

ULTRACORTENOL® GEL , Eye gel
УЛТРАКОРТЕНОЛ ГЕЛ, Очен гел
КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ НА ПРОДУКТА

Ultracortenol® Gel 0.5 % Очен гел

2. КОЛИЧЕСТВЕН И КАЧЕСТВЕН СЪСТАВ

Prednisolone acetate 5 mg/ g

3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Ultracortenol® Gel 0.5 % е стерилен очен гел, суспензия

4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

4.1. Показания

Ultracortenol® Gel 0.5 % се предписва при лечение на неинфекциозни възпаления на предния очен сегмент, с възможност за приложение при постоперативни възпаления.

4.2. Дозировка и начин на употреба

Препоръчителната доза е 1 капка Ultracortenol® Gel 0.5 % в засегнатото око/очи 3 до 4 пъти дневно в продължение на 1 – 2 седмици.

За да се избегне отмиването на активната субстанция, когато е назначено съпътстващо лечение с друг медикамент, се препоръчва да се спази поне 5 минутен интервал между двете приложения. Препоръчително е първо да се поставят очните капки, а след това Ultracortenol® Gel 0.5 % .

4.3. Противопоказания

Ultracortenol® Gel 0.5 % е противопоказан при пациенти със:

- свръхчувствителност към активната или някоя от помощните съставки
- бактериални, вирусни или гъбичкови инфекции на окото (напр. заболявания на роговицата вследствие на инфекция с Herpes simplex, очна туберкулоза)
- наранявания и язвени лезии на роговицата
- закритоъгълна и откритоъгълна глаукома

Тъй като Ultracortenol® Gel 0.5 % съдържа бензалкониев хлорид, не трябва да се прилага при пациенти със свръхчувствителност към него.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки за употреба.

Ultracortenol® Gel 0.5 % не трябва да се ползва, докато се носят контактни лещи. В случай, че носенето на контактни лещи е неизбежно, те трябва да бъдат сваляни преди

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО	
Приложение към разрешение за употреба № 11-5492/18.06.02	
621/28.05.02	<i>Марица</i>



приложение и да се поставят отново не по-рано от 30 минути след употребата на Ultracortenol® Gel 0.5 % .

Бензалкониевият хлорид може да промени прозрачността на меките контактни лещи.

Тъй като съдържа консервант /бензалкониев хлорид/, Ultracortenol® Gel 0.5 % не трябва да се прилага при хирургична очна намеса.

За да се избегне замърсяване, не позволявайте върхът на флакона да се докосва до каквато й да е повърхност.

4.5. Взаимодействие с други лекарства и други форми на взаимодействие

Ефектът на Ultracortenol® Gel 0.5 % върху ВОН може да се увеличи, когато медикаментът е предписан на пациенти, които вече получават лекарства, повишаващи ВОН. Отговорът на тези пациенти трябва стриктно да се следи.

Комбинация на локален нестероиден противовъзпалителен агент (инхибитор на циклооксигеназата) и лечение с Ultracortenol® Gel 0.5 % може да подобри противовъзпалителния ефект в сравнение с приложение на Ultracortenol® Gel 0.5 % самостоятелно.

4.6. Бременност и лактация

БРЕМЕННОСТ:

Ultracortenol® Gel 0.5 % не е изследван по време на бременност. Има данни, че във високи концентрации кортикостероидите могат да имат вредно действие върху фетуса. Малко вероятно е да се достигнат системни концентрации, които да са фармакологично активни със съответната употреба на Ultracortenol® Gel 0.5 %. Въпреки това, Ultracortenol® Gel 0.5 % не трябва да се ползва по време на бременност, освен ако ползата надвишава риска.

Активното вещество на Ultracortenol® Gel 0.5 % , преднизолон, може да бъде абсорбирано системно. Тъй като се екскретира с кърмата след високи системни дози, кърменето има потенциал да предизвика нежелани ефекти у новороденото. Въпреки че е необичайно да бъдат достигнати такива дози при употреба на Ultracortenol® Gel 0.5 % , неговото приложение при кърмене трябва да се ограничава само до случаи с ясна полза.

4.7. Ефекти върху вниманието по време на шофиране и работа с машини

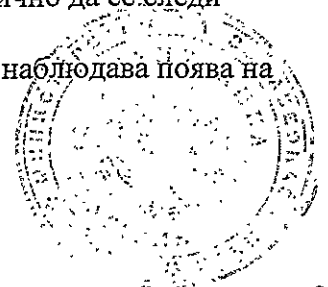
Не са провеждани изследвания върху способността за шофиране и работа с машини.

При шофиране и работа с машини трябва да се вземе предвид, че непосредствено след прилагане на Ultracortenol® Gel 0.5 % е възможно преходно замъгляване на зрението /за няколко минути/. Обикновено това отзвучава след равномерното разнасяне на гела по очната повърхност.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Ultracortenol® Gel 0.5 % съдържа преднизолон ацетат, който може да доведе до повишаване на вътреочното налягане. Тази реакция се наблюдава при всички кортикостероиди за очна употреба и обикновено се повишава от по-високи дози и продължителна употреба. Ultracortenol® Gel 0.5 % трябва да се ползва под лекарско - наблюдение и за определен период от време. Препоръчва се периодично да се следи вътреочното налягане.

След продължително лечение с локален кортикостероид може да се наблюдава поява на катаракта.



Приложението на кортикостероиди може потенциално да маскира симптомите на очна инфекция. Вторична инфекция трябва да се има предвид, ако симптомите на възпаление персistirат независимо от лечението с Ultracortenol® Gel 0.5% .

Продължителното лечение с локален кортикостероид може да доведе до перфорация на роговицата, особено в случаите със съществуващо специфично предразположение, напр. пациенти с дистрофия на роговицата.

4.9. Предозиране

Не са докладвани случаи на предозиране. В случай на предозиране в окото, изплакнете внимателно с вода.

5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ ДАННИ

5.1. Фармакодинамика

Фармакотерапевтична група: очен противовъзпалителен агент, АТС код : S 01 BA 04

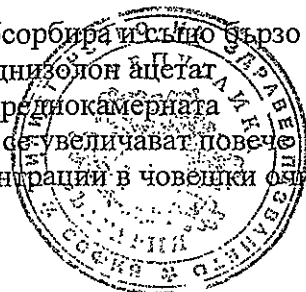
Преднизолон ацетат е естер на преднизолон и има същите свойства. Той намалява клетъчната и фибриозна екскудация и възстановява ексцесивната пропускливост на възпалените капиляри до нормална. Въздейства на кинетиката и функцията на левкоцитите; напр. понижава възможността на някои левкоцитни популации да кумулират на мястото на възпалението и влияе на специализираните функционални свойства на клетките, включени в ефекторния имунен отговор. Особено въздействието върху макрофагите може да бъде относително продължително в сравнение с въздействието върху другите левкоцити. Противовъзпалителното действие също е опосредствано от съдови ефекти и/или от регулация на възпалителните медиатори на мястото на увреждането.

Ефектите на преднизолон се опосредстват от клетъчната регулация на протеиновата синтеза, след като преднизолонът се е свързал с рецепторите, т.е. има индиректен механизъм на действие. Те са неспецифични и се проявяват независимо от това дали третираното увреждане е алергично, травматично или инфекциозно. Сред наличните кортикостероиди преднизолонът е между предпочитаните и най-често употребяваните за очно приложение. Това се дължи на благоприятния баланс на неговото желано кортикоидно действие и относително ниските минералкортикоидни ефекти, които са нежелани.

При модел на зайци /постоперативно възпаление след катарактна хирургия/ няма разлика в противовъзпалителната ефикасност на Ultracortenol Gel 0.5% и преднизолон ацетат 1% суспензия – очни капки /оценени по клетките в преднокамерната течност, измерени с лазерен апарат/. Същото наблюдение е направено постоперативно при пациенти след отстраняване на лещата от окото.

5.2. Фармакокинетика

След локално приложение в окото, преднизолон ацетатът бързо се абсорбира и също бързо метаболизира в преднизолон, както е установено в проучвания с преднизолон ацетат суспензия – очни капки. Максимални концентрации в роговицата и преднокамерната течност на зайци се достигат след около 30 минути. Концентрациите се увеличават повече от два пъти, ако корнеалният епител е отстранен. Максимални концентрации в човешки очи



се наблюдават след приблизително 2 часа. Полуживотът е приблизително 80 минути в роговицата и 150 минути в преднокамерната течност.

Топикалното приложение в окото води също до системна абсорбция.

Ultracortenol Gel 0.5% е нова очна гел – формула. Контактното време с роговицата на очния гел е по-дълго от това на конвенционалните суспензии с воден вехикулум. Ultracortenol Gel 0.5% формира депо върху очната повърхност. Депото съдържа значими количества от активния метаболит преднизолон.

Фармакокинетиката на Ultracortenol Gel 0.5% е различна от тази на конвенционалните суспензии с воден вехикулум /преднизолон ацетат 1% очни капки/:

	Преднокамерна течност		Плазма	
	Ultracortenol Gel 0.5 %	Prednisolone acetate 1 % суспензия	Ultracortenol Gel 0.5 %	Prednisolone acetate 1 % суспензия
C _{max} (µg/ml)	0.3	0.6	0.042	0.095
T _{max} (h)	0.5	2.0	2.0	1.0
AUC(µg.h/ml)	0.5	1.5	0.214	0.360

Само преднизолонът, но не и преднизолон ацетатът, може да се регистрира в преднокамерната течност и плазмата.

Преднизолонът бързо и почти напълно се абсорбира от гастроинтестиналния тракт. Максимални плазмени нива на концентрация се достигат след 1-2 часа. Бионаличността варира между индивидите от 60% до почти 100%; биологичният полуживот е 12-36 часа. В плазмата преднизолонът се свързва с албумин и транскортин. Максималният ефект се достига, благодарение на индиректния механизъм на действие, след 4 до 8 часа. Метаболизира се предимно в черния дроб и в известна степен в почти всички тъкани. Метаболитите се екскретират главно с урината.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Проучвания върху острата токсичност

LD₅₀ на преднизолон при плъхове е 240 mg/kg. Подкожни дози от 3500 mg/kg са летални при мишки. При клинично приложение на хора преднизолон в дози от 200 mg или даже над това ниво се понасят.

Токсичност на повтарящата се доза

Тестове за субхронична и хронична токсичност на преднизолон показват повишена поява на локални нежелани ефекти като вторични инфекции и системни ефекти, за които е известно, че се индуцират от глюкокортикоиди.

Карциногенен потенциал

Няма известни специални преклинични проучвания върху онкогенния/карциногенен потенциал на преднизолон.

Мутагенен потенциал

Преднизолонът е недостатъчно тестван за неговия мутагенен потенциал.



Репродукция и фертилитет

Експериментални проучвания с животни показваха висока честота на аборти, плацентна инсуфициенция, клиновидно небце и други ефекти, свързани с високи дози стероиди. Плъховете показват минимални аномалии на черепа, челюстта и езика. Дневни дози от 10-15 mg/kg по време на бременността водят до хистологични промени в плацентата и fetalния черен дроб. Fetalният растеж се забавя. При все това, досега клиничният опит с преднизолон при бременни жени не показва специфичен риск от тератогенни ефекти.

Локална толерантност

Вредни свойства на топикално приложен Ultracortenol Gel 0.5% не са наблюдавани.

6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ

6.1. Списък на помощните вещества

Benzalkonium chloride (0.05 mg/g), Sorbitol, Polyvinyl alcohol, Carbomer 974 P, Sodium acetate 3 H₂O, Lysine monohydrate, Water for injections.

6.2. Несъвместимости

Бензалкониевият хлорид може да се депозира в меките контактни лещи. Следователно контактните лещи трябва да се отстраняват преди приложение на очния гел и да не се поставят отново по-рано от 30 минути след употребата на Ultracortenol Gel 0.5%.

6.3. Срок на годност

Срокът на годност на неотворения продукт е 18 месеца.

Срокът на годност след първото отваряне на флакона е 4 седмици.

6.4. Специални условия за съхранение

Да се съхранява под 25°C. Да се съхранява в оригиналната опаковка. Да не се замразява. След първото отваряне флаконът да се съхранява във външната картонена опаковка /защитен от светлина/ с гутатора надолу, за да се улесни капането.

6.5. Данни за опаковката

Флаконът е пластмасово шишенце с гутатор, направено от прозрачен полиетилен без оцветители за флакони, и винтова капачка, направена от полиетилен с оцветители за флакони. Съдържа 5g от постоянната суспензия преднизолон ацетат.

6.6. Инструкции за употреба

Наконечникът остава стерилен до разкъсване на предпазния пръстен. Всяко останало количество 4 седмици след първоначалното отваряне трябва да се изхвърли. Пациентите трябва да бъдат инструктирани, че ако Ultracortenol Gel 0.5% не се съхранява правилно след първоначалното отваряне, може да се контаминира от обичайните бактерии, които причиняват очни инфекции.



7. ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

NOVARTIS Ophthalmics AG
Riethofstrasse 1
CH-8442 Hettlingen
Switzerland

8. РЕГИСТРАЦИОНЕН №

9. ДАТА НА ПЪРВА РЕГИСТРАЦИЯ

10. ДАТА НА РЕВИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

