

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Neosynephrin-POS 10 %, 100 mg/ml, krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

1 ml roztworu zawiera 100 mg chlorowodoru fenylefryny (*Phenylephrini hydrochloridum*).

Substancja pomocnicza o znanym działaniu:

1 ml roztworu zawiera 0,05 mg benzalkoniowego chlorku.

Pełny wykaz substancji pomocniczych, patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór

4. SZCZEGÓŁOWE DANE KLINICZNE

4.1 Wskazania do stosowania

- uzyskanie krótkotrwałego rozszerzenia źrenicy w celu wykonania badania dna oka, szczególnie obwodowej jego części oraz po operacjach okulistycznych,
- zapobieganie i zrywanie tylnych zrostów tęczówki przy zapaleniach jagodówki,
- podanie w celu zdiagnozowania zapalenia spojówki i występującego równocześnie zapalenia tęczówki i ciała rzęskowego.

4.2 Dawkowanie i sposób podawania

Dawkowanie

Zazwyczaj stosowana dawka leku to 1 do 2 razy na dobę 1 kropla leku do każdego oka. Podawanie przez okres dłuższy niż 5 dni może odbywać się wyłącznie pod kontrolą lekarza.

Dzieci i młodzież

Lek Neosynephrin-POS 10 % jest przeciwwskazany do stosowania u dzieci w wieku poniżej 12 lat (patrz punkt 4.3).

Brak danych dotyczących dzieci w wieku od 12 do 18 lat. Stosowanie leku Neosynephrin-POS 10 % nie jest zalecane u tych pacjentów.

4.3 Przeciwwskazania

Produkt leczniczy jest przeciwwskazany do stosowania w następujących przypadkach:

- nadwrażliwość na fenylefrynę lub na którąkolwiek substancję pomocniczą wymienioną w punkcie 6.1,
 - suche zapalenie błon śluzowych nosa,
 - ciąża i karmienie piersią,
 - dzieci w wieku poniżej 12 lat (patrz punkt 4.4).
-

4.4 Specjalne ostrzeżenia i środki ostrożności dotyczące stosowania

Należy zachować szczególną ostrożność stosując Neosynephrin-POS 10% w przypadku jaskry, ponieważ rozszerzenie źrenicy może być szkodliwe, szczególnie przy jaskrze z wąskim kątem przesączania, również w przypadku nadciśnienia tętniczego i zaburzeń rytmu serca, ciężkich zmian chorobowych serca i naczyń. Istnieje ryzyko, że krople mogą przedostać się do układu krążenia. Dlatego należy stosować je bardzo ostrożnie u pacjentów z zaburzeniami rytmu serca i innymi chorobami serca, nadciśnieniem tętniczym, tętniakiem, zaawansowanym stwardnieniem tętnic, nadczynnością tarczycy. Uwaga powyższa dotyczy również pacjentów w podeszłym wieku, dzieci w wieku od 12 do 18 lat.

Produkt leczniczy zawiera benzalkoniowy chlorek. Benzalkoniowy chlorek może być absorbowany przez miękkie soczewki kontaktowe i zmieniać ich zabarwienie. Należy usunąć soczewki kontaktowe przed zakropieniem i odczekać co najmniej 15 minut przed ponownym założeniem. Zgłaszano, że chlorek benzalkoniowy może powodować także podrażnienie oczu, objawy zespołu suchego oka lub może wpływać na film łzowy i powierzchnię rogówki. Chlorek benzalkoniowy należy stosować ostrożnie u pacjentów z zespołem suchego oka lub z uszkodzeniami rogówki. Pacjentów leczonych długotrwale należy kontrolować. Z powodu niewielkiej liczby danych nie ma różnic w profilu działań niepożądanych u dzieci w porównaniu z osobami dorosłymi. Zasadniczo jednak oczy dzieci wykazują silniejszą reakcję na bodźce niż oczy osób dorosłych. Podrażnienie może mieć wpływ na leczenie u dzieci.

Dzieci i młodzież

Stosowanie u dzieci w wieku poniżej 12 lat jest przeciwwskazane, ponieważ notowano ciężkie ogólnoustrojowe działania niepożądane związane z produktami okulistycznymi zawierającymi fenylefrynę.

Stosowanie u dzieci w wieku od 12 do 18 lat nie jest zalecane ze względu na brak odpowiedniego doświadczenia klinicznego.

4.5 Interakcje z innymi produktami leczniczymi i inne rodzaje interakcji

Sercowo-naczyniowe działanie podanych jednocześnie inhibitorów MAO, trójpierścieniowych leków przeciwdepresyjnych, jak również insuliny, atropiny i propranololu może ulec nasileniu.

W przypadku leczenia nadciśnienia guanetydyną i rezerpiną może nastąpić znaczne podwyższenie ciśnienia krwi.

4.6 Wpływ na płodność, ciążę i laktację

Stosowanie podczas ciąży lub laktacji jest przeciwwskazane (patrz punkt 4.3).

4.7 Wpływ na zdolność prowadzenia pojazdów mechanicznych i obsługiwanie maszyn

Neosynephrin-POS 10% hamuje akomodację i rozszerza źrenicę. Zdolność widzenia jest upośledzona na kilka godzin. W tym okresie pacjent nie może prowadzić pojazdów ani obsługiwać maszyn.

4.8 Działania niepożądane

Bardzo często: $\geq 1/10$

Często: $\geq 1/100$ do $< 1/10$

Niezbyt często: $\geq 1/1000$ do $< 1/100$

Rzadko: $\geq 1/10000$ do $< 1/1.000$

Bardzo rzadko: $< 1/10000$

Nieznana: częstość nie może być określona na podstawie dostępnych danych

Przekrwienie; piekący ból oczu.

Rzadko może wystąpić utrzymujące się przez kilka godzin zaburzenie ostrości widzenia połączone z

zamazanym obrazem (w pojedynczych przypadkach może wystąpić amplituda akomodacji do 3 dioptrii).

Rzadko może wystąpić podwyższenie ciśnienia krwi. W pojedynczych przypadkach stwierdzono podwyższenie ciśnienia krwi połączone z kołataniem serca, częstoskurczem i silnymi bólami głowy. Objawy te występowały przede wszystkim pacjentów z przekrwieniem i krwawieniem spojówek oraz uszkodzeniami nabłonka gałki ocznej. Długotrwałe stosowanie może powodować zaczerwienienie i obrzęk oka, a u starszych pacjentów występowanie działania przeciwnego, polegającego na zwężeniu źrenicy. W pojedynczych przypadkach, długotrwałe stosowanie może wywołać zrogowacenie spojówki z zamknięciem punkcików łzowych i łzotokiem. Benzalkoniowy chlorek może wywoływać podrażnienie oczu.

Uwaga

Neosynephrin-POS 10 % może zwężać kąt tęczówkowo-rogówkowy i prowadzić do napadu jaskry. Przy stwierdzonej wcześniej jaskrze należy zastosować dodatkowo leki obniżające ciśnienie wewnątrzgałkowe (np. pilokarpinę).

Dzieci i młodzież

Zaburzenia układu oddechowego, klatki piersiowej i śródpiersia

Obrzęk płuc – częstość nieznana (nie może być określona na podstawie dostępnych danych).

Zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych

Po dopuszczeniu produktu leczniczego do obrotu istotne jest zgłaszanie podejrzewanych działań niepożądanych. Umożliwia to nieprzerwane monitorowanie stosunku korzyści do ryzyka stosowania produktu leczniczego. Osoby należące do fachowego personelu medycznego powinny zgłaszać wszelkie podejrzewane działania niepożądane krajowego systemu zgłaszania: Departament Monitorowania Niepożądanych Działań Produktów Leczniczych Urzędu Rejestracji Produktów Leczniczych, Wyrobów Medycznych i Produktów Biobójczych Al. Jerozolimskie 181C, 02-222 Warszawa, tel.: + 48 22 49-21-301, fax: +48 22 49-21-309, strona internetowa:

<https://smz.ezdrowie.gov.pl>

Działania niepożądane można zgłaszać również podmiotowi odpowiedzialnemu.

4.9 Przedawkowanie

Można spodziewać się następujących objawów po przedawkowaniu: nadciśnienia połączonego z kołataniem serca, bólów głowy, wymiotów, wystąpienia uczucia strachu, drżenia, z początku częstoskurczu potem, z powodu stymulacji kłębka szyjnego, spowolnienia czynności serca. W pojedynczych przypadkach może wystąpić, także po podaniu miejscowym większej ilości fenylefryny 10 %, niebezpieczne podwyższenie ciśnienia krwi.

Dawka toksyczna dla dzieci wynosi 3 mg, a dla dorosłych 300 mg na kilogram masy ciała.

Po przyjęciu doustnym, należy podać węgiel aktywowany i ewentualnie wykonać płukanie żołądka.

Po miejscowym przedawkowaniu należy oczy natychmiast przepłukać wodą.

Jeśli wystąpi odruchowa bradykardia należy podać atropinę (dzieciom 0,01 do 0,02 mg/kg masy ciała), przy niebezpiecznym podwyższeniu ciśnienia fentolaminę, jako obwodowy bloker receptorów.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Preparaty sympatykomimetyczne, kod ATC: S 01 FB 01

Chlorowodorek fenylefryny jest stosowany miejscowo do oka w stężeniu od 0,06 % do 10 %, a jako środek obkurczający naczynia, w podrażnieniach spojówek w stężeniu od 0,1 % do 0,25 %.

Chlorowodorek fenylefryny należy do grupy α -sympatykomimetyków (agonistów receptorów α_1) z wyraźnymi właściwościami zapobiegającymi przekrwieniom. Selektywne działanie fenylefryny na

receptory $\alpha 1$ zostało potwierdzone licznymi badaniami na zwierzętach. I tak np. bunazozyna, jako silny bloker receptorów $\alpha 1$ antagonizuje obkurczanie tętnic w oku królika wywołane przez chlorowodorek fenylefryny.

Efekt rozszerzający źrenicę i obniżający ciśnienie wewnątrzgałkowe chlorowodoru fenylefryny przy większym jego stężeniu (2,5 %-10 %) polega na działaniu na mięśnie oka.

Przy niższych stężeniach chlorowodoru fenylefryny wykorzystywane jest działanie, zapobiegające przekrwieniom, towarzyszące stanom podrażnień oka i błony śluzowej nosa.

Po stosowaniu 10% roztworu chlorowodoru fenylefryny obserwowano, równoległe do rozszerzenia źrenicy, zjawisko porażenia akomodacji. Rozszerzenie źrenicy utrzymuje się przez okres około 5 godzin.

Badania zależności występowania odpowiednio, efektu rozszerzającego źrenicę, bądź porażającego akomodację, w zależności od wielkości podanej dawki, potwierdza wzrost siły działania w zakresie stężeń od 0,1 % do 10 %.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Właściwości farmakokinetyczne po miejscowym podaniu do oka.

Prowadzono badania in-vivo i in-vitro z użyciem oczu królików. Nabłonek rogówki odgrywa istotną rolę w przenikaniu chlorowodoru fenylefryny, jak również bierze udział w procesach metabolicznych.

Usunięcie nabłonka prowadzi do 10 krotnego zwiększenia przenikania fenylefryny i jej metabolitów. Zgadza się to z obserwacją, że fenylefryna słabo rozpuszcza się w lipidach i w zakresie fizjologicznego pH tworzy słabą zasadę. Po 3 krotnym podaniu 0,1% roztworu fenylefryny, 56 % substancji czynnej stwierdzono w cieczy wodnistej.

Stężenie fenylefryny wzrasta 10 do 13 krotnie w przypadku usunięcia nabłonka (badania na zwierzętach). Stężenie substancji czynnej w rogówce wzrasta 3,5 krotnie.

W przypadku nieuszkodzonego nabłonka stężenie w cieczy wodnistej wynosiło 25 μ M, zaś w przypadku nabłonka uszkodzonego 340 μ M.

Metabolizm fenylefryny zachodzi częściowo już w rogówce.

W przypadku podania roztworu o stężeniu poniżej 0,1 % ilość metabolizowanej fenylefryny wewnątrz gałki ocznej wyraźnie się obniża.

Chlorowodorek fenylefryny szybko opuszcza przednią komorę oka. Po podaniu 1,5% roztworu chlorowodoru fenylefryny ilość wydalana wynosi $1,3 \pm 0,2 \text{ h}^{-1}$.

Fenylefryna jest substratem dla monoaminooksydazy (MAO), enzymu występującego w nabłonku rogówki. Nie jest jednak, jak dotąd, wyjaśnione czy MAO odpowiedzialna jest za biotransformację fenylefryny.

Farmakokinetyka ośrodkowa

U dorosłych pacjentów obserwuje się wymierne podwyższenie ciśnienia krwi w przypadku dożylnego podania 0,75 mg chlorowodoru fenylefryny stężenie maksymalne występuje po 1 minucie.

Skurczowe i rozkurczowe ciśnienie krwi powraca do poziomu wyjściowego po około 5 minutach. Po miejscowym podaniu 2 kropli do oka zawierających po 0,66 mg chlorowodoru fenylefryny, stwierdza się, że działanie sercowo-naczyniowe występuje z pewnym opóźnieniem, odpowiadającym podanej dawce.

Wehłanianie ośrodkowe po miejscowym podaniu jest więc znaczne.

5.3 Przedkliniczne dane o bezpieczeństwie

Toksyczność ostra

Ostra toksyczność miejscowa

Istnieją badania dotyczące podawania miejscowego wysokich dawek chlorowodoru fenylefryny (roztwór 2,5 %), które dowodzą, że u ludzi w wyniku działania obkurczającego, częściowe ciśnienie tlenu może być obniżone, przy czym przepływ krwi przez płamkę po zastosowaniu zgodnym z przepisaniem nie ulega istotnej zmianie.

U królików, po usunięciu nabłonka rogówki i podaniu 2,5 % i 10 % roztworu fenylefryny, stwierdzono

działanie cytotoksyczne na śródbłonek rogówki i nadmierne rogowacenie.

Obserwowano szczególnie zgrubienie rogówki w wyniku powstania obrzęku. Podobne wyniki obserwowano przy podaniu 10 % roztworu chlorowodoru fenylefryny kotom. Po zastosowaniu roztworu chlorowodoru fenylefryny o niższym stężeniu (0,125%), nie obserwowano wystąpienia podobnego zjawiska.

Toksyczność przewlekła

Brak badań, dotyczących toksyczności przewlekłej u zwierząt.

Potencjał mutageny i rakotwórczy

Badania in-vitro nie dają istotnych wskazówek, dotyczących działania mutagennego. Badania potencjału rakotwórczego przeprowadzono na myszach i szczurach przez okres

2 lat. Nie znaleziono dowodów potwierdzających występowanie zmian neoplastycznych. U szczurów stwierdzano, zależną od dawki, zwiększoną skłonność do występowania przewlekłych ogniskowych zapaleń wątroby i prostaty.

Toksyczny wpływ na reprodukcję

W badaniach na szczurach stwierdzono, zależne od podanej dawki fenylefryny, silne zmniejszenie ukrwienia macicy, co należy łączyć ze wzrostem oporu w obwodowych naczyniach macicy oraz wzrostem kurczliwości błony mięśniowej macicy, co prowadziło do zaburzeń wzrostu płodowego. W badaniach zarodków szczurów, fenylefryna prowadziła do wyraźnego wzrostu częstości występowania położenia odwrotnego.

U ludzi nie stwierdzono znaczącego wzrostu liczby uszkodzeń płodu na skutek podawania fenylefryny.

Fenylefryna, w badaniach na szczurach, prowadzi do wzrostu teratogennego potencjału inhibitorów anhidrazy acetazolamidu. Brak danych dotyczących stosowania fenylefryny podczas laktacji.

6. DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Wykaz substancji pomocniczych

Benzalkoniowy chlorek (środek konserwujący),

Sodu edetynian,

Woda do wstrzykiwań.

6.2 Niezgodności farmaceutyczne

Dotychczas nieznanne

6.3 Okres ważności

2 lata

Po pierwszym otwarciu lek może być używany przez 4 tygodnie.

6.4 Specjalne środki ostrożności podczas przechowywania

Przechowywać w temperaturze poniżej 25 °C.

Przechowywać w oryginalnym opakowaniu w celu ochrony przed światłem.

6.5 Rodzaj i zawartość opakowania

Plastikowa butelka o pojemności 10 ml.

6.6 Specjalne środki ostrożności dotyczące usuwania i przygotowania produktu leczniczego do stosowania

Wszelkie niewykorzystane resztki produktu leczniczego lub jego odpady należy usunąć zgodnie z lokalnymi przepisami.

7. PODMIOT ODPOWIEDZIALNY POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

URSAPHARM Poland Sp. z o.o.
Wybrzeże Gdynskie 27
01-531 Warszawa, Polska
Telefon: 022 732 07 90
Telefax: 022 732 07 99
e-mail: info@ursapharm.pl

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

12106

9. DATA WYDANIA PIERWSZEGO POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU I DATA PRZEDŁUŻENIA POZWOLENIA

16.02.2006

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO