

AZESTINE

COMPOSITION:

Each 1 ml of AZESTINE nasal spray contains 1 mg of azelastine hydrochloride.

PROPERTIES: AZESTINE is an antihistamine intended for intranasal administration. Azelastine hydrochloride exhibits histamine H₁-receptor antagonist activity. When administered in patients with vasomotor rhinitis, azelastine hydrochloride nasal spray (in the recommended therapeutic dose) significantly improves the symptom complex comprising of rhinorrhea, postnasal drip, nasal congestion, and sneezing. Azelastine has no adverse effect on the nasal mucosa, and it can be safely administered in allergic rhinitis patients with asthma.



INDICATIONS: AZESTINE nasal spray is indicated for:

1. The treatment of the symptoms of seasonal allergic rhinitis such as rhinorrhea, sneezing, and nasal pruritus in adults and children 5 years and older.
2. The treatment of the symptoms of vasomotor rhinitis, such as rhinorrhea, nasal congestion and postnasal drip in adults and children 12 years and older.

CONTRAINDICATIONS: AZESTINE nasal spray is contraindicated in patients with a known hypersensitivity to azelastine hydrochloride or any of the product's components.

DOSAGE AND ADMINISTRATION:

Notes:

- Avoid spraying in the eyes.
- Before initial use, and when 3 or more days have elapsed since the last use, the spray bottle should be primed with few sprays until a fine mist appears



The recommended dosage is explained in the following table:

| Seasonal Allergic Rhinitis | |
|--|--|
| Age 5 to 11 years 1 spray per nostril twice daily | 12 years and older Two sprays per nostril twice daily |
| Vasomotor Rhinitis | |
| 12 years and older Two sprays per nostril twice daily | |

WARNINGS AND PRECAUTIONS:

- The bottle of product should be discarded 3 months after the first use of the nasal spray. Don't use the drug if the expiration date is exceeded.
- Caution should be exercised when driving a car or operating potentially dangerous machinery.
- AZESTINE nasal spray should be used only as prescribed.
- Do not use AZESTINE nasal spray concurrently with other antihistamines without consulting a physician.
- AZESTINE should be used during pregnancy only if the potential benefit justifies the potential risk to the fetus (pregnancy category C).
- It is not known whether azelastine hydrochloride is excreted in human milk. Thus, caution should be exercised when AZESTINE is administered to nursing women.
- The safety and effectiveness of AZESTINE in patients below the age of 5 years have not been established.

SIDE EFFECTS: The more frequent side effects are: bitter taste, somnolence and nasal burning. The less frequent side effects are: paroxysmal sneezing, nausea, rhinitis, epistaxis.

Very rare side effects are: glossitis, throat burning, laryngitis.

Other more frequent side effects observed in patients 5 to 12 years of age not in adult are: cold symptoms, cough.

DRUG INTERACTIONS: Alcohol or other CNS depressants: Their concurrent use with AZESTINE should be avoided due to possible additional reductions in alertness.

LABORATORY TEST INTERACTIONS: The administration of nasal and oral azelastine hydrochloride formulations may infrequently result in hepatic transaminase elevations.

PHARMACOKINETICS: After intranasal administration, the systemic bioavailability of azelastine hydrochloride is approximately 40%. Maximum plasma concentrations (C_{max}) are achieved in 2-3 hours. Azelastine is oxidatively metabolized to the principal active metabolite, desmethylazelastine, by the cytochrome P450 enzyme system. Azelastine is 88% plasma protein bound. Azelastine hydrochloride administered intra-nasally at doses above two sprays per nostril twice daily results in greater systemic absorption of azelastine. After the administration of the nasal spray, significant decrease in symptoms is reached within 3 hours, and persists over the 12-hour dosing interval.

OVERDOSAGE AND TREATMENT: There have been no reported overdosage with azelastine hydrochloride nasal spray. Acute overdosage by adults with this dosage form is unlikely to result in clinically significant adverse events, other than increased somnolence. General supportive measures should be employed if overdosage occurs. Oral ingestion of antihistamines has the potential to cause serious adverse effects in young children. Thus, AZESTINE should be kept out of the reach of children, and medical assistance should be sought in case of accidental ingestion by a young child.

STORAGE CONDITIONS: Store the nasal spray upright and tightly closed at room temperature (20°-25°C), Protect from heat, protect from freezing.

PACKAGE:

15 mL in spray bottle.

Rev. No: 31105

| THIS IS A MEDICAMENT |
|---|
| <ul style="list-style-type: none">- The medicament is a product which affects your health, and its consumption contrary to instruction is dangerous for you.- Follow strictly the doctor's prescription, the method of use and the instructions of the pharmacist who sold the medicament. The doctor and the pharmacist are experts in medicine, its benefits and risks.- Do not by yourself interrupt the period of treatment prescribed for you.- Do not repeat the same prescription without consulting your doctor. |
| KEEP THE MEDICAMENT OUT OF THE REACH OF CHILDREN |

Council of Arab Health Ministers

Arab Pharmacists Association

DIAMOND PHARMA – Damascus – Syria

أزيستين

التركيب:

كل ١ مل من بخاخ الأزيستين الأنفي يحوي ١ ملغ أزيلاستين هيدروكلورايد.

خواص المستحضر: الأزيستين هو مضاد هستامين مخصص للاستعمال داخل الأنف. يبدي الأزيلاستين هيدروكلورايد فعالية حاصرة لمستقبلات الهيستامين H1. يقوم بخاخ الأزيلاستين هيدروكلورايد الأنفي (بالجرعات العلاجية الموصى بها) عند إعطائه لمرضى التهاب الأنف الوبائي الحركي بتحسين ملحوظ لمجمل الأعراض المؤلفة من السيلان الأنفي، والسيلان الأنفي الخلفي، الاحتقان الأنفي، والعطاس. ليس للأزيلاستين أي تأثير جانبي على مخاطية الأنف، ويعتبر آمناً عند مرضى التهاب الأنف التحسسي الذين يعانون من الربو.

الاستطبيات: تتضمن استطبيات بخاخ الأزيستين الأنفي ما يلي:

١. علاج أعراض التهاب الأنف التحسسي الموسمي بما فيها سيلان الأنف، العطاس، و الحكمة الأنفية لدى البالغين والأطفال بعمر ٥ سنوات فما فوق.
٢. علاج أعراض التهاب الأنف الوبائي الحركي بما فيها سيلان الأنف، الاحتقان الأنفي والسيلان الأنفي الخلفي لدى البالغين والأطفال بعمر ١٢ سنة فما فوق.

مضادات الاستطباب: يعتبر بخاخ الأزيستين الأنفي مضاد استطباب في حال وجود فرط تحسس معروف تجاه الأزيلاستين هيدروكلورايد أو أي من مكونات المستحضر.

الجرعة وطريقة الاستعمال:

ملاحظة:

- تجنب بخ الدواء في العين.

- قبل الاستعمال للمرة الأولى، وفي حال تركت العبوة لثلاثة أيام أو أكثر دون استخدام، يجب ضغط العبوة عدة مرات حتى الحصول على رذاذ جيد قبل أخذ الجرعة منها.

يوضح الجدول التالي الجرعة المنصوح بها:

| التهاب الأنف التحسسي الموسمي | |
|-------------------------------------|-------------------------------------|
| ١١-٥ سنة | ١٢ سنة وما فوق |
| ١ بخة في كل فتحة أنفية مرتين يومياً | ٢ بخة في كل فتحة أنفية مرتين يومياً |

| التهاب الأنف الوبائي الحركي | |
|-----------------------------|-------------------------------------|
| ١٢ سنة وما فوق | ٢ بخة في كل فتحة أنفية مرتين يومياً |

تحذيرات الاستعمال:

- يجب التخلص من عبوة المستحضر بعد مرور ٣ أشهر من أول استخدام للبخاخ الأنفي.
- كما يجب عدم استعمال البخاخ بعد انتهاء فترة صلاحيته.
- يجب أخذ الحذر أثناء استعمال هذا الدواء عند قيادة السيارات أو تشغيل الآلات الخطرة.
- يجب الالتزام الشديد بتعليمات استخدام بخاخ الأزيستين الأنفي.
- لا تستخدم بخاخ الأزيستين الأنفي بالمشاركة مع مضادات الهيستامين الأخرى دون استشارة الطبيب.
- يستخدم الأزيستين أثناء الحمل فقط إذا كانت الفائدة المرجوة منه تفوق الخطر المحتمل على الجنين (من أدوية الحمل C).
- لم يعرف حتى الآن فيما إذا كان الأزيلاستين هيدروكلورايد يفرز عبر حليب الأم. لذا يجب أخذ الحذر عند إعطاء الأزيستين للأمهات المرضعات.
- لم يتم بعد إثبات فعالية و أمان الأزيستين عند المرضى دون عمر الـ ٥ سنوات.

التأثيرات الجانبية:

تتضمن التأثيرات الجانبية الأكثر شيوعاً: طعم مر، نعاس، حرقة في الأنف. أما التأثيرات الجانبية الأقل شيوعاً فهي: نوبات عطاس، غثيان، التهاب أنف، ورعاف. التأثيرات الجانبية النادرة جداً: التهاب لسان، حرقة في البلعوم، التهاب الحنجرة.

تتضمن التأثيرات الجانبية الأكثر شيوعاً المشاهدة عند الأطفال بين ٥-١٢ سنة وغير المشاهدة عند البالغين: أعراض رشح، وسعال.

التداخلات الدوائية: الكحول أو مثبطات الجملة العصبية المركزية الأخرى: يجب تجنب تناولهما بشكل متزامن مع الأزيستين لاحتمال حدوث انخفاض إضافي في درجة التنبه.

التدخلات الدوائية في النتائج المخبرية السريرية: نادراً ما يؤدي إعطاء مستحضرات الأزيلاستين هيدروكلورايد الأنفية والسفوية إلى زيادة أنزيمات الترانس أميناز الكبدية.

الحركية الدوائية: يبلغ التوافر الحيوي الجهازي للأزيلاستين هيدروكلورايد بعد تطبيقه داخل الأنف حوالي ٤٠٪. ويصل للتراكم البلاسمية الأعظمية خلال ٢-٣ ساعات. تقوم مجموعة أنزيمات السيتوكروم P450 باستقلاب تاكسدي للأزيلاستين لتعطي المستقلب الرئيسي الفعال الأزيلاستين منزوع الميثيل. يرتبط الأزيلاستين ببروتينات البلاسما بنسبة ٨٨٪. يؤدي إعطاء الأزيلاستين هيدروكلورايد أنفياً بجرعات تزيد عن بختين في كل فتحة أنفية مرتين يومياً لزيادة امتصاص الدواء جهازياً. يحدث تراجع ملحوظ في الأعراض خلال ٣ ساعات من تطبيق البخاخ الأنفي، و يدوم هذا التأثير طيلة الـ ١٢ ساعة الفاصلة بين الجرعات.

تأثير زيادة الجرعة ومعالجتها: لم تسجل حالات فرط جرعة ناتجة عن بخاخ الأزيلاستين هيدروكلورايد الأنفي. من غير المتوقع أن يسبب فرط الجرعة الحد بهذا المستحضر عند البالغين تأثيرات جانبية سريرية هامة عدا النعاس. في حال حدوث فرط جرعة يجب تطبيق الإجراءات الداعمة العامة. قد يسبب ابتلاع مضادات الهيستامين تأثيرات جانبية شديدة عند الأطفال الصغار. لذا يجب حفظ الأزيستين بعيداً عن متناول الأطفال، ويجب طلب المساعدة الطبية إذا تم ابتلاعه من قبل الأطفال عرضاً.

شروط الحفظ والتخزين: يحفظ البخاخ الأنفي بشكل قائم، محكم الإغلاق في درجة حرارة الغرفة (٢٠-٢٥°م)، وبعيداً عن مصادر الحرارة، تجنب تجميد المستحضر.

التعبئة وشكل العبوة: عبوة ذات رأس بخاخ تحوي ١٥ مل.

| إن هذا الدواء |
|---|
| - الدواء مستحضر يؤثر على صحتك، واستهلاكه خلافاً للتعليمات يعرضك للخطر. |
| - اتبع بدقة وصفة الطبيب وطريقة الاستعمال المنصوص عليها، وتعليمات الصيدلاني الذي صرفها لك، فالطبيب والصيدلاني هما الخبيران بالدواء ونفعه وضره. |
| - لا تقطع مدة العلاج المحددة من تلقاء نفسك. |
| - لا تكرر صرف الدواء بدون وصفة طبية. |

لا تترك الأدوية في متناول أيدي الأطفال

اتحاد الصيدالة العرب

مجلس وزراء الصحة العرب

شركة دياموند فارما - دمشق - سوريا