

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

LOKALEN pomad

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin Madde: Her tüp % 5 lidokain baz içerir.

Yardımcı Maddeler: Her 30 gramlık tüpte;

Metil paraben	0.0075 g
Propil paraben	0.0045 g
Setostearil alkol	2.160 g

Yardımcı maddeler için 6.1' e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Pomad

Beyaz renkte, homojen pomad.

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1 Terapötik Endikasyonları:

- Deri ve mukozanın yüzeysel yanıklar
- Çeşitli nedenlere bağlı kaşıntılar
- Meme ucu, anüs, dudak çatlakları ve ağrıları
- Endotrakeal entubasyon uygulamasında anesteziik 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 g LOKALEN'e karşılık

gelir. Günlük 17-20 g LOKALEN (850-1000 mg lidokaine eşdeğer) dozu aşılmamalıdır.

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

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.

4.3 Kontrendikasyonlar

Lidokain, amid tipi anestezikler veya LOKALEN'in içeriğindeki maddelere karşı aşırı duyarlılığı olanlarda kullanılmamalıdır.

4.4 Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

Sepsis ve ilacın uygulandığı mukozanın ciddi olarak hasar görmesi durumunda, ani sistemik emilim riski olabileceğinden, LOKALEN 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.

LOKALEN bilinen ilaç alerjisi olan hastalarda dikkatli kullanılmalıdır. Para-aminobenzoik asit türevlerine (prokain, tetrakain, benzokain gibi) alerjisi olan hastalarda lidokaine karşı çapraz duyarlılık görülmemiştir.

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

Bu tıbbi ürün her dozunda 1.30 mg metil paraben ve 0.80 mg propil paraben (hidroksibenzoat) içermektedir. Alerjik reaksiyonlara (muhtemelen gecikmiş) sebebiyet verebilir.

Bu tıbbi ürün her dozunda 360.0 mg setostearil alkol içermektedir. Lokal deri reaksiyonlarına (örneğin, kontak dermatite) sebebiyet verebilir.

4.5 Diğer tıbbi ürünler ile etkileşim ve diğer etkileşim şekilleri

LOKALEN'in lokal uygulanmasıyla ilgili olarak, literatürde herhangi bir ilaçla etkileşim bildirilmemiştir.

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)

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

Gebelik dönemi

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 anesteziklerin yan etkilerine benzerdir. Bu yan etkiler genellikle doza bağlıdır 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).

Bağışıklık 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 iritasyon, kızarıklık, kaşıntı veya döküntü.

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

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

Topikal kullanımda aşırı doz mümkün olmamakla birlikte ortaya çıkması halinde nefes yolunu açık bulundurmak 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 anestezikler ve antipruritikler

ATC kodu: D04AB01

LOKALEN pomad topikal anestezik 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 anestezik 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-dimetilanilinin 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 güvenlilik 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-ksilidinin 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

Metil paraben
Propil paraben
Dipotasyum hidrojen fosfat
Emulgin B2
Setostearil alkol
Vazelin
Deiyonize su

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

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:

TOPRAK İLAÇ ve KİM. MAD. SAN. Ve TİC. A.Ş.

Toprak Center, İhlamur Yıldız Cad. No: 10,

34353 Beşiktaş / İSTANBUL

Tel : +90 (212) 326 30 97

Faks: +90 (212) 236 87 29

E-mail: ilac@toprak.com.tr

8. RUHSAT NUMARASI

159/66

9. İLK RUHSAT TARİHİ / RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi : 16.03.1992

Ruhsat yenileme tarihi : 28.06.2004

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ