

ОБЩАЯ ХАРАКТЕРИСТИКА ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

1. НАИМЕНОВАНИЕ ЛЕКАРСТВЕННОГО ПРЕПАРАТА

Опатанол, 1 мг/мл, капли глазные

2. КАЧЕСТВЕННЫЙ И КОЛИЧЕСТВЕННЫЙ СОСТАВ

Действующее вещество – олопатадин.

1 мл препарата содержит олопатадина гидрохлорида 1,11 мг (эквивалентно олопатадина основанию 1,0 мг).

Вспомогательные вещества, наличие которых надо учитывать в составе лекарственного препарата: бензалкония хлорид 0,1 мг/мл (см. раздел 4.4).

Полный перечень вспомогательных веществ приведен в разделе 6.1.

3. ЛЕКАРСТВЕННАЯ ФОРМА

Капли глазные.

Прозрачный или слегка опалесцирующий раствор от бесцветного до бледно-желтого цвета.

4. КЛИНИЧЕСКИЕ ДАННЫЕ

4.1 Показания к применению

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

4.2 Режим дозирования и способ применения

Режим дозирования

Доза составляет одну каплю препарата Опатанол в конъюнктивальный мешок пораженного глаза (пораженных глаз) два раза в сутки (с интервалом в 8 часов).

При необходимости длительность лечения может составлять до четырех месяцев.

Особые группы пациентов

Пациенты пожилого возраста

Пожилые пациенты (65 лет и старше) не нуждаются в коррекции дозы.

Дети

Опатанол можно применять у детей в возрасте от трех лет и старше в той же дозе, что и у взрослых. Безопасность и эффективность препарата Опатанол у детей в возрасте до 3 лет не была установлена.

Пациенты с печеночной и почечной недостаточностью

Исследования олопатадина в форме глазных капель у пациентов с нарушениями функции печени или почек не проводились. При нарушении функции печени или почек коррекции дозы не требуется (см. раздел 5.2).

Способ применения

Только для применения в офтальмологии.

После снятия колпачка, если фиксирующее кольцо для контроля первого вскрытия ослаблено, удалите его перед применением препарата. Для предотвращения загрязнения кончика капельницы-дозатора и раствора необходимо соблюдать осторожность, чтобы не коснуться кончиком капельницы-дозатора флакона век, области вокруг глаз и других поверхностей. Системная абсорбция снижается при носослезной окклюзии или закрытии век на 2 минуты, что в свою очередь может привести к уменьшению системных побочных эффектов и увеличению местной активности.

Флакон следует хранить плотно закрытым, когда он не используется.

В случае применения более одного местного офтальмологического лекарственного препарата, следует соблюдать по крайней мере 5-минутный интервал между последовательными применениями препаратов. Глазные мази следует применять в последнюю очередь.

Пациентам следует рекомендовать не носить контактные линзы при покраснении глаз. Препарат Опатанол не следует применять для лечения раздражения, вызванного ношением контактных линз.

4.3 Противопоказания

Гиперчувствительность к действующему веществу или к любому из вспомогательных веществ, перечисленных в разделе 6.1

4.4 Особые указания и меры предосторожности при применении

С осторожностью

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

После местного применения препарата Опатанол возможно системное всасывание. При наличии признаков нежелательных реакций (НР) или гиперчувствительности необходимо прекратить приём препарата.

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

Следует снимать контактные линзы перед применением препарата и снова устанавливать их не ранее, чем через 15 минут после инстилляции. 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.

4.5 Взаимодействия с другими лекарственными препаратами и другие виды взаимодействия

Исследования взаимодействия с другими препаратами не проводились.

Исследования *in vitro* показали, что олопатадин не ингибитирует метаболические реакции, в которых участвуют изоферменты цитохрома Р-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.

4.6 Фертильность, беременность и лактация

Беременность

Данные относительно применения олопатадина беременными женщинами ограничены. Исследования на крысах и кроликах, которым перорально вводили олопатадин, не показали какой-либо токсичности для эмбриона и плода в 2480 раз превышающей максимальную рекомендуемую дозу для человека при офтальмологическом применении (MROHD) (одна капля 0,7% офтальмологического раствора олопатадина в каждый глаз в пересчете на площадь поверхности тела (BSA)). У крыс не наблюдалось снижения веса плода при применении препарата в дозе, в 25 раз превышающей MROHD, в пересчете на BSA.

Во время беременности не ожидается никаких эффектов, поскольку системное воздействие оолопатадина незначительно при местном офтальмологическом применении.

Данные, полученные в ходе исследований на животных

В исследовании эмбрионального развития (EFD) на крысах олопатадин (60, 200 и 600 мг/кг/день) вводили перорально в течение всего периода органогенеза. Мидриаз, гиперемия и расширение сосудов глазного дна, нетипичные дыхательные шумы наблюдались у самок, принимавших препарат в высоких дозах, а уровень дозы для матери без какого-либо эффекта составлял 60 мг/кг/день (что соответствует 746-кратному MROHD в пересчете на BSA). У потомства снижение массы тела живых плодов и уменьшение числа окостенений наблюдались при дозе 600 мг/кг/день (что соответствует 7460-кратному MROHD в пересчете на BSA). При дозе 60 мг/кг/день наблюдалась расщелина нёба у 2 плодов, но не при более высоких дозах. При внешнем обследовании, обследовании скелета и внутренних органов не наблюдалось никаких дозозависимых отклонений, и, следовательно, доза без какого-либо эффекта для потомства составляла 200 мг/кг/день (что соответствует 2480-кратному MROHD в пересчете на BSA).

В исследовании EFD на кроликах олопатадин (25, 100 и 400 мг/кг/день) вводили перорально в период органогенеза. Патологическое дыхание и слезотечение наблюдались при дозе 400 мг/кг/день, а уровень дозы для матери без эффекта составлял 100 мг/кг/день (что соответствует 2480-кратному MROHD в пересчете на BSA). Никакого воздействия на плод не наблюдалось, и, следовательно, доза без эффекта для потомства составляла 400 мг/кг/день (что соответствует 9950-кратному MROHD в пересчете на BSA).

В исследовании peri-/постнатальной токсичности крысы получали олопатадин в дозе до 600 мг/кг/день перорально на поздних сроках беременности и в течение всего периода лактации. Токсическое действие на материнский организм наблюдалось при дозе 600 мг/кг/день. Олопатадин приводил к снижению неонатальной выживаемости при дозе 60 мг/кг/день и снижению прибавки массы тела у потомства при дозе 4 мг/кг/день (в 50 раз больше MROHD в пересчете на BSA), что связано с грудным вскармливанием, как продемонстрировано в перекрестном исследовании (см. подраздел *Лактация - Данные, полученные в ходе исследований на животных*).

Лактация

Неизвестно, попадает ли олопатадин в грудное молоко после применения препарата. Нет данных о влиянии олопатадина на ребенка, находящегося на грудном вскармливании, или на выработку молока. На основании низкого уровня олопатадина, присутствующего в плазме крови человека после местного офтальмологического применения, ожидается, что концентрация олопатадина, присутствующего в грудном молоке, будет незначительной. Однако, поскольку отсутствуют данные о концентрации олопатадина/метаболитов в грудном молоке после местного офтальмологического применения, существует риск для ребенка, находящегося на грудном вскармливании.

Олопатадин проникал в молоко кормящих крыс после перорального приема и приводил к токсическому влиянию на плод (см. *Данные, полученные в ходе исследований на животных*).

Пациентов следует проинформировать о том, что антигистаминные препараты могут влиять на выработку молока у кормящей матери.

Следует учитывать преимущества грудного вскармливания для развития и здоровья ребенка, а также клиническую потребность матери в олопатадине и любые возможные нежелательные лекарственные реакции данного препарата на ребенка, находящегося на грудном вскармливании.

Данные, полученные в ходе исследований на животных

В перекрестном исследовании, в котором детенышам самок, не получавших олопатадин, выкармливали самки, получавшие его (60 мг/кг/день), наблюдалось замедление прироста массы тела детенышей, что подтверждает влияние олопатадина на массу тела детенышей через молоко.

Пероральное введение 1 мг/кг радиоактивно меченного олопатадина крысам продемонстрировало, что олопатадин и/или его метаболиты в значительной степени проникали в молоко при соотношении молоко: плазма ($AUC_{0-\infty}$), равном 1,5. Максимальные уровни радиоактивности в молоке были определены примерно через 1 час после введения дозы с периодом полувыведения 28,3 часа.

Фертильность

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

4.7 Влияние на способность управлять транспортными средствами и работать с механизмами

Препарат Опатанол 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.

4.8 Нежелательные реакции

Резюме профиля безопасности

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 дозе 10 мг. Общая частота встречаемости нежелательных реакций составила около 4,5 %, в то время как прекращение участия в клиническом исследовании вследствие развития нежелательных реакций отмечено только в 1.6% случаев. В ходе клинических исследований не отмечено серьезных нежелательных реакций как со стороны органа зрения, так и со стороны организма в целом. Наиболее частой нежелательной реакцией, связанной с лечением, была боль в глазу, это явление отмечалось у 0,7 % пациентов.

Табличное резюме нежелательных реакций

Нежелательные реакции, отмечавшиеся в ходе клинических исследований и пострегистрационного применения препарата (см. Таблицу ниже), перечислены и классифицированы согласно системно-органным классам словаря MedDRA. Внутри каждого системно-органного класса нежелательные реакции приведены в порядке уменьшения их частоты. Внутри каждой категории частоты нежелательные реакции представлены в порядке уменьшения степени их серьезности. Кроме того, для каждой нежелательной реакции приведена

соответствующая ей категория частоты в соответствии со следующими обозначениями (CIOMS III): очень часто ($\geq 1 / 10$); часто ($\geq 1 / 100$ до $< 1 / 10$); нечасто ($\geq 1 / 1000$ до $< 1 / 100$); редко ($\geq 1 / 10\,000$ до $< 1 / 1\,000$); очень редко ($< 1 / 10\,000$).

Системно-органный класс	Частота встречаемости	Нежелательные реакции
Инфекции и инвазии	Нечасто	Ринит
Нарушения со стороны иммунной системы	Частота неизвестна	Гиперчувствительность, припухлость лица
Нарушения со стороны нервной системы	Часто	Головная боль, дисгевзия
	Нечасто	Головокружение, гипестезия
	Частота неизвестна	Сомнолентность
Нарушения со стороны органа зрения	Часто	Боль в глазу, раздражение глаза, «сухой» глаз, неестественные ощущения в глазу
	Нечасто	Эрозия роговицы, дефекты эпителия роговицы, нарушение со стороны эпителия роговицы, точечный кератит, кератит, окрашивание роговицы, глазные выделения, фотофобия, помутнение поля зрения, уменьшение остроты зрения, блефароспазм, дискомфорт в глазах, зуд в глазу, фолликулы

		конъюнктивы, нарушение со стороны конъюнктивы, ощущение присутствия стороннего тела в глазу, гиперсекреторное слезоотделение, эритема век, отек век, нарушения со стороны век, гиперемия глаз
	Частота неизвестна	Отек роговицы, отечность конъюнктивы, конъюнктивит, мидриаз, зрительное нарушение, образование корочек на краях век
Нарушения со стороны дыхательной системы, органов грудной клетки и средостения	Часто	Сухость в носу
	Частота неизвестна	Одышка, синусит
Желудочно-кишечные нарушения	Частота неизвестна	Тошнота, рвота
Нарушения со стороны кожи и подкожных тканей	Нечасто	Контактный дерматит, ощущение жжения кожи, сухая кожа
	Частота неизвестна	Дерматит, эритема
Общие нарушения и реакции в месте введения	Часто	Усталость
	Частота неизвестна	Астения, недомогание

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

Сообщение о подозреваемых нежелательных реакциях

Важно сообщать о подозреваемых нежелательных реакциях после регистрации лекарственного препарата с целью обеспечения непрерывного мониторинга соотношения «польза – риск» лекарственного препарата. Медицинским работникам рекомендуется сообщать о любых подозреваемых нежелательных реакциях лекарственного препарата через национальные системы сообщения о нежелательных реакциях государств – членов Евразийского экономического союза.

Российская Федерация

Адрес: 109012, г. Москва, Славянская площадь, д. 4, стр. 1

Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения Российской Федерации

Телефон: +7 (495) 698-45-38, +7 (499) 578-02-30

Факс: +7 (495) 698-15-73

Электронная почта: pharm@roszdravnadzor.gov.ru

Сайт: <http://www.roszdravnadzor.gov.ru>

4.9 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 Опатанол 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 два раза в день в течение 2,5 дней, не наблюдалось значительного удлинения интервала QTc по сравнению с плацебо. Диапазон максимальных стационарных 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.

5. ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

5.1. Фармакодинамические свойства

Фармакотерапевтическая группа:

Противоаллергическое средство – H1-гистаминовых рецепторов блокатор.

Код ATХ: S01GX09

Механизм действия

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.

5.2 Фармакокинетические свойства

Абсорбция

Олопатадин всасывается системно, как и другие лекарственные средства для местного применения. Системное всасывание олопатадина местного применения 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.

Элиминация

Поскольку концентрации в плазме после местного офтальмологического применения олопатадина в 50–200 раз ниже, чем после хорошо переносимых

пероральных доз, коррекция дозы для пожилых людей или людей с почечной недостаточностью не требуется. Метаболизм в печени является второстепенным путем выведения. Считается, что необходимость в коррекции дозы у пациентов с нарушением функции печени отсутствует.

5.3. Данные доклинической безопасности

В доклинических данных, полученных по результатам стандартных исследований фармакологической безопасности, токсичности при многократном введении, генотоксичности, канцерогенного потенциала и репродуктивной и онтогенетической токсичности, особый вред для человека не выявлен.

Имеются нежелательные реакции, не обнаруженные в клинических исследованиях, но выявленные у животных при воздействии лекарственного препарата в дозах, схожих с дозами, примененными в клинических исследованиях, что может иметь клиническую значимость. Исследования на животных показали снижение роста детенышей кормящих самок, получавших системные дозы олопатадина, значительно превышающие максимальный уровень, рекомендуемый для офтальмологического применения у человека. Олопатадин обнаруживался в молоке кормящих крыс после перорального применения.

6. ФАРМАЦЕВТИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА

6.1. Перечень вспомогательных веществ

Бензалкония хлорид

Натрия хлорид

Натрия гидрофосфата додекагидрат (динатрия фосфат додекагидрат)

Хлористоводородная кислота и/или натрия гидроксид

Вода очищенная

6.2. Несовместимость

Ввиду отсутствия исследований на совместимость данный препарат нельзя смешивать с другими лекарственными средствами.

6.3 Срок годности (срок хранения)

3 года.

Использовать в течение 28 дней после вскрытия флакона.

6.4 Особые меры предосторожности при хранении

Хранить при температуре не выше 30°C.

6.5 Характер и содержание первичной упаковки

По 5 мл во флакон-капельницу из полиэтилена низкой плотности. По 1 флакону с листком-вкладышем помещают в картонную пачку.

На картонной пачке допускается наличие контроля первого вскрытия.

6.6 Особые меры предосторожности при уничтожении использованного лекарственного препарата или отходов, полученных после применения лекарственного препарата или работы с ним.

Особые требования отсутствуют.

7. ДЕРЖАТЕЛЬ РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

Новартис Фарма АГ, Лихтштрассе 35, 4056 Базель, Швейцария /
Novartis Pharma AG, Lichtstrasse 35, 4056 Basel, Switzerland

7.1. Представитель держателя регистрационного удостоверения

Претензии потребителей направлять по адресу:

Российская Федерация

ООО «Новартис Фарма»

125315 г. Москва, Ленинградский проспект, 70

тел.: +7 495 967 12 70

факс: +7 495 967 12 68

эл. почта: drug.safety_russia@novartis.com

Прочие источники информации

Подробные сведения о препарате содержатся на веб-сайте Союза.

<http://www.eurasiancommission.org/>

8. НОМЕР РЕГИСТРАЦИОННОГО УДОСТОВЕРЕНИЯ

ЛП № (000333)-(РГ-RU)

**9. ДАТА ПЕРВОЙ РЕГИСТРАЦИИ (ПОДТВЕРЖДЕНИЯ РЕГИСТРАЦИИ,
ПЕРЕРЕГИСТРАЦИИ)**

Дата первой регистрации: 02.08.2021

10. ДАТА ПЕРЕСМОТРА ТЕКСТА

Общая характеристика лекарственного препарата Опатанол доступна на информационном портале Евразийского экономического союза в информационно-коммуникационной сети «Интернет»
<http://www.eurasiancommission.org>.