

SÚHRN CHARAKTERISTICKÝCH VLASTNOSTÍ LIEKU

1. NÁZOV LIEKU

AZELSAN

nosová roztoková aerodisperzia

2. KVALITATÍVNE A KVANTITATÍVNE ZLOŽENIE

1 ml roztoku obsahuje 1 mg azelastínium-chloridu.

Jedna dávka (0,14 ml) obsahuje 0,14 mg azelastínium-chloridu, čo zodpovedá 0,13 mg azelastínu.

Úplný zoznam pomocných látok, pozri časť 6.1.

3. LIEKOVÁ FORMA

Nosová roztoková aerodisperzia.

Číry, bezfarebný roztok bez častíc.

pH roztoku je v rozmedzí 6,4 – 7,2.

4. KLINICKÉ ÚDAJE

4.1 Terapeutické indikácie

Azelastín je indikovaný na symptomatickú liečbu sezónnej alergickej rinitídy (napr. sennej nádchy) a akútnej exacerbácie chronickej alergickej rinitídy u dospelých, dospievajúcich a detí od 6 rokov.

4.2 Dávkovanie a spôsob podávania

Dávkovanie

Dospelí:

Jedno vstreknutie (0,14 ml) do každej nosovej dierky dvakrát denne (0,56 mg azelastínium-chloridu).

Starší pacienti:

U starších pacientov sa nevykonali žiadne špecifické štúdie.

Pediatrická populácia:

U detí od 6 rokov a starších jedno vstreknutie (0,14 ml) do každej nosovej dierky dvakrát denne (0,56 mg azelastínium-chloridu).

Azelastín sa nemá používať u detí do 6 rokov vzhľadom na nedostatok údajov o bezpečnosti a účinnosti.

Spôsob podávania

Nazálne použitie.

Opatrenia pred zaobchádzaním alebo podaním lieku

Vstrekujte vo vzpriamenej polohe hlavy.

Pred prvým použitím pumpu niekoľkokrát stlačte (3 až 4-krát), kým začne vystrekovať rovnomerné dávky.

Ak sa azelastín nepoužíval 6 alebo viac dní, pumpa sa musí opätovne stlačiť a niekoľkokrát uvoľniť, kým sa vytvorí jemná hmľa.

Po podaní utrite trysku pumpy a vymeňte ochranný kryt.

4.3 Kontraindikácie

Precitlivenosť na liečivo alebo na ktorúkoľvek z pomocných látok uvedených v časti 6.1

4.4 Osobitné upozornenia a opatrenia pri používaní

Aerodisperzia sa má používať pri vzpriamenej polohe hlavy, pozri časť 4.8.

4.5 Liekové a iné interakcie

Nevykonalí sa žiadne interakčné štúdie s nosovou aerodisperziou s obsahom azelastínu.

4.6 Fertilita, gravidita a laktácia

Gravidita

K dispozícii nie sú žiadne alebo iba obmedzené množstvo údajov o používaní azelastínu u gravidných žien. Pri vysokých perorálnych dávkach bola u zvierat pozorovaná reprodukčná toxicita (pozri časť 5.3). Azelastín sa má používať počas gravidity len ak možný prínos prevýši možné riziko pre plod.

Dojčenie

Nie je známe, či sa azelastín/jeho metabolity vylučujú do ľudského mlieka. Pretože nie je možné vylúčiť riziko pre novorodencov/dojčatá, opatrnosť je potrebná pri podávaní azelastínu dojčiacim ženám.

Fertilita

Účinky na plodnosť sa pozorovali v štúdiách na zvieratách (pozri časť 5.3).

4.7 Ovplyvnenie schopnosti viesť vozidlá a obsluhovať stroje

Azelastín má malý vplyv na schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje.

V ojedinelých prípadoch sa pri používaní azelastínu môže objaviť únava, vyčerpanosť, závrat alebo slabosť, ktoré môžu byť spôsobené aj samotným ochorením. V týchto prípadoch môže byť schopnosť viesť vozidlá a obsluhovať stroje znížená. Tento účinok môže zosilniť alkohol.

4.8 Nežiaduce účinky

Frekvencie sú definované ako: veľmi časté ($\geq 1/10$), časté ($\geq 1/100$ až $< 1/10$), menej časté ($\geq 1/1\ 000$ až $< 1/100$), zriedkavé ($\geq 1/10\ 000$ až $< 1/1\ 000$), veľmi zriedkavé ($< 1/10\ 000$), neznáme (z dostupných údajov sa ich frekvencia nedá odhadnúť).

Poruchy imunitného systému

Veľmi zriedkavé: hypersenzitívne reakcie

Poruchy nervového systému

Časté: po podaní sa môže vyskytnúť horká chuť špecifická pre liečivo (často kvôli nesprávnemu spôsobu podaniu, a to pri nakláňaní hlavy príliš dozadu), čo môže v zriedkavých prípadoch viesť k nevoľnosti

Veľmi zriedkavé: závrat, somnolencia (únava, spavosť)

Poruchy dýchacej sústavy, hrudníka a mediastína

Menej časté: môže sa vyskytnúť mierne prechodné podráždenie zapálených nosových slizníc s príznakmi ako je pichanie, svrbenie a kýchanie, epistaxa

Poruchy gastrointestinálneho traktu

Zriedkavé: nauzea

Celkové poruchy a reakcie v mieste podania

Veľmi zriedkavé: únava (ustatnosť, vyčerpanie), závrat alebo slabosť

Poruchy kože a podkožného tkaniva

Veľmi zriedkavé: vyrážka, svrbenie, urtikária

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie

Hlásenie podozrení na nežiaduce reakcie po registrácii lieku je dôležité. Umožňuje priebežné monitorovanie pomeru prínosu a rizika lieku. Od zdravotníckych pracovníkov sa vyžaduje, aby hlásili akékoľvek podozrenia na nežiaduce reakcie prostredníctvom **národného systému hlásenia uvedeného v Prílohe V**.

4.9 Predávkovanie

Výsledky štúdií na zvieratách poukazujú, že toxické dávky môžu vyvolať symptómy CNS, napr. excitáciu, tras, kŕče. Ak sa vyskytnú u ľudí, je potrebné začať symptomatickú a podpornú liečbu, pretože neexistuje žiadne špecifické antidotum. Pri predávkovaní sa odporúča gastrická laváž.

Pri použití do nosa sa nepredpokladá predávkovanie.

5. FARMAKOLOGICKÉ VLASTNOSTI

5.1 Farmakodynamické vlastnosti

Farmakoterapeutická skupina: dekonjestíva a iné nosové liečivá na lokálne použitie, antialergiká s výnimkou kortokosteroidov, ATC kód: R01AC03.

Azelastín je klasifikovaný ako silné, dlhodobopôsobiace, antialergické liečivo ($t_{1/2} \sim 20$ hodín) s vlastnosťami selektívneho H_1 antagonistu.

Okrem toho údaje z *in vivo* štúdií na morčatách preukázali, že azelastín podávaný v terapeuticky relevantných dávkach inhibuje leukotriénmi a PAF-indukovanú bronchokonstrikciiu. Inhibícia zápalu dýchacích ciest, ktorý je dôvodom hypersenzitívnych reakcií, dokázaná v testovaní azelastínium-chloridu na zvieratách, sa tiež môže pripísať k týmto vlastnostiam. Relevancia týchto výsledkov z pokusov na zvieratách v liečbe ľudí nie je jasná.

5.2 Farmakokinetické vlastnosti

Po opakovanom nazálnom podaní (0,14 mg) do každej nosovej dierky dvakrát denne boli plazmatické koncentrácie azelastínu približne 0,26 ng/ml. Koncentrácie aktívneho metabolitu, demetylazelastínu, boli zistené pri alebo pod dolnou hranicou merateľnosti (0,12 ng/ml).

Po opakovanom perorálnom podaní boli stanovené priemerné rovnovážne plazmatické koncentrácie C_{max} 3,9 ng/ml pre azelastín a 1,86 ng/ml pre demetylazelastín po podaní 2,2 mg azelastínu b.i.d. (dvakrát denne), čo je terapeutická perorálna dávka na liečbu alergickej rinitídy.

Po perorálnom podaní sa azelastín rýchlo absorbuje a vykazuje absolútnu biologickú dostupnosť 81 %. Potrava nemá žiadny vplyv na absorpciu. Distribučný objem je vysoký, čo poukazuje na distribúciu prevažne do periférnych tkanív. Úroveň väzby na bielkoviny je nízka (80-95 %, hodnota príliš nízka na to, aby došlo k vytesňovacím reakciám).

Eliminačný plazmatický polčas po jednorazovej dávke azelastínu je približne 20 hodín pre azelastín a približne 45 hodín pre N-demetylazelastín (terapeuticky aktívny metabolit). Vylučovanie sa uskutočňuje hlavne prostredníctvom stolice. Opakovaná exkrécia malého množstva dávky do stolice naznačuje možnú enterohepatálnu cirkuláciu.

5.3 Predklinické údaje o bezpečnosti

Azelastínium-chlorid nevykazoval žiadny senzibilizujúci účinok na morčatá. Azelastín nepreukázal žiadne genotoxické účinky v súbore testov *in vitro* a *in vivo* a ani žiadne karcinogénne účinky u potkanov alebo myší. U samcov a samíc potkanov azelastín v perorálnych dávkach vyšších ako 3,0 mg/kg/deň spôsobil zníženie indexu plodnosti v závislosti od dávky; počas štúdií chronickej toxicity sa na reprodukčných orgánoch samcov a samíc nezistili žiadne zmeny súvisiace s liečivom.

Embryotoxické a teratogénne účinky u potkanov, myší a králikov sa vyskytli iba pri dávkach toxických pre matku (napríklad u myší a potkanov pri dávkach 68,6 mg/kg/deň).

Pri vysokých perorálnych dávkach, zodpovedajúcich 1 095-násobku odporúčanej intranazálnej dennej dávky u ľudí, sa počas testovania reprodukčnej toxicity u zvierat vyskytli smrť plodu, retardácia rastu a zvýšený výskyt skeletálnych abnormalít.

6. FARMACEUTICKÉ INFORMÁCIE

6.1 Zoznam pomocných látok

hypromelóza 2910
edetan disodný
bezvodá kyselina citrónová
dodekahydrát hydrogenfosforečnanu sodného
chlorid sodný
čistená voda

6.2 Inkompatibility

Neaplikovateľné.

6.3 Čas použiteľnosti

27 mesiacov (neotvorené).

Po prvom otvorení nepoužívajte dlhšie ako 6 mesiacov.

6.4 Špeciálne upozornenia na uchovávanie

Neuchovávajte v chladničke alebo mrazničke.

Uchovávajte pri teplote do 25 °C.

Podmienky na uchovávanie po prvom otvorení lieku, pozri časť 6.3.

6.5 Druh obalu a obsah balenia

Nosová roztoková aerodisperzia s obsahom azelastínu je naplnená vo viacdávkovom plastovom obale (z polyetylénu s vysokou hustotou) s viacdávkovou pumpou. Jedna fľaška obsahuje 10 ml roztoku.

6.6 Špeciálne opatrenia na likvidáciu a iné zaobchádzanie s liekom

Žiadne zvláštne požiadavky.

7. DRŽITEĽ ROZHODNUTIA O REGISTRÁCII

XANTIS PHARMA LIMITED
Lemesou 5, EUROSURE TOWER
1st floor, Flat/Office 101
2112 Nicosia, Cyprus

8. REGISTRAČNÉ ČÍSLO

24/0364/17-S

9. DÁTUM PRVEJ REGISTRÁCIE/PREDLŽENIA REGISTRÁCIE

Dátum prvej registrácie: 27.11.2017

10. DÁTUM REVÍZIE TEXTU

03/2021