

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

PRECOXİN® %10 sprey, çözelti

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin maddeler:

1mL’de 100 mg lidokaine eşdeğer 115,5 mg lidokain hidroklorür içerir.

%10 lidokain

Yardımcı maddeler:

Propilen glikol....416,5 mg/mL

Yardımcı maddeler için 6.1 'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Çözelti

Beyaz renkli lavanta kokulu sprey

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1. Terapötik endikasyonlar

PRECOXİN lokal anestezik etki sağlar. Bu dozaj şekli ile erkeklerde erken boşalma, premature ejakülasyon (PE) tedavisinde kullanılmaktadır.

4.2. Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji / uygulama sıklığı ve süresi:

PRECOXİN, yalnızca haricen kullanım için tasarlanmıştır.

Erkek genital derisinde lokal anestezik etki oluşturmak için cinsel ilişkiden 5-15 dakika önce yetişkinler için 1-2 sprey (30-60 mg) olarak uygulanır. Miktar ve zaman kullanıcı tarafından belirlenir. Minimum etkili doz kullanılır. Maksimum doz 24 saat içinde 6 spreyi (180 mg’ı) geçmemelidir. Doktora danışmadan ürün 3 aydan fazla bir süre kullanılmamalıdır.

Uygulama şekli:

Doktorunuz başka bir şekilde tavsiye etmediyse aşağıda tarif edildiği şekilde kullanabilirsiniz. Penisin baş ve gövde kısmına spreyleme yapılmalıdır. Penis derisinden tamamen absorbe olana

kadar uygulanan sprey ovulur. Cinsel ilişkiden sonra yıkanmalıdır.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Karaciğer yetmezliği:

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

Böbrek yetmezliği:

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

Pediyatrik popülasyon:

Çocuklarda kullanılmamalıdır.

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. Yaşlılarda tavsiye edilmemektedir.

4.3. Kontrendikasyonlar

Lidokain, amid tipi anestezikler veya PRECOXİN'in içeriğindeki maddelere karşı aşırı duyarlılığı olanlarda veya bu maddelere aşırı duyarlılığı olan partneri olanlarda kullanılmamalıdır. PRECOXİN, tedavi edilmemiş bakteriyel, viral, patojenik mantar veya parazitik orijinli enfeksiyonu olan hastalarda kullanılmamalıdır. PRECOXİN, hastane dışında sınıf III anti-aritmik ilaçla tedavi edilen hastalar tarafından kullanılmamalıdır (bkz. Bölüm 4.4 ve 4.5).

Sepsis (kan zehirlenmesi) veya ilacın uygulandığı mukozanın ciddi olarak hasar görmesi durumunda, ani sistemik emilim riski olabileceğinden, PRECOXİN kullanılmamalıdır.

4.4. Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

Kızarıklık ya da tahriş gelişirse kullanım bırakılmalıdır. Sepsis ve ilacın uygulandığı mukozanın ciddi olarak hasar görmesi durumunda, ani sistemik emilim riski olabileceğinden, PRECOXİN uygulanırken dikkatli olunmalıdır.

Yüksek plazma düzeyleri ve ciddi yan etkileri önlemek amacıyla yeterli etkinin sağlandığı, mümkün olduğu kadar 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.

PRECOXİN bilinen ilaç alerjisi olan hastalarda dikkatli kullanılmalıdır. Şiddetli karaciğer hastalığı olan hastalar lokal anestezikleri normal şekilde metabolize edemediklerinden, bu hastalarda lidokainin toksik plazma konsantrasyonlarının gelişme riski daha yüksektir.

PRECOXİN ciddi kalp rahatsızlığı olanlarda dikkatli verilmelidir. Özellikle geniş deri yüzeylerine ve bilhassa da oklüzyon altında uygulandığında kalp ritim 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 aşılarda (BCG aşısı gibi) intrakütan enjeksiyonlarının sonuçları izlenmelidir.

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

PRECOXİN, 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, PRECOXİN 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.

PRECOXİN, muhtemelen porfirinojeniktir ve daha güvenli bir alternatif olduğunda sadece akut porfirisi olan hastalara reçete edilmelidir. Uygun önlemler savunmasız hastalar için alınmalıdır.

Partnerinizde yanma, kaşıntı ve tahriş varsa kullanıma ara verilmelidir.

İçeriğinde bulunan propilen glikol nedeni ile ciltte irritasyona 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 beta blokörler), lidokainin tekrarlanan yüksek dozlarda uzun bir süre boyunca uygulanması halinde potansiyel olarak toksik plazma konsantrasyonlarına neden olabilir.

Dolayısıyla, lidokain ile tavsiye edilen dozlarda kısa dönemli tedavileri takiben bu tür etkileşimlerin klinik önem taşımaması beklenir.

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

Antiaritmik ajanlar, antikonvülsanlar, antikolinergik ajanlar, antihipertansifler, barbitüratlar, beta blokörler, kas gevşeticiler ve semptomimetik ajanlarla etkileşimler rapor edilmiştir. Serum enzimlerine yönelik tanısal testlerle etkileşimler de rapor edilmiştir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Özel popülasyonlar üzerinde herhangi bir etkileşim çalışması yapılmamıştır.

Pediyatrik popülasyon:

Çocuklar üzerinde herhangi bir etkileşim çalışması yapılmamıştır.

4.6. Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik risk kategorisi B'dir.

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

PRECOXİN sadece erkekler tarafından kullanır. Partner kadınlarda doğum kontrolü (kontrasepsiyon) ile ilgili veri bulunmamaktadır.

Gebelik dönemi

PRECOXİN sadece erkekler tarafından kullanır. Bununla birlikte cinsel ilişki sırasında partnerinize lidokain geçişi olabilir. Gebelik sırasında lidokain kullanımının güvenli olup olmadığına dair yeterli veri olmadığı için partneriniz hamile ise PRECOXİN kullanılmamalıdır. Hayvan deneylerinde zararlı bir etki görülmemiştir.

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. (Bkz. Bölüm 5.3).

Laktasyon dönemi

PRECOXİN sadece erkekler tarafından kullanır. Bununla birlikte cinsel ilişki sırasında partnerinize lidokain geçişi olabilir. Lidokain anne sütüne geçer, partneriniz emziriyor ise dikkatli olunmalıdır.

Üreme yeteneği / Fertilite

Lidokainin insanlarda üreme yeteneği ve fertilite üzerine etkisi hakkında herhangi bir veri bulunmamaktadır. Lidokainin fertiliteyle ilgili advers etkiler meydana getirdiği saptanmıştır (Bkz. Bölüm 5.3).

4.7. Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Topikal olarak uygulanan PRECOXİN'den lidokainin sistemik dolaşıma geçişinin, araç veya makine kullanma yeteneğini bozacak yeterli plazma konsantrasyonlarına yol açması muhtemel değildir.

4.8. İstenmeyen etkiler

Son derece nadir durumlarda, lokal anestezik preparatlar alerjik reaksiyonlarla ilişkilendirilmiştir. PRECOXİN'in kullanımından sonra ara sıra lokal cilt tahrişi meydana gelebilir.

Lidokainin yan etkileri diğer amid tipi lokal anesteziklerin 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, konvülsiyon, kasılmalar, bilinç kaybı ve olası solunum durması ile karakterize edilen merkezi sinir sistemi üzerinde uyarıcı ve/veya depresan eylemler sayılabilir. Kardiyovasküler reaksiyonlar depresandır ve hipotansiyon, miyokardiyal depresyon, bradikardi ve kalp durmasını içerebilir.

PRECOXİN'in önerilen maksimum dozda uygulanmasının ardından elde edilen plazma lidokain seviyeleri, sistemik toksisite ile ilişkili konsantrasyondan yaklaşık 25 kat daha düşüktür.

Yan etkilerin sıklık gruplandırması şöyledir

Çok yaygın ($>1/10$); yaygın ($>1/100$ ila $<1/10$); yaygın olmayan ($>1/1.000$ ila $<1/100$); seyrek ($>1/10.000$ ila $<1/1.000$); 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 hastalıkları

Yaygın: Ciltte iritasyon, kızarıklık, kaşıntı veya döküntü.

Kazara gözle temasından sonra korneada iritasyon gözlenmiştir.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması:

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yara/risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TÜFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir (www.tick.gov.tr; e-posta: tufam@titck.gov.tr; tel:0 800 314 00 08, faks:0312 218 35 99).

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Akut durumlar lokal anesteziklerin 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 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 Grubu: Topikal Anestezikler, Amidler

ATC Kodu: N01BB02

Lidokainin derinin epidermal ve dermal tabakaları içerisine penetre olması ile dermal anestezi sağlanır. Anestezinin etkinliği, uygulama süresine ve doza bağlıdır.

Lidokain voltaja duyarlı sodyum kanallarının intraselüler bölümüne içten doğrudan reversibl olarak bağlanır. Yapılan bloğun derecesi sinirin nasıl uyarıldığına ve dinlenim membran potansiyeline bağlıdır. Lidokain sodyum kanallarına sadece yüklü formda olduklarında ve sodyum kanalları açık olduğu zaman bağlanabilir. Bu koşullarda daha güçlü bağlanır ve böylece sodyum kanalını stabilize eder. Lidokainin lokal anestezik özellikleri bu üründe penisin temas duyarlılığını azaltmak için kullanılmaktadır.

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 mikrogram/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:

Oral verilen lidokain karaciğerde metabolize edilir ve ilk geçiş etkisine uğrar. Lidokainin metabolitleri ise etkin olan monoetilglisinksilidid (MEGX) ve glisinksilidid (GX)'dir.

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 /Doğruluk olmayan durum

Veri bulunmamaktadır.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler

Böbrek/karaciğer yetmezliği

Lidokain karaciğerden hızlı bir şekilde metabolize olduğundan, karaciğer fonksiyonlarının bozulması 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 olarak 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 400

Propilen glikol

Klorheksidin diglukonat (%20 a/h)

Lavanta esansı

Saf su

6.2. Geçimsizlikler

Bilinen herhangi bir geçimsizliği bulunmamaktadır.

6.3. Raf ömrü

24 ay

6.4. Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

6.5. Ambalajın niteliği ve içeriği

Polipropilen kapaklı 40 mL'lik alüminyum tüp içinde

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

Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller "Tıbbi Ürünlerin Kontrolü Yönetmeliği" ve "Ambalaj ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelikleri" ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

AYMED İLAÇ SAN. ve TİC. LTD. ŞTİ.

Adres : Ehlibeyt Mah. 1242.Cad. No:18/14 Balgat Çankaya / ANKARA

Telefon : (312) 473 34 10

Faks : (312) 473 31 10

e-mail : www.aymedilac.com

8. RUHSAT NUMARASI

2017/8

9. İLK RUHSAT TARİHİ / RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 12.01.2017

Ruhsat yenileme tarihi:-

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ