

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

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

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

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, bufor fosforanowy 3.42 mg/ml

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.

##### *Stosowanie u osób w podeszłym wieku*

Nie ma potrzeby wprowadzania zmian dawkowania u pacjentów w podeszłym wieku.

##### *Dzieci i młodzież*

Alerpalux może być stosowany u pacjentów pediatrycznych w wieku trzech lat i starszych w takiej samej dawce jak u dorosłych. Nie określono bezpieczeństwa stosowania ani skuteczności produktu leczniczego Alerpalux u dzieci w wieku poniżej 3 lat. Nie ma dostępnych danych.

##### 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 dostosowania dawkowania (patrz punkt 5.2).

##### Sposób podawania

Do stosowania wyłącznie do oka.

Jeśli po zdjęciu nakrętki kołnierz zabezpieczający jest poluzowany, należy go wyrzucić przed zastosowaniem produktu leczniczego. Aby zapobiec zakażeniu końcówki kroplomierza i roztworu zawartego w butelce, należy zachować ostrożność i nie dotykać końcówką kroplomierza powiek, otaczających tkanek ani żadnych powierzchni. Butelkę należy dokładnie zakręcać, kiedy nie jest używana.

W razie jednoczesnego stosowania innych podawanych do oka produktów leczniczych, należy zachować odstęp pięciu minut pomiędzy podaniem kolejnych produktów. Maści do oczu należy stosować na końcu.

#### **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.

Lek zawiera 0.003 mg chlorku benzalkoniowego w każdej kropli co odpowiada 0,1 mg/ml. Chlorek benzalkoniowy może powodować także podrażnienie oczu, zwłaszcza u osób z zespołem suchego oka lub zaburzeniami dotyczącymi rogówki. W razie wystąpienia nieprawidłowych odczuć w obrębie oka, klucia lub bólu w oku po zastosowaniu leku, należy skontaktować się z lekarzem. Konieczne jest staranne monitorowanie pacjentów w przypadku długotrwałego stosowania. Opisywano również przypadki wywoływania przez benzalkoniowy chlorek punktikowatych i (lub) toksycznych, wrzodziejących ubytków rogówki. Wymagane jest staranne monitorowanie pacjentów, którzy często lub długotrwale stosują ten produkt i u których występuje suchość oka lub choroby, w których czynność rogówki jest zaburzona.

##### *Soczewki kontaktowe*

Chlorek benzalkoniowy może być absorbowany przez miękkie soczewki kontaktowe i zmieniać ich zabarwienie. Pacjentów należy poinformować o konieczności usunięcia soczewek kontaktowych przed zakropieniem i odczekaniu co najmniej 15 minut przed ponownym założeniem.

#### **4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji**

Nie przeprowadzono badań dotyczących interakcji z innymi produktami leczniczymi. 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 danych lub istnieją tylko ograniczone dane dotyczące stosowania do oka olopatadyny u kobiet w okresie ciąży.

Badania na zwierzętach wykazały szkodliwy wpływ na reprodukcję po podaniu ogólnym (patrz punkt 5.3).

Nie jest zalecane stosowanie olopatadyny w ciąży i u kobiet w wieku rozrodczym niestosujących odpowiednich metod zapobiegania ciąży.

##### Karmienie piersią

Badania na zwierzętach wykazały, że olopatadyna przenika do mleka po podaniu doustnym (informacja szczegółowa, patrz punkt 5.3).

Nie można wykluczyć zagrożenia dla noworodków/niemowląt.

Nie należy stosować produktu Alerpalux w okresie karmienia piersią.

### Płodność

Nie przeprowadzono badań mających na celu ocenę wpływu miejscowego podania do oka olopatadyny na płodność u ludzi.

### **4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów i obsługiwanie maszyn**

Produkt Alerpalux nie ma wpływu lub wywiera nieistotny 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**

Podsumowanie profilu bezpieczeństwa

W badaniach klinicznych prowadzonych z udziałem 1680 pacjentów, olopatadynę podawano jeden do czterech razy na dobę do obu oczu, przez okres do czterech miesięcy. Produkt stosowano w monoterapii lub jako leczenie uzupełniające do stosowania loratadyny w dawce 10 mg. U około 4,5% pacjentów wystąpiły działania niepożądane związane ze stosowaniem olopatadyny, jednak tylko 1,6% pacjentów przerwało udział w badaniach klinicznych z powodu działań niepożądanych. W badaniach klinicznych nie zgłoszono żadnych, okulistycznych ani ogólnoustrojowych, ciężkich działań niepożądanych, związanych ze stosowaniem olopatadyny. Najczęściej zgłaszanym działaniem niepożądany związanym z leczeniem był ból oka, notowany z ogólną częstością 0,7%.

Tabelaryczne zestawienie działań niepożądanych

W badaniach klinicznych i po wprowadzeniu do obrotu zgłaszano następujące działania niepożądane, które sklasyfikowano zgodnie z następującą konwencją: bardzo często ( $\geq 1/10$ ), często ( $\geq 1/100$  do  $< 1/10$ ), niezbyt często ( $\geq 1/1,000$  do  $< 1/100$ ), rzadko ( $\geq 1/10,000$  do  $< 1/1000$ ), bardzo rzadko ( $< 1/10,000$ ) częstość nieznana (częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych). W obrębie każdej grupy o określonej częstości występowania objawy niepożądane są wymienione zgodnie ze zmniejszającym się nasileniem.

<b>Klasyfikacja Układów i Narządów</b>	<b>Częstość</b>	<b>Działania niepożądane</b>
Zakażenia i zarażenia pasożytnicze	Niezbyt często	nieżyt błony śluzowej nosa
Zaburzenia układu immunologicznego	Nieznana	nadwrażliwość, obrzęk twarzy
Zaburzenia układu nerwowego	Często	bóle głowy, zaburzenia smaku
	Niezbyt często	zawroty głowy, obniżenie czucia dotyku
	Nieznana	senność
Zaburzenia oka	Często	ból oka, podrażnienie oka, suchość oka, nietypowe odczucia w oczach
	Niezbyt często	nadżerki rogówki, nieprawidłowości nabłonka rogówki, choroby nabłonka

		rogówki, punktowe zapalenie rogówki, zapalenie rogówki, plamki na rogówce, wydzielina z oka, światłowstręt, niewyraźne widzenie, zmniejszona ostrość widzenia, kurcz powiek, dyskomfort w oku, świąd oka, grudki na spojówkach, choroby spojówek, uczucie obecności ciała obcego w oczach, zwiększone łzawienie, zaczerwienienie powiek, obrzęk powiek, choroba powiek, przekrwienie spojówek
	Nieznana	obrzęk rogówki, zapalenie spojówek, obrzęk oka, obrzmienie oka, rozszerzenie źrenicy, zaburzenia widzenia, strupki na brzegach powiek
Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia	Często	suchość błony śluzowej nosa
	Nieznana	dusznność, zapalenie zatok
Zaburzenia żołądka i jelit	Nieznana	nudności, wymioty
Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej	Niezbyt często	kontaktowe zapalenie skóry, uczucie pieczenia skóry, suchość skóry
	Nieznana	zapalenie skóry, rumień
Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania	Często	zmęczenie
	Nieznana	osłabienie mięśni, złe samopoczucie

U niektórych pacjentów z poważnym uszkodzeniem rogówki zgłaszano bardzo rzadkie przypadki zwapnienia rogówki związane ze stosowaniem kropli do oczu z zawartością fosforanów.

#### 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.: 22 49-21-301

Faks: 22 49-21-309

e-mail: [ndl@urpl.gov.pl](mailto: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 produktu Alerpalux 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 znaczącego 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 nasilenie przedmiotowych i podmiotowych objawów ze strony nosa, które często towarzyszą sezonowemu alergicznemu zapaleniu spojówek. Nie wywołuje klinicznie istotnej zmiany średnicy źrenicy.

### 5.2 Właściwości farmakokinetyczne

#### Wchłanianie

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.

#### Eliminacja

Z badań farmakokinetycznych wynika, że okres półtrwania olopatadyny w osoczu po podaniu doustnym wynosi około 8 do 12 godzin a eliminacja odbywa się głównie poprzez wydzielanie nerkowe. Około 60-70% dawki wydalą się z moczem w postaci niezmienionej. W moczu wykryto obecność dwóch metabolitów w małych stężeniach: 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 dawki 10 mg olopatadyny podawanej doustnie młodym ochotnikom (średni wiek 21 lat) i ochotnikom w podeszłym wieku (średni wiek 74 lata) 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 farmakokinetykę olopatadyny po podaniu doustnym. Wyniki wskazują, że w tej populacji można oczekiwać nieco większego stężenia olopatadyny w osoczu. Ponieważ po miejscowym podaniu olopatadyny do oczu jej stężenie w osoczu 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.

Badania na zwierzętach wykazały zmniejszony wzrost potomstwa karmiących samic, które otrzymywały ogólnoustrojowe dawki olopatadyny znacznie przekraczające maksymalne zalecane dawki podawane do oka u człowieka. Olopatadynę wykryto w mleku karmiących samic szczura po podaniu doustnym.

## **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.  
Teksturalne pudełko 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**

Bausch Health Ireland Limited  
3013 Lake Drive  
Citywest Business Campus  
Dublin 24, D24PPT3  
Irlandia

**8. NUMERY POZWOLEŃ NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

21874

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

Data wydania pierwszego pozwolenia: 2014-05-19  
Data ostatniego przedłużenia pozwolenia: 2019-05-27

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