

ІНСТРУКЦІЯ ДЛЯ МЕДИЧНОГО ЗАСТОСУВАННЯ ЛІКАРСЬКОГО ЗАСОБУ

ЗАТВЕРДЖЕНО

Наказ Міністерства охорони

здоров'я України

12.05.2017 № 509

Регістраційне посвідчення

№ UA/7011/01/01

Склад:

діюча речовина: 1 г крему містить кислоти азелаїнової у перерахуванні на 100 % суху речовину 200 мг;

допоміжні речовини: кислота бензойна (Е 210), гліцерол моностеарат 40-55, макрогону стеарат, «CUTINA CBS», октилдодеканол, пропіленгліколь, гліцерин, вода очищена.

Лікарська форма. Крем.

Основні фізико-хімічні властивості: білий непрозорий крем.

Фармакотерапевтична група. Місцеві засоби для лікування акне.

Код АТХ D10A X03.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Азелаїнова кислота, діюча речовина Акнестоп, являє собою прямоланцюгову дикарбонову кислоту, наявну в природі, що позбавлена токсичності, тератогенності та мутагенності.

Вважається, що терапевтичну ефективність крему Акнестоп при лікуванні акне зумовлюють його антимікробна дія та безпосередній вплив на фолікулярний гіперкератоз.

Клінічно спостерігається значне зниження щільності колонізації *Propionibacterium acnes* і суттєве зменшення фракції вільних жирних кислот у ліпідах поверхні шкіри.

Азелаїнова кислота *in vitro* і *in vivo* інгібує проліферацію кератиноцитів та нормалізує порушення процесів термінального диференціювання епідермісу при утворенні акне. У моделі вуха кролика азелаїнова кислота прискорює комедолізис тетрадекан-індукованих комедонів. При концентрації 0,31–2,5 % проявляється біоцидна дія після тривалого контакту протягом 30–120 хвилин проти грампозитивних та грамнегативних аеробних бактерій, анаеробних бактерій та грибів.

Дослідження *in vitro* не продемонстрували наявності мутантних форм, стійких до азелаїнової кислоти, ні у *Staphylococcus epidermidis*, ні у *Propionibacterium acnes*.

Фармакокінетика.

Після нанесення крему азелаїнова кислота проникає в усі шари шкіри людини. Проникнення відбувається з більшою швидкістю через уражену

 **АКНЕСТОП** ACNESTOP

шкіру, ніж через неушкоджену шкіру. Після одноразового нанесення на поверхню шкіри 1 г азелаїнової кислоти (5 г крему) підшкірно адсорбується 3,6 % нанесеної дози.

Частина азелаїнової кислоти, адсорбованої через шкіру, екскретується з сечею у незмінному вигляді. Інша частина розпадається шляхом β-окиснення на дикарбонові кислоти з коротшою довжиною ланцюга (C7, C5), що також були виявлені у сечі.

Дослідження системної переносимості після повторного перорального та зовнішнього застосування азелаїнової кислоти не виявили жодних ознак того, що навіть в екстремальних умовах, наприклад, при нанесенні на велику площу та/або при оклюзії можна очікувати розвиток побічних ефектів.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування акне (вугрів звичайних), що характеризується наявністю комедонів, папул, пустул і маленьких вузликів.

Протипоказання.

Гіперчутливість до діючої речовини або до будь-якої з допоміжних речовин лікарського засобу.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Дослідження взаємодії не проводили.

Під час контрольованих клінічних досліджень взаємодії з лікарськими засобами не спостерігалося. Азелаїнова кислота хімічно несумісна з лугами, сильними окислювачами і відновниками.

Склад крему не дозволяє очікувати будь-яких небажаних взаємодій окремих компонентів, які могли б негативно вплинути на безпеку препарату.

Особливості застосування.

Винятково для зовнішнього застосування. Не допускати потрапляння крему в очі, ротovu порожнину або на слизові оболонки. Якщо препарат потрапив в очі, ротovu порожнину або на слизові оболонки, слід негайно промити їх великою кількістю води. Якщо подразнення очей триває, рекомендується звернутися до лікаря. Після кожного нанесення крему слід вимити руки.

Супутнє застосування косметичних продуктів, спиртвих або агресивних миючих засобів, настоянок, в'яжучих або абразивних речовин або відлущувальних засобів слід обмежити під час лікування, наскільки це можливо.

Бензойна кислота може спричиняти помірне подразнення шкіри, очей та слизових оболонок. Пропіленгліколь також може спричиняти подразнення шкіри.

У рідкісних випадках під час постреєстраційного нагляду повідомлялося про загострення бронхіальної астми у пацієнтів, які отримували азелаїнову кислоту.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність.

Не проводилося належних і добре контрольованих досліджень препаратів азелаїнової кислоти для зовнішнього застосування з участю вагітних жінок.

Дослідження на тваринах не вказують на прямий або непрямий шкідливий вплив на перебіг вагітності, розвиток ембріона/плода, пологи або постнатальний розвиток.

Вагітним жінкам слід з обережністю застосовувати препарат.

Годування груддю.

Невідомо, чи секретується азелаїнова кислота у грудне молоко *in vivo*. Однак експеримент *in vitro* продемонстрував, що може мати місце потрапляння діючої речовини у грудне молоко. Як очікується, розподіл азелаїнової кислоти у грудному молоці не може призвести до значних змін відносно її базового рівня, оскільки вона не концентрується у грудному молоці та менше 4 % топічно нанесеної азелаїнової кислоти всмоктується системно (не збільшуючи при цьому ендогенну експозицію вказаної речовини вище фізіологічного рівня). Однак жінкам, які годують груддю, слід з обережністю застосовувати препарат.

Слід уникати контактів немовляти зі шкірою/груддю, обробленою препаратом.

Здатність впливати на швидкість реакції при керуванні автотранспортом або іншими механізмами. Не впливає.

Спосіб застосування та дози.

Крем Акнестоп 2 рази на добу (вранці та ввечері) наносити на уражені ділянки шкіри і м'яко втирати. Приблизно 0,5 г = 2,5 см крему достатньо для всієї поверхні обличчя. Перед застосуванням крему Акнестоп шкіру слід ретельно промити водою та висушити. Також можна використати м'який косметичний очищувальний засіб.

Важливим є регулярне застосування крему Акнестоп протягом усього курсу лікування.

Тривалість курсу лікування може змінюватися залежно від індивідуального перебігу захворювання і визначається ступенем його вираженості. У пацієнтів з акне відсутнє покращення спостерігається, як правило, приблизно через 4 тижні. Однак для досягнення оптимального результату рекомендується застосовувати препарат Акнестоп безперервно протягом кількох місяців. Існує клінічний досвід безперервного застосування препарату азелаїнової кислоти місцевої дії упродовж періоду до 1 року.

У випадку надмірного подразнення шкіри (див. розділ «Побічні реакції») слід зменшити кількість крему для нанесення або частоту застосування

крему Акнестоп до 1 разу на добу аж до зникнення подразнення. При необхідності терапію можна тимчасово перервати на кілька днів. Після короткого періоду лікування без помітних результатів необхідна повторна медична оцінка.

Діти. Застосовувати підліткам віком від 12 років. Немає необхідності у корекції дози при призначенні крему Акнестоп підліткам віком від 12 років. Безпека та ефективність застосування крему Акнестоп дітям віком до 12 років не встановлена.

Передозування.

Результати досліджень гострої токсичності не вказують на існування будь-якого ризику виникнення гострої інтоксикації при одноразовому передозуванні (нанесенні крему на велику поверхню шкіри за умов, сприятливих для адсорбції) або при ненавмисному прийомі всередину.

Побічні реакції.

Частоту побічних реакцій визначали згідно з MedDRA: дуже часто ($\geq 1/10$); часто (від $\geq 1/100$ до $< 1/10$); нечасто (від $\geq 1/1000$ до $< 1/100$); рідко (від $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$); дуже рідко ($< 1/10000$), частота невідома (не може бути оцінена на підставі наявних даних).

Порушення з боку шкіри та підшкірної клітковини: нечасто — себорея, акне, депігментація шкіри; рідко — хейліт (запалення губ), висипання.

Місцеві розлади: дуже часто — печіння, свербіж та еритема; часто — лущення, біль, сухість, зміна кольору шкіри та подразнення у місці застосування; нечасто — парестезії, дерматит, дискомфорт та набряк у місці застосування; поодинокі — кропив'янка, виразка у місці нанесення; рідко — везикули, екзема, відчуття тепла та виразка у місці застосування. Зазвичай місцеві подразнення шкіри минають під час лікування.

Розлади з боку імунної системи: рідко — гіперчутливість.

Зафіксовані випадки загострення симптомів бронхіальної астми у пацієнтів, які застосовували азелаїнову кислоту (частота невідома).

При виникненні будь-яких небажаних ефектів, у т.ч. не зазначених у цій інструкції, слід повідомити лікаря.

Місцева переносимість препарату у дітей віком від 12 років подібна до переносимості у дорослих пацієнтів.

Термін придатності. 2 роки.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С. Не заморожувати. Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 30 г у тубах, 1 туба в паці.

Категорія відпуску. Без рецепта.

Виробник. ПАТ «Київмедпрепарат».

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

Україна, 01032, м. Київ, вул. Саксаганського, 139

Дата останнього перегляду. 12.05.2017.