

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

### 1. ИМЕ НА ЛЕКАРСТВЕНИЯ ПРОДУКТ

Linoladiol® N

Линоладиол® N

ИЗПЪЛНИТЕЛНА АГЕНЦИЯ ПО ЛЕКАРСТВА
Кратка характеристика на продукта - Приложение 1
Към РУ 2688 / 01.08.08
Одобрено: 20 / 08.07.08

### 2. КАЧЕСТВЕН И КОЛИЧЕСТВЕН СЪСТАВ

100 g крем съдържа:

Estradiol hemihydrate

0.01033 g

( съответстващи на estradiol 0.01 %)

### 3. ЛЕКАРСТВЕНА ФОРМА

Крем за нанасяне върху кожата и лигавиците на външните гениталии  
Крем за вътревагалищно приложение с помощта на апликатор. Бял, гладък крем

### 4. КЛИНИЧНИ ДАННИ

#### 4.1. Терапевтични показания

Линоладиол N се използва при атрофия в областта на вулвата и вагиналицето и обусловените от това сърбеж и сухота на вагиналицето, както и смущения при полово общуване.

#### 4.2. Дозировка и начин на приложение

За нанасяне върху кожата и лигавиците на външните гениталии  
За вътревагалищно приложение с помощта на апликатор.

В областта на външните гениталии Linoladiol N се нанася 2-3 пъти дневно.  
При интравагинално приложение във вагиналицето се вкарва ½ до 1 пълнеж на апликатора вечер, преди лягане.  
През първата седмица от лечението приложението става всекидневно в продължение на 5-7 последователни дни. След това се прилага поддържащо дозиране 2-3 пъти седмично.

#### 4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към цетилстеарилалкохол. Препаратът не трябва да се прилага при естроген – зависими тумори, ендометриоза, по време на бременност, при недиагностицирано абнормно генитално кървене, както и при известен или подозиран рак на млечната жлеза, освен по строга преценка на съотношението полза – риск.

#### 4.4. Специални предупреждения и предпазни мерки при употреба

При по-продължително ежедневна прилагане на Линоладиол N вътре вагиналично при жени с ендометриум, отговарящо на стимулиране, би трябвало местното естрогенно лечение да се допълни с орално приложение на



гестагени. Ако се появят неочаквани кръвотечения, лечението с Линоладиол трябва да се преустанови до изясняване на причината.

Съобщавано е, че естрогените увеличават риска от карцином на ендометриума при жени в менопауза. Определени пациенти могат да развият нежелана поява на естрогенна стимулация като абнормно генитално кървене и мастодония.

Линоладиол N не трябва да се употребява непосредствено преди сексуално общуване и като лубрикант, за да се избегнат нежелани ефекти върху партньора. При продължителна употреба трябва да се съблюдава за възможни странични ефекти. Като предпазна мярка Линоладиол N не трябва да се употребява от деца или подрастващи.

Цетилстеариловият алкохол може да причини локално зачервяване, сърбеж на кожата ( т.е. контактен дерматит).

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

Следните взаимодействия на Линоладиол N не могат да се изключат по принцип и при интравагинално приложение: намаляване на действието на подтискащи кръвосъсирването и понижавачи кръвната захар препарати. Намаляване на ефективността на Линоладиол N чрез препарати, които индуцират микрозомни чернодробни ензими / например барбитурати, рифампицин/.

#### **4.6. Бременност и кърмене**

Линоладиол N е медицински противопоказан да се използва по време на бременност и кърмене.

#### **4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Не са известни.

#### **4.8. Нежелани лекарствени реакции**

При свръхчувствителност спрямо цетилстеарил алкохол могат да възникнат алергични реакции. При по-продължителна употреба трябва да се следи за дължащи се на естрогена системни нежелани реакции. Неочакваните или засилени кръвотечения трябва да се изяснят диагностично.

#### **4.9. Предозиране**

При умишлено или случайно приемане на Линоладиол N през устата могат да настъпят нежелани реакции, като стомашно- чревни оплаквания, гадене и т.н. Понеже нежеланите реакции отзвучават бързо и няма данни за предизвикване на сериозни смущения, не са необходими специални мерки.

### **5. ФАРМАКОЛОГИЧНИ СВОЙСТВА**

#### **5.1. Фармакодинамични свойства**

АТС код: G03 CA03

Линоладиол N съдържа като активна субстанция естествен полов хормон 17 $\beta$ -естрадиол, който е най-силно действащият вътреклетъчен естествен естроген. Освен типичното хормонално действие през репродуктивната възраст, естрадиол оказва характерно въздействие върху кожата, която разширява



капилярите и стимулира общото кръвооросяване. Естрогените стимулират пролиферацията на епителните клетки и увеличават синтеза на колаген в кожата.

Естрадиол действа подобно на други стероидни хормони чрез специфични рецептори, непосредствено върху генетичната информация / върху ДНК /. По този начин естрадиол повлиява на транскрипцията /синтезата на РНК/ и стимулира синтезирането на специфични протеини.

### **5.2. Фармакокинетични свойства**

При локално прилагане на стероидни хормони трябва да се очаква добра резорбция. При естрадиол се наблюдава first-pass- ефект, който може да се избегне при дермално или вагинално приложение. Определянето на кръвната концентрация на естрадиол след интравагинално приложение при жени след менопауза, показва след 1 до 1 ½ часа подчертано увеличение на концентрацията над характерната за постменопаузата изходна стойност от < 20 pg естрадиол и < 40 pg естрон, което се задържа от 3 до 4 часа. След 8 часа увеличението вече не се наблюдава. При интравагинално приложение на 2 грама Линоладиол N и при изходни концентрации < 20 pg естрадиол и < 40 pg естрон се получават концентрации за естрадиола между 16 и 74 pg и за естрона между 20 и 59 pg. Естрадиол се метаболизира бързо в черния дроб и червата в естрон и по-нататък в естриол. Превръщането на естрадиол в естриол е необратимо. Над 95 % от естриола се отделят с урината, предимно във формата на глюкорониди.

### **5.3. Предклинични данни за безопасност**

Понеже естрадиол е естествен, наличен и в човешкия организъм хормон, не са необходими изследвания за токсикологични параметри.

## **6. ФАРМАЦЕВТИЧНИ ДАННИ**

### **6.1. Списък на помощните вещества:**

Бензилов алкохол, цетилпалмитат, цетилов стеарил алкохол, натриев цитрат-дихидрат, октилдодеканол, полисорбат 60, сорбитанов стеарат, пречистена вода.

### **6.2. Несъвместимости**

Няма

### **6.3. Срок на годност**

3 години

### **6.4. Специални указания за съхранение**

Да не се съхранява над 25 С°.

### **6.5. Вид и съдържание на опаковките**

Алуминиева туба с вътрешен защитен лак и капачка от полиетилен.

Туби с 50g крем, с приложен апликатор



**7. ПРОИЗВОДИТЕЛ И ПРИТЕЖАТЕЛ НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

Dr. August Wolff GmbH & Co. KG – Arzneimittel  
Sudbrackstrasse 56  
33611 Bielefeld, Германия

**8. НОМЕР НА РАЗРЕШЕНИЕТО ЗА УПОТРЕБА**

9700437

**9. ДАТА НА ПЪРВО РАЗРЕШАВАНЕ ЗА УПОТРЕБА**

22.03.2004 г.

**10. ДАТА НА АКТУАЛИЗИРАНЕ НА ТЕКСТА**

януари 2008 г.

