

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВНООПАЗАНАТО	
ДЪРЖАВЕН РЕГИСТЪР	
Регистрационен номер за употреба № 11-2903/08.08.03	
072/15.07.03	<i>Меню</i>

## КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

# OPATANOL®

1. **Име на лекарствения продукт**  
**OPATANOL® 1 mg/ml eye drops, solution**  
**ОПАТАНОЛ 1 mg/ml капки за очи, разтвор**

2. **Количествен и качествен състав**

Лекарствено вещество в 1 ml:

Olopatadine 1 mg (as Olopatadine hydrochloride 1.11 mg)

За помощните вещества, вж. 6.1

3. **Лекарствена форма**

Капки за очи, разтвор.

*Разтворът е прозрачен и безцветен.*

4. **Клинични данни**

4.1. **Терапевтични индикации**

За симптоматично лечение на **сезонни алергични конюнктивити**.

4.2. **Дозировка и начин на приложение**

Препоръчаната доза е една капка OPATANOL в конюнктивния сак на засегнатото око (очи) два пъти дневно (през интервал от 8 часа).

Лечението може да продължи до 4 месеца (ако е необходимо).

Трябва да се внимава да не се докосват клепачите, заобикалящата ги площ или други повърхности с връхчето на шишенцето, за да се предпази от замърсяване апликатора-капкомер и разтвора.

В случай на съпътстваща терапия към други лекарствени продукти, за локално приложение в окото, трябва да се спазва интервал (от пет до десет минути) между отделните накапвания.

### Употреба при пациенти в старческа възраст

Не е необходима промяна в дозировката (специална дозировка) при пациенти в старческа възраст.

### Употреба при деца и юноши

OPATANOL може да се използва при деца (над 3 годишна възраст) както се прилага в същата дозировка, както и при възрастни.



#### Употреба при пациенти с чернодробно и бъбречно увреждане

*Olopatadine* (олопатедин) под формата на капки за очи (т.е. OPATANOL) не е изследван при пациенти с бъбречни или чернодробни заболявания. Въпреки това, не се смята за необходимо пациентите с бъбречни или чернодробни увреждания да бъдат подлагани на някаква специална дозировка. (В/ж т.5.2.)

#### **4.3. Противопоказания**

Свръхчувствителност към *olopatadine* или към някое от помощните вещества, обявени в състава на лекарствения продукт.

#### **4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки за употреба**

OPATANOL е антиалергичен/ антихистаминов лекарствен продукт и независимо от това, че се прилага локално, се абсорбира и системно. Ако се появят някакви симптоми за сериозни нежелани лекарствени реакции или свръхчувствителност лечението трябва незабавно да се преустанови.

За *бензалкониевия хлорид*, който обикновено се използва като консервант при офталмологичните лекарствени продукти, е известно, че причинява точковидна и/ или токсична язвена кератопатия. OPATANOL съдържа *бензалкониев хлорид* и затова се изисква наблюдение на пациентите със сухота в окото, които са подложени на честа или продължителна терапия, или при такива с проблемна роговица.

#### Контактни лещи

Пациентите трябва да бъдат информирани, че е необходимо да изчакат 10 – 15 минути след накапването на OPATANOL, преди да поставят контактните си лещи обратно в окото. OPATANOL не трябва да се поставя в окото докато се носят контактни лещи.

#### **4.5. Взаимодействие с други лекарствени продукти и други форми на взаимодействие**

Не са проведени клинични проучвания с OPATANOL за изследване на взаимодействията.

*In vitro* проучванията показват, че *olopatadine* не пречи на метаболитните процеси, в които участват цитохром Р-450 изозимите 1А2, 2С8, 2С9, 2С19, 2D6, 2Е1 и 3А4. Тези резултати показват, че *olopatadine* вероятно няма да повлияе на метаболитните процеси с други едновременно прилагани лекарствени вещества.

#### **4.6. Бременност и кърмене**

##### Бременност

Няма клинични данни за *olopatadine* при пациентки с доказана бременност.

Изследванията с животни не показват директни или индиректни вредни ефекти по отношение на бременността, развитието на ембриона/плода, раждането или постнаталното развитие. (виж 5.3.)

Независимо от това, трябва да се внимава при изписване на лекарствения продукт на бременни жени.



#### Кърмачки

OPATANOL не се препоръчва при кърмачки.

*Olopatadine* е откриван в млякото на кърмещи плъхове в следствие на перорално приложение. Проучванията при животни са показали намаляване на растежа на малките, кърмени от женски, които получават – системно, дози от *olopatadine* превишаващи многократно максималното ниво на препоръчаната доза за очно приложение при човек. Не е известно, дали локалното приложение при хора може да доведе до такава системна абсорбция, достатъчна да даде забележими количества в човешкото мляко.

#### **4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини**

Както е с всички капки за очи, временното замъгляване или други смущения в зрението могат да повлияят върху способността за шофиране или работа с машини. Ако при поставянето на лекарствения продукт зрението се замъгли, пациентът трябва да изчака докато зрението се проясни и едва тогава да шофира или да работи с машини.

#### **4.8. Нежелани лекарствени реакции**

При клиничните проучвания, включващи приблизително **950** човека, OPATANOL е прилаган един до четири пъти дневно в двете очи, за период до четири месеца, като монотерапия или като съпътстваща терапия към *loratadine* 10 mg. Очаквало се, че при около 5 % от пациентите може да настъпят нежелани лекарствени реакции; обаче само 1.4% от тези пациенти са прекъснали клиничните проучвания поради поява на нежелани лекарствени реакции, свързани с OPATANOL.

По време на клиничните проучвания не са докладвани сериозни, очни или системни, нежелани лекарствени реакции, свързани с OPATANOL. Най-често докладваната, свързана с лечението нежелана лекарствена реакция е очният дискомфорт, разпространен при 0.9% от пациентите.

Следните нежелани лекарствени реакции, които са определени като вероятно, възможно или определено свързани с лечението, са докладвани по време на клиничните проучвания с OPATANOL. Всички те са **нечести** (0.1 – 1%).

#### **Очни нежелани лекарствени реакции**

##### Нечести:

Очен дискомфорт; сърбеж; очна хиперемия; секреция; кератити; сухота в окото; оток на клепача; усещане за чуждо тяло; фотофобия.

#### **Системни нежелани лекарствени реакции**

##### Нечести:

**Тялото като цяло:**

главоболие; астения (*астено-динамичен синдром*)

**Нервна система:**

замаяност

**Респираторна система:**

сухота в носа

Следните нежелани лекарствени реакции са докладвани много рядко по време на пост-маркетинговите наблюдения на OPATANOL. Те общо се приемат като свързани с



употребата на антиалергичните / антихистаминови лекарствени продукти: замъглено зрение, сухота в устата, ринити, *еритема* (зачервяване на кожата).

#### 4.9. Предозиране

Няма данни при хората, свързани с предозиране при случайно или преднамерено поглъщане на лекарствения продукт. *Olopatadine* има ниска степен на остра токсичност при животни. Случайното поглъщане на цялото съдържание на шишенцето OPATANOL би довело до максимално системно ниво от 5 mg *olopatadine*. Ако се приеме, че абсорбцията е 100%, то поглъщането на цялото съдържание на шишенцето, би довело до крайна доза от 0.5 mg/kg при дете с тегло 10 kg.

Увеличение на QT – интервала при кучета е наблюдавано само при дози, превишаващи значително максималната доза за хора, което показва малка връзка с клиничната употреба. При перорална доза от 5 mg – разпределена на два приема, в продължение на 2.5 дена при 102<sup>-ма</sup> здрави доброволци (жени и мъже – млади и в старческа възраст) няма увеличение на QT – интервала, сравнено с *placebo*. Проучването показва пик на плазмената концентрация (at steady - state) на *olopatadine* от 35 до 127 ng/ml и доказва, че *olopatadine* приложен локално е поне 70-пъти по-безопасен по отношение на *ефекта върху сърдечната реполяризация*.

В случай на предозиране на лекарствения продукт е необходимо да се извърши подходящо наблюдение и третиране на пациента.

### 5. Фармакологични свойства

#### 5.1. Фармакодинамични свойства

**Фармакотерапевтична група:** Офталмологични лекарствени продукти; Деконгестанти и антиалергични средства; Други антиалергични лекарствени продукти

#### АТС: S01GX 09

*Olopatadine* (*олонатадин*) е мощен селективен антиалергичен / антихистаминов агент, който оказва въздействие чрез многократни отделни механизми. Той атакува хистамина (основния медиатор на алергичното противодействие при хората) и също така пречи на хистамина да индуцира възпалителната продукция на цитокини от епителните клетки на човешката конюнктива. Данните от *in vitro* проучванията показват, че *olopatadine* въздейства на мастните клетки на конюнктивата и потиска освобождаването на про-възпалителни медиатори. При пациенти с открит назолакримален тракт, за намаляване на назалната симптоматика, която често съпровожда сезонните алергични конюнктивити, се препоръчва локално приложение в окото на OPATANOL.

*Olopatadine* не причинява клинично значими промени в диаметъра на зеницата.

#### 5.2. Фармакокинетични свойства

*Olopatadine* се абсорбира системно, както всички други локално приложени лекарствени продукти. Системната абсорбция на *olopatadine* е минимална с плазмени концентрации, вариращи от стойности под долната количествена граница (< 0.5 ng/ml) до 1-3 ng/ml. Тези концентрации са от 50 до 200 пъти по-ниски в сравнение с концентрациите, получени при добре поносимите перорални дози. При пероралните фармакокинетични проучвания се



установено, че полу-живота на *olopatadine* в плазмата е приблизително 8 до 12 часа, а изхвърлянето му се осъществява през бъбреците. Приблизително 60 – 70 % от дозата се възстановява като активно вещество в урината. Два метаболита (*mono-desmethyl* и *N-oxide*) са открити в ниски концентрации в урината.

Тъй като *olopatadine* се изхвърля основно с урината, като непроменено активно вещество (лекарствено вещество), увреждането на бъбречната функция променя фармакокинетиката на *olopatadine* с пик на плазмената концентрация 2.3 – пъти по-голям при пациенти с тежки бъбречни увреждания (т.е. със средна стойност на креатининовия клиаранс 13 ml/min), в сравнение със здрави пациенти. След доза от 10 mg – перорално, при пациенти на хемодиализа, плазмените концентрации на *olopatadine* са значително по-ниски в деня на хемодиализа, отколкото в деня когато не са подложени на хемодиализа, което предполага, че *olopatadine* може да бъде отстранен при хемодиализата.

Фармакокинетичните сравнителни проучвания, при перорални дози от 10 mg *olopatadine*, при млади пациенти (със средна възраст 21 години) и пациенти в старческа възраст (със средна възраст 74 години) не показват значими разлики в плазмените концентрации (AUC), свързането на протеини или изхвърлянето с урината на непромененото лекарство вещество или неговите метаболити.

Проучванията на бъбречните увреждания, след перорални дози *olopatadine*, са проведени при пациенти с тежки бъбречни увреждания. Резултатите показват, че могат да се очакват по-високи плазмени концентрации при тази група пациенти. Тъй като концентрациите, след локално приложение на *olopatadine* в окото са 50 до 200-пъти по-ниски, отколкото след добре поносимите дози, приложени перорално; следователно не е необходимо специално нагласяване на дозировката при пациенти в старческа възраст или при пациенти с бъбречни увреждания.

Метаболизмът през черния дроб е второстепенен път на изхвърляне.

Не е необходимо специално нагласяване на дозировката при пациенти с чернодробни увреждания.

### 5.3. Предклинични данни за безопасност

Предклиничните данни не показват наличието на някаква специална опасност за хората, базирайки се на проведените конвенционалните проучвания за безопасност, фармакология, токсичност, генотоксичност, карциногенен потенциал и токсичност при размножаване.

## 6. Фармацевтични данни

### 6.1. Списък на помощните вещества

Benzalkonium chloride

Sodium chloride

Disodium phosphate dodecahydrate (E 339)

Hydrochloric acid (E 507) и/или Sodium hydroxide (E 524) (за нагласяване на рН)

Purified water Q.S.

### 6.2. Несъвместимости

Не са известни.



### 6.3. Срок на годност

- 3 (три) години.
- Да не се използва повече от четири седмици след първоначалното отваряне.

### 6.4. Специални условия на съхранение

Не се изискват специални условия на съхранение.

### 6.5. Данни за опаковката

OPATANOL се доставя в непрозрачни, пластмасови шишенца (от ПЕНП) от 5 мл, с полипропиленова капачка на винт (DROP-TAINER®).

Предлага се в следните опаковки:

картонена кутия, съдържаща 1 шишенце x 5 мл  
или

3 шишенца x 5 мл /не е задължително всички разновидности опаковки да се предлагат на пазара/.

### 6.6. Инструкции за употреба

Не се изискват специални.

### 7. Име и адрес на притежателя на разрешението за употреба

Alcon Laboratories (UK) Ltd.

Pentagon Park

Boundary Way,

Hemel Hempstead; Herts.,

HP2 7UD United Kingdom

### Производител:

S.A. Alcon Couvreur N.V.

Rijksweg 14, B-2870 Puurs/ Belgium

### 8. Регистрационен номер в EU:

EU/1/02/217/001-002

### 9. Дата на първо разрешение за употреба:

### 10. Дата на първа ревизия на текста на КХП:

