

1. LEGEMIDLETS NAVN

Xyloproct

2. KVALITATIV OG KVANTITATIV SAMMENSETNING

1 g salve inneholder: Lidokain 50 mg, hydrokortisonacetat 2,5 mg
For fullstendig liste over hjelpestoffer se pkt. 6.1.

3. LEGEMIDDELFORM

Rektalsalve, hvit/gulhvitt farge

4. KLINISKE OPPLYSNINGER

4.1 Indikasjoner

Xyloproct er indisert til voksne ved behandling av hemoroider, analfissurer, proktitter, anorektaleksemmer og analkløe.

4.2 Dosering og administrasjonsmåte

Rektalsalve: Utvendige hemoroider: Salven appliseres 2-4 ganger daglig. Innvendige hemoroider: Litt salve presses inn i endetarmsåpningen 2-4 ganger daglig.

4.3 Kontraindikasjoner

Overfølsomhet overfor virkestoffene eller overfor ett eller flere av innholdsstoffene.
Tuberkuløse prosesser i det aktuelle område. Kukopper, kopper, vannkopper, Herpes simplex.

4.4 Advarsler og forsiktighetsregler

Preparatet bør ikke brukes over lang tid og/eller i for høye doser. Før langtidsbruk må mulighet for malignitet utelukkes. Ved soppinfeksjon anbefales lokalvirkende antimykotika.

Pasienter som samtidig behandles med antiarytmika klasse III, f.eks. amiodarone, bør utvise forsiktighet da effektene på hjertet kan være additive. Systemiske effekter av lidokain kan ikke utelukkes (se pkt. 4.5).

Hvis irritasjon eller rektal blødning oppstår, må behandling med Xyloproct avbrytes og pasienten undersøkes nøye og eventuell annen terapi bør påbegynnes. Feilbruk kan maskere eller forverre bakterie-, parasitt-, sopp- eller virusinfeksjon.

Xyloproct rektalsalve er antagelig porfyrinogent og skal kun foreskrives til pasienter med akutt porfyri når det ikke finnes andre trygghere alternativer. Det er grunn til å utvise forsiktighet hos utsatte pasienter.

4.5 Interaksjon med andre legemidler og andre former for interaksjon

Ved høye doser lidokain bør additiv systemisk toksisitet vurderes hvis pasienten samtidig behandles med andre lokalanestetika eller stoffer som er strukturelt like lokalanestetika.

Spesifikke interaksjonsstudier med lidokain og antiarytmika klasse III, f.eks. amiodarone, er ikke utført, men forsiktighet ved behandling av disse pasientene anbefales (se pkt. 4.4).

4.6 Graviditet og amming

Graviditet: Lang klinisk erfaring indikerer liten risiko for fosterskadelige effekter.

Amming: Lidokain og hydrokortisonacetat går over i morsmelk, men det er lite sannsynlig at barn som ammes påvirkes ved terapeutiske doser.

4.7 Påvirkning av evnen til å kjøre bil og bruke maskiner

Legemidlet antas ikke å påvirke evnen til å kjøre bil og bruke maskiner.

4.8 Bivirkninger

Mindre vanlige (<1/100 til $\geq 1/1000$):

Hud: Hudatrofi, ofte irreversibel med tynn hud, telangiectasia, purpura og stria. Rosacea lignende og perioral dermatitt, med og uten hudatrofi, kontaktallergi overfor lidokain eller hydrokortison.

Endokrine: Reboundeffekt, som kan forårsake avhengighet av steroider. Forsinkelse av tilhelingsprosess.

Sjeldne (< 1/1000):

Allmenne: Allergiske reaksjoner, samt anafylaktisk sjokk.

Melding av mistenkte bivirkninger

Melding av mistenkte bivirkninger etter godkjenning av legemidlet er viktig. Det gjør det mulig å overvåke forholdet mellom nytte og risiko for legemidlet kontinuerlig. Helsepersonell oppfordres til å melde enhver mistenkt bivirkning. Dette gjøres via meldeskjema som finnes på nettsiden til Statens legemiddelverk: www.legemiddelverket.no/meldeskjema.

4.9 Overdosering

Lidokain kan forårsake akutt systemisk effekt hvis høye systemiske nivåer nås som følge av hurtig absorpsjon eller overdosering. Det er ikke meldt om toksiske effekter ved anbefalte doser av Xyloproct.

Symptomer på toksisitet/overdosering: Symptomer fra nervesystemet som eksitasjon og i alvorlige tilfelle, sentralnervøs og kardiovaskulær depresjon.

Behandling: Alvorlige nevrologiske symptomer (kramper, CNS-depresjon) må behandles symptomatisk ved respirasjonsstøtte og administrasjon av antikonvulsive legemidler.

5. FARMAKOLOGISKE EGENSKAPER

5.1 Farmakodynamiske egenskaper

Farmakoterapeutisk gruppe: Antihemoroidemiddel. ATC-kode: C05A A01.

Virkningsmekanisme: Xyloproct er en kombinasjon av lidokain og hydrokortison for analgt bruk. Lidokain er et lokalanestetikum som virker lokalbedøvende på det rektale vevet.

Hydrokortison er et mildt kortikosteroid med antiinflammatorisk aktivitet.

Farmakodynamiske effekter: Lidokain forårsaker, i likhet med andre anestetika, reversibel blokada av impulser langs nervefibrene ved å beskytte indre bevegelse av natriumioner gjennom nervemembranen. Lokalanestetika av amidtypen virker i natriumkanalene av nervemembranen. Lokalanestetika kan også ha lignende effekter på eksitabile membraner i hjernen og myokardium. Hvis store doser legemiddel når den systemiske sirkulasjonen raskt, vil symptomer på toksisitet oppstå, i vesentlig grad fra det sentralnervøse og kardiovaskulære systemet.

5.2 Farmakokinetiske egenskaper

Lidokain absorberes som følge av lokal administrasjon i mukøse vev, absorpsjonsrate er avhengig av konsentrasjon og total dose administrert, administrasjonssted, og varighet av eksponering. Generelt er absorpsjonsraten for lokalt absorbert lokalanestetika hurtigst som følge av intratrakeal og bronkial administrasjon. Lidokain har også høy absorpsjon fra mage/tarmtraktus, men lite legemiddel når det systemiske kretsløp p.g.a. biotransformasjon i leveren.

Normalt er ca. 65 % av lidokain bundet til plasmaproteiner. Lokalanestetika av amid-typen er i hovedsak bundet til alfa-1-syre glykoprotein selv om de også er bundet til albumin.

Lidokain passerer blod/hjernebarrieren sannsynligvis ved passiv diffusjon.

Den vanlige eliminasjonsveien for lidokain er via levermetabolisme. Biotransformasjon inkluderer oksidativ N-dealkylering, ring-hydroksylering, kløyving av amid- bindinger og konjugering. N-dealkylering; en stor del av biotransformasjon skjer ved metabolisering til monoetylglisinylylidin og glycinxylylidin. Farmakologisk/toksikologisk virkning av disse metabolitter er lik, men er mindre potent enn lidokain. Ca. 90 % av administrert lidokain utskilles i form av ulike metabolitter, og mindre enn 10 % utskilles uomdannet. Den primære metabolitten i urin er et konjugat av 4-hydroksi-2,6-xylylidin.

Mindre enn 50 % hydrokortison absorberes som følge av rektal absorpsjon. Ved lokal administrasjon, spesielt med okklusivt plaster eller ved skader i hud, kan tilstrekkelig kortikosteroid absorberes og gi systemisk effekt. Kortikosteroider er bundet til plasmaproteiner i det systemiske kretsløpet, vanligvis til globulin og mindre til albumin. Kun ubundet hydrokortison er farmakologisk virksomt eller metaboliseres. Kortikosteroider metaboliseres vanligvis i leveren, men også i nyrer. Utskilles via urin.

5.3 Prekliniske sikkerhetsdata

Hydrokortison er et kortikosteroid som påvirker fosterutvikling hos drektige dyr.

6. FARMASØYTISKE OPPLYSNINGER

6.1 Fortegnelse over hjelpestoffer

Rektalsalve: Aluminiumacetat pulver, sinkoksid, stearylalkohol, cetylalkohol, makrogol (400 og 4000), rensset vann.

6.2 Uforlikeligheter

Ikke aktuelt.

6.3 Holdbarhet

Salve: 24 måneder ved oppbevaring i kjøleskap (2 °C - 8 °C), 2 måneder ved høyst 25 °C hos forbruker.

6.4 Oppbevaringsbetingelser

Salve oppbevares i kjøleskap (2 °C - 8 °C), ved høyst 25 °C i 2 måneder hos forbruker.

6.5 Emballasje (type og innhold)

Salve: Aluminiumstube

6.6 Spesielle forholdsregler for destruksjon og annen håndtering

Beskyttelsesmembranen på tuben, perforeres ved hjelp av korken.

7. INNEHAVER AV MARKEDSFØRINGSTILLATELSEN

Aspen Pharma Trading Limited, 3016 Lake Drive, Citywest Business Campus, Dublin 24, Irland

8. MARKEDSFØRINGSTILLATELSESNUMMER (NUMRE)

4917

9. DATO FOR FØRSTE MARKEDSFØRINGSTILLATELSE / SISTE FORNYELSE

23.07.1965/08.04.2009

10. OPPDATERINGSDATO

31.01.2018