

Кратка характеристика на продукта

1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Mastu S
Масту S

2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ**Активни вещества:**

1 g ректална маз съдържа: 50 mg буфексамак, 50 mg бисмутов субгалат, 50 mg титанов диоксид, 5 mg лидокаинов хидрохлорид.

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ректална маз

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ**4.1 Терапевтични показания**

- Хемороидална болест първа и втора степен.
- Болестно променени външни хемороиди
- Остри анални фисури.
- Остра и хронична анална екзема.
- Възпалителни процеси в или около ануса и ректума (проктит).

4.2 Дозировка и начин на приложение

Препоръчителна дозировка:

Нанася се върху засегнатите места около ануса и/или ректума два пъти дневно.

Начин на приложение:

а) За външна употреба: Ректалната маз се нанася върху засегнатите участъци на ануса и леко се втрива. Преди нанасянето на мазта, аналната област се почиства с топла вода и кърпа (без сапун).

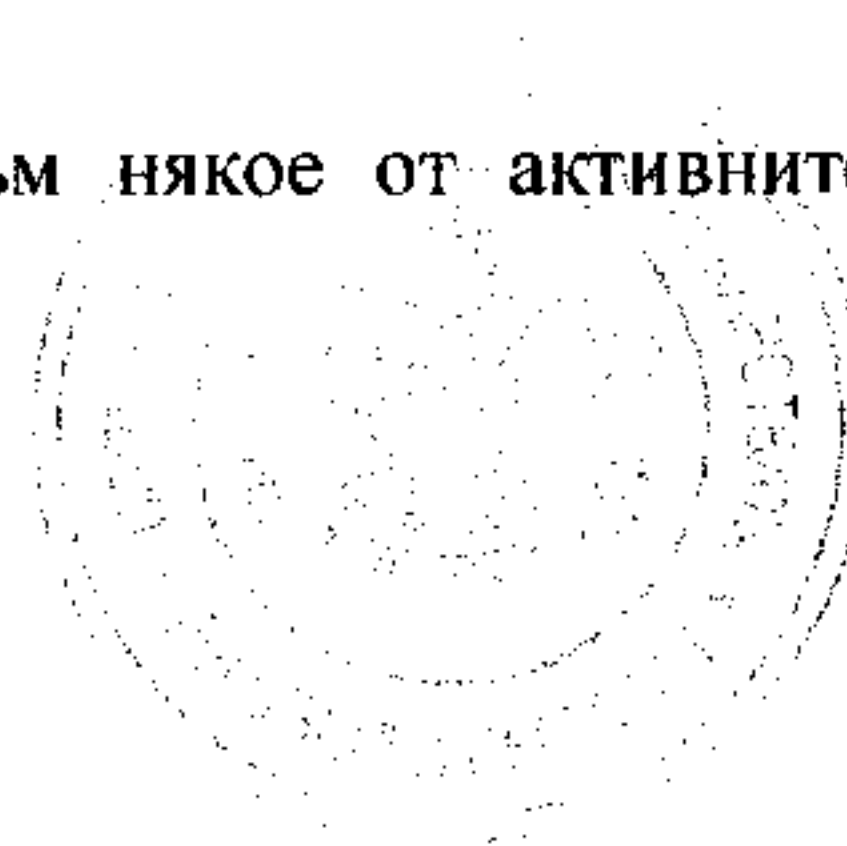
б) За локална употреба (в ануса и/или ректума): Да се нанася мазта в ректума два пъти дневно, по възможност след изхождане по голяма нужда. Да се използва апликатора поставен в опаковката, за да се въведе мазта в ректума.

Масту S трябва да се прилага докато премине острото дразнене и възпаление. Препоръчва се лечението да продължи още 8-10 дни за поддържане на комфорта.

Ако е необходимо по продължително лечение, трябва да се използва продукт, който не съдържа локален анестетик.

4.3 Противопоказания

Доказана свръхчувствителност към някое от активните или помощните вещества на това лекарство.



Тъй като при пациенти с история на контактни алергии и атопичен дерматит съществува по-голям риск от алергични реакции, те трябва да използват Масту S само след консултация с лекар. Масту S не трябва да се прилага при пациенти със специфични кожни заболявания на мястото на приложение (сифилис, туберкулоза).

4.4 Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

Ланолинът може да предизвика локални кожни реакции (напр. контактен дерматит).

При едновременна употреба на Масту S с презерватив е възможно намаляване на устойчивостта на презерватива към скъсване и неговата надеждност.

4.5 Взаимодействия с други лекарствени продукти или други форми на взаимодействие

До момента не са известни взаимодействия с други лекарства.

4.6 Бременност и кърмене

Няма данни от клинични изпитвания за приложението на Масту S при бременни и кърмачки. Поради това, трябва да се прецени много внимателно очакваната полза спрямо потенциалните рискове.

4.7 Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Няма налични доказателства за потенциалното действие на продукта върху способността за шофиране или работа с машини.

4.8 Нежелани лекарствени реакции

Свръхчувствителност към някоя от съставките на лекарствения продукт. Такива реакции обикновено се проявяват под формата на локално дразнене (еритема, парене, сърбеж) и могат, в редки случаи, да се разпространят и върху нетретирани кожни участъци, предизвиквайки оток на кожата с последваща мокреща везикулария, която се излющва и образува ръбчета. Тези прояви в редки случаи могат да бъдат тежки и да обхващат обширни кожни участъци.

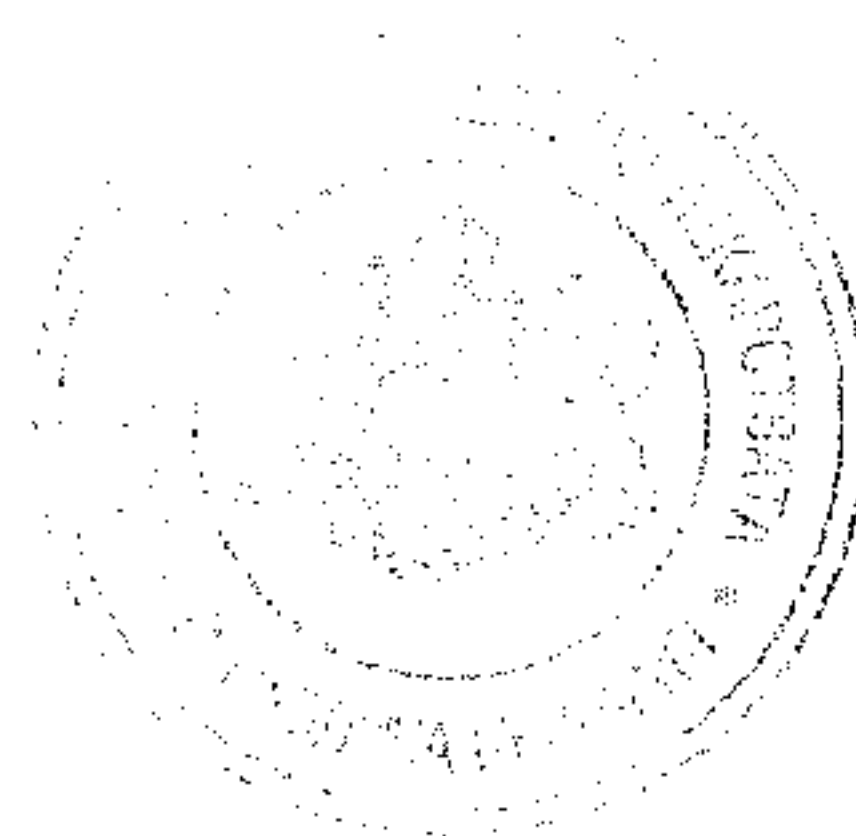
Пациенти, получили реакции на свръхчувствителност или внезапно влошаване на налично кожно заболяване, трябва да спрат употребата на това лекарство.

4.9 Предозиране

Досега не са известни случаи на токсичност и е малко вероятно да се появят, когато Масту S се прилага както е указано, т. е. локално, върху ограничена повърхност.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамични свойства



Фармакотерапевтична група: Вещества за лечение на хемороиди и анални фисури за локално приложение. Локални анестетици. Лидокаин.

АТС код: C05AD01

Буфексамак

Буфексамакът е производно на арилоцетната киселина и когато се прилага локално при специфични условия (носител, концентрация $\leq 10\%$), проявява противовъзпалителна активност при някои фармакологични модели с животни (UV еритема, карагенанов оток).

Лидокаинов хидрохлорид

Лидокаиновият хидрохлорид е локален анестетик от амиден тип и притежава голям афинитет на свързване с отворените инактивирани натриеви канали от вътрешната страна на клетъчните мембрани на възбудимите структури. Афинитетът му към затворените натриеви канали е слаб. Лидокаиновото свързване увеличава времето за възстановяване на канала (т.е. времето, необходимо на канала да премине от неактивиран в затворен) 10 до 1000 пъти, като увеличава рефракторния период и намалява броя на импулсите провеждани през канала. Затова нервните клетки, стимулирани от високочестотни импулси с увеличен потенциал на действие (напр. в сензорните нервни влакна) са по-чувствителни спрямо действието на лидокаин. Освен това, колкото по-малък е диаметърът на нервното влакно, толкова по-малко е разстоянието, което трябва да се преодолее за пасивно провеждане на импулсите. Следователно, тъй като лидокаинът блокира първоначално само сегментите на малките нервни влакна, влакната с малък диаметър (В, С и А) – които отговарят напр. за провеждане на ноцицептивен импулс – ще бъдат първите, които ще бъдат блокирани, затова локалните анестетици са в състояние избирателно и обратимо да потискат чувството за болка в определени части на тялото.

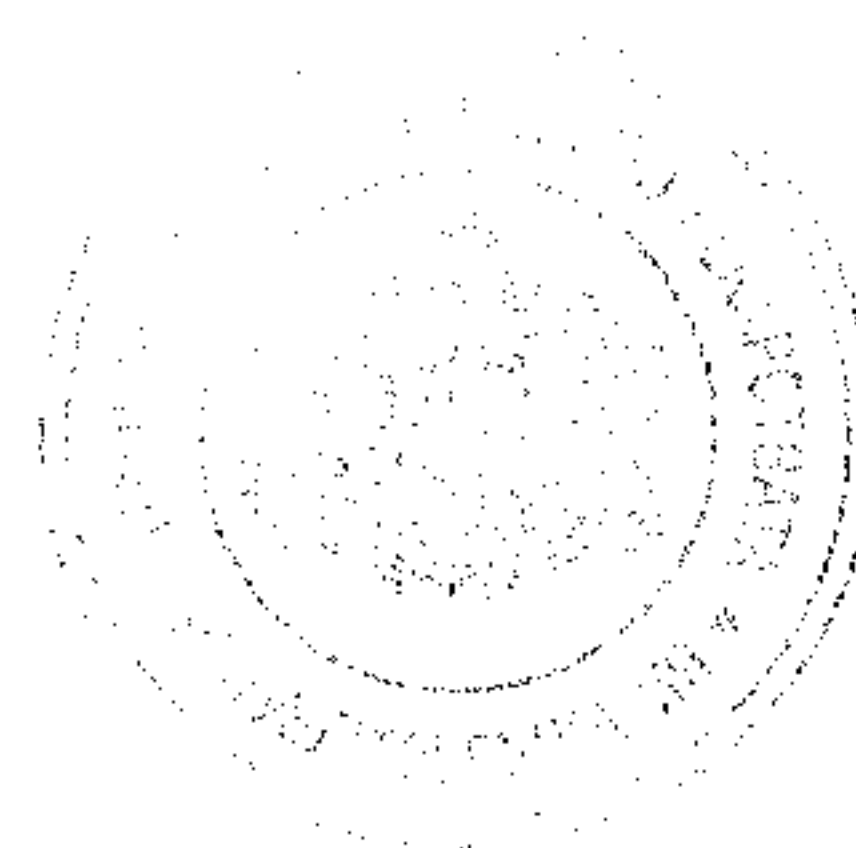
За осъществяване на дифузията през клетъчните мембрани е необходима непротонираната форма на едно лекарство и поради това рК стойността на локалния анестетик и рН на средата са най-важните условия той да достигне своето място на действие в клетката. Предполага се, че действието върху йонния канал се дължи на протонираната форма молекулата. Сравнен с други локални анестетици, лидокаинът притежава средна сила, средна продължителност на действие и бързо настъпващ ефект.

5.2. Фармакокинетични свойства

Буфексамак

След перорален прием буфексамакът се резорбира бързо в стомашно-чревния тракт. Около 78% от количеството при хора се елиминира чрез бъбреците и около 6,5% посредством фекалиите в рамките на 24 часа. Най-важният метаболит при хора и маймуни е р-бутоксифенилоцетната киселина (ВРА), която е била открита също в урината на кучета, макар и в по-малки количества.

Кинетика след кожно и ректално приложение



Пенетрацията на буфексамака зависи от съответния носител (вехикулум). Той преминава през *stratum corneum*. Когато са били прилагани външно при хора под формата на крем 5 g от 5% буфексамак, метаболитната концентрация е била в по-ниски граници от определените при газова хроматография. След приложение на супозитории съдържащи буфексамак, в серума са били открити $< 0.2 \mu\text{g/ml}$ от него и $< 0.5 \mu\text{g/ml}$ ВРА.

Лидокаинов хидрохлорид

Той се абсорбира бързо от стомашно-чревния тракт и през мукозните мембрани или увредената кожа.

5.3.Предклинични данни за безопасност

Буфексамак

а) Остра токсичност

Пероралната LD_{50} при изследванията за остра токсичност върху мишки и плъхове е била 4 g/kg телесно тегло.

б) Хронична токсичност

Плъхове, третирани перорално с максимум 400 mg/kg буфексамак в продължение на 3-9 месеца, показват следните признаци на токсичност: намалено телесно тегло, забавен растеж, лека анемия, повишаване на алкалната фосфатаза и азота в кръвната урея, увеличаване на относителното тегло на черния дроб, бъбреците и надбъбречната жлеза, атрофия на тимуса и мастна дегенерация на черния дроб.

12-месечно изследване върху резус-маймуни, тествани с 200 mg/kg телесно тегло перорално приет буфексамак показва следните отклонения: увеличена смъртност, дължаща се на бъбречна токсичност, слабо увеличение на телесното тегло, депресия, анорексия, анемия, увеличение на азота в кръвната урея и серумния креатинин, повишаване на артериалното налягане, хистологично-забележимо фокално възпаление на бъбреците, фиброза, левкоцитна инфилтрация и гломерулосклероза. 100 mg/kg перорално приет буфексамак се понася от резус-маймуни без прояви на токсичност. Изследвания върху кучета показват, че се появяват признаци на токсичност при по-високи дози (300mg/kg).

в) Туморогенен потенциал

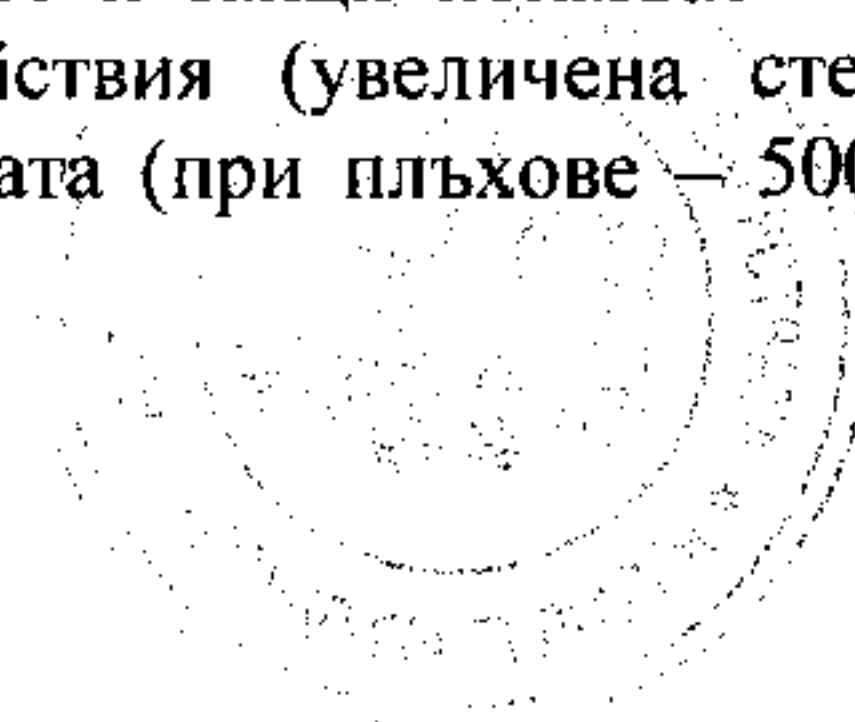
24-месечно проучване на плъхове, тествани с перорални дневни дози буфексамак от над 500 mg/kg показва, че няма разлика в честотата на възникване на тумори между третираните животни и контролните, нетретирани такива.

г) Мутагенен потенциал

Предварителните резултати от тестване за мутагенност върху бактерии и клетки от бозайници са били отрицателни, но не са достатъчни за окончателна оценка.

д) Репродуктивна токсичност

Ембриотоксичните проучвания върху плъхове и зайци показват намалено тегло на плода и ембриотоксични въздействия (увеличена степен на резорбция) само при дози токсични за майката (при плъхове – 500 mg/kg



телесно тегло; при зайци – 150 mg/kg телесно тегло). Тератогенни ефекти не са наблюдавани.

Бисмутов субгалат

Бисмутовият субгалат е неразтворим във вода, разредени киселини и основи. Има адстрингентни свойства и подпомага заздравяването на рани. Тъй като е неразтворим при физиологични условия, бисмутовият субгалат не се абсорбира при локално приложение. Трябва да се има предвид, че бисмут съдържащите съединения могат да предизвикат прояви на токсичност, когато се използват върху големи раневи повърхности.

Титанов диоксид

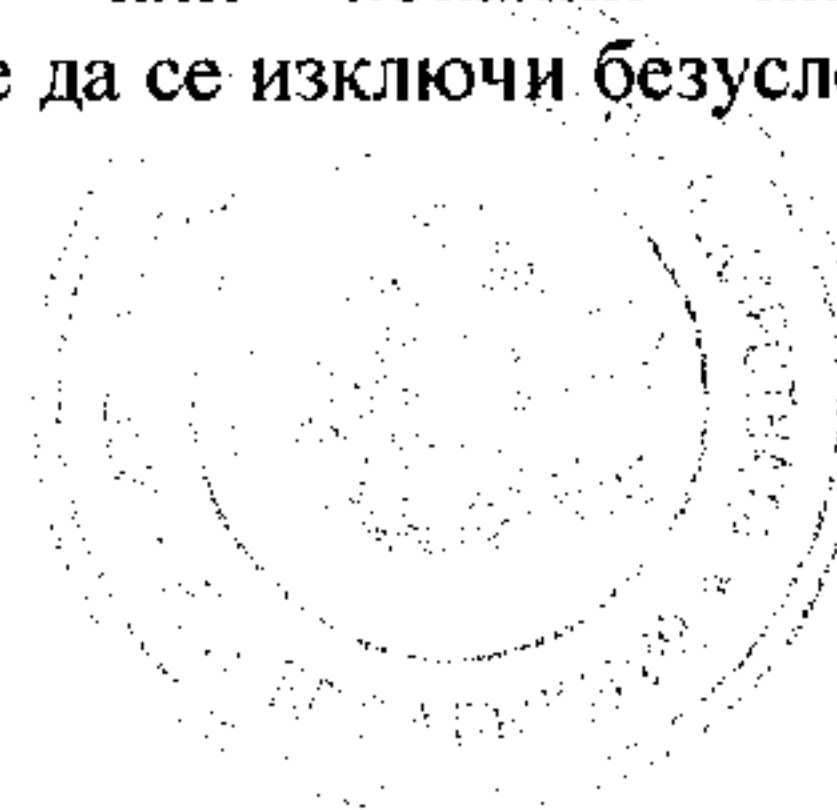
Титановият диоксид е също неразтворим във вода, разредени киселини и основи. Има адстрингентно и подсушаващо действие и подпомага зарастването на раните. Тъй като е неразтворим при физиологични условия, титановият диоксид не се абсорбира при външно приложение.

Лидокаинов хидрохлорид

Едноседмично изследване за безопасност на антихемороидална форма на лидокаин с или без добавен буфексамак, приложена във влагалището на заек, не показва отклонения на мястото на приложение и няма клинични данни за системна токсичност. Лекарствената форма- ректална маз се понася много добре при кумулативни дози, значително надвишаващи тези, които се препоръчват за клинична употреба.

Проведено е изследване за остра токсичност при перорално приложение при плъхове, за да се преценят последствията при поглъщане по невнимание на дозите, съдържащи се в търговската опаковка на антихемороидалният продукт. Не са установени признаци на остра токсичност, нито смърт, дължащи се на изследвания продукт. Липсата на признаци на остро отравяне при еднократни дози по-високи от 20 g/kg показва, че неволното поглъщане на съдържанието на търговската опаковка (една туба ректална маз), еквивалент на 1-1.5 g/kg лидокаин, няма да предизвика никакви увреждания при 20-килограмово дете. Затова лекарствената форма се счита за безопасна. Има данни, които сочат, че 2,6-ксилидинът, метаболит на лидокаина може да има мутагенно действие, при плъхове, а може би и при хора. Тези данни са били получени при опити *in vitro*, при които този метаболит е бил използван в много високи, субтоксични концентрации. Засега няма налични данни, които да сочат, че самият лидокаин е мутагенен.

В изследванията за канцерогенност на 2,6-ксилидин при плъхове в продължение на две години, включващи трансплацентарно въздействие и следродово третиране с много високи дози (високочувствителна тестова система), е открита връзката му с развитието на злокачествени и доброкачествени (главно) аденопаиломи или локални инвазивни аденокарциноми на назалния епител. Не може да се изключи безусловно, че



тези находки не могат да се проявят при хората. Затова Масту S не трябва да се използва във високи дози за продължителен период от време.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Изопропил палмитат, течен парафин, полиетилен, сорбитан сесквиолеат, сорбитол, пречистена вода, ланолин

6.2 Несъвместимости

Не са известни.

6.3 Срок на годност

3 години.

6.4 Специални условия на съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.5 Данни за опаковката

Оригинална опаковка с апликатор, съдържаща 20 g ректална маз.

6.6 Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

Няма специални изисквания.

7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

STADA Arzneimittel AG
Stadastrasse 2 – 18
61118 Bad Vilbel, Германия
Phone: +49 6101 603-0
Fax: +49 6101 603-259

8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

9600218

9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ/ПОДНОВЯВАНЕ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

26.08.1996

ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Ноември 2006

