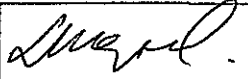


КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. ТЪРГОВСКО ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Lidocain 10% spray
Лидокаин 10% спрей

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕСПАЗВАНЕТО	
Възлагане към разрешение за употреба № 11-9044/29.05.04	
655/27.04.04	

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Всеки флакон от 38 g съдържа 3,80 g lidocaine като лекарство вещество.
(4.8 mg lidocaine / доза)

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Спрей дермален, разтвор

Описание: безцветен спиртен разтвор с ментолов аромат.

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Терапевтични приложения

За премахване на болката при следните процедури:

В оториноларингологията

- При пунктиране на максиларния синус и при малки хирургични интервенции в носната кухина, фаринкса и епифаринкса
- Парацетеза

В гинекологичната практика

Непосредствено преди разждането и преди епизиотомия и зашиване на перинеума, като допълнително противоболково средство.

При инструментални изследвания и въвеждане на катетър в храносмилателния тракт и дихателните пътища

Предизвиква повърхностна анестезия на орофарингеалната и трахеалната лигавици, като намалява рефлексния отговор, отслабва хемодинамичния отговор и облекчава въвеждането на катетъра или преминаването на различни инструменти при ендотрахеална интубация, ларингоскопия, бронхоскопия и езофагоскопия.

В стоматологичната практика

Преди поставяне на инжекции, преди вземане на отпечатъци за протеза, при зъбни рентгенови снимки, при премахване на зъбен камък.



4.2. Дозировка и начин на приложение

Да се прилага чрез напръскване на лигавицата; всяко едно врпъскване освобождава 4.8 mg lidocaine върху третираната лигавична повърхност. Дозировката варира в зависимост от индикацията и размера на областта, която ще бъде анестезирана. За да се избегне повишаването на плазмените нива на lidocaine, важно е да се използва най-малката доза, с която се постига задоволителен ефект. Обикновено са достатъчни 1 до 3 врпъсквания, макар че при гинекологични манипулации може да се приложат 15 - 20 врпъсквания и повече (максимум 40 врпъсквания/70 kg телесно тегло). При пациенти в напреднала възраст или такива, с намалени защитни сили на организма, дозата трябва да бъде съответстваща на състоянието им.

Препоръчвана дозировка при различни индикации

Индикация	Доза (брой врпъсквания)
Оториноларингология	1 - 4
Акушерство	15 - 20
Ендоскопия	2 - 3
Стоматология	1 - 3

Третиране на по-големи участъци може да стане чрез намокряне на памучен тампон с лекарството.

Деца

Литературните данни показват, че в стоматологията и оралната хирургия Lidocain spray може да бъде използван също и при деца, за предпочитане да се приложи чрез памучен тампон, за да се елиминира страхът от напръскването, а също и усещането за ципане, което обикновено се явява като нежелана реакция. Деца под 2 годишна възраст могат да бъдат третирани по същия начин.

4.3. Противопоказания

- Свръхчувствителност към lidocaine или анамнеза за конвулсивни инциденти при прилагане на лекарството, свръхчувствителност към някои от помощните вещества
- II - III степен на атриовентрикуларен (AV) блок и нарушения във вътрекамерната проводимост
- Синдром на Adam - Stokes, силно изразена брадикардия, синдром на болния синусов възел
- Кардиогенен шок
- Значително увреждане на левокамерната функция



4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Особено внимание е необходимо при приложението в случаите на увредена чернодробна функция, циркулаторна недостатъчност, хипотония, неадекватна бъбречна функция и епилепсия, при които е необходима редукция на дозата. Да се прилага с особено внимание в случаите на наранена лигавица, при пациенти в напреднала възраст и/или пациенти с намалени защитни сили и такива, които вече използват лекарствен продукт на основата на lidocaine за лечение на сърдечно заболяване.

При деца под 2 годишна възраст се предпочита използването на памучен тампон, напоен с Lidocain spray.

В момента на приложението му спрехт причинява усещане за парене.

В момента на приложение флаконът трябва да се държи изправен. Аерозолът не трябва да попада в очите, а също и в дихателните пътища (риск от аспирация)

Фарингеалното приложение изисква особено внимание.

Преди прилагане на лекарството при фарингеална или ринофарингеална хирургия, трябва да се има предвид следното: lidocaine потиска фарингеалния рефлекс и достига ларинкса и трахеята, като потиска също и кашличния рефлекс, което може да доведе до бронхопневмония. Поради риска от аспирация спрехт е противопоказан когато се използва гипс като импресионен материал при вземане на отпечатък за зъбна протеза. Lidocain spray не се препоръчва за локална анестезия преди тонзилектомия и аденотомия при деца под 8 години.

Горепосочените предпазни мерки са от особена важност при децата, защото техният гълтателен рефлекс се включва по-често отколкото при възрастни.

Алергични реакции възникват изключително рядко при приложение на Lidocain spray.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

Следните лекарствени вещества предизвикват повишаването на серумното ниво на lidocaine: chlorpromazine, cimetidine, propranolol, pethidine, bupivacain, quinidine, disopyramide, amitriptyline, imipramine, nortriptyline.

Комбинацията с I/a тип агенти (напр. Quinidine, procainamide, disopyramide) води до удължаване на Q-T сегмента и рядко до атриовентрикуларен блок или камерно мъждене.

Phenytoin увеличава кардиодепресивния ефект на lidocaine.

Комбинацията на lidocaine с procainamide може да индуцира неврологични нежелани реакции (делир, халюцинации).



Lidocaine може да потенцира ефекта на нервномускулните блокери, тъй като той потиска предаването в нервномускулния синапс.

В случай на дигиталисова интоксикация *lidocaine* може да увеличи тежестта на съществуващия AV блок.

Злоупотребата с алкохол увеличава потискащия дихателната функция ефект на *lidocaine*.

4.6. Бременност и кърмене

Не са провеждани контролирани клинични проучвания с лекарствения продукт при бременни жени. Затова използването му при бременни изисква внимателна преценка на съотношението полза / риск, същата внимателна преценка се налага и при кърмачки.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма ограничения за шофиране и извършване на дейности с повишен риск освен ако се появят смущаващи нежелани лекарствени реакции.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Има усещане за леко щипене (парене) по време на прилагането на *Lidocain*. То изчезва с развитието на анестезиращ ефект (в рамките на 1 минута).

Алергични реакции (анафилактичен шок) след прилагане на *Lidocain spray* се развиват много рядко.

Нежелани реакции от страна на централната нервна система (ЦНС), например нервност и/или депресия и от страна на сърдечно-съдовата система, например хипотония, брадикардия, се появяват много рядко.

4.9. Предозиране

Ефекти върху централната нервна система (ЦНС) и сърдечно-съдовата система са били наблюдавани при случаи на предозиране на *lidocaine*. В такива случаи трябва да се поддържат свободни дихателните пътища и да се подава кислород и/или изкуствено дишане.

В случай на конвулсии, последните се третират с 50 - 100 mg succinylcholine и/или 5 - 15 mg diazepam. Кратко действащите барбитурати, а също и thiopental могат да бъдат полезни.

Хемодиализата е неефективна в острата фаза на предозирането на *lidocain*.

Atropine може да се използва за овладяването на симптомите от страна на сърдечно-съдовата система. 0.5 - 1.0 mg atropine, приложен i.v. може да



коригира брадикардията и нарушенията в проводимостта, докато при развитие на хипотония се прилагат симпатомиметици заедно с бета-рецепторни агонисти.

При сърдечен арест от основно значение се явява незабавното започване на сърдечен масаж.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамични свойства

Lidocaine представлява локален анестетик от амиден тип, със стабилизиращ мембраната ефект и е антиаритмичен агент от групата I/b по класификацията на Vaughan William. Анестезиращият му ефект се дължи на потискане на генерирането на нервните импулси и потискане провеждането на възбуждението. Механизмът на действие на локалните анестетици, включително *lidocaine*, е намаление на пермеабилитета на невронната мембрана за натриеви йони. Прагът на електричната възбудимост нараства постепенно под влияние на лекарственото вещество и поради това провеждането се блокира.

Когато се приложи локално на лигавица, *lidocaine* се резорбира в различна степен в зависимост от дозата и мястото на апликация. Степента на перфузия на лигавицата повлиява резорбцията на лекарството. Ефектът на *Lidocain spray* се развива напълно за 1 минута, а продължава 5-6 минути. Причиненото от лекарството изтръпване изчезва постепенно за около 15 минути. В терапевтични дози лекарственото вещество не повлиява сърдечната честота и няма отрицателен инотропен ефект (няма кардиодепресивен ефект).

5.2. Фармакокинетични свойства

МЕТАБОЛИЗЪМ

Lidocaine бързо се метаболизира от чернодробните микрозомални ензими, като оксидативното N-деалкилиране започва след няколко минути. Скоростта на метаболизиране вероятно е ограничена от чернодробния кръвен ток, и като резултат, може да бъде намалена при пациенти след миокарден инфаркт и/или конгестивна сърдечна недостатъчност. *Lidocain* се метаболизира до *monoethylglycinexylidide* (MEGX) и *glycinexylidide*. И двата метаболита са с много по-слабо изразена антиаритмична активност от началната съставка.

РАЗПРОСТРАНЕНИЕ В ТЪКАНИТЕ

Разпространението става в:

- Тъкани: лекарственото вещество се разпространява предимно в добре перфузираните тъкани: бъбреци, бели дробове, черен дроб и сърце, а също и в мастната тъкан.
- Плацентата: *lidocaine* преминава плацентарната бариера чрез пасивна



дифузия. Преминаването през плацентата може да причини преминаването на лекарственото вещество в плода, където нивото на lidocaine да достигне токсични стойности. Лекарството преминава през плацентата бързо и може да се открие във феталната циркулация няколко минути след приложението му при майката.

- Свързване с плазмени протеини: Зависи от концентрацията на лекарството в плазмата и от концентрацията на α -1-acid glycoprotein (AAG). Свързването на lidocaine с плазмените протеини е съобщавано в диапазона 33% до 80%. Показано е, че свързването се увеличава при уремични и при бъбречно-трансплантирани пациенти, а също и прекаран остър инфаркт на миокарда. Последният е съпроводен също и с увеличение на нивото на AAG. Повишеното свързване на lidocaine може да намали нивото на свободния lidocaine и дори да доведе до увеличение на общата плазмена концентрация на лекарственото вещество.

ЕКСКРЕЦИЯ

Приблизително 90% от лекарственото вещество се екскретира под формата на метаболити, а 10% се екскретира непроменен чрез бъбреците. Уринната екскреция на непроменения лекарството частично зависи от рН на урината. Съобщава се, че при кисело рН на урината се увеличава екскрецията на лекарството.

Не е ясно дали lidocaine се екскретира с кърмата. Затова се изисква внимание при прилагане на лекарствения продукт при кърмачки.

Полуживотът на лекарственото вещество е по-дълъг при пациенти с чернодробни заболявания. Препоръчва се 40% редукция на дозата при пациенти с чернодробно заболяване и/или сърдечна недостатъчност.

5.3. Предклинични данни за безопасност

ТОКСИЧНОСТ ПО ОТНОШЕНИЕ НА РЕПРОДУКТИВНИТЕ СПОСОБНОСТИ

Проучвания при животни показват, че при дози до 6.6 пъти по-високи от терапевтичните, lidocaine не причинява увреждания на плода. Няма проведени добре контролирани проучвания с бременни жени. Внимателна преценка се изисква преди да се приложи lidocaine при жени във фертилна възраст и особено в първия триместър на бременността.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Peppermint oil, Ph. Eur., Propylene Glycol, Ph. Eur., Ethanol 96% BP.



6.2. Несъвместимости

Lidocaine преципитира ако се смеси с *amphotericin*, *methohexitone* или *sulphadiazine*. В зависимост от рН на разтвора *lidocaine* може да бъде несъвместим с *ampicilline*. Тази информация не е приложима за лекарствена форма дермален спрей.

6.3. Срок на годност

5 години

6.4. Специални условия за съхранение

Да се съхранява от 15-25⁰С и да се пази от нагряване.

6.5. Данни за опаковката

Прозрачен флакон от кафяво стъкло с помпичка от високоплътен полиетилен, пластичен актуатор от нископлътен полиетилен и капачка от пластмаса. Флаконът съдържа $38g \pm 10\%$, пълнен е с безцветен или бледожълт разтвор с подобна на ментол миризма и горчив и подобен на ментол вкус. Броят на впръскванията от един флакон е не по-малък от 650. Флаконът и листовката с информация за пациента са поставени в картонена кутия.

6.6. Препоръки при употреба/манипулиране

Виж точка 4.2.

7. ПРОИЗВОДИТЕЛ

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38.
HUNGARY
Phone: (36-1) 469 2222
Fax: (36-1) 383 9253

 7

8. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

EGIS PHARMACEUTICALS LTD.
1106 BUDAPEST, Kereszturi ut 30-38.
HUNGARY
Phone: (36-1) 469 2222
Fax: (36-1) 383 9253

9. РЕГИСТРАЦИОНЕН НОМЕР

№. 9700571
Протокол П-880/05.11.1997

10. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШЕНИЕ ЗА УПОТРЕБА

11. ДАТА НА ПОСЛЕДНА РЕДАКЦИЯ НА ТЕКСТА

Март, 2004 г.