

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Trachisan 8 mg, pastylki

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda pastylka zawiera: 8 mg lidokainy chlorowodoru (w postaci lidokainy chlorowodoru jednowodnego).

Substancje pomocnicze:

Każda pastylka zawiera 0,68 g sorbitolu.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

### 3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Pastylka

Opis: biała, okrągła, płaska pastylka ze ściętymi krawędziami.

### 4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

#### 4.1 Wskazania do stosowania

Krótkotrwałe, miejscowe leczenie bólu związanego z nieropnymi zakażeniami gardła.

#### 4.2 Dawkowanie i sposób podawania

*Dorośli:*

1 pastylkę ssąć co 2 godziny.

Nie należy przekraczać maksymalnej dawki dobowej 6 pastylek.

Nie należy stosować pastylek przez okres dłuższy niż 3 dni.

Jeśli ciężkie zapalenie gardła lub ból gardła trwa dłużej niż 2 dni i towarzyszy mu gorączka, bóle głowy, nudności lub wymioty, pacjent powinien skontaktować się z lekarzem.

*Młodzież:*

Trachisan 8 mg nie jest zalecany do stosowania u dzieci w wieku od 12 do 17 lat ze względu na niewystarczającą ilość danych dotyczących skuteczności i bezpieczeństwa stosowania (patrz punkt 4.4).

*Dzieci:*

Nie należy stosować tego produktu leczniczego u dzieci w wieku poniżej 12 lat (patrz punkt 4.3).

Trachisan 8 mg jest przeznaczony do stosowania w obrębie jamy ustnej i gardła i powinien rozpuszczać się powoli w jamie ustnej.

### 4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na chlorowoderek lidokainy, środki miejscowo znieczulające z grupy amidów lub na którąkolwiek substancję pomocniczą.

Pacjenci w wieku poniżej 12 lat nie powinni stosować produktu Trachisan 8 mg (patrz punkt 4.4).

### 4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Trachisan 8 mg zawiera sorbitol.

Nie należy stosować tego produktu u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją fruktozy. Sorbitol może powodować zaburzenia żołądkowo-jelitowe i biegunkę.

Lidokaina jest metabolizowana głównie w wątrobie, a metabolity są wydalane głównie przez nerki. U pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby i (lub) nerek, stężenia lidokainy oraz jej metabolitów w osoczu mogą być zwiększone.

To działanie nie ma znaczenia klinicznego, jeśli lidokaina jest podawana w postaci pastylek.

Środki miejscowo znieczulające mogą powodować zaburzenia połykania i zwiększać niebezpieczeństwo zachłyśnięcia, zwłaszcza u małych dzieci, ze względu na częstotliwość spożywania posiłków (patrz punkt 4.3). Należy unikać przyjmowania pokarmu lub napojów bezpośrednio po zastosowaniu pastylek. Zdrętwienie języka lub błony śluzowej policzków może zwiększać ryzyko urazu spowodowanego przygryzieniem. Ze względu na zmniejszoną wrażliwość na ciepło, istnieje zwiększone ryzyko wystąpienia oparzeń błony śluzowej jamy ustnej oraz gardła, spowodowanych gorącymi napojami oraz pokarmem. Wielokrotne stosowanie może powodować zdrętwienie gardła, co powoduje trudności w przełykaniu.

Nie zaleca się stosowania produktu Trachisan 8 mg u dzieci w wieku od 12 do 17 lat, ze względu na niewystarczającą ilość danych dotyczących skuteczności i bezpieczeństwa stosowania.

Trachisan 8 mg należy stosować z ostrożnością u pacjentów z ciężkimi uszkodzeniami i (lub) zapaleniem błony śluzowej jamy ustnej i gardła, zwłaszcza u pacjentów z chorobami układu sercowo-naczyniowego oraz powodującymi drgawki.

U pacjentów ze znaną alergią na inne amidowe środki znieczulające miejscowo w wywiadzie, należy się spodziewać alergii krzyżowej na chlorowoderek lidokainy.

W celu uniknięcia innych powikłań nie należy stosować produktu Trachisan 8 mg przez okres dłuższy niż 2 dni bez konsultacji z lekarzem, zwłaszcza jeśli występuje ciężkie zapalenie gardła lub utrzymuje się ból gardła z towarzyszącą gorączką, bólem głowy, nudnościami lub wymiotami.

### 4.5 Interakcje z innymi lekami i inne rodzaje interakcji

Chociaż nie ma to znaczenia klinicznego w przypadku stosowania lidokainy w postaci pastylek, opisano następujące interakcje lidokainy:

Cymetydyna może zmniejszać metabolizm lidokainy, poprzez hamowanie wątrobowych enzymów mikrosomalnych, co może powodować zwiększenie stężenia lidokainy.

Leczenie preparatami blokującymi receptory beta-adrenergiczne może zmniejszać przepływ krwi przez wątrobę, co może powodować zmniejszenie metabolizmu lidokainy.

Jednoczesne stosowanie propranololu może powodować zwiększenie stężenia lidokainy w osoczu o około 30%. Nie można wykluczyć konkurencji o wątrobowe enzymy mikrosomalne, które biorą udział w metabolizmie.

Leki indukujące wątrobowe enzymy mikrosomalne, jak np. benzodiazepiny i barbiturany, mogą przyspieszać metabolizm lidokainy, co powoduje zmniejszenie stężenia lidokainy.

#### **4.6 Ciąża i laktacja**

##### *Ciąża*

Nie są dostępne kontrolowane badania kliniczne przeprowadzone u kobiet w ciąży. Ograniczone dane dotyczące ekspozycji na preparat podczas ciąży nie wykazują powstawania wad rozwojowych.

Po podaniu pozajelitowym lidokaina przenika przez łożysko.

W badaniach przeprowadzonych na zwierzętach, działania niepożądane na płód podczas ekspozycji na lidokainę w okresie prenatalnym, były obserwowane tylko po dużych dawkach (patrz punkt 5.3). Nie należy stosować produktu Trachisan 8 mg w okresie ciąży, chyba że jest to bezwzględnie konieczne.

##### *Laktacja*

Jeśli Trachisan 8 mg jest stosowany zgodnie z zaleceniami, lidokaina przenika do mleka kobiecego w tak małych ilościach, że niebezpieczeństwo dla dziecka karmionego piersią jest mało prawdopodobne.

#### **4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu**

Trachisan 8 mg nie ma wpływu na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie urządzeń mechanicznych w ruchu.

#### **4.8 Działania niepożądane**

Bardzo często:  $>1/10$

Często:  $>1/100$  i  $<1/10$

Niezbyt często:  $>1/1000$  i  $<1/100$

Rzadko:  $>1/10\,000$  i  $<1/1000$

Bardzo rzadko:  $<1/10\,000$ , w tym pojedyncze przypadki

Możliwe działania niepożądane po podaniu preparatu Trachisan 8 mg są podobne do tych, których zwykle należy się spodziewać po innych amidowych środkach znieczulających miejscowo.

Ogólnoustrojowe działania niepożądane występują tylko wtedy, gdy stężenie lidokainy w osoczu wynosi więcej niż 5-10 µg/ml. W związku z powyższym, z powodu niewielkiej szybkości wchłaniania, nie należy się spodziewać wystąpienia ogólnoustrojowych działań niepożądanych po zastosowaniu produktu Trachisan 8 mg.

##### *Zaburzenia układu immunologicznego*

Bardzo rzadko ( $< 1/10\,000$ ): mogą wystąpić reakcje nadwrażliwości lub podrażnienie w jamie ustnej.

##### *Zaburzenia żołądka i jelit*

Rzadko ( $> 1/10\,000$  i  $< 1/1000$ ): zaburzenia smaku lub drętwienie języka. Te objawy zwykle ustępują po krótkim czasie.

Bardzo rzadko ( $< 1/10\,000$ ): działanie przeczyszczające spowodowane zawartością sorbitolu.

#### **4.9 Przedawkowanie**

Przedawkowanie lidokainy występuje po zażyciu zbyt dużej liczby pastylek. Przedawkowanie lidokainy może powodować przemijające pobudzenie ośrodkowego układu nerwowego z wczesnymi

objawami, takimi jak: ziewanie, niepokój, zawroty głowy, nudności, wymioty, dysfagia, ataksja, zaburzenia słuchu i widzenia. Zatrucie umiarkowanego stopnia może powodować kurcze mięśni i drgawki, po których może wystąpić utrata przytomności, depresja oddechowa i śpiączka. W przypadku bardzo ciężkiego zatrucia może wystąpić niedociśnienie tętnicze i zapaść sercowo-naczyniowa, aż do całkowitej niewydolności serca i zatrzymania czynności serca, co jest spowodowane zmniejszeniem kurczliwości mięśnia serca i zaburzeniami przewodzenia.

Leczenie przedawkowania jest objawowe. Drgawki można leczyć diazepamem. W przypadku wystąpienia niewydolności oddechowej i sercowo-naczyniowej, należy zastosować podstawowe i zaawansowane zabiegi wspomagające czynności życiowe.

## **5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE**

### **5.1 Właściwości farmakodynamiczne**

Grupa farmakoterapeutyczna: środki miejscowo znieczulające;  
kod ATC: R02A D02

Chlorowodorek lidokainy jest środkiem miejscowo znieczulającym z grupy amidów. Preparat blokuje przewodzenie impulsów wzdłuż wrażliwych włókien nerwowych w miejscu podania i jest to działanie odwracalne. Powoduje to zmniejszenie wrażliwości na ból, i występujące kolejno, zmniejszenie wrażliwości na zimno, ciepło i dotyk.

Lidokaina zmniejsza przepuszczalność błony komórkowej dla kationów, zwłaszcza dla jonów sodu. W zależności od stężenia, powoduje to zmniejszenie pobudliwości nerwów, ponieważ do zwiększenia potencjału czynnościowego niezbędne jest gwałtowne zwiększenie przepuszczalności dla jonów sodu. Stabilizacja błony komórkowej jest powodowana poprzez nagromadzenie lipofilnego środka miejscowo znieczulającego w błonie komórki. To powoduje niespecyficzne poszerzenie błony i blokowanie kanałów jonowych, zwłaszcza kanałów sodowych. Wtórne działanie polega na tym, że przepływ elektrolitów jest upośledzony przez hydrofilne cząsteczki środka miejscowo znieczulającego, które przenikają do porów zawierających wodę. Działanie jest zależne od wartości  $pK_a$  substancji oraz pH środowiska (np. ilość niezrównoważonej zasady), która przenika przez lipofilną błonę komórek nerwowych lepiej niż kationy. Po podaniu miejscowym, lidokaina dyfunduje szybko do zakończeń nerwowych, gdzie jest wiązana do struktur fosfolipidowych, a jej powinowactwo jest względnie duże, z powodu dobrej rozpuszczalności w tłuszczach.

### **5.2 Właściwości farmakokinetyczne**

#### *Wchłanianie*

Dostępność biologiczna lidokainy po podaniu doustnym wynosi około 35%. Po podaniu lidokainy w postaci pastylek maksymalne stężenie w surowicy występuje po 20 minutach. Po podaniu co 2 godziny, stan stacjonarny jest osiągany po 10 godzinach bez nagromadzania mierzonego za pomocą AUC.

#### *Dystrybucja*

Lidokaina jest szybko wchłaniana przez tkanki. Okres półtrwania w fazie dystrybucji wynosi od 6 do 9 minut, a objętość dystrybucji – 1,5 l/kg mc. U pacjentów z niewydolnością serca objętość dystrybucji zmniejsza się do 0,8 – 1,1 l/kg mc., a u pacjentów z niewydolnością wątroby ta wartość zwiększa się do około 2,3 l/kg mc. U noworodków  $V_D$  wynosiła 2,7 l/kg mc.

Lidokaina wiąże się z albuminami surowicy (60% do 80%), głównie z alfa-1-kwaśną glikoproteiną.

Lidokaina przenika przez barierę krew/mózg i łożysko oraz wydziela się do mleka.

### *Metabolizm*

Okolo 90% dawki lidokainy jest metabolizowane w wątrobie. Substancja jest metabolizowana do mniej czynnych metabolitów – monoetyloglicynianu ksylidyny (MEGX) i glicynianu ksylidyny (GX). MEGX jest dalej metabolizowany w wątrobie do GX, 2,6- ksylidyny i 4-hydroksy-2,6-ksylidyny oraz jej pochodnych glukuronowych.

### *Eliminacja*

Lidokaina jest wydalana głównie przez nerki w postaci 4-hydroksy-2,6-ksylidyny oraz pochodnych glukuronowych. Ilość niezmienionej substancji wynosi < 10%. Okres półtrwania w fazie eliminacji lidokainy oraz MEGX wynosi około 2 godziny, podczas gdy jednego z GX – około 10 godzin. Klirens wynosi 0,95 l/min. Szybkość eliminacji zależy od pH i zwiększa się, jeśli mocz jest zakwaszony.

### *Specjalne grupy pacjentów*

Właściwości farmakokinetyczne lidokainy u pacjentów w podeszłym wieku nie różnią się znacząco od właściwości farmakokinetycznych u młodszych pacjentów. U pacjentów w podeszłym wieku okres półtrwania eliminacji był wydłużony.

U noworodków lidokaina jest eliminowana w prawie niezmienionej postaci. Okres półtrwania w fazie eliminacji wynosi około 3 godzin.

Niewydolność nerek nie ma znaczącego wpływu na klirens lidokainy, ale eliminacja metabolitów może być zmniejszona.

U pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby lub niewydolnością serca, okres półtrwania w fazie eliminacji może być wydłużony, odpowiednio do 4,5-6 godzin i 4-10 godzin.

## **5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie**

Testy mutagenności lidokainy miały ujemne wyniki. Badania *in vitro* z podaniem dużych, prawie toksycznych dawek metabolitu 2,6-ksylidyny wykrywanej u szczurów i ludzi wykazują, że ten metabolit lidokainy może mieć, po dalszym metabolizmie, działanie mutagenne.

W długoterminowych badaniach karcynogenności po ekspozycji przez łożysko oraz podawaniu 2,6-ksylidyny po porodzie przez 2 lata w dużych dawkach, obserwowano powstawanie u szczurów złośliwych i łagodnych guzów, zwłaszcza jamy nosowej (ethmoturbinalia), w tym wysoce wrażliwym układzie badawczym.

Te wyniki mogą mieć znaczenie dla ludzi. W związku z powyższym, nie należy stosować lidokainy w dużych dawkach przez długi okres.

W badaniach przeprowadzonych na zwierzętach, nie stwierdzono dowodów na działanie teratogenne lub działań niepożądanych wpływających na rozwój potomstwa, po prenatalnej ekspozycji na lidokainę. Ekspozycja płodu na duże stężenia preparatu zaburzała przepływ krwi przez macicę i powodowała drgawki u płodu. Możliwy wpływ na zachowanie potomstwa po prenatalnej ekspozycji nie był wystarczająco badany u zwierząt.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1 Wykaz substancji pomocniczych**

Sorbitol  
Olejek miętowy  
Magnezu stearynian

### **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

### **6.3 Okres trwałości**

3 lata.

### **6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu**

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25°C.  
Nie przechowywać w lodówce ani nie zamrażać.  
Przechowywać w oryginalnym opakowaniu.

### **6.5 Rodzaj i zawartość opakowania**

Opakowanie bezpośrednie: blistry PCV/Aluminium w tekturowym pudełku.  
Wielkość opakowań: 2, 10, 12, 16, 20, 24, 30, 36, 40, 48, 50, 60 i 100 pastylek.  
Nie wszystkie rodzaje opakowań muszą znajdować się w obrocie.

### **6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania**

Brak szczególnych wymagań.

## **7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

YES Pharmaceutical Development Services GmbH  
Bahnstrasse 42 – 46  
61381 Friedrichsdorf  
Niemcy

## **8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Pozwolenie Nr:

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

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