ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ОЛОПАТАДИН

Склад:

діюча речовина: олопатадин (olopatadine);

1 мл препарату містить олопатадину 1 мг;

допоміжні речовини: натрію хлорид, бензалконію хлорид, натрію гідрофосфат, натрію гідроксид або кислота хлористоводнева, вода для ін’єкцій.

Лікарська форма. Краплі очні, розчин.

Основні фізико-хімічні властивості: 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 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.

При проведенні стандартних досліджень з безпеки, фармакології, токсичності повторних доз, генотоксичності, досліджень канцерогенного потенціалу та токсичного впливу на репродуктивну функцію не виявлено будь-якої небезпеки для людини.

Була показана затримка розвитку цуценят при їх вигодовуванні самками, які отримували системні дози олопатадину в дозах, що перевищувала максимальну рекомендовану для

офтальмологічного застосування людині. Олопатадин виявляли у 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 — у межах нижче рівня кількісного визначення (< 0,5 нг/мл) до 1,3 нг/мл. Ці концентрації у 50–200 разів нижчі, ніж при пероральному застосуванні препарату у дозах, що добре переносяться.

Період напіввиведення олопатадину при пероральному застосуванні з плазми крові становить приблизно 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 із сечею, головним чином у вигляді незміненої активної речовини, фармакокінетика олопатадину змінюється при порушеннях функції нирок, пікові концентрації у плазмі крові у пацієнтів із тяжкою нирковою недостатністю (середній кліренс креатиніну – 13 мл/хв) у 2–3 рази вищі порівняно зі здоровими дорослими добровольцями. 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 його не проводили, що дає підставу припустити, що виведення олопатадину відбулося у процесі гемодіалізу.

При пероральному прийомі дози у 10 мг молодим людям та людям літнього віку будь-якої істотної різниці концентрації у плазмі крові, зв’язуванні з білком, виведенні з сечею незміненої лікарської речовини та метаболітів не виявлено.

При пероральному застосуванні пацієнтам із тяжкою нирковою недостатністю можна очікувати деякою мірою вищу концентрацію у плазмі крові при застосуванні препарату. Оскільки концентрації у плазмі після місцевого офтальмологічного застосування олопатадину у

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 у корекції дозування для пацієнтів із 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 щодо вивчення взаємодії препарату 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. Олопатадин не спричиняє метаболічної взаємодії з іншими активними речовинами у разі їх супутнього застосування.

Особливості застосування.

Препарат є протиалергічним/антигістамінним засобом, який слід застосовувати місцево, але він абсорбується системно. При будь-яких ознаках серйозних реакцій або підвищеній чутливості слід припинити застосування препарату.

Повідомляли 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. На тваринах була виявлена репродуктивна токсичність після системного застосування (див. розділ «Фармакологічні властивості»). Олопатадин не рекомендується застосовувати вагітним та жінкам репродуктивного віку, які не застосовують контрацептивні засоби.

Годування груддю

При пероральному застосуванні тваринами олопатадин проникав у молоко тварин (детально див. «Фармакологічні властивості»). Не можна виключати ризик для новонароджених/дітей грудного віку. Препарат не слід застосовувати у період годування груддю.

Репродуктивна функція

Досліджень щодо оцінки ефекту олопатадину на репродуктивну функцію людини після місцевого офтальмологічного застосування не проводили.

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

Препарат 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 механізмами.

Спосіб застосування та дози.

Тільки для офтальмологічного застосування.

У кон'юнктивальний мішок ураженого ока (очей) слід закапувати по 1 краплі препарату 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.

Можна застосовувати у педіатричній практиці дітям віком від 3 років у тому ж дозуванні, що і дорослим. Безпека та ефективність застосування препарату 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 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»).

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

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

Діти.

Препарат 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 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 спостерігалося тільки при дозах, які істотно перевищували максимальну дозу для людини, вказуючи на малоймовірність збільшення інтервалу QT при клінічному застосуванні. При застосуванні здоровим добровольцям, молодим людям, людям літнього віку 5 мг препарату двічі на добу перорально протягом 2,5 дня спостерігалося незначне збільшення інтервалу QT порівняно з плацебо. Рівні пікових концентрацій олопатадину у плазмі крові (від 35 до 127 нг/мг) 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 олопатадин застосовували від 1 до 4 разів на добу в обидва ока протягом чотирьох місяців як монотерапію або як додаткову терапію до лоратадину 10 мг. Побічні ефекти, пов’язані із застосуванням олопатадину, 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 олопатадину 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 (≥1/10), часто (>1/100, <1/10), нечасто (>1/1000, ≤1/100), поодинокі (>1/10000, ≤1/1000), рідко (≤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 повідомляли про випадки кальцифікації рогівки при застосуванні очних крапель, що містять фосфати.

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

Повідомлення про побічні реакції після реєстрації лікарського засобу має важливе значення. Це дає змогу проводити моніторинг співвідношення користь/ризик при застосуванні цього лікарського засобу. Медичним та фармацевтичним працівникам, а також пацієнтам або їх законним представникам слід повідомляти про усі випадки підозрюваних побічних реакцій та відсутності ефективності лікарського засобу через Автоматизовану інформаційну систему з фармаконагляду за посиланням: https://aisf.dec.gov.ua.

Термін придатності. 2 роки.

Термін придатності препарату після розкриття флакона - не більше 4 тижнів.

Умови зберігання. Зберігати в оригінальній упаковці при температурі не вище 25 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 5 мл у флаконі з кришкою-крапельницею у коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Виробник. Товариство з обмеженою відповідальністю «ФАРМЕКС ГРУП».

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Україна, 08301, Київська обл., м. Бориспіль, вул. Шевченка, буд. 100.