

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

OEKOLP 1 mg/g, krem

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 g kremu zawiera 1,0 mg estriolu (*Estriolum*)

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: glikol propylenowy.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krem dopochwowy

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie chorób spowodowanych niedoborem estrogenów, takich jak:

- zmiany atroficzne w obrębie pochwy i sromu:

Dolegliwości sromu i pochwy (świąd, pieczenie, suchość pochwy) dyspareunia, atroficzne zapalenie sromu i pochwy, upławy w przypadkach niedoboru estrogenów, zapalenie szyjki macicy, zwężenie pochwy, owrzodzenia pochwy i szyjki macicy;

- Leczenie przed- i pooperacyjne pochwy u kobiet z niedoborem estrogenów.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Należy stosować 0,5 g kremu ($\frac{1}{2}$ objętości aplikatora odpowiadająca 0,5 mg estriolu) na dobę lub w pojedynczych przypadkach, o ile to konieczne maksymalnie 1 g kremu (= 1 objętość aplikatora odpowiadająca 1 mg estriolu) na dobę, dopochwowo. Alternatywnie, odpowiednia ilość kremu dopochwowego stosowana jest na zewnętrzne narządy płciowe. Podana dawka maksymalna 1g kremu na dobę nie powinna być przekraczana.

Krem stosuje się dopochwowo za pomocą załączonego aplikatora wielokrotnego użytku. Alternatywnie stosując na zewnętrzne narządy płciowe należy nałożyć cienką warstwę kremu na miejsca wymagające leczenia i wetrzeć palcami.

Leczenie zmian atroficznych w obrębie narządów płciowych:

Zwykle stosuje się 0,5 g kremu OEKOLP na dobę przez okres 3 tygodni. Po tym czasie skuteczna jest zwykle dawka podtrzymująca 0,5 g kremu na dobę stosowana raz lub dwa razy na tydzień.

Leczenie przed i po operacjach w obrębie pochwy:

Zwykle stosuje się 0,5 g kremu na dobę ($\frac{1}{2}$ objętości aplikatora) przez okres około dwu tygodni przed operacją. Po operacji jako dawka podtrzymująca podawane jest 0,5 g kremu na dobę ($\frac{1}{2}$ objętości aplikatora) dwa razy w tygodniu.

W zależności od nasilenia objawów niedoboru hormonów w błonie śluzowej pochwy, konieczne być może stosowanie kremu OEKOLP przez dłuższy czas. W takim przypadku konieczne jest przeprowadzanie co sześć miesięcy badania lekarskiego

z cytologiczną oceną błony śluzowej pochwy w celu stwierdzenia w jaki sposób należy kontynuować leczenie.

4.3 Przeciwwskazania

- nadwrażliwość na estriol lub którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1
- krwawienie z dróg rodnych o nieznanym pochodzeniu;
- podejrzenie lub obecność nowotworów złośliwych estrogenozależnych.

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Wskazania do natychmiastowego przerwania leczenia:

Wystąpienie po raz pierwszy migrenowych bólów głowy lub częste występowanie nadzwyczajnie silnych bólów głowy, pierwsze objawy zapalenia żył lub objawy zakrzepowo-zatorowe, wystąpienie żółtaczki cholestatycznej, duży wzrost ciśnienia tętniczego krwi, ostre zaburzenia widzenia.

Krem OEKOLP powinien być podawany wyłącznie w oparciu o regularną kontrolę medyczną i badanie ginekologiczne. Dotyczy to w szczególności przypadków ciągłych lub powtarzających się krwawień z pochwy.

W przypadku dobrej odpowiedzi na leczenie, należy starać się stosować najmniejszą skuteczną dawkę leku.

Zakażenie w obrębie pochwy powinno być jednocześnie leczone za pomocą odpowiednich leków.

Brak jest danych na temat związku pomiędzy ciągłym długoterminowym podawaniem dopochwowym estriolu podczas menopauzy, a wzrostem ryzyka raka endometrium. Jednakże należy rozważyć odpowiednie środki ostrożności.

W przypadku stosowania prezerwatyw z lateksu w trakcie leczenia za pomocą kremu OEKOLP, może wystąpić zmniejszenie ich wytrzymałości a co za tym idzie zmniejszenie skuteczności ochrony.

Krem OEKOLP zawiera glikol propylenowy, który może powodować podrażnienie skóry.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

W przypadku jednoczesnego leczenia antybiotykami, działanie estriolu może być okresowo osłabione poprzez hamowanie krążenia jelitowo-wątrobowego. Jednoczesne podawanie barbituranów i leków przeciwpadaczkowych może także osłabić działanie estriolu.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak jest wskazań do podawania estriolu w ciąży. Estriol przenika do mleka matki.

Karmienie piersią

Estriol w okresie karmienia piersią powinien być stosowany miejscowo i w małej dawce.

4.7 Wpływ na zdolność do prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Nie dotyczy

4.8 Działania niepożądane

Czasami wystąpić mogą następujące działania niepożądane:

Zwłaszcza na początku leczenia plamienia, napięcie piersi i ich bolesność, zaburzenia żołądkowo-jelitowe (np. nudności), obrzęki z przemijającym zwiększeniem masy ciała i miejscowe podrażnienie pochwy ze świądem, pieczeniem i rumieniem. Ponadto, czasami na początku leczenia obserwowano zwiększenie ilości wydzieliny z szyjki macicy i upławy.

W rzadkich przypadkach mogą wystąpić migrenowe bóle głowy i bardzo rzadko kurcze nóg lub uczucie „ciężkich nóg”.

4.9 Przedawkowanie

Tkliwość i bolesność piersi, upławy, obrzęki, zwiększenie masy ciała, krwawienie z pochwy lub macicy (łyżeczkowanie diagnostyczne!), nudności i wymioty mogą być objawami przedawkowania, które może być zwalczane poprzez zmniejszenie dawki lub przerwanie leczenia.

Bardziej nasilone objawy niepożądane nie są znane nawet w przypadku zwiększania podawanych miejscowo dawek estriolu.

W przypadku zażycia przez dzieci produktów zawierających estriol w większych dawkach, nie należy oczekiwać wystąpienia ciężkiego zatrucia. Mogą wystąpić nudności i zaburzenia żołądkowo-jelitowe.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Estrogeny naturalne i półsyntetyczne, produkty proste.

Kod ATC: G03CA04

Estriol jest głównym metabolitem estradiolu i estronu i jest produkowany głównie w wątrobie. W przeciwieństwie do innych estrogenów, estriol wiąże się słabo ze specyficznymi receptorami wrażliwych na estrogen organów docelowych. Po przedostaniu się do jądra komórkowego, indukuje on syntezę określonych białek.

Estriol promuje fizjologiczną powrót do normy nabłonka sromu, jak również proliferację warstw błony śluzowej pochwy, szyjki, cewki moczowej i pęcherza poprzez zwiększenie ukrwienia i przepływu krwi. Atrofia i zaburzenia czynnościowe tych narządów (np. po usunięciu jajników lub podczas okresu pomenopauzalnego) spowodowane niedoborami estrogenów, są w większości odwracane poprzez doustne lub dopochwowe podawanie estriolu. Wpływ na błonę śluzową pochwy powoduje wtórne zwiększenie magazynowania glikogenu i kolonizację bakterii Döderleina, jak również normalizację wartości pH. Zwiększa się wydzielanie śluzu.

Z drugiej strony, podawany dopochwowo estriol w dawkach terapeutycznych nie wykazuje żadnego znaczącego wpływu na endometrium. Nawet w większych dawkach nie powoduje on, lub powoduje jedynie słabe działanie proliferacyjne, czego

konsekwencją jest bardzo małe prawdopodobieństwo wystąpienia działania niepożądanego w postaci krwawienia.

Estriol nie wywiera wpływu na inne hormony lub metabolizm wątrobowy. Tak więc normalna dawka lecznicza nie zmienia syntezy białek, metabolizmu lipidów czy krzepnięcia krwi. Estriol nie jest odpowiedni do leczenia osteoporozy czy arteriosklerozy.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu dopochwowym około 20% dawki estriolu jest wchłaniane w formie niezmienionej do krwioobiegu i może powodować działania ogólne. Dawka 0,5 mg estriolu zapewnia stężenia we krwi w granicach od 50 do 150 pg/ml (maksymalne stężenie po podaniu dawki pojedynczej po około 2 godzinach, spadek po około 10-12 godzinach). Są one porównywalne ze stężeniami obserwowanymi po podaniu doustnym dawek dziesięciokrotnie większych. W przypadku powtarzającego się podawania, osiągane jest mniej lub bardziej stałe stężenie we krwi, będące wciąż w granicach wartości cyklu fizjologicznego.

8% wchłoniętego estriolu jest dostępne w formie niezwiązanej, a około 91% jest związane z albuminami. Metabolizm wątrobowy prowadzi głównie do tworzenia nieaktywnych glukuronidów i siarczanów, które są szybko wydalone poprzez nerki. Pozostałe formy związane docierają do jelit poprzez żółć bez istotnej reabsorpcji wolnego estriolu do krwi.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

W badaniach na zwierzętach nie wykazano działań toksycznych po podaniu miejscowym i doustnym.

Po implantacji podskórnej dużych dawek estriolu, zwiększa się częstość występowania nowotworów nerek u chomików i nowotworów gruczołów sutkowych u myszy.

Nie obserwowano działania mutagennego.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Chlorek dekwaliniowy, olejek zapachowy (Sport PH-Y), dokuzynian sodowy, glikol propylenowy, dimetikon 350, monostearynian glicerydu samoemulgujący, triglicerydy nasyconych kwasów tłuszczowych średniej długości łańcuchowej, Softisan 601 składający się z 80-90% estrów mono, -di, -tri glicerydu z nasyconymi kwasami tłuszczowymi (C8-C18) i 10-20% eteru cetostearylowego makrogolu, woda oczyszczona.

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

5 lat

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Tuba aluminiowa

Opakowanie zawiera 25 g kremu dopochwowego i aplikator.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania <i przygotowania produktu leczniczego do stosowania>

Brak specjalnych wymagań

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Dr. Kade

Pharmazeutische Fabrik GmbH

Rigistraße 2

12277 Berlin, Niemcy

8. NUMER(Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

4470

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE/ DATA PRZEDŁUŻENIA

19.10.1999, 02.11.2005, 28.11.2008

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO