

POVZETEK GLAVNIH ZNAČILNOSTI ZDRAVILA

1. IME ZDRAVILA

Alezaxin 0,5 mg/ml kapljice za oko, raztopina v enoodmernem vsebniku

2. KAKOVOSTNA IN KOLIČINSKA SESTAVA

En mililiter raztopine vsebuje 0,5 mg azelastinijevega klorida.
Ena kapljica vsebuje 0,018 mg azelastinijevega klorida.
Volumen ene kapljice je 35,5 µl.

Za celoten seznam pomožnih snovi glejte poglavje 6.1.

3. FARMACEVTSKA OBLIKA

kapljice za oko, raztopina v enoodmernem vsebniku
bistra, brezbarvna raztopina

pH je med 6,0 in 6,5.
Osmolalnost je med 250 in 310 mosmol/kg.

4. KLINIČNI PODATKI

4.1 Terapevtske indikacije

Zdravljenje in preprečevanje simptomov sezonskega alergijskega konjunktivitisa pri odraslih in otrocih, starih 4 leta in več.

Zdravljenje simptomov nesezonskega (celoletnega) alergijskega konjunktivitisa pri odraslih in mladostnikih, starih 12 let in več.

4.2 Odmerjanje in način uporabe

Odmerjanje

Sezonski alergijski konjunktivitis

Priporočeni odmerek za odrasle in otroke, stare 4 leta in več, je ena kapljica v vsako oko dvakrat na dan. Odmerek se po potrebi lahko poveča na eno kapljico v vsako oko do štirikrat na dan. V primeru pričakovane izpostavitve alergenu je treba zdravilo Alezaxin uporabiti preventivno, pred pričakovano izpostavitvijo.

Nesezonski (celoletni) alergijski konjunktivitis

Priporočeni odmerek za odrasle in mladostnike, stare 12 let in več, je ena kapljica v vsako oko dvakrat na dan. Odmerek se po potrebi lahko poveča na eno kapljico v vsako oko do štirikrat na dan.

Trajanje zdravljenja je treba tako pri sezonskem kot nesezonskem alergijskem konjunktivitisu omejiti na največ 6 tednov, ker so v kliničnih preskušanjih dokazali varnost in učinkovitost za obdobje do 6 tednov.

Bolnikom je treba svetovati, naj se obrnejo na svojega zdravnika, če se simptomi poslabšajo ali ne izboljšajo po 48 urah.

Bolnika je treba opozoriti, da se zdravljenje sezonskega alergijskega konjunktivitisa, ki traja več kot 6 tednov, izvaja le pod zdravniškim nadzorom.

Pediatrična populacija

Varnost in učinkovitost zdravila Alezaxin pri otrocih, mlajših od 4 let, še nista bili dokazani. Podatki niso na voljo.

Zdravilo Alezaxin se ne sme uporabljati pri otrocih, mlajših od 4 let.

Starejša populacija

Zdravilo Alezaxin se lahko pri starejših bolnikih uporablja v enakih odmerkih kot pri odraslih bolnikih.

Način uporabe

okularna uporaba

4.3 Kontraindikacije

Preobčutljivost na učinkovino ali katero koli pomožno snov, navedeno v poglavju 6.1.

4.4 Posebna opozorila in previdnostni ukrepi

Zdravilo Alezaxin ni namenjeno za zdravljenje okužb očesa.

Preprečiti je treba stik s kontaktnimi lečami. Uporabniki kontaktnih leč si morajo le-te odstraniti pred uporabo zdravila Alezaxin, po uporabi zdravila pa počakati vsaj 15 minut, preden si jih ponovno vstavijo.

4.5 Medsebojno delovanje z drugimi zdravili in druge oblike interakcij

Študij medsebojnega delovanja niso izvedli.

Študije medsebojnega delovanja so bile izvedene pri velikih peroralnih odmerkih azelastina, vendar pa te študije nimajo pomena za azelastinijev klorid v raztopini kapljic za oko. Po uporabi kapljic za oko so sistemske koncentracije azelastina namreč v pikogramskem območju.

4.6 Plodnost, nosečnost in dojenje

Nosečnost

Ni zadostnih podatkov, ki bi potrdili varnost uporabe azelastina med nosečnostjo. Po uporabi velikih peroralnih odmerkov azelastina je pri eksperimentalnih živalih prišlo do pojava neželenih učinkov (smrt ploda, zastoj v rasti in malformacije okostja). Po lokalni okularni uporabi je sistemska izpostavljenost sicer minimalna (pikogramsko območje), vendar je pri uporabi zdravila Alezaxin med nosečnostjo potrebna previdnost.

Dojenje

Azelastin se v majhni količini izloča v materino mleko, zato uporaba zdravila Alezaxin med dojenjem ni priporočljiva.

Plodnost

Vpliv na plodnost pri ljudeh ni bil raziskan.

4.7 Vpliv na sposobnost vožnje in upravljanja strojev

Po uporabi zdravila Alezaxin se lahko pojavi blago, prehodno draženje oči, ki pa na vid običajno ne vpliva v večji meri. Vendar pa je treba bolnika opozoriti, da mora v primeru prehodnih motenj vida počakati, da se vid zbistri, preden vozi ali začne z upravljanjem strojev.

4.8 Neželeni učinki

Pogostnost neželenih učinkov je opredeljena v skladu z naslednjim dogovorom:

zelo pogosti ($\geq 1/10$), pogosti ($\geq 1/100$ do $< 1/10$), občasni ($\geq 1/1.000$ do $< 1/100$), redki ($\geq 1/10.000$ do $< 1/1.000$), zelo redki ($< 1/10.000$), neznana (pogostnosti ni mogoče oceniti iz razpoložljivih podatkov).

Bolezni imunskega sistema

Zelo redki: alergijske reakcije (kot sta izpuščaj in srbečica)

Bolezni živčevja

Občasni: grenak okus v ustih

Očesne bolezni

Pogosti: blago, prehodno draženje očesa

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih

Poročanje o domnevnih neželenih učinkih zdravila po izdaji dovoljenja za promet je pomembno. Omogoča namreč stalno spremljanje razmerja med koristmi in tveganji zdravila. Od zdravstvenih delavcev se zahteva, da poročajo o katerem koli domnevnem neželenem učinku zdravila na:

Javna agencija Republike Slovenije za zdravila in medicinske pripomočke

Sektor za farmakovigilanco

Nacionalni center za farmakovigilanco

Slovenčeva ulica 22

SI-1000 Ljubljana

Tel: +386 (0)8 2000 500

Faks: +386 (0)8 2000 510

e-pošta: h-farmakovigilanca@jazmp.si

spletna stran: www.jazmp.si

4.9 Preveliko odmerjanje

Simptomi

O primerih prevelikega odmerjanja azelastina pri topikalni uporabi niso poročali in reakcije prevelikega odmerjanja pri tej poti uporabe niso pričakovane.

Zdravljenje

Ni izkušenj glede uporabe toksičnih odmerkov azelastinijevega klorida pri ljudeh. Rezultati preskusov na živalih kažejo, da lahko v primeru prevelikega odmerjanja ali zastrupitve pričakujemo pojav motenj osrednjega živčevja. Zdravljenje teh motenj mora biti simptomatsko. Antidot ni znan.

5. FARMAKOLOŠKE LASTNOSTI

5.1 Farmakodinamične lastnosti

Farmakoterapevtska skupina: Dekongestivi in protialergijska zdravila, druga protialergijska zdravila, oznaka ATC: S01GX07

Azelastin, derivat ftalazinona, je močna dolgodelujoča protialergijska spojina, ki deluje kot selektivni antagonist histaminskih receptorjev H₁. Po topikalni okularni aplikaciji ima dodatni protivnetni učinek.

Podatki iz *in vivo* (predkliničnih) in *in vitro* študij kažejo, da azelastin zavira sintezo ali sproščanje kemičnih mediatorjev, ki sodelujejo v zgodnji in pozni fazi alergijskih reakcij, npr. levkotriena, histamina, faktorja aktivacije trombocitov (PAF – *platelet-activating factor*) in serotoninina.

Ocene elektrokardiograma (EKG) pri dolgotrajnem zdravljenju v dosedanjih študijah večkratnega odmerjanja pri bolnikih, ki so jemali velike peroralne odmerke azelastina, so pokazale, da azelastin ne vpliva klinično pomembno na korigiran QT (QTc) interval.

Pri več kot 3700 bolnikih, ki so prejeli azelastin peroralno, niso ugotovili povezave med pojavom ventrikularne aritmije ali *torsade de pointes* ter jemanjem azelastina.

Olajšanje simptomov alergijskega konjunktivitisa bi moralo biti opazno po 15–30 minutah.

5.2 Farmakokinetične lastnosti

Splošne značilnosti (sistemska farmakokinetika)

Azelastin se po peroralni uporabi hitro absorbira in ima absolutno biološko uporabnost 81 %. Hrana na absorpcijo ne vpliva. Volumen porazdelitve je velik, kar kaže na porazdelitev predvsem v perifernem tkivu. Stopnja vezave na beljakovine je relativno nizka (80–90 %, kar je prenizka stopnja, da bi povzročila zaskrbljenost glede reakcij izpodrivanja učinkovin).

Plazemski razpolovni čas izločanja po enkratnem odmerku azelastina je približno 20 ur za azelastin in približno 45 ur za terapevtsko aktivni presnovek N-desmetilazelastin. Izločanje poteka v glavnem z blatom. Neprenehno izločanje majhnih količin odmerka v blato nakazuje, da presnova azelastina do neke mere poteka enterohepatično.

Značilnosti pri bolnikih (okularna farmakokinetika)

Po večkratni okularni aplikaciji kapljic za oko z azelastinom (ena kapljica v vsako oko, do štirikrat na dan) so bile srednje vrednosti največje koncentracije azelastinijevega klorida v plazmi (C_{max}) v stanju dinamičnega ravnovesja zelo majhne in so bile zaznane na meji oz. pod mejo kvantifikacije.

5.3 Predklinični podatki o varnosti

Pri morskih prašičkih azelastinijev klorid ni imel senzibilizacijskega učinka. V naboru standardnih *in vitro* ter *in vivo* preskusov azelastin ni imel genotoksičnega potenciala, niti ni izkazal karcinogenega potenciala pri podganah ali miših.

Pri podganjih samcih in samicah je azelastin pri peroralnih odmerkih, ki so presegali 3,0 mg/kg/dan, povzročil od odmerka odvisno zmanjšanje indeksa plodnosti. Na reproduktivnih organih samcev in samic v študijah kronične toksičnosti pa niso ugotovili z učinkovino povezanih sprememb.

Embriotoksični in teratogeni učinki pri podganah, miših in kuncih so se pojavili samo pri odmerkih, toksičnih za samico (pri podganah in kuncih so na primer opazili malformacije okostja pri odmerkih 68,6 mg/kg/dan).

6. FARMACEVTSKI PODATKI

6.1 Seznam pomožnih snovi

70-odstotni sorbitol, tekoči (nekrystalizirajoči)
hipromeloza
dinatrijev edetat
natrijev hidroksid
voda za injekcije

6.2 Inkompatibilnosti

Navedba smiselno ni potrebna.

6.3 Rok uporabnosti

2 leti

6.4 Posebna navodila za shranjevanje

Shranjujte pri temperaturi do 25 °C.

6.5 Vrsta ovojnine in vsebina

Kapljice za oči, raztopina v 0,6-mililitrskih prozornih enoodmernih vsebnikih iz polietilena nizke gostote. Pakirano v kartonasti škatli, ki vsebuje 10, 20, 30 ali 60 enoodmernih vsebnikov.

6.6 Posebni varnostni ukrepi za odstranjevanje

Neuporabljeno zdravilo ali odpadni material zavrzite v skladu z lokalnimi predpisi.

7. IMETNIK DOVOLJENJA ZA PROMET Z ZDRAVILOM

BAUSCH + LOMB IRELAND LIMITED
3013 Lake Drive
Citywest Business Campus
Dublin 24
D24 PPT3
Irska

8. ŠTEVILKA (ŠTEVILKE) DOVOLJENJA (DOVOLJENJ) ZA PROMET Z ZDRAVILOM

H/22/02886/001-004

9. DATUM PRIDOBITVE/PODALJŠANJA DOVOLJENJA ZA PROMET Z ZDRAVILOM

Datum prve odobritve: 3.2.2022

10. DATUM ZADNJE REVIZIJE BESEDILA

27. 2. 2023

