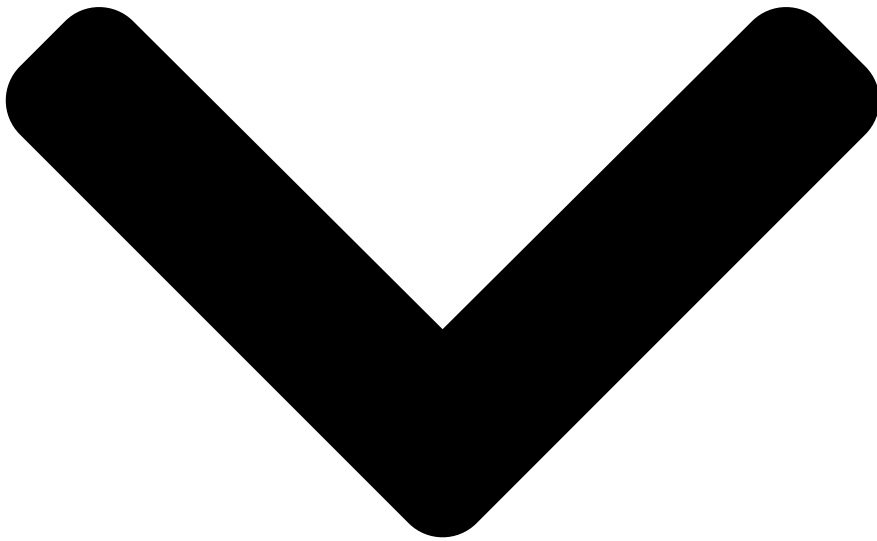
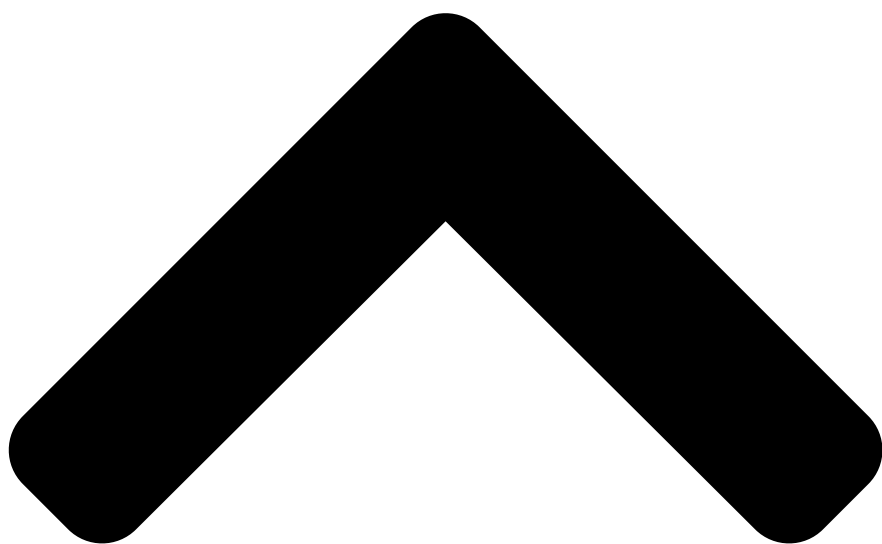
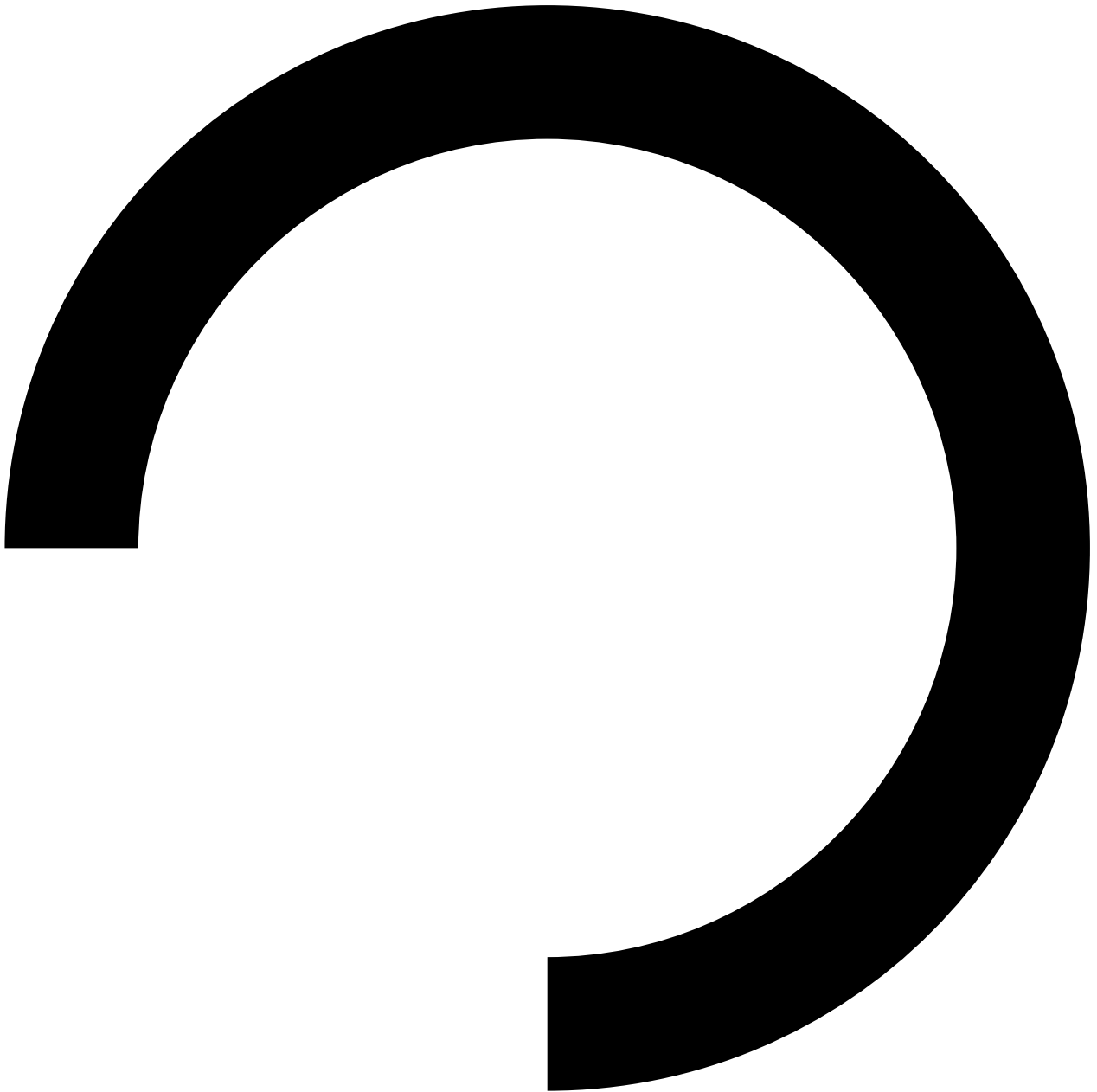


Lidocain-Base Rezepturen: Überwindung der Löslichkeitsproblematik mit 3 bewährten Methoden

Inhaltsverzeichnis







Einleitung

Einer der bekanntesten Vertreter der **Lokalanästhetika** ist zweifellos Lidocain. Dieser Wirkstoff blockiert die spannungsabhängigen Natriumkanäle der Neuronen und verringert somit die Durchlässigkeit ihrer Membran gegenüber Natriumionen.

Lidocain findet in verschiedenen Formen Anwendung – sei es als Injektion, Gel, Creme, Salbe oder Spray. Es wird zu unterschiedlichen medizinischen Zwecken eingesetzt, unter anderem als Lokalanästhetikum bei kleineren Eingriffen oder in der Zahnmedizin, aber auch als Arzneimittel in der **Schmerztherapie**, beispielsweise bei neuropathischen Schmerzen.

Zudem wird es bei der Behandlung von Herzrhythmusstörungen verwendet. In diesem Artikel konzentrieren wir uns jedoch auf die dermalen bzw. topischen Darreichungsformen und die Möglichkeiten in der Rezeptur. Oftmals steht man vor der Frage, ob nun die Base oder das Salz verarbeitet werden soll. Welche Verbindung ist also wann die Richtige?

Wann setze ich Lidocain-Base und wann Lidocain-Hydrochlorid ein?

Als nützliche Eselsbrücke kann man sich merken: Lidocain- **B**ase eignet sich für „**g**eschlossene/intakte“ Haut, während Lidocain-**H**ydrochlorid (Salz) für „**o**ffene“ Haut oder Schleimhäute ideal ist. (*B und G kommen vor H und O im Alphabet*)

Die **schlechte Wasserlöslichkeit der Base** macht es perfekt für Anwendungen, die eine langsame Freisetzung des Wirkstoffs erfordern, insbesondere wenn dieser in nicht-wässrigen Lösungsmitteln oder auf einer Fettbasis gelöst wird. Es kann aber unter gewissen Bedingungen auch in hydrophilen Grundlagen eingearbeitet werden. Die Lidocain-Base findet häufig Verwendung in topischen Formulierungen wie Salben, Cremes und Gelen, besonders wenn eine lang anhaltende Wirkung auf der Haut gewünscht ist. Die langsamere Absorption von Lidocain Base ist bei der lokalen Schmerzlinderung von Vorteil, da sie eine längere Wirkdauer ermöglicht. Oft werden lipophile Grundlagen verwendet, um zusätzlich vom okklusiven Effekt zu profitieren, wodurch das Arzneimittel länger auf der Haut verbleibt und eine verlängerte Wirkung erzielt wird.

Das **Salz bzw. Hydrochlorid hingegen hat eine gute Wasserlöslichkeit**, weshalb es sich sehr gut für wasserhaltige Rezepturen eignet z.B. Gele, Creme oder Lösungen. Aufgrund der schnellen Absorption ist Lidocain HCl besonders

nützlich, wenn eine unmittelbare Wirkung erforderlich ist z.B. bei offenen Wunden oder entzündeten Arealen.

Eigenschaften und Normdosen der Lidocain-Base

- Schlecht bzw. praktisch unlöslich in Wasser
- Stabil gegen Hitze
- Rezeptierbarer pH-Bereich: 4-7
- Normdosis: 0,5 - 10 % Erwachsene
- Normdosis: 0,5 - 3 % Kinder

Herstellung mit der FagronLab™ TRM Salbenmühle

Wird Lidocain-Base in eine Salbengrundlage, also in eine wasserfreie Zubereitung, eingearbeitet, in der es sich nicht löst, dann kommt die Salbenmühle bzw. der Dreiwalzenstuhl zum Einsatz. Hier liegt Lidocain-Base dann **suspendiert** vor. Um zu vermeiden, dass der Patient bei der Abgabe ein Peeling erhält, muss die Rezeptur unbedingt über die Salbenmühle oder den Dreiwalzenstuhl verarbeitet werden.

Zunächst kann die Lidocain-Base in der Glasfantaschale vor-zerkleinert werden. Vom Mörsern würde ich jedoch abraten, da es zu einem Wirkstoffverlust kommen kann und Lidocain die Atemwege reizen kann. Hierbei sollte im Hinblick auf die Arbeitssicherheit die Partikelbelastung in der Luft so gering wie möglich gehalten werden.

Deshalb erfolgt die weitere Zerkleinerung mit der Salbenmühle oder dem Dreiwalzenstuhl, da man ohnehin nicht ohne diese auskommt. Es sollten **mindestens drei Durchgänge** mit der Salbenmühle oder dem Dreiwalzenstuhl erfolgen. Dabei sollte nach jedem Durchlauf die Walzenstellung um eine Einheit verkleinert werden, um ein homogenes Ergebnis zu erzielen. Es könnte zuvor auch ein Rezepturkonzentrat hergestellt werden, gerade bei vermehrter

Herstellung.

Rezepturbeispiel

Lidocain 10% in Hydrophobes Basisgel DAC

Lidocain-Base 5,00 g

Hydrophobes Basisgel DAC ad 50,00 g

*Die Haltbarkeit sollte aufgrund von möglichem Kristallwachstum bei max. 3 Monaten angesetzt werden und eventuell sollte die Lagerung im Kühlschrank in Erwähnung gezogen werden, dies ist die Empfehlung des Online NRF/DAC.**

Produkte erhältlich im Fagron Online-Shop:

- [Lidocain-Base](#)
- [Hydrophobes Basisgel DAC](#)
- [Glasfantaschale](#)
- [FagronLab™ TRM Salbenmühle](#)

Herstellung mit Wärme bzw. dem FagronLab™ PRO-DMS Magnetprüher

Die Lidocain-Base ist **hitzestabil und löst sich in der Macrogolsalbe**, was diese zu einer geeigneten Option macht, insbesondere wenn man eine Rezeptur mit fester Konsistenz wünscht. Man sollte jedoch bedenken, dass Macrogolsalbe die Haut reizen kann und daher nicht für jeden Patienten geeignet ist. Nichtsdestotrotz lässt sich diese Rezeptur realisieren. Für die Herstellung wird ein Wasserbad oder eine Heizplatte bzw. ein Magnetprüher mit Heizfunktion benötigt.

Zunächst werden **alle Grundlagenbestandteile** - Macrogol 400, Propylenglykol und Macrogol 4000 - **gemischt und dann „geschmolzen“**, bis eine klare

Flüssigkeit entsteht bei ca. 60°C. In dieser Schmelze wird dann die Lidocain-Base gelöst. Dies kann etwas Zeit in Anspruch nehmen, insbesondere wenn das Lidocain zuvor nicht zerkleinert wurde. Ich habe in meiner Rezeptur darauf verzichtet, da es sich ohnehin löst und ich keinen Wirkstoffverlust riskieren wollte. Zudem kann die Arbeitssicherheit, im Vergleich zur Verarbeitung mit der Salbenmühle oder dem Dreiwalzenstuhl, besser gewährleistet werden.

Nachdem die Lidocain-Base gelöst ist, wird die Salbe kaltgerührt. Die **Konsistenz** der Salbe kann sich nach dem Erkalten und mit der Zeit noch verändern bzw. **fester** werden. Diese Rezepturvorschrift statt ursprünglich aus dem niederländischen Formularium.

*Haltbarkeitsvergabe würde ich gemäß NRF/DAC Empfehlungen zur Festlegung der Aufbrauchsfrist- Fall 2 durchführen.***

Rezepturbeispiel

Lidocain 5% in Macrogolsalbe

Lidocain-Base 2,50 g

Propylenglycol 12,50g

Macrogol 4000 15,00g

Macrogol 400 20,00g

- [Lidocain-Base](#)
- [Propylenglycol](#)
- [Macrogol 4000 Pulver](#)
- [Macrogol 400 Flüssigkeit](#)
- [Glasfantaschale](#)
- [Wägeschälchen](#)
- [FagronLab™ PRO-DMS Magnetrührer](#)

Herstellung mit einem Eutektikum

Wenn eine Herstellungsmethode benötigt wird, bei der Lidocain ohne Wärme oder den Einsatz einer Salbenmühle bzw. einem Dreiwalzenstuhl verarbeitet werden soll, besteht die Möglichkeit, ein Eutektikum einzusetzen. Diese Alternative ermöglicht es, Lidocain-Base sogar in wasserhaltige Grundlagen einzuarbeiten und selbstverständlich auch in lipophilen bzw. hydrophoben. Dies ist möglich, wenn Lidocain-Base und Menthol in bestimmten Verhältnissen (1:1) gemischt werden; sie bilden dann eine **eutektische Mischung**.

Diese Mischung hat einen Schmelzpunkt, der niedriger ist als der von Lidocain-Base oder Menthol allein. Dadurch **wird aus zwei „Pulvern“ eine Flüssigkeit**, welche sich optimal in Grundlagen emulgieren lässt. Aber Vorsicht, je nach Menge und Grundlage kann die Grundlage sich verflüssigen. Diese Rezepturen sollten aufgrund des Menthols nicht rektal oder auf geschädigten Hautstellen angewendet werden.

*Die Verwendbarkeitsfrist würde ich gemäß NRF/DAC Empfehlungen zur Festlegung der Aufbrauchsfrist- Fall 5 vergeben.***

Rezepturbeispiel

Lidocain 4% in Hydrophobe Basiscreme DAC mit Menthol als Eutektikum

Lidocain-Base 2,00 g

Menthol 2,00 g

Hydrophobe Basiscreme DAC ad 50,00 g

Produkte erhältlich im Fagron Online-Shop:

- [Lidocain-Base](#)
- [Menthol](#)
- [Hydrophobe Basiscreme DAC](#)

- [Glasfantaschale](#)
- [Wägeschälchen](#)

Der Lidocain-Rezepturen Vergleich

In diesem Video habe ich vor allem noch einmal die verschiedenen Konsistenzen miteinander verglichen: **drei verschiedene Herstellungsmethoden, drei unterschiedliche Grundlagen für einen Wirkstoff**. Lidocain-Base-Rezepturen können vielfältig sein, und gerade im Bereich der Individualrezepturen ergeben sich zahlreiche Optionen.

Quellen

Informationen rund um das Thema Lidocain-Base und Lidocain-Hydrochlorid, wie auch mögliche Rezepturvorschriften können folgenden Quellen entnommen werden:

[NRF/DAC - Rezepturhinweise](#)

[NRF/DAC - Dosierung](#)

[NRF/DAC- Wirkstoffprofile](#)

[Empfehlungen Aufbrauchsfrist](#)

[Europäisches Arzneibuch](#)

Wenn dir dieser Artikel gefallen hat, teile ihn gerne mit deinen Kollegen:



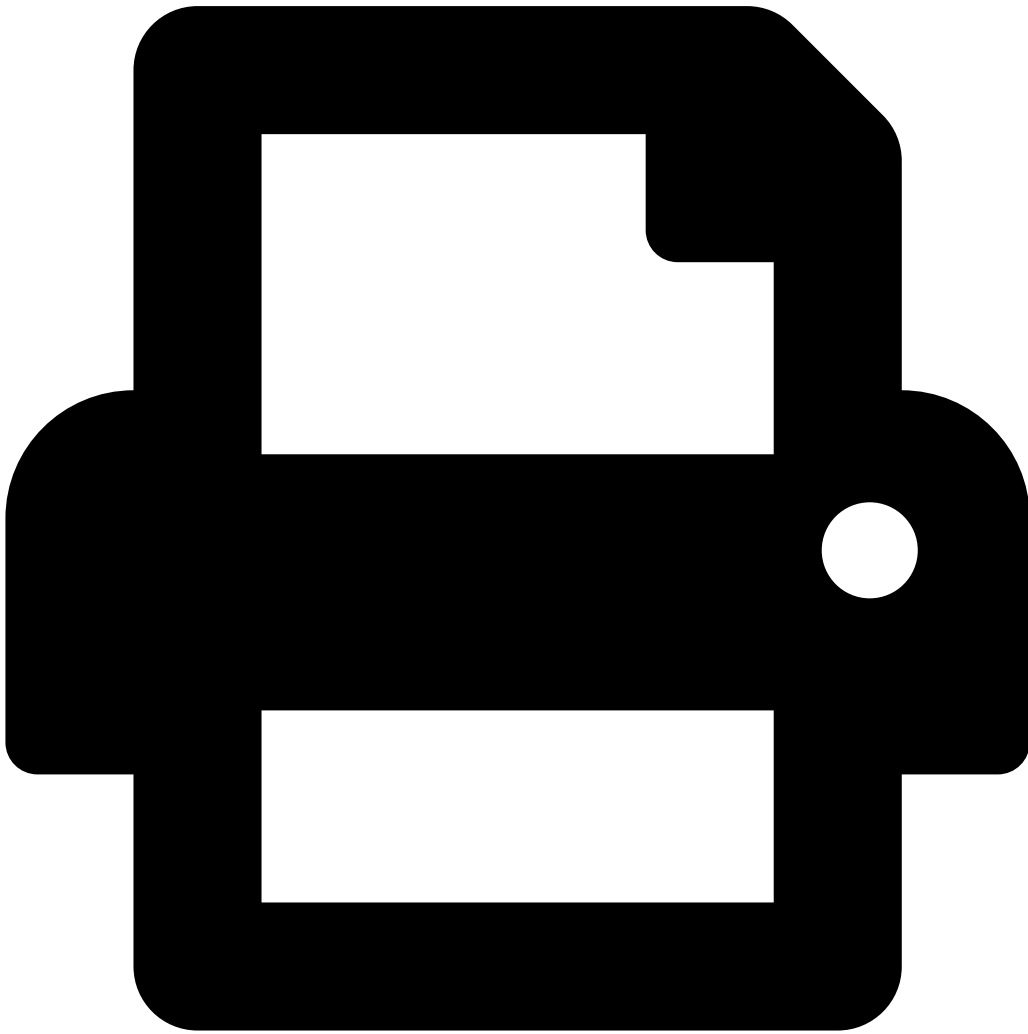
Facebook



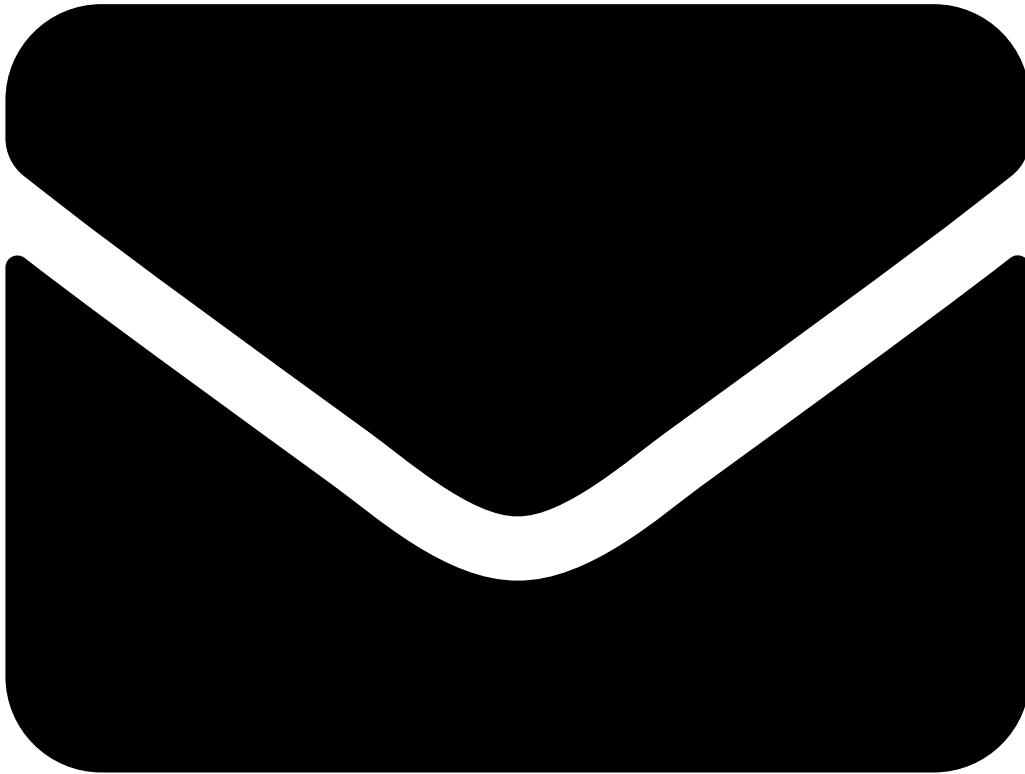
LinkedIn



WhatsApp



Print



Email

Weitere interessante Blogartikel



[Rezepturblog](#)

Suspension - Herstellung mit Fertigarzneimitteln

Suspension - Herstellung mit Fertigarzneimitteln bzw. Tabletten als Ausgangsstoff und individueller Viskositätseinstellung

[Zum Blogartikel »](#)



[Rezepturblog](#)

Lithium-Orotat Rezepturen

Sind Lithium-Orotat Rezepturen bei der Behandlung von Post-Covid-Symptomen und Fatigue, mit Hilfe von Kapseln oder Lösungen eine Möglichkeit?

[Zum Blogartikel »](#)



[Rezepturblog](#)

Suspension herstellen aus Weichkapseln?

Kann man aus Weichkapseln eine Suspension herstellen? Und ist dies auch mit SyrSpend® SF möglich? Erfahren Sie, unter welchen Bedingungen dies machbar ist und erhalten Sie ein Rezeptur-Beispiel, insbesondere für die Herstellung einer Suspension während eines Lieferengpasses von Pednidan Saft (Ethosuximid).

[Zum Blogartikel »](#)

Haftungsausschluss:

Bitte beachten Sie, dass die oben aufgeführten Rezepturbeispiele theoretische Überlegungen sind, die als Hilfestellung bei der Recherche für die Plausibilitätsprüfung dienen sollen. Da jede Rezeptur bzw. Plausibilitätsprüfung durch einen Apotheker oder eine Apothekerin freigegeben werden muss, obliegt es diesem/r, zu entscheiden, ob die Rezeptur sinnvoll bzw. plausibel ist. Die Entscheidung liegt somit ausschließlich beim verantwortlichen Apotheker oder bei der verantwortlichen Apothekerin. Die Firma Fagron GmbH übernimmt keine Haftung.