

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ЛІДОКСАН МЕНТОЛ

(LIDOKSAN MENTHOL)

Склад:

діючі речовини: хлоргексидину дигідрохлорид, лідокаїну гідрохлорид;

1 льодяник містить хлоргексидину дигідрохлориду 5 мг та лідокаїну гідрохлориду 1 мг;

допоміжні речовини: ментол (левоментол), кислота лимонна безводна, магнію стеарат, сорбіт (E 420).

Лікарська форма. Льодяники.

Основні фізико-хімічні властивості: круглі таблетки білого або майже білого кольору з невеликими вкрапленнями з м'ятним смаком та запахом.

Фармакотерапевтична група. Лікарські засоби, що застосовуються при захворюваннях горла. Антисептики. Код АТХ R02AA05.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка. Лідокаїну гідрохлорид є периферійним місцевим анестетиком амідного типу. Він проявляє поверхневий аналгетичний ефект без затримки проведення нервових імпульсів в місці введення.

Як місцевий анестетик, лідокаїн має той самий механізм дії, що й інші препарати цієї групи: він блокує генерацію і проведення нервових імпульсів у чутливих, рухових і вегетативних нервових волокнах. Він безпосередньо впливає на мембрани клітин, інгібуючи надходження іонів натрію в нервові волокна через мембрани. У зв'язку з прогресуючим поширенням анестезувального ефекту зростає поріг електричного збудження в периферичних нервах, проведення нервового імпульсу сповільнюється, а відтворення потенціалу дії послаблюється, що в кінцевому підсумку, призводить до повного блокування нервового імпульсу. Загалом місцеві анестетики швидше блокують вегетативні нерви, дрібні немієлінізовані (відчуття болю) і дрібні мієлінізовані (відчуття болю, температура), ніж великі мієлінізовані волокна (відчуття дотику, тиску).

На молекулярному рівні лідокаїн специфічно блокує натрієві іонні канали в неактивному стані,

що перешкоджає генеруванню потенціалу дії, запобігаючи проведенню нервового імпульсу при місцевому застосуванні лідокаїну поблизу нерва.

Вплив на периферичні нерви є важливим, якщо лідокаїн застосовується як місцевий анестетик. Співвідношення ефективності та токсичності є сприятливим. Спричинені лідокаїном алергічні реакції спостерігаються дуже рідко.

Хлоргексидин є катіонним антисептиком, який чинить антибактеріальний вплив як на грампозитивні, так і на грамнегативні мікроорганізми (наприклад, *Micrococcus sp.*, *Staphylococcus sp.*, *Streptococcus sp.*, *Bacillus sp.*, *Clostridium sp.*, *Corynebacterium sp.*). Він також чинить протимікозну дію відносно дерматофітів та грибів. Препарат діє як бактеріостатик в низьких концентраціях, а у високих концентраціях виявляє бактерицидну дію.

Хлоргексидин несе потужний позитивний заряд; таким чином, він адсорбується на негативно заряджених ділянках бактеріальної клітинної стінки і на позаклітинних структурах. Абсорбція специфічна і локалізується на відповідних ділянках бактеріальної клітинної стінки, що містять фосфати.

Хлоргексидин зв'язується з цитоплазматичною мембраною бактерії. Він адсорбується на негативно зарядженій поверхні зубів, на розташованих в роті пластинах чи мембрані ротової порожнини. Невеликі кількості активних речовин потрапляють в шлунково-кишковий тракт зі слиною. Хлоргексидин не піддається всмоктуванню. Лідокаїн може всмоктуватися через слизову оболонку рота і глотки. Однак більша його частина руйнується, не досягаючи системного кровотоку.

Фармакокінетика.

Хлоргексидин

Абсорбція

Після місцевого або перорального застосування хлоргексидин погано абсорбується. Після місцевого застосування на уражену ділянку шкіри хлоргексидин абсорбується зовнішнім шаром шкіри, що спричиняє тривалий бактерицидний вплив на шкіру. Під час фармакокінетичних досліджень виявлено, що приблизно 30 % хлоргексидину залишається у ротовій порожнині після промивання, а далі поступово вивільняється у слину. Пацієнти проковтують близько 4 % хлоргексидину.

Розподіл

Після перорального застосування зв'язування хлоргексидину з білками плазми є недостатнім.

Метаболізм та виведення

Хлоргексидин не накопичується. Метаболізується тільки незначна частина. 10 % абсорбованої діючої речовини виводиться з сечею, а 90 % — з калом.

Лідокаїн

Абсорбція

Ступінь системної абсорбції лідокаїну залежить від ділянки та шляху застосування. Він швидко абсорбується із травного тракту, слизових оболонок та через пошкоджену шкіру, однак перед

попаданням у системний кровотік більша його частина розкладається. Абсорбція зі слизових оболонок після місцевого застосування залежить від перфузії та загальної дози. Через 30 хвилин після застосування менше ніж 17 % від дози може виводитись в незміненому стані із травного тракту та менше ніж 1,5 % — з інших тканин.

Анестезувальна дія лідокаїну після місцевого застосування проявляється через дві – п'ять хвилин та триває від 30 до 45 хвилин. Анестезія є поверхневою та не поширюється на підслизові структури.

Розподіл

Лідокаїн добре розподіляється у тканинах (нирках, легенях, печінці, серці, жировій тканині). Лідокаїн проникає через гематоенцефалічний бар'єр та плаценту та виділяється в грудне молоко людини.

Метаболізм та виведення

Лідокаїн метаболізується шляхом першого проходження через печінку. Він деалкілується у печінці. Перші два метаболіти є фармакологічно активними. У деяких пацієнтів ці два метаболіти чинять токсичний вплив на центральну нервову систему. Він виводиться головним чином нирками у формі метаболітів, 10 % — у вигляді незміненої субстанції. Біологічний період напіввиведення лідокаїну становить 1,5–2 години у дорослих пацієнтів та 3 години у новонароджених. Біологічний період напіввиведення метаболітів лідокаїну становить 2–10 годин.

Біологічний період напіввиведення пролонгований при застійній серцевій недостатності, захворюваннях печінки та інфаркті міокарда.

Клінічні характеристики.

Показання.

Запальні та інфекційні захворювання порожнини рота та глотки — такі як: стоматити, гінгівіти, фарингіти, що супроводжуються болем при ковтанні та подразненнях.

Протипоказання.

- Підвищена чутливість до діючих речовин (хлоргексидину або лідокаїну) чи до будь-якої з допоміжних речовин препарату або до місцевих анестетиків амідного типу.
- Дитячий вік до 6 років;
- Протипоказано дітям із судомами м'язів в анамнезі (включаючи фебрильні судоми), оскільки цей лікарський засіб містить левоментол.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Лідокаїн є відомим інгібітором ферменту CYP1A2 та меншою мірою — ізоферментів 2D6 та 3A4, але взаємодії із субстратами цих ферментів при застосуванні препарату у рекомендованих дозах є клінічно незначущими.

Лідокаїн не слід застосовувати разом з іншими дезінфекційними розчинами, що містять важкі метали. Коіонофорез вазоактивних речовин може значно вплинути на трансдермальну доставку лідокаїну.

Описані клінічно незначні взаємодії лідокаїну з такими лікарськими засобами: нервово-м'язові інгібітори, інші антиаритмічні засоби, гідантоїни (протиепілептичні засоби), адреналін, опіати, бета-блокатори, циметидин, антиаритмічний мексилетин. Незначущі взаємодії також спостерігалися у пацієнтів з інфарктом міокарда, спричиненим кокаїном.

Пацієнтам не слід приймати Лідоксан Ментол одночасно з інгібіторами холінестерази (наприклад неостигміном, дистигміном, піридостигміном) або з іншими лікарськими засобами для лікування тяжкої міастенії.

На фоні лікування льодяниками Лідоксан Ментол пацієнтам не слід застосовувати інші місцеві антисептики для одночасної дезінфекції горла. Це не стосується інших лікарських засобів, що містять хлоргексидин/лідокаїн, через вміст однакового діючого інгредієнта. Разова доза льодяників повинна замінити разову дозу спрею. При одночасному застосуванні спрею і льодяників пацієнтам не слід перевищувати добову дозу. Також спрей і льодяники не слід застосовувати дітям одночасно.

Хлоргексидин несумісний з аніоноактивними речовинами (наприклад натрію лаурилсульфатом) та деякими іншими речовинами (наприклад альгінатами, трагакантом), які часто містяться у зубних пастах. Таким чином, інтервал між чищенням зубів і прийомом льодяників Лідоксан Ментол повинен становити не менше 30 хвилин.

Особливості застосування.

Бактеріальні інфекції, що супроводжуються підвищенням температури тіла, слід лікувати окремо. У таких випадках, після консультації з лікарем, Лідоксан Лимон використовують як додатковий лікарський засіб для зняття болю в глотці.

Слід бути обережним, призначаючи препарат пацієнтам із серцевою недостатністю, порушенням функції печінки, а також пацієнтам, які одночасно приймають аналоги лідокаїну (антиаритмічні засоби класу I), через збільшення ризику посилення побічної дії лідокаїну.

Пацієнтам, схильним до реакцій гіперчутливості, Лідоксан Ментол слід застосовувати з обережністю.

Пацієнтам не слід застосовувати цей лікарський засіб більше 3-4 днів. Його рекомендується використовувати лише до зменшення болю і подразнення глотки,

спричинених запаленням. Якщо за цей час стан пацієнта не покращується, слід припинити лікування та звернутися до лікаря.

Після застосування пацієнту не слід приймати їжу або напої та чистити зуби.

Цей лікарський засіб містить сорбіт (Е 420). Якщо у Вас встановлена непереносимість деяких цукрів, проконсультуйтеся з лікарем, перш ніж приймати цей лікарський засіб.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Зміна фармакокінетики та/або фармакодинаміки лідокаїну під час вагітності може викликати токсичні ефекти. Немає адекватних і контрольованих досліджень застосування хлоргексидину вагітним жінкам.

Метаболіти лідокаїну виділяються з грудним молоком; проте жодних побічних ефектів у немовлят на грудному вигодовуванні не спостерігалось. Невідомо, чи проникає хлоргексидин у грудне молоко. Однак застосування лікарського засобу вагітним жінкам і матерям-годувальницям не рекомендується, якщо ризик не є меншим за очікувану користь від лікування.

Дані про вплив лідокаїну та хлоргексидину на фертильність людини відсутні.

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

Жодних досліджень щодо впливу препарату на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або роботі з іншими механізмами не проводилось.

Лікарський засіб не впливає або має незначний вплив на здатність керувати автомобілем та іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Дорослі та діти віком від 12 років

Рекомендована доза — від 6 до 10 льодяників на день залежно від тяжкості симптомів. Льодяник слід повільно розсмоктувати у ротовій порожнині кожні 2,5–4 години.

Діти віком від 6 до 12 років

Рекомендована доза для дитини віком від 6 років становить половину дози дорослої людини, тобто від 3 до 5 льодяників на день залежно від тяжкості симптомів. Лідоксан Ментол слід повільно розсмоктувати у роті кожних 5–8 годин.

Максимальна разова доза для дорослих становить 5 мг хлоргексидину (0,08 мг/кг маси тіла) і 1 мг лідокаїну (0,02 мг/кг маси тіла), що відповідає 1 льодянику.

Максимальна добова доза хлоргексидину становить 50 мг, а максимальна добова доза лідокаїну становить 10 мг, що відповідає 10 льодяникам.

Спосіб застосування.

Лідоксан Ментол, льодяники, необхідно розсмоктувати до повного розчинення. Препарат призначають для місцевого застосування в ротовій порожнині і горлі.

Не бажано застосовувати препарат під час або зразу ж після вживання їжі.

Тривалість лікування

Лідоксан Ментол не можна приймати протягом більше 3–4 днів. Якщо протягом цього періоду часу стан пацієнта не покращується або у пацієнта розвивається бактеріальна інфекція, що супроводжується підвищенням температури тіла, лікування слід припинити і звернутися за консультацією до лікаря.

Пацієнти з цукровим діабетом

Лідоксан Ментол не містить цукру (сахарози) — його можна приймати пацієнтам з цукровим діабетом.

Діти. Не призначають дітям віком до 6 років.

Передозування.

Хоча лікарський засіб містить лише невелику частку токсичних доз обох діючих речовин і використовується місцево в ротовій порожнині, його можна проковтнути помилково або через неосторожність. Особливо це стосується дітей.

Хлоргексидин абсорбується із травного тракту у незначній кількості. Лідокаїн абсорбується швидше, але біодоступність після перорального застосування становить тільки 35 %. Токсичні ефекти лідокаїну виникають при плазмових концентраціях, що перевищують 6 мг/л. Після застосування надмірних доз (більше 20 льодяників на день) можуть виникати труднощі при ковтанні (зниження контролю над ковтальним рефлексом) — в такому випадку слід негайно звернутися до лікаря. Системна інтоксикація виникає внаслідок впливу на центральну нервову систему та серцево-судинну систему. Першими реакціями передозування є ушкодження центральної нервової системи.

Симптоми, які можуть виникнути при системній інтоксикації:

- з боку центральної нервової системи:

головний біль, галюцинації, запаморочення, в'ялість, сонливість, неспокій, дзвін у вухах, парестезії, порушення мовлення і слуху, періоральне оніміння, метаболічний ацидоз, ністагм, тремор м'язів, психоз, судоми, зупинка дихання, кома, епілептичний напад, зміна рівня свідомості;

- з боку серцево-судинної системи:

циркуляторний колапс, тяжка брадикардія, серцева аритмія (зупинка синусового вузла, тахіаритмія), зупинка серця.

Крім того, відомі окремі випадки передозування хлоргексидином з появою таких симптомів: набряк глотки, некротичні ураження стравоходу, підвищення показників амінотрансфераз у сироватці крові (більш ніж у 30 разів вище норми), блювання, ерозії шлунка та дванадцятипалої кишки з активним атрофічним гастритом, ейфорія, порушення зору та повна втрата смаку (упродовж 8 годин).

Лікування при системній інтоксикації

При виникненні симптомів системної інтоксикації терапію слід негайно припинити. Слід викликати блювання та промити шлунок. Слід прийняти аніоноактивні речовини, наприклад: алкілбензолсульфонат, алкілсульфонат чи алкілсульфат натрію. У більш тяжких випадках пацієнта слід госпіталізувати для підтримки дихання та кровообігу, а також для уникнення зневоднення. Для лікування судомних нападів застосовують діазепам.

Побічні реакції.

Небажані явища наведено за класами систем органів і частотою виникнення:

дуже часті ($\geq 1/10$);

часті ($\geq 1/100$ до $< 1/10$);

нечасті ($\geq 1/1000$ до $< 1/100$);

поодинокі ($\geq 1/10000$ до $< 1/1000$);

рідкісні ($< 1/10000$);

невідомо (не може бути розрахована за наявними даними).

З боку системи крові та лімфатичної системи

Невідомо: метгемоглобінемія.

З боку імунної системи

Часті: шкірні реакції гіперчутливості.

Поодинокі: тяжкі реакції гіперчутливості, включаючи анафілактичний шок.

Рідкісні: уртикарія.

Невідомо: реакції гіперчутливості уповільненого типу (контактна алергія, фоточутливість) або інші реакції з боку шкіри чи зубів, чи одночасний розвиток цих реакцій.

З боку психіки

Невідомо: неспокій, збудження, ейфорія.

З боку нервової системи

Невідомо: сонливість, запаморочення, дезорієнтація, сплутаність свідомості (включаючи сплутаність мовлення), вертиго, тремор, психоз, нервозність, парестезії, оніміння, судоми, втрата свідомості, кома.

З боку органів зору

Невідомо: порушення зору, включаючи неясність зору, або диплопія.

З боку органів слуху та лабіринту

Невідомо: дзвін у вухах (тинітус).

З боку дихальної системи, органів грудної клітки та середостіння

Невідомо: диспное, респіраторний дистрес-синдром, пригнічення дихання, зупинка дихання, астма.

З боку травного тракту

Часті: нудота, блювання, біль у животі.

Невідомо: труднощі з ковтанням, виразки у ротовій порожнині.

З боку шкіри та підшкірної клітковини

Поодинокі: контактний дерматит.

Невідомо: ліхеноїдні реакції, лущення шкіри, набряк привушної залози.

З боку скелетно-м'язової та сполучної тканини

Невідомо: посмикування м'язів або тремор.

Порушення загального характеру

Невідомо: астенія, транзиторне порушення смаку або відчуття печіння язика, відчуття гарячого або холодного.

При тривалому та безперервному застосуванні хлоргексидину по всій поверхні ротової порожнини може виникати тимчасове коричневе забарвлення зубів. Однак це забарвлення можна усунути. Не було повідомлень про зміну кольору зубів під час застосування лікарського засобу тільки в ділянці глотки.

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану систему з фармаконагляду за посиланням: <https://aisf.dec.gov.ua/>.

Термін придатності. 3 роки.

Умови зберігання. Зберігати при температурі не вище 25 °С. Зберігати в недоступному для дітей місці.

Упаковка. Блістер, що містить 12 льодяників; по 2 блістери в картонній коробці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник.

(випуск серій)

Лек Фармацевтична компанія д.д./ Lek Pharmaceuticals d.d.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

вул. Веровшкова 57, Любляна 1526, Словенія/ Verovskova ulica 57, Ljubljana 1526, Slovenia.

Виробник.

(виробництво за повним циклом)

Лабораторія Кваліфар НВ (Кваліфар НВ)/ Laboratoria Qualiphar NV (Qualiphar NV).

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Рііксвег 9, Борнем, 2880, Бельгія / Rijksweg 9, Bornem, 2880, Belgium.