

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

ANESTOL pomad

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin madde: Her 30 gramlık tüp
Lidokain baz %5 içerir.

Yardımcı maddeler:

Her 30 gramlık tüp

Propil paraben	0.021 g
Metil paraben	0.009 g
Propilen glikol	11.970 g

Yardımcı maddeler için 6.1'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Pomad

Beyaz renkte, homojen, kıvamlı pomad.

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1. Terapötik endikasyonlar

- Deri ve mukozanın yüzeysel yanıkları
- Çeşitli nedenlere bağlı kaşıntılar
- Meme ucu, anüs, dudak çatlakları ve ağrıları
- Endotrakeal entubasyon uygulamasında anestezik lubrikan olarak

4.2. Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Gerektiğinde birkaç defa kullanılabilir.

Bir seferde uygulanan lidokain dozu 250 mg'ı aşmamalıdır. Bu miktar 5 gram ANESTOL'e karşılık gelir. Günlük 17-20 g ANESTOL (850-1000 mg lidokaine eşdeğer) dozu aşılmamalıdır.

Çok geniş yüzeye, çok sık uygulama ile hipersensitivite ortaya çıkabileceğinden bu şekilde kullanılması önerilmez.

ANESTOL, sınırlı bir süre boyunca kullanım içindir. Tedavi süresi, on gün ila üç hafta arasında değişir. Eğer tedavi daha uzarsa, özellikle lidokainin neden olduğu bir irritasyondan şüpheleniliyorsa, tedaviler arasına bir zaman verilmelidir. Tedaviye ara verildikten sonra lokal irritasyon ortadan kalmış ise, lidokaine karşı olası hassasiyet yama testi gibi yöntemlerle incelenmelidir.

Uygulama şekli:

Doktor tarafından başka bir şekilde önerilmediği takdirde; hasta bölgeye uygun bir miktar iyice yedirilerek sürülür.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Böbrek yetmezliği:

Sistemik lidokain uygulamasında toksisite görülebilir ancak harici uygulamada doz ayarlaması gerekmemektedir.

Karaciğer yetmezliği:

Lidokain karaciğerde metabolize olduğundan, karaciğer fonksiyon bozukluğu olan hastalarda lidokainin yarı ömrü uzayabilir. Şiddetli karaciğer yetmezliğinde ilacın daha küçük alanlara uygulanması düşünülebilir.

Pediyatrik popülasyon

Çocuklara uygulanacak doz daha düşük olmalı; çocuğun yaşı, kilosu ve fiziksel durumuna uygun olmalıdır.

Geniş ve zarar görmüş yüzeylere uygulanırken, lidokainin sistemik absorpsiyonunun artabileceği göz önünde bulundurulmalıdır.

Geriatrik popülasyon

Topikal kullanım ile ilgili olarak bu hasta grubuna ait herhangi bir bilgi bulunmamaktadır. Ancak yaşlılarda hastanın yaşı ve fiziksel durumuyla ilişkili olarak azaltılmış doz verilmelidir.

4.3. Kontrendikasyonlar

Lidokain, amid tipi anestezipler veya ANESTOL'un içeriğindeki maddelere karşı aşırı duyarlılığı olanlarda kullanılmamalıdır.

ANESTOL, tedavi edilmemiş bakteriyel, viral, patojenik mantar veya parazitik orijinli enfeksiyonu olan hastalarda kullanılmamalıdır. ANESTOL, hastane dışında sınıf III anti-aritmik ilaçla tedavi edilen hastalar tarafından kullanılmamalıdır (bkz. Bölüm 4.4 ve 4.5).

4.4. Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

Sepsis ve ilacın uygulandığı mukozanın ciddi olarak hasar görmesi durumunda, ani sistemik emilim riski olabileceğinden, ANESTOL uygulanırken dikkatli olunmalıdır.

Yüksek plazma düzeyleri ve ciddi yan etkileri önlemek amacıyla yeterli etkinin sağlandığı, mümkün olan düşük dozlar kullanılmalıdır. Tekrarlanan dozlarda ilacın veya metabolitlerinin birikmesi nedeniyle kan düzeylerinde artış görülebilir. Yüksek kan düzeylerine gösterilen tolerans hastanın durumuna göre değişir. Yaşlılarda, çocuklarda ve akut hastalarda hastanın yaşı ve fiziksel durumuyla ilişkili olarak azaltılmış doz verilmelidir.

ANESTOL bilinen ilaç alerjisi olan hastalarda dikkatli kullanılmalıdır. Para-aminobenzoik asit türevlerine (prokain, tetrakain, benzokain gibi) alerjisi olan hastalarda lidokaine karşı çapraz duyarlılık görülmemiştir; ancak lidokain, özellikle etiyolojik ajanın kesin olarak bilinmediği durumlar olmak üzere ilaç duyarlılığı öyküsü olan hastalarda dikkatle kullanılmalıdır. Şiddetli karaciğer hastalığı olan hastalar lokal anestezipleri normal şekilde metabolize edemediklerinden, bu hastalarda lidokainin toksik plazma konsantrasyonlarının gelişme riski daha yüksektir.

ANESTOL ciddi kalp rahatsızlığı olanlarda dikkatli verilmelidir.

Özellikle geniş deri yüzeylerine ve bilhassa da oklüzyon altında uygulandığında kalp ritm bozuklukları, nefes alma zorluğu, koma ve hatta ölüme yol açabilmektedir.

Hayvan çalışmalarında şiddetli göz tahrişi gözlenmiş olduğundan, lidokainin gözle temasından kaçınılmalıdır. Ayrıca, koruyucu reflekslerin kaybı nedeniyle kornea tahrişi ve potansiyel abrazyon olasılığı da vardır. Lidokainin konjonktival dokulardaki emilimi belirlenmemiştir. Gözle temas gerçekleştiği takdirde göz derhal su veya salin ile yıkanmalı ve duyu geri gelinceye kadar göz korunmalıdır.

Hastalar lidokain kullanırken, dermal analjeziye tedavi uygulanan bölgedeki tüm duyuların bloke olmasının eşlik edebileceğinin bilincinde olmalıdır. Bu nedenle, hastalar tedavi uygulanan bölgede duyular tamamen geri gelinceye kadar bu bölgede kazara travma oluşturan durumlardan (kaşıma, ovuşturma ya da aşırı ısıya ya da soğuğa maruz bırakma) kaçınılmalıdır.

Lidokain, %0.5'in üzerindeki konsantrasyonlarda bakterisit ve antiviral özellikler göstermektedir. Bu nedenle, canlı aşılardan (BCG aşısı gibi) intrakütan enjeksiyonlarının sonuçları izlenmelidir.

Sınıf III anti-aritmik ilaçlar (örneğin; amiodaron veya sotalol) ile tedavi edilen hastalar, yakın gözlem altında tutulmalı ve EKG izlemesi göz önünde bulundurulmalıdır.

ANESTOL, sınırlı bir süre boyunca kullanım içindir. Lidokainin aşırı dozajı veya dozlar arasındaki kısa aralar, yüksek lidokain plazma seviyeleri ve ciddi advers etkilerle sonuçlanabilir. Hastalar, tavsiye edilen dozaja katı bir şekilde bağlı kalmalıdır.

Uygulama bölgesinde enfeksiyon varsa, ANESTOL ile birlikte uygun antibakteriyel, antiviral veya antifungal tedavi uygulanmalıdır.

Kullanmadan önce malignite olasılığı hariç bırakılmalıdır.

Eğer rektal kanama ve irritasyon olursa tedaviye son verilmelidir.

Rektumdan sistemik absorpsiyon olabilir ve yüksek dozda rektal uygulamayla konvülsiyon gibi merkezi sinir sistemi yan etkileri gözlenir.

ANESTOL, muhtemelen porfirinojeniktir ve daha güvenli bir alternatif olduğunda sadece akut porfirisisi olan hastalara reçetele edilmelidir. Uygun önlemler savunmasız hastalar için alınmalıdır.

Bu tıbbi ürün her dozunda 0.009 g metil paraben ve 0.021 g propil paraben (hidroksibenzoat) içermektedir. Alerjik reaksiyonlara (muhtemelen gecikmiş) sebebiyet verebilir.

Bu tıbbi ürün her dozunda 11.970 g propilen glikol içermektedir. Ciltte iritasyona neden olabilir.

4.5. Diğer tıbbi ürünler ile etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

Lidokain, Sınıf I antiaritmik ilaçlar (tokainid ve meksiletin gibi) alan hastalarda dikkatle kullanılmalıdır; çünkü toksik etkiler aditif ve genellikle sinerjiktir.

Lidokainin klerensini azaltan ilaçlar (örn. simetidin ya da propranolol gibi betablokörler), lidokainin tekrarlanan yüksek dozlarda uzun bir süre boyunca uygulanması halinde potansiyel olarak toksik plazma konsantrasyonlarına neden olabilir. Dolayısıyla, lidokain (örn.

ANESTOL) ile tavsiye edilen dozlarda kısa dönemli tedavileri takiben bu tür etkileşimlerin klinik önem taşımaması beklenir.

Başka lokal anestezipler kullanmakta olan hastalara yüksek dozlarda ANESTOL'un uygulandığı durumlarda ek sistemik toksisite riski göz önünde bulundurulmalıdır.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler

Pediyatrik popülasyon:

Etkileşim çalışması yapılmamıştır.

Geriatrik popülasyon:

Etkileşim çalışması yapılmamıştır.

4.6. Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi: B

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

Doğum kontrolü üzerine etkileri ile ilgili veri bulunmamaktadır.

Gebelik dönemi

Hayvan çalışmaları, gebelik üzerine etki, embriyonal / fetal gelişim üzerine etkiler açısından yetersizdir.

Lidokain ile gebeliklerde maruz kalmaya ilişkin klinik veri mevcut değildir. Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalar, gebelik/embriyonal/fetal gelişim/doğum ya da doğum sonrası gelişim ile ilgili olarak doğrudan ya da dolaylı zararlı etkiler olduğunu göstermemektedir.

Gebe kadınlara uygulanırken dikkatli olunmalıdır.

Laktasyon dönemi

Lidokain anne sütüne geçer, emziren annelere uygulanırken dikkatli olunmalıdır.

Üreme yeteneği / Fertilite

Lidokainin sıçan ve tavşanlarda yapılan deneylerde fetusa herhangi bir zararı olmadığı tespit edilmiş olmasına rağmen kadınlarda fetus üzerine etkisi bilinmediğinden özellikle gebeliğin erken dönemlerinde dikkatli olunmalıdır.

4.7. Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Lidokain lokal olarak uygulandığında, araç ve makine kullanımına herhangi bir etkisi yoktur.

4.8. İstenmeyen etkiler

Lidokainin yan etkileri diğer amid tipi lokal anesteziplerin yan etkilerine benzerdir.

Bu yan etkiler genellikle doza bağımlıdır ve yüksek dozda uygulama veya hızlı absorpsiyon nedeniyle yüksek plazma konsantrasyonlarının ortaya çıkması sonucu meydana gelebilir. Bunun yanında aşırı duyarlılık, idiosenkrazi ve tolerans azalmasına bağlı reaksiyonlar da oluşturabilir. Ciddi yan etkiler genellikle sistemiktir. Bu reaksiyonlar arasında sinirlilik, baş dönmesi, görme bozuklukları, tremor, konvülsiyonlar sayılabilir.

Advers etkiler sıklıklarına göre şu şekilde tanımlanmaktadır:

Çok yaygın ($\geq 1/10$); yaygın ($\geq 1/100$ ila $< 1/10$); yaygın olmayan ($\geq 1/1000$ ila $< 1/100$); seyrek ($\geq 1/10.000$ ila $< 1/1000$); çok seyrek ($< 1/10.000$), bilinmiyor (eldeki verilerden hareketle tahmin edilemiyor).

Bağıışıklık sistemi hastalıkları

Yaygın olmayan: Alerjik reaksiyonlar (genellikle parenteral tedavi sonrası görülür). Uzun dönem topikal kullanım sonrası hipersensitivite oluşabilir.

Deri ve deri altı doku bozuklukları

Yaygın: Ciltte irritasyon, kızarıklık, kaşıntı veya döküntü.

Kazara gözle temasından sonra korneada irritasyon gözlenmiştir.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yarar/risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TÜFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir (www.titck.gov.tr; e-posta: tufam@titck.gov.tr; tel: 0 800 314 00 08; faks: 0 312 218 35 99).

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Akut durumlar lokal anesteziğin terapötik kullanımı sırasında karşılaşılan yüksek plazma düzeyleriyle ilgilidir.

Sistemik toksisite belirtileri; bulanık görüş, sersemlik veya uyuşukluk, nefes almada zorluk, titreme, göğüs ağrısı veya düzensiz kalp atışı olabilir.

Topikal kullanımda aşırı doz mümkün olmamakta birlikte ortaya çıkması halinde nefes yolunu açık bulundurmamak gerekir. Konvülsiyonlara karşı antikonvülsif ajanlar kullanılabilir. Bir tüp ilacın kazara yutulması halinde, oral biyoyararlanım düşüktür ancak hipotansiyon ve kalp bloğu görülebilir. Bu durumda uygun resüsitasyon önlemleri uygulanmalıdır.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1. Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik grup: Lokal anesteziğin ve antipruritikler
ATC kodu: D04AB01

Anestol pomad topikal anesteziğin bir madde olan lidokain ihtiva eder. Suda eriyen baz içinde hazırlanmıştır. Lidokain uyarının başlaması ve iletilmesi için gereken iyon akışını inhibe ederek sinir hücresi membranını stabilize eder ve lokal anestezi oluşumunu sağlar. Etkinin başlaması 3-5 dk içinde olur.

Lidokainin yüksek plazma düzeylerine ulaşması kalp debisi, total periferik direnç ve ortalama kan basıncında değişikliklere neden olur. Bu değişiklikler, lokal anesteziğin ilacın kardiyovasküler sistemin çeşitli bileşenleri üzerine doğrudan depresan etkili olarak otonomik sinir liflerinin bloke edilmesine bağlı olabilir.

5.2. Farmakokinetik özellikler

Genel özellikler

Emilim:

Lidokain topikal uygulamayı takiben mukoz membranlardan emilebilir. Emilim hızı ve miktarı; uygulama bölgesi, süresi, konsantrasyon ve toplam dozaja bağlıdır. Lidokain, aynı zamanda gastrointestinal kanaldan da iyi emilir, ancak bir miktar değişmemiş ilaç karaciğerde biyotransformasyon nedeniyle dolaşımda tespit edilmiştir.

Dağılım:

Plazma proteinlerine bağlanması, ilaç konsantrasyonu ile ilişkilidir ve bağlı fraksiyon artan ilaç konsantrasyonu ile düşer. 1-4 µg/ml serbest baz konsantrasyonunda, % 60-80 oranında lidokain proteinlere bağlı bulunur. Bağlanma aynı zamanda alfa-1-asit-glikoprotein plazma konsantrasyonuna bağlıdır. Lidokain, kan-beyin ve plasental bariyerleri büyük ihtimalle pasif difüzyon ile geçer.

Biyotransformasyon:

Lidokain, karaciğerden hızla biyotransformasyona uğrar ve metabolitleri ile değişmemiş ilaç böbrekler yolu ile atılır. Yaklaşık % 90'ı çeşitli metabolitleri şeklinde karaciğerde metabolize olur.

Eliminasyon:

Lidokainin yaklaşık %10'u böbrekler yoluyla değişmeden atılır. İdrarda rastlanan başlıca metaboliti 4-hidroksi-2,6-dimetilanilin bir konjugatıdır. Lidokain metabolizmasına ilişkin çalışmalarda, intravenöz bolus lidokain enjeksiyonunu takiben lidokainin eliminasyon yarı ömrü 1.5-2 saat olarak gösterilmiştir.

Doğrusallık/doğrusal olmayan durum:

Veri bulunmamaktadır.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Böbrek / karaciğer yetmezliği:

Lidokain karaciğerden hızlı bir şekilde metabolize olduğundan, karaciğer fonksiyonlarının etkilenmesi durumunda lidokainin kinetiği değişebilir.

Böbrek yetmezliği lidokain kinetiğini etkilemez ancak metabolitlerin vücutta birikimini artırabilir.

5.3. Klinik öncesi güvenlik verileri

Lidokainin mutajenik ve kanserojenik potansiyelini ve fertilite üzerine etkilerini değerlendirmek için yeterli çalışma yapılmamıştır.

Lidokain HCl'in mutajenik potansiyeli Ames Salmonella/mammalian mikrozom testiyle, insan lenfositindeki yapısal kromozom sapmasının *in vitro* analiziyle ve *in vivo* fare mikronukleus analizi ile test edilmiştir. Bu testlerde herhangi bir mutajenik etki belirtisi görülmemiştir. 2,6-ksilidin ve lidokain metabolitinin mutajenisitesi karma sonuçlu farklı testlerle çalışılmıştır. Sadece metabolik aktivasyon şartlarındaki Ames testinde bileşik zayıf mutajenik bulunmuştur. İlave olarak, aktivasyonlu veya aktivasyonsuz timidin kinaz yerinde indüklenmiş kromozom sapmasında ve solüsyon konsantrasyonunun 1.2 mg/ml olduğu kardeş

kromatografik değişimlerde, 2,6-ksilidinin mutajenik olduğu gözlenmiştir. *In vivo* denemelerinde genotoksisite kanıtı bulunmamıştır.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1. Yardımcı maddelerin listesi

Polietilen glikol 1500
Polietilen glikol 6000
Propilen glikol
Metil paraben
Propil paraben

6.2. Geçimsizlikler

Mevcut değildir.

6.3. Raf ömrü

36 ay.

6.4. Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

6.5. Ambalajın niteliği ve içeriği

10 g ve 30 g'lık alüminyum tüp

6.6. Beşeri tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da materyaller “Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği” ve “Ambalaj ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmeliği”ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Sandoz İlaç San. ve Tic. A.Ş.
Küçükbakkalköy Mah. Şehit Şakir Elkovan Cad.
No:15A 34750 Ataşehir/İstanbul

8. RUHSAT NUMARASI

82/21

9. İLK RUHSAT TARİHİ / RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 08.07.1966

Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ
