

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

LIDOPOSTERIN
50 mg/g, maść

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 g maści zawiera 50 mg lidokainy (*Lidocainum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: alkohol cetylowy.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Maść

Biała, jednorodna maść.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Zmniejszenie dolegliwości bólowych okolicy odbytu u pacjentów z guzkami krwawniczymi oraz wspomagająco w znieczuleniu przed i po badaniu przez odbyt. Łagodzenie swiądu odbytu.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Na początku leczenia maść należy stosować 2 do 3 razy na dobę, następnie dwa razy na dobę. Ilość stosowanej maści zależy od wielkości leczonego obszaru skóry i błony śluzowej. Nie należy przekraczać maksymalnej dawki 2,5 g maści (125 mg lidokainy) na jedno podanie. Długość pasma wyciśniętego z tuby wynosi około 2 cm.

Produktu leczniczego nie należy stosować dłużej niż 7 dni. W przypadku nawrotu objawów choroby produkt leczniczy LIDOPOSTERIN można użyć ponownie.

Dzieci i młodzież

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu leczniczego Lidoposterin u dzieci i młodzieży w wieku poniżej 18 lat. Brak dostępnych danych.

Sposób podawania

Produkt leczniczy przeznaczony jest wyłącznie do stosowania na skórę i błonę śluzową okolicy odbytu.

Maść należy stosować rano i wieczorem po wypróżnieniu. Maść należy ostrożnie wetrzeć w skórę i błony śluzowe wymagające leczenia.

Maść nałożoną na okolicę odbytu można przykryć opatrunkiem z gazy.

W celu stosowania w kanale odbytu należy posługiwać się aplikatorem dołączonym do opakowania. Aplikator jest przymocowany do tuby i ma zdejmowaną nakrętkę. Poprzez naciśnięcie tuby maść

zostaje wciśnięta do aplikatora, którego długość stożkowatego zakończenia rurki, wkładanego do odbytu, wynosi 3,4 cm. Następnie aplikator należy ostrożnie włożyć w odbytnicę. Ponownie nacisnąć tubę i wycofać aplikator z kanału odbytu.
Aplikator można myć gorącą wodą.

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

W zalecanych dawkach i odstępach leczenia ogólnoustrojowe stężenia lidokainy pozostają niskie i nie oczekuje się, aby powodowały ogólnoustrojowe działania niepożądane.

Zastosowanie preparatu na uszkodzoną skórę i (lub) błonę śluzową okolicy odbytu może skutkować wchłonięciem się większej ilości lidokainy do krwioobiegu i spowodować niepożądane działanie układowe.

Pacjenci z problemami dotyczącymi serca powinni skonsultować się z lekarzem przed zastosowaniem tego leku. Pacjenci tacy powinni być uważnie monitorowani pod kątem wystąpienia objawów ostrej toksyczności.

W przypadku zakażeń grzybiczych wymagane jest jednoczesne stosowanie miejscowo działających leków przeciwgrzybiczych.

Produkt leczniczy zawiera alkohol cetylowy, który może powodować miejscową reakcję skórą (np. kontaktowe zapalenie skóry).

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Lidokainę należy stosować ostrożnie jednocześnie ze znieczuleniem stomatologicznym i innymi środkami znieczulenia miejscowego lub substancjami strukturalnie podobnymi do środków znieczulenia miejscowego typu amidowego (np. leki przeciwwarytmiczne klasy IB), ponieważ działania toksyczne mogą się sumować.

Nie przeprowadzono specjalnych badań dotyczących interakcji pomiędzy środkami znieczulenia miejscowego a lekami przeciwwarytmicznymi klasy III, ale należy zachować ostrożność.

Produkty lecznicze, które hamują metabolizm lidokainy (np. cymetydyna i beta-adrenolityki), mogą powodować potencjalnie toksyczne stężenia w osoczu, gdy lidokaina jest podawana wielokrotnie w dużych dawkach przez długi czas. Takie interakcje nie mają znaczenia klinicznego po krótkotrwałym leczeniu lidokainą w zalecanych dawkach.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Lidokaina przenika przez łożysko. Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego potencjału teratogennego lidokainy.

Brak dostępnych danych dotyczących stosowania produktu leczniczego LIDOPOSTERIN u kobiet w ciąży. Potencjalne ryzyko dla ludzi nie jest znane. Dlatego LIDOPOSTERIN może być stosowany w okresie ciąży tylko wtedy, gdy jest to wyraźnie wskazane.

Karmienie piersią

Lidokaina przenika do mleka matki. Ze względu na stosunkowo szybki metabolizm lidokainy oczekuje się, że tylko niewielkie ilości lidokainy będą przenikać do mleka matki. Nie ma jednak badań dotyczących stosowania produktu leczniczego Lidoposterin u kobiet karmiących piersią.

Płodność

Nie są dostępne dane kliniczne dotyczące płodności. Badania na zwierzętach nie wykazały żadnego wpływu na płodność kobiet.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

LIDOPOSTERIN nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

4.8 Działania niepożądane

Zaburzenia żołądka i jelit

Często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$)

biegunka

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Bardzo często ($\geq 1/10$)

reakcja nadwrażliwości (np. swędzenie, pieczenie)

Niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$)

dyskomfort, zaczerwienienie

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

Działania niepożądane tego samego rodzaju, które występują w przypadku bezwzględnego przedawkowania lidokainy podawanej pozajelitowo mogą wystąpić w przypadku przedawkowania lidokainy 50 mg/g maści doodbytniczej. Jednak przy zalecanych dawkach toksyczność ogólnoustrojowa jest bardzo mało prawdopodobna. W przypadku jakiegokolwiek toksyczności oczekuje się, że symptomatologia będzie taka sama jak po innym znieczuleniu miejscowym, tj. objawy pobudzenia ośrodkowego układu nerwowego oraz, w ciężkich przypadkach, depresja ośrodkowego układu nerwowego i depresja mięśnia sercowego.

Niezamierzone przedawkowanie, w wyniku którego małe dzieci omyłkowo przyjęły maść doustnie, mogą wywołać toksyczność żołądkowo-jelitową (ból brzucha, nudności). W takim przypadku należy monitorować, czy nie występują objawy toksyczności ogólnoustrojowej.

Objawy przedawkowania lidokainy

Niewyraźne widzenie, zawroty głowy, nudności, drżenie, bradykardia i niedociśnienie, a w przypadku ciężkiego przedawkowania asystolia, bezdech, drgawki, śpiączka, zatrzymanie akcji serca, zatrzymanie oddechu, a nawet zgon.

Nie istnieje żadna swoista odtrutka na lidokainę.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki stosowane zewnętrznie w leczeniu hemoroidów, produkty zawierające środki miejscowo znieczulające, kod ATC: C05AD01

Lidokaina jest substancją miejscowo znieczulającą z grupy leków amidopodobnych. Leki miejscowo znieczulające zapobiegają wytwarzaniu i przewodzeniu impulsów nerwowych. Podstawowy mechanizm działania polega na odwracalnym hamowaniu początkowo zwiększonej przepuszczalności dla jonów sodu w komórkach nerwów obwodowych podczas przewodzenia impulsów. Lidokaina w sposób odwracalny zmniejsza miejscową wrażliwość na ból.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Wchłanianie

Biodostępność lidokainy po podaniu doodbytniczym wynosi około 50-70%.

Po podaniu wielokrotnym (trzy razy na dobę przez trzy dni) produktu leczniczego LIDOPOSTERIN w dawce 2,5 g (co odpowiada 125 mg lidokainy) średnia geometryczna AUC wynosiła 503,8 ng/ml·h ($\tau = 6$ h), a średnia geometryczna C_{max} (maksymalnego stężenia w osoczu) wynosiła 145,9 ng/ml. C_{max} osiągnięto po 1,83 godziny.

Ogólnoustrojowe działanie lidokainy zaczyna się przy poziomie 1500 ng/ml, a pierwsze efekty toksyczne obserwuje się przy stężeniach powyżej 3000 ng/ml. Tym samym poziomy stężenie lidokainy po podaniu doodbytniczym produktu leczniczego LIDOPOSTERIN pozostawały znacznie poniżej poziomów we krwi, które mają działanie ogólnoustrojowe.

Dystrybucja

Lidokaina wiąże w około 70% z białkami osocza, w tym z alfa-1-kwaśną glikoproteiną (AAG). Lidokaina przenika przez łożysko i barierę krew-mózg.

Metabolizm

Lidokaina ulega intensywnemu metabolizmowi w wątrobie. W dealkilacji do monoetyloglicyneksylidydu (MEGX) pośredniczą zarówno CYP1A2, jak i CYP3A4. MEGX jest metabolizowany do 2,6-dimetyloaniliny i glicyneksylidydu (GX). MEGX ma aktywność drgawkową odpowiadającą działaniu lidokainy, natomiast GX nie wykazuje żadnej aktywności drgawkowej. Wydaje się, że MEGX występuje w podobnych stężeniach w osoczu jak substancja macierzysta.

Eliminacja

Lidokaina jest wydalana głównie w postaci metabolitów z moczem. Około 10% jest wydalane w postaci niezmienionej z moczem. Okres półtrwania w osoczu po podaniu wielokrotnym (trzy razy na dobę przez trzy dni) produktu leczniczego LIDOPOSTERIN w dawce 2,5 g wynosił 3,38 godz. Zmniejszony klirens lidokainy obserwowano u pacjentów z niewydolnością serca, chorobą wątroby wywołaną alkoholem oraz przewlekłym lub wirusowym zapaleniem wątroby.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Nie wykazano toksycznych działań lidokainy u ludzi podczas wielokrotnego podawania produktu leczniczego w dawkach terapeutycznych na skórę i błonę śluzową okolicy odbytu. Częstość występowania reakcji alergicznych jest także bardzo mała. Jednakże szczególnie w przypadku długotrwałego leczenia dużymi dawkami oraz u dzieci, mogą wystąpić działania niepożądane wymienione w punkcie 4.8.

Nie przeprowadzono badań toksykologicznych i badań oceniających toksyczny wpływ produktu leczniczego na reprodukcję.

W przypadku pozajelitowego podawania dużych dawek lignokainy gryzoniom (szczur, mysz, królik) występowały objawy niepożądane takie jak hiperwentylacja, zmniejszenie ciśnienia krwi, zaburzenia rytmu, zmniejszenie napięcia mięśni, zwężenie źrenic, a w ciężkich przypadkach drgawki, wymioty, zmniejszenie temperatury ciała, śpiączka oraz zatrzymanie oddychania.

Istnieją dane, że 2,6-ksylidyna, metabolit lidokainy, u szczurów oraz prawdopodobnie także u ludzi wykazuje działanie mutagenne. Badania przeprowadzono w warunkach *in vitro*, w których metabolit stosowano w bardzo dużych dawkach. Obecnie brak jest jakichkolwiek danych dotyczących działania mutagennego.

W badaniu rakotwórczości u szczurów z zastosowaniem bardzo wrażliwego protokołu, obejmującego ekspozycję przezłożyskową i podawanie po urodzeniu zwierzętom bardzo dużych dawek 2,6-ksylidyny przez dwa lata, obserwowano występowanie nowotworów złośliwych i łagodnych, w szczególności w małżowinach nosowych. Dlatego nie należy podawać produktu leczniczego LIDOPOSTERIN (lidokainy) w dużych dawkach długotrwale.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

alkohol cetylowy
makrogol 1500
makrogol 3000
makrogol 400
woda oczyszczona

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Produkt leczniczy pakowany w tuby aluminiowe 25 g wewnątrz lakierowane żywicą epoksydową, zabezpieczone na końcu lateksem lub lakierem termozgrzewalnym, zamknięte nakrętką PE.
W tekturowym pudełku: tuba aluminiowa i kaniula PE.
Zawartość opakowania 25 g.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

DR. KADE Pharmazeutische Fabrik GmbH
Rigistraße 2
12277 Berlin, Niemcy

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

11628

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 30.04.2004

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 18.09.2013

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**