KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

EMEKSAT % 0,05 göz damlası, çözelti

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin madde(ler):

1 mL çözelti

0,5 mg emedastine eşdeğer 0,884 mg emedastin difumarat içerir.

Yardımcı madde(ler):

Benzalkonyum klorür 0,10 mg/ mL

Yardımcı maddeler için 6.1.'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Göz damlası, çözelti.

Renksiz partikülsüz berrak çözelti.

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1. Terapötik endikasyonlar

Mevsimsel alerjik konjunktivitin semptomatik tedavisinde endikedir.

4.2. Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji / uygulama sıklığı ve süresi:

EMEKSAT 6 haftadan uzun klinik çalışmalarda denenmemiştir.

Pozoloji

Doz, etkilenen gözlere günde iki kez bir damladır.

Diğer oftalmik ilaçlarla beraber kullanıldığında, ürünlerin uygulamaları arasında 10 dakikalık bir süre bırakılmalıdır. Göz pomadları en son uygulanmalıdır.

Uygulama şekli

Oküler kullanım içindir.

Damlalık ucunun ve çözeltinin kontaminasyonunu önlemek için, damlalığın ucunun göz kapaklarına, çevresindeki bölgelere ve diğer yüzeylere değdirilmemesine dikkat edilmelidir.

Kapak açıldıktan sonra, emniyet belirteci olan halka gevşekse ürünü kullanmadan önce halkayı çıkarınız.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler

Böbrek/Karaciğer yetmezliği:

EMEKSAT böbrek/karaciğer yetmezliği olan hastalarda çalışılmamıştır, dolayısıyla bu popülasyonda önerilmemektedir.

Pediyatrik popülasyon:

EMEKSAT, çocuk hastalarda (3 yaş ve üzeri) erişkinlerdeki aynı pozolojiyle kullanılabilir.

Geriyatrik popülasyon:

EMEKSAT, 65 yaş ve üzerindeki hastalarda denenmemiştir ve dolayısıyla bu popülasyonda kullanımı önerilmemektedir.

4.3. Kontrendikasyonlar

Bileşimindeki maddelerden herhangi birine karşı aşırı duyarlılığı olanlarda kullanılmamalıdır.

4.4. Özel kullanım uyarıları ve önlemler

Emedastin ile bağlantılı korneal infiltratlar bildirilmiştir. Korneal infiltrat durumunda ürün kesilmelidir ve uygun tedavi başlatılmalıdır.

Oftalmik ürünlerde yaygın olarak kullanılan koruyucu benzalkonyum klorürün punktat keratopatiye ve/veya toksik ülseratif keratopatiye neden olduğu bildirilmiştir. EMEKSAT benzalkonyum klorür içerdiğinden, sık veya uzun süreli kullanımı halinde yakın takip gereklidir.

İçerdiği benzalkonyum klorür sebebiyle gözde iritasyona sebebiyet verebilir. Benzalkonyum klorür yumuşak kontakt lensler tarafından emilebilir ve kontakt lenslerin rengini değiştirebilir. Bu ilacı kullanmadan önce kontakt lensleri çıkarmalı ve 15 dakika sonra takmalısınız.

Benzalkonyum klorür özellikle kuru göz durumu ve kornea (gözün ön tarafındaki şeffaf katman) hastalıklarınız varsa gözde tahrişe neden olabilir. Kullanımdan sonra gözde anormal his, batma veya acı hissederseniz doktorunuza başvurunuz.

4.5. Diğer tıbbi ürünler ile etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

Herhangi bir etkileşim çalışması gerçekleştirilmemiştir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler

Pediyatrik popülasyon:

Çocuklar üzerinde özel bir etkileşim çalışması yapılmamıştır.

4.6. Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi: C

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar / Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

Emedastinin doğum kontrol yöntemlerine etkisi bilinmemektedir.

EMEKSAT gerekli olmadıkça çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlarda kullanılmamalıdır.

Gebelik dönemi

Emedastinin gebe kadınlarda kullanımına ilişkin yeterli veri mevcut değildir.

Hayvanlar üzerinde yapılan araştırmalar, gebelik ve/veya embriyonel/fetal gelişim ve/veya doğum ve/veya doğum sonrası gelişim üzerindeki etkiler bakımından yetersizdir (Bölüm 5.3.'e bakınız). İnsanlara yönelik potansiyel risk bilinmemektedir.

EMEKSAT gerekli olmadıkça gebelik döneminde kullanılmamalıdır.

Laktasyon dönemi

Oral uygulamadan sonra sıçanlarda emedastin süte geçmiştir. İnsanlarda topikal uygulamadan sonra anne sütünde saptanabilir miktarlarda yeterli sistemik dolaşıma geçip geçmediği bilinmemektedir. EMEKSAT emzirme döneminde uygulanırsa dikkatli olunmalıdır.

Üreme yeteneği / Fertilite

Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalar herhangi bir olumsuz fertilite bulgusu göstermemiştir (Bölüm 5.3.'e bakınız). İnsanlarda üreme yeteneği üzerindeki etkisi bilinmemektedir.

4.7. Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

EMEKSAT'ın araç ve makine kullanma yeteneği üzerine hiç etkisi yoktur veya ihmal edilebilir bir etkisi vardır, ancak diğer oküler ilaçlarla olduğu gibi, damlatma sırasında geçici görme bulanıklığı veya başka görme rahatsızlıkları ortaya çıkarsa, hasta araç veya herhangi bir makine kullanmadan önce görme netleşinceye kadar beklemelidir.

4.8. İstenmeyen etkiler

Güvenlik profilinin özeti

696 hastayı içeren 13 klinik çalışmada emedastin 42 güne kadar iki göze birden günde 1–4 defa uygulandı. Klinik denemelerde, hastaların yaklaşık %7'sinde emedastin ile ilişkili advers ilaç reaksiyonu meydana geldi; yine de, bu hastaların %1'den daha azı bu advers reaksiyonlar nedeniyle tedaviyi bıraktı. Klinik denemelerde ciddi oftalmik veya sistemik advers reaksiyon gözlenmedi. En sık görülen advers ilaç reaksiyonları hastaların %1 ile %2'sinde ortaya çıkan göz ağrısı ve kaşıntısıydı.

Aşağıda listelenen advers reaksiyonlar klinik çalışmalarda veya pazarlama sonrası deneyimlerde gözlendi, sistem organ sınıfına göre sınıflandırıldı.

Advers etkiler çok yaygın (≥1/10), yaygın (≥1/100 ila <1/10), yaygın olmayan (≥1/1.000 ila <1/100), seyrek (≥1/10.000 ila <1/1.000), çok seyrek (<1/10.000), bilinmiyor (eldeki verilerden hareketle tahmin edilemiyor) olarak listelenmiştir.

Psikiyatrik hastalıkları

Yaygın olmayan:

Anormal rüyalar.

Sinir sistemi hastalıkları

Yaygın olmayan:

Baş ağrısı, sinüs baş ağrısı, disguzi.

Göz hastalıkları

Yaygın:

Göz ağrısı, gözde kaşıntı, konjunktival hiperemi.

Yaygın olmayan:

Korneal infiltratlar, korneal lekelenme, bulanık görme, göz iritasyonu, kuru göz, gözlerde yabancı cisim hissi, lakrimasyon artışı, astenopi, oküler hiperemi.

Kardiyak hastalıklar

Bilinmiyor:

Taşikardi.

Deri ve deri altı doku hastalıkları

Yaygın olmayan:

Kızarıklık.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yarar/risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TÜFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir (www.titck.gov.tr; e-posta: tufam@titck.gov.tr; tel: 0 800 314 00 08; faks: 0 312 218 35 99).

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Ürünün oküler doz aşımı ile ilgili spesifik bir reaksiyon beklenmemektedir.

Kazaen veya kasıtlı olarak ağız yolundan alınan aşırı dozla ilgili insanlarda veri bulunmamaktadır. EMEKSAT şişesinin tüm içeriğinin kazaen oral yolla alınması durumunda, sedatif etki oluşabilir ve emedastinin QT intervalini artırma potansiyeli akılda tutulmalıdır ve uygun izleme ve tedavi başlatılmalıdır.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1. Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik grup: Göz İlaçları; Dekonjestanlar ve antialerjikler; Diğer antialerjikler.

ATC kodu: S01GX06.

Emedastin, güçlü selektif ve topikal olarak etkili bir histamin H_1 antagonistidir (K_i= 1,3 nM). Emedastinin histamin reseptörlerine (H_1, H_2 ve H_3) afinitesinin *in vitro* denemeleri H_1 reseptörleri için 10.000 kat daha selektif olduğunu göstermiştir, K_i'ler sırasıyla 1,3 nM, 49,064 nM ve 12,430 nM'dır. *İn vivo* olarak emedastinin topikal oküler uygulaması, histaminle uyarılan konjunktival vasküler geçirgenlikte konsantrasyona bağlı bir inhibisyon oluşturur. Emedastinle yapılan çalışmalar adrenerjik, dopaminerjik ve serotonin reseptörleri üzerine herhangi bir etki göstermemiştir.

5.2. Farmakokinetik özellikler

Genel Özellikler

Emedastin, beyaz veya çok hafif sarı kristal bir tozdur. Kokusuzdur veya belirsiz bir karakteristik kokusu vardır. %0,2'lik çözeltisinin pH'sı 3–4,5 arasındadır.

Emilim:

Emedastin topikal olarak uygulanan diğer etkin maddeler gibi sistemik olarak emilmektedir.

Dağılım:

Emedastin 0,5 mg/mL steril oftalmik solüsyonun 15 gün süreyle günde iki kez bilateral uygulanmasıyla ana bileşiğin plazma konsantrasyonları genellikle yöntemin miktar tayini sınırının (0,3 ng/mL) altında bulundu. Emedastin miktar tayininin yapılabildiği numunelerde de 0,30–0,49 ng/mL aralığındaydı. Emedastinin insanlardaki oral biyoyararlanımı yaklaşık olarak %50 civarındadır ve maksimum plazma konsantrasyonuna dozlamadan 1–2 saat sonra ulaşılmaktadır.

Biyotransformasyon:

Emedastin başlıca karaciğerde metabolize olmaktadır. Topikal emedastinin eliminasyon yarı ömrü 10 saattir. Başlıca iki metaboliti 5- ve 6-hidroksiemedastindir. 5- ve 6-Hidroksiemedastinin 5-okso analogları ve N-oksit de ayrıca minör metabolitleri olarak oluşmaktadır.

Eliminasyon:

Oral dozun yaklaşık %44'ü 24 saat içinde idrarla atılmaktadır ve bunun sadece %3,6'sı ana bileşik olarak atılmaktadır. Başlıca iki metaboliti 5- ve 6-hidroksiemedastin serbest şekilde ve

konjuge halde idrarla atılırlar.

Hastalardaki karakteristik özellikler

Böbrek/Karaciğer yetmezliği: Böbrek/Karaciğer yetmezliği olanlarda özel bir çalışma yapılmamıştır.

5.3. Klinik öncesi güvenlilik verileri

Emedastin difumarat çeşitli uygulama yollarıyla değişik hayvan türlerinde düşük bir akut toksisite göstermiştir. Tavşanlarda uzun dönem topikal oküler uygulamada klinik olarak anlamlı herhangi bir lokal veya sistemik etki gözlenmemiştir.

Korneal limbal mononükleer hücre infiltratları 0,5 mg/mL ile tedavi edilen 4 erkek maymundan 1'inde, 1,0 mg/mL ile tedavi edilenlerde, 4 erkekten 4'ünde ve 4 dişiden 1'inde görülmüştür. Skleral mononükleer hücre infiltratları 0,5 mg/mL ile tedavi edilenlerden 4 erkekten 1'inde ve 4 dişiden 1'inde, 1,0 mg/mL ile tedavi edilenlerden 4 erkekten 2'sinde ve 4 dişiden 1'inde görülmüştür. Ortalama plazma doruk seviyeleri 0,5 mg/mL için 1 ng/mL ve 1,0 mg/mL için 2 ng/mL idi.

Emedastinin köpeklerde QT intervalini artırdığı bulunmuştur; etki görülmeyen plazma düzeyi (NOEL), hastalarda bulunandan 23 kat daha yüksek düzeylere eşdeğerdir (emedastin saptama limiti olan 0,3 ng/mL ile karşılaştırıldığında 7 ng/mL).

Emedastin difumarat fare ve sıçanlarda yapılan çalışmalarda karsinojenik bulunmamıştır. Emedastin difumarat *in vitro* ve *in vivo* standart genotoksisite testleri dizisinde genotoksik bulunmamıştır.

Sıçanlardaki bir teratoloji çalışmasında değerlendirilen en yüksek dozda (140 mg/kg/gün) fötotoksik etkiler görülmüş fakat teratojenik etkiler gözlenmemiştir; daha düşük düzeylerde (40 mg/kg/gün), ancak yine de önerilen terapötik dozu aşan miktarlarda herhangi bir etki gözlenmemiştir. Tavşanlarda yapılan çalışmada herhangi bir üreme toksisitesi gözlenmemiştir.

Sıçanlarda Emedastine difumaratın 30 mg/kg/gün'e kadar oral uygulamalarında fertilitede/üreme yeteneğinde bozulma ve azalmış üreme kapasitesi ile ilgili herhangi bir kanıt bulunmamaktadır.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1. Yardımcı maddelerin listesi

Benzalkonyum klorür
Trometamol
Sodyum klorür
Hidroksipropil metil seliloz
Hidroklorik asit ve/veya Sodyum hidroksit (pH ayarı için)
Enjeksiyonluk su

6.2. Geçimsizlikler

Geçerli değildir.

6.3. Raf ömrü

48 ay.
Açıldıktan sonra 4 hafta içinde kullanılmalıdır.

6.4. Saklamaya yönelik özel uyarılar

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.

6.5. Ambalajın niteliği ve içeriği

LDPE–HDPE kapak ile kapatılmış, LDPE damlalıklı, 5 mL'lik çözelti içeren 1 adet opak LDPE şişe içerisinde, kullanma talimatı ile birlikte karton kutuda ambalajlanır.

6.6. Beşeri Tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Özel bir gereksinim yoktur.
Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller "Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği" ve "Ambalaj Atıkları Kontrolü Yönetmeliği"ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

World Medicine İlaç San. ve Tic. A.Ş.

Bağcılar / İstanbul

8. RUHSAT NUMARASI

2018/118

9. İLK RUHSAT TARİHİ / RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi : 07.03.2018

Ruhsat yenileme tarihi :

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ