

## **Состав**

*действующее вещество:* олопатадина;

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

*вспомогательные вещества:* бензалкония хлорид, натрия фосфат безводный, натрия хлорид, натрия гидроксид или кислота соляная разведенная, вода для инъекций.

## **Лекарственная форма**

Капли глазные, раствор.

*Основные физико-химические свойства:* прозрачная бесцветная жидкость.

## **Фармакотерапевтическая группа**

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

## **Фармакодинамика**

Олопатадина 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 олопатадина действует на тучные клетки конъюнктивы человека, подавляя высвобождение медиаторов воспаления. Отмечалось, что местное офтальмологическое применение олопатадина у пациентов с сохраненной проходимостью носослезного канала уменьшает назальные признаки и симптомы, которые часто сопровождают сезонный аллергический конъюнктивит. 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, которые превышали максимальную рекомендованную для офтальмологического применения человеку. Олопатадин проявлялся в молоке

кормящих крыс после перорального применения.

## **Фармакокинетика**

Олопатадина абсорбируется системно, как и другие лекарственные средства для местного применения. Однако при местном применении его 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 в дозах, хорошо переносятся.

Исследования по фармакокинетике при пероральном применении показали, что период полувыведения олопатадина из плазмы крови составляет приблизительно 8-12 часов. 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 олопатадина выводится с мочой, главным образом в виде неизмененного активного вещества, его фармакокинетика изменяется при нарушениях функции почек, максимальная концентрация в плазме крови у пациентов с тяжелой почечной недостаточностью (средний клиренс креатинина - 13 мл/мин) в 2-3 раза выше по сравнению со здоровыми взрослыми добровольцами. При проведении гемодиализа пациентам после приема олопатадина в дозе 10 мг его концентрация в плазме крови была значительно меньше в день проведения гемодиализа, чем в день, когда его не проводили, что дает основание предположить, что вывод олопатадина произошло в процессе гемодиализа.

В сравнительных исследованиях по фармакокинетике при пероральном приеме дозы 10 мг молодым людям (средний возраст - 21 год) и людям пожилого возраста (средний возраст - 74 года) какой-либо существенной разницы концентрации в плазме крови, связывании с белком, выведении из мочой неизмененного активного 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 олопатадина в плазме крови. Поскольку концентрации в плазме крови после местного офтальмологического применения олопатадина в 50-200 раз ниже, чем при пероральном применении 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 олопатадина. Поэтому нет необходимости в коррекции дозы для пациентов с нарушениями функции печени.

## **Показания**

Лечение сезонных аллергических конъюнктивитов.

## **Противопоказания**

Повышенная чувствительность к олопатадину или к любым вспомогательным веществам препарата.

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

Исследований по изучению взаимодействия олопатадина 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**

Лекарственное средство является противоаллергическим/антигистаминным средством, применяется местно, но абсорбируется системно. При любых признаках серьезных реакций или повышенной чувствительности следует прекратить.

Лекарственное средство 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 применяют препарат.

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

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

управлять автотранспортом или другими 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»). Препарат не рекомендуется применять в период беременности и женщинам репродуктивного возраста, которые не используют контрацептивные средства.

### Период кормления грудью.

Исследования на животных показали, что олопатадина проникает в грудное молоко после приема внутрь (см. Раздел «Фармакологические свойства»). Нельзя исключать риск для новорожденных/детей грудного возраста. Препарат не следует применять в период кормления грудью.

### Фертильность.

Исследований по оценке эффекта олопатадина на репродуктивную функцию человека после местного офтальмологического применения не проводили.

## **Способ применения и дозы**

Лекарственное средство предназначено только для местного применения.

В конъюнктивальный мешок пораженного глаза (глаз) следует закапывать по 1 капле лекарственного средства 2 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 пациентам с нарушениями функции печени и почек.

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

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

## **Дети**

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

Безопасность и эффективность применения олопатадина детям до 3 лет не изучена. Данные по этой возрастной категории отсутствуют.

## **Передозировка**

Нет данных о передозировке олопатадина у человека при случайном или преднамеренном глотании. Олопатадина выявил низкий уровень острой токсичности у животных. Случайное проглатывание содержания всего флакона 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 олопатадина 2 раза в сутки на протяжении 2,5 суток, наблюдалось незначительное увеличение интервала QT по сравнению с плацебо. В этом исследовании установлены равные максимальных концентраций олопатадина в плазме крови (35 до 127 нг/мл) минимум в 70 раз превышали уровни 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 олопатадина применяли от 1 до 4 раз в сутки в оба глаза в течение 4 месяцев в качестве монотерапии или в качестве дополнительной терапии к лоратадину в дозе 10 мг. Побочные реакции, связанные с применением олопатадина, наблюдались примерно в 4,5% пациентов; однако только 1,6% из них были исключены из клинических исследований в связи с возникновением этих побочных реакций. При проведении клинических исследований не было сообщений о каких-либо серьезных офтальмологических или системных побочных реакций, связанных с

применением олопатадина. Наиболее частой побочной реакцией при применении олопатадина был глазной боли с частотой возникновения 0,7%. Следующие побочные реакции отмечались в течение клинических исследований и в постмаркетинговый период и классифицированы в соответствии с классами систем органов по MedDRA и частотой: очень часто ( $^31 / 10$ ), часто ( $^31 / 100$ ,  $<1/10$ ), нечасто ( $^31 / 1000$ ,  $< 1/100$ ), редко ( $^31 / 10000$ ,  $<1/1000$ ), очень редко ( $<1/10000$ ), неизвестно (частоту нельзя оценить на основе имеющихся данных). В рамках каждой группы побочные реакции представлены в порядке уменьшения степени их тяжести.

*Инфекции и инвазии:*

нечасто - ринит.

*Со стороны иммунной системы:*

неизвестно - повышенная чувствительность, припухлость лица.

*Со стороны нервной системы:*

часто - головная боль, дисгевзия; нечасто - головокружение, гипестезия; неизвестно - сонливость.

*Со стороны органов зрения:*

часто - боль в глазу, раздражение глаза, сухость глаза, аномальная чувствительность глаз нечасто - эрозия роговицы, повреждения эпителия роговицы, нарушения со стороны эпителия роговицы, точечный кератит, кератит, окраска роговицы, выделения из глаза, светобоязнь, помутнение зрения, снижение остроты зрения, блефароспазм, чувство дискомфорта в глазу, зуд глаз, конъюнктивальные фолликулы, нарушения со стороны конъюнктивы, ощущение инородного тела в глазу, усиленное слезотечение, эритема век, отек век, нарушения со стороны век, гиперемия глаза; неизвестно - отек роговицы, отек глаза, припухлость глаз, конъюнктивит, мидриаз, нарушение зрения, образование чешуек по краям век.

*Со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения:*

часто - сухость в носу; неизвестно - одышка, синусит.

*Со стороны пищеварительного тракта:*

неизвестно - тошнота, рвота.

*Со стороны кожи и подкожных тканей:*

нечасто - контактный дерматит, ощущение жжения на коже, сухость кожи;

неизвестно - дерматит, эритема.

*Со стороны организма в целом и реакции в месте введения:*

часто - повышенная утомляемость; неизвестно - астения, недомогание.

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

*Сообщение о подозреваемых побочных реакции.*

Сообщение о подозреваемых побочных реакции, возникшие после регистрации лекарственного средства, очень важны. Это позволяет постоянно наблюдать за балансом польза / риск лекарственного средства. Работников системы здравоохранения просят сообщать о любых подозреваемых побочных реакции через национальную систему сообщений.

### **Срок годности**

3 года.

После вскрытия флакона препарат можно использовать в течение 28 дней.

### **Условия хранения**

Хранить при температуре не выше 25 ° C в недоступном для детей месте.

### **Упаковка**

Раствор по 5 мл во флаконе-капельнице; по 1 флакону-капельнице в картонной коробке.

### **Категория отпуска**

По рецепту.

**Производитель**

УОРЛД Медицина ИЛАЧ САН. ВЕ ТиДжей. А.Ш. /  
WORLD MEDICINE ILAC SAN. VE TIC. A.S.

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

15 Теммуз Махаллеши Джамии Йолу Джаддеси №50 Гюнешли Бешикташ/Стамбул,  
Турция/15 Temmuz Mahallesi Cami Yolu Caddesi No: 50 Gunesli Bagcilar/Istanbul,  
Turkey.

**Источник инструкции**

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