

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

ALERPALUX, 1 mg/ml, krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I IŁOŚCIOWY

Jeden ml roztworu zawiera 1 mg olopatadyny (w postaci olopatadyny chlorowodoru).

Jedna kropla o przeciętnej wielkości 30 mg zawiera około 30 mikrogramów olopatadyny (w postaci olopatadyny chlorowodoru).

Substancje pomocnicze o znanym działaniu: benzalkoniowy chlorek 0,1 mg

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór. Przezroczysty, bezbarwny roztwór bez widzialnych cząstek o pH 6,6–7,6 i osmolalności: 270–330 mosmol/kg.

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

Leczenie ocznych objawów przedmiotowych i podmiotowych sezonowego alergicznego zapalenia spojówek.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Dawka to jedna kropla produktu Alerpalux do worka spojówkowego chorego oka (oczu) 2 razy na dobę (z zachowaniem 8 godzin przerwy pomiędzy zakraplaniem kolejnych dawek). Leczenie można kontynuować przez okres do czterech miesięcy, jeżeli zostanie to uznane za konieczne.

Aby zapobiec zanieczyszczeniu końcówki zakraplacza i roztworu zawartego w butelce, należy zachować ostrożność, aby nie dotknąć końcówką zakraplacza butelki do powieki, otaczających ją obszarów lub innych powierzchni. Gdy lek nie jest stosowany, butelkę należy trzymać szczelnie zamkniętą.

W przypadku jednoczesnego leczenia innymi lekami do stosowania miejscowego do oczu, pomiędzy kolejnymi aplikacjami należy zachować odstęp co najmniej pięć minut.

Stosowanie u osób w podeszłym wieku

U pacjentów w podeszłym wieku nie ma konieczności modyfikacji dawki.

Dzieci i młodzież

Alerpalux można stosować u dzieci i młodzieży (po trzecim roku życia) w takiej samej dawce jak u dorosłych.

Stosowanie u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby i nerek

Olopatadyny w formie kropli do oczu nie przebadano u pacjentów z chorobami nerek lub wątroby. Nie należy jednak spodziewać się, aby u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek lub wątroby istniała konieczność zmiany dawkowania (patrz punkt 5.2).

4.3 Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na substancję czynną lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Olopatadyna jest lekiem przeciwalergicznym i przeciwhistaminowym, który mimo podawania miejscowego ulega wchłanianiu ogólnoustrojowemu. W razie wystąpienia ciężkich reakcji niepożądanych lub nadwrażliwości, należy przerwać stosowanie tego leku.

Wykazano, że chlorek benzalkonium, często używany jako konserwant w preparatach stosowanych do oczu, może wywołać punktikowatą keratopatię i/lub toksyczną wrzodziejącą keratopatię. Ponieważ Alerpalux krople do oczu roztwór zawiera chlorek benzalkonium, konieczne jest staranne monitorowanie pacjentów w przypadku częstego lub przedłużonego stosowania u pacjentów z suchością oka lub w stanach przebiegających z uszkodzeniem rogówki.

Soczewki kontaktowe

Pacjentów należy poinformować o konieczności odczekania 10-15 minut od momentu zakroplenia preparatu Alerpalux do założenia soczewek kontaktowych. Nie należy podawać kropli do oczu Alerpalux przy założonych soczewkach kontaktowych.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Nie przeprowadzono badań dotyczących interakcji.

Wyniki badań *in vitro* wykazały, że olopatadyna nie hamuje reakcji metabolicznych przebiegających z udziałem izoenzymów 1A2, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 i 3A4 cytochromu P-450. Wyniki te wskazują, że nie jest prawdopodobne, aby olopatadyna wchodziła w interakcje metaboliczne z innymi jednocześnie podawanymi substancjami czynnymi.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Ciąża

Brak dostępnych danych klinicznych dotyczących podawania olopatadyny w czasie ciąży.

Badania na zwierzętach nie wykazały bezpośredniego ani pośredniego niekorzystnego wpływu leku na przebieg ciąży, rozwój zarodka/płodu, poród czy rozwój postnatalny (patrz punkt 5.3). Należy zachować ostrożność przepisując lek kobietom w ciąży.

Karmienie piersią

Nie zaleca się stosowania kropli do oczu Alerpalux przez matki karmiące piersią.

Olopatadynę wykryto w mleku samic szczurów po podaniu doustnym. Badania na zwierzętach wykazały zmniejszenie wzrostu potomstwa karmionego przez matki otrzymujące olopatadynę ogólnoustrojowo w dawkach znacznie przekraczających maksymalne zalecane dawki, stosowane do oczu u ludzi. Nie wiadomo, czy lek stosowany miejscowo u ludzi wchłania się do organizmu w stopniu wystarczającym do wystąpienia wykrywalnych stężeń olopatadyny w mleku.

Płodność

Nie ma danych dotyczących wpływu olopatadyny na płodność u ludzi. W badaniach nieklinicznych nie obserwowano wpływu olopatadyny na płodność (patrz punkt 5.3).

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Podobnie jak w przypadku stosowania wszystkich kropli do oczu, może wystąpić przemijające niewyraźne widzenie lub inne zaburzenia widzenia, które mogą upośledzać zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn. Jeżeli po zakropleniu preparatu wystąpi niewyraźne widzenie, pacjent przed rozpoczęciem prowadzenia pojazdów i obsługą maszyn musi odczekać do momentu powrotu ostrości widzenia.

4.8 Działania niepożądane

Jak każdy lek, Alerpalux może powodować pewne działania niepożądane, chociaż nie u każdego one wystąpią.

Uznano, że poniższe działania niepożądane mają związek z zastosowanym leczeniem i sklasyfikowano je zgodnie z następującą konwencją: Bardzo często ($\geq 1/10$), często ($> 1/100$ do $< 1/10$), niezbyt często ($> 1/1\,000$ do $\leq 1/100$), rzadko ($> 1/10\,000$ do $\leq 1/1\,000$) lub bardzo rzadko ($\leq 1/10\,000$). W zakresie każdej z grup o określonej częstości, działania niepożądane przedstawione zostały od najcięższego do najłagodniejszego.

Zakażenia i infestacje

Niezbyt często: nieżyt nosa

Zaburzenia układu nerwowego

Często: ból głowy, zaburzenia smaku

Niezbyt często: zawroty głowy, niedoczulica

Zaburzenia oka

Często: ból oka, podrażnienie oka, suchość oka, nietypowe uczucie w oczach

Niezbyt często: nadżerka rogówki, nieprawidłowość nabłonka rogówki, choroby nabłonka rogówki, punkcikowate zapalenie rogówki, zapalenie rogówki, plamki na rogówce, wydzielina z oka, światłowstręt, niewyraźne widzenie, zmniejszenie ostrości widzenia, kurcz powieki, dyskomfort w oku, świąd oka, grudki na spojówce, choroba spojówki, uczucie obecności ciała obcego w oczach, nasilone łzawienie, świąd powiek, zaczerwienienie powieki, obrzęk powieki, choroba powieki, przekrwienie spojówek, przekrwienie oczu

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Często: suchość nosa

Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej

Niezbyt często: kontaktowe zapalenie skóry, uczucie pieczenia skóry, suchość skóry

Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania

Często: uczucie zmęczenia

Nieznane (nie można oszacować na podstawie dostępnych danych):

Ze strony oczu: obrzęk rogówki, zapalenie spojówek, obrzęk oka, obrzmienie oka, rozszerzenie źrenic, zaburzenie widzenia, strupy na brzegu powieki

Ogólnoustrojowe: nadwrażliwość, duszność, senność, obrzęk twarzy, zapalenie skóry, rumień, nudności, wymioty, zapalenie zatok, astenia, uczucie ogólnego rozbicia.

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać

wszelkie podejrzewane działania niepożądane za pośrednictwem Departamentu Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych {aktualny adres, nr telefonu i faksu ww. Departamentu} e-mail: ndl@urpl.gov.pl.

4.9 Przedawkowanie

Nie są dostępne dane na temat przypadkowego lub zamierzonego przedawkowania olopatadyny u ludzi poprzez jej przyjęcie drogą doustną. Olopatadyna charakteryzuje się małą ostrą toksycznością u zwierząt.

Przypadkowe połknięcie całej zawartości butelki z olopatadyną może spowodować ogólnoustrojowe narażenie pacjenta na maksymalnie 5 mg olopatadyny. Zakładając 100% wchłanianie, taka ekspozycja w przypadku dziecka o masie ciała 10 kg odpowiadałaby przyjęciu dawki 0,5 mg/kg mc.

U psów obserwowano wydłużenie odcinka QTc jedynie przy ekspozycji na dawki uznane za znacznie przekraczające maksymalną ekspozycję u człowieka, co oznacza niewielkie znaczenie dla praktyki klinicznej. 102 zdrowym ochotnikom, młodym i w podeszłym wieku, mężczyznom i kobietom, podawano doustnie dawkę 5 mg dwa razy na dobę przez 2,5 dnia, nie obserwując znacznego wydłużenia odcinka QTc w porównaniu z placebo. Zakres maksymalnych stężeń olopatadyny w osoczu w stanie stacjonarnym (35 do 127 ng/ml) obserwowany w tym badaniu oznacza co najmniej 70-krotnie większy margines bezpieczeństwa przy miejscowym stosowaniu olopatadyny w odniesieniu do jej wpływu na repolaryzację serca.

W przypadku przedawkowania należy wdrożyć odpowiednie monitorowanie pacjenta i odpowiednie leczenie.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmaceutyczna: leki oftalmologiczne; obkurczające naczynia i przeciwalergiczne; inne leki przeciwalergiczne, kod ATC: S01GX 09

Olopatadyna jest silnym, wybiórczym lekiem przeciwalergicznym/przeciwhistaminowym, który wywiera efekty lecznicze za pośrednictwem wielu odmiennych mechanizmów działania. Jest antagonistą histaminy (głównego mediatora reakcji alergicznej u ludzi) i zapobiega indukowanej przez histaminę produkcji cytokin zapalnych przez komórki nabłonka spojówki u człowieka. Dane uzyskane z badań *in vitro* sugerują, że może oddziaływać na komórki tuczne spojówki człowieka hamując uwalnianie mediatorów prozapalnych. Sugerowano, że u pacjentów z drożnymi przewodami nosowo-łzowymi, miejscowe podawanie olopatadyny do oczu zmniejsza przedmiotowe i podmiotowe objawy ze strony nosa, które często towarzyszą sezonowemu alergicznemu zapaleniu spojówek. Nie wywołuje klinicznie istotnej zmiany średnicy źrenicy.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Podobnie jak inne leki stosowane miejscowo, olopatadyna podlega ogólnoustrojowemu wchłanianiu. Ogólnoustrojowe wchłanianie olopatadyny podawanej miejscowo jest jednak minimalne; stężenia występujące w osoczu mieszczą się w zakresie od poniżej granicy oznaczalności (<0,5 ng/ml) do 1,3 ng/ml. Są to stężenia 50-do 200-krotnie mniejsze niż uzyskiwane po podaniu dobrze tolerowanych dawek doustnych. Według badań farmakokinetycznych okres półtrwania olopatadyny w osoczu po podaniu doustnym wynosił około 8 do 12 godzin a eliminacja odbywa się głównie poprzez wydzielanie nerkowe. Z moczem wydalało się około 60-70% dawki w postaci niezmienionej. W moczu wykryto w małych stężeniach dwa metabolity, pochodną mono-demetylowaną i N-tlenek olopatadyny.

Ponieważ olopatadyna jest wydzielana w moczu głównie w postaci niezmienionej, zaburzenie czynności nerek zmienia farmakokinetykę olopatadyny, przez co osiąga ona maksymalne stężenie w osoczu 2,3-krotnie większe u pacjentów z ciężkim upośledzeniem czynności nerek (średni klirens kreatyniny 13,0 ml/min) w porównaniu ze zdrowymi dorosłymi. Po doustnym podaniu dawki 10 mg pacjentom poddawanych hemodializie (brak produkcji moczu), stężenie olopatadyny w osoczu było znacznie mniejsze w dniu hemodializy, niż w dniu bez hemodializy, co sugeruje, że olopatadynę można usunąć za pomocą hemodializy.

Badania porównujące farmakokinetykę doustnej dawki 10 mg olopatadyny u osób młodych (średni wiek 21 lat) i w podeszłym wieku (średni wiek 74 lat) nie wykazały istotnych różnic w stężeniu w osoczu (AUC), wiązaniu z białkami lub wydalaniu w moczu niezmienionego leku i jego metabolitów.

U pacjentów z ciężkim upośledzeniem czynności nerek przeprowadzono badanie oceniające wpływ upośledzenia czynności nerek na doustnie podaną olopatadynę. Wyniki wskazują, że w tej populacji można oczekiwać nieco większego stężenia olopatadyny w osoczu. Ponieważ po podaniu olopatadyny do osocza jej stężenie jest 50 do 200 razy mniejsze niż po dobrze tolerowanych dawkach doustnych, nie wydaje się, aby u osób w wieku podeszłym lub z upośledzeniem czynności nerek była potrzebna modyfikacja dawki. Metabolizm wątrobowy stanowi mniej istotną drogę eliminacji olopatadyny. Nie wydaje się, aby było konieczne modyfikowanie dawki u pacjentów z zaburzoną czynnością wątroby.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Dane niekliniczne, uzyskane na podstawie konwencjonalnych badań farmakologicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie wykazały szczególnego zagrożenia dla człowieka.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Benzalkoniowy chlorek,
Sodu chlorek,
Disodu fosforan dwunastowodny,
Kwas solny,
Sodu wodorotlenek,
Woda do wstrzykiwań.

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

3 lata.
Wyrzucić po 28 dniach od pierwszego otwarcia butelki.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Brak szczególnych środków ostrożności dotyczących przechowywania.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Butelka z LDPE o pojemności 5 ml z kroplomierzem z LDPE i zakrętką z HDPE z zabezpieczeniem gwarancyjnym.

Tekturowe pudełka zawierające 1 lub 3 butelki z ulotką informacyjną.

Nie wszystkie wielkości opakowań muszą znajdować się w obrocie.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania

Bez specjalnych wymagań.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

PharmaSwiss Česká republika s.r.o.

Jankovcova 1569/2c,

170 00 Prague 7

Republika Czeska

Tel: +420(2)3471-9600

Faks: +420(2)3471-9619

8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

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

Data wydania pierwszego pozwolenia:

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO