

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ASPIGOLA smak miętowy bez cukru, 2 mg + 1,2 mg + 0,6 mg, pastylki twarde

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Każda pastylka twarda zawiera:

Lidokainy chlorowodorek jednowodny	2,0 mg
Alkohol 2,4-dichlorobenzylowy	1,2 mg
Amylometakrezol	0,6 mg

Substancje pomocnicze o znanym działaniu:

Izomalt (E 953)	1830 mg
Maltitol ciekły (E 965)	633 mg

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Pastylka twarda

Niebieskozielone, okrągłe pastylki twarde o średnicy 19 mm o smaku miętowym.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Objawowe leczenie dolegliwości bólowych jamy ustnej i gardła, np. zapalenie gardła, zapalenie krtani, ból gardła oraz po zabiegu usunięcia migdałków podniebiennych, u osób dorosłych i młodzieży w wieku powyżej 12 lat.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dorośli i młodzież w wieku 12 lat lub starsza

1 pastylka co 2-3 godziny, maksymalnie do 8 pastylek na dobę przez 3 do 4 dni.

Dzieci i młodzież

Produkt leczniczy jest przeciwwskazany do stosowania u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

Pacjenci w podeszłym wieku

Dostosowanie dawki nie jest konieczne.

Pacjenci z zaburzeniami czynności nerek i (lub) wątroby

Brak jest dostępnych danych na temat stosowania produktu Aspigola smak miętowy bez cukru u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby lub nerek.

Sposób podawania

Do stosowania na błonę śluzową jamy ustnej.

Pastyłkę należy powoli rozpuścić w jamie ustnej, to znaczy nie należy jej umieszczać między dziąsłem a policzkiem.

Produktu leczniczego nie należy przyjmować przed jedzeniem lub piciem.

Należy stosować najmniejszą skuteczną dawkę przez możliwie najkrótszy czas do ustąpienia objawów.

4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancje czynne lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Alergia na leki miejscowo znieczulające z grupy amidów w wywiadzie.
- Pacjenci ze skłonnościami do methemoglobinemii lub pacjenci z methemoglobinemią bądź podejrzeniem methemoglobinemii w wywiadzie.
- Ze względu na zawartość lidokainy produkt leczniczy jest przeciwwskazany do stosowania u dzieci w wieku poniżej 12 lat.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

- Jeśli objawy nie ustąpią lub nawet pogorszą po 3-4 dniach, należy skonsultować się z lekarzem.
- Jeżeli bólowi gardła towarzyszy wysoka gorączka, ból głowy, nudności lub wymioty, produktu leczniczego nie należy stosować dłużej niż 2 dni bez konsultacji lekarskiej.
- Stosowanie zbyt dużych dawek, zbyt krótkie odstępy pomiędzy dawkami lub stosowanie produktu na uszkodzoną błonę śluzową może spowodować zwiększenie stężenia produktu leczniczego w osoczu i wystąpienie ciężkich działań niepożądanych (patrz punkt 4.9). Tego produktu leczniczego nie należy stosować w obszarze jamy ustnej i gardła, jeśli występują tam większe niezagojone rany.
- Należy zachować ostrożność podczas stosowania tego produktu leczniczego u pacjentów ciężko chorych lub u osłabionych pacjentów w podeszłym wieku, ponieważ są oni bardziej wrażliwi na działania niepożądane tego produktu leczniczego.
- Aspigola smak miętowy bez cukru może powodować drętwienie języka i może zwiększać ryzyko urazu spowodowanego ugryzieniem. Znieczulenie gardła wywołane przez ten produkt leczniczy może prowadzić do zachłyśnięcia (kaszel podczas jedzenia, dający wrażenie dławienia się pacjenta). Dlatego pacjent powinien być świadomy, że działanie miejscowo znieczulające może utrudniać połykanie, a tym samym zwiększać ryzyko zachłyśnięcia. Z tego powodu nie należy przyjmować tego produkt leczniczego przed jedzeniem lub piciem.

Aspigola smak miętowy bez cukru zawiera izomalt i maltitol. Produkt leczniczy nie powinien być stosowany u pacjentów z rzadko występującą dziedziczną nietolerancją fruktozy.

Aspigola smak miętowy bez cukru zawiera mniej niż 1 mmol sodu (23 mg) na pastylkę, to znaczy produkt leczniczy uznaje się za „wolny od sodu”.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Nie zaleca się stosowania innych produktów antyseptycznych jednocześnie lub jeden po drugim ze względu na możliwość interakcji (działanie przeciwstawne, dezaktywacja).

Pomimo, że dawka lidokainy jest niewielka, ze względu na jej zawartość w tym produkcie leczniczym, należy wziąć pod uwagę następujące kwestie:

Produkty lecznicze blokujące receptory beta-adrenergiczne zmniejszają przepływ krwi przez wątrobę, a tym samym prędkość metabolizmu lidokainy, powodując zwiększone ryzyko toksyczności.

Cymetydyna może hamować metabolizm wątrobowy lidokainy, powodując zwiększone ryzyko działania toksycznego. Może to powodować nadwrażliwość krzyżową na inne leki miejscowo znieczulające z grupy amidów.

Leki przeciwartymiczne klasy III, takie jak meksyletyna i prokainamid, mogą wywoływać interakcje farmakokinetyczne lub farmakodynamiczne.

Izoenzymy CYP1A2 i CYP3A4 cytochromu P450 biorą udział w powstawaniu MEGX, farmakologicznie aktywnego metabolitu lidokainy, dlatego inne leki, takie jak fluwoksamina, erytromycyna i itrakonazol, mogą zwiększać stężenie lidokainy w osoczu krwi.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu leczniczego Aspigola smak miętowy bez cukru w okresie ciąży.

Ograniczona ilość danych dotyczących kobiet w ciąży (300-1000 ciąż) nie wskazała, że lidokaina wywołuje wady rozwojowe lub działa toksycznie na płód lub noworodka, chociaż łatwo przenika ona przez barierę łożyska.

Brak danych dotyczących stosowania amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego jako substancji farmakologicznie czynnych w okresie ciąży. Ze względu na brak udokumentowanego doświadczenia dotyczącego stosowania, nie zaleca się przyjmowania produktu Aspigola smak miętowy bez cukru w okresie ciąży.

Karmienie piersią

Nie ustalono bezpieczeństwa stosowania produktu leczniczego Aspigola smak miętowy bez cukru w okresie karmienia piersią.

Lidokaina przenika w niewielkich ilościach do mleka kobiecego. Ze względu na małą dawkę lidokainy nie przewiduje się jej wpływu na niemowlę. Brak danych dotyczących przenikania amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego do mleka kobiecego.

Nie można wykluczyć zagrożenia dla noworodków i (lub) niemowląt. W związku z tym, ten produkt leczniczy nie powinien być stosowany w okresie karmienia piersią.

Płodność

Brak danych dotyczących wpływu stosowania lidokainy, amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego na płodność.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Ten produkt leczniczy nie ma wpływu lub wywiera nieistotny wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługi maszyn.

4.8 Działania niepożądane

W okresie stosowania zgłaszano następujące działania niepożądane dla skojarzenia substancji czynnych wchodzących w skład tego produktu leczniczego. Opisano je według klasyfikacji układów i narządów i sklasyfikowano na podstawie częstości występowania z zastosowaniem następującej konwencji:

Bardzo często ($\geq 1/10$); często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$); niezbyt często ($\geq 1/1\ 000$ do $< 1/100$); rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1\ 000$); bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$); częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia układu immunologicznego

Częstość nieznana: nadwrażliwość (może objawiać się obrzękiem naczynioruchowym, pokrzywką, skurczem oskrzeli i niedociśnieniem tętniczym z utratą przytomności)

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Częstość nieznana: obrzęk gardła

Zaburzenia żołądka i jelit

Częstość nieznana: ból brzucha, nudności, dyskomfort w jamie ustnej (objawami mogą być uczucie pieczenia lub klucia w jamie ustnej lub gardle), obrzęk jamy ustnej, zaburzenia smaku

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Częstość nieznana: wysypka skórna

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych

Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa

Tel.: + 48 22 49 21 301

Faks: + 48 22 49 21 309

Strona internetowa: <https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Objawy

Biorąc pod uwagę małą zawartość substancji czynnych, przedawkowanie jest mało prawdopodobne. Do przedawkowania może dojść w przypadku nieprawidłowego stosowania (znacznie większa dawka, zmiany na błonach śluzowych). Najcięższymi objawami zatrucia lidokainą są objawy ze strony ośrodkowego układu nerwowego (bezsenna, nerwowość, pobudzenie, depresja oddechowa i zatrzymanie oddechu, bezdech, drgawki, śpiączka i zgon) oraz układu krążenia (ciężkie niedociśnienie tętnicze, asystolia, zatrzymanie krążenia i bradykardia); może wystąpić również methemoglobinemia.

Leczenie

Leczenie jest objawowe i wspomagające; konieczny jest nadzór medyczny.

Methemoglobinemię można leczyć przez natychmiastowe wstrzyknięcie dożylnie błękitu metylenowego (1-4 mg/kg masy ciała).

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki stosowane w chorobach gardła, antyseptyki, różne.

Kod ATC: R02AA20.

Alkohol 2,4-dichlorobenzylowy (2,4-DCBA) i amylometakrezol (AMC) to substancje o właściwościach antyseptycznych, przeciwbakteryjnych, przeciwwirusowych i przeciwwgrzybiczych, które przynoszą ulgę w bólu gardła. Lidokaina jest substancją o właściwościach miejscowo znieczulających, z grupy amidów.

Pastyłki twarde zawierające skojarzenie amylometakrezolu i alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego były przedmiotem kilku badań klinicznych przeprowadzonych u osób dorosłych. Wykazano istotne działanie przeciwbólowe, czynnościowe, czuciowe i psychologiczne już po 1-5 minutach. Utrzymywało się ono do 2 godzin po podaniu w przypadku stosowania pastylek twardych. Pacjenci przyjmujący pastylki do ssania zawierające amylometakrezol i alkohol 2,4-dichlorobenzylowy zgłaszali, że odczuwali ulgę w bólu gardła, zmniejszenie trudności w przełykaniu a także odczuwali działanie łagodzące i powlekające.

Lidokaina powoduje zahamowanie przewodnictwa we włóknach nerwowych poprzez blokowanie zależnych od napięcia kanałów Na⁺. Działanie środka znieczulającego miejscowo jest odwracalne

i kończy się, gdy jego stężenie spadnie poniżej poziomu krytycznego (minimalne stężenie blokujące). Rutynowe stosowanie lidokainy jako środka znieczulającego miejscowo oraz niewielka liczba zgłaszanych działań niepożądanych potwierdzają, że przy właściwym stosowaniu jest to środek bezpieczny.

Połączenie wszystkich trzech substancji aktywnych zostało przebadane przez McNally'ego w 2012 roku. W badaniu określono skuteczność przeciwbólową dwóch pastylek do ssania – jednej zawierającej AMC 0,6 mg, 2,4-DCBA 1,2 mg i chlorowodoru lidokainy 10 mg, drugiej zawierającej heksylorezorcynę 2,4 mg - w porównaniu z placebo u pacjentów z ostrym bólem gardła spowodowanym infekcją górnych dróg oddechowych (ang. *upper respiratory tract infection*, URTI). Było to wieloośrodkowe, randomizowane badanie z podwójnie ślepą próbą, w grupach równoległych i kontrolowane placebo. Pierwszorzędnym punktem końcowym skuteczności było zmniejszenie bólu gardła w porównaniu z wartością wyjściową po 2 godzinach w przypadku obu pastylek do ssania w porównaniu z placebo po 2 godzinach od przyjęcia dawki. Tabletki do ssania AMC/DCBA + lidokaina zapewniły szybką i skuteczną ulgę w bólu gardła u pacjentów z URTI.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Okres półtrwania lidokainy wynosi od 1 do 2 godzin (około 100 minut), w zależności od dawki. Okres półtrwania jej metabolitu, glicynianu ksylidyny (GX) jest dłuższy, dlatego może się on gromadzić, w szczególności w przypadku wydalania przez nerki.

Brak odpowiednich danych dotyczących farmakokinetyki alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu, z wyjątkiem badania biodostępności opisanego w Charakterystyce produktu leczniczego produktu Benagol (2008), w którym stwierdzono szybkie uwalnianie obu środków antyseptycznych do śliny, z osiągnięciem maksymalnego stężenia w ciągu 3-4 minut po ssaniu pastylki. Ilość alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu stwierdzona w ślinie po 120 minutach stanowi około 50% podanej dawki.

U pacjentów po zawale mięśnia sercowego (z niewydolnością serca lub bez niewydolności serca) okres półtrwania lidokainy i monoetyloglicynianu ksylidyny (MEGX) jest wydłużony; okres półtrwania GX może również być wydłużony u pacjentów z niewydolnością serca wtórną do zawału mięśnia sercowego. Odnotowano również dłuższy okres półtrwania lidokainy u pacjentów z zastoinową niewydolnością serca lub chorobą wątroby. Może on być wydłużony po ciągłym wlewie dożylnym trwającym ponad 24 godziny. Wydalanie MEGX może być również zmniejszone u pacjentów z zastoinową niewydolnością serca.

Lidokaina łatwo wchłania się przez błony śluzowe. Okres półtrwania w osoczu, w fazie eliminacji wynosi około 2 godzin. Po wchłonięciu ulega znacznemu metabolizmowi pierwszego przejścia w wątrobie i ulega szybkiej deetylacji do aktywnego metabolitu monoetyloglicynianu ksylidyny, który jest następnie hydrolizowany do różnych metabolitów, w tym glicynianu ksylidyny. Mniej niż 10% jest wydalone przez nerki w postaci niezmienionej. Metabolity są również wydalone z moczem.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne dotyczące alkoholu 2,4-dichlorobenzylowego i amylometakrezolu nie wskazują na szczególne zagrożenie dla ludzi. Dane te pochodzą z konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa, badań toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego oraz toksycznego wpływu na rozrodczość i rozwój.

W badaniach nieklinicznych, działanie lidokainy obserwowano jedynie w przypadku narażenia przekraczającego maksymalną ekspozycję u człowieka, co wskazuje na niewielkie znaczenie tych obserwacji w praktyce klinicznej.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Sacharyna sodowa (E 954)
Izomalt (E 953)
Maltitol ciekły (E 965)
Indygotyna (E 132)
Żółcień chinolinowa (E 104)
Olejek miętowy
Olejek eteryczny anyżu gwiazdzistego
Lewomentol
Kwas winowy

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy

6.3 Okres ważności

3 lata

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Brak specjalnych zaleceń dotyczących przechowywania produktu leczniczego.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Blistry PVC/PVDC/Aluminium w tekturowym pudełku
Wielkość opakowań: 12, 16, 24, 36, 48 pastylek twardych

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Brak specjalnych wymagań dotyczących usuwania.

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Bayer Sp. z o. o.
Al. Jerozolimskie 158
02-326 Warszawa

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu:

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