

## **Состав**

*действующее вещество:* олопатадин;

1 мл олопатадина содержит 1 мг (в виде гидрохлорида);

*вспомогательные вещества:* бензалкония хлорид, натрия хлорид, натрия фосфат додекагидрат, соляная кислота и / или натрия гидроксид (для регулирования pH), вода очищенная.

## **Лекарственная форма**

Капли глазные.

*Основные физико-химические свойства:* стерильный прозрачный раствор от бесцветного до светло-желтого цвета.

## **Фармакотерапевтическая группа**

Средства для применения в офтальмологии. Противоотечные и антиаллергические средства. Код АТХ S01G X09.

## **Фармакодинамика**

Олопатадин является сильнодействующим селективным противоаллергическим / антигистаминным средством, имеет несколько выраженных механизмов действия. Он противодействует высвобождению гистамина (основного медиатора аллергической реакции у людей) и предотвращает стимулированию выработки цитокинов эпителиальными клетками конъюнктивы человека, которое обусловлено гистамином. Данные исследований *in vitro* свидетельствуют, что препарат действует на тучные клетки конъюнктивы человека, подавляя высвобождение медиаторов воспаления. Отмечалось, что местное офтальмологическое применение препарата ОПАТАНОЛ® у пациентов с сохраненной проходимостью носослезного канала уменьшает назальные признаки и симптомы, которые часто сопровождают сезонный аллергический конъюнктивит. Препарат не вызывает клинически значимых изменений диаметра зрачка.

Доклинические данные, полученные при проведении стандартных исследований по безопасности, фармакологии, токсичности повторных доз, генотоксичности, исследований канцерогенного потенциала и токсического влияния на репродуктивную функцию, не показали какой-либо опасности для человека.

Исследования на животных показали задержку развития щенков при их грудном вскармливании самками, которые получали системные дозы олопатадина в дозах, превышала максимальную рекомендованную для офтальмологического применения человеку. Олопатадин оказывался в молоке кормящих крыс после перорального применения.

### **Фармакокинетика**

Олопатадин абсорбируется системно, как и другие лекарственные средства для местного применения. Однако при местном применении олопатадина системная абсорбция является минимальной, а концентрация в плазме крови - в пределах ниже уровня количественного определения ( $<0,5$  нг / мл) до  $1,3$  нг / мл. Эти концентрации в 50-200 раз ниже, чем при пероральном применении препарата в дозах, хорошо переносятся.

Исследования по фармакокинетике при пероральном применении показали, что период полувыведения олопатадина из плазмы крови составляет приблизительно 8-12 часов, препарат выводится преимущественно почками. Примерно 60-70% дозы было выявлено в моче в виде активного вещества. Два метаболита моно-десметил и N-оксид были обнаружены в моче в низких концентрациях.

Поскольку олопатадин выводится с мочой, главным образом в виде неизмененного активного вещества, фармакокинетика олопатадина изменяется при нарушениях функции почек, пиковые концентрации в плазме крови у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (средний клиренс креатинина -  $13$  мл / мин) в 2-3 раза выше по сравнению с таковыми у здоровых взрослых добровольцев. При проведении гемодиализа пациентам после приема препарата в дозе  $10$  мг концентрация олопатадина в плазме крови была значительно меньше в день проведения гемодиализа, чем в день, когда он не проводился, что дает основание предположить, что вывод олопатадина произошло в процессе гемодиализа.

В сравнительных исследованиях по фармакокинетике при пероральном приеме дозы  $10$  мг молодыми людьми (средний возраст -  $21$  год) и лицами пожилого возраста (средний возраст -  $74$  года) какой-либо существенной разницы между концентрациями в плазме, связыванием с белком, выводом с мочой неизмененной лекарственного вещества и метаболитов не обнаружено.

Были проведены исследования олопатадина при пероральном применении пациентам с тяжелой почечной недостаточностью. Результаты свидетельствуют, что в этой категории пациентов можно ожидать некоторой степени высокую концентрацию в плазме при применении препарата ОПАТАНОЛ®. Поскольку

концентрации в плазме после местного офтальмологического применения олопатадина в 50-200 раз ниже, чем при пероральном применении препарата в дозах, хорошо переносятся, нет необходимости корректировать дозы для пожилых людей и пациентов с нарушениями функции почек. Метаболизм в печени не является главным путем элиминации препарата. Поэтому нет необходимости в коррекции дозы для пациентов с нарушениями функции печени.

## **Показания**

Лечение сезонных аллергических конъюнктивитов.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к олопатадину или к вспомогательному веществу препарата.

## **Взаимодействие с другими лекарственными средствами и другие виды взаимодействий**

Исследований взаимодействия препарата ОПАТАНОЛ® с другими лекарственными средствами не проводили.

Исследования *in vitro* показали, что олопатадин не угнетает метаболические реакции изоферментов 1A2, 2C8, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 и 3A4 цитохрома P450. Эти результаты свидетельствуют о том, что олопатадин не вызывает метаболического взаимодействия с другими активными веществами в случае их одновременного применения.

## **Особенности применения**

ОПАТАНОЛ® является противоаллергическим / антигистаминным средством, применяется местно, но абсорбируется системно. При любых признаках серьезных реакций или повышенной чувствительности следует прекратить применение препарата.

ОПАТАНОЛ® содержит бензалкония хлорид, который может вызвать раздражение глаза.

Сообщалось также, что бензалкония хлорид может вызвать точечную кератопатию и / или токсическое язвенной кератопатию. Следует внимательно наблюдать за пациентами с синдромом сухого глаза или повреждениями роговицы, которые часто или в течение длительного времени используют

препарат.

### *Контактные линзы*

Бензалкония хлорид, как известно, может обесцвечивать контактные линзы. Следует избегать контакта с мягкими контактными линзами. Пациентов следует проинформировать о том, что перед применением препарата необходимо снять контактные линзы и подождать не менее 15 минут после закапывания и только тогда снова одеть контактные линзы.

### **Способность влиять на скорость реакции при управлении автотранспортом или работе с механизмами**

ОПАТАНОЛ® не имеет или имеет незначительное влияние на способность управлять автотранспортом и другими механизмами. Как и при применении любых глазных капель, временное помутнение зрения или другие нарушения зрения могут влиять на способность управлять автотранспортом или работать с механизмами. Если нечеткость зрения возникает во время закапывания, пациенту необходимо подождать, пока зрение восстановится, прежде чем управлять автотранспортом или работать с механизмами.

### **Применение в период беременности или кормления грудью**

#### *Беременность*

Данные по офтальмологическому применению олопатадина беременным женщинам отсутствуют или их количество ограничено. Исследования на животных показали репродуктивной токсичности после системного применения (см. Раздел «Фармакологические свойства»). Олопатадина не рекомендуется применять беременным и женщинам репродуктивного возраста, не использующие контрацептивные средства.

#### *Кормление грудью*

Исследования на животных показали, что олопатадин проникает в грудное молоко после перорального применения (подробно см. «Фармакологические свойства»). Нельзя исключать риск для новорожденных / детей грудного возраста. ОПАТАНОЛ® не следует применять в период кормления грудью.

#### *Репродуктивная функция*

Исследований влияния олопатадина на репродуктивную функцию человека после местного офтальмологического применения не проводили.

## **Способ применения и дозы**

*Только для офтальмологического применения.*

В конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз) следует закапывать по 1 капле препарата ОПАТАНОЛ® два раза в сутки (с интервалом в 8:00). В случае необходимости лечение может длиться до 4-х месяцев.

*Применение у пациентов пожилого возраста.*

Нет необходимости в корректировке дозы для этой категории пациентов.

*Применение детям и подросткам.*

ОПАТАНОЛ® можно применять в педиатрической практике детям в возрасте от 3 лет в той же дозировке, что и взрослым. Безопасность и эффективность применения препарата ОПАТАНОЛ® детям до 3 лет не изучена. Данные по этой возрастной категории отсутствуют.

*Применение при нарушениях функции печени и почек.*

Исследований олопатадина в форме глазных капель (ОПАТАНОЛ®) пациентам с нарушениями функции печени или почек не проводили. Однако нет необходимости в корректировке дозы в случае нарушений функции печени или почек (см. Раздел «Фармакокинетика»).

После вскрытия флакона следует снять защитное кольцо, предназначенное для контроля вскрытия.

Чтобы предупредить загрязнение края капельницы и содержимого флакона, необходимо соблюдать осторожность и не касаться века или других поверхностей краем флакона-капельницы. После каждого использования следует плотно закрывать флакон-капельница.

Если местно применяют более одного офтальмологического средства, интервал между их применением должен составлять не менее 5 минут. Глазные мази следует применять в последнюю очередь.

### **Дети**

ОПАТАНОЛ® можно применять детям в возрасте от 3 лет в той же дозировке, что и взрослым.

### **Передозировка**

Нет данных о передозировке у человека при случайном или преднамеренном глотании. Олопатадина выявил низкий уровень острой токсичности у животных. Случайное проглатывание содержания всего флакона препарата ОПАТАНОЛ® приведет к максимальной системного действия 5 мг олопатадина. Это действие может проявиться при конечной дозе 0,5 мг / мл у ребенка с массой тела 10 кг при 100% абсорбции.

Увеличение интервала QT у собак наблюдалось только при дозах, существенно превышающих максимальную дозу для человека, указывая на маловероятность увеличения интервала QT при клиническом применении. В исследовании с участием 102 здоровых добровольцев, молодых мужчин и женщин, людей пожилого возраста, получавших 5 мг дважды в сутки на протяжении 2,5 дня, наблюдалось незначительное увеличение интервала QT по сравнению с соответствующим показателем при применении плацебо. В этом исследовании установлены равные пиковых концентраций олопатадина в плазме (от 35 до 127 нг / мг) минимум в 70 раз превышали уровне при местном применении олопатадина по влиянию на сердечную реполяризацию.

В случае передозировки необходимо провести соответствующее обследование и лечение пациента.

### **Побочные реакции**

В ходе клинических исследований с участием 1680 пациентов ОПАТАНОЛ® применяли от 1 до 4 раз в день в оба глаза в течение четырех месяцев в качестве монотерапии или в качестве дополнительной терапии к лоратадину 10 мг. Побочные эффекты, связанные с применением препарата ОПАТАНОЛ®, наблюдались примерно в 4,5% пациентов; однако только 1,6% из них были исключены из клинических исследований в связи с возникновением этих побочных эффектов. При проведении клинических исследований не было сообщений о каких-либо серьезных офтальмологических или системных побочных эффектах, связанных с применением препарата. Частым побочным эффектом при применении препарата ОПАТАНОЛ® был глазной боли с частотой возникновения 0,7%.

Следующие побочные реакции отмечались в течение клинических исследований и в постмаркетинговый период и классифицированы по частоте: очень часто ( $\geq 1 / 10$ ), часто ( $> 1/100$ ,  $< 1/10$ ), нечасто ( $> 1/1000$ ,  $\leq 1 / 100$ ), единичные ( $> 1/10000$ ,  $\leq 1 / 1000$ ), редко ( $\leq 1 / 10\ 000$ ) или частота неизвестна (невозможно оценить частоту их возникновения из существующих данных). В рамках каждой группы побочные реакции представлены в порядке уменьшения их степени тяжести.

<b>Классы систем органов</b>	<b>Частота</b>	<b>Побочные реакции</b>
Инфекции и инвазии	Нечасто	Ринит
Со стороны иммунной системы	Частота неизвестна	Повышенная чувствительность, пр лица
Со стороны нервной системы	Часто	Головная боль, дисгевзия
	Нечасто	Головокружение, гипестезия
	Частота неизвестна	Сонливость
Офтальмологические нарушения	Часто	Боль в глазу, раздражение глаза, с глаза, аномальная чувствительность
	Нечасто	Эрозия роговицы, повреждения эп роговицы, нарушения со стороны э роговицы, точечный кератит, керат окраска роговицы, выделения из гл светобоязнь, помутнение зрения, с остроты зрения, блефароспазм, чу дискомфорта в глазу, зуд глаз, конъюнктивальные фолликулы, на стороны конъюнктивы, ощущение м тела в глазу, усиленное слезотечен эритема век, отек век, нарушения с век, гиперемия глаза
	Частота неизвестна	Отек роговицы, отек глаза, припух конъюнктивит, мидриаз, нарушения образование чешуек по краям век

Со стороны респираторной системы, торакальные и медиастинальные нарушения	Часто	Сухость в носу
	Частота неизвестна	Диспное, синусит
Со стороны желудочно-кишечного тракта	Частота неизвестна	Тошнота, рвота
Со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто	Контактный дерматит, ощущение жжения на коже, сухость кожи
	Частота неизвестна	Дерматит, эритема
Общие нарушения и состояния, связанные с местом введения	Часто	Повышенная утомляемость
	Частота неизвестна	Астения, слабость

У пациентов со значительным поражением роговицы очень редко сообщалось о случаях кальцификации роговицы при применении глазных капель, содержащих фосфаты.

Предоставление сообщений о подозреваемых побочных реакциях на зарегистрированное лекарственное средство является очень важным. Это позволяет продолжать контролировать соотношение польза / риск для лекарственного средства. Медицинских работников просят сообщать, согласно действующему законодательству, о подозреваемых побочных реакциях на препарат, которые возникли у пациента во время терапии.

### **Срок годности**

3 года.

Не использовать более 4 недель после вскрытия флакона.

## **Условия хранения**

Специальные условия хранения препарата не предусмотрены. Хранить в местах, недоступных для детей.

## **Упаковка**

По 5 мл во флаконах-капельницах «дроп-Тейнер®», 1 флакон-капельница в коробке из картона. Не все виды упаковок могут быть представлены на рынке.

## **Категория отпуска**

По рецепту.

## **Производитель**

Алкон-Куврьор/Alcon-Couvreur.

## **Местонахождение производителя и его адрес места осуществления деятельности**

Рийксвег 14, В-2870 Пуурс, Бельгия/ Rijksweg 14, В-2870 Puurs, Belgium.

## **Источник инструкции**

Инструкция лекарственного средства взята из официального источника — [Государственного реестра лекарственных средств Украины](#).