

SOUHRN ÚDAJŮ O PŘÍPRAVKU

1. NÁZEV LÉČIVÉHO PŘÍPRAVKU

Aspegola 2,23 mg/ml + 4,46 mg/ml + 6,0 mg/ml orální sprej, roztok

2. KVALITATIVNÍ A KVANTITATIVNÍ SLOŽENÍ

	Jeden ml roztoku obsahuje:	Jeden vstřík (0,13 ml) obsahuje
Amylmetakresol	2,23 mg	0,29 mg
2,4-dichlorbenzylalkohol	4,46 mg	0,58 mg
Monohydrát lidokain-hydrochloridu	7,39 mg	0,96 mg
	(odpovídá 6,0 mg lidokainu)	(odpovídá 0,78 mg lidokainu)

Pomocné látky se známým účinkem:

Ethanol	310,27 mg/ml
Sorbitol	91,00 mg/ml

Úplný seznam pomocných látek viz bod 6.1.

3. LÉKOVÁ FORMA

Orální sprej, roztok

Načervenalý homogenní roztok s anýzovou a mátovou příchutí a vůní, s pH v rozmezí 6,5–7,5.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1. Terapeutické indikace

Ke krátkodobé místní antiseptické léčbě k úlevě od bolesti a zánětu v hrdle a v dutině ústní (zarudnutí, edém) a dalších příznaků bolavého hrdla u dospělých a dospívajících od 12 let.

4.2. Dávkování a způsob podání

Dávkování

Dospělí a dospívající ve věku od 15 let:

2 vstříky spreje do úst a/nebo do hrdla jednou až maximálně šestkrát během 24 hodin

Dospívající ve věku 12 až 15 let:

2 vstříky spreje do úst a/nebo do hrdla jednou až maximálně čtyřikrát během 24 hodin

Pediatrická populace

Tento léčivý přípravek je kontraindikován u dětí mladších 12 let (viz bod 4.3).

Způsob podání

Orální podání.

Trysku je třeba namířit do zadní části hrdla.

Pumpičku je třeba dvakrát stisknout, pokaždé je přitom potřeba ji úplně stisknout a mezi oběma aplikacemi spreje sundat z pumpičky prst.

Během aplikace spreje se má zadržet dech.

Tento léčivý přípravek se nemá užívat před jídlem nebo pitím či bezprostředně poté.

4.3. Kontraindikace

Hypersenzitivita na léčivou látku/léčivé látky nebo na kteroukoli pomocnou látku uvedenou v bodě 6.1.

Alergie na lokální anestetika amidového typu v anamnéze.

Pacienti náchylní k methemoglobinemii nebo se suspektní methemoglobinemii či jejím výskytem anamnéze.

Vzhledem k obsahu lidokainu je přípravek kontraindikován u dětí mladších 12 let.

4.4. Zvláštní upozornění a opatření pro použití

- Pokud symptomy přetrvávají po 3 až 4 dnech nebo se zhoršují, případně objeví-li se další symptomy, jako je vysoká horečka, bolest hlavy, nauzea nebo zvracení, je třeba se poradit s lékařem.
- Nadměrné dávkování, příliš krátké dávkovací intervaly nebo použití přípravku na poškozenou sliznici může vést ke zvýšeným plazmatickým koncentracím a k závažným nežádoucím účinkům (viz bod 4.9). Tento léčivý přípravek se nemá použít v oblasti dutiny ústní a hrdla v případě přítomnosti větších akutních ran.
- Tento léčivý přípravek se nedoporučuje u pacientů s astmatem či bronchospasmem v anamnéze nebo v současnosti.
- Tento léčivý přípravek je nutno podávat s opatrností u akutně nemocných nebo fragilních starších pacientů, kteří jsou citlivější na nežádoucí účinky tohoto léčivého přípravku.
- Aspegola může způsobovat necitlivost jazyka a může zvyšovat nebezpečí poranění kousnutím. Anestezie hrdla vyvolaná tímto léčivým přípravkem může vést k aspiraci do plic (kašel při jídle vyvolávající dojem, že se osoba dusí). Pacient si má být vědom, že navození topické anestezie může narušit polykání a zvýšit tak riziko aspirace. Je tudíž zásadní, aby se tento léčivý přípravek neužíval před jídlem či pitím.

Je třeba zabránit přímému zasažení očí sprejem.

Tento léčivý přípravek obsahuje 84,03 mg alkoholu (ethanolu) v jedné dávce (dvě stisknutí pumpičky). Množství alkoholu v jedné dávce tohoto léčivého přípravku odpovídá méně než 2,1 ml piva nebo 0,84 ml vína. Takto malé množství alkoholu v tomto léčivém přípravku nemá žádné znatelné účinky.

Tento léčivý přípravek obsahuje 33,80 mg sorbitolu v jedné dávce (dvě stisknutí pumpičky).

Tento léčivý přípravek obsahuje méně než 1 mmol (23 mg) sodíku v jedné dávce (dvě stisknutí pumpičky), to znamená, že je v podstatě „bez sodíku“.

4.5. Interakce s jinými léčivými přípravky a jiné formy interakce

Současné nebo následné podání jiných antiseptik se nedoporučuje vzhledem k možnosti interference (antagonismus, deaktivace).

I když je dávka lidokainu nízká, vzhledem k jeho přítomnosti v tomto léčivém přípravku je nutno zvážit tyto skutečnosti:

Léčivé přípravky způsobující blokádu beta-adrenergických receptorů snižují průtok krve játry a tudíž rychlost, s jakou se lidokain metabolizuje, což vede ke zvýšenému riziku toxicity.

Cimetidin může inhibovat metabolismus lidokainu v játrech s následkem zvýšeného rizika toxicity.

Může způsobit zkříženou citlivost vůči jiným lokálním anestetikům amidového typu.

Antiarytmika třídy III, jako jsou mexiletin a prokainamid, v důsledku potenciálních farmakokinetických nebo farmakodynamických interakcí.

Na tvorbě MEGX, farmakologicky aktivního metabolitu lidokainu, se podílejí izoenzymy CYP1A2 a CYP3A4 cytochromu P450. Jiné léky jako fluvoxamin, erytromycin a itraconazol mohou tudíž zvyšovat plazmatickou koncentraci lidokainu.

4.6. Fertilita, těhotenství a kojení

Těhotenství

Bezpečnost přípravku Aspegola během těhotenství nebyla stanovena.

Na základě údajů získaných ze středně velkého souboru těhotných žen (300–1000 těhotenství) nebyly zjištěny žádné důkazy o výskytu malformací či toxických účinků na plod nebo novorozence způsobených lidokainem, i když lidokain snadno prochází placentární bariérou.

O použití amylmetakresolu a 2,4-dichlorbenzylalkoholu jako farmakologických léčivých látek během těhotenství nejsou k dispozici žádné údaje. Vzhledem k absenci doložených zkušeností se použití přípravku Aspegola během těhotenství nedoporučuje.

Kojení

Bezpečnost přípravku Aspegola v období kojení nebyla stanovena.

Lidokain se v malém množství vylučuje do mateřského mléka. Vzhledem k nízké dávce se nepředpokládá žádný účinek lidokainu na kojené dítě. O vylučování amylmetakresolu a 2,4-dichlorbenzylalkoholu do mateřského mléka nejsou k dispozici žádné údaje.

Riziko pro kojené novorozence/děti nelze vyloučit. Tento léčivý přípravek se tudíž nemá užívat v období kojení.

Fertilita

O účinku lidokainu, amylmetakresolu a 2,4-dichlorbenzylalkoholu na fertilitu nejsou k dispozici žádné údaje.

4.7. Účinky na schopnost řídit a obsluhovat stroje

Tento přípravek nemá žádný nebo má zanedbatelný vliv na schopnost řídit a obsluhovat stroje.

4.8. Nežádoucí účinky

Během používání byly pro kombinaci léčivých látek obsažených v tomto léčivém přípravku hlášeny následující nežádoucí účinky. Nežádoucí účinky jsou popsány podle tříd orgánových systémů a jsou klasifikovány podle frekvence výskytu následujícím způsobem:

Velmi časté ($\geq 1/10$ pacientů), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$ pacientů); méně časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$ pacientů), vzácné ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$ pacientů), velmi vzácné ($< 1/10\ 000$ pacientů), není známo (frekvenci nelze z dostupných údajů určit).

Poruchy imunitního systému: Frekvence není známo:

Hypersenzitivita (může se projevit angioedémem, kopřivkou, bronchospasmem a hypotenzí se ztrátou vědomí)

Poruchy krve a lymfatického systému: Frekvence není známo:

Methemoglobinemie

Respirační, hrudní a mediastinální poruchy: Frekvence není známo:

Faryngeální edém

Gastrointestinální poruchy: Frekvence není známo:

Bolest břicha, nauzea, diskomfort v dutině ústní (může se projevovat pálením nebo štípaním v ústech nebo v hrdle), otok úst, dysgeuzie

Poruchy kůže a podkožní tkáně: Frekvence není známo:

Kožní vyrážka

Hlášení podezření na nežádoucí účinky

Hlášení podezření na nežádoucí účinky po registraci léčivého přípravku je důležité. Umožňuje to pokračovat ve sledování poměru přínosů a rizik léčivého přípravku. Žádáme zdravotnické pracovníky, aby hlásili podezření na nežádoucí účinky na adresu:

Státní ústav pro kontrolu léčiv

Šrobárova 48

100 41 Praha 10

Webové stránky: www.sukl.cz/nahlasit-nezadouci-ucinek

4.9. Předávkování

Příznaky

Vzhledem k nízké hladině léčivých látek je předávkování nepravděpodobné.

V případě abnormálního použití (mnohem vyšší dávkování, slizniční léze) může k předávkování dojít. Nejzávažnější účinky intoxikace lidokainem představují účinky na centrální nervový systém (nespavost, nervozita, agitovanost, respirační deprese a zástava dýchání, apnoe, záchvaty, kóma a smrt) a na kardiovaskulární systém (těžká hypotenze, asystolie, srdeční zástava a bradykardie); může se vyskytnout rovněž methemoglobinemie.

Léčba

Léčba je symptomatická a podpůrná; je vyžadován lékařský dohled.

Methemoglobinemii lze léčit okamžitou intravenózní injekcí methylenové modři (1–4 mg/kg).

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1. Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: Krční léčiva, antiseptika, různá jiná krční antiseptika. ATC kód: R02AA20.

Díky kombinaci léčivých látek vykazuje přípravek Aspegola lokální antiseptické, baktericidní, fungicidní a analgetické vlastnosti.

Tento léčivý přípravek obsahuje:

- 2,4-dichlorbenzylalkohol a amylmetakresol, dvě antiseptika s antibakteriálními, antivirovými a antimykotickými vlastnostmi působící proti patogenní bakteriální flóře dutiny ústní. Tyto dvě léčivé látky patří do chemické skupiny alkoholů, resp. fenolů.
- Lidokain, lokální anestetikum amidového typu, které poskytuje rychlou, intenzivní a dlouhodobou úlevu od bolesti.

Pro kombinaci všech tří léčivých látek (API) v lékové formě spreje sice neexistují žádné farmakodynamické studie, byly ovšem provedeny různé studie k vyhodnocení jejich klinické účinnosti a bezpečnosti při podání v lékové formě pastilek. Pastilky obsahující kombinaci amylmetakresolu a 2,4-dichlorbenzylalkoholu byly zkoumány v několika klinických hodnoceních u dospělých pacientů. Výsledky prokázaly významné

analgetické, funkční, smyslové a psychologické účinky nastupující již po 1–5 minutách a trvající až 2 hodiny po podání při použití ve formě pastilek. Získané důkazy lze vztáhnout i na spreje, jelikož obě léčivé formy představují topické přípravky, které působí v hrdle a v dutině ústní, kdy dochází k uvolňování API ve formě roztoku.

5.2. Farmakokinetické vlastnosti

Lidokain vykazuje poločas 1 až 2 hodiny (zhruba 100 minut), který závisí na dávce. Poločas metabolitu glyncinxylididu (GX) je delší a může tudíž docházet ke kumulaci, zejména při renálním vylučování.

O farmakokinetice 2,4-dichlorbenzylalkoholu ani amylmetakresolu nejsou k dispozici žádná relevantní data kromě studie biologické dostupnosti, která je uvedena v souhrnu údajů o přípravku pro přípravek Benagol (Benagol, 2008) a v níž bylo stanoveno rychlé uvolňování obou antiseptik do slin s dosažením maximálních hladin po 3–4 minutách cucání pastilky.

Množství 2,4-dichlorbenzylalkoholu a amylmetakresolu stanovené ze slin po 120 minutách dosahuje přibližně 50 % podaného množství.

Lidokain se snadno vstřebává sliznicemi. Plazmatický eliminační poločas je přibližně 2 hodiny. Po vstřebání nastupuje ve významné míře metabolismus při prvním průchodu játry a dochází k rychlé deethylaci na aktivní metabolit monoethylglyncinxylidid, který je následně hydrolyzován na různé metabolity včetně glyncinxylididu. Méně než 10 % je vylučováno ledvinami v nezměněné formě. Metabolity jsou rovněž vylučovány močí.

U pacientů s infarktem myokardu (se srdečním selháním nebo bez něj) je poločas lidokainu a monoethylglyncinxylididu (MEGX) prodloužený; u pacientů se srdečním selháním po infarktu myokardu může být také prodloužen poločas GX. Delší poločas lidokainu byl rovněž hlášen u pacientů s městnavým srdečním selháním nebo onemocněním jater, může být také delší po kontinuální i.v. infuzi trvající déle než 24 hodin. U pacientů s městnavým srdečním selháním může být dále snižena eliminace MEGX.

5.3. Předklinické údaje vztahující se k bezpečnosti

Z neklinických dat o 2,4-dichlorbenzylalkoholu a amylmetakresolu nevyplývá žádné zvláštní riziko pro člověka. Tato data vycházejí z konvenčních farmakologických studií bezpečnosti, studií toxicity po opakovaném podávání, genotoxicity a kancerogenního potenciálu, reprodukční a vývojové toxicity.

Účinky lidokainu byly v neklinických studiích pozorovány pouze při expozicích považovaných za dostatečně převyšující maximální expozici u člověka, což ukazuje na malou relevanci pro klinické použití.

6. FARMACEUTICKÉ ÚDAJE

6.1. Seznam pomocných látek

Ethanol 96 %

Glycerol (E 422)

Roztok hydroxidu sodného (pro úpravu pH)

Čištěná voda

Tekutý nekrytalizující sorbitol (E 420)

Sodná sůl sacharinu

Monohydrát kyseliny citronové

Erythrosin (E 127)

Levomenthol

Aroma máty peprné (menthon, isomenthon, menthyl-acetát, isopulegol, propylenglykol, neomenthol, levomenthol, pulegon, piperiton)

Anýzové aroma (propylenglykol (E 1520), ethanol, anethol a přírodní aroma)

6.2. Inkompatibility

Neuplatňuje se.

6.3. Doba použitelnosti

2 roky

Doba použitelnosti po prvním otevření: 1 měsíc

6.4. Zvláštní upozornění pro uchovávání

Uchovávejte při teplotě do 30 °C.

Lahvičku uchovávejte v krabičce, aby byl přípravek chráněn před světlem.

6.5. Druh obalu a obsah balení

Přípravek Aspegola je balen ve skleněné lahvičce (třídy III) s dávkovací pumpičkou. Pumpička se skládá z polypropylenu a polyethylenu.

Jedna lahvička obsahuje 20 ml roztoku, což představuje 153 stisknutí.

6.6. Zvláštní opatření pro likvidaci přípravku a pro zacházení s ním

Žádné zvláštní požadavky na likvidaci

Veškerý nepoužitý léčivý přípravek nebo odpad musí být zlikvidován v souladu s místními požadavky.

7. DRŽITEL ROZHODNUTÍ O REGISTRACI

BAYER s.r.o., Siemensova 2717/4, 155 00 Praha 5 - Stodůlky, Česká republika

8. REGISTRAČNÍ ČÍSLO(A)

69/031/22-C

9. DATUM PRVNÍ REGISTRACE/DATUM PRODLOUŽENÍ REGISTRACE

Datum první registrace: 14. 1. 2025

Datum posledního prodloužení registrace:

10. DATUM REVIZE TEXTU

14. 1. 2025