

ЗБИРЕН ИЗВЕШТАЈ ЗА ОСОБИНИТЕ НА ЛЕКОТ

1. ИМЕ НА ЛЕКОТ

ДОЛОКАИН 20 mg/g гел (lidokainhlorid)

2. КВАЛИТАТИВЕН И КВАНТИТАТИВЕН СОСТАВ

1 g од гелот содржи 20 mg лидокаинхлорид.

Ексципиенси со познато дејство:

1 g гел содржи 200 mg пропиленгликол.

За целосен попис на ексципиенси видете го поглавјето 6.1.

3. ФАРМАЦЕВТСКИ ОБЛИК

Гел.

Безбоен до благо светло жолтеникав, бистар гел со својствен мирис.

4. КЛИНИЧКИ ПОДАТОЦИ

4.1 Терапевтски индикации

Долокаин е индициран за локална анестезија во случаи на:

- катетеризација на уретрата,
- цистоскопија,
- ендоскопија на дигестивниот тракт.

4.2 Дозирање и начин на употреба

Дозирање

Кај жени, деца (2-12 години) и адолесценти (помлади од 18 години) не е најдобро докажано дејството на лидокаин гелот, со што потребата за негова примена треба да биде по проценка на лекар. Специјална препорака за дозирање на овие групи пациенти не може да се даде, меѓутоа генерално правило е дека количината на примениот гел се прилагодува индивидуално според анатомијата на уретрата на секој пациент.

Системската апсорпција на лидокаинот може да биде зголемена кај деца, поради тоа треба да се внимава. Генерално максималната доза од 2,9 mg/kg лидокаинхидрохлорид кај деца, од 2 до 12 годишна возраст, не смее да се надмине.

Долокаин гелот не смее да се применува кај деца помали од 2 години.

Долокаин гелот е наменет само за еднократна употреба. Преостанатата количина гел треба да ја фрлите (погледајте во делот 6.6)

Анестезија на уретрата кај жена

Надворешниот отвор на уретрата се мие и дезинфицира, а потоа се инјектираат 3-5 ml од гелот (60-100 mg). Надворешниот отвор на



уретрата се покрива со тампон натопен со гел и се остава за време од 5-10 минути.

Анестезија на уретрата кај маж

Надворешниот отвор на уретрата се мие и дезинфицира, а потоа се инјектираат 5-10 ml од гелот (100-200 mg) или додека пациентот не почувствува напнатост (катетеризација). При сондирање или цистоскопија, пет до десет минути потоа, се врши и второто вбригување на остатокот од гелот (додека пациентот не почувствува напнатост, околу 10-15 ml).

Ендоскопски испитувања

а) Ендоскопски испитувања на горните делови на дигестивниот тракт - Соодветна количина од гелот (5 ml) се наносува пет минути пред операцијата, во орофарингеалната зона на пациентот. После пет минути се внесува ендоскопската сонда.

б) Ендоскопски испитувања на долните делови на дигестивниот тракт - Соодветна количина од гелот (10-25 ml) се наносува интраректално. После пет до десет минути се внесува ендоскопската сонда намачкана со гелот.

4.3 Контраиндикации

Преосетливост на активната компонента или на некој од ексципиентите наведени во поглавјето 6.1.

Преосетливост на локални анестетици од амиден тип. .

Нанесување на слузницата од окото.

Долокаин гел не смее да се употребува кај деца помлади од 2 години.

4.4 Посебни мерки на предупредување и посебни мерки на претпазливост при употреба

Лекот не е наменет за офталмолошка примена, па затоа не треба да се користи во близина на очите. Гелот не би требало да се користи во слушниот канал, ако има перфорација на ушната мембрана.

Не се препорачува примена на лекот во случај на локална инфекција на местото на апликација или во случаи на оштетување на слузокожата, бидејќи оштетната слузница овозможува зголемена системска апсорпција.

Лидокаинот треба внимателно да се применува кај возрасни луѓе, деца (2-12 години) и адолесценти (помлади од 18 години), кај пациенти со кардиоваскуларни заболувања и епилепсија, кај пациенти со тешки оштетувања на функцијата на бубрезите или хепарот, како и кај пациенти со мијастенија гравис.

Овој лек содржи пропиленгликол кој може да ја надразни кожата.

4.5 Интеракции со други лекови и други форми на интеракција

Не се опишани значителни интеракции после локална употреба на гелот.

4.6 Плодност, бременост и доене

Бременост

Нема податоци за штетно дејство на лидокаин применет локално кај



мајката или детето.

Доење

Лидокаинот добро ја преминува плацентарната бариера и се излучува во мајчиното млеко. Исклучително ниска е можноста за настанување на потенцијални токсични ефекти при изложување на новороденото или доенчето на лидокаин преку мајчиното млеко. Според мислењето на Американската академија на педијатрите, лидокаинхлорид е компатибилен со доењето.

4.7 Ефекти врз способноста за управување со моторни возила и машини

Долокаин гелот не влијае врз способноста за управување со моторни возила и машини.

4.8 Несакани ефекти

Зачестеноста на несакани ефекти е дефинирана како: многу често ($\geq 1/10$); често ($\geq 1/100$, $< 1/10$); помалку често ($\geq 1/1000$, $< 1/100$); ретко ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1000$); многу ретко ($< 1/10\ 000$) и непознато (не може да процени од достапните податоци).

Употребен локално, лидокаинхлорид ретко предизвикува алергична или анафилактична реакција, вклучувајќи исип на местото на апликација на гелот. Исипот што се појавува на местото на апликација е умерен и обично исчезнува спонтано еден до два часа после примената.

Пореметувања на имунолошкиот систем

Многу ретко: ангиоедем.

Пореметувања на респираторниот систем, торакални и медијастинални нарушувања

Многу ретко: бронхоспазам.

Пореметувања на кожата и на поткожното ткиво

Многу ретко: уртикарија.

Во случај на системски несакани ефекти, потребно е веднаш да прекинете со употребата на лекот, како и да се посоветуваат со доктор.

Пријавување сомнеж за несакани ефекти

По добивање на решение за лекот, важно е да се пријават сомнежите за неговите несакани ефекти. Со тоа се овозможува континуирано следење на соодносот корист и ризик на лекот. Несаканите реакции од лековите може да ги пријавите во Националниот центар за фармаковигиланца при Агенцијата за лекови и медицински средства (ул.Св.Кирил и Методиј бр.54 кат 1) или по електронски пат преку веб страната на Агенцијата <http://malmed.gov.mk/>



4.9 Предозирање

Во случај на примена на големи количини на лидокаин хидрохлорид на оштетена слузокожа, може да дојде до ресорпција на лекот и до појава на системски ефекти.

5 ФАРМАКОЛОШКИ ОСОБИНИ

5.1 Фармакодинамски особини

Фармакодинамска група:

Локален анестетик, амид, АТС шифра N01BB02.

Механизам на дејство

Механизмот на дејство на лидокаинхлоридот е последица на неговиот ефект врз Na^+ каналите. Тој се врзува со специфичен рецептор во интраклеточниот дел од каналот и го блокира Na^+ каналот на начин кој е зависен од време и волтажа, со што го спречува преносот на нервните импулси за време на ексцитацијата.

Фармакодинамски ефект

Постепениот пораст на концентрацијата на локалниот анестетик на местото на нервните завршетоци предизвикува: покачување на прагот на надразливост, успорување на спроведувањето на импулсот, снижување на фреквенцијата на акцискиот потенцијал, намалување на амплитудата на акцискиот потенцијал, намалување на способноста за создавање на акциски потенцијал. Споменатиот пораст на лидокаинскиот ефект, во рамките на порастот на концентрацијата, е последица од неговото врзување со поголемиот број Na^+ канали. Ако Na^+ моментално е блокиран над критичната должина на нервното влакно, преносот на импулсот е сопрен. Затоа апликацијата на лидокаин хидрохлорид предизвикува привремена (за одреден временски период), како и тотална аналгезија и анестезија на саканите делови од телото, во зависност од местото на апликација.

5.2 Фармакокинетски особини

Апсорпција

Апсорпцијата на лидокаинот зависи од местото на апликација. Апсорпцијата преку неоштетена кожа е многу мала.

После 400 mg i.m. инјекција на лидокаин, пикот на средната концентрација во плазмата изнесува 6,48 $\mu\text{g/ml}$, спореден со 4,91 $\mu\text{g/ml}$ после субкутана вагинална инјекција и 1,95 $\mu\text{g/ml}$ после субкутана абдоминална инјекција.

Се претпоставува дека апсорпцијата преку оштетено ткиво се разликува во однос на апсорпцијата преку здраво ткиво.

Биорасположливоста на лидокаинот е повисока ако се нанесе на слузокожата на горните дишни патишта, отколку на слузокожата на долните дишни патишта.

Прифатливи концентрации на лидокаин во плазмата се добиваат со следниот режим на апликација пред бронхоскопија: нанесување на 2% гел на орофарингсот и во носалката. Апсорпцијата на лидокаинот при



интраназална апликација може да варира значително.

5.3 Предклинички податоци за нештетност

Со Амесов тест, микрозомален тест и со анализа на структурните хромозомски аберации на хумани лимфоцити *in vitro*, како и со тестот на микронуклеусот на глувци *in vivo* не се воочени никакви знаци на мутагеност на лидокаин. Меѓутоа при испитување на неговите метаболити воочена е лесна мутагена активност на метаболитот 2,6-xilidin. Мутагеноста на метаболитот исто така е воочена на локусот на тимидин киназа со можни хромозомски аберации, меѓутоа во многу високи концентрации.

Со испитување на канцерогеноста на лидокаинот, како и на неговиот најзначаен потенцијално канцероген метаболит 2,6-xilidin, не е забележана зголемена инциденца на појава на карцином кај испитуваните животни.

Испитувањата не покажаа никакво штетно дејство на лекот при репродукцијата, ниту на плодот. Треба да се обрне внимание во случаи на употреба на лидокаинот на оштетена слузница, како и на слузница на доенчиња и мали деца.

6. ФАРМАЦЕВТСКИ ПОДАТОЦИ

6.1 Листа на ексципиенси

- Пропиленгликол
- Калиум дихидрогенфосфат
- Натриум хидрогенфосфат дихидрат
- Натриум хлорид
- Хидроксиетилцелулоза
- Прочистена вода

6.2 Инкомпатибилија

Не е утврдена.

6.3 Рок на употреба

2 години.

6.4 Начин на чување

Да се чува на температура до 25°C.

6.5 Изглед и содржина на пакувањето

Алуминиумска туба со 25 g гел со ПП затворац, во кутија која на двата краја е заштитена со сигурносна налепница.

6.6 Посебни мерки за отстранување и друго ракување со лекот

Содржината на тубата е стерилна. Ако на кутијата има знаци на оштетување или неовластено отворање, производот не смее да се



користи. Стерилноста може да се гарантира само ако сигурносните налепници на краевите на кутијата не се оштетени.

Долокаин гелот е наменет само за еднократна употреба. Преостанатата количина на гел треба да ја фрлите.

Неискористениот лек или отпадниот материјал потребно е да се отстрани во согласност со националните прописи.

7. НОСИТЕЛ НА ОДОБРЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ

“ЕУРОЛЕК” дооел Скопје, Качанички пат бр.174, Визбегово
1010 Скопје, Република Северна Македонија
Тел. 02-2655-855

8. НАЧИН И МЕСТО НА ИЗДАВАЊЕ

Се издава само со лекарски рецепт, во аптеки.

9. БРОЈ НА РЕШЕНИЕТО ЗА СТАВАЊЕ ВО ПРОМЕТ/ОБНОВА

10. ДАТУМ НА РЕВИЗИЈА НА ЗБИРНИОТ ИЗВЕШТАЈ НА ОСОБИНТЕ НА ЛЕКОТ

Јануари, 2020.

