

## 1. BEZEICHNUNG DER ARZNEIMITTEL

**Posterisan® akut 50 mg/g Rektalsalbe**  
**Posterisan® akut 50 mg/g Rektalsalbe**  
 mit Analdehner

## 2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

1 g Rektalsalbe enthält 50 mg Lidocain.  
 Sonstiger Bestandteil mit bekannter Wirkung: Cetylalkohol (siehe Abschnitt 4.4).  
 Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile siehe Abschnitt 6.1.

## 3. DARREICHUNGSFORM

Rektalsalbe

## 4. KLINISCHE ANGABEN

### 4.1 Anwendungsgebiete

- Linderung von Schmerzen im Analbereich vor proktologischer Untersuchung
- Linderung von anorektalem Juckreiz

### 4.2 Dosierung und Art der Anwendung

#### Dosierung

Die Salbe wird 2- bis 3-mal täglich angewendet. Die Menge richtet sich nach der Größe der zu behandelnden Haut- und Schleimhautpartien. Die Maximaldosis von 2,5 g Salbe (125 mg Lidocain) pro Einzelanwendung sollte nicht überschritten werden.

#### Art der Anwendung

Die Salbe wird morgens und abends sowie möglichst vor (ca. 30 min.) und nach der Stuhlentleerung auf die zu behandelnden Haut- und Schleimhautpartien dünn aufgetragen und mit dem Finger vorsichtig eingegeben.

Für den Gebrauch der Salbe im Analkanal und angrenzenden Enddarm kann der in den Salbenpackungen enthaltene Applikator mit seitlichen Austrittsöffnungen benutzt werden. Mit deren Hilfe kann die Salbe gezielt dort abgegeben werden, wo die Erkrankung hauptsächlich lokalisiert ist und die Schmerzen entstehen.

Wird die Salbe über längere Zeit nicht benutzt, sollte der Applikator abgeschraubt und mit warmem Wasser gereinigt werden.

Zur schrittweisen Dehnung des verkrampften Schließmuskels bzw. um Schließmuskelkrämpfen vorzubeugen, kann zusätzlich zur Salbenbehandlung ein Analdehner angewendet werden (Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe mit Analdehner).

Die Salbe darf maximal für 3 Tage bis zum Arztbesuch angewendet werden.

### 4.3 Gegenanzeigen

Überempfindlichkeit gegen den Wirkstoff oder einen der in Abschnitt 6.1 genannten sonstigen Bestandteile.

### 4.4 Besondere Warnhinweise und Vorichtsmaßnahmen für die Anwendung

Wirksamkeit und Unbedenklichkeit von Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe zur längerfristigen Behandlung von Schmerzen im Rahmen des anorektalen Symptomkomplexes sind bisher nicht ausreichend belegt.

Bei Pilzbefall ist die zusätzliche Anwendung eines lokal wirksamen Antimykotikums erforderlich.

Cetylalkohol kann örtlich begrenzt Hautreizungen (z. B. Kontaktdermatitis) hervorrufen.

### 4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Bisher nicht bekannt.

### 4.6 Fertilität, Schwangerschaft und Stillzeit

Lidocain, der Wirkstoff dieses Arzneimittels, sollte in der Schwangerschaft nur angewendet werden, wenn es unbedingt erforderlich ist.

Kontrollierte Studien an Schwangeren liegen nicht vor. Bisher gab es keine Hinweise auf kongenitale Anomalien nach Lidocain-Exposition in der Schwangerschaft. Tierexperimentelle Studien ergaben Hinweise auf Verhaltensänderungen nach pränataler Exposition, aber nicht auf teratogene Effekte. Daten zum Übertritt von Lidocain nach topischer Anwendung in die Plazenta oder Muttermilch liegen nicht vor.

Nach parenteraler Anwendung geht Lidocain in geringen Mengen in die Muttermilch über. Eine Gefährdung des Säuglings bei topischer Anwendung von Lidocain in der Stillzeit erscheint unwahrscheinlich.

### 4.7 Auswirkungen auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen

Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe hat keinen oder einen zu vernachlässigenden Einfluss auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen.

### 4.8 Nebenwirkungen

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Häufigkeiten zugrunde gelegt:

<b>Sehr häufig</b>	(≥ 1/10)
<b>Häufig</b>	(≥ 1/100, < 1/10)
<b>Gelegentlich</b>	(≥ 1/1000, < 1/100)
<b>Selten</b>	(≥ 1/10 000, < 1/1000)
<b>Sehr selten</b>	(< 1/10 000)
<b>Nicht bekannt</b>	(Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar)

#### Allgemeine Erkrankungen und Beschwerden am Verabreichungsort

**Sehr häufig:** Jucken und Brennen. Es kann sich dabei um eine Überempfindlichkeitsreaktion (z. B. Kontaktallergie) handeln.

**Gelegentlich:** leichte Schmerzen, Rötung

#### Erkrankungen des Gastrointestinaltraktes

**Häufig:** Durchfall

#### Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen

Die Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen nach der Zulassung ist von großer Wichtigkeit. Sie ermöglicht eine kontinuierliche Überwachung des Nutzen-Risiko-Verhältnisses des Arzneimittels. Angehörige von Gesundheitsberufen sind aufgefordert, jeden Verdachtsfall einer Nebenwirkung

dem Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte, Abt. Pharmakovigilanz, Kurt-Georg-Kiesinger-Allee 3, D-53175 Bonn, Website: [www.bfarm.de](http://www.bfarm.de), anzuzeigen.

### 4.9 Überdosierung

Fälle von Überdosierungen oder Intoxikationen sind für Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe bisher nicht bekannt. Da die Dosierung des Wirkstoffes auf eine lokale Wirkung auf der Haut bzw. Schleimhaut im Analbereich angelegt ist, sind Überdosierungen bei therapiegemäßer Anwendung nicht zu befürchten.

Bei versehentlicher peroraler Einnahme der Salbe (Kinder) kann es zu gastrointestinalen Beschwerden (Bauchschmerzen, Übelkeit) kommen. Erst nach sehr hohen peroralen Dosen von Lidocain wurde darüber hinaus über Bewusstseinsstrübung, kardiogenen Schock, Krämpfe und Atemdepression berichtet.

Ein spezifisches Antidot existiert für Lidocain nicht.

## 5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

### 5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe: Lokalanästhetikum-haltiges Hämorrhoidenmittel zur lokalen Anwendung

ATC-Code: C05AD01

Lidocain ist ein Lokalanästhetikum vom Säureamid-Typ. Es blockiert die Bildung und Weiterleitung von Nervenimpulsen durch reversible Reduktion der bei der Reizübertragung erhöhten Membranpermeabilität peripherer Nervenzellen für Natriumionen.

Diese Wirkung wird durch Bindung und Anlagerung des Lokalanästhetikums an die Phospholipid-Strukturen der Membranen der Natriumionenkanäle und der dadurch bewirkten Membranstabilisierung im intakten Zustand hervorgerufen. Es kommt zur Blockierung des Ionenaustauschsystems, zur Hemmung des Natriumioneneinstroms und zu einer Verdrängung von Kalziumionen. Die Dauer des Kontakts bestimmt die Wirkdauer des Medikaments.

Durch diese Hemmung der Erregbarkeit der schmerzvermittelnden sensiblen Endorgane begrenzt Lidocain das Schmerzempfinden lokal und setzt es reversibel herab. Individuell in sehr unterschiedlichem Ausmaß gilt dies in weiterer Reihenfolge auch für das Kälte-, Wärme-, Berührung- und Druckempfinden. Daraus ergibt sich die topische Anwendung bei Wundschmerz.

### 5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Lidocain zählt zu den mittelstark wirksamen Lokalanästhetika und wird topisch im Dosisbereich 1–5 % angewendet. Nach Auftragung auf Haut oder Schleimhaut wird Lidocain rasch aufgenommen und an den Nervenendigungen aufgrund seiner hohen Lipidlöslichkeit mit vergleichsweise hoher Affinität an die Phospholipidstrukturen der Membranen gebunden. Daraus ergibt sich



der rasche Wirkungseintritt innerhalb weniger Minuten und die verhältnismäßig lange Wirkdauer von Lidocain.

Untersuchungen mit anderen Zubereitungen gehen von einer Resorptionsquote aus dem Anal- bzw. Rektumbereich von ca. 30–60 % aus, da Schleimhaut und geschädigte Haut wesentlich höhere Penetrationsraten als normale Haut aufweisen. Systemisch wirksame Blutspiegel bewegen sich um 1–10 µg/ml. Diese werden bei topischer Anwendung auf begrenzten Flächen nur selten erreicht, sie liegen in der Regel unter 1 µg/ml. Allerdings wurden nach Anwendung größerer Mengen Lidocain-Gel im Mund- und Rachenbereich auch Blutspiegel um 2 µg/ml gemessen. In einer eigenen Untersuchung wurden nach einfacher bzw. mehrfacher Auftragung (3-mal täglich) von Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe zur Behandlung von Schmerzen im Anorektalbereich maximale Serumkonzentrationen von im Mittel 0,132–0,146 µg/ml erreicht. Eine klinisch relevante systemische Anreicherung von Lidocain fand bei Mehrfachanwendung nicht statt. Systemische Wirkungen von Lidocain wurden nicht beobachtet.

### 5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Systematische Untersuchungen zur Toxikologie mit Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe liegen nicht vor.

Die Prüfung der lokalen Toxizität von Lidocain an verschiedenen Tierspezies hat keine Hinweise auf irreversible Gewebeschäden ergeben.

Es liegen zahlreiche Untersuchungen an unterschiedlichen Tierarten zur akuten Toxizität von Lidocain vor. Ausgeprägte Effekte auf das ZNS wurden im Dosisbereich um 5 mg/kg nach intravenöser und 30–50 mg/kg nach subkutaner Applikation beobachtet. In höheren Dosen traten dann Todesfälle vor allem durch Konvulsionen auf.

Die beim Menschen ermittelte toxische (kardiovaskuläre oder zentralnervöse Symptome) Plasmakonzentration resp. Krampfschwellendosis von Lidocain wird mit 5 µg/ml bis > 10 µg/ml Blutplasma angegeben.

Es gibt Hinweise, dass ein bei der Ratte, möglicherweise auch beim Menschen, aus Lidocain entstehendes Stoffwechselprodukt, 2,6-Xylidin, mutagene Wirkungen haben könnte. Diese Hinweise ergeben sich aus In-vitro-Tests, in denen dieser Metabolit in sehr hohen, nahezu toxischen Konzentrationen eingesetzt wurde. Dafür, dass auch die Muttersubstanz Lidocain selbst mutagen ist, gibt es derzeit keinen Anhalt.

In einer Kanzerogenitätsstudie mit transplazentärer Exposition und nachgeburtlicher Behandlung der Tiere über 2 Jahre mit sehr hohen Dosen 2,6-Xylidin an Ratten, wurden in diesem hochempfindlichen Testsystem bösartige und gutartige Tumoren vor allem in der Nasenhöhle (Ethmoturbinalia) beobachtet. Eine Relevanz dieser Befunde für den Menschen erscheint nicht völlig unwahrscheinlich. Daher sollte Lidocain nicht über längere Zeit in hohen Dosen verabreicht werden.

Studien zur Reproduktionstoxizität gaben keine Hinweise auf teratogene Wirkungen der Substanz. Bei der Ratte wurden nach pränataler Lidocain-Exposition Verhaltensänderungen beschrieben.

## 6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

### 6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Cetylalkohol, Macrogole, gereinigtes Wasser.

### 6.2 Inkompatibilitäten

Nicht zutreffend.

### 6.3 Dauer der Haltbarkeit

3 Jahre

Nach Anbruch darf Posterisan akut 50 mg/g Rektalsalbe höchstens 6 Monate verwendet werden.

### 6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Nicht über 30 °C lagern.

### 6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

Aluminiumtuben  
OP mit 25 g Rektalsalbe  
OP mit 25 g Rektalsalbe mit Analdehner

### 6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Keine besonderen Anforderungen.

## 7. INHABER DER ZULASSUNG

DR. KADE  
Pharmazeutische Fabrik GmbH  
Rigistraße 2  
12277 Berlin  
Telefon: (030) 720 82-0  
Telefax: (030) 720 82-200  
E-Mail: info@kade.de  
www.kade.de

## 8. ZULASSUNGSNUMMER

6077267.00.00

## 9. DATUM DER ERTEILUNG DER ZULASSUNG/VERLÄNGERUNG DER ZULASSUNG

03.06.2005

## 10. STAND DER INFORMATION

August 2014

## 11. VERKAUFSABGRENZUNG

Apothekenpflichtig

Zentrale Anforderung an:

Rote Liste Service GmbH

Fachinfo-Service

Mainzer Landstraße 55  
60329 Frankfurt