

REZUMATUL CARACTERISTICILOR MEDICAMENTULUI

1. DENUMIREA COMERCIALĂ A MEDICAMENTULUI

Ultraproct unguent rectal

2. COMPOZIȚIA CALITATIVĂ ȘI CANTITATIVĂ

Un gram unguent rectal conține pivalat de fluocortolonă 0,918 mg, caproat de fluocortolonă 0,945 mg și clorhidrat de cincocaină 5 mg.

Pentru lista tuturor excipienților, vezi pct. 6.1.

3. FORMA FARMACEUTICĂ

Unguent rectal

Unguent transparent, incolor până la ușor gălbui

4. DATE CLINICE

4.1 Indicații terapeutice

Tratament de scurtă durată în caz de hemoroizi interni sau externi, fisuri anale superficiale sau proctite.

4.2 Doze și mod de administrare

Ultraproct unguent rectal se va utiliza după efectuarea atentă a toaletei locale, de preferință după defecație.

Doza recomandată este de două aplicații pe zi. Dacă simptomele sunt severe, doza recomandată în prima zi de tratament este de până la patru aplicații pe zi. Hemoroizii proeminenți ar trebui să fie acoperiți bine cu unguent și dacă este posibil să se efectueze reintroducerea lor prin presare cu degetul.

Înainte să aplicați unguentul în interiorul anusului, aplicatorul din cutie trebuie să fie fixat pe tub (pentru informații referitoare la aplicarea și curățarea aplicatorului, vezi pct. 6.6).

În general ameliorarea simptomelor este rapidă, însă nu trebuie să determine întreruperea precoce a tratamentului. Pentru a evita apariția recidivelor, tratamentul trebuie continuat cel puțin o săptămână, cu administrare mai puțin frecventă (o aplicare pe zi), chiar și după dispariția simptomelor. Cu toate acestea, durata tratamentului nu trebuie să depășească 4 săptămâni.

4.3 Contraindicații

Utilizarea în zona de tratament a unor infecții bacteriene, virale, tuberculoase sau fungice.
Hipersensibilitate la substanțele active sau la oricare dintre excipienții enumerați la pct. 6.1.

4.4 Atenționări și precauții speciale pentru utilizare

Dacă simptomele nu se ameliorează rapid, tratamentul trebuie întrerupt și trebuie efectuat un examen proctologic.

În caz de infecții bacteriene sau micotice concomitente este necesar un tratament antiinfecțios specific. S-au raportat câteva cazuri în literatură de dezvoltare a cataractei la pacienții care au utilizat corticosteroizi sistemici, pentru perioade prelungite de timp.

4.5 Interacțiuni cu alte medicamente și alte forme de interacțiune

Nu se cunosc.

4.6 Fertilitatea, sarcina și alăptarea

Studiile la animale efectuate cu glucocorticoizi au evidențiat toxicitate asupra funcției de reproducere (vezi pct. 5.3).

Unele studii epidemiologice au sugerat că există posibilitatea creșterii riscului de cheiloschizis la nou-născuții ai căror mame au fost tratate cu glucocorticoizi sistemici în primul trimestru de sarcină. Cheiloschizisul este o malformație rară și dacă administrarea de glucocorticoizi sistemici este teratogenă, acestea pot justifica creșterea doar pentru 1 sau 2 cazuri per 1000 femei tratate în timpul sarcinii. Datele cu privire la utilizarea de glucocorticoizi sistemici în timpul sarcinii sunt insuficiente, însă un risc scăzut poate fi așteptat deoarece biodisponibilitatea sistemică a glucocorticoizilor administrați topic este foarte mică.

Ca o regulă generală, medicamentele topice conținând glucocorticoizi nu trebuie administrate în primele trei luni de sarcină. Recomandarea tratamentului cu Ultraproct, precum și raportul beneficiu terapeutic matern/risc potențial fetal trebuie atent reevaluat la femeile gravide și la cele care alăptează. În mod deosebit, utilizarea de lungă durată trebuie evitată.

Excreția unei cantități semnificative de glucocorticoizi în laptele matern este puțin probabilă.

4.7 Efecte asupra capacității de a conduce vehicule și de a folosi utilaje

Ultraproct unguent rectal nu are nicio influență asupra capacității de a conduce vehicule și de a folosi utilaje.

4.8 Reacții adverse

Dacă Ultraproct unguent rectal este utilizat timp îndelungat, nu poate fi exclusă apariția unor simptome locale (de exemplu atrofia tegumentului).

În cazuri rare pot apărea reacții alergice cutanate.

Raportarea reacțiilor adverse suspectate

Raportarea reacțiilor adverse suspectate după autorizarea medicamentului este importantă. Acest lucru permite monitorizarea continuă a raportului beneficiu/risc al medicamentului. Profesioniștii din domeniul sănătății sunt rugați să raporteze orice reacție adversă suspectată prin intermediul sistemului național de raportare, ale cărui detalii sunt publicate pe web-site-ul Agenției Naționale a Medicamentului și a Dispozitivelor Medicale <http://www.anm.ro>.

4.9 Supradozaj

Conform rezultatelor studiilor de toxicitate acută efectuate cu esteri de fluocortolonă și clorhidrat de cincocaină, nu este de așteptat un risc de toxicitate acută după administrarea în doză unică, rectală sau perianală de Ultraproct unguent rectal, chiar și în caz de supradozaj accidental. După ingestia orală accidentală a câtorva grame de Ultraproct unguent rectal, principalele efecte sistemice ale clorhidratului de cincocaină care sunt de așteptat să apară, în funcție de doză, se pot manifesta ele

însele ca efecte cardiovasculare severe (deprimarea funcției cardiace până la stop cardiac) și simptome ale SNC (convulsii, deprimare respiratorie până la stop respirator).

5. PROPRIETĂȚI FARMACOLOGICE

5.1 Proprietăți farmacodinamice

Grupa farmacoterapeutică: antihemoroidale pentru utilizare locală, preparate conținând corticosteroizi, codul ATC: C05AA08.

Fluocortolona exercită un efect antiinflamator, antialergic și antipruriginos. Diminuează dilatația capilară, edemul intercelular și infiltrarea țesuturilor; inhibă proliferarea capilară.

Deoarece Ultraproct unguent rectal conține 2 esteri ai fluocortolonei, care încep să-și exercite principalele efecte la intervale de timp diferite, rezultă un efect rapid și de lungă durată (acțiune bifazică).

Ca anestezic local, cincocaina ameliorează durerea.

5.2 Proprietăți farmacocinetice

Datorită lipofiliei și a greutatei moleculare diferite, pivalatul de fluocortolonă și caproatul de fluocortolonă difuzează diferit la locul inflamației, rezultând pe de o parte o acțiune rapidă și, pe de altă parte, o acțiune de lungă durată.

S-a constatat că după administrarea topică de Ultraproct unguent rectal, cei doi esteri sunt hidrolizați la fluocortolonă liberă și acizii corespunzători, la nivel cutanat perianal sau al mucoasei rectale.

Nu sunt disponibile studii cu privire la gradul de biodisponibilitate sistemică după administrare rectală de Ultraproct unguent rectal. Studiile efectuate cu preparate cu o compoziție asemănătoare au arătat că mai puțin de 15% din doza de pivalat de fluocortolonă este absorbită rectal.

După absorbție, fluocortolona este transformată în metaboliți la nivel hepatic, majoritatea acestora fiind excretați prin urină.

Similar glucocorticoizilor, cincocaina exercită un efect analgezic local. Atingerea concentrațiilor plasmatică ale cincocainei la care se obține efectul analgezic nu este o condiție necesară. Deoarece nu sunt disponibile studii de absorbție, evaluarea riscului a fost efectuată luând în considerare o absorbție completă. În cazul celei mai slabe absorbții, doza de cincocaină absorbită este prea mică pentru a determina reacții adverse atunci când Ultraproct unguent rectal este utilizat conform instrucțiunilor.

După absorbție, cincocaina este transformată într-un număr de metaboliți. În primul rând, reacțiile de metabolizare sunt di-etilarea oxidativă a funcției di-etilamino, hidroxilarea și degradarea oxidativă a lanțului butiloxi- și formarea suplimentară de metaboliți polari neidentificați.

Chiar și în cazul unei absorbții complete, efectele sistemice pot fi evitate când sunt utilizate doze mici de medicament.

5.3 Date preclinice de siguranță

În studiile de toleranță sistemică după administrarea repetată de esteri fluocortolonici și clorhidrat de cincocaină, conținute de Ultraproct unguent rectal, nu s-a constatat că ar putea fi prohibitivă utilizarea prescriptivă a acestui medicament.

Semnele de intoleranță, au fost documentate în general pentru anesteziile locale. Nu este de așteptat ca din cauza cantităților mici de clorhidrat de cincocaină administrată topic să apară semne de intoleranță.

Studiile de embriotoxicitate efectuate cu fluocortolonă au determinat rezultate tipice pentru glucocorticoizi, cum ar fi efecte embrioretale și/sau teratogene induse datorită unor sisteme de testare adecvate. Astfel, luând în considerare aceste rezultate, se recomandă atenție deosebită atunci când se prescrie Ultraproct unguent rectal în timpul sarcinii. (vezi pct. 4.6).

Nu sunt disponibile date din studii non-clinice și nici date epidemiologice care să evalueze potențialul teratogen al clorhidratului de cincocaină. Cu toate acestea, în analogie cu structura și efectul anestezic local al clasei amidelor, nu sunt de așteptat efecte embriotoxice la om, după utilizarea topică de doze terapeutice. Clorhidratul de cincocaină nu este considerat genotoxic, pe baza rezultatelor obținute la testele de mutagenitate bacteriană sau pe celule de mamifere, efectuate *in vivo* și *in vitro*.

Investigarea fluocortolonei într-o baterie de teste bacteriene privind detectarea efectelor mutagene, nu a evidențiat potențial genotoxic. Având în vedere că nu există evidențe relevante ale efectelor mutagene a oricărei substanțe din categoria glucocorticoizilor. Astfel de efecte nu sunt de așteptat nici de la esterii fluocortolonei. Investigațiile privind efectele mutagene ale clorhidratului de cincocaină la bacterii sau la celulele de mamifere, nu au evidențiat potențial genotoxic.

Nu au fost efectuate teste specifice de carcinogenitate pentru fluocortolonă și cincocaină. Pe baza cunoștințelor privind structura, mecanismul efectului farmacologic și rezultatele studiilor de toxicitate sistemică după administrări repetate, nu există evidențe privind potențialul carcinogen.

La câine, nu au fost observate reacții de intoleranță locală după administrări rectale repetate. După mulți ani de utilizarea terapeutică a Ultraproct unguent rectal la om nu au fost evidențiate efecte locale nedorite demne de menționat. Sporadic, au fost raportate efecte secundare în principal din cauza suspiciunii de alergie de contact.

6. PROPRIETĂȚI FARMACEUTICE

6.1 Lista excipienților

Octildodecanol
Ulei de ricin
Ulei de ricin hidrogenat
Monoricinoleat de macrogol 400
Ulei de citrice și trandafiri

6.2 Incompatibilități

Nu este cazul.

6.3 Perioada de valabilitate

2 ani

6.4 Precauții speciale pentru păstrare

A se păstra la temperaturi sub 25°C, în ambalajul original.

6.5 Natura și conținutul ambalajului

Cutie cu un tub din aluminiu a 15 g unguent rectal și o canulă rectală din PEJD prevăzută cu capac de protecție

Cutie cu un tub din aluminiu a 30 g unguent rectal și o canulă rectală din PEJD prevăzută cu capac de protecție

6.6 Precauții speciale pentru eliminarea reziduurilor

Fără cerințe speciale.

Folosirea aplicatorului:

Nu folosiți aplicatorul dacă este deteriorat. Înșurubați complet aplicatorul pe tub. După fiecare aplicare, ștergeți exteriorul aplicatorului cu un șervețel de hârtie, apoi îndepărtați produsul rămas în interiorul aplicatorului cu ajutorul unui bețișor cu vată și ștergeți-l din nou cu un șervețel de hârtie. Clătiți aplicatorul cu apă caldă pentru aproximativ 1 minut și uscați exteriorul aplicatorului cu un șervețel de hârtie.

7. DEȚINĂTORUL AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

KARO PHARMA AB

Box 16184, 103 24, Stockholm, Suedia

8. NUMĂRUL(ELE) AUTORIZAȚIEI DE PUNERE PE PIAȚĂ

1411/2009/01

1411/2009/02

9. DATA PRIMEI AUTORIZĂRI SAU A REÎNNOIRII AUTORIZAȚIEI

Reînnoirea autorizației – Februarie 2009

10. DATA REVIZUIRII TEXTULUI

Septembrie, 2020