

FACHINFORMATION

Zusammenfassung der Merkmale des Arzneimittels

1. BEZEICHNUNG DER ARZNEIMITTEL

Spersacarpin 0,5% (5 mg/ml) Augentropfen, Lösung
Spersacarpin 2% (20 mg/ml) Augentropfen, Lösung

2. QUALITATIVE UND QUANTITATIVE ZUSAMMENSETZUNG

Spersacarpin 0,5% / 2% Augentropfen, Lösung
1 ml Augentropfen enthält 5 mg / 20 mg Pilocarpinhydrochlorid.

Sonstiger Bestandteil mit bekannter Wirkung:

Dieses Arzneimittel enthält etwa 4 Mikrogramm Benzalkoniumchlorid pro Tropfen, entsprechend 0,1 mg/ml.

Vollständige Auflistung der sonstigen Bestandteile, siehe Abschnitt 6.1.

3. DARREICHUNGSFORM

Augentropfen, Lösung

4. KLINISCHE ANGABEN

4.1 Anwendungsgebiete

- Chronisches Offenwinkelglaukom (chronisches Weitwinkelglaukom)
- Chronisches Winkelblockglaukom (chronisches Engwinkelglaukom)
- Akuter Glaukomanfall
- Pupillenverengung (Miosis) nach Pupillenerweiterung durch Mydriatika bzw. nach Operationen.

4.2 Dosierung und Art der Anwendung

Dosierung

Spersacarpin 0,5% Augentropfen

Bei chronischem Glaukom wird entsprechend dem Augeninnendruck 3- bis 4-mal täglich jeweils 1 Tropfen Spersacarpin 0,5% Augentropfen in den Bindehautsack eingetropf. Die erforderliche Dosis wird an Hand der Tagesdruckkurven individuell bestimmt.

Bei akutem Glaukomanfall werden die Tropfen bis zum Erreichen des erforderlichen Druck-Niveaus appliziert. Danach und zur Behandlung des unbehandelten Partnerauges stehen höhere Konzentrationen von Pilocarpinhydrochlorid-Augentropfen zur Verfügung.

Spersacarpin 2% Augentropfen

Bei chronischem Glaukom wird entsprechend dem Augeninnendruck 3- bis 4-mal täglich jeweils 1 Tropfen Spersacarpin 2% Augentropfen in den Bindehautsack eingetropf.

Die erforderliche Dosis wird an Hand der Tagesdruckkurven individuell bestimmt.

Bei akutem Glaukomanfall werden Tropfen niedriger Konzentration bis zum Erreichen des erforderlichen Druckniveaus appliziert.

Nach Erreichen des erforderlichen Druckniveaus werden Spersacarpin 2% Augentropfen

4-mal täglich am betroffenen Auge appliziert. Das bisher unbehandelte Partnerauge erhält üblicherweise Spersacarpin 2% Augentropfen 3-mal täglich zur Prophylaxe eines Winkelblockes.

Sehr selten kann es bei der Applikation von Spersacarpin durch die weitere Abflachung der Vorderkammer zur Verstärkung oder Auslösung der Winkelblocksituation kommen. Bei unzureichender Drucksenkung sind andere drucksenkende Maßnahmen zu ergreifen.

Möglicherweise benötigen Patienten mit dunkler Iris eine höhere Applikationshäufigkeit oder höhere Konzentrationen von Pilocarpinhydrochlorid. Der Augendruck ist bei solchen Patienten genau nachzukontrollieren.

Art der Anwendung

Zur Anwendung am Auge.

Die Anwendungsdauer ist bei guter Verträglichkeit nicht begrenzt.

Hinweis:

Bei akutem Glaukomanfall muss aufgrund der häufigen Anwendung, vor allem, wenn Tropfen in höherer Konzentration verwendet werden, die Möglichkeit einer systemischen Resorption von Pilocarpinhydrochlorid beachtet werden.

Zur Vermeidung einer möglichen systemischen Resorption, sollten nach der Applikation der Augentropfen 2 bis 3 Minuten lang die Tränenkanäle mit den Fingern zugehalten werden.

4.3 Gegenanzeigen

Spersacarpin darf nicht angewendet werden

- bei Erkrankungen des Auges, bei denen eine Pupillenverengung kontraindiziert ist: akuten Entzündungen der Regenbogenhaut (Iritis acuta), Uveitisglaukom, Neovaskularisationsglaukom,
- bei Überempfindlichkeit gegen den Wirkstoff oder einen der in Abschnitt 6.1 genannten sonstigen Bestandteile,
- in der Stillzeit
- bei Säuglingen und Kinder bis 3 Jahren.

4.4 Besondere Warnhinweise und Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Vorsichtsmaßnahmen für die Anwendung

Spersacarpin sollte aufgrund der möglichen systemischen Wirkungen nur mit besonderer Vorsicht angewendet werden bei

- Herzinsuffizienz,
- Asthma bronchiale (auch bei topischer Anwendung von Pilocarpinhydrochlorid können akute Asthmaanfälle ausgelöst werden),
- Hyperthyreose,
- Ulcus ventriculi und duodeni,
- Stenosen im Verdauungstrakt (z.B. Ileus) und
- Blasenentleerungsstörungen durch Harnwegsobstruktion.

Warnhinweise

Benzalkoniumchlorid kann von weichen Kontaktlinsen aufgenommen werden und kann zur Verfärbung der Kontaktlinsen führen. Kontaktlinsen sind vor der Anwendung zu entfernen und frühestens 15 Minuten nach der Anwendung wieder einzusetzen.

Benzalkoniumchlorid kann Reizungen am Auge hervorrufen, insbesondere bei trockenen Augen oder Erkrankungen der Hornhaut.

Benzalkoniumchlorid sollte bei Patienten mit trockenen Augen und bei Patienten mit geschädigter Hornhaut mit Vorsicht angewendet werden.

Bei längerer Anwendung sollten die Patienten überwacht werden.

4.5 Wechselwirkungen mit anderen Arzneimitteln und sonstige Wechselwirkungen

Pilocarpinhydrochlorid kann auch nach lokaler Applikation am Auge die Wirkung depolarisierender Muskelrelaxantien verlängern. Die Wirkung stabilisierender Muskelrelaxantien kann dagegen vermindert werden. Die negativ chronotrope Wirkung herzwirksamer Glykoside kann durch Pilocarpinhydrochlorid verstärkt werden.

4.6 Schwangerschaft und Stillzeit

Schwangerschaft

Bisher liegen keine oder nur sehr begrenzte Erfahrungen mit der Anwendung von Pilocarpinhydrochlorid bei Schwangeren vor. Bei Neugeborenen, deren Mütter kurz vor der Geburt mit dem in Spersacarpin Augentropfen enthaltenen Wirkstoff Pilocarpinhydrochlorid behandelt wurden, sind Hyperthermie, Unruhezustände, Krampfanfälle sowie eine erhöhte Diaphoresis beschrieben worden. Tierexperimentelle Studien haben eine Reproduktionstoxizität gezeigt (siehe Abschnitt 5.3). Da auch bei einer topischen Anwendung von Pilocarpinhydrochlorid eine systemische Verfügbarkeit gegeben ist und damit unerwünschte Effekte auf das ungeborene Kind nicht ausgeschlossen werden können, dürfen Spersacarpin Augentropfen in der Schwangerschaft nur bei zwingender Indikation und nach sorgfältiger Nutzen-Risiko-Abwägung verordnet werden. Die Gefahr systemischer Nebenwirkungen kann durch Okklusion des Tränennasenganges (Fingerdruck) verringert werden. Dennoch sollte die niedrigste, therapeutisch wirksame Dosis gewählt und wiederholte oder lang dauernde Anwendungen von Spersacarpin Augentropfen in der Schwangerschaft vermieden werden.

Stillzeit

Es ist nicht bekannt, ob Pilocarpinhydrochlorid in die Muttermilch übergeht. Spersacarpin Augentropfen sind während der Stillzeit kontraindiziert. Ist dennoch eine Anwendung von Spersacarpin Augentropfen unbedingt erforderlich, muss abgestillt werden.

4.7 Auswirkungen auf die Verkehrstüchtigkeit und die Fähigkeit zum Bedienen von Maschinen

Spersacarpin Augentropfen beeinflusst infolge Pupillenverengung und Schleiersehen die Sehleistung und somit das Reaktionsvermögen im Straßenverkehr und bei der Bedienung von Maschinen.

4.8 Nebenwirkungen

Bei der Bewertung von Nebenwirkungen werden folgende Häufigkeitsangaben zugrunde gelegt:

Sehr häufig ($\geq 1/10$)	kann mehr als 1 von 10 Behandelten betreffen
Häufig ($\geq 1/100$, $< 1/10$)	kann bis zu 1 von 10 Behandelten betreffen
Gelegentlich ($\geq 1/1.000$, $< 1/100$)	kann bis zu 1 von 100 Behandelten betreffen
Selten ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)	kann bis zu 1 von 1.000 Behandelten betreffen
Sehr selten ($< 1/10.000$)	kann bis zu 1 von 10.000 Behandelten betreffen
Nicht bekannt	Häufigkeit auf Grundlage der verfügbaren Daten nicht abschätzbar

Nebenwirkungen am Auge

verminderte Sehschärfe bei Patienten mit Linsentrübung (insbesondere Kerntürbungen und hintere subkapsuläre Trübungen), Miosis, konjunktivale Infektionen, gestörte Akkomodation mit vorübergehender Kurzsichtigkeit, Akkomodationsspasmen, die bis zu 2-3 Stunden anhalten können, sowie Pupillenverengung mit Störung des Sehens bei Dämmerung und Dunkelheit besonders bei Patienten unter 40 Jahren, vordere subkapsuläre Trübung, Myokomie des Lids, okuläre und periokuläre Schmerzen.

Augenerkrankungen

Häufig

vermehrte Tränensekretion, allergische Blepharokonjunktivitis und leichte Reizung der Bindehaut, Kopfschmerzen im Augen- und Stirnbereich als Ausdruck eines Ziliarmuskelspasmus.

Sehr selten

Pupillarsaumzysten,

insbesondere bei hohen Pilocarpinhydrochlorid-Konzentrationen von mehr als 2% kommt es zu einer Verengung der Vorderkammer und dadurch eventuell zur Auslösung oder Verstärkung der Symptomatik eines akuten Winkelblockglaukoms,

- Bei Augen mit primär chronischem Offenwinkelglaukom kann es in 15% der Fälle bei einer langfristigen Therapie mit Pilocarpinhydrochlorid zu Linsenflattern kommen.
- Permanente vordere und hintere Synechien können entstehen.
- Bei Patienten mit engem Kammerwinkel und bestehender Linsentrübung besteht die Gefahr eines Pupillarblockes.

Gefahr einer Netzhautablösung bei disponierten Personen (z.B. hohe Myopie, bekannte Netzhautdegenerationen). Deshalb sollte vor der erstmaligen Verordnung von Pilocarpinhydrochlorid bei allen Patienten eine Netzhautuntersuchung erfolgen und bei disponierten Personen während der Behandlung eine regelmäßige Netzhautuntersuchung erfolgen. Disponierte Patienten sollten zuvor über typische Symptome einer Netzhautablösung aufgeklärt werden.

Spersacarpin Augentropfen enthalten ein Konservierungsmittel, welches zur Allergisierung und weiteren Nebenwirkungen wie z.B. Geschmacksirritationen führen kann.

Allgemeine Erkrankungen und Beschwerden am Verabreichungsort:

Häufig

allergische Reaktionen.

Sehr selten

Übelkeit, Erbrechen, Tenesmen, abdominelle Spasmen, Speichelfluss, Schwitzen, Bronchialspasmen, Lungenödem, Störung der Herzfunktion, Blutdrucksteigerung, Muskelschwäche und Krämpfe.

Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen

Die Meldung des Verdachts auf Nebenwirkungen nach der Zulassung ist von großer Wichtigkeit. Sie ermöglicht eine kontinuierliche Überwachung des Nutzen-Risiko-Verhältnisses des Arzneimittels. Angehörige von Gesundheitsberufen sind aufgefordert, jeden Verdachtsfall einer Nebenwirkung über das

Bundesinstitut für Arzneimittel und Medizinprodukte

Abt. Pharmakovigilanz

Kurt-Georg-Kiesinger Allee 3

D-53175 Bonn

Webseite: <http://www.bfarm.de>

anzuzeigen.

4.9 Überdosierung

Symptome einer Überdosierung

Bei systemischer Applikation von Pilocarpinhydrochlorid ist bereits unterhalb der Dosis von 20 mg (Einzelmaksimaldosis bei Erwachsenen) mit Risiken zu rechnen. Systemische Reaktionen können auch schon nach Anwendung von Pilocarpinhydrochlorid am Auge in therapeutischen Dosen auftreten. Dies gilt vor allem für höhere Dosierung, wie z.B. bei der Therapie des akuten Glaukomanfalls.

Im Vordergrund der Pilocarpinhydrochlorid-Intoxikation stehen muskarinerge Effekte, wie Miosis, erhöhte Tränen-, Speichel-, Schweiß- und Bronchialsekretion, Übelkeit, Erbrechen, Bauchschmerzen, Durchfall und verstärkter Harndrang sowie Hautrötung und Kopfschmerz.

Der Kreislauf reagiert mit Blutdruckabfall. Initial bzw. bei niedrigeren Dosen kann eine reflektorische Tachykardie, bei höheren Dosen eine Bradykardie und im Extremfall ein Herzstillstand auftreten. Höhere Dosen können zu Bronchialspasmen und zum Lungenödem führen. Muskeltremor und zentrale Krämpfe können auftreten.

Therapiemaßnahmen bei Überdosierung

Nach versehentlicher oraler Aufnahme sind Maßnahmen der primären Detoxikation durchzuführen (Magenspülung, medizinische Kohle, Natriumsulfat). Zur Behandlung der muskarinergen Symptome wird Atropinsulfat als Antidot intravenös appliziert, ggf. in mehrmaliger Wiederholung. (Erwachsene 2 bis 4 mg, Kinder 0,04 bis 0,08 mg pro kg Körpergewicht, max. 4 mg).

Die benötigte Gesamtdosis bzw. Behandlungsdauer richtet sich nach der Symptomatik. Hierbei steht die Kontrolle der vitalen Funktionen (Herz-, Kreislauffunktion, Atmung) im Vordergrund. In schweren Fällen können Schockbehandlung und Herzmassage erforderlich werden. Krämpfe sind z.B. mit Diazepam zu behandeln.

5. PHARMAKOLOGISCHE EIGENSCHAFTEN

5.1 Pharmakodynamische Eigenschaften

Pharmakotherapeutische Gruppe:

Direktes Parasympathomimetikum (Glaukomtherapeutikum; Miotikum),

ATC-Code: S01E B01

Pilocarpinhydrochlorid, ein direkt wirkendes Parasympathomimetikum, ist ein Alkaloid aus *Pilocarpus jaborandi* oder *Pilocarpus microphyllus*. Es erregt muscarinartig spezifisch die postganglionären parasympathischen Acetylcholinrezeptoren und führt bei systemischer Anwendung zu verstärkter Schweiß-, Speichel- und Bronchialsekretion sowie zu Erbrechen und Durchfall. Es stimuliert die Sekretion der gastrointestinalen Drüsen und führt zur Kontraktion der glatten Muskulatur der Bronchien, des Gastrointestinaltraktes, der Gallenwege, der ableitenden Harnwege sowie der Harnblase. Pilocarpinhydrochlorid führt zu einer Erweiterung peripherer Gefäße, die aber nicht immer mit einer Blutdrucksenkung verknüpft ist.

Am Herzen wirkt es negativ chronotrop und negativ inotrop. Tierexperimentell hat es überwiegend stimulierende, aber auch dämpfende Effekte am Zentralnervensystem. Pilocarpinhydrochlorid wird durch Bindung an Plasmaprotein teilweise inaktiviert.

Pilocarpinhydrochlorid bewirkt als direktes Parasympathomimetikum am Auge Pupillenverengung, Ziliarmuskeltonisierung und vermehrten Abfluss von Kammerwasser. Es bewirkt durch Ziliarmuskelkontraktion eine vorübergehende Kurzsichtigkeit, die bei jüngeren Personen stärker ist als bei älteren. Durch Verstärkung des Kammerwasserabflusses kommt es zu einer Verminderung des intraokularen Druckes. Möglicherweise kommt es auch zu einer Verminderung der Kammerwassersekretion durch Pilocarpinhydrochlorid.

5.2 Pharmakokinetische Eigenschaften

Nach topischer Applikation am Auge wird Pilocarpinhydrochlorid sehr gut resorbiert, da es aufgrund seiner Löslichkeitseigenschaften die Lipidbarriere der Hornhaut gut penetriert.

In wässriger Lösung ist der pH-Wert für die Wirksamkeit von Pilocarpinhydrochlorid von großer Bedeutung. Bei niedrigeren pH-Werten zeichnet sich die Lösung durch eine gute Haltbarkeit, aber eine fürs Auge schlechtere Verträglichkeit aus. In Richtung vom sauren zum neutralen Bereich des pH-Wertes ist die Wirkung der Pilocarpinhydrochlorid-Lösung bei gleicher Konzentration größer, weil die lipophile Alkaloidbase wesentlich besser als das dissoziierte Alkaloidsalz durch die Hornhaut penetriert. Bei höherem pH-Wert wird jedoch die Stabilität der Lösung beeinträchtigt, was sich in einer niedrigeren Wirksamkeit niederschlägt. Die Formulierungen der entsprechenden Augentropfenlösung aus Pilocarpinhydrochlorid stellen somit einen Kompromiss aus den Forderungen nach Stabilität, Wirksamkeit und Verträglichkeit dar. Beim Menschen wurde ermittelt, dass 20 min. nach topischer Instillation von 2 Tropfen einer 2%igen Pilocarpinhydrochloridlösung in das Auge im Kammerwasser eine 0,2%ige Konzentration des Wirkstoffs vorlag. Am Kaninchen wurde nachgewiesen, dass Pilocarpinhydrochlorid bereits im Auge durch enzymatische Hydrolyse teilweise inaktiviert wird.

Die wesentliche Ursache für den Konzentrationsabfall am Auge ist jedoch der Abtransport in den Gesamtorganismus durch das Blut.

5.3 Präklinische Daten zur Sicherheit

Akute Toxizität

Siehe Ziffer 4.9 "Überdosierung". Letale Effekte sind tierexperimentell durch Herzstillstand und Lungenödem bedingt.

Langzeitstudien an Tieren zur Beurteilung des karzinogenen Potentials wurden an Mäusen und Ratten durchgeführt. Pilocarpinhydrochlorid führte in supratherapeutischer Dosierung bei Ratten, nicht jedoch bei Mäusen, zu einer statistisch signifikanten Zunahme von Phäochromozytomen bei Tieren beiderlei Geschlechts und zu einer Zunahme von hepatozellulären Adenomen nur bei weiblichen Tieren.

Es gibt keinen Hinweis auf die Mutagenität mit Pilocarpinhydrochlorid im Ames-Test, bei Tests zu Chromosomen-Veränderungen in Ovarzellen von Hamstern und im *in-vivo*-Mikronukleustest am Knochenmark von Mäusen. Pilocarpinhydrochlorid war in einem DNA-Repair-Test mit Ratten-Hepatozyten nicht gentoxisch.

Pilocarpinhydrochlorid hat bei Ratten und Hühnerembryonen teratogene Effekte gezeigt. Diese Effekte konnten jedoch in zwei, dem heutigen Standard entsprechend durchgeführten Studien, in denen Ratten bis zu 90 mg/kg/Tag und Kaninchen bis zu 9 mg/kg/Tag Pilocarpinhydrochlorid peroral während der Organogenese erhielten, nicht reproduziert werden. Bei Ratten führte die orale Verabreichung von mehr als 3 mg/kg/Tag zu einer verringerten Überlebensrate bei den Nachkommen. Die postnatale Entwicklung der überlebenden F1-Generation wurde bei mütterlichen Dosen von bis zu 72 mg/kg/Tag nicht beeinträchtigt. Bei den Elterntieren zeigten sich bei Dosen oberhalb von 3 mg/kg/Tag negative Einflüsse auf die Fertilität (bei Männchen Verminderung der Spermienbeweglichkeit, erhöhte Anzahl abnormalen Spermien, bei Weibchen verringerter Fertilitätsindex).

6. PHARMAZEUTISCHE ANGABEN

6.1 Liste der sonstigen Bestandteile

Spersacarpin 0,5% Augentropfen

Benzalkoniumchlorid (Konservierungsmittel) 0,1 mg

Borsäure

Hypromellose (Methocel®)

Gereinigtes Wasser

Spersacarpin 2% Augentropfen

Benzalkoniumchlorid (Konservierungsmittel) 0,1 mg

Borsäure

Hypromellose (Methocel®)

Natriumtetraborat 10 H₂O

Gereinigtes Wasser

6.2 Inkompatibilitäten

Inkompatibilitäten mit alkalisch reagierenden Stoffen sowie Jod- und Silbersalzen.

6.3 Dauer der Haltbarkeit

Die Dauer der Haltbarkeit von Spersacarpin Augentropfen beträgt 3 Jahre.

Darf nach Anbruch höchstens 4 Wochen lang verwendet werden.

6.4 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Aufbewahrung

Nicht über 25°C lagern. Die Flasche im Umkarton aufbewahren, um den Inhalt vor Licht zu schützen.

Aufbewahrungsbedingungen nach Anbruch des Arzneimittels, siehe Abschnitt 6.3.

6.5 Art und Inhalt des Behältnisses

Augentropfenfläschchen aus Polyethylen

Augentropfflasche mit 10 ml
Dreierpackung mit 3 x 10 ml

Es werden möglicherweise nicht alle Packungsgrößen in den Verkehr gebracht.

6.6 Besondere Vorsichtsmaßnahmen für die Beseitigung

Keine besonderen Anforderungen.

7. INHABER DER ZULASSUNG

OmniVision GmbH

Lindberghstraße 9

82178 Puchheim

Deutschland

Telefon: +49 (0)89 / 84 07 92-30

Telefax: +49 (0)89 / 84 07 92-40

E-Mail: info@omnivision.de

8. ZULASSUNGSNUMMERN

Spersacarpin 0,5% Augentropfen: 6309068.01.00

Spersacarpin 2% Augentropfen: 6309068.00.00

9. DATUM DER ERTEILUNG DER ZULASSUNG/VERLÄNGERUNG DER ZULASSUNG

24.01.1997 / 11.02.2005 / 16.11.2010

10. STAND DER INFORMATION

Juni 2020

11. VERKAUFSABGRENZUNG

Verschreibungspflichtig