pheninden-Derivat, ist ein Histaminrezeptorantagonist vom H₁-Typ und hemmt in vitro und in vivo die durch H₁-Rezeptoren vermittelten Histamin-

wirkungen. Dimetindenmaleat aktiviert in niedrigen Konzentrationsbereichen (10^{-5} mol/l) den Abbau von Histamin durch Stimulation der Histaminmethyltransferase. Das Enzym wird in höheren Konzentrationen (ab 5×10^{-4} mol/l) gehemmt. Die durch Histamin ausgelösten Kreislaufwirkungen werden, soweit H_1 -Rezeptoren betroffen sind, antagonistisch durch Dimetindenmaleat beeinflusst.

Hierzu gehören der durch Histamin auslösbare Blutdruckabfall, der Rückgang des gesamten peripheren Widerstandes, des Blutflusses in der Arteria hepatica und des Widerstandes in der Mesenterial-Arterie sowie die Erhöhung des Blutdrucks in der Portalvene. Neben der Hemmung histamin-induzierter Reaktionen wurde bei höheren Konzentrationen auch eine antagonistische Aktivität von Dimetindenmaleat gegenüber Bradykinin, Serotonin und Acetylcholin beobachtet.

Als Vertreter der H_1 -Rezeptor-Antagonisten hat Dimetindenmaleat keinen Einfluss auf die durch Histamin erhöhte Magensaftsekretion.

Gegenüber der in manchen Fällen beobachtbaren sedierenden Potenz der H_1 -Rezeptor-Antagonisten entwickelt sich im Falle des Dimetindenmaleats in kurzer Zeit (1–2 Tage) Toleranz, so dass eine dauerhafte Beeinträchtigung der Vigilanz etc. nicht erwartet werden muss.

In Kombination mit einem H_2 -Rezeptor-Antagonisten kann Fenistil durch Histaminfreisetzung ausgelöste klinische Reaktionen vermeiden.

In vitro konnte gezeigt werden, dass Dimetindenmaleat die Freisetzung von Histamin aus Mastzellen hemmt.

Bei topischer Applikation zeigt Dimetindenmaleat lokalanästhetische Eigenschaften. Für Personen unter 16 Jahren liegen keine klinischen Studien vor.

5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Fenistil Gel dringt schnell in die Haut ein. Die Hemmung der Histaminwirkung setzt nach wenigen Minuten ein und erreicht ihr Maximum nach 1 bis 4 Stunden.

Der Vergleich der wirksamen Dosierungen im pharmakologischen Experiment bei parenteraler und oraler Verabreichung läßt eine gute Resorption des Wirkstoffes erwarten.

Verabreichung von 0,25 mg/kg KG p.o. beim Hund führt zur Erzielung maximaler Blutkonzentration in weniger als einer Stunde. Zwischen der ersten und der vierten Stunde werden 2,5 µg/ml/h eliminiert, nach intravenöser Gabe der gleichen Dosierung werden nach einer Stunde Blutspiegel von 40 µg/ml verglichen mit 9 µg/ml bei oraler Gabe erreicht.

Die Eliminationskinetik erfolgt in den ersten vier Stunden einer Reaktion erster Ordnung mit einer Geschwindigkeitskonstante von 0,5 bis $0,62 \text{ h}^{-1}$. Dimetindenmaleat wird zum Teil unverändert im Harn ausgeschieden.

Die geringen Dosierungen und die analytischen Limitationen schränken die Erhebung der traditionellen pharmakokinetischen Pa-

rameter mit großer Genauigkeit ein. Die systemische Verfügbarkeit von Dimetindenmaleat nach Gabe von Fenistil Tropfen beträgt etwa 70%. Maximale Blutspiegel werden aber bei unretardierten Formen nach oraler Applikation innerhalb von 1–2 h erreicht. Die Plasmaproteinbindung beträgt etwa 90% im Konzentrationsbereich von 0,2–5 µMol. Die Serumclearance nach intravenöser Applikation und damit die Verteilung in die Gewebe ist ein sehr schneller Prozeß. Die Serumgehalte an Dimetindenmaleat fallen innerhalb von 25 Minuten um ca. den Faktor 100. Die Metabolisierung führt zur Hydroxylierung und Methoxylierung von Dimetinden. Der Wirkstoff sowie auch die Metaboliten werden sowohl biliär als auch renal ausgeschieden. Die mit dem Harn eliminierte Fraktion von Dimetinden hängt aufgrund der basischen Natur der Substanz im Wesentlichen vom pH-Wert des Harnes ab. Nach intravenöser Applikation werden ca. 9 % der Dosis renal eliminiert. Die Werte für die orale Applikation liegen etwas niedriger, aber in der gleichen Größenordnung.

Die Eliminationshalbwertszeit beträgt nach intravenöser Gabe sowie Verabreichung oraler, nichtretardierter Formen im Mittel 6,3 Stunden.

Der Hauptmetabolit von Dimetindenmaleat nach Inkubation in vitro mit Lebermikrosomen verschiedener Säugetierspezies (einschließlich Mensch) konnte als 6-Hydroxydimetinden charakterisiert werden. Dieser Metabolit wurde auch im menschlichen Harn gefunden.

Zusätzlich in geringer Menge auftretende Metaboliten konnten als am Phenylyring des Indenteils substituiertes Methoxy-, Dihydroxy- und Hydroxymethoxydimetinden identifiziert werden.

5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Präklinische Daten zum Wirkstoff wiesen gemäß herkömmlichen Studien zur Sicherheit, Pharmakologie, Toxizität bei wiederholter Verabreichung und Gentoxizität keine besonderen Gefahren für den Menschen auf. Bei Ratten und Kaninchen wurde keine teratogene Wirkung beobachtet. Dimetinden zeigte bei Ratten weder einen Einfluss auf die Fertilität noch die peri- und postnatale Entwicklung der Nachkommen bei Dosen 250mal höher als beim Menschen.

Mutagenität/Kanzerogenität

Prüfungen auf tumorigene Wirkung (Kanzerogenitätsstudien) wurden mit Dimetinden nicht durchgeführt.

Mutagenitätsuntersuchungen in vivo und in vitro verliefen negativ.

6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Gereinigtes Wasser; Propylenglycol; Carbowmer 980; Natriumhydroxid; Methyl-4-hydroxybenzoat (E 218)(Parabene).

6.2 Inkompatibilitäten

Keine bekannt.

6.3 Dauer der Haltbarkeit

Die Dauer der Haltbarkeit beträgt im ungeöffneten Behältnis 3 Jahre.

Nach Anbruch ist Fenistil Gel 6 Monate haltbar.

Dieses Arzneimittel soll nach Ablauf des Verfalldatums nicht mehr angewendet werden.

6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Keine.

6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

Farbloses Gel in einer Aluminiumtube.

Packungsgrößen:

20 g

50 g

100 g

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Keine besonderen Anforderungen.

7. Inhaber der Zulassung

Novartis Consumer Health GmbH
81366 München

Novartis Consumer Health GmbH
Zielstattstr. 40

81379 München

Telefon: (089) 78 77-0

Telefax: (089) 78 77-444

Email:

medical.contactcenter@novartis.com

8. Zulassungsnummer

Reg-Nr. 48 646

9. Stand der Information

Dezember 2011

10. Verkaufsabgrenzung

Apothekenpflichtig

A54-0

Zentrale Anforderung an:

Rote Liste Service GmbH

FachInfo-Service

Postfach 11 01 71

10831 Berlin