

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Allestin, 0,5 mg/ml, krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jeden ml kropli do oczu zawiera 0,5 mg azelastyny chlorowodorku. Jedna kropla zawiera 0,015 mg azelastyny chlorowodorku.

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: 0,125 mg benzalkoniowego chlorku/ml kropli do oczu, roztwór.

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 powyżej 4 lat.

Leczenie objawowe niesezonowego (całorocznego), alergicznego zapalenia spojówek u dorosłych i młodzieży w wieku powyżej 12 lat.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Sezonowe alergiczne zapalenie spojówek

U dorosłych i dzieci w wieku powyżej 4 lat najczęściej podaje się jedną kroplę do każdego oka dwa razy na dobę. W razie konieczności dawkę tę można zwiększyć do jednej kropli, podawanej 4 razy na dobę. Lek Allestin można podawać profilaktycznie przed przewidywanym narażeniem na alergen.

Niesezonowe (całoroczne) alergiczne zapalenie spojówek

U dorosłych i młodzieży w wieku powyżej 12 lat zazwyczaj podaje się jedną kroplę do każdego oka, dwa razy na dobę. W razie konieczności dawkę tę można zwiększyć do jednej kropli podawanej 4 razy na dobę. W badaniach klinicznych potwierdzono skuteczność i bezpieczeństwo stosowania produktu podczas leczenia trwającego maksymalnie 6 tygodni, dlatego jeden cykl leczenia należy ograniczyć do 6 tygodni.

Uwaga dotycząca samoleczenia

Należy poinstruować pacjenta, że leczenie sezonowego zapalenia spojówek przez okres dłuższy niż 6 tygodni powinno odbywać się wyłącznie pod kontrolą lekarską.

Sposób podawania

Podanie do oka.

Krople do oczu należy podawać do worka spojówkowego. Głowę należy lekko odchylić do tyłu.

Krople do oczu należy zawsze stosować w taki sposób, by nie dopuścić do kontaktu końcówki butelki z okiem bądź skórą.

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

Produkt leczniczy Allestin nie jest przeznaczony do leczenia zakażenia oczu.

Produkt leczniczy Allestin zawiera benzalkoniowy chlorek. Może powodować podrażnienie oczu. Należy unikać jego kontaktu z miękkimi soczewkami kontaktowymi. Przed zastosowaniem produktu leczniczego należy wyjąć soczewki kontaktowe z oczu i odczekać 15 minut przed ich ponownym założeniem. Wykazano, że powoduje przebarwienia miękkich soczewek kontaktowych.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Nie przeprowadzono badań dotyczących interakcji chlorowodoru azelastyny po podaniu do oka. Wyniki przeprowadzonych badań interakcji z użyciem tej substancji w dużych dawkach, podawanych doustnie nie mają znaczenia dla produktu leczniczego Allestin, gdyż jej stężenie ogólnoustrojowe po podaniu w postaci kropli do oczu jest na poziomie pikogramów.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Płodność

Badania na zwierzętach z zastosowaniem podawanej doustnie azelastyny w dawkach przekraczających dawki lecznicze wykazały zmniejszenie wskaźnika płodności (patrz punkt 5.3).

Ciąża

Brak wystarczających danych z badań klinicznych dotyczących bezpieczeństwa stosowania azelastyny przez kobiety w ciąży. W badaniach na zwierzętach, w których stosowano duże dawki azelastyny podawanej doustnie, zaobserwowano działania niepożądane (obumarcie płodu, opóźnienie wzrostu płodu i deformacje układu kostnego). Miejscowe podanie doocznego skutkuje niewielkim stężeniem substancji czynnej we krwi (rzędu pikogramów). Jednakże, należy zachować szczególną ostrożność podczas stosowania produktu Allestin w czasie ciąży.

Karmienie piersią

Produkt leczniczy Allestin przenika do mleka kobiecego w niewielkich ilościach. Z tego powodu nie zaleca się stosowania produktu leczniczego Allestin podczas laktacji.

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn

Nie przeprowadzono badań dotyczących wpływu produktu na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn.

Może występować łagodne, przemijające podrażnienie oczu wywołane zakropieniem leku. Jest mało prawdopodobne, aby produkt Allestin, zaburzał widzenie w znacznym stopniu. Jednakże, należy poinformować pacjentów, że w razie wystąpienia jakiegokolwiek przemijającego zaburzenia widzenia nie powinni prowadzić pojazdów, obsługiwać maszyn do momentu powrotu prawidłowej ostrości widzenia.

4.8 Działania niepożądane

Ocenę działań niepożądanych przeprowadzono na podstawie następujących częstości występowania:

Bardzo często ($\geq 1/10$), często ($\geq 1/100$ do $< 1/10$), niezbyt często ($\geq 1/1000$ do $< 1/100$), rzadko ($\geq 1/10\ 000$ do $< 1/1000$), bardzo rzadko ($< 1/10\ 000$), nie znana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zaburzenia układu nerwowego
Niezbyt często: gorzki smak w ustach

Zaburzenia oka
Często: łagodne, przemijające podrażnienie oczu

Zaburzenia układu immunologicznego
Bardzo rzadko: reakcje alergiczne (takie jak wysypka i świąd).

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, Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49 21 301, faks: + 48 22 49 21 309, e-mail: ndl@urpl.gov.pl.

4.9 Przedawkowanie

Po zakropieniu leku do oczu nie są znane specyficzne reakcje przedawkowania i nie są one spodziewane w przypadku tej drogi podania. Nie prowadzono badań dotyczących podawania toksycznych dawek chlorowodoru azelastyny u ludzi. Na podstawie wyników badań przeprowadzonych na zwierzętach można spodziewać się, że po podaniu toksycznej dawki mogą wystąpić zatrucia, zaburzenia centralnego układu nerwowego. Leczenie tych zaburzeń jest objawowe. Nie jest znana odtrutka.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: leki zmniejszające przekrwienie i przeciwalergiczne, inne leki przeciwalergiczne
Kod ATC: S01GX07.

Azelastyna, pochodna ftalazyfonu jest specyficznym, silnym i długo działającym antagonistą receptora H₁, o właściwościach przeciwalergicznych. Dodatkowo po podaniu miejscowym do oka wykazuje działanie przeciwzapalne.

Dane z badań *in vivo* (przedklinicznych) oraz badań *in vitro* wykazały, że azelastyna hamuje syntezę lub uwalnianie mediatorów chemicznych (np. leukotrienów, histaminy, PAF i serotoniny), które uczestniczą we wczesnej i późnej fazie reakcji alergicznej.

U pacjentów leczonych dużymi dawkami azelastyny, podawanej doustnie prowadzono długoterminową ocenę badania EKG. Z badań tych wynika, że po wielokrotnym podaniu azelastyny nie obserwuje się żadnego klinicznego wpływu tego związku na skorygowany odstęp QT (QTc).

U ponad 3700 pacjentów leczonych doustnie azelastyną nie zaobserwowano związku między stosowaniem azelastyny a występowaniem komorowych zaburzeń rytmu serca lub wielokształtnego częstoskurczu komorowego (*torsade de pointes*).

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Charakterystyka ogólna (farmakokinetyka układowa)

Po podaniu doustnym azelastyna szybko się wchłania. Bezwzględna biodostępność wynosi 81%. Jedzenie nie wpływa na szybkość wchłaniania. Duża objętość dystrybucji azelastyny wskazuje, że przenika ona do kompartmentu obwodowego.

Stopień wiązania azelastyny z białkami osocza jest stosunkowo mały (80-90%, poziom zbyt mały, aby brać pod uwagę reakcje wypierania leku).

Biologiczny okres półtrwania po pojedynczym podaniu azelastyny wynosi 20 godzin dla azelastyny i około 45 godzin dla jej głównego, czynnego metabolicznie metabolitu N-demetyloazelastyny. Azelastyna jest usuwana z organizmu głównie z kałem. Niewielkie ilości podanej dawki azelastyny w kale mogą oznaczać, że w wydalaniu azelastyny może także mieć udział krążenie wątrobowo - jelitowe.

Charakterystyka pacjentów (farmakokinetyka po podaniu do oka)

Po podaniu do oka produktu Allestin (po jednej kropli do każdego oka 4 razy na dobę), stężenie maksymalne azelastyny chlorowodoru we krwi było bardzo małe (równe lub mniejsze niż dolna granica oznaczalności).

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

W badaniach wykonywanych na świnkach morskich wykazano, że stosowaniu azelastyny chlorowodoru nie towarzyszy występowanie reakcji nadwrażliwości. Dane z badań *in vitro* i *in vivo* przeprowadzone na szczurach i myszach, nie wykazały genotoksycznego i rakotwórczego działania azelastyny.

U samców i samic szczurów, po podaniu azelastyny w dawkach większych niż 30 mg/kg/dobę zaobserwowano zależne od dawki zmniejszenie wskaźnika płodności. Nie stwierdzono zmian w narządach rozrodczych samców i samic, które mogłyby być spowodowane podawaniem azelastyny podczas badań toksyczności.

W badaniach przeprowadzonych na szczurach, myszach i królikach, działanie teratogenne oraz szkodliwe na zarodek i płód zaobserwowano tylko po podaniu samicom toksycznych dawek azelastyny (np. po podaniu szczurom i królikom dawki azelastyny 50 mg/kg/dobę zaobserwowano zniekształcenia kostne).

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Benzalkoniowy chlorek
Sorbitol ciekły, krystalizujący
Hypromeloza
Disodu edetynian
Sodu wodorotlenek
Woda oczyszczona

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata

Po pierwszym otwarciu opakowania bezpośredniego: 4 tygodnie.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25°C.

Przechowywać butelkę w opakowaniu zewnętrznym w celu ochrony przed światłem.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Przezroczysta butelka LDPE z kroplomierzem i białą zakrętką z HDPE zabezpieczającą przed dostępem dzieci.

1 butelka zawierająca 6 ml kropli do oczu.

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

Pharma Stulln GmbH
Werksstraße 3
92551 Stulln
Niemcy

8. NUMER(-Y) POZWOLENIA(Ń) NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

21249

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

12.06.2013

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO

04.05.2015