

1. Bezeichnung des Arzneimittels

Fenistil® Gel

**2. Verschreibungsstatus/
Apothekenpflicht**

Apothekenpflichtig

3. Zusammensetzung des Arzneimittels

3.1 Stoff- oder Indikationsgruppe

Antiallergikum

3.2 Arzneilich wirksame Bestandteile

1 g Gel enthält 1 mg Dimetindenmaleat

3.3 Sonstige Bestandteile

Gereinigtes Wasser; Propylenglykol; Carbo-mer 980; Natriumhydroxid; Methyl-4-hydroxybenzoat
Enthält Methyl-4-hydroxybenzoat (Paraben) als Konservierungsmittel.

4. 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.

5. Gegenanzeigen

Das Präparat darf nicht angewendet werden bei:
– Überempfindlichkeit gegenüber Dimetindenmaleat, Methyl-4-hydroxybenzoat oder einen der sonstigen Bestandteile.
– bekannter Insektengiftallergie.

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

Schwangerschaft/Stillzeit:

Aus grundsätzlichen medizinischen Erwägungen sollte das Präparat in den ersten drei Schwangerschaftsmonaten nicht eingesetzt und danach äußerst sparsam angewendet werden, obwohl keine Anhaltspunkte für eine fruchtschädigende Wirkung bestehen.
Stillende sollten das Präparat nicht an den Brustwarzen anwenden.

6. Nebenwirkungen

Gelegentlich können leichte vorübergehende, lokale Hautreaktionen wie Trockenheit oder Brennen beobachtet werden.
Sehr selten wurde über allergische Hautreaktionen berichtet.
Methyl-4-hydroxybenzoat kann Überempfindlichkeitsreaktionen, auch Spätreaktionen, hervorrufen.

7. Wechselwirkungen mit anderen Mitteln

Bisher keine bekannt

8. Warnhinweise

Methyl-4-hydroxybenzoat kann Überempfindlichkeitsreaktionen, auch Spätreaktionen, hervorrufen.

9. Wichtigste Inkompatibilitäten

Bisher nicht bekannt

10. Dosierung mit Einzel- und Tagesgaben

Mehrmals täglich dünn auf die betroffenen Hautstellen auftragen und leicht verreiben.

11. Art und Dauer der Anwendung

Zur Anwendung auf der Haut.
Verbände sollten nicht angelegt werden.

12. Notfallmaßnahmen, Symptome und Gegenmittel

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 zentral-nervöse Symptome. Exzitation evtl. mit Halluzinationen möglich, Desorientiertheit, Unkoordiniertheit, Muskelzuckungen, Hyperpyrexie, tonisch-klonische Krämpfe möglich.

Bei großen Dosen: Koma, Herz- und Kreislaufversagen.

b) Therapie von 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.

13. Pharmakologische und toxikologische Eigenschaften, Pharmakokinetik und Bioverfügbarkeit, soweit diese Angaben für die therapeutische Verwendung erforderlich sind

13.1 Pharmakologische Eigenschaften

Dimetindenmaleat, ein Pheninden-Derivat, ist ein Histaminrezeptorantagonist vom H₁-Typ und hemmt in vitro und in vivo die durch H₁-Rezeptoren vermittelten Histaminwirkungen. 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 H₁-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 H₁-Rezeptor-Antagonisten hat Dimetindenmaleat keinen Einfluss auf die durch Histamin erhöhte Magensaftsekretion.

Gegenüber der in manchen Fällen beobachtbaren sedierenden Potenz der H₁-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 H₂-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.

13.2 Toxikologische Eigenschaften

Die akute Toxizität wurde an Ratte, Maus, Meerschweinchen und Hund geprüft. Das systemische akute Vergiftungsbild nach oraler und parenteraler Gabe ist gleich. Im unteren toxischen Dosisbereich treten Sedierung, Ataxie, Tremor und Dyspnoe auf. Im höheren Dosisbereich treten tonisch-klonische Krämpfe und vermehrt die durch die schwachen anticholinergen Eigenschaften bedingten Wirkungen wie Mydriasis und verminderte Speichelsekretion hinzu. Die chronische orale Verabreichung von Dimetindenmaleat an Ratten über 12 Monate und Hunden über 6 Monate ergab keine histologischen Befunde, die eine Schädigung im Bereich therapeutisch wirksamer Dosen nahelegen. Das Blutbild blieb während der gesamten Behandlungszeit normal.

Reproduktionstoxikologische Untersuchungen an Ratten und Kaninchen ergaben bis zu Dosen von 16 mg/kg/Tag und 9 mg/kg/Tag i.v. keine Hinweise auf spezifisch schädigende, insbesondere teratogene Eigenschaften. Embryotoxische Wirkungen wurden erst im maternaltoxischen Dosisbereich beobachtet.

Dimetinden kann bei der Ratte die Plazenta passieren und in die Milch übergehen. Für den Menschen liegen keine ausreichenden Erfahrungen mit der Anwendung in der Schwangerschaft und der Stillzeit vor. Es ist nicht bekannt, ob der Wirkstoff in die Muttermilch übergeht.

Prüfungen auf tumorogene Wirkung (Kanzero-genitätsstudien) wurden mit Dimetinden nicht durchgeführt.

Mutagenitätsuntersuchungen in vivo und in vitro verliefen negativ.

13.3 Pharmakokinetik

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 h⁻¹. Dimetindenmaleat wird zum Teil unverändert im Harn ausgeschieden.

Die geringen Dosierungen und die analytischen Limitationen schränken die Erhebung der traditionellen pharmakokinetischen Parameter 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 Phenylring des Indenteils substituiertes Methoxy-, Dihydroxy- und Hydroxymethoxydimetinden identifiziert werden.

13.4 Bioverfügbarkeit

Entfällt, s. Pkt. 13.2.

14. Sonstige Hinweise

Keine

15. Dauer der Haltbarkeit

Die Dauer der Haltbarkeit beträgt 3 Jahre.

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

Nach Anbruch ist Fenistil Gel 6 Monate haltbar.

16. Besondere Lager- und Aufbewahrungshinweise

Keine.

16a. Besondere Vorsichtsmaßnahmen zur Beseitigung von nicht verwendeten Arzneimitteln

Keine.

17. Darreichungsformen und Packungsgrößen

Fenistil Gel

N 1 20 g

N 2 50 g

N 3 100 g

Klinikpackung

18. Stand der Information

April 2004

19. Name oder Firma und Anschrift des pharmazeutischen Unternehmers

Novartis Consumer Health GmbH
81366 München

Novartis Consumer Health GmbH
Zielstattstraße 40
81379 München
Telefon (0 89) 78 77-0
Telefax (0 89) 78 77-4 44

Zentrale Anforderung an:

BPI Service GmbH

Postfach 12 55

88322 Aulendorf