

# VALMISTEYHTEENVETO

## 1. LÄÄKEVALMISTEEN NIMI

Lastin 0,5 mg/ml silmätipat, liuos

## 2. VAIKUTTAVAT AINEET JA NIIDEN MÄÄRÄT

Atselastiinihydrokloridi 0,05 % (0,5 mg/ml).

Yhdessä tipassa on atselastiinihydrokloridia 0,015 mg.

Apuaine, jonka vaikutus tunnetaan: 1ml sisältää 0,125 mg bentsalkoniumkloridia.

Täydellinen apuaineluettelo, ks. kohta 6.1.

## 3. LÄÄKEMUOTO

Silmätipat, liuos.

Kirkas, väritön liuos.

## 4. KLIINISET TIEDOT

### 4.1 Käyttöaiheet

Kausiluonteisen allergisen silmän sidekalvotulehduksen oireiden hoito ja ehkäisy aikuisilla sekä 4-vuotialla ja sitä vanhemmilla lapsilla.

Ympärivuotisen allergisen silmän sidekalvotulehduksen oireiden hoito aikuisilla sekä 12-vuotialla ja sitä vanhemmilla lapsilla.

### 4.2 Annostus ja antotapa

#### *Kausiluonteinen allerginen silmän sidekalvotulehdus*

Tavallinen annostus aikuisille sekä 4-vuotialle ja sitä vanhemmille lapsille on yksi tippa kumpaankin silmään kaksi kertaa päivässä, tarvittaessa annostusta voidaan lisätä neljään kertaan päivässä.

Jos allergeenialtistus on ennakoitavissa, tulee Lastinia käyttää ennaltaehkäisevästi ennen altistusta.

#### *Ympärivuotinen allerginen silmän sidekalvotulehdus*

Tavallinen annostus aikuisille sekä 12-vuotialle ja sitä vanhemmille lapsille on yksi tippa kumpaankin silmään kaksi kertaa päivässä, tarvittaessa annostusta voidaan lisätä neljään kertaan päivässä.

Koska kliinisissä tutkimuksissa on esitetty turvallisuus ja teho 6 hoitoviikkoon asti, tulee hoidon kesto rajoittaa 6 viikkoon.

Neuvo itsehoitokäyttöön: Potilaita pitää neuvoa ottamaan lääkäriin yhteyttä, jos oireet pahenevat tai ne eivät lieydy 48 tunnin kuluttua. On myös huomioitava, että yli 6 viikon käyttö täytyy tapahtua lääkärin valvonnassa myös silloin, kun kyseessä on kausiluonteinen allerginen silmän sidekalvotulehdus.

### 4.3 Vasta-aiheet

Yliherkkyys vaikuttavalle aineelle tai kohdassa 6.1 mainituille apuaineille.

#### 4.4 Varoitukset ja käyttöön liittyvät varotoimet

Lastin silmätippoja ei ole tarkoitettu silmäinfektioiden hoitoon.

Lastin silmätipat sisältävät bentsalkoniumkloridia. Bentsalkoniumkloridi voi aiheuttaa silmä-ärsytystä erityisesti, jos sinulla on kuivat silmät tai sarveiskalvon sairauksia.

Lastin silmätippojen ja pehmeiden piilolinssien yhtäaikaista käyttöä tulee välttää. Piilolinssit tulee poistaa ennen silmätippojen käyttöä. Tämän jälkeen tulee odottaa 15 minuuttia ennen kuin piilolinssit voidaan ottaa käyttöön.

Liuos värjää pehmeitä piilolinsssejä.

#### 4.5 Yhteisvaikutukset muiden lääkevalmisteiden kanssa sekä muut yhteisvaikutukset

Lastin silmätipoilla ei ole tehty spesifisiä yhteisvaikutustutkimuksia.

Yhteisvaikutustutkimuksia on tehty suurilla oraalilla annoksilla atselastiinia. Tutkimusten tulokset eivät kuitenkaan ole sovellettavissa Lastin silmätippoihin, koska systeemiset pitoisuudet ovat pikogramma-luokkaa silmätippojen annostelun jälkeen.

#### 4.6 Hedelmällisyys, raskaus ja imetys

##### Raskaus

Saatavilla ei ole riittävästi tietoa, jotta voitaisiin olla varmoja atselastiinin turvallisuudesta raskauden aikana. Suuret suunkautta annetut atselastiiniannokset ovat eläinkokeissa aiheuttaneet haittavaikutuksia (sikiön kuolema, kasvun hidastuminen ja luuston epämuodostumat). Paikallisesti silmään tapahtuvaa annostelua seuraa minimaalinen systeeminen altistus (pikogramman luokkaa). Kuitenkin varovaisuutta tulee noudattaa käytettäessä Lastinia raskauden aikana.

##### Imetys

Pieniä määriä atselastiinia erittyy äidinmaitoon, eikä Lastinia sen tähden suositella käytettäväksi imetyksen aikana.

##### Hedelmällisyys

Vaikutuksia ihmisen hedelmällisyyteen ei ole tutkittu.

#### 4.7 Vaikutus ajokykyyn ja koneidenkäyttökykyyn

Lastinin annostelun jälkeen koettu lievä, ohimenevä ärsytys ei todennäköisesti vaikuta näkökykyyn sen enempää. Potilasta tulee kuitenkin neuvoa odottamaan, että näkökyky palautuu ennalleen ennen ajoneuvolla ajamista tai koneiden käyttöä, jos valmiste aiheuttaa ohimenevää vaikutusta näkökykyyn.

#### 4.8 Haittavaikutukset

Haittavaikutukset on esitetty kussakin yleisyysluokassa haittavaikutuksen vakavuuden mukaan alenevassa järjestyksessä:

Hyvin yleinen ( $\geq 1/10$ ), yleinen ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ), melko harvinainen ( $\geq 1/1\ 000$ ,  $< 1/100$ ), harvinainen ( $\geq 1/10\ 000$ ,  $< 1/1\ 000$ ), hyvin harvinainen ( $< 1/10\ 000$ ), tuntematon (koska saatavissa oleva tieto ei riitä arviointiin).

Immuunijärjestelmä: *hyvin harvinainen*: allerginen reaktio (kuten ihottuma ja kutina).

Hermosto: *melko harvinainen*: kitkerä maku suussa.

Silmät: *yleinen*: lievä ohimenevä silmä-ärsytys.

##### Epäillyistä haittavaikutuksista ilmoittaminen

On tärkeää ilmoittaa myyntiluvan myöntämisen jälkeisistä lääkevalmisteen epäillyistä haittavaikutuksista. Se mahdollistaa lääkevalmisteen hyöty-haittatasapainon jatkuvan arvioinnin. Terveystieteiden ammattilaisia pyydetään ilmoittamaan kaikista epäillyistä haittavaikutuksista seuraavalle taholle:

www-sivusto: [www.fimea.fi](http://www.fimea.fi)  
Lääkealan turvallisuus- ja kehittämiskeskus Fimea  
Lääkkeiden haittavaikutusrekisteri  
PL 55  
00034 FIMEA

#### 4.9 Yliannostus

Spesifisiä reaktioita silmään tapahtuneen yliannostuksen jälkeen ei tunneta. Silmän kautta tapahtuvan annostelun yhteydessä yliannostusreaktioita ei ole odotettavissa.

Toksisten atselastiinihydrokloridi-annosten antamisesta ihmisille ei ole kokemuksia. Eläinkokeissa saatuihin tuloksiin perustuen voidaan yliannostus- tai myrkytystapauksissa odottaa keskushermostohäiriöitä. Näiden häiriöiden hoito tulee olla oireenmukaista. Antidoottia ei ole.

### 5. FARMAKOLOGISET OMINAISUUDET

#### 5.1 Farmakodynamiikka

Farmakoterapeuttinen luokitus: Allergialääkkeet, ATC-koodi: S01GX07

Atselastiini, ftalatsinonijohdannainen, on luokiteltu voimakkaaksi pitkävaikutteiseksi antiallergiseksi aineeksi, jolla on selektiivinen H<sub>1</sub>-antagonistivaikutus. Paikallisen silmäannostelun jälkeen voidaan lisäksi havaita aineen anti-inflammatorinen vaikutus.

Tiedot *in vivo* (prekliinisistä) ja *in vitro* -tutkimuksista osoittavat, että atselastiini estää allergisissa reaktioissa sekä varhaisessa että myöhäisessä vaiheessa esiintyvien kemiallisten välittäjäaineiden, kuten leukotrieenin, histamiinin, PAF:n ja serotoniinin synteesiä tai vapautumista.

Pitkäaikaishoidon EKG-tutkimukset potilailla, joita on hoidettu suurilla oraalilla atselastiiniannoksilla, ovat osoittaneet, että moniannostutkimuksissa atselastiinilla ei ole ollut kliinisesti merkittävää vaikutusta QT (QTc) intervalliin.

Atselastiinin yhteyttä kammioperäisiin rytmihäiriöihin ja torsade de pointes:iin ei havaittu yli 3700 oraalisesti atselastiinia saavalla potilaalla.

Allergisen sidekalvotulehduksen oireiden pitäisi helpottua 15–30 minuutin kuluttua.

#### 5.2 Farmakokineetiikka

##### **Yleiset ominaisuudet (systeminen farmakokineetiikka)**

Oraalisen annostelun jälkeen atselastiini imeytyy nopeasti absoluuttisen biologisen hyötyosuuden ollessa 81 %. Nautitulla ruoalla ei ole vaikutusta imeytymiseen. Jakautumistilavuus on suuri, mikä osoittaa jakautumisen suuntautuvan pääasiassa periferiaan. Proteiineihin sitoutuminen on suhteellisen alhainen (80–90 %, riittävän alhainen taso, jotta ei ole huolta lääkeaineen syrjäytymisestä).

Puoliintumisaikat plasmassa kerta-annoksen jälkeen ovat noin 20 tuntia atselastiinilla ja noin 45 tuntia terapeuttisesti aktiivisella metaboliitilla, N-desmetyyli-atselastiinilla. Erittyminen tapahtuu pääasiassa ulosteen mukana. Pienten määrien erittyminen ulosteeseen viittaa siihen, että jonkin verran enterohepaattista kiertoa saattaa tapahtua.

## **Ominaisuudet potilailla (silmän farmakokinetiikka)**

Lastin silmätippojen toistuvan silmäapplikoinnin jälkeen (yksi tippa kumpaankin silmään neljästi päivässä -annosteluun asti), atselastiinihydrokloridin vakaan tilan  $C_{max}$  tasot plasmassa olivat hyvin alhaiset ja niitä oli juuri ja juuri todettavissa tai ne olivat määrittämissä alapuolella.

### **5.3 Prekliiniset tiedot turvallisuudesta**

Atselastiinihydrokloridi ei osoittautunut herkistäväksi marsulla suoritetuissa tutkimuksissa. Atselastiini ei osoittautunut genotoksiseksi *in vitro* ja *in vivo* -testeissä eikä sillä ollut karsinogeenisiä vaikutuksia rotille tai hiirille.

Koiras- ja naarasrotilla atselastiini aiheutti yli 3,0 mg/kg/päivä -suuruksilla oraalilla annoksilla annoksesta riippuvaisen laskun fertiilitteettikertoimeen, kuitenkin pitkäaikaisissa toksisuustutkimuksissa ei löydetty aineeseen liittyviä muutoksia koiraiden tai naaraiden lisääntymiselimissä.

Embryotoksiset ja teratogeeniset vaikutukset rotilla, hiirillä ja kaneilla ilmaantuivat ainoastaan emolle toksisilla annoksilla (esim. luuston epämuodostumia havaittiin rotilla ja kaneilla annoksella 68,6 mg/kg/päivä).

## **6. FARMASEUTTISET TIEDOT**

### **6.1 Apuaineet**

Bentsalkoniumkloridi  
Dinatriumedetaatti  
Hypromelloosi  
Sorbitoli, (70 % liuos)  
Natriumhydroksidi  
Injektionesteisiin käytettävä vesi.

### **6.2 Yhteensopimattomuudet**

Ei oleellinen.

### **6.3 Kesto aika**

3 vuotta.

Avaamisen jälkeen: Ei saa käyttää 4 viikkoa kauemmin.

### **6.4 Säilytys**

Tämä lääkevalmiste ei vaadi erityisiä säilytysolosuhteita.

### **6.5 Pakkaustyyppi ja pakkauskoot**

Läpinäkymätön 10 ml:n HDPE-pullo ja LDPE tippakärki, jossa valkoinen HDPE- kierrekorkki.

Pakkauskoot: 6 ml, 8 ml, 10 ml.

Kaikkia pakkauskokoja ei välttämättä ole myynnissä.

### **6.6 Erityiset varotoimet hävittämiselle**

Ei erityisvaatimuksia.

**7. MYYNTILUVAN HALTIJA**

Viatris Oy  
Vaisalantie 2-8  
02130 Espoo

**8. MYYNTILUVAN NUMERO**

13658

**9. MYYNTILUVAN MYÖNTÄMISPÄIVÄMÄÄRÄ/UUDISTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

Myyntiluvan myöntämisen päivämäärä: 21 joulukuu 1998  
Viimeisimmän uudistamisen päivämäärä: 17 helmikuu 2008

**10. TEKSTIN MUUTTAMISPÄIVÄMÄÄRÄ**

26.10.2022

# PRODUKTRESUMÉ

## 1. LÄKEMEDLETS NAMN

Lastin 0,5 mg/ml ögondroppar, lösning

## 2. KVALITATIV OCH KVANTITATIV SAMMANSÄTTNING

Azelastinhydroklorid 0,05 % (0,5 mg/ml).

En droppe innehåller azelastinhydroklorid 0,015 mg.

Hjälpämnen med känd effekt: 1 ml innehåller 0,125 mg bensalkoniumklorid.

För fullständig förteckning över hjälpämnen, se avsnitt 6.1.

## 3. LÄKEMEDELSFORM

Ögondroppar, lösning.

Klar, färglös lösning.

## 4. KLINISKA UPPGIFTER

### 4.1 Terapeutiska indikationer

Behandling och förebyggande av tecken och symtom på säsongsbunden allergisk konjunktivit hos vuxna och barn 4 år och äldre.

Behandling av symtom på allergisk konjunktivit under hela året hos vuxna och barn 12 år och äldre.

### 4.2 Dosering och administreringsätt

#### *Säsongsbunden allergisk konjunktivit*

Normal dos för vuxna och barn från 4 års ålder är en droppe i båda ögonen två gånger dagligen. Vid behov kan dosen ökas till fyra gånger dagligen.

Om allergenexponeringen kan förutses ska Lastin användas förebyggande före exponering.

#### *Allergisk konjunktivit under hela året*

Normal dos för vuxna och barn från 12 års ålder är en droppe i båda ögonen två gånger dagligen. Vid behov kan dosen ökas till fyra gånger dagligen.

Eftersom säkerhet och effekt har visats i kliniska prövningar vid upp till 6 veckors behandling ska behandlingstiden begränsas till 6 veckor.

Råd för självbehandling: Patienter ska rådaskontaktas om symtomen förvärras eller inte lindras inom 48 timmar. Det bör också beaktas att användning i mer än 6 veckor måste ske under överinseende av en läkare även när det gäller säsongsbunden allergisk konjunktivit.

### 4.3 Kontraindikationer

Överkänslighet mot den aktiva substansen eller mot något hjälpämne som anges i avsnitt 6.1.

### 4.4 Varningar och försiktighet

Lastin ögondroppar är inte avsedda för behandling av ögoninfektioner.

Lastin ögondroppar innehåller bensalkoniumklorid. Bensalkoniumklorid kan orsaka ögonirritation särskilt vid torra ögon eller hornhinn sjukdomar.

Samtidig användning av Lastin ögondroppar och mjuka kontaktlinser bör undvikas. Kontaktlinserna ska tas bort före användning av ögondroppar. Därefter ska man vänta 15 minuter innan kontaktlinserna kan användas.

Lösningen färgar mjuka kontaktlinser.

### 4.5 Interaktioner med andra läkemedel och övriga interaktioner

Inga specifika interaktionsstudier med Lastin ögondroppar har utförts.

Interaktionsstudier har utförts med höga orala doser azelastin. Resultaten från provningarna är emellertid inte tillämpliga på Lastin ögondroppar eftersom de systemiska koncentrationerna efter administrering av ögondroppar är i storleksordningen pikogram.

### 4.6 Fertilitet, graviditet och amning

#### Graviditet

Det finns inte tillräckliga data tillgängliga för att vara säker på säkerheten för azelastin under graviditet. Stora orala doser azelastin har i djurförsök orsakat biverkningar (fosterdöd, tillväxthämning och skelettdeformiteter). Lokal administrering i ögat följs av minimal systemisk exponering (i storleksordningen pikogram). Försiktighet bör dock iaktas vid användning av Lastin under graviditet.

#### Amning

Små mängder azelastin utsöndras i bröstmjolk och därför rekommenderas inte användning av Lastin under amning.

#### Fertilitet

Effekter på mänsklig fertilitet har inte studerats.

### 4.7 Effekter på förmågan att framföra fordon och använda maskiner

Mild eller övergående irritation efter administrering av Lastin har troligen ingen effekt på synförmågan. Patienten ska dock uppmanas att vänta tills synen återställts innan han eller hon kör fordon eller använder maskiner om produkten orsakar en övergående effekt på synförmågan.

### 4.8 Biverkningar

Biverkningarna presenteras nedan i enlighet med organsystem och frekvens i fallande ordning:

Mycket vanliga ( $\geq 1/10$ ), Vanliga ( $\geq 1/100$ ,  $< 1/10$ ), Mindre vanliga ( $\geq 1/1\ 000$ ,  $< 1/100$ ), Sällsynta ( $\geq 1/10\ 000$ ,  $< 1/1\ 000$ ), Mycket sällsynta ( $< 1/10\ 000$ ), Ingen känd frekvens (kan inte beräknas från tillgängliga data).

Immunsystemet: *mycket sällsynta*: allergisk reaktion (som hudutslag och klåda).

Centrala och perifera nervsystemet: *mindre vanliga*: bitter smak i munnen.

Ögon: *vanliga*: mild övergående ögonirritation.

### Rapportering av misstänkta biverkningar

Det är viktigt att rapportera misstänkta biverkningar efter att läkemedlet godkänts. Det gör det möjligt att kontinuerligt övervaka läkemedlets nytta-riskförhållande. Hälso- och sjukvårdspersonal uppmanas att rapportera varje misstänkt biverkning till:

webbplats: [www.fimea.fi](http://www.fimea.fi)  
Säkerhets- och utvecklingscentret för läkemedelsområdet Fimea  
Biverkningsregistret  
PB 55  
00034 FIMEA

## 4.9 Överdoser

Specifika reaktioner i ögat efter överdosering är inte kända. Vid intraokulär administrering är överdoseringsreaktioner inte förväntade.

Det finns ingen erfarenhet av administrering av toxiska doser av azelastinhydroklorid till människor. Baserat på resultat från djurförsök kan man i fall av överdosering eller förgiftning förvänta sig störningar i centrala nervsystemet. Behandlingen av dessa störningar ska vara symtomatisk. Det finns ingen antidot.

## 5. FARMAKOLOGISKA EGENSKAPER

### 5.1 Farmakodynamiska egenskaper

Farmakoterapeutisk grupp: Övriga antiallergika, ATC-kod: S01GX07

Azelastin, ett ftalazinonderivat, är klassificerat som ett kraftfullt långverkande antiallergiskt medel med selektiv H<sub>1</sub>antagonisteffekt. Efter lokal ögondosering kan den antiinflammatoriska effekten av ämnet dessutom observeras.

Data från *in vivo*- (prekliniska) och *in vitro*-undersökningar visar att azelastin hämmar syntesen eller frisättningen av kemiska neurotransmittorer som förekommer i både tidiga och sena stadier av allergiska reaktioner, såsom leukotriener, histamin, PAF och serotonin.

EKG-undersökningar på patienter som långtidsbehandlats med höga orala doser azelastin har visat att azelastin i flerdosprövningar inte haft någon kliniskt signifikant effekt på QT (QTc)-intervallet.

Ingen koppling mellan azelastin och ventrikulär arytm och torsades de pointes observerades hos mer än 3 700 patienter som fick oralt azelastin.

Symtomen på allergisk konjunktivit bör lätta efter 15–30 minuter.

### 5.2 Farmakokinetiska egenskaper

#### Allmänna egenskaper (systemisk farmakokinetik)

Efter oral administrering absorberas azelastin snabbt med en absolut biotillgänglighet på 81 %. Intag av mat har ingen effekt på absorptionen. Distributionsvolymen är stor, vilket indikerar att distributionen huvudsakligen riktas till periferin. Bindningen till proteiner är relativt låg (80–90 %, en tillräckligt låg nivå för att det inte ska finnas någon oro för läkemedelsförskjutning).

Halveringstiden i plasma efter en engångsdos är cirka 20 timmar för azelastin och cirka 45 timmar för den terapeutiskt aktiva metaboliten N-desmetyl-azelastin. Utsöndringen sker huvudsakligen med avföringen. Utsöndring av små mängder i avföringen tyder på att viss enterohepatisk cirkulation kan förekomma.



## **Egenskaper hos patienter (ögats farmakokinetik)**

Efter upprepad applicering av Lastin ögondroppar (en droppe i båda ögonen i upp till fyra gånger om dagen), var azelastinhydroklorids steady state  $C_{\max}$  nivåer i plasma mycket låga och knappt detekterbara eller låg de under detektionsgränsen.

### **5.3 Prekliniska säkerhetsuppgifter**

Azelastinhydroklorid visade sig inte vara sensibiliserande i prövningar med marsvin. Azelastin visade sig inte vara genotoxiskt i *in vitro*- och *in vivo*-tester och hade inte karcinogena effekter på råttor och möss.

Med orala doser på över 3,0 mg/kg/dag orsakade azelastin hos han- och honråttor dosberoende minskning av fertilitetskoefficienten i långsiktiga toxicitetsunderökningar, dock upptäcktes inga substansrelaterade förändringar i manliga eller kvinnliga reproduktionsorgan.

Embryotoxiska och teratogena effekter på råtta, mus och kanin uppträdde endast hos modern vid toxiska doser (t.ex. skelettdeformationer sågs hos råtta och kanin vid en dos på 68,6 mg/kg/dag).

## **6. FARMACEUTISKA UPPGIFTER**

### **6.1 Förteckning över hjälpämnen**

Bensalkoniumklorid  
Dinatriumedetat  
Hypromellos  
Sorbitol (70 % lösning)  
Natriumhydroxid  
Vatten för injektionsvätskor.

### **6.2 Inkompatibiliteter**

Ej relevant.

### **6.3 Hållbarhet**

3 år.

Efter öppnandet: Använd inte i mer än 4 veckor.

### **6.4 Särskilda förvaringsanvisningar**

Inga särskilda förvaringsanvisningar.

### **6.5 Förpackningstyp och innehåll**

Ogenomskinlig 10 ml HDPE-flaska och LDPE droppspets, med vit HDPE-skruvkork.

Förpackningsstorlekar: 6 ml, 8 ml, 10 ml.

Eventuellt kommer inte alla förpackningsstorlekar att marknadsföras.

### **6.6 Särskilda anvisningar för destruktion**

Inga speciella anvisningar.

**7. INNEHAVARE AV GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING**

Viatriis Oy  
Vaisalavägen 2-8  
02130 Esbo

**8. NUMMER PÅ GODKÄNNANDE FÖR FÖRSÄLJNING**

13658

**9. DATUM FÖR FÖRSTA GODKÄNNANDE/FÖRNYAT GODKÄNNANDE**

Datum för det första godkännandet: 21 december 1998  
Datum för den senaste förnyelsen: 17 februari 2008

**10. DATUM FÖR ÖVERSYN AV PRODUKTRESUMÉN**

26.10.2022