

КРАТКА ХАРАКТЕРИСТИКА НА ПРОДУКТА

EMADINE®

МИНИСТЕРСТВО НА ЗДРАВЕОПАЗВАНЕТО

Приложение към
разрешение за употреба № 11-10184/2210.010

665/23.10.04 *Мелев*

1. **Име на лекарствения продукт:**
EMADINE® 0.05% eye drops, solution
ЕМАДИН 0.05% капки за очи, разтвор

2. **Количествен и качествен състав:**
Лекарствено вещество:
Един милилитър съдържа emedastine 0.5 mg (като difumarate)
За помощните вещества, вж. б.1

3. **Лекарствена форма:**
Капки за очи, разтвор.
EMADINE е прозрачен, безцветен разтвор.

4. Клинични данни

4.1. Показания

Симптоматично лечение на сезонни алергични конюнктивити.

4.2. Начин на приложение и дозировка:

EMADINE е само за очно приложение.

Клинични изпитвания на EMADINE не са провеждани за период по-дълъг от шест седмици.

EMADINE трябва да се прилага по една капка в засегнатото око (очи) два пъти дневно.

Трябва да се внимава да не се докосват клепачите, заобикалящата ги област или други повърхности с върха на апликатора-капкомер, за да се избегне евентуално замърсяване на разтвора.

Употреба при пациенти в напреднала възраст

EMADINE не е изпитван при пациенти в напреднала възраст, по-възрастни от 65 години, поради това не се препоръчва за тази група пациенти.

Употреба при деца

EMADINE може да бъде използван при деца (над три години) като се прилага по същия начин както и при възрастни.

Употреба при пациенти с чернодробно и бъбречно увреждане

EMADINE не е изпитван при такива пациенти, поради това употребата му не се препоръчва при тях.

4.3. Противопоказания

Свръхчувствителност към емедастин или някое от помощните вещества.

4.4. Специални предупреждения и специални предпазни мерки за употреба

Описани са инфилтрати на роговицата, които се свързват с употребата на EMADINE.



10.11.04
Мелев

В случай на поява на роговични инфилтрати, лекарственият продукт трябва да бъде спрян и да бъде приложено подходящо лечение.

За бензалкониевият хлорид, използван като консервант в този лекарствен продукт е известно, че причинява точковидна и/или язвена кератопатия. Бензалкониевият хлорид може да причини дразнене.

Контактни лещи

Пациентите трябва да бъдат предупредени да изчакат поне 15 минути след поставянето на EMADINE преди да поставят контактните лещи в окото. EMADINE не трябва да се поставя докато се носят меки контактни лещи. Известно е, че бензалкониевият хлорид променя цвета на меките контактни лещи.

4.5. Лекарствени и други взаимодействия

В случай на употреба заедно с други очни лекарствени продукти е необходим интервал от 10 минути по между им.

Не са провеждани специфични изпитвания с емедастин за лекарствени взаимодействия.

4.6. Бременност и кърмене

Бременност

Няма достатъчно данни от изследвания за употреба на емедастин при бременни жени. Проучванията при животни показват репродуктивна токсичност (виж част 5.3.). Не е известен потенциален риск за хората. Въпреки това, вземайки под внимание липсата на въздействие на емедастин върху адренергичните, допаминергичните и серотониновите рецептори, EMADINE може да се използва при бременни ако се спазва препоръчаната в част 4.2. дозировка.

Кърмене

Емедастин е откриван в млякото на плъхове вследствие на перорално приложение. Не е известно дали локалното приложение на емедастин при хората може да доведе до системна абсорбция, в резултат на което да бъде открит в човешкото мляко. EMADINE трябва да се използва внимателно по време на кърмене.

4.7. Ефекти върху способността за шофиране и работа с машини

Както при употребата на всеки един лекарствен продукт за очно приложение, ако при поставянето се появи краткотрайно замъгляване на зрението, пациентът трябва да изчака зрението му да се проясни преди да шофира или да работи с машини.

4.8. Нежелани лекарствени реакции

Очни ефекти

Общото разпространение на нежеланите лекарствени реакции, свързани с EMADINE при клиничните проучвания е 9.1%.

Следните нежелани лекарствени реакции сигурно, вероятно или възможно свързани с лечението, са докладвани по време на клиничните проучвания с EMADINE. Те биват чести (1% до 4.7%) или нечести (под 1%).



Най-често описваната нежелана лекарствена реакция при EMADINE капки за очи е дразнене на окото (краткотрайно парене или лютене по време на поставянето).

Други наблюдавани очни нежелани лекарствени реакции са:

Чести: сухота в окото (NOS), зачервяване на окото (*хиперемия*), сърбеж (*пруритус*), и замъглено зрение.

Нечести: петна на роговицата, усилено съзене, роговични инфилтрати, астигматизъм (*умора в окото, дискомфорт, съзене*) и аномално усещане в окото (усещане за чуждо тяло).

Системни ефекти

Докладвани са няколко вида системни нежелани лекарствени реакции. Всички те са ~~нечести~~ ^{не} ($< 1\%$). Наблюдавани са системни нежелани лекарствени реакции от страна на:

Имунната система: алергични реакции.

Нервната система: главоболие и промяна във вкусовите усещания

Кожата и подкожните тъкани: обриви (NOS).

4.9. Предозиране

Няма данни при хората относно предозирането при случайно или съзнателно поглъщане на лекарствения продукт. В случай на случайно поглъщане на съдържанието на шишенцето EMADINE, трябва да се има предвид възможността емедастин да увеличи QT интервала и трябва да бъде приложено подходящо наблюдение и лечение.

5. Фармакологични данни

5.1. Фармакодинамични свойства

Фармакотерапевтична група: деконгестанти и антиалергични средства; други антиалергични средства

АТС: S01GX 06

Емедастин е силно избирателен и локално ефективен хистамин H_1 антагонист ($K_j = 1.3 \text{ nM}$). *In vitro* изпитванията на афинитета на емедастин към хистаминовите рецептори (H_1 , H_2 и H_3) показват 10,000 пъти по-висок афинитет за H_1 рецепторите в сравнение с H_2 и H_3 , съответно $K_j = 1.3 \text{ nM}$; 49,064 nM и 12,430 nM. *In vivo* локалното очно приложение на емедастин продуцира концентрационно-зависимо инхибиране на хистамин-стимулираната конюктивно съдова пропускливост.

Изследванията с емедастин не показват наличие на ефекти върху адренергичните, допаминергичните и серотониновите рецептори.

5.2. Фармакокинетични свойства

Емедастин има системна абсорбция, както и другите офталмологични лекарствени продукти. В изследване с EMADINE капки за очи 0.05 % - разтвор, включващо 10 напълно здрави доброволци - третирани двустранно (в двете очи), два пъти дневно в продължение на 15 дни, плазмените концентрации на метаболитите са основно под границата на количественото



съдържание (0.3 ng/ml). В пробите, в които е измерено количеството на емедастин, той варира от 0.30 ng/ml до 0.49 ng/ml.

Бионаличността (при перорален прием) на емедастин при хора е приблизително 50 % и максимални плазмени концентрации се получават за по-малко от 1 - 2 часа след дозирането.

Емедастин се метаболизира главно от черния дроб. Времето на полуелиминиране на локално прилагания емедастин е 10 часа. Приблизително 44 % от пероралната доза се открива в урината след 24 часа, само 3.6 % от тази доза се екскретира (изхвърля) като метаболити. Два основни метаболита, 5 - и 6 - *hydroxyemedastine*, се отделят с урината както в свободна, така и в свързана форма. 5'-окси аналозите на 5 - и 6 - *hydroxyemedastine* и N - оксида също се образуват като метаболити, но в по-малки количества.

5.3. Предклинични данни за безопасност

Емедастин дифумарат показва ниска остра токсичност при много от видовете при различните начини на приложение. Не са наблюдавани клинично значими локални или системни ефекти при продължителни локални, очни изследвания при зайци.

Роговични лимбални моноядрени клетъчни инфилтрати са наблюдавани при 1/4 от мъжките маймуни третирани с 0.5 mg/ml (от 4/4 мъжки) и при 1/4 женски третирани с 1.0 mg/ml. Моноядрени клетъчни инфилтрати на склерата присъстват при 1/4 от мъжките и 1/4 от женските, третирани с 0.5 mg/ml и при 2/4 от мъжките и 1/4 от женските, третирани с 1.0 mg/ml. Средните максимуми на плазмените нива са приблизително между 1ng/ml и 2ng/ml, съответно за леченията проведени с 0.5 и 1.0 mg/ml разтвори.

Установено е, че емедастин увеличава QT- интервала при кучета; NOEL съответства на нива 23 пъти по-високи от тези открити при пациенти (7ng/ml в сравнение с 0.3ng/ml, т.е. границите за откриване на емедастин).

При изследвания с плъхове и мишки не е установено емедастин дифумарат да е канцерогенен. Емедастин дифумарат не е генотоксичен при стандартния комплект от *in vitro* и *in vivo* генотоксични анализи.

При изследвания за тератогенност на плъхове, са наблюдавани фетотоксични, но не тератогенни ефекти при най-високата доза възлизаща около (140 mg/kg/дневно); не са наблюдавани такива ефекти при ниските концентрации (40 mg/kg/дневно), които съответстват на дозиране, далеч превишаващо препоръчваната терапевтична доза. Репродуктивна токсичност не е наблюдавана при изследване на зайци.

6. Фармацевтични данни

6.1. Списък на помощните вещества

Benzalkonium chloride 0.01%,
Trometamol,
Sodium chloride,
Hypromellose,
Hydrochloric acid / sodium hydroxide (за нагл. на pH)
Purified water.



6.2. Несъвместимости

Не са известни.

6.3. Срок на годност

30 месеца.

EMADINE капки за очи не трябва да се използва повече от 4 седмици след първоначалното отваряне на шишенцето.

6.4. Специални условия за съхранение

Да се съхранява при температура под 25°C.

6.5. Данни за опаковката

EMADINE капки за очи се доставя в непрозрачни пластмасови тип "DROP-TAINER" шишенца от 5 ml и 10 ml. Не е задължително всички разновидности опаковки да се предлагат на пазара.

6.6. Препоръки при употреба

Няма специални изисквания.

7. Име и адрес на притежателя на регистрационното досие

Alcon Laboratories (UK) Ltd.

Boundary Way
Hemel Hempstead
Herts HP2 7UD
United Kingdom

8. Регистрационен номер: № 9900310

Номер, под който е вписан в регистъра на ЕО:

Emadine 0.05%, 5ml – EU/1/98/095/001

Emadine 0.05%, 10ml – EU/1/98/095/002

9. Дата на първо разрешение за употреба:

EMADINE е официално одобрен от Европейската комисия на 28.01.1999г.

EMADINE е разрешен за употреба в България на 09.10.1999.

10. Дата на последна ревизия на текста: Юни, 2004

