ІНСТРУКЦІЯ

для медичного застосування лікарського засобу

ОПАТАДИН ЕКО

(OPATADIN ECO)

Склад:

діюча речовина: olopatadine;

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

допоміжні речовини: натрію гідрофосфат, додекагідрат; натрію хлорид; полісорбат 80; кислота хлористоводнева розведена; вода для ін’єкцій.

Лікарська форма. Краплі очні, розчин.

Основні фізико-хімічні властивості: прозора безбарвна або майже безбарвна рідина.

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 ОПАТАДИН ЕКО 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 перевищували 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 становить приблизно 8−12 годин, препарат виводиться переважно нирками. Приблизно 60−70 % дози було виявлено в сечі у вигляді активної речовини. Два метаболіти, монодесметил та N-оксид, були виявлені у сечі у низьких концентраціях.

Оскільки олопатадин виводиться зі сечею, головним чином у вигляді незміненої активної речовини, фармакокінетика олопатадину змінюється при порушеннях функції нирок, максимальна концентрація у плазмі крові у пацієнтів з тяжкою нирковою недостатністю (середній кліренс креатиніну – 13 мл/хв) у 2−3 рази вища порівняно з такою у здорових дорослих добровольців. При проведенні гемодіалізу пацієнтам після перорального прийому препарату в 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 концентрацією у плазмі крові, зв’язуванням з білком, виведенням зі 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 крові при застосуванні препарату ОПАТАДИН ЕКО. Оскільки концентрація у плазмі крові після місцевого офтальмологічного застосування олопатадину в 50−200 разів нижча, ніж при пероральному застосуванні препарату у дозах, що добре переносяться, немає необхідності коригувати дозування для людей літнього віку та пацієнтів із порушеннями функції нирок. Метаболізм у печінці не є головним шляхом елімінації препарату. Тому немає необхідності в корекції дозування для пацієнтів із порушеннями функції печінки.

Клінічні характеристики.

Показання.

Лікування сезонного алергічного кон’юнктивіту.

Протипоказання.

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

Взаємодія з іншими лікарськими засобами та інші види взаємодій.

Досліджень взаємодії препарату ОПАТАДИН ЕКО 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.

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

Досліджень впливу лікарського засобу на контактні лінзи не проводили. Слід зняти контактні лінзи перед застосуванням препарату, знову одягти лінзи можна через 15 хвилин після застосування.

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 використовують контрацептивні засоби.

Період годування груддю

Дослідження на тваринах показали, що олопатадин проникає у грудне молоко після перорального застосування (див. розділ «Фармакологічні властивості»). Не можна виключати ризик для новонароджених/дітей грудного віку. Лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО 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.

Лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО не впливає 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 ОПАТАДИН ЕКО 2 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

Лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО можна застосовувати у педіатричній практиці дітям віком від 3 років у тому ж дозуванні, що і дорослим. Безпека та ефективність застосування препарату ОПАТАДИН ЕКО 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 (ОПАТАДИН ЕКО) 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.

Лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО є стерильним розчином, що не містить консервантів.

Перед застосуванням лікарського засобу:

- Перед першим застосуванням лікарського засобу слід спочатку попрактикуватися з використання флакона-крапельниці, повільно натискаючи його, щоб закапати одну краплю в око, не торкаючись його.

- Якщо пацієнт впевнений, що може закапати одну краплю, він повинен вибрати ту позицію, яку вважає найбільш комфортною (можна сісти, лежати на спині або стояти перед дзеркалом).

Застосування лікарського засобу:

1. Перед застосуванням препарату слід ретельно вимити руки.

2. Якщо упаковка або флакон пошкоджені, не застосовувати краплі.

3. Необхідно впевнитися, що герметичне кільце на кришці не пошкоджене. Перед першим

використанням відкрутити кришку: може відчуватися незначний опір під час розриву гарантійного кільця.

4. У разі пошкодження гарантійного кільця під час першого відкриття його слід зняти та викинути, щоб уникнути травмування.

5. Необхідно нахилити голову назад і обережно відтягнути нижню повіку, щоб утворився простір між очним яблуком і повікою. Слід уникати контакту між наконечником крапельниці та оком, повіками або пальцями.

6. Обережно натиснути на стінки флакона і дати краплі потрапити в око. Потрібно врахувати, що затримка між стисканням флакона і випаданням краплі може тривати кілька секунд. Не натискати надто сильно. Якщо пацієнт не знає, як вводити краплі, необхідно запитати лікаря, фармацевта або медсестру.

7. Якщо лікар призначив застосування лікарського засобу в кон'юнктивальний мішок іншого ока, необхідно повторити пункти 5-7.

8. Після використання та перед повторним використанням флакон необхідно струсити 1 раз, тримаючи флакон наконечником вниз, не торкаючись наконечника крапельниці, щоб видалити залишки розчину в наконечнику. Це необхідно для забезпечення доставки наступних крапель. Після закапування закрутити кришку на флаконі.

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.

Лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО 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 ОПАТАДИН ЕКО 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. У дослідженні з участю 102 здорових добровольців, молодих чоловіків та жінок, людей літнього віку, які застосовували 5 мг препарату 2 рази на добу перорально протягом 2,5 дня, спостерігалося незначне збільшення інтервалу QT порівняно з відповідним показником при застосуванні плацебо. У цьому дослідженні встановлений рівень максимальної концентрації олопатадину у плазмі крові (від 35 до 127 нг/мг) щонайменше у 70 разів перевищувала рівень при місцевому застосуванні олопатадину щодо впливу на серцеву реполяризацію.

У випадку передозування необхідно провести відповідне обстеження та лікування пацієнта.

-

Побічні реакції.

У процесі клінічних досліджень з участю 1680 пацієнтів лікарський засіб ОПАТАДИН ЕКО застосовували від 1 до 4 разів на день в обидва ока протягом 4-х місяців як монотерапію або як додаткову терапію до лоратадину 10 мг. Побічні реакції, пов’язані зі застосуванням препарату ОПАТАДИН ЕКО, спостерігалися приблизно у 4,5 % пацієнтів, однак тільки 1,6 % з них було виключено з клінічних досліджень у зв’язку з виникненням цих побічних реакцій. Під час проведення клінічних досліджень не було повідомлень про будь-які серйозні офтальмологічні або системні побічні дії, пов’язані зі застосуванням препарату. Найчастішим побічним ефектом при застосуванні препарату ОПАТАДИН ЕКО був очний біль із 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), рідко (>1/10000, ≤1/1000), дуже рідко (≤1/10000), 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
З боку органів зору	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.

Повідомлення про підозрювані побічні реакції

Повідомлення про підозрювані побічні реакції після реєстрації лікарського засобу відіграють важливу роль. Це дає змогу продовжувати спостереження за співвідношенням користі та ризику застосування лікарського засобу. Працівники галузі охорони здоров’я повинні повідомляти про будь-які підозрювані побічні реакції.

Термін придатності. 2 роки.

Термін придатності після першого відкриття – 90 днів.

Умови зберігання.

Зберігати при температурі не вище 30 °С.

Зберігати у недоступному для дітей місці.

Упаковка. По 5 мл розчину в поліетиленовому флаконі-крапельниці місткістю 5 мл із кришкою з гарантійним кільцем. По 1 або по 3 флакони з інструкцією для медичного застосування у картонній коробці.

Категорія відпуску. За рецептом.

Заявник.

Фармацевтичний завод “ПОЛЬФАРМА” С.А.

Pharmaceutical Works “POLPHARMA” S.A.

Місцезнаходження заявника та адреса місця провадження його діяльності.

вул. Пельплиньска 19, 83-200, Старогард Гданьски, Польща

19, Pelplinska Str., 83-200 Starogard Gdanski, Poland

Виробник.

Рафарм С.А.

Rafarm S.A.

Місцезнаходження виробника та адреса місця провадження його діяльності.

Тесі Пусі Хатзі Агіу Лука, Паяня, 190 02, Греція

Thesi Pousi Xatzi Agiou Louka, Paiania, 190 02, Greece