

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВАТА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ 11-3438, 11.12.08
Одобрено: 23 / 30.09.08

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

1. Име на лекарствения продукт

Dexamethasone Adipharm 0,1% eye drops, suspension

Дексаметазон Адифарм 0,1% капки за очи, суспензия

2. Качествен и количествен състав

Един ml от суспензията съдържа 1 mg дексаметазон (*dexamethasone*).

За пълния списък на помощните вещества вж. точка 6.1.

3. Лекарствена форма

Капки за очи, суспенсия.

4. Клинични данни

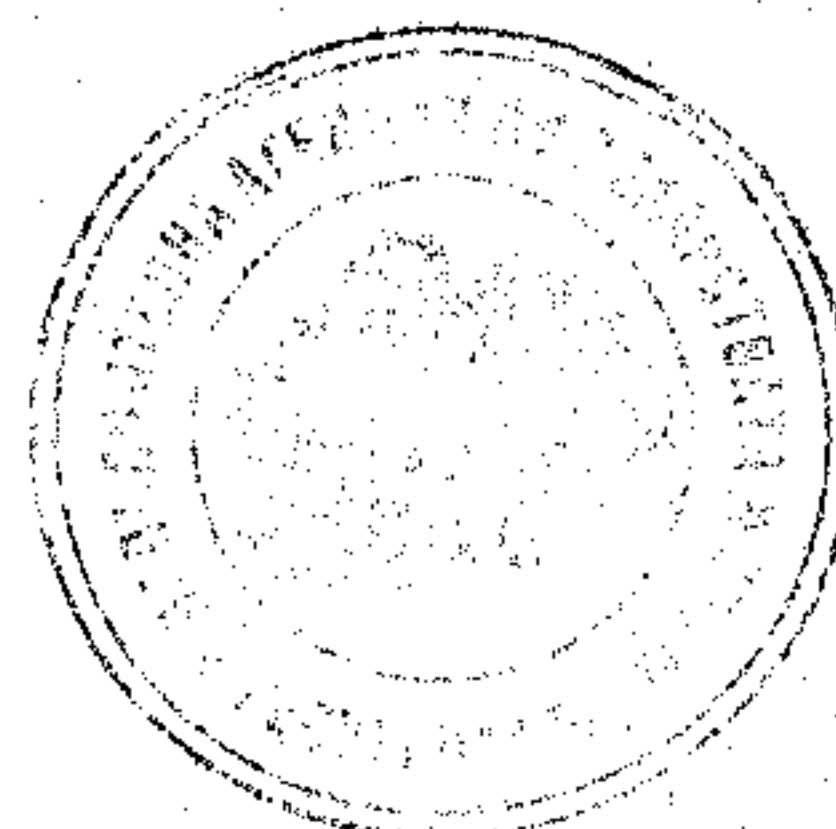
4.1. Терапевтични показания

Dexamethasone Adipharm е предназначен за лечение на чувствителни към стероиди възпалителни заболявания, като:

- Възпаление на предния сегмент на окото – остри и хронични предни увеити, ирити, иридоциклити, циклити, херпес зостер кератити (*когато острата фаза на заболяването отmine*);
- Заболявания на конюнктивата - кератоконюнктивити, негнойни конюнктивити, включително вернални, алергични и катарални. Лекарствения продукт е особено ефективен, когато алергията е водеща причина за заболяването;
- Рецидивиращи маргинални разязвявания с токсичен или алергичен произход;
- Химични или термични изгаряния;
- Постоперативно лечение.

4.2. Дозировка и начин на приложение

Преди употреба е бутилката трябва да се разклати.



При тежки възпалителни състояния началната доза е 1-2 капки в конюнктивата през 30-60 минути, като с подобряване на състоянието дозата постепенно се намалява до приложение на всеки 4 часа.

При умерено/хронично възпаления се прилагат по 1-2 капки в конюнктивата на окото през 3-6 часа (може и по-често, в зависимост от състоянието).

При алергия или лека форми на възпаление дозировката е 1-2 капки на всеки 3-4 часа.

Когато лекарственият продукт се прилага заедно с други офталмологични продукти, между двете накапвания е необходим интервал от минимум 15 минути.

Продължителността на лечението не трябва да превишава 2 седмици, без повторна лекарска консултация.

Деца

Не се препоръчва прилагането на продукта при деца . поради липсата на достатъчно данни по отношение на безопасността и ефикасността при тази група пациенти.

4.3. Противопоказания

- свръхчувствителност към активното вещество или към някое от помощните вещества;
- някои вирусни заболявания на роговицата и конюнктивата;
- други вирусни заболявания: напр. херпес симплекс, варицела или ваксинация за вариола;
- туберкулоза и гъбични инфекции;
- остри гнойни инфекции;
- други заболявания, предизвикани от патогенни микроорганизми, поради възможност за маскиране на симптомите или влошаване на инфекцията от кортикостероидното лечение;
- пациенти с повишено вътреочно налягане и/или анамнеза за такова;
- деца.



4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

При продължително прилагане или прилагане на продукта във високи дози е възможна значителна системна резорбция на кортикостероида, както и появата на очна хипертензия у някои пациенти.

Продължителното приложение може да предизвика появата на очен херпес симплекс или други системни нежелани ефекти. В подобни случаи се препоръчва редовно проследяване състоянието на очите.

Суспензията е предназначена само за локално прилагане в конюнктивалния сак. Не бива да се прилага за вътреочно инжектиране.

В случай, че не настъпи подобрене на състоянието след 3-4 дневно лечение, се препоръчва назначаването на допълнително локално или системно лечение.

Dexamethasone Adipharm съдържа консерванта бензалкониев хлорид и може да се абсорбира от меки контактни лещи. Контактните лещи трябва да бъдат остранявани преди приложението на продукта и поставяни обратно най-малко 15 минути след накапването.

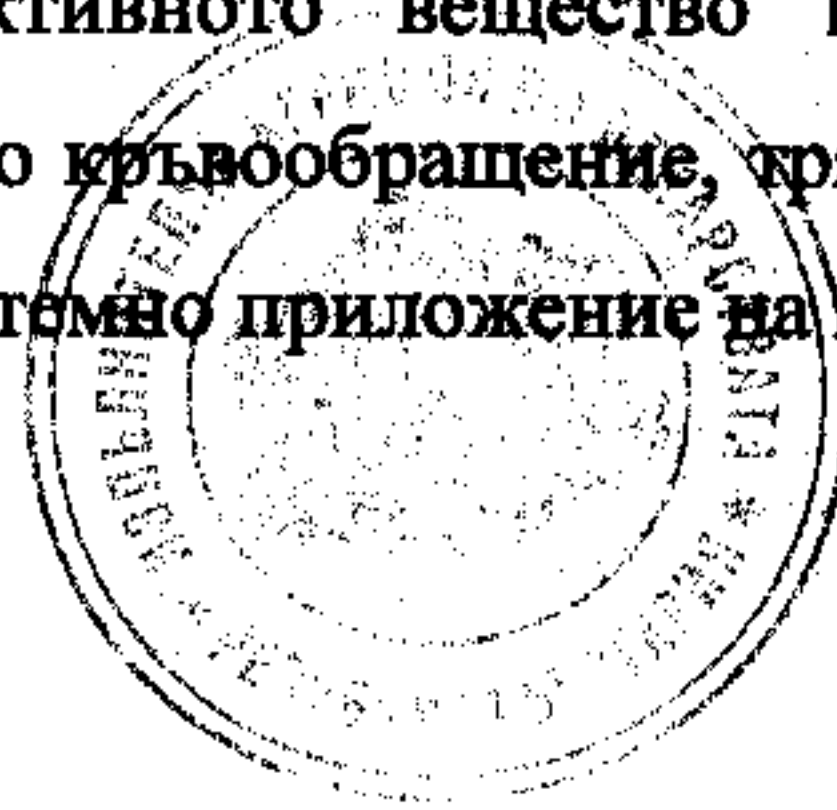
При използването на Dexamethasone Adipharm заедно с други очни капки е необходимо спазването на най-малко 15-минутен интервал между прилагането им.

Важно за спортисти: Поради възможност за системна абсорбция, употребата на този продукт може да даде фалшиво положителен резултат при допинг-контрол.

4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие

Възможно е допълнително повишаване на вътреочното налягане, особено когато дексаметазон се прилага едновременно с атропин или други антихолинергични средства, които също повишават вътреочното налягане.

Предвид това, че определено количество от активното вещество при очно приложение в обичайни дози преминава в системното кръвообращение, трябва да се имат предвид лекарствените взаимодействия, при системно приложение на продукта.



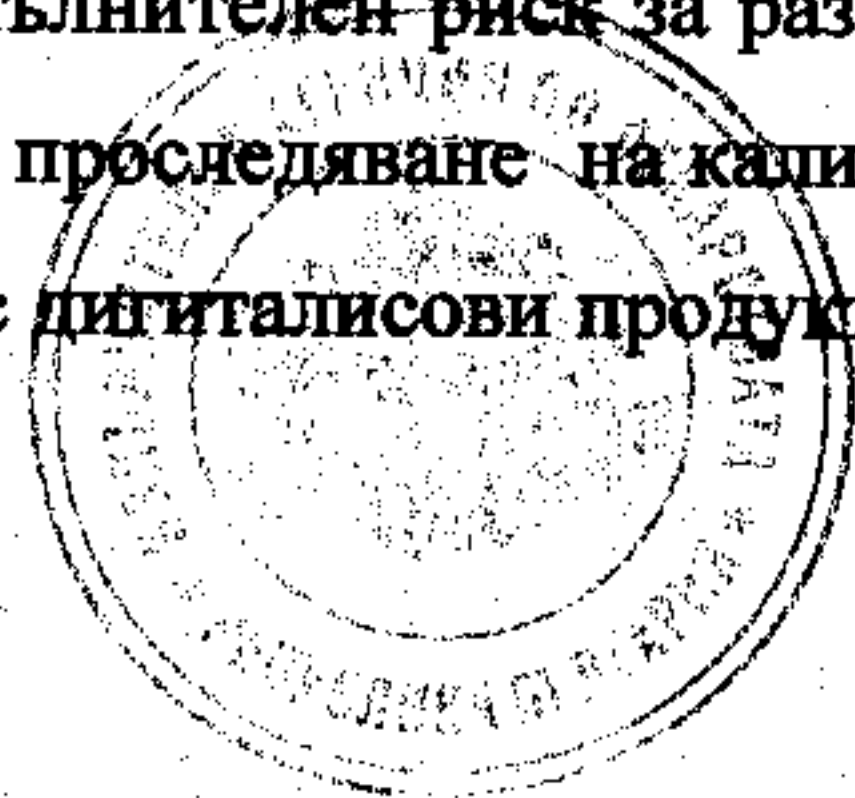
Dexamethasone взаимодейства с лекарствени продукти, провокиращи *torsades de pointes* (астемизол, бепридил, еритромицин IV, халофантрин, пентамидин, спарфлоксацин, султоприд, терфенадин, винкамин). Това взаимодействие е по-изразено при хипокалиемия, брадикардия и удължен Q-T интервал.

Взаимодействие с ацетилсалицилова киселина и други салицилати: съществува риск от намаляване на плазменото ниво на салицилатите при едновременно лечение с кортикостероидни продукти, и тяхното предозиране след спиране на кортикостероидното лечение. Ето защо, е необходимо да се адаптират дозите на салицилатите по време и след лечението с кортикостероидите.

Взаимодействие с антиаритмични средства, които може да доведат до т.н. *torsades de pointes* (амиодарон, дизопирамид, хинидин и производните му, соталол): необходимо е да се следи нивото на калия в кръвта и да се коригира хипокалиемията, да се контролира Q-T интервала и при появата на *torsades de pointes* да се спре прилагането на антиаритмичното средство.

Взаимодействие с перорални антикоагуланти: възможно е влияние на кортикотерапията върху коагулацията, както на ниво метаболизъм на антикоагуланта, така и на ниво фактори на коагулацията. Възможни са усложненията, поради наличието на хеморагичен риск от хепаринов тип, характерен за лечението с кортикостероиди (на ниво лигавица на червата и поради съдова недостатъчност). При прилагането на високи дози или продължително лечение (повече от 10 дни), когато комбинираното лечение е оправдано е необходим лекарски контрол.

Взаимодействие с други хипокалиемични средства (хипокалиемични средства самостоятелно или в комбинация с диуретици, стимулиращи очистителни, амфотерицин В IV): тези комбинации представляват допълнителен риск за развитие на хипокалиемия. В тези случаи е необходимо постоянно проследяване на калиевото ниво в кръвта и неговата корекция, особено при лечение с дигиталисови продукти.



Взаимодействие с дигиталисови продукти: хипогликемията ускорява появата на дигиталисови токсични ефекти. Необходимо е постоянно следене на нивото на калия в кръвта и евентуална корекция.

Ензимни индуктори (карбамазепин, фенобарбитал, фенитоин, примидон, рифампицин): плазмената концентрация и ефективност на кортикостероидите намалява, поради усилване на чернодробния метаболизъм. В тези случаи е необходимо клинично и биологично наблюдение, както и адаптиране на начина на прилагането на кортикоида по време и след комбинацията с индуктора.

Взаимодействие с инсулин, метформин, хипогликемични сулфамиди: наблюдава се повишаване на гликемията, понякога в комбинация с ацидоза, която се появява, поради намаляването на толерантността към глюкоза под действието на кортикостероидите. Препоръчва се пациентът да бъде предупреден и самостоятелно да следи за нивото на захарта в кръвта и урината, особено в началото на лечението. Едновременното лечение с кортикостероиди и антидиабетни средства, както и след спирането на хормона, изисква адаптиране на дозата на антидиабетните средства.

Взаимодействие с изониазид: при тази комбинация се наблюдава намаляване на плазмената концентрация на изониазид, поради усилване на неговия чернодробен метаболизъм и намаляване на метаболизма на глюкокортикоида. Необходимо е клинично и микробиологично наблюдение.

Взаимодействие с аминоклутетимид: наблюдава се намаляване на ефективността на дексаматазон, поради усилване на чернодробния метаболизъм. Това изисква адаптиране на дозите на Dexamethasone Adipharm.

Взаимодействие с антихипертензивни средства: намалява се антихипертензивния ефект, поради задържане на натрий и вода, предизвикано от кортикоидите.

Взаимодействие с интерферон-алфа: съществува риск от инхибиране действието на интерферона.



Взаимодействие с празиквантел: намалява плазмените концентрации на празиквантел.

4.6. Бременност и кърмене

Липсват достатъчно данни за нежеланите ефекти на дексаметазон по време на бременност и кърмене.

Проучванията при животни показват малформации или други ембриотоксични ефекти (напр. проблеми с нарастването на плода). Подобни проучвания не са провеждани при човека. Необходима е внимателна преценка на съотношението полза/риск по време на бременността (особено през първия триместър).

Глюкокортикоидите се отделят в човешката кърма. Ето защо, при лечение с продукта, кърменето трябва да бъде преустановено (особено в случай на продължителна терапия).

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Възможни нежелани ефекти като леки зрителни нарушения могат да повлияят способността за шофиране и работа с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

- Като цяло, продуктът се понася добре. Нежеланите реакции могат да включват преходно локално дразнене, сърбеж, палпебрален или конюнктивален еритем. Съществува риск от поява на реакции на свръхчувствителност от страна на кожата и конюнктивата.
- Продължителната употреба на кортикостероиди може да доведе до появата на очна хипертензия, развитие на глаукома или увреждане на зрителния нерв, помътняване на лещата, повърхностен кератит, субкапсуларна задна катаракта.
- При поява на язви на роговицата или склерата, кортикоидите може да забавят заздравяването и да провокират появата на суперинфекция.
- При повишена системна абсорбция е възможна поява на нежелани ефекти от страна на стомашно-чревния тракт като гадене и повръщане.



4.9. Предозиране

Предозиране при приложение в очите е малко вероятно. Погълчането на съдържанието на една опаковка не може да доведе до поява на симптомите на предозиране, тъй като една бутилка Dexamethasone Adipharm съдържа 10 mg от лекарствено вещество.

Въпреки това, симптомите на предозиране могат да бъдат подобни на нежеланите ефекти на продукта.

5. Фармакологични свойства

Фармакотерапевтична група: Сетивни органи. Офталмологични лекарствени продукти. Противовъзпалителни. Кортикостероиди. АТС код: S01BA 01

5.1. Фармакодинамични свойства

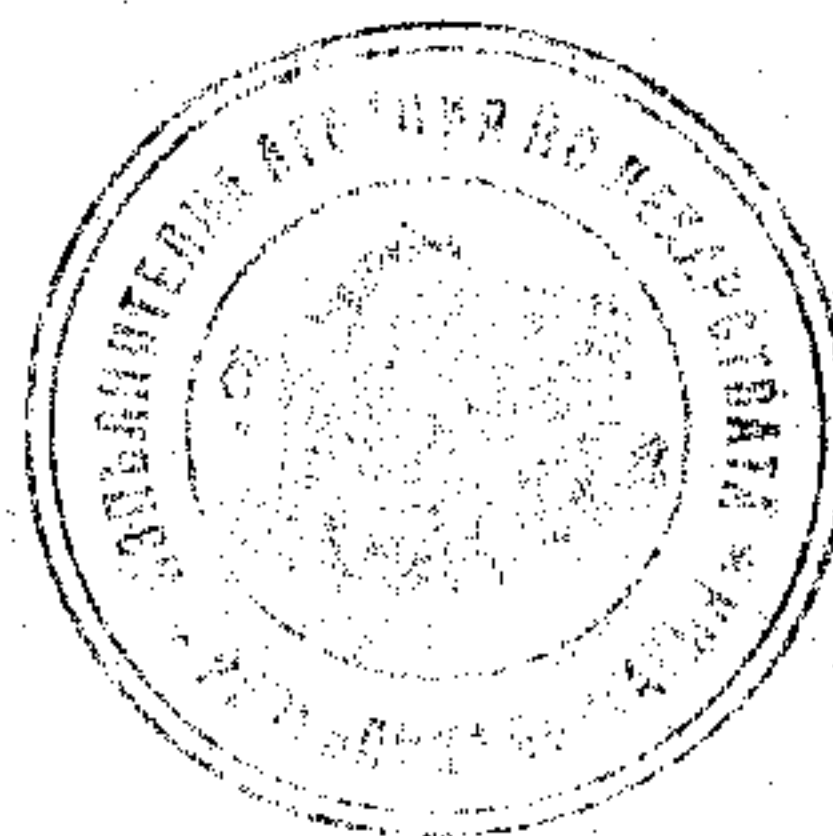
Терапевтичното приложение на дексаметазон се базира на известната му противовъзпалителна активност – 25 до 30 пъти по-висока от тази на хидрокортизона. От друга страна, свързаните с дексаметазон нежелани ефекти като задържане на натрий и вода, загуба на калий и нарушение на глюкозния метаболизъм, са незначителни в сравнение с тези на хидрокортизона.

Механизмът на действие на дексаметазон е подобен на този на хидрокортизона. Специфичният механизъм на потискане на възпалението и алергичната реакция все още не е напълно изяснен. Инхибирането на синтеза на специфичните протеини, участващи в хемотаксиса и имунологичния процес, както и други функционални промени в левкоцитите и макрофагите стои в основата на този механизъм.

Установено е, че локалното приложение на стероиди в окото е ефективно при лечението на неинфекциозни възпалителни заболявания на предния очен сегмент, роговицата и конюнктивата.

Възпалението на задния очен сегмент, обаче изисква системно лечение.

5.2. Фармакокинетични свойства



Dexamethasone се резорбира бързо в стомашно-чревния тракт. Плазменото време на полуживот е около 190 минути. 77% се свързват с плазмените протеини. До 65% от дозата се екскретират с урината в продължение на 24 часа.

Преминава през плацентарната бариера и се излъчва в кърмата при човека.

Изследванията, проведени с радиоактивно белязан дексаметазон-сулфобензоат-натрий, са показали бърза абсорбция на дексаметазон във външната част на окото, в това число в роговицата, конюнктивата, извънклетъчната течност и ириса. Максимален ефект настъпва 10-20 минути след накапването на офталмологичната суспензия. 30 минути след накапването активното вещество е намерено в плазма, жлъчка, черен дроб, бъбреци и урина.

След перорално прилагане на 1,2,4-³H-дексаметазон, 15% от дозата се екскретират с урината за около 4 часа. 50% се екскретират като конюгат (глюкоронид-конюгат). В сравнение с останалите пациенти, нивото на дексаметазон и дексаметазон-конюгат в урината е по-високо при пациенти, които много дълго време са приемали дифенилхидантоин.

След интравенозно приложение 16% от дозата се излъчва в първите 4 часа, а 64% до 24 часа чрез урината. Предполага се, че основен метаболитен път след интравенозно приложение е образуването на полярни производни - неконюгати.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Остра токсичност

Проведените проучвания при перорален прием, веднъж дневно, в продължение на 7 дни показват, че LD₅₀ на дексаметазон при мишки е 16g/kg телесно тегло и над 3 g/kg телесно тегло при плъхове.

При подкожно приложение, веднъж дневно в продължение на 7 дни са установени следните летални дози на дексаметазон: LD₅₀ > 700 mg/kg т.м при мишки и около 120 mg/kg т.м при плъхове.

Хронична токсичност: няма данни за хронична токсичност нито при хора, нито при животни. Представените в т. 4.8 нежелани лекарствени реакции може да се очакват при продължителното приложение на продукта в дози над 1.5 mg/дневно.



Канцерогенност, мутагенност, влияние върху фертилитета

Изследванията, проведени върху човешки клетки, клетките на мишки и *Drosophilla melanogaster* са показали, че dexamethasone има мутагенен потенциал, специфичен за *FS(1)K10*.

Освен това, dexamethasone при подкожно прилагане на плъхове Вистар (възраст 9 дни) в доза 1 mg/kg т.м. е показал функционална тератогенност, която се е проявила с краткосрочно отслабване на паметта. Наблюдавано е също промяна на имунния отговор, изразена в повишение на клетъчния имуен отговор и намаление на хуморалния.

Проведените проучвания не предполагат повишен риск от репродуктивна токсичност.

Приложението на дексаметазон в края на бременността води до повишен риск от адренкортикална атрофия за плода. В този случай е необходима допълнителна терапия на новороденото.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощни вещества

Полисорбат 80

Хипромелоза

Динатриев фосфат додекахидрат

Лимонена киселина, монохидратна

Натриев хлорид

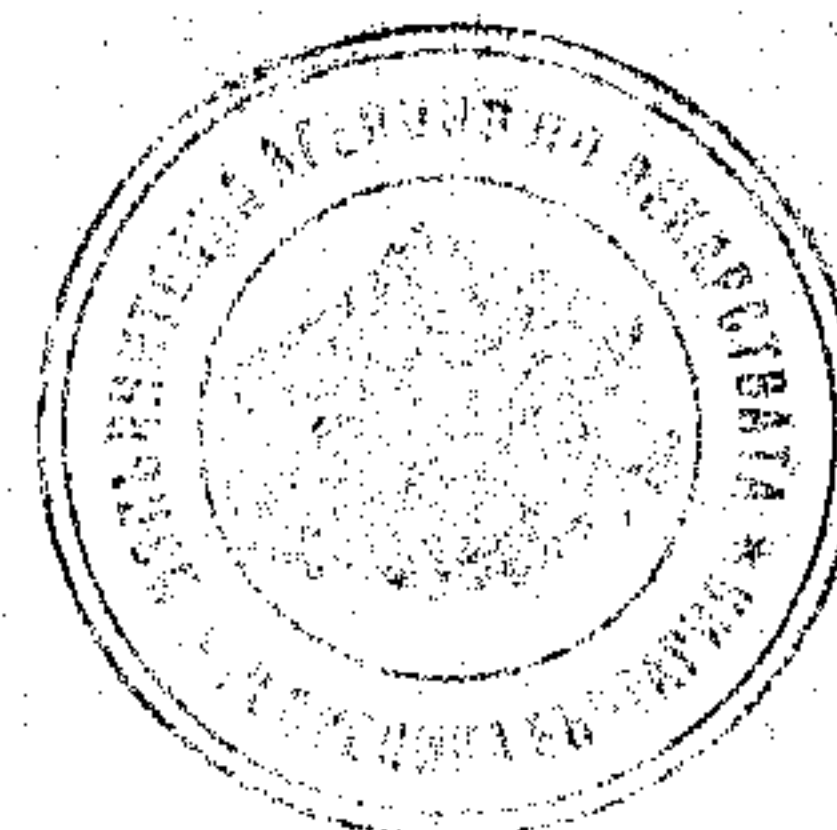
Динатриев едетат

Бензалкониев хлорид

Пречистена вода.

6.2. Несъвместимости

Не е приложимо.



Спазва се общото правило: при едновременната употреба на няколко продукта за очно приложение е необходимо спазването на интервал от поне 15 минути между тях.

6.3. Срок на годност

2 години.

След първоначалното отваряне на опаковката лекарственият продукт е годен за употреба в продължение на 28 дни.

6.4. Специални условия на съхранение

Да се съхранява на защитено от светлина място, при температура под 25 °С.

Да не се използва повече от 28 дни след отваряне на бутилката.

Да не се използва след изтичане на срока на годност, обозначен на опаковката.

6.5. Данни за опаковката

Полиетиленова бутилка с 10 ml суспенсия, снабдена с капкомер и стерилна капачка, запечатана с пръстен.

6.6. Специални предпазни мерки при изхвърляне и работа

За да се предотврати замърсяването на продукта при употреба се препоръчва да не се пипа с ръце капкомера или края на запушалката и да не се допират до очите. Има описани случаи на бактериален кератит, поради неправилното използване на многодозова опаковка.

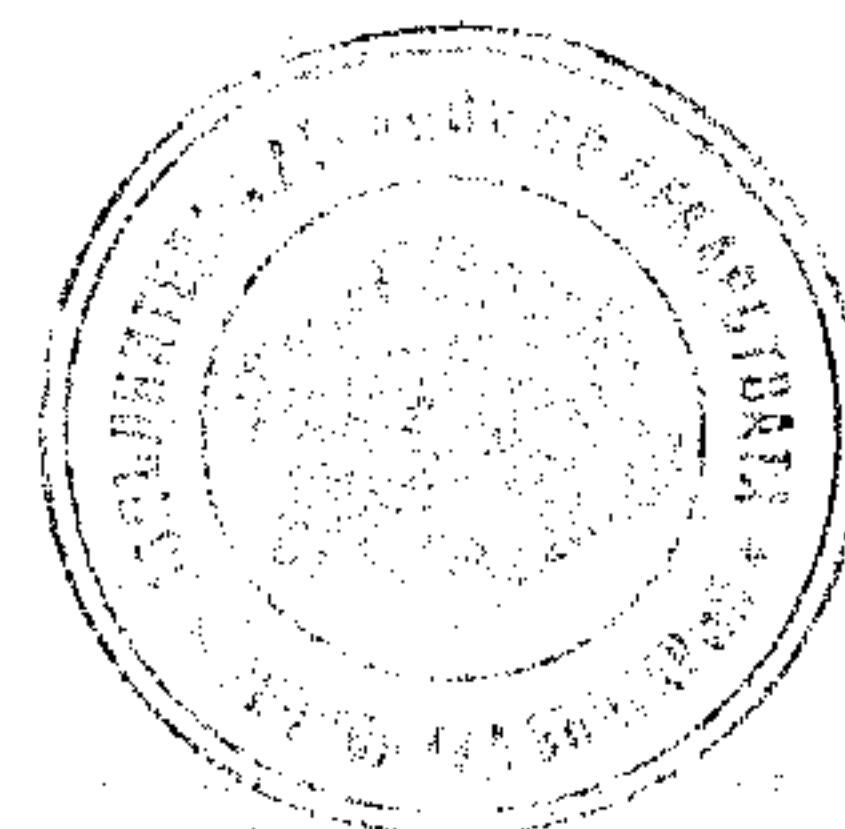
Бутилката не трябва да се използва едновременно за приложение в очите и носа, както и при различни пациенти.

7. Притежател на разрешението за употреба

АДИФАРМ ЕАД

бул. Симеоновско шосе № 130

София 1700, България



8. НОМЕР(А) НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА

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

10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА

Септември, 2007 г.

