

VALMISTEYHTEENVETO

1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Bafucin Mint imeskelytabletit

2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Yksi imeskelytabletti sisältää:

Bentsokaiini	2 mg
Setyylipyridiniumkloridi	2 mg
2,4-diklooribentsyylialkoholi	2 mg
Gramisidiini	0,3 mg

Apuaineet, joiden vaikutus tunnetaan: sorbitoli.

Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1.

3. LÄÄKEMUOTO

Imeskelytabletti.

Lähes valkoinen, nelikulmainen, mentolin ja piparmintun makuinen tabletti, pituus ja leveys 11,5 mm, korkeus 6 mm.

4. KLIINISET TIEDOT

4.1 Käyttöaiheet

Suun ja nielun desinfiointiin.

4.2 Annostus ja antotapa

Aikuiset ja yli 5-vuotiaat lapset: Yksi imeskelytabletti joka toinen tunti. Anna tabletin liueta hitaasti suussa. Älä ota enempää kuin 12 imeskelytablettia vuorokaudessa. Ei alle 5-vuotiaille lapsille ilman lääkärin määräystä.

4.3 Vasta-aiheet

Yliherkkyys vaikuttaville aineille tai kohdassa 6.1 mainituille apuaineille.

4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Bentsokaiini voi aiheuttaa methemoglobinemiaa, joka on harvinainen mutta vakava tila, jossa hapen kuljetus veressä on vähentynyt. Methemoglobinemia vaatii välitöntä hoitoa. Potilaan on lopetettava valmisteen käyttö ja hakeuduttava välittömästi lääkäriin, jos seuraavia oireita kehittyy: ihon, huulten tai kynsimarron kalpeus, harmaus tai sinertäminen, päänsärky, heikotuksen tunne, sekavuus, hengenahdistus, uupumus ja takykardia (nopea sydämen syke). Vaikeimmissa tapauksissa methemoglobinemia voi johtaa kuolemaan.

Jos kurkkukipuun liittyy korkea kuume, päänsärkyä tai pahoinvointia tai jos kurkkukipu pahenee tai pitkittyy, potilaan on otettava yhteyttä lääkäriin, koska kyseessä voi olla streptokokkibakteerin aiheuttama angiina.

Bafucin Mint -tabletit sisältävät sorbitolia. Potilaiden, joilla on harvinainen perinnöllinen fruktoosi-intoleranssi, ei tule käyttää tätä lääkettä. Sorbitolilla on lievästi laksatiivinen vaikutus. Energiasisältö 2,6 kcal/g sorbitolia.

4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Ei tunnettuja yhteisvaikutuksia.

4.6 Hedelmällisyys, raskaus ja imetys

Käytöstä raskaana oleville naisille ei ole riittäviä ja hyvin kontrolloituja tutkimuksia. Ei tiedetä, erittyvätkö bentsokaiini, setyylipyridiniumkloridi, 2,4-diklooribentsyylialkoholi ja gramisidiini tai niiden metaboliitit rintamaitoon.

Bafucin Mint -tabletteja saa käyttää raskauden ja imetyksen aikana vain jos hoidon mahdolliset hyödyt äidille ovat suuremmat kuin sikiölle / rintaruokituille imeväiselle mahdollisesti aiheutuva vaara.

4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn

Bafucin Mint -valmisteella ei ole haitallista vaikutusta ajokykyyn ja koneiden käyttökykyyn.

4.8 Haittavaikutukset

Harvinainen ($\geq 1/10\ 000$, $< 1/1\ 000$).

Veri ja imukudos: methemoglobinemia.

Iho ja ihonalainen kudokset: nokkosihottuma, eksanteema, Quincken edeema.

Bafucin Mint -valmisteen aiheuttamat haittavaikutukset johtunevat pääasiassa bentsokaiinin aiheuttamista yliherkkyysoireista.

Suurina määrinä sorbitoli voi aiheuttaa vatsakipuja, ilmavaivoja ja osmoottista ripulointia.

Epäillyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

On tärkeää ilmoittaa myyntiluvan myöntämisen jälkeisistä lääkevalmisteen epäillyistä haittavaikutuksista. Se mahdollistaa lääkevalmisteenhyöty-haitta -tasapainon jatkuvan arvioinnin. Terveydenhuollon ammattilaisia pyydetään ilmoittamaan kaikista epäillyistä haittavaikutuksista seuraavalle taholle:

www-sivusto: www.fimea.fi

Lääkealan turvallisuus- ja kehittämiskeskus Fimea

Lääkkeiden haittavaikutusrekisteri

PL 55

00034 Fimea

4.9 Yliannostus

Kirjallisuudesta ei ole löydetty raportteja, joissa olisi kuvattu bentsokaiinin, setyylipyridiniumkloridin, 2,4-diklooribentsyylialkoholin ja gramisidiinin yhdistelmän yliannostuksia ihmisellä. Valmisteen markkinoille tulon jälkeisten turvallisuustietojen analyysissä ei ole todettu yliannostukseen liittyviä haittavaikutuksia.

Lisätietoja saa Myrkytystietokeskuksesta.

5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen ryhmä: Nielun sairauksien lääkkeet: Antibiootit, ATC-koodi R02A B30.

Valmiste sisältää kolmen antibakteerisen aineen ja yhden puuduteaineen yhdistelmää. Antibakteeristen aineiden on osoitettu tehoavan *in vitro* tiettyihin grampositiivisiin bakteereihin, kuten A-, C- ja G-ryhmien streptokokkeihin. Bentsokaiini lievittää kipua paikallisesti nopeasti

Bentsokaiini

Bentsokaiini on puuduteaine, joka kuuluu para-aminobentsoehapon estereihin, joilta puuttuu terminaalinen aminoryhmä. Bentsokaiini estää neuronin solukalvon läpäisevyyttä natriumioneille, mikä vakauttaa neuronin sähköistä potentiaalia ja aikaansaa paikallispuuduttavan vaikutuksen.

Setyylipyridiniumkloridi

Setyylipyridiniumkloridi on kvaternaarinen ammoniumyhdiste, jolla on laajakirjoinen antibakteerinen vaikutus. Positiivisen latauksen ja hydrofobisen alueen ansiosta setyylipyridiniumkloridi vaikuttaa mikrobisolun pinnalla ja yhdistyy solukalvoon. Tämän vuorovaikutuksen seurauksena solukalvon eheys rikkoutuu, mikä aiheuttaa solukomponenttien vuotamisen, solun metabolian häiriintymisen ja solujen kasvun eston, mikä voi johtaa solun kuolemaan.

2,4-diklooribentsyylialkoholi

2,4-diklooribentsyylialkoholi on paikallinen antisepti, joka estää mikrobien kasvua suuontelossa. 2,4-diklooribentsyylialkoholi kykenee estämään useiden mikro-organismien kasvua, ja sillä on osoitettu olevan tehokkain vaikutus *A. actinomycetemcomitans*- ja *P. gingivalis* -organismeja vastaan. Nämä organismit liittyvät parodontiitin juveniileihin ja tuhoaviin muotoihin. 2,4-diklooribentsyylialkoholi estää myös depolarisaation aiheuttamaa natriumin sisäänvirtausta paikallispuudutteen tavoin.

Gramisidiini

Gramisidiini on peptidiantibiootti, jota *Bacillus brevis* tuottaa. Gramisidiini estää puhdistetun RNA-polymeraasin RNA-synteesiä häiritsemällä RNA-polymeraasin sitoutumista DNA:han.

5.2 Farmakokinetiikka

Bentsokaiinin, setyylipyridiniumkloridin, 2,4-diklooribentsyylialkoholin ja gramisidiinin yhdistelmän farmakokinetiikkaa valmisteessa käytettyinä pitoisuuksina ei ole tutkittu.

Imeytyminen

Bentsokaiini imeytyy hyvin limakalvoilta, mutta ehjän ihon läpi imeytyminen on vähäistä.

Metabolia

Bentsokaiini metaboloituu maksan ja plasman koliiniesteraasien välityksellä maksassa.

Eliminaatio

Bentsokaiini ja sen päämetaboliitti para-aminobentsoehappo erittyvät pääasiassa virtsaan. Pieni osa bentsokaiinista erittyy munuaisten kautta.

5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta

Julkaistusta kirjallisuudesta ei ole löydetty vaikuttavien aineiden yhdistelmällä tehtyjä non-kliinisiä tutkimuksia. Näin ollen on tarkasteltu yksittäisten vaikuttavien aineiden non-kliinistä turvallisuutta koskevia tietoja.

Bentsokaiini

Bentsokaiinin akuutti oraallinen toksisuus on vähäistä rotilla, joilla LD₅₀-arvot ovat 3 042 mg/kg, ja hiirillä, joilla LD₅₀-arvot ovat 2 500 mg/kg, ja akuutti toksisuus hiirellä intraperitoneaalista antoreittiä käytettäessä on kohtalainen. Bentsokaiinin on ilmoitettu aiheuttaneen methemoglobinemiaa eri eläinlajeissa. Taso, jolla methemoglobinemiaa ei havaittu rotissa, oli 16 mg/kg.

Bentsokaiini ei ollut genotoksinen *in vitro*- ja *in vivo* -määrittelyissä.

Setyylipyridiniumkloridi

Setyylipyridiniumkloridin akuutti oraallinen toksisuus rotissa, hiirissä, kaneissa ja koirissa on kohtalainen. 13 viikkoa kestäneessä ruokavaliotutkimuksessa haitattomaksi annokseksi (NOAEL, No-Observed-Adverse-Effect-Level) osoitettiin rotalla 18 mg/kg.

Setyylipyridiniumkloridi ei ollut genotoksinen *in vitro*- ja *in vivo* -määrittelyissä.

Ravinnon mukana annettulla valmisteella tehdyssä 1 vuoden kestäneessä rottatutkimuksessa suurimmallakaan tutkitulla annoksella 35 mg/kg ei havaittu haittavaikutuksia. Setyylipyridiniumkloridi ei lisäksi ole genotoksinen, joten se ei oletettavasti ole myöskään karsinogeeninen.

Setyylipyridiniumkloridi ei ollut rotille eikä kaneille teratogeeninen.

Rotilla tehdyssä kahden sukupolven lisääntymistoksisuustutkimuksessa ei havaittu merkittäviä vaikutuksia hedelmällisyyteen.

2,4-diklooribentsyylialkoholi

2,4-diklooribentsyylialkoholin akuutti toksisuus on vähäistä. Rotilla tehdyssä subkroonista toistuvan annoksen toksisuutta selvittävässä tutkimuksessa ei havaittu hoitoon liittyviä vaikutuksia annostasolla 100 mg/kg (NOAEL).

2,4-diklooribentsyylialkoholi ei ole mutageeninen.

2,4-diklooribentsyylialkoholi ei ollut teratogeeninen kaneilla, jotka saivat suun kautta 20 mg/kg.

Gramisidiini

Gramisidiinin akuutti oraallinen toksisuus jyrksijöillä on vähäistä. Akuutti parenteraalinen toksisuus on kuitenkin suuri. Koirilla tehdyssä toistuvan annoksen toksisuutta selvittävässä tutkimuksessa gramisidiinin anto laskimoon annoksella 2 mg/kg aiheutti kuoleman 2–8 vuorokauden kuluessa.

6. FARMASEUTTISET TIEDOT

6.1 Apuaineet

Sorbitoli (E 420) 500 mg

Sakkariinatrium

Levomentoli

Makrogoli 6000

Etyyliselluloosa

Piparminttuöljy
Dimetikoni.

6.2 Yhteensopimattomuudet

Ei oleellinen.

6.3 Kesto aika

2 vuotta.

6.4 Säilytys

Säilytä huoneenlämmössä (+15–+25 °C). Herkkä kosteudelle.

6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot

25 tai 50 imeskelytablettia polypropeenistä valmistetussa tablettipurkissa.
Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle ja muut käsittelyohjeet

Ei erityisvaatimuksia.

7. MYYNTILUVAN HALTIJA

McNeil, a division of Janssen-Cilag Oy
Vaisalan tie 2
02130 Espoo

8. MYYNTILUVAN NUMERO

11357

9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

17.1.1994 / 9.4.2010

10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ

7.12.2016