

ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ОПАТАНОЛ®

(OPATANOL®)

Склад:

діюча речовина: олопатадин;

1 мл розчину містить олопатадину 1 мг (у вигляді гідрохлориду);

допоміжні речовини: бензалконію хлорид, натрію хлорид, натрію гідрофосфат додекагідрат, кислота хлористоводнева та/або натрію гідроксид (для регулювання рН), вода очищена.

Лікарська форма. Краплі очні.

Основні фізико-хімічні властивості: стерильний прозорий розчин від безбарвного до світло- жовтого кольору.

Фармакотерапевтична група.

Засоби для застосування в офтальмології. Протинабрякові та антиалергічні засоби.

Код АТХ S01G X09.

Фармакологічні властивості.

Фармакодинаміка.

Олопатадин є сильнодіючим селективним протиалергічним/антигістамінним засобом, що має декілька виражених механізмів дії. Він протидіє вивільненню гістаміну (основного медіатора алергічної реакції у людей) та запобігає стимулюванню продукування цитокінів епітеліальними клітинами кон'юнктиви людини, яке зумовлене гістаміном. Дані досліджень *in vitro* свідчать, що препарат діє на опасисті клітини кон'юнктиви людини, пригнічуючи вивільнення медіаторів запалення. Відзначалося, що місцеве офтальмологічне застосування препарату ОПАТАНОЛ® у пацієнтів зі збереженою прохідністю носослізного каналу зменшує назальні ознаки та симптоми, які часто супроводжують сезонний алергічний кон'юнктивіт. Препарат не спричиняє клінічно значущих змін діаметра зіниці.

Доклінічні дані, отримані при проведенні стандартних досліджень з безпеки, фармакології, токсичності повторних доз, генотоксичності, досліджень канцерогенного потенціалу та токсичного впливу на репродуктивну функцію, не показали будь-якої небезпеки для людини.

Дослідження на тваринах показали затримку розвитку цуценят при їх грудному вигодовуванні самками, які отримували системні дози олопатадину в дозах, що перевищувала максимальну рекомендовану для офтальмологічного застосування людині. Олопатадин виявлявся в молоці годуючих щурів після перорального застосування.

Фармакокінетика.

Олопатадин абсорбується системно, як і інші лікарські засоби для місцевого застосування. Однак при місцевому застосуванні олопатадину системна абсорбція є мінімальною, а концентрація у плазмі крові — в межах нижче рівня кількісного визначення ($< 0,5$ нг/мл) до 1,3 нг/мл. Ці концентрації в 50–200 разів нижчі, ніж при пероральному застосуванні препарату у дозах, що добре переносяться.

Дослідження з фармакокінетики при пероральному застосуванні показали, що період напіввиведення олопатадину з плазми крові приблизно становить 8–12 годин, препарат виводиться переважно нирками. Приблизно 60–70 % дози було виявлено в сечі у вигляді активної речовини. Два метаболіти моно-десметил та N-оксид були виявлені у сечі у низьких концентраціях.

Оскільки олопатадин виводиться з сечею, головним чином у вигляді незміненої активної речовини, фармакокінетика олопатадину змінюється при порушеннях функції нирок, пікові концентрації у плазмі крові у пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю (середній кліренс креатиніну – 13 мл/хв) у 2–3 рази вищі порівняно з такими у здорових дорослих добровольців. При проведенні гемодіалізу пацієнтам після перорального прийому препарату у дозі 10 мг концентрація олопатадину у плазмі крові була значно менша у день проведення гемодіалізу, ніж у день, коли він не проводився, що дає підставу припустити, що виведення олопатадину відбулося у процесі гемодіалізу.

У порівняльних дослідженнях з фармакокінетики при пероральному прийомі дози 10 мг молодими особами (середній вік – 21 рік) та особами літнього віку (середній вік – 74 роки) будь-якої істотної різниці між концентраціями у плазмі, зв'язуванням з білком, виведенням з сечею незміненої лікарської речовини та метаболітів не виявлено.

Були проведені дослідження олопатадину при пероральному застосуванні пацієнтам з тяжкою нирковою недостатністю. Результати свідчать, що у цієї категорії пацієнтів можна очікувати деякою мірою вищу концентрацію у плазмі при застосуванні препарату ОПАТАНОЛ®. Оскільки концентрації у плазмі після місцевого офтальмологічного застосування олопатадину в 50–200 разів нижчі, ніж при пероральному застосуванні препарату у дозах, що добре переносяться, немає необхідності коригувати дозування для людей літнього віку та пацієнтів з порушеннями функції нирок. Метаболізм у печінці не є головним шляхом елімінації препарату. Тому немає необхідності в корекції дозування для пацієнтів з порушеннями функції печінки.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування сезонних алергічних кон'юнктивітів.

Протипоказання.

Підвищена чутливість до олопатадину або до будь-якої допоміжної речовини препарату.

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Досліджень взаємодії препарату ОПАТАНОЛ® з іншими лікарськими засобами не проводили.

Дослідження *in vitro* показали, що олопатадин не пригнічує метаболічні реакції ізоферментів 1A2, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 та 3A4 цитохрому P450. Ці результати свідчать про те, що олопатадин не спричиняє метаболічної взаємодії з іншими активними речовинами у разі їх супутнього застосування.

Особливості застосування.

ОПАТАНОЛ® є протиалергічним/антигістамінним засобом, що застосовується місцево, але абсорбується системно. При будь-яких ознаках серйозних реакцій або підвищеній чутливості слід припинити застосування препарату.

ОПАТАНОЛ® містить бензалконію хлорид, який може спричинити подразнення ока.

Повідомлялося також, що бензалконію хлорид може спричинити точкову кератопатію та/або токсичну виразкову кератопатію. Слід уважно спостерігати за пацієнтами з синдромом сухого ока або ушкодженнями рогівки, які часто або впродовж тривалого часу використовують препарат.

Контактні лінзи

Бензалконію хлорид, як відомо, може знебарвлювати контактні лінзи. Слід уникати контакту з м'якими контактними лінзами. Пацієнтів слід проінформувати про те, що перед застосуванням препарату необхідно зняти контактні лінзи та зачекати щонайменше 15 хвилин після закапування і лише тоді знову одягнути контактні лінзи.

Застосування у період вагітності або годування груддю.

Вагітність

Дані щодо офтальмологічного застосування олопатадину вагітним жінкам відсутні або їх кількість обмежена. Дослідження на тваринах виявили репродуктивну токсичність після системного застосування (див. розділ «Фармакологічні властивості»). Олопатадин

не рекомендується застосовувати вагітним та жінкам репродуктивного віку, які не застосовують контрацептивні засоби.

Годування груддю

Дослідження на тваринах показали, що олопатадин проникає у грудне молоко після перорального застосування (детально див. «Фармакологічні властивості»). Не можна виключати ризик для новонароджених/дітей грудного віку. ОПАТАНОЛ® не слід застосовувати у період годування груддю.

Репродуктивна функція

Досліджень впливу олопатадину на репродуктивну функцію людини після місцевого офтальмологічного застосування не проводили.

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

ОПАТАНОЛ® не має або має незначний вплив на здатність керувати автотранспортом та іншими механізмами. Як і при застосуванні будь-яких очних крапель, тимчасове затуманення зору або інші порушення зору можуть впливати на здатність керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами. Якщо затуманення зору виникає під час закапування, пацієнту необхідно зачекати, поки зір проясниться, перш ніж керувати автотранспортом або працювати з іншими механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Тільки для офтальмологічного застосування.

У кон'юнктивальний мішок ураженого ока (очей) слід закапувати по 1 краплі препарату ОПАТАНОЛ® два рази на добу (з інтервалом у 8 годин). У разі необхідності лікування може тривати до 4-х місяців.

Застосування пацієнтам літнього віку.

Немає необхідності у коригуванні дозування для цієї категорії пацієнтів.

Застосування дітям та підліткам.

ОПАТАНОЛ® можна застосовувати у педіатричній практиці дітям віком від 3 років у тому ж дозуванні, що і дорослим. Безпека та ефективність застосування препарату ОПАТАНОЛ® дітям віком до 3 років не вивчена. Дані щодо цієї вікової категорії відсутні.

Застосування при порушеннях функції печінки та нирок.

Досліджень олопатадину у формі очних крапель (ОПАТАНОЛ®) пацієнтам із порушеннями

функції печінки або нирок не проводили. Однак немає необхідності в коригуванні дозування у разі порушень функції печінки або нирок (див. розділ «Фармакокінетика»).

Після першого відкриття флакона слід зняти захисне кільце, призначене для контролю першого відкриття.

Щоб попередити забруднення краю крапельниці та вмісту флакона, необхідно дотримуватись обережності та не торкатися повік, прилеглих ділянок або інших поверхонь краєм флакона-крапельниці. Після кожного використання слід щільно закривати флакон-крапельницю.

Якщо місцево застосовують більше ніж один офтальмологічний засіб, інтервал між їх застосуванням повинен становити не менше 5 хвилин. Очні мазі слід застосовувати в останню чергу.

-

Діти.

ОПАТАНОЛ® можна застосовувати дітям віком від 3 років у тому ж дозуванні, що і дорослим.

-

Передозування.

Немає даних про передозування у людини при випадковому або навмисному ковтанні. Олопатадин виявив низький рівень гострої токсичності у тварин. Випадкове проковтування вмісту всього флакона препарату ОПАТАНОЛ® призведе до максимальної системної дії 5 мг олопатадину. Ця дія може проявитися при кінцевій дозі 0,5 мг/мл у дитини з масою тіла 10 кг у разі 100 % абсорбції.

Збільшення інтервалу QT у собак спостерігалось тільки при дозах, які істотно перевищували максимальну дозу для людини, вказуючи на малоімовірність збільшення інтервалу QT при клінічному застосуванні. У дослідженні з участю 102 здорових добровольців, молодих чоловіків та жінок, людей літнього віку, які застосовували 5 мг препарату двічі на добу перорально протягом 2,5 дня, спостерігалось незначне збільшення інтервалу QT порівняно з відповідним показником при застосуванні плацебо. У цьому дослідженні встановлені рівні пікових концентрацій олопатадину у плазмі (від 35 до 127 нг/мл) щонайменше у 70 разів перевищували рівні при місцевому застосуванні олопатадину щодо впливу на серцеву реполяризацію.

У випадку передозування необхідно провести відповідне обстеження та лікування пацієнта.

-

Побічні реакції.

У ході клінічних досліджень з участю 1680 пацієнтів ОПАТАНОЛ® застосовували від 1 до 4 разів на день в обидва ока протягом чотирьох місяців як монотерапію або як додаткову терапію до лоратадину 10 мг. Побічні ефекти, пов'язані із застосуванням препарату ОПАТАНОЛ®, спостерігалися приблизно у 4,5 % пацієнтів; однак тільки 1,6 % з них було виключено з клінічних досліджень у зв'язку з виникненням цих побічних

ефектів. Під час проведення клінічних досліджень не було повідомлень про будь-які серйозні офтальмологічні або системні побічні дії, пов'язані із застосуванням препарату. Найчастішим побічним ефектом при застосуванні препарату ОПАТАНОЛ® був очний біль з частотою виникнення 0,7 %.

Нижченаведені побічні реакції відзначалися протягом клінічних досліджень і у постмаркетинговий період та класифіковані за частотою: дуже часто ($\geq 1/10$), часто ($> 1/100$, $< 1/10$), нечасто ($> 1/1000$, $\leq 1/100$), поодинокі ($> 1/10000$, $\leq 1/1000$), рідко ($\leq 1/10000$) або частота невідома (неможливо оцінити частоту їх виникнення з існуючих даних). У межах кожної групи побічні реакції представлено у порядку зменшення їхнього ступеня тяжкості.

Класи систем органів	Частота	Побічні реакції
Інфекції та інвазії	Нечасто	Риніт
З боку імунної системи	Частота невідома	Підвищена чутливість, припухлість обличчя
З боку нервової системи	Часто	Головний біль, дисгевзія
	Нечасто	Запаморочення, гіпестезія
	Частота невідома	Сонливість
Офтальмологічні порушення	Часто	Біль в оці, подразнення ока, сухість ока, аномальна чутливість очей
	Нечасто	Ерозія рогівки, ушкодження епітелію рогівки, порушення з боку епітелію рогівки, точковий кератит, кератит, забарвлення рогівки, виділення з ока, світлобоязнь, затуманення зору, зниження гостроти зору, блефароспазм, відчуття дискомфорту в оці, свербіж ока, кон'юнктивальні фолікули, порушення з боку кон'юнктиви, відчуття стороннього тіла в оці, посилена сльозотеча, еритема повік, набряк повік, порушення з боку повік, гіперемія ока
	Частота невідома	Набряк рогівки, набряк ока, припухлість ока, кон'юнктивіт, мідріаз, порушення зору, утворення лусочок по краях повік
З боку респіраторної системи, торакальні та медіастинальні порушення	Часто	Сухість у носі
	Частота невідома	Диспное, синусит
З боку шлунково-кишкового тракту	Частота невідома	Нудота, блювання
З боку шкіри та підшкірних тканин	Нечасто	Контактний дерматит, відчуття печіння на шкірі, сухість шкіри
	Частота невідома	Дерматит, еритема
Порушення загального характеру та стани, пов'язані з місцем введення	Часто	Підвищена втомлюваність
	Частота невідома	Астенія, нездужання

У пацієнтів зі значним ураженням рогівки дуже рідко повідомлялося про випадки кальцифікації рогівки при застосуванні очних крапель, що містять фосфати.

Надання повідомлень про підозрювані побічні реакції на зареєстрований лікарський засіб є дуже важливим. Це дає змогу продовжувати контролювати співвідношення користь/ризик для лікарського засобу. Медичних працівників просять повідомляти, згідно з чинним законодавством, про підозрювані побічні реакції на препарат, що виникли у пацієнта під час терапії.

Термін придатності. 3 роки.

Не використовувати більше 4 тижнів після першого відкриття флакона.

Умови зберігання.

Спеціальні умови зберігання препарату не передбачені. Зберігати у місцях, недоступних для дітей.

Упаковка. По 5 мл у флаконі-крапельниці, по 1 або 3 флакони-крапельниці в коробці з картону. Не всі види упаковок можуть бути представлені на ринку.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник.

1. Новартіс Мануфактурінг НВ/ Novartis Manufacturing NV.
2. Новартіс Фармасьютіка, С.А., Іспанія/ Novartis Farmaceutica, S.A., Spain.

Місцезнаходження виробника та його адреса місця провадження діяльності.

1. Рійксвег 14, Пуурс-Сінт-Амандс, 2870, Бельгія/ Rijksweg 14, Puurs-Sint-Amends, 2870, Belgium.
2. Гран Віа де лес Кортс Каталанес 764, Барселона, 08013, Іспанія/ Gran Via de les Corts Catalanes 764, Barcelona, 08013, Spain.