

## CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

### 1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Arteoptic, 20 mg/ml, krople do oczu, roztwór

### 2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu 20 mg/ml (2%) zawiera 20 mg chlorowodoru karteololu (*Carteololi hydrochloridum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu: benzalkoniowy chlorek.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

### 3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór

Przezroczysty, bezbarwny, bezwonny, jałowy roztwór.

### 4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

#### 4.1 Wskazania do stosowania

Zmniejszenie ciśnienia śródgałkowego u pacjentów z:

- nadciśnieniem ocznym,
- przewlekłą jaskrą otwartego kąta przesączania.

#### 4.2 Dawkowanie i sposób podawania

##### *Dorośli*

1 kropla produktu leczniczego Arteoptic, krople do oczu, roztwór, 20 mg/ml, 2 razy na dobę do worka spojówkowego chorego oka (oczu).

##### *Pacjenci w podeszłym wieku*

Nie ma konieczności dostosowywania dawki u pacjentów w podeszłym wieku.

##### *Dzieci*

Nie oceniano bezpieczeństwa i skuteczności stosowania karteololu u dzieci.

Przez uciśnięcie kanału nosowo-lzowego lub zamknięcie powiek na 2 minuty zmniejsza się ogólnoustrojowe wchłanianie leku. To z kolei może spowodować zmniejszenie liczby układowych (ogólnoustrojowych) działań niepożądanych i nasilenie miejscowej aktywności.

Aplikator pozostaje jałowy aż do chwili złamania oryginalnego zamknięcia opakowania. Należy poinstruować pacjentów, by unikali dotykania końcówką aplikatora do powierzchni oka lub okolic oka, ponieważ w takim przypadku może dojść do zanieczyszczenia roztworu.

Jeśli ciśnienie śródgałkowe u pacjenta pozostaje na niezadowalającym poziomie przy zastosowaniu tego dawkowania, można rozważyć podanie innych leków zmniejszających ciśnienie śródgałkowe.

Jeśli konieczne jest zakropienie więcej niż jednego leku, należy zachować co najmniej 5-minutowy odstęp pomiędzy zakropieniem kolejnych leków.

### 4.3 Przeciwwskazania

- Nadwrażliwość na substancję czynną (karteolol) lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1.
- Reaktywna choroba dróg oddechowych, w tym astma oskrzelowa lub dodatni wywiad w kierunku astmy oskrzelowej i skurczu oskrzeli, ciężka przewlekła obturacyjna choroba płuc.
- Bradykardia zatokowa, zespół chorego węzła zatokowego, blok zatokowo-przedsionkowy drugiego lub trzeciego stopnia, blok przedsionkowo-komorowy nie kontrolowany przez rozrusznik. Objawowa niewydolność serca, wstrząs kardiogeny.

### 4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Podobnie jak inne leki okulistyczne stosowane miejscowo, karteolol jest wchłaniany ogólnoustrojowo. Ze względu na beta-adrenergiczny składnik, karteolol, mogą wystąpić reakcje ze strony serca i naczyń czy płuc oraz inne działania niepożądane tego samego rodzaju, co obserwowane w przypadku beta-adrenolityków stosowanych ogólnoustrojowo.

Częstość występowania ogólnoustrojowych działań niepożądanych po podaniu miejscowym do oka jest niższa niż w przypadku podania ogólnoustrojowego. Jak zmniejszyć wchłanianie ogólnoustrojowe, patrz punkt 4.2.

#### *Zaburzenia serca*

U pacjentów z chorobami serca i naczyń (np. choroba niedokrwienna serca, dławica Prinzmetala i niewydolność serca) i niedociśnieniem tętniczym leczenie beta-adrenolitykami należy krytycznie ocenić i rozważyć leczenie innymi substancjami czynnymi.

Pacjentów z chorobami układu krążenia należy obserwować pod kątem oznak zaostrzenia się tych chorób i działań niepożądanych.

Ze względu na negatywny wpływ na czas przewodzenia, beta-adrenolityki powinny być podawane ostrożnie u pacjentów z blokiem serca pierwszego stopnia.

#### *Zaburzenia naczyniowe*

Pacjentów z ciężkimi zaburzeniami krążenia obwodowego (np. ciężkie postaci choroby Raynauda lub zespół Raynauda), nieleczonym guzem chromochłonnym nadnercza i niedociśnieniem należy leczyć ostrożnie.

#### *Zaburzenia oddechowe*

Informowano o reakcjach ze strony układu oddechowego, w tym o zgonie spowodowanym skurczem oskrzeli u pacjentów z astmą po podaniu niektórych beta-adrenolityków stosowanych do oczu.

Produkt leczniczy Arteoptic należy stosować ostrożnie u pacjentów z przewlekłą obturacyjną chorobą płuc (POChP) o nasileniu łagodnym lub umiarkowanym, i tylko wtedy, gdy potencjalne korzyści przewyższają potencjalne ryzyko.

#### *Hipoglikemia/cukrzyca*

Beta-adrenolityki należy stosować ostrożnie u pacjentów z występującą samoistną hipoglikemią lub pacjentów z labilną cukrzycą, ponieważ beta-adrenolityki mogą maskować objawy przedmiotowe i podmiotowe ostrej hipoglikemii.

Beta-adrenolityki należy stosować ostrożnie u pacjentów z kwasicą ketonową lub kwasicą metaboliczną.

Beta-adrenolityki mogą również maskować objawy nadczynności tarczycy.

#### *Choroby rogówki*

Beta-adrenolityki stosowane w okulistyce mogą powodować suchość oczu. Pacjentów z chorobami rogówki należy leczyć ostrożnie.

#### *Inne leki beta-adrenergiczne*

Przy stosowaniu karteololu u pacjentów już leczonych beta-adrenolitykami działającymi ogólnie wpływ na ciśnienie wewnątrzgałkowe lub znane ogólnoustrojowe działanie blokujące receptory beta mogą być nasilone.

U tych pacjentów należy uważnie obserwować odpowiedź na lek. Nie zaleca się stosowania dwóch miejscowo działających beta-adrenolityków (patrz punkt 4.5).

#### *Reakcje anafilaktyczne*

Przyjmując leki beta-adrenolityczne pacjenci z dodatnim wywiadem w kierunku atopii lub ciężkich reakcji anafilaktycznych na różne alergenów mogą silniej reagować na wielokrotną stymulację tymi alergenami i mogą nie reagować na typowe dawki adrenaliny stosowane w leczeniu reakcji anafilaktycznych.

#### *Odwarstwienie naczyniówki*

Informowano o odwarstwieniu naczyniówki w wyniku podawania leków hamujących wydzielanie cieczy wodnistej (np. tymolol, acetazolamid) po zabiegach filtracyjnych.

#### *Znieczulenie chirurgiczne*

Beta-adrenolityki stosowane do oczu mogą zablokować ogólnoustrojowe działania  $\beta$ -agonistów, np. adrenaliny. Należy poinformować anestezjologa, że pacjent jest leczony karteololem.

Podobnie jak w przypadku leczenia jaskry innymi lekami, zaleca się regularne badanie ciśnienia śródgałkowego i ocenę rogówki.

#### *Zaburzenia układu nerwowego*

Pacjentów z miastenią należy leczyć ostrożnie. Blokada receptorów beta-adrenergicznych może pogłębiać osłabienie mięśni związane z określonymi objawami miastonii, takimi jak podwójne widzenie, opadanie powiek i ogólne osłabienie.

#### *Pacjenci noszący soczewki kontaktowe*

Karteolol w postaci kropli do oczu zawiera chlorek benzalkoniowy jako środek konserwujący. Dlatego leku nie należy stosować podczas noszenia miękkich soczewek kontaktowych. Przed zakropieniem leku soczewki należy zdjąć i ponownie nałożyć nie wcześniej niż po upływie co najmniej 15 minut.

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

Nie przeprowadzono badań dotyczących interakcji leków z karteololem.

Istnieje ryzyko działania addytywnego, prowadzącego do niedociśnienia i (lub) znacznej bradykardii podczas jednoczesnego podawania beta-adrenolityków w postaci roztworu do oczu z antagonistami kanału wapniowego w postaci doustnej, lekami blokującymi receptory beta-adrenergiczne, lekami przeciwaritmicznymi (w tym amiodaronem), glikozydami naporstnicy, parasympatykomimetykami czy guanetydyną.

Czasami notowano rozszerzenie źrenic wynikające z jednoczesnego stosowania beta-adrenolityków stosowanych do oczu i adrenaliny (epinefryny).

Jeśli pacjent przyjmuje dodatkowy lek okulistyczny, należy zachować co najmniej 5-minutową przerwę pomiędzy podaniem obu produktów.

### **4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację**

#### Ciąża

Brak wystarczających danych dotyczących stosowania karteololu u kobiet w ciąży. Nie należy stosować karteololu w czasie ciąży, chyba że jest to bezwzględnie konieczne. Jak zmniejszyć wchłanianie ogólnoustrojowe, patrz punkt 4.2.

Badania epidemiologiczne nie wykazały wpływu na powstawanie wad rozwojowych, ale pokazują ryzyko opóźnienia wzrostu płodu, gdy beta-adrenolityki podawane są doustnie. Ponadto u noworodków obserwowano objawy przedmiotowe i podmiotowe blokady adrenergicznej beta (np. bradykardię, niedociśnienie, zaburzenia oddechowe i hipoglikemię), kiedy beta-adrenolityki były podawane do czasu porodu. Jeśli produkt leczniczy Arteoptic jest podawany do czasu porodu, noworodka należy uważnie obserwować w pierwszych dniach życia.

#### Karmienie piersią

Beta-adrenolityki przenikają do mleka. Jednak w dawkach terapeutycznych karteololu w postaci kropli do oczu nie jest prawdopodobne, aby w mleku była obecna taka ilość, która powoduje wystąpienie objawów klinicznych stosowania beta-adrenolityków u noworodka. Jak zmniejszyć wchłanianie ogólnoustrojowe, patrz punkt 4.2.

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

Podobnie jak w przypadku innych leków zakraplanych do oczu, jeśli u pacjenta wystąpią jakiegokolwiek zaburzenia widzenia po zakropieniu karteololu w postaci kropli do oczu, należy unikać prowadzenia pojazdów i obsługi maszyn, aż do chwili, gdy widzenie powróci do normy.

#### **4.8 Działania niepożądane**

Podobnie jak inne leki stosowane miejscowo do oczu, karteolol jest wchłaniany ogólnoustrojowo. Może to spowodować działania niepożądane podobne do tych obserwowanych w przypadku beta-adrenolityków działających ogólnoustrojowo. Częstość występowania działań niepożądanych po podaniu miejscowym do oczu jest niższa niż w przypadku leków przyjmowanych ogólnoustrojowo. Wymienione działania niepożądane obejmują reakcje obserwowane w grupie beta-adrenolityków stosowanych do oczu:

##### *Zaburzenia układu immunologicznego:*

Układowe reakcje alergiczne, w tym obrzęk naczynioruchowy, pokrzywka, miejscowe i uogólnione wysypki, świąd, reakcja anafilaktyczna.

##### *Zaburzenia metabolizmu i odżywiania:*

Hipoglikemia

##### *Zaburzenia psychiczne:*

Bezsenność, depresja, koszmary nocne, utrata pamięci.

##### *Zaburzenia układu nerwowego:*

Omdlenia, udar naczyniowy mózgu, niedokrwienie mózgu, nasilenie objawów przedmiotowych i podmiotowych miastenii (nużliwości mięśni), zawroty głowy, parestezje i ból głowy.

##### *Zaburzenia oka*

Objawy przedmiotowe i podmiotowe podrażnienia oczu (np. palenie, pieczenie, swędzenie, łzawienie, zaczerwienienie), uczucie ciała obcego, suchość oka, nadwrażliwość na światło (światłowstręt), zapalenie spojówek, zapalenie brzegów powiek, zapalenie rogówki, obrzęk, zamazane widzenie i odwarstwienie naczyniówki po zabiegu filtracji (patrz punkt 4.4. Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania), zmniejszona wrażliwość rogówki, suchość oczu, erozja rogówki, opadanie powiek, przekrwienie spojówek i podwójne widzenie.

##### *Zaburzenia serca*

Bradykardia, ból w klatce piersiowej, kołatanie serca, obrzęki, zaburzenia rytmu serca, zastoinowa niewydolność serca, blok przedsionkowo-komorowy, zatrzymanie akcji serca, niewydolność serca.

##### *Zaburzenia naczyń:*

Niedociśnienie, zjawisko Raynauda, zimne dłonie i stopy.

#### *Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia*

Skurcz oskrzeli (głównie u pacjentów ze stwierdzoną wcześniej kurczliwością oskrzeli), duszność, kaszel.

#### *Zaburzenia żołądka i jelit:*

Zaburzenia smaku, nudności, niestrawność, biegunka, suchość w ustach, bóle brzucha, wymioty.

#### *Zaburzenia skóry i tkanki podskórnej*

Łysienie, wysypka łuszczycowa lub nasilenie łuszczycy, wysypka skórna.

#### *Zaburzenia mięśniowo-szkieletowe i tkanki łącznej:*

Mialgia.

#### *Zaburzenia układu rozrodczego i piersi:*

Zaburzenia seksualne, zmniejszenie libido.

#### *Zaburzenia ogólne i stany w miejscu podania*

Astenia/zmęczenie

#### 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](mailto:ndl@urpl.gov.pl)

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

## **4.9 Przedawkowanie**

Brak informacji dotyczących doraźnego leczenia przedawkowania u ludzi. W razie przypadkowego przedawkowania kropli do oczu, oczy należy przemyć wodą lub roztworem soli fizjologicznej.

Do najczęstszych objawów jakich można się spodziewać po przedawkowaniu leku blokującego receptory beta-adrenergiczne należą zawroty głowy, ból głowy, duszność, objawowa bradykardia, niedociśnienie, skurcz oskrzeli i ostra niewydolność serca. W razie przedawkowania można zastosować standardowe leczenie.

## **5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE**

### **5.1 Właściwości farmakodynamiczne**

Grupa farmakoterapeutyczna: Preparaty przeciwjaskrowe i miotyki, środki beta-adrenolityczne.

Kod ATC: S01ED05

Nazwa chemiczna: Chlorowodorek 5-(3-tert-butyloamino-2-hydroksypropoksy)-3,4-dihydro-2(1H)chinolinonu

Karteolol jest nieselektywnym lekiem blokującym receptory beta-adrenergiczne, posiadającym wewnętrzną aktywność sympatykomimetyczną (ISA) i bez istotnej aktywności stabilizowania błony. Wykazano, że środki beta-adrenolityczne z ISA w mniejszym stopniu wpływają na objętość minutową

serca, spoczynkową częstość akcji serca, opór naczyń obwodowych i w konsekwencji na krążenie obwodowe niż beta-adrenolityki bez ISA.

Karteolol obniża prawidłowe i podwyższone ciśnienie śródgałkowe, niezależnie od obecności jaskry. Dokładny mechanizm zmniejszania ciśnienia w oku przez beta-adrenolityki nie został ostatecznie wyjaśniony. Wydaje się jednak, że leki blokujące receptory beta-adrenergiczne stosowane w okulistyce działają głównie przez zmniejszenie ilości wytwarzanej cieczy wodnistej.

Karteolol w postaci kropli do oczu skutecznie zmniejszał ciśnienie śródgałkowe u pacjentów z jaskrą lub nadciśnieniem ocznym, gdy lek podawano miejscowo dwa razy na dobę w ramach badań klinicznych. Nie stwierdzono żadnego istotnego wpływu na czucie rogówki, wydzielanie łez lub wielkość źrenicy.

Podanie karteololu do oczu u zwierząt i zdrowych ludzi wykazało, że zwiększa on prędkość przepływu krwi przez tkanki tęczówki lezonego oka u królików oraz nasila przepływ krwi przez tkanki nerwu wzrokowego u ludzi.

Podczas gdy miejscowe nieselektywne leki beta-adrenolityczne zmniejszają stężenie HDL w surowicy i pogarszają stosunek całkowitego cholesterolu do HDL, beta-adrenolityki z wewnętrzną aktywnością sympatykomimetyczną wydają się mieć mniejszy wpływ na te parametry lub być zupełnie neutralne.

## **5.2 Właściwości farmakokinetyczne**

Jednorazowe zakroplenie do oczu królika 2% roztworu chlorowodoru karteololu znakowanego <sup>14</sup>C wykazało, że karteolol szybko przenika przez rogówkę. Największe stężenia stwierdzono w rogówce, tęczówce, przedniej części twardówki, ciele rzęskowym i spojówkach po upływie 30 do 60 minut od podania dawki, jednak stężenia te szybko zmniejszyły się od 5 do 10% stężeń maksymalnych po 8 godzinach.

8-hydroksylacja przez CYP2D6 jest jedyną reakcją katalizowaną przez cytochrom P450. Karteolol nie wykazuje ani działania pobudzającego, ani hamującego na CYP1A2, 2C9, 2C19, 2E1 i 3A4. 8-hydroksykarteolol został oceniony jako silniej obniżający ciśnienie wewnątrzgałkowe (IOP – *intraocular pressure*) niż karteolol, zarówno u królików, jak i u małp. Brak dostępnych danych dotyczących metabolizmu karteololu po zaaplikowaniu do oczu u ludzi.

Zdrowym ochotnikom zakraplano jedną kroplę 2% roztworu chlorowodoru karteololu do każdego oka. Około 16% dawki zostało wydalone z moczem w postaci niezmienionej w ciągu pierwszych 24 godzin po zakropieniu. Okres półtrwania w fazie eliminacji z moczem wynosił około 5 godzin. Stężenia chlorowodoru karteololu w osoczu po podaniu miejscowym do oka kształtowały się poniżej poziomu wykrywalności (5 ng/ml).

## **5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie**

Dane przedkliniczne, uwzględniające wyniki konwencjonalnych badań toksyczności po podaniu wielokrotnym, genotoksyczności, potencjalnego działania rakotwórczego i toksycznego wpływu na reprodukcję, nie ujawniają występowania szczególnego zagrożenia dla człowieka.

## **6. DANE FARMACEUTYCZNE**

### **6.1 Wykaz substancji pomocniczych**

Benzalkoniowy chlorek, sodu chlorek, sodu diwodorofosforan dwuwodny, disodu fosforan dwunastowodny, woda do wstrzykiwań.

## **6.2 Niezgodności farmaceutyczne**

Nie dotyczy.

## **6.3 Okres ważności**

2 lata.

Po pierwszym otwarciu butelki: 28 dni.

## **6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania**

Przechowywać w temperaturze poniżej 25°C.

## **6.5 Rodzaj i zawartość opakowania**

5 ml butelka z kroplomierzem z LDPE, zamknięta zakrętką z pierścieniem gwarancyjnym z HDPE w tekturowym pudełku.

## **6.6 Szczególne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowywania produktu leczniczego do stosowania**

Bez specjalnych wymagań.

## **7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Laboratoires THEA  
12 rue Louis Blériot  
63017 Clermont-Ferrand Cedex 2  
Francja

## **8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU**

Pozwolenie nr 7565

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

Data wydania pierwszego pozwolenia na dopuszczenie do obrotu: 05.03.1998 r.

Data ostatniego przedłużenia pozwolenia:

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