

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Azelastin POS,
0,5 mg/ml, krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

0,05 % roztwór chlorowodorku azelastyny (0,50 mg/ml).

Jedna kropla leku o objętości około 30 µl zawiera 0,015 mg chlorowodorku azelastyny (*Azelastini hydrochloridum*).

Zawiera chlorek benzalkoniowy (0,125 mg/ml)

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór.
Klarowny, bezbarwny roztwór.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1. Wskazania do stosowania

Leczenie i profilaktyka objawów alergicznego sezonowego zapalenia spojówek u dorosłych i dzieci w wieku 4 lat i powyżej.

Leczenie objawów całorocznego alergicznego zapalenia spojówek u dorosłych i dzieci w wieku 12 lat i powyżej.

4.2. Dawkowanie i sposób podawania

Podanie do oka

Krople do oczu należy podawać do worka spojówkowego mając głowę lekko odchyloną do tyłu. Podczas podawania należy zawsze unikać kontaktu końcówki zakraplacza z okiem lub skórą.

Sezonowe alergiczne zapalenie spojówek

Dorosłym i dzieciom w wieku 4 lat i powyżej zazwyczaj podaje się jedną kroplę leku do każdego oka, dwa razy na dobę (rano i wieczorem). W razie konieczności dawkę tę można zwiększyć do jednej kropli, podawanej cztery razy na dobę.

Całoroczne alergiczne zapalenie spojówek

Doroślým i dzieciom w wieku 12 lat i powyżej zazwyczaj podaje się jednå kroplę leku do kaźdego oka dwa razy na dobę (rano i wieczorem). W razie konieczności, dawkę tę można zwiększyć do jednej kropli podawanej 4 razy na dobę.

W badaniach klinicznych potwierdzono skuteczność i bezpieczeństwo stosowania leku podczas leczenia trwającego do 6 tygodni, dlatego terapię preparatem należy ograniczyć do maksymalnie 6 tygodni.

Unikać kontaktu z miękkimi soczewkami kontaktowymi (patrz punkt 4.4).

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą.

4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Azelastin POS, nie jest wskazany w leczeniu zakażeń oczu.

Podobnie, jak w przypadku innych leków w postaci kropli do oczu, podczas stosowania azelastyny, nie należy używać soczewek kontaktowych.

Preparat zawiera chlorek benzalkoniowy będący środkiem konserwującym. Lek może powodować podrażnienie oczu. Należy unikać kontaktu leku z miękkimi soczewkami kontaktowymi. Należy usunąć soczewki kontaktowe przed zakropieniem i odczekać co najmniej 15 minut przed ponownym założeniem. Substancja zmienia zabarwienie soczewek kontaktowych.

Inne ostrzeżenia podano w punktach 4.5 i 4.6.

4.5. Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Specyficzne badania dotyczące interakcji Azelastin POS z innymi lekami nie były prowadzone.

Prowadzono badania interakcji z użyciem dużych dawek doustnych. Nie mają one jednak żadnego znaczenia dla Azelastin POS, ponieważ stężenie substancji czynnej w osoczu po zakropieniu preparatu do oka wyraża się w pikogramach.

4.6. Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Brak wystarczających danych potwierdzających bezpieczeństwo stosowania azelastyny u kobiet w okresie ciąży. W badaniach doświadczalnych na zwierzętach duże dawki doustne tej substancji powodowały działania niepożądane (obumarcie płodu, zahamowanie wzrostu i wady rozwojowe kośćca). Po miejscowym zastosowaniu preparatu, stężenia substancji czynnej w organizmie są minimalne (wyrażone w pikogramach), należy jednak zachować ostrożność stosując preparat Azelastin POS podczas ciąży.

Niewielkie ilości azelastyny przenikają do mleka kobiecego i dlatego nie zaleca się stosowania preparatu Azelastin POS u kobiet karmiących piersią.

4.7. Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Jest praktycznie nieprawdopodobne aby łagodne, przemijające podrażnienie oczu wywołane zakropieniem preparatu Azelastin POS, mogło pogarszać lub upośledzać widzenie. Jednak pacjenci odczuwający jakiegokolwiek przemijające zaburzenia widzenia nie powinni prowadzić pojazdów i obsługiwać maszyn, do chwili ustąpienia tych objawów.

4.8. Działania niepożądane

Częstość występowania objawów niepożądanych określa się na podstawie następujących kryteriów:

Bardzo często	($\geq 1/10$)
Często	($\geq 1/100$ do $< 1/10$)
Niezbyt często	($\geq 1/1000$ do $< 1/100$)
Rzadko	($\geq 1/10000$ do $< 1/1000$)
Bardzo rzadko	($< 1/10000$)
Nie znana	częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych

Zaburzenia układu immunologicznego

Bardzo rzadko: Reakcje alergiczne (takie jak wysypka i świąd)

Zaburzenia układu nerwowego

Niezbyt często: Gorzki smak w ustach

Zaburzenia oka

Często: łagodne, przejściowe podrażnienie oka

4.9. Przedawkowanie

Nie są znane żadne specyficzne reakcje na przedawkowanie po podaniu do oka i nie należy także ich oczekiwać.

Brak doświadczeń z zastosowaniem toksycznych dawek chlorowodoru azelastyny u ludzi. Po przedawkowaniu lub w przypadku zatrucia można spodziewać się zaburzeń ze strony ośrodkowego układu nerwowego (analogicznie, jak stwierdzano w badaniach na zwierzętach).

W takich przypadkach należy zastosować leczenie objawowe. Nie jest znana odtrutka dla azelastyny.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1. Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Leki zmniejszające przekrwienie oraz przeciwalergiczne, inne leki przeciwalergiczne

Kod ATC: S01GX07

Azelastyna pochodna ftalazynonu, jest związkiem o silnym i długotrwałym działaniu przeciwalergicznym. Działa antagonistycznie, na receptory H_1 . Po podaniu miejscowym do oczu, lek wykazuje także działanie przeciwzapalne.

Z badań przedklinicznych *in vivo* i *in vitro* wynika, że azelastyna zmniejsza syntezę lub uwalnianie mediatorów chemicznych uczestniczących we wczesnej i późnej fazie reakcji alergicznej, np. leukotrienów, histaminy, PAF (czynnik aktywujący płytki) i serotoniny.

W dotychczasowych badaniach u pacjentów przyjmujących długotrwale duże dawki azelastyny doustnie, wyniki EKG potwierdziły, że podawanie wielokrotnych dawek preparatu nie powoduje istotnych klinicznie zmian ustalonego odstępu QT (QTc).

Nie obserwowano związku pomiędzy leczeniem azelastyną, a występowaniem arytmii komorowych lub *torsade de pointes* u ponad 3700 pacjentów leczonych doustną postacią azelastyny.

5.2. Właściwości farmakokinetyczne

Farmakokinetyka po podaniu układowym

Po podaniu doustnym azelastyna jest szybko wchłaniana, przy czym jej bezwzględna dostępność biologiczna wynosi 81 %. Spożywanie pokarmów nie ma wpływu na absorpcję preparatu. Duża objętość dystrybucji wskazuje, że preparat w przeważającej części rozmieszczany jest na obwodzie. Stopień wiązania z białkami osocza jest stosunkowo mały (80 - 90 %, stężenie zbyt małe, aby brać pod uwagę możliwość wypierania leku).

Okres półtrwania w fazie eliminacji po przyjęciu pojedynczej dawki preparatu wynosi około 20 godzin dla azelastyny i około 45 godzin dla jej biologicznie czynnego metabolitu, N-dezmetylazelastyny. Preparat jest wydalany głównie z kałem.

Utrzymujące się wydalenie niewielkich ilości dawki z kałem sugeruje możliwość przenikania leku do krążenia jelitowo-wątrobowego.

Farmakokinetyka po podaniu miejscowym do oka

Po wielokrotnym zakropleniu preparatu zawierającego azelastynę o takim samym składzie jak Azelastin POS (w dawce jedna kropla do worka spojówkowego każdego oka, cztery razy na dobę) wartości C_{max} w stanie równowagi stacjonarnej chlorowodoru azelastyny były bardzo małe i kształtowały się na granicy oznaczalności lub poniżej tej granicy.

5.3. Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Chlorowodorek azelastyny podawany świnkom morskim nie wykazywał działania alergizującego. Nie odnotowano działania genotoksycznego azelastyny w szeregu testów *in vitro* i *in vivo*, ani działania rakotwórczego w badaniach przeprowadzonych u szczurów i myszy.

Azelastyna podawana doustnie samicom i samcom szczura, w dawce powyżej 30,0 mg/kg/dobę, powodowała zależne od wielkości dawki obniżenie wskaźnika płodności.

W badaniach toksyczności przewlekłej, nie wykazano jednak, zarówno u osobników męskich jak i żeńskich, wystąpienia zmian w narządach płciowych, które byłyby wywołane przez azelastynę.

Zjawisko embriotoksyczności i teratogenności występowało u ciężarnych szczurów, myszy i królików jedynie w zakresie dawek toksycznych dla matek (np. obserwowano wady kośćca u szczurów i królików, którym podawano dawki 50 mg/kg/dobę).

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1. Wykaz substancji pomocniczych

Benzalkoniowy chlorek (środek konserwujący)
Disodu edetynian
Hypromeloza
Sorbitol
Sodu wodorotlenek (do korekty pH)
Woda do wstrzyknięć.

6.2. Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3. Okres ważności

Zamknięta butelka: 3 lata

Nie należy używać leku dłużej niż 4 tygodnie po pierwszym otwarciu opakowania bezpośredniego.

6.4. Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Brak szczególnych środków ostrożności dotyczących przechowywania produktu leczniczego.

6.5. Rodzaj i zawartość opakowania

Wielkość opakowania: butelka z LDPE 10 ml z białym zakraplaczem z LDPE i białą zakrętką z HDPE. Jedna butelka zawiera 10 ml roztworu.

6.6. Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Brak szczególnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

URSAPHARM Poland Sp. z o.o., ul. Żywiczna 7, 05-092 Łomianki, Poland
Telefon: 022 751 28 86
Telefax: 022 751 28 86
e-mail: info@ursapharm.pl

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

**9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO
OBROTU/DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA**

**10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU
CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO**