

## **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**

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 tryggere 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 Fertilitet, 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.

#### **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 analt 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 blokkade 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 monoetylglisinylidin og glycinxyloidin. 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 uomodannet. Den primære metabolitten i urin er et konjugat av 4-hydroksi-2,6-xyloidin.

Mindre enn 50 % hydrokortison absorberes som følge av rektal absorpsjon. Ved lokal administrering, spesielt med okkulsivt 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**

AstraZeneca AS, Oslo

## **8. MARKEDSFØRINGSTILLATELSESNUMMER (NUMRE)**

4917.

## **9. DATO FOR FØRSTE MARKEDSFØRINGSTILLATELSE / SISTE FORNYELSE**

23.07.1965/03.06.2004

## **10. OPPDATERINGSDATO**

18.05.2010