ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НІФЕКАЇН

(NIFECAINE)

Склад:

діючі речовини: nifedipine, lidocaine hydrochloride;

1 г крему містить ніфедипіну 3 мг та лідокаїну гідрохлориду15 мг;

допоміжні речовини: парафін білий м’який, пропіленгліколь, тригліцериди середнього ланцюга, макроголу стеарат, спирт цетостеариловий (тип А) емульгований, гліцеролу моностеарат, натрію метилпарабен (натрію метилпарагідроксибензоат), пропілпарабен (пропілпарагідроксибензоат), вода очищена.

Лікарська форма. Крем ректальний.

Основні фізико-хімічні властивості: однорідний жовтий крем з легким характерним запахом.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування геморою та анальних тріщин для місцевого застосування. Інші препарати, комбінації.

Код АТХ С05А Х03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ніфекаїн має синергічний механізм дії. Ніфедипін є блокатором кальцієвих каналів групи дигідропіридину, при місцевому застосуванні він чинить розслаблювальну дію на периферичні гладкі м’язи. Ніфедипін діє шляхом зниження гіпертонусу внутрішнього анального сфінктера.

Фармакокінетика.

Фармакокінетичні властивості ректального крему Ніфекаїн вивчали за участю здорових добровольців. Визначення активних речовин в крові за допомогою валідованого аналітичного методу дало негативні результати, оскільки в сироватці крові ніфедипін не виявлявся. Крім того, тільки мінімальні сліди лідокаїну виявлялися у 2 пацієнтів з 12. Ці наднизькі концентрації (нижче порога кількісного визначення) є набагато нижчими за концентрації, що здатні чинити терапевтичну дію при системному застосуванні лідокаїну. Отже, системна дія крему Ніфекаїн в результаті всмоктування діючих речовин може бути виключена. Це було підтверджено

подальшими клінічними дослідженнями, під час яких не спостерігалося жодних небажаних ефектів внаслідок системної абсорбції через слизову оболонку аноректальної зони.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування анальних тріщин і прокталгії, пов’язаних з гіпертонусом анального сфінктера.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до діючих речовин, зокрема до лідокаїну та інших місцевих анестетиків амідного типу, наприклад бупівакаїну, етидокаїну, мепівакаїну та прилокаїну, або будь-яких інших допоміжних речовин, що входять до складу препарату.

Передбачувана або підтверджена вагітність та період годування груддю (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Тяжка гіпотензія та серцева недостатність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії не проводилися.

Пацієнтам, які приймають протиаритмічні препарати I класу (наприклад токаїнід, мексилетин) або інші місцеві анестетики, слід застосовувати препарат з обережністю, оскільки існує ризик виникнення сукупних системних ефектів через наявність лідокаїну. Інгібітори моноаміноксидази посилюють місцевоаналгезуючу дію лідокаїну.

Лікування ректальним кремом Ніфекаїн може підсилити дію гіпотензивних засобів через присутність ніфедипіну.

Пропранол подовжує період напіврозпаду лідокаїну та підвищує рівень ніфедипіну в плазмі крові.

Циметидин може підвищувати рівні ніфедипіну та лідокаїну в плазмі крові.

Одночасне застосування крему для ректального застосування Ніфекаїн пацієнтами, які приймають *дигоксин*, може призвести до підвищення рівня дигоксину в плазмі крові.

Особливості застосування.

Місцеве застосування лікарського засобу у надмірних дозах та/або протягом тривалого періоду часу може спричинити явища сенсибілізації, локальну гіперемію та кровотечі, які зникають

після припинення лікування.

Під час клінічних випробувань не було зареєстровано небажаних ефектів внаслідок можливої системної абсорбції лікарського засобу

Ректальний крем Ніфекаїн слід з особливою обережністю застосовувати пацієнтам із серйозними пошкодженнями слизових оболонок та запаленням у зоні, що підлягає лікуванню, оскільки в таких ситуаціях можливе надмірне всмоктування діючих речовин.

Необхідно з обережністю застосовувати Ніфекаїн пацієнтам з цукровим діабетом або з тяжкою печінковою та/або нирковою недостатністю.

Лікування ректальним кремом Ніфекаїн пацієнтів старечого віку, а також пацієнтів, які отримують бета-блокатори або антигіпертензивні препарати, потрібно проводити під наглядом лікаря.

Рекомендується перевірка артеріального тиску на початку лікування та періодично протягом усієї терапії.

У разі неефективності лікування (відсутність поліпшення або погіршення симптомів) його необхідно припинити та звернутися до лікаря за консультацією.

Окрім того, при лікуванні геморою препаратом Ніфекаїн, кремом ректальним, рекомендовано виконувати правила гігієни заднього проходу, дотримуватись рухливого способу життя та правил здорового харчування для забезпечення випорожнень м’якої консистенції.

Ректальний крем Ніфекаїн містить натрію метилпарабен (натрію метилпарагідроксибензоат) та пропілпарабен (пропілпарагідроксибензоат), що можуть спричинити алергічні реакції (можливо, уповільнені). Наявність пропіленгліколю та спирту цетостеарилового (тип А) емульгованого може спричиняти місцеві шкірні реакції (наприклад контактний дерматит).

Гліцеролу моностеарат, що входить до складу препарату, може чинити м’яку проносну дію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Ніфедипін і лідокаїн проникають через плацентарний бар’єр і потрапляють в грудне молоко. Дослідження на щурах і кролях показали, що ніфедипіну чинить тератогенну дію. Лідокаїн не показав наявність будь-яких ризиків для плода.

При застосуванні блокатора кальцієвих каналів, зокрема ніфедипіну, як токолітичного засобу під час вагітності, особливо у випадках багатоплідної вагітності (двійня та більше), внутрішньовенно та/або при супутньому застосуванні бета-2 агоністів спостерігався гострий набряк легень.

Таким чином, вагітним і жінкам, які годують груддю, цей препарат не рекомендований до застосування.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Одночасний прийом ніфедипіну з алкоголем може негативно впливати на швидкість реакції.

Лікарський засіб Ніфекаїн, крем ректальний, призначений для місцевого застосування і діє локально, тому не можна передбачити вплив препарату на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Для ендоректального та періанального застосування. Наносити крем двічі на день протягом принаймні трьох тижнів.

Метод застосування: ляжте на лівий бік, зніміть ковпачок з туби та зафіксуйте канюлю, витисніть невелику кількість крему для змащення канюлі та введіть її в анальний отвір. Натисніть на кінець туби, щоб витиснути приблизно один сантиметр крему (в одному сантиметрі туби міститься приблизно 2,5–3 г крему).

Діти.

Не рекомендовано застосовувати дітям у зв’язку з відсутністю даних стосовно безпеки та ефективності.

Передозування.

Не зафіксовано випадків системної токсичності внаслідок передозування при місцевому застосуванні крему ректального Ніфекаїн. У разі отруєння після місцевого застосування препарату очікується, що системні ефекти будуть схожими з тими, що зазвичай спостерігаються при інших шляхах введення діючих речовин.

У разі сильної інтоксикації ніфедипіном можуть виникнути розлади свідомості, включаючи кому, зниження артеріального тиску, порушення серцевого ритму та кардіогенний шок.

У разі випадкового ковтання лікарського засобу (у разі проковтування кількох грамів крему) очікуються системні симптоми, спричинені застосуванням лідокаїну гідрохлориду. Залежно від дози вони можуть проявлятись у формі серцево-судинних порушень тяжкого ступеня (зниження артеріального тиску, підвищене потовиділення, блідість шкірних покривів, брадикардія, аритмія, пригнічення функцій серця, шок, а в особливо тяжких випадках – зупинка серця) або реакцій, пов’язаних із порушеннями з боку центральної нервової системи (головний біль, запаморочення, нечіткість зорового сприйняття, диплопія, шум у вухах, сонливість, оніміння кінцівок, озноб, занепокоєння, судоми, диспное, а в особливо тяжких випадках – дихальна недостатність). Можлива метгемоглобінемія.

Лікування. У разі передозування потрібні ретельний моніторинг життєво важливих функцій, підтримуючі заходи, які забезпечують рівень кисню, а також симптоматичне лікування порушень з боку центральної нервової системи та серцево-судинної системи, наприклад, бета-симпатоміметичні засоби можна застосовувати при брадикардії, атропін, а у разі вираженої гіпотензії – глюконат кальцію (10–20 мл внутрішньовенно повільно 10% розчину) та, можливо, допамін або норадреналін.

Значна частина токсичних реакцій на місцеві анестетики та лідокаїн мають прояви з боку ЦНС; з'являються запаморочення, що часто супроводжуються порушеннями зору та слуху, наприклад труднощі з акомодацією та шум у вухах. У найтяжчих випадках можливе пригнічення ЦНС та судоми. Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.

Місцево можуть з'являтися такі реакції, як біль, печіння, свербіж, гіперемія та кровотеча. Ці ефекти слабшають при припиненні лікування.

У дуже рідкісних випадках місцеве застосування препаратів, що містять лідокаїн, спричиняло алергічні реакції (у тяжких випадках – анафілактичний шок).

Під час клінічних випробувань не спостерігалося жодних побічних ефектів через можливу системну абсорбцію двох активних інгредієнтів (головний біль, запаморочення, периферична вазодилатація, гіпотонія, запаморочення та тремор).

Частота невідома: набряк легенів*.

Системні побічні реакції, пов'язані з лідокаїном, ідентичні за проявами до таких, що пов'язані з місцевими анестетиками амідної групи.

*Зареєстровано випадки при застосуванні як токолітика під час вагітності (див. розділ *«Застосування у період вагітності або годування груддю»).*

Термін придатності. 3 роки.

Використати впродовж 30 днів після відкриття туби.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 30 г крему в тубі з ковпачком; по 1 тубі у комплекті з канюлею у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

Нью.Фа.Дем. С.р.л.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

ЗОНА ІНДАСТРІАЛ - 80014 ГІУГЛІАНО У КАМПАНІЇ (НА), Італія

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

НІФЕКАЇН

(NIFECAINE)

Склад:

діючі речовини: nifedipine, lidocaine hydrochloride;

1 г крему містить ніфедипіну 3 мг та лідокаїну гідрохлориду15 мг;

допоміжні речовини: парафін білий м’який, пропіленгліколь, тригліцериди середнього ланцюга, макроголу стеарат, спирт цетостеариловий (тип А) емульгований, гліцеролу моностеарат, натрію метилпарабен (натрію метилпарагідроксибензоат), пропілпарабен (пропілпарагідроксибензоат), вода очищена.

Лікарська форма. Крем ректальний.

Основні фізико-хімічні властивості: однорідний жовтий крем з легким характерним запахом.

Фармакотерапевтична група. Засоби для лікування геморою та анальних тріщин для місцевого застосування. Інші препарати, комбінації.

Код АТХ С05А Х03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Ніфекаїн має синергічний механізм дії. Ніфедипін є блокатором кальцієвих каналів групи дигідропіридину, при місцевому застосуванні він чинить розслаблювальну дію на периферичні гладкі м’язи. Ніфедипін діє шляхом зниження гіпертонусу внутрішнього анального сфінктера.

Фармакокінетика.

Фармакокінетичні властивості ректального крему Ніфекаїн вивчали за участю здорових добровольців. Визначення активних речовин в крові за допомогою валідованого аналітичного методу дало негативні результати, оскільки в сироватці крові ніфедипін не виявлявся. Крім того, тільки мінімальні сліди лідокаїну виявлялися у 2 пацієнтів з 12. Ці наднизькі концентрації (нижче порога кількісного визначення) є набагато нижчими за концентрації, що здатні чинити терапевтичну дію при системному застосуванні лідокаїну. Отже, системна дія крему Ніфекаїн в результаті всмоктування діючих речовин може бути виключена. Це було підтверджено подальшими клінічними дослідженнями, під час яких не спостерігалося жодних небажаних ефектів внаслідок системної абсорбції через слизову оболонку аноректальної зони.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування анальних тріщин і прокталгії, пов’язаних з гіпертонусом анального сфінктера.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до діючих речовин, зокрема до лідокаїну та інших місцевих анестетиків амідного типу, наприклад бупівакаїну, етидокаїну, мепівакаїну та прилокаїну, або будь-яких інших допоміжних речовин, що входять до складу препарату.

Передбачувана або підтверджена вагітність та період годування груддю (див. розділ «Застосування у період вагітності або годування груддю»).

Тяжка гіпотензія та серцева недостатність.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії не проводилися.

Пацієнтам, які приймають протиаритмічні препарати I класу (наприклад токаїнід, мексилетин) або інші місцеві анестетики, слід застосовувати препарат з обережністю, оскільки існує ризик виникнення сукупних системних ефектів через наявність лідокаїну. Інгібітори моноаміноксидази посилюють місцевоаналгезуючу дію лідокаїну.

Лікування ректальним кремом Ніфекаїн може підсилити дію гіпотензивних засобів через присутність ніфедипіну.

Пропранол подовжує період напіврозпаду лідокаїну та підвищує рівень ніфедипіну в плазмі крові.

Циметидин може підвищувати рівні ніфедипіну та лідокаїну в плазмі крові.

Одночасне застосування крему для ректального застосування Ніфекаїн пацієнтами, які приймають *дигоксин*, може призвести до підвищення рівня дигоксину в плазмі крові.

Особливості застосування.

Місцеве застосування лікарського засобу у надмірних дозах та/або протягом тривалого періоду часу може спричинити явища сенсибілізації, локальну гіперемію та кровотечі, які зникають після припинення лікування.

Під час клінічних випробувань не було зареєстровано небажаних ефектів внаслідок можливої системної абсорбції лікарського засобу

Ректальний крем Ніфекаїн слід з особливою обережністю застосовувати пацієнтам із серйозними пошкодженнями слизових оболонок та запаленням у зоні, що підлягає лікуванню, оскільки в таких ситуаціях можливе надмірне всмоктування діючих речовин.

Необхідно з обережністю застосовувати Ніфекаїн пацієнтам з цукровим діабетом або з тяжкою печінковою та/або нирковою недостатністю.

Лікування ректальним кремом Ніфекаїн пацієнтів старечого віку, а також пацієнтів, які отримують бета-блокатори або антигіпертензивні препарати, потрібно проводити під наглядом лікаря.

Рекомендується перевірка артеріального тиску на початку лікування та періодично протягом усієї терапії.

У разі неефективності лікування (відсутність поліпшення або погіршення симптомів) його необхідно припинити та звернутися до лікаря за консультацією.

Окрім того, при лікуванні геморою препаратом Ніфекаїн, кремом ректальним, рекомендовано

виконувати правила гігієни заднього проходу, дотримуватись рухливого способу життя та правил здорового харчування для забезпечення випорожнень м’якої консистенції.

Ректальний крем Ніфекаїн містить натрію метилпарабен (натрію метилпарагідроксибензоат) та пропілпарабен (пропілпарагідроксибензоат), що можуть спричинити алергічні реакції (можливо, уповільнені). Наявність пропіленгліколю та спирту цетостеарилового (тип А) емульгованого може спричиняти місцеві шкірні реакції (наприклад контактний дерматит).

Гліцеролу моностеарат, що входить до складу препарату, може чинити м’яку проносну дію.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Ніфедипін і лідокаїн проникають через плацентарний бар’єр і потрапляють в грудне молоко. Дослідження на щурах і кролях показали, що ніфедипіну чинить тератогенну дію. Лідокаїн не показав наявність будь-яких ризиків для плода.

При застосуванні блокатора кальцієвих каналів, зокрема ніфедипіну, як токолітичного засобу під час вагітності, особливо у випадках багатоплідної вагітності (двійня та більше), внутрішньовенно та/або при супутньому застосуванні бета-2 агоністів спостерігався гострий набряк легень.

Таким чином, вагітним і жінкам, які годують груддю, цей препарат не рекомендований до застосування.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами.

Одночасний прийом ніфедипіну з алкоголем може негативно впливати на швидкість реакції.

Лікарський засіб Ніфекаїн, крем ректальний, призначений для місцевого застосування і діє локально, тому не можна передбачити вплив препарату на здатність керувати автотранспортом або іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Для ендоректального та періанального застосування. Наносити крем двічі на день протягом принаймні трьох тижнів.

Метод застосування: ляжте на лівий бік, зніміть ковпачок з туби та зафіксуйте канюлю, витисніть невелику кількість крему для змащення канюлі та введіть її в анальний отвір. Натисніть на кінець туби, щоб витиснути приблизно один сантиметр крему (в одному сантиметрі туби міститься приблизно 2,5–3 г крему).

Діти.

Не рекомендовано застосовувати дітям у зв’язку з відсутністю даних стосовно безпеки та ефективності.

Передозування.

Не зафіксовано випадків системної токсичності внаслідок передозування при місцевому застосуванні крему ректального Ніфекаїн. У разі отруєння після місцевого застосування препарату очікується, що системні ефекти будуть схожими з тими, що зазвичай спостерігаються при інших шляхах введення діючих речовин.

У разі сильної інтоксикації ніфедипіном можуть виникнути розлади свідомості, включаючи кому, зниження артеріального тиску, порушення серцевого ритму та кардіогенний шок.

У разі випадкового ковтання лікарського засобу (у разі проковтування кількох грамів крему) очікуються системні симптоми, спричинені застосуванням лідокаїну гідрохлориду. Залежно від дози вони можуть проявлятись у формі серцево-судинних порушень тяжкого ступеня (зниження артеріального тиску, підвищене потовиділення, блідість шкірних покривів, брадикардія, аритмія, пригнічення функцій серця, шок, а в особливо тяжких випадках – зупинка серця) або реакцій, пов’язаних із порушеннями з боку центральної нервової системи (головний біль, запаморочення, нечіткість зорового сприйняття, диплопія, шум у вухах, сонливість, оніміння кінцівок, озноб, занепокоєння, судоми, диспное, а в особливо тяжких випадках – дихальна недостатність). Можлива метгемоглобінемія.

Лікування. У разі передозування потрібні ретельний моніторинг життєво важливих функцій, підтримуючі заходи, які забезпечують рівень кисню, а також симптоматичне лікування порушень з боку центральної нервової системи та серцево-судинної системи, наприклад, бета-симпатоміметичні засоби можна застосовувати при брадикардії, атропін, а у разі вираженої гіпотензії – глюконат кальцію (10–20 мл внутрішньовенно повільно 10% розчину) та, можливо, допамін або норадреналін.

Значна частина токсичних реакцій на місцеві анестетики та лідокаїн мають прояви з боку ЦНС; з’являються запаморочення, що часто супроводжуються порушеннями зору та слуху, наприклад труднощі з акомодацією та шум у вухах. У найтяжчих випадках можливе пригнічення ЦНС та судоми. Лікування симптоматичне.

Побічні реакції.

Місцево можуть з’являтися такі реакції, як біль, печіння, свербіж, гіперемія та кровотеча. Ці ефекти слабшають при припиненні лікування.

У дуже рідкісних випадках місцеве застосування препаратів, що містять лідокаїн, спричиняло алергічні реакції (у тяжких випадках – анафілактичний шок).

Під час клінічних випробувань не спостерігалося жодних побічних ефектів через можливу системну абсорбцію двох активних інгредієнтів (головний біль, запаморочення, периферична вазодилатація, гіпотонія, запаморочення та тремор).

Частота невідома: набряк легенів*.

Системні побічні реакції, пов’язані з лідокаїном, ідентичні за проявами до таких, що пов’язані з місцевими анестетиками амідної групи.

*Зареєстровано випадки при застосуванні як токолітика під час вагітності (див. розділ «*Застосування у період вагітності або годування груддю»).*

Термін придатності. 3 роки.

Використати впродовж 30 днів після відкриття туби.

Умови зберігання.

Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка.

По 30 г крему у тубі з ковпачком; по 1 тубі у комплекті з канюлею у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

ВАМФАРМА С.Р.Л.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

ВІА КЕННЕДІ, 5, КОМАЗЗО (ЛО), 26833, Італія