

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Inovox Express smak pomarańczowy, 2 mg + 0,6 mg +1,2 mg, pastylki twarde

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda pastylka twarda zawiera:

Lidokainy chlorowodorek jednowodny	2 mg
Amylometakrezol	0,6 mg
Alkohol 2,4-dichlorobenzylowy	1,2 mg

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

Sacharoza	1495,33 mg
Glukoza ciekła	1016,82 mg
Żółcień pomarańczowa	0,072 mg
Czerwień koszenilowa	0,0125 mg

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Pastylki twarde

Inovox Express smak pomarańczowy to pomarańczowe, dwuwypukłe, cylindryczne pastylki twarde o średnicy 19 mm, o smaku pomarańczowym.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Miejscowe leczenie antyseptyczne stanów zapalnych (zaczerwienienie, obrzęk) gardła i jamy ustnej, a także łagodzenie bólu w tych stanach.

Łagodzenie objawów bólu gardła.

Inovox Express smak pomarańczowy przeznaczony jest dla osób dorosłych i młodzieży w wieku powyżej 12 lat.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli i młodzież w wieku powyżej 12 lat:

1 pastylka co 2-3 godziny, w razie potrzeby, maksymalnie do 8 pastylek w ciągu 24 godzin u dorosłych (maksymalnie 4 pastylki u młodzieży).

Dzieci i młodzież

Nie stosować produktu leczniczego u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

Sposób podawania

Do stosowania w jamie ustnej.

Pastyłkę powoli rozpuszczać w jamie ustnej, nie umieszczać pomiędzy dziąsłem a policzkiem.

Nie stosować produktu leczniczego przed posiłkiem lub wypiciem napoju.

Nie zaleca się stosowania produktu leczniczego dłużej niż 5 dni (patrz punkt 4.4).

Osoby w podeszłym wieku:

Dostosowanie dawki nie jest konieczne.

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek i (lub) wątroby:

Nie ma dostępnych danych dotyczących stosowania produktu Inovox Express smak pomarańczowy u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby lub nerek.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancje czynne lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

Ze względu na zawartość lidokainy produkt jest przeciwwskazany do stosowania u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy przestrzegać wskazanego dawkowania: przyjmowanie produktu w dużych dawkach lub zbyt często może wpływać na układ nerwowy w wyniku przenikania leku do krwi, co może powodować drgawki lub zaburzenia pracy serca.

Nie zaleca się stosowania produktu dłużej niż 5 dni, ponieważ może on zmieniać naturalną florę bakteryjną w gardle.

Jeśli objawy utrzymują się dłużej niż 2 dni, nasilą się lub wystąpią inne objawy, takie jak wysoka gorączka, ból głowy, nudności lub wymioty i wysypka na skórze, należy ocenić stan kliniczny w celu wykrycia zakażeń bakteryjnych (angina, zapalenie migdałków).

Należy zachować ostrożność podczas stosowania produktu u ciężko chorych lub osłabionych osób w podeszłym wieku, ponieważ osoby takie są bardziej wrażliwe na działania niepożądane tego produktu leczniczego.

Produktu nie należy stosować, jeśli w jamie ustnej i gardle występują większe niezagojone rany.

Znieczulenie gardła spowodowane tym produktem leczniczym może doprowadzić do zachłyśnięcia (kaszel podczas jedzenia sugerujący, że pacjent się zadławił). W związku z tym nie należy stosować produktu przed posiłkiem lub wypiciem napoju.

Pacjenci z astmą powinni stosować ten produkt leczniczy pod kontrolą lekarza.

Inovox Express smak pomarańczowy może powodować drętwienie języka i zwiększać ryzyko ugryzienia się. Dlatego należy zachować ostrożność podczas jedzenia i picia gorących pokarmów i napojów. Pacjenta należy poinformować, że miejscowe znieczulenie może zaburzać połykanie, a tym samym zwiększyć ryzyko zachłyśnięcia. Z tego powodu nie należy jeść bezpośrednio po zastosowaniu środków miejscowo znieczulających w obrębie jamy ustnej i gardła.

Pacjentów uczulonych na amidowe środki miejscowo znieczulające należy poinformować o nadwrażliwości krzyżowej na leki amidowe, takie jak lidokaina (patrz punkt 4.5).

Produkt Inovox Express smak pomarańczowy zawiera 1,016 g glukozy i 1,495 g sacharozy w jednej pastylce. Należy to wziąć pod uwagę u pacjentów z cukrzycą. Pacjenci z rzadkimi dziedzicznymi zaburzeniami związanymi z nietolerancją fruktozy, zespołem złego wchłaniania glukozy-galaktozy lub niedoborem sacharazy-izomaltazy, nie powinni przyjmować produktu leczniczego.

Produkt leczniczy zawiera mniej niż 1 mmol (23 mg) sodu na pastylkę, to znaczy produkt leczniczy uznaje się za „wolny od sodu”.

Inovox Express smak pomarańczowy zawiera terpeny występujące w lewomentolu. Zbyt duże dawki terpenów mogą prowadzić do powikłań neurologicznych, takich jak drgawki u dzieci.

Inovox Express smak pomarańczowy zawiera barwniki żółcień pomarańczową i czerwień koszenilową. Produkt leczniczy może powodować reakcje alergiczne.

4.5. Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Nie zaleca się stosowania innych środków antyseptycznych jednocześnie lub jeden po drugim ze względu na możliwość interakcji (działanie przeciwstawne, dezaktywacja).

Mimo że dawka lidokainy jest niewielka, ze względu na jej zawartość w produkcie należy wziąć pod uwagę następujące fakty:

– Leki blokujące receptory beta-adrenergiczne zmniejszają przepływ krwi przez wątrobę, a zatem także szybkość metabolizmu lidokainy, powodując zwiększone ryzyko działań toksycznych.

– Cymetydyna może hamować metabolizm wątrobowy lidokainy, powodując zwiększone ryzyko działań toksycznych.

Może to powodować nadwrażliwość krzyżową na inne amidowe środki miejscowo znieczulające.

– Leki przeciwarytmiczne klasy III, takie jak meksyletyna i prokainamid, mogą wywoływać interakcje farmakokinetyczne lub farmakodynamiczne.

– Izoenzymy CYP1A2 i CYP3A4 cytochromu P450 biorą udział w powstawaniu MEGX, farmakologicznie aktywnego metabolitu lidokainy, dlatego inne leki, takie jak fluwoksamina, erytromycyna i itrakonazol, mogą zwiększać stężenie lidokainy w osoczu krwi.

4.6. Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu Inovox Express smak pomarańczowy podczas ciąży.

Duża liczba danych dotyczących miejscowego stosowania lidokainy w czasie ciąży nie wskazuje na zwiększone ryzyko wad wrodzonych. Lidokaina przenika przez łożysko, jednak jej wchłanianie jest bardzo małe ze względu na małą dawkę. Badania na zwierzętach nie wykazują szkodliwego wpływu na reprodukcję (patrz punkt 5.3).

Nie ma danych dotyczących stosowania amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego jako substancji farmakologicznie czynnych w czasie ciąży. Ze względu na brak udokumentowanego doświadczenia dotyczącego stosowania, nie zaleca się przyjmowania produktu Inovox Express smak pomarańczowy podczas ciąży.

Karmienie piersią

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu Inovox Express smak pomarańczowy w okresie karmienia piersią. Lidokaina przenika w niewielkich ilościach do mleka kobiecego. Ze względu na małą dawkę nie przewiduje się wpływu lidokainy na niemowlę. Nie ma danych dotyczących

przenikania amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego do mleka kobiecego. Należy podjąć decyzję, czy przerwać karmienie piersią, czy przerwać podawanie produktu Inovox Express smak pomarańczowy, biorąc pod uwagę korzyści z karmienia piersią dla dziecka i korzyści z leczenia dla matki.

Płodność

Nie ma danych dotyczących wpływu lidokainy, amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego na płodność.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Ten produkt leczniczy nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8. Działania niepożądane

W okresie stosowania produktu zgłaszano następujące działania niepożądane dla skojarzenia substancji czynnych zawartych w tym produkcie leczniczym:

Zaburzenia układu immunologicznego

Rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $\leq 1/1000$): reakcje nadwrażliwości (pieczenie, świąd), obrzęk naczynioruchowy, pieczenie w gardle i nieprzyjemny smak.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl> Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9. Przedawkowanie

Nie przewiduje się problemów związanych z przedawkowaniem. W przypadku wchłaniania ogólnoustrojowego może wystąpić przemijające pobudzenie OUN, a następnie zahamowanie czynności OUN (senność, utrata przytomności) i zahamowanie czynności układu sercowo-naczyniowego (niedociśnienie, spowolnione lub nieregularne bicie serca).

Nie zaleca się długotrwałego stosowania tego produktu (dłużej niż 5 dni), ponieważ może on zmieniać naturalną florę bakteryjną w gardle.

Dzieci i młodzież

Stosowanie produktu w dużych dawkach i długotrwale u dzieci w wieku poniżej 6 lat może powodować drgawki.

Objawy

Biorąc pod uwagę niewielką zawartość substancji czynnych przedawkowanie jest mało prawdopodobne.

W przypadku nieprawidłowego stosowania (znacznie większe dawki, zmiany dotyczące błon śluzowych), może dojść do przedawkowania. Przejawem tego jest początkowo nadmierne

znieczulenie górnych dróg oddechowych i przewodu pokarmowego. Mogą wystąpić reakcje ogólnoustrojowe ze względu na wchłanianie lidokainy. Do najcięższych działań niepożądanych lidokainy należy zatrucie ośrodkowego układu nerwowego (bezsensowność, niepokój, pobudzenie i depresja oddechowa) i układu sercowo-naczyniowego; może również wystąpić methemoglobinemia.

Leczenie

W przypadku przedawkowania, można rozważyć wywołanie wymiotów i (lub) płukanie żołądka (w ciągu jednej godziny) w przypadku potencjalnie ciężkiego zatrucia. Dodatkowe działania stosuje się tylko wspomagająco, w zależności od występujących objawów.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki stosowane w chorobach gardła, antyseptyki, różne.
Kod ATC: R02AA20.

Alkohol 2,4-dichlorobenzylowy i amylometakrezol wykazują właściwości antyseptyczne.

Przeciwbakteryjne i przeciwgrzybicze działanie pastylek zawierających amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy wykazano podczas badań *in vitro* oraz *in vivo*. W badaniach *in vitro* wykazano działanie przeciwwirusowe pastylek zawierających amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy wobec wirusów otoczkowych po kontakcie trwającym 1 minutę. W długim okresie stosowania produktów zawierających amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy nie wykazano jakiegokolwiek zmniejszenia aktywności względem patogennych wirusów, co sugeruje brak powstawania oporności.

Po połączeniu obu substancji czynnych obserwowane jest synergistyczne działanie przeciwbakteryjne, co pozwala na zmniejszenie dawki złożonej stosowanej w pastylkach zawierających amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy.

Podczas badań klinicznych wykazano działanie przeciwbólowe pastylek zawierających amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy, powodujące zmniejszenie bólu gardła i trudności w przełykaniu; początek działania obserwowano po upływie 5 minut, a czas działania wynosił do 2 godzin. Znacząco większą ulgę niż w przypadku pastylek niezawierających substancji leczniczych, wykazano w przypadku leczenia trwającego do 3 dni.

Działanie produktu zawierającego skojarzenie amylometakrezolu, alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego oraz lidokainy wykazano w badaniu klinicznym, w którym zaobserwowano zmniejszenie bólu gardła oraz zmniejszenie trudności w przełykaniu po 5 minutach. W tym samym badaniu zaobserwowano działanie znieczulające gardło już w 1 minutę po podaniu pastylki zawierającej amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy oraz lidokainę.

Lidokaina powoduje szybkie znieczulenie miejscowe i złagodzenie bólu występującego podczas stanu zapalnego. Lidokaina powoduje odwracalne zahamowanie przewodnictwa we włóknach nerwowych poprzez blokowanie pompy sodowo-potasowej i hamowanie przepuszczalności błony komórkowej dla jonów. Przewodnictwo w cienkich włóknach nerwowych, bez osłonki mielinowej (np. włókna przewodzące czucie bólu) jest hamowane przez małe, występujące w dawce produktu stężenie analgetyku miejscowego. Początek działania polegającego na blokowaniu małych nerwów obecnych w błonie śluzowej jamy ustnej występuje po około 1-5 minutach.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Okres półtrwania lidokainy wynosi 1 do 2 godzin (około 100 minut) i zależy od dawki. Okres półtrwania jej metabolitu, glicynianu ksylidyny (GX) jest dłuższy, dlatego może się on gromadzić, w szczególności w przypadku wydalania przez nerki.

Brak odpowiednich danych dotyczących farmakokinetyki alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu, z wyjątkiem badania biodostępności opisanego w charakterystyce produktu leczniczego Benagol (Benagol, 2008), w którym stwierdzono szybkie uwalnianie obu środków antyseptycznych do śliny i ich największe stężenie po 3-4 minutach ssania pastylki.

Ilość alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu stwierdzana w ślinie po 120 minutach wynosi w przybliżeniu 50% podanej dawki.

U pacjentów po zawale mięśnia sercowego (z niewydolnością serca lub bez niewydolności serca), okres półtrwania lidokainy i monoetyloglicynianu ksylidyny (MEGX) jest wydłużony; okres półtrwania GX może także być wydłużony u pacjentów z niewydolnością serca wtórną do zawału mięśnia sercowego. Dłuższy okres półtrwania opisywano również dla lidokainy u pacjentów z zastoinową niewydolnością serca lub chorobą wątroby i może on być wydłużony po ciągłym wlewie dożylnym trwającym ponad 24 godziny. Wydalanie MEGX może także być zmniejszone u pacjentów z zastoinową niewydolnością serca.

Lidokaina jest łatwo wchłaniana przez błony śluzowe. Okres półtrwania w osoczu w fazie eliminacji wynosi około 2 godziny. Po wchłonięciu ulega ona w znacznym stopniu metabolizmowi pierwszego przejścia w wątrobie, gdzie ulega szybkiej deetylacji do aktywnego metabolitu, monoetyloglicynianu ksylidyny, który następnie jest hydrolizowany do różnych metabolitów, w tym glicynianu ksylidyny. Mniej niż 10% leku jest wydalane w postaci niezmienionej przez nerki. Metabolity są także wydalane z moczem.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne dotyczące alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu nie wykazały szczególnego zagrożenia dla ludzi. Dane te pochodzą z konwencjonalnych badań toksyczności po podaniu jednorazowym i wielokrotnym, genotoksyczności i toksycznego wpływu na reprodukcję. Nie przeprowadzono badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa i badań rakotwórczości.

Badania genotoksyczności lidokainy dały wynik ujemny. Nie badano działania rakotwórczego lidokainy. Metabolit lidokainy, 2,6-ksylidyna, wykazuje działanie genotoksyczne *in vitro*. W badaniu rakotwórczości u szczurów narażonych na 2,6-ksylidynę w okresie płodowym, po urodzeniu i przez całe życie, obserwowano guzy w jamie nosowej, guzy podskórne i guzy wątroby. Znaczenie kliniczne występowania w związku z krótkotrwałym/okresowym stosowaniem lidokainy jest nieznane.

W badaniach na zwierzętach, przeprowadzonych po zastosowaniu lidokainy w okresie ciąży, dotyczących toksycznego wpływu lidokainy na reprodukcję, nie znaleziono dowodów na działanie teratogenne lub zaburzenia rozwoju fizycznego potomstwa. Ekspozycja płodu na duże dawki lidokainy wpływała jednak na przepływ krwi w macicy i powodowała drgawki u płodu.

Poza tym dane niekliniczne dotyczące lidokainy nie dostarczyły żadnych istotnych informacji do istniejącego doświadczenia klinicznego.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

Lewomentol

Sodowa sacharyna (E 954)

Sacharoza

Glukoza ciekła

Żółcień pomarańczowa (E 110)

Czerwień koszenilowa (E 124)

Kwas cytrynowy jednowodny (E 330)

Aromat pomarańczowy

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3. Okres ważności

27 miesięcy.

6.4. Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 30°C.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry PVC/PVDC/Aluminium.

Wielkość opakowań: 12, 24 lub 36 pastylek.

6.6. Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowywania produktu leczniczego do stosowania

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

US Pharmacia Sp. z o.o.
ul. Ziębicka 40
50-507 Wrocław

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

22749

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 15/10/2015

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia:

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO