

ИНСТРУКЦИЯ

ПО МЕДИЦИНСКОМУ ПРИМЕНЕНИЮ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Олопатадин

Регистрационный номер:

Торговое наименование: Олопатадин

Международное непатентованное или группировочное наименование:
олопатадин

Лекарственная форма: капли глазные

Состав на 1 мл препарата:

Действующее вещество: олопатадина гидрохлорид – 1,11 мг в пересчете на олопатадин – 1,00 мг.

Вспомогательные вещества: бензалкония хлорид – 0,10 мг, динатрия гидрофосфат дигидрат – 6,00 мг, натрия хлорид – 6,00 мг, хлористоводородной кислоты раствор 1 М или натрия гидроксида раствор 1 М – до pH 7,0-7,2, вода для инъекций – до 1,00 мл.

Описание:

Прозрачный бесцветный или слегка желтоватый раствор.

Фармакотерапевтическая группа: противоаллергическое средство – H1-гистаминовых рецепторов блокатор

Код АТХ: S01GX09

Фармакологические свойства

Фармакодинамика

Олопатадин является сильнодействующим селективным противоаллергическим/антигистаминным средством, имеющим несколько выраженных механизмов действия.

Он противодействует гистамину (первичный медиатор аллергической реакции у человека) и предотвращает индуцированную гистамином продукцию воспалительных цитокинов эпителиальными клетками конъюнктивы человека. Данные исследований *in vitro* показывают, что он может действовать на тучные клетки конъюнктивы человека, подавляя высвобождение провоспалительных медиаторов. У пациентов с сохраненной проходимостью носослезного канала местное офтальмологическое применение олопатадина уменьшало назальные признаки и симптомы, которые часто сопровождают сезонный аллергический конъюнктивит. Олопатадин не вызывает клинически значимого изменения диаметра зрачка.

Фармакокинетика

Всасывание

Олопатадин всасывается системно, как и другие лекарственные средства для местного применения. Системное всасывание олопатадина при местном применении минимально и составляет от $<0,5$ нг/мл до 1,3 нг/мл в плазме. Эти концентрации в 50-200 раз; ниже, чем при пероральном применении препарата в дозах, которые хорошо переносятся.

Выведение

По данным фармакокинетических исследований пероральных форм олопатадина период полувыведения составляет от 8 до 12 часов, выведение препарата осуществляется преимущественно почками. 60-70 % введенной дозы выводиться с мочой в неизменном виде, также в моче определяются низкие концентрации 2 метаболитов – молодесметина и н-оксида.

В связи с тем, что олопатадин выводится почками преимущественно в неизменном виде, нарушение работы почек приводит к изменению фармакокинетики олопатадина, приводя к значительному (в 2, 3 раза) повышению концентрации

олопатадина в плазме у пациентов с тяжёлой почечной недостаточностью (клиренс креатинина 13 мл/мин). Концентрация олопатадина в плазме после его местного применения в виде инстилляций в 50-200 раз ниже, чем при пероральном применении терапевтических доз, следовательно, изменение режима дозирования у пациентов с нарушениями функции почек не требуется. Метаболизм в печени является второстепенным путем выведения. Поскольку печеночный путь элиминации не является основным для олопатадина, не требуется коррекции дозы при применении пациентами с нарушениями функции печени. После перорального приема 10 мг олопатадина пациентами на гемодиализе концентрация олопатадина в плазме была значительно ниже в день проведения гемодиализа в сравнении с днями, когда гемодиализ не проводился. Это свидетельствует о том, что выведение олопатадина с помощью гемодиализа возможно. По результатам сравнительных исследований фармакокинетики пероральной лекарственной формы олопатадина в концентрации 10 мг у молодых (средний возраст – 21 год) и пожилых пациентов (средний возраст – 74 года) не отмечено значимых различий в концентрациях олопатадина в плазме, связывания с белками плазмы и параметрах выведения препарата в неизменном виде и в виде метаболитов.

Фармакокинетика у особых групп пациентов

Пациенты пожилого возраста и пациенты с почечной недостаточностью

Поскольку концентрации в плазме после местного офтальмологического применения олопатадина в 50-200 раз ниже, чем после приема хорошо переносимых пероральных доз, коррекция дозы у пациентов пожилого возраста или пациентов с почечной недостаточностью не требуется.

Пациенты с печеночной недостаточностью

Считается, что необходимость в коррекции дозы у пациентов с нарушением функции печени отсутствует.

Показания к применению

Препарат Олопатадин показан к применению у детей с 3 лет и взрослых для лечения симптомов сезонного аллергического конъюнктивита.

Противопоказания

Гиперчувствительность к олопатадину или любому из вспомогательных веществ препарата, период грудного вскармливания.

С осторожностью

У пациентов с сопутствующим синдромом «сухого» глаза и заболеваниями роговицы.

Применение во время беременности и в период грудного вскармливания

Фертильность

Исследования по оценке влияния олопатадина на репродуктивную функцию человека после местного офтальмологического применения не проводились.

Беременность

Данные относительно офтальмологического применения олопатадина у беременных женщин отсутствуют, или их количество ограничено. Исследования на животных показали репродуктивную токсичность после системного применения.

Не рекомендуется применять олопатадин во время беременности и женщинам репродуктивного возраста, не применяющих контрацепцию.

Период грудного вскармливания

Имеющиеся данные исследований на животных показали, что олопатадин проникает в грудное молоко после перорального применения.

Нельзя исключать риск для новорожденных детей/младенцев грудного возраста.

Не следует применять олопатадин в период грудного вскармливания.

Способ применения и дозы

Только для применения в офтальмологии.

Взрослые

Доза составляет 1 каплю препарата Олопатадин в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз) 2 раза в сутки (с интервалом в 8 часов).

Дети

Препарат Олопатадин можно применять у детей в возрасте от 3 лет и старше в той же дозе, что и у взрослых.

Безопасность и эффективность олопатадина у детей в возрасте до 3 лет не установлена. Данные отсутствуют.

При необходимости длительность лечения может составлять до 4 месяцев.

В случае сопутствующей терапии другими местными офтальмологическими средствами, следует соблюдать 5-минутный интервал между последовательными применениями препаратов. Глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Перед закапыванием глазных капель:

- При первом применении, прежде чем закапать капли в глаза, следует потренироваться закапывать по одной капле из флакона в воздух, подальше от глаз, медленно сжимая флакон.
- Когда пациент уверен, что он может закапать по одной капле за один раз, следует выбрать удобное положение для закапывания капель (сидя, лежа на спине или стоя перед зеркалом).

Порядок работы с флаконом-капельницей:

1. Перед применением препарата необходимо тщательно вымыть руки.
2. Нельзя использовать препарат, если упаковка или флакон повреждены.
3. При первом применении убедитесь, что не нарушена герметичность кольца контроля первого вскрытия на крышке. При отвинчивании крышки ощущается легкое сопротивление до тех пор, пока кольцо контроля первого вскрытия не сломается.
4. После отделения кольца контроля первого вскрытия его следует выбросить, чтобы оно не попало в глаз.
5. Пациент должен слегка наклонить голову назад и осторожно оттянуть нижнее веко вниз, чтобы образовался мешочек между глазом и веком (следует избегать контакта между кончиком капельницы и глазом, веком или пальцами).
6. Препарат следует закапывать, плавно надавливая на середину флакона. Возможна задержка в несколько секунд между нажатием на флакон и вытеканием капли. Не рекомендуется сжимать флакон слишком сильно. В случае затруднений в применении препарата, следует обратиться к врачу, фармацевту или медсестре.
7. Пациент должен повторить шаги 5 и 6 для другого глаза, если врач рекомендовал ему сделать это.

8. После использования и перед повторным применением препарата, флакон следует встряхнуть один раз в направлении вниз, не касаясь кончика капельницы, чтобы удалить остатки жидкости на кончике. Это необходимо для обеспечения доставки последующих капель. Затем флакон плотно закрыть крышкой.

В случае сопутствующей терапии другими топическими глазными лекарственными средствами между последовательными применениями должен быть интервал в 5 минут.

Глазные мази следует назначать последними.

Побочное действие

В клинических исследованиях с участием 1680 пациентов режим дозирования составлял от 1 до 4 капель в день, длительность курса терапии составляла до 4 месяцев, применение олопатадина проводилось как в монотерапии, так и совместно с лоратадином в дозировке 10 мг. Общая частота встречаемости нежелательных реакций (НР) составила порядка 4,5 %, в то время как прекращение участия в клиническом исследовании вследствие развития НР отмечено только в 1,6 % случаев. В ходе клинических исследований не отмечено серьезных НР как со стороны органа зрения, так и со стороны организма в целом. Наиболее частой НР, связанной с лечением, была боль в глазу, это явление отмечалось у 0,7 % пациентов.

Следующие нежелательные реакции (НР) отмечались в ходе клинических исследований и пострегистрационного применения препарата и классифицированы согласно следующей градации частоты встречаемости НР: очень часто ($\geq 1/10$), часто (от $\geq 1/100$ до $< 1/10$), нечасто (от $\geq 1/1000$ до $< 1/100$), редко (от $\geq 1/10000$ до $< 1/1000$), очень редко ($< 1/10000$), частота неизвестна (частота встречаемости не может быть определена на основании имеющихся данных).

Инфекции и инвазии

Нечасто: ринит.

Нарушения со стороны иммунной системы

Частота неизвестна: гиперчувствительность, отечность лица.

Нарушение со стороны нервной системы

Часто: головная боль, дисгевзия.

Нечасто: головокружение, гипестезия.

Частота неизвестна: сонливость.

Нарушения со стороны органа зрения

Часто: боль в глазу, раздражение глаза, синдром «сухого глаза», необычные ощущения в глазу.

Нечасто: эрозия роговицы, дефект эпителия роговицы, точечный кератит, кератит, накопление красящего пигмента в области дефекта роговицы при проведении диагностических проб, выделения из глаз, светобоязнь, затуманивание зрения, снижение остроты зрения, блефароспазм, дискомфорт в глазу, зуд в глазу, фолликулез конъюнктивы, нарушения со стороны конъюнктивы, чувство инородного тела в глазу, слезотечение, эритема век, отек век, нарушения со стороны век, конъюнктивальная инъекция.

Частота неизвестна: отек роговицы, отек конъюнктивы, конъюнктивит, мидриаз, нарушение зрительных функций, корочки на краях век.

Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения

Часто: сухость в носу.

Частота неизвестна: диспноэ, синусит.

Желудочно-кишечные нарушения

Частота неизвестна: тошнота, рвота.

Нарушения со стороны кожи и подкожной клетчатки

Нечасто: контактный дерматит, чувство жжения кожи, сухость кожи.

Частота неизвестна: дерматит, эритема.

Общие нарушения и реакции в месте введения

Часто: повышенная утомляемость.

Частота неизвестна: астения, чувство недомогания.

В очень редких случаях при применении фосфатсодержащих капель пациентам с сопутствующим значительным повреждением роговицы развивалась кальцификация роговицы.

Передозировка

Нет данных о передозировке у человека в результате случайного или преднамеренного проглатывания. Олопатадин имеет низкий уровень острой токсичности у животных. При случайном проглатывании всего содержимого флакона с препаратом Олопатадин максимальное системное воздействие олопатадина составляет 5 мг. Это воздействие могло бы привести к конечной дозе 0,5 мг/кг для младенца с массой тела 10 кг при условии 100%-й абсорбции. *Симптомы*

Удлинение интервала QTc у собак наблюдалось только при воздействии, которое считалось значительно превышающим максимальное воздействие на человека, что указывает на незначительное отношение к клиническому применению.

В исследовании с участием 102 здоровых добровольцев молодого и пожилого возраста мужского и женского пола, которые получали перорально дозу 5 мг 2 раза в день в течение 2,5 дней, не наблюдалось значительного удлинения интервала QTc по сравнению с плацебо. Диапазон максимальных равновесных концентраций олопатадина в плазме (от 35 до 127 нг/мл), наблюдаемый в этом исследовании, представляет собой по крайней мере 70-кратный предел безопасности для местного применения олопатадина в отношении воздействия на реполяризацию сердца.

Лечение

В случае передозировки необходимо обеспечить надлежащее наблюдение и лечение пациента.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами

Исследования взаимодействия с другими препаратами не проводились. Исследования *in vitro* показали, что, олопатадин не ингибирует метаболические реакции, в которых участвуют изоферменты цитохрома P-450 1A2, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4. Данные результаты показывают, что олопатадин вряд ли приведет к метаболическим взаимодействиям с другими одновременно вводимыми активными препаратами.

Особые указания

После местного применения олопатадина возможно системное всасывание. При наличии признаков НР; или реакций гиперчувствительности необходимо прекратить приём препарата.

Олопатадин содержит бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение глаз и изменять цвет, мягких контактных линз.

Следует избегать контакта препарата с мягкими контактными линзами. Пациентов следует предупреждать о необходимости снимать контактные линзы перед применением препарата снова устанавливать их не ранее, чем через 15 минут после инстилляций. При частом или длительном применении препарата бензалкония хлорид может обуславливать возникновение точечного кератита или токсической язвенной кератопатии при наличии у пациентов синдрома «сухого» глаза или патологии роговицы.

Влияние на способность управлять транспортными средствами, механизмами

Олопатадин не оказывает или оказывает незначительное влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами. Как и в случае с любыми глазными каплями, после закапывания возможно временное затуманивание зрения или другие нарушения зрения, что может негативно повлиять на способность управлять транспортными средствами или механизмами. Если при применении препарата возникает нечеткость зрения, пациенту необходимо подождать до восстановления четкости, зрительного восприятия, прежде чем приступать к управлению транспортными средствами или работе с механизмами.

Форма выпуска

Капли глазные, 0,1 %.

По 2,5 мл, 5 мл или 10 мл препарата помещают во флакон-капельницу полимерную из полиэтилена высокого давления с крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления и пробкой-капельницей из полиэтилена низкого давления объемом 5 мл (для розлива 2,5 мл или 5 мл препарата) или объемом 10 мл (для розлива 5 мл или 10 мл препарата) или во флакон-капельницу полимерный из полиэтилена высокого давления с винтовой горловиной, крышкой навинчиваемой из полиэтилена низкого давления и пробкой-капельницей из полиэтилена низкого или высокого давления, вместимостью 5 мл (для розлива 2,5 мл или 5 мл препарата) или вместимостью 10 мл (для розлива 5 мл или 10 мл препарата).

По 2,5 мл, 5 мл или 10 мл препарата помещают в стерильные полимерные флаконы-капельницы, изготовленные по технологии «blow-fill-seal» «выдувание-наполнение-герметизация» из полиэтилена низкой плотности высокого давления, герметично закрытые крышками навинчиваемыми из полиэтилена низкой плотности.

По 1 полимерному флакону-капельнице с инструкцией по медицинскому применению помещают в пачку из картона или хром-эрзац.

Условия хранения

В защищенном от света месте при температуре не выше 25 °С. Хранить в недоступном для детей месте.

Срок годности

2 года. После вскрытия флакон хранить не более 30 дней. Не применять по истечении срока годности, указанного на упаковке.

Условия отпуска

Отпускают по рецепту.

Юридическое лицо, на имя которого выдано регистрационное удостоверение

ООО «КОСМОФАРМ», Россия

107076, г. Москва, ул. Стромынка, д. 19, корп. 2, пом 128, ком 7.

тел.: +7(495) 644-00-31

факс: +7(495) 644-00-32

Производитель/ Организация, принимающая претензии потребителей

ООО «Славянская аптека», Россия, 601125, Владимирская обл., Петушинский район,
пос. Вольгинский

тел.: тел.: +7 (495) 510-60-95

сайт: www.slavapteca.ru

Представитель компании



Бородина Е. Н.