

RAVIMI OMADUSTE KOKKUVÕTE

1. RAVIMPREPARAADI NIMETUS

Trachilid, 8 mg losengid

2. KVALITATIIVNE JA KVANTITATIIVNE KOOSTIS

Iga loseng (imemistablett) sisaldab 8 mg lidokaiinvesinikkloriidi (monohüdraadina).
INN. *Lidocainum*

Abiained:

Iga loseng sisaldab 0,67 g sorbitooli.

Abiainete täielik loetelu vt lõik 6.1.

3. RAVIMVORM

Loseng.

Valge, ümar, lame, kaldservadega loseng (imemistablett).

4. KLIINILISED ANDMED

4.1 Näidustused

Mittemädasest kurgupõletikust tingitud valu lühiajaline lokaalne ravi.

4.2 Annustamine ja manustamisviis

Täiskasvanud

Üks loseng iga kahe tunni järel.

Maksimaalset ööpäevast annust, kuus losengi, ei tohi ületada.

Losenge ei tohi manustada üle kolme päeva.

Kui kurgupõletik on raskekujuline või kurguvalu püsib kauem kui kaks päeva ning sellega kaasnevad palavik, peavalu, iiveldus või oksendamine, tuleb pöörduda arsti poole.

Lapsed

Trachilid on lastele vanuses alla 12 aasta vastunäidustatud (vt lõik 4.3).

Noorukid

Trachilid'i ei soovitata kasutada noorukitel vanuses 12...17 aastat ohutuse ja efektiivsuse ebapiisavate andmete tõttu (vt lõik 4.4).

Trachilid on mõeldud orofarüingeaalseks kasutamiseks ning neil tuleb lasta aeglaselt suus imenduda.

4.3 Vastunäidustused

Ülitundlikkus lidokaiinvesinikkloriidi, amiid-tüüpi lokaalanesteetikumide või lõigus 6.1 loetletud mis tahes abiainete suhtes.

Trachilid on patsientidele vanuses alla 12 aasta vastunäidustatud (vt lõik 4.4).

4.4 Erihoiatused ja ettevaatusabinõud kasutamisel

Lidokaiin metaboliseeritakse peamiselt maksas ja metaboliidid eemaldatakse valdavalt neerude kaudu. Maksa- ja/või neerufunktsiooni häirega patsientidel võib lidokaiini või tema metaboliitide sisaldus seerumis suurenedada.

Kui lidokaiini manustada losengina, ei oma see toime kliinilist tähtsust.

Lokaalanesteetikumid võivad häirida neelamisfunktsiooni ja suurendada aspiratsiooniohtu. See on eriti oluline väikelaste puhul, kes söövad sageli (vt lõik 4.3). Vahetult pärast lidokaiini losengide võtmist tuleb vältida söömist ja joomist. Keele ja põse limaskestast tundetus võib suurendada hammustustraumade ohtu. Alanenud kuumatundlikkuse tõttu on suurenenud oht põletada suu ja kurgu limaskestast kuumade jookide ja toitudega. Korduv kasutamine võib tekitada kurgutuimust ja neelamisraskusi.

Trachilid'i ei soovitata kasutada noorukitel vanuses 12...17 aastat ohutuse ja efektiivsuse ebapiisavate andmete tõttu.

Tugevalt kahjustatud ja/või põletikulise suu ja neelu limaskestaga patsientidel tuleb Trachilid'i kasutada ettevaatusega, eelkõige juhtudel, kui kaasneb südameveresoonkonna või krampe põhjustavaid haigusi.

Ristallergiat lidokaiinvesinikkloriidile võib oodata patsientidel, kellel on anamneesis allergiat teiste amiid-tüüpi lokaalanesteetikumidele.

Kui raskekujuline kurgupõletik või kurguvalu püsib ja lisandub palavik, peavalu, iiveldus või oksendamine, ei tohi tüsistuste vältimiseks Trachilid'i kasutada kauem kui kaks päeva ilma arstiga konsulteerimata.

Trachilid sisaldab sorbitooli. Harvaesineva päriliku fruktoositalumatushäirega patsiendid ei tohi seda ravimit kasutada.

4.5 Koostoimed teiste ravimitega ja muud koostoimed

Kuigi losengina ei ole lidokaiini mõju kliiniliselt oluline, on kirjeldatud lidokaiini järgmisi koostoimeid:

Tsimetidiin võib vähendada lidokaiini metabolismi, pärssides maksa mikrosomaalseid ensüüme ja suurendades sellega lidokaiini sisaldust plasmas.

Beetablokaator-ravi võib vähendada maksa verevoolu, mis võib vähendada lidokaiini metabolismi.

Samaaegne propranolooli kasutamine võib suurendada lidokaiini sisaldust plasmas ligikaudu 30%. Ei saa ka välistada metabolismis osalevate maksa mikrosomaalsete ensüümide konkureerimise olulist mõju.

Maksa mikrosomaalsete ensüümide aktiveerijad, nagu bensodiasepiinid ja barbituraadid, võivad kiirendada lidokaiini metabolismi ja sellega vähendada lidokaiini sisaldust plasmas.

4.6 Rasedus ja imetamine

Rasedus

Kontrollitud kliinilised uuringud rasedatega puuduvad. Piiratud andmed ravimi rasedusaegse kasutamise kohta ei ole viidanud lidokaiini kahjulikele toimetele rasedusele või loote/vastsündinu tervisele. Parenteraalsel kasutamisel läbib lidokaiin platsentat.

Loomkatsetes ilmneseid lidokaiini prenataalsel kasutamisel kõrvaltoimed lootel ainult suurte annuste korral (vt lõik 5.3). Trachilid ei tohi kasutada raseduse ajal, kui see ei ole hädavajalik.

Imetamine

Lidokaiin imendub rinnapiima niivõrd väikestes kogustes, et Trachilid soovitatud annustes kasutades on ravimi kahjulik toime rinnapiimaga toidetavale imikule väga ebatõenäoline.

4.7 Toime reaktsioonikiirusele

Trachilid ei oma toimet autojuhtimise ja masinate käsitsemise võimele.

4.8 Kõrvaltoimed

Väga sage:	≥ 1/10
Sage:	≥ 1/100 kuni < 1/10
Aeg-ajalt:	≥ 1/1000 kuni < 1/100
Harv:	≥ 1/10 000 kuni < 1/1000
Väga harv:	< 1/10 000
Teadmata:	sagedust ei saa hinnata olemasolevate andmete alusel

Trachilid võimalikud kõrvaltoimed on sarnased teiste amiid-tüüpi lokaalanesteetikumide kõrvaltoimetega. Soovimatud süsteemsed toimed tekivad ainult siis, kui lidokaiini sisaldus plasmas ületab 5...10 mikrogrammi/ml. Et Trachilid imendub vähesel määral, ei ole süsteemseid kõrvaltoimeid oodata.

Immuunsüsteemi häired

Väga harv: võivad tekkida ülitundlikkusreaktsioonid või suupiirkonna sensitisatsioon.

Seedetrakti häired

Harv: maitsetundlikkuse häired või keele tundetus. Need kõrvaltoimed kaovad tavaliselt lühikese aja jooksul.

Väga harv: sorbitoolist tingitud lahtistav toime.

Võimalikest kõrvaltoimetest teavitamine

Ravimi võimalikest kõrvaltoimetest on oluline teavitada ka pärast ravimi müügiloa väljastamist. See võimaldab jätkuvalt hinnata ravimi kasu/riski suhet. Tervishoiutöötajatel palutakse teavitada kõigist võimalikest kõrvaltoimetest www.ravimiamet.ee kaudu.

4.9 Üleannustamine

Lidokaiini üleannustamine võib tekkida ainult väga suure hulga losengide võtmisel. Lidokaiini üleannustamine võib põhjustada ajutist kesknärvisüsteemi stimulatsiooni koos selliste varajaste sümptomitega nagu haigutamine, rahutus, pearinglus, iiveldus, oksendamine, düsartria, ataksia, kuulmis- ja nägemishäired. Mõõdukas intoksikatsioon võib viia lihastõmbeluste ja -krampideni, millele võivad järgneda teadvushäired, hingamise pärssumine ja kooma. Väga tõsise mürgistuse korral võib tekkida hüpotensioon ja kardiovaskulaarne kollaps kuni täieliku südamepuudulikkuse ja südameseiskumiseni, mis on põhjustatud müokardi kontraktiilsuse nõrgenemisest ja südame juhtivushäirest.

Üleannustamise ravi on sümptomaatiline. Krampe võib ravida diasepaamiga. Hingamis- ja südamevereringe puudulikkuse korral tuleb anda vastavat esmaabi ja intensiivravi.

5. FARMAKOLOOGILISED OMADUSED

5.1 Farmakodünaamilised omadused

Farmakoterapeutiline grupp: lokaalanesteetikumid
ATC-kood: R02AD02

Lidokaiinvesinikkloriid on amiid-tüüpi lokaalanesteetikum. See blokeerib lokaalsel manustamisel tundlikkusega seotud närviimpulsse ja on pöörduva toimega. Selle tulemusena väheneb kõigepealt valutundlikkus ning edasi temperatuuri- ja puutetundlikkus.

Lidokaiin vähendab membraanide läbilaskvust katioonidele, eriti naatriumioonidele. Kontsentratsioonist sõltuvalt langetab see närvide erutuvust, mis on seotud aktsioonipotentsiaali vähenemiseks vajaliku äkilise naatriumi läbilaskvuse tõusuga. Membraanide stabilisatsioon saavutatakse lipofiilse lokaalanesteetikumi kuhjumisega rakumembraanis. See põhjustab membraani mittespetsiifilise paisumise, mille tõttu ionikanalid, eriti naatriumkanalid, blokeeruvad. Teise toimeena mõjutavad vett sisalduvatesse pooridesse kogunenud lokaalanesteetikumi hüdrofiilsed osad elektrolüütide liikuvust. Kirjeldatud toime sõltub aine pK_a -väärtusest ja keskkonna pH-väärtusest, s.t mahalaetud aluse hulgest, mis tungib lipofiilse närvi membraani sisse katioonidest paremini. Toopilise manustamise järel difundeerub lidokaiin kiiresti närvi lõppharudesse, kus seondub fosfolipiidstruktuuridega suhteliselt suure afiinsusega, mis on põhjustatud lidokaiini heast rasvlahustuvusest.

5.2 Farmakokineetilised omadused

Absorptsioon

Lidokaiini biosaadavus suukaudsel tarvitamisel on ligikaudu 35%. Lidokaiini losengide kasutamise järel saavutatakse maksimaalne seerumikontsentratsioon 20 minutiga. Kui ravimit võeti iga kahe tunni järel, saavutati püsiseisund 10 tunniga ning AUC alusel hinnatuna toimeaine ei kuhjunud.

Jaotumine

Lidokaiin imendub kiiresti kudedesse. Jaotumise poolväärtusaeg on 6...9 minutit, jaotusruumalaga 1,5 l/kg. Südamepuudulikkusega patsientidel langeb see 0,8...1,1 l/kg ja maksapuudulikkusega patsientidel suureneb 2,3 l/kg. Vastsündinute V_D oli 2,7 l/kg.

Lidokaiin on seotud seerumialbumiiniga (60 ... 80%), peamiselt alfa-1-happe glükoproteiiniga.

Lidokaiin läbib hematoentsefaalbarjääri ja platsenta ning eritub rinnapiima.

Metabolism

Ligikaudu 90% lidokaiinist metaboliseeritakse maksas. See metaboliseeritakse väiksema aktiivsusega metaboliitideks monoetüülglütsiineksüliidiks (MEGX) ja glütsiineksüliidiks (GX). MEGX metaboliseeritakse edasi maksas GX, 2,6-ksüliidiiniks ja 4-hüdroksü-2,6-ksüliidiiniks ja selle glükuroniidiks.

Eliminatsioon

Lidokaiin eritatakse organismist neerude kaudu 4-hüdroksü-2,6-ksüliidiini ja selle glükuroniidina. Muutumatu aine osakaal jääb alla 10%. Lidokaiini ja MEGX eliminatsiooni poolväärtusaeg on ligikaudu kaks tundi, kuid GX oma on ligikaudu 10 tundi. Kliirens on 0,95 l/min. Eliminatsiooni kiirus sõltub pH-st ja suureneb uriini happeliseks muutmisel.

Patsientide erirühmad

Lidokaiini farmakokineetilised omadused eakatel ei erine oluliselt nooremate patsientide näitajatest. Eakatel eliminatsiooni poolväärtusaeg pikenes.

Vastsündinutel elimineerub lidokaiin peaaegu muutumatul kujul. Eliminatsiooni poolväärtusaeg on ligikaudu kolm tundi.

Neerupuudulikkus ei oma olulist toimet lidokaiini kliirensile, kuid metaboliitide eliminatsioon võib väheneda.

Kahjustunud maksafunktsiooni või südamepuudulikkusega patsientidel võib eliminatsiooni poolväärtusaeg pikeneda vastavalt 4,5...6 tunni ja 4...10 tunnini.

5.3 Prekliinilised ohutusandmed

Lidokaiini mutageensuuringud andsid negatiivseid tulemusi. *In vitro* uuringutes leiti, et inimese ja rottide organismis tekkiv lidokaiini metaboliit 2,6-ksülidiin võib suurtes, peaaegu toksilistes annustes olla pärast metaboliseerumist mutageenne.

Pikaajalistes kartsinogeensuuringutes transplatsentaarse ekspositsiooni ja kaheaastase postnataalse raviga väga suurtes annustes 2,6-ksülidiiniga, tuvastati rottidel suure tundlikkusega testsüsteemi abil paha- ja healoomulisi kasvajaid, peamiselt ninaõõnes (etmoturbinaalia).

Need tulemused võivad olla olulised ka inimeste jaoks. Seetõttu ei tohi lidokaiini kasutada suurtes annustes pikka aega.

Loomkatsetes ei leitud lidokaiini prenataalsel kasutamisel teratogeenset mõju ega vaimse arengu häireid vastündinutel. Looote organismi jõudnud lidokaiini suur kontsentratsioon põhjustas lootel krampe ja mõjutas emaka verevoolu. Võimalikke käitumishäireid pärast prenataalset ekspositsiooni ei ole loomkatsetes piisavalt uuritud.

6. FARMATSEUTILISED ANDMED

6.1 Abiainete loetelu

Sorbitool
Veevaba sidrunhape
Sukaadisidruni maitseaine
Sidrunimahla maitseaine
Atsesulfaamkaalium
Magneesiumstearaat

6.2 Sobimatus

Ei kohaldata.

6.3 Kõlblikkusaeg

3 aastat.

6.4 Säilitamise eritingimused

Hoida temperatuuril kuni 25 °C.
Mitte hoida külmkapis või sügavkülmas.
Hoida originaalpakendis, niiskuse eest kaitstult.

6.5 Pakendi iseloomustus ja suurus

Trachilid losenge turustatakse PVC-alumiiniumblistrites, mis on pakendatud pappkarpidesse.

Pakendi suurused: 2, 10, 12, 16, 20, 24, 30, 36, 40, 48, 50, 60 või 100 losengi.

Kõik pakendi suurused ei pruugi olla müügil.

6.6 Erihoiatused ravimi hävitamiseks

Erinõuded puuduvad.

7. MÜÜGILOA HOIDJA

Engelhard Arzneimittel GmbH & Co. KG
Herzbergstr. 3
61138 Niederdorfelden
Saksamaa
E-mail: info@engelhard-am.de

8. MÜÜGILOA NUMBER

533707

9. ESMASE MÜÜGILOA VÄLJASTAMISE/MÜÜGILOA UUENDAMISE KUUPÄEV

Müügiloa esmase väljastamise kuupäev: 12.02.2007
Müügiloa viimase uuendamise kuupäev: 21.04.2010

10. TEKSTI LÄBIVAATAMISE KUUPÄEV

Märts 2015