

Monographie de produit

Incluant les renseignements pour le patient sur le médicament

^{Pr}**BLEXTEN**[®]

Solution ophtalmique de bilastine

Pour usage ophtalmique

6 mg/mL de bilastine

Antagoniste des récepteurs H₁ de l'histamine

Aralez Pharmaceuticals Canada Inc.
6733 Mississauga Road, Suite 800
Mississauga (Ontario)
Canada L5N 6J5

Date d'approbation :
2025-10-01

Numéro de contrôle : 290817

Modifications importantes apportées récemment à la monographie

Aucun au moment de l'autorisation la plus récente

Table des matières

Certaines sections ou sous-sections qui ne s'appliquaient pas au moment de la plus récente monographie de produit autorisée ne sont pas indiquées.

Modifications importantes apportées récemment à la monographie.....	2
Table des matières	2
Partie 1 : Renseignements pour le professionnel de la santé	4
1 Indications	4
1.1 Enfants	4
1.2 Personnes âgées	4
2 Contre-indications.....	4
4 Posologie et administration.....	4
4.1 Considérations posologiques.....	4
4.2 Posologie recommandée et ajustement posologique.....	4
4.4 Administration	4
4.5 Dose oubliée	5
5 Surdose.....	5
6 Formes pharmaceutiques, concentrations, composition et conditionnement	5
7 Mises en garde et précautions	6
Généralités.....	6
Effets sur la capacité de conduire un véhicule et d'utiliser des machines.....	6
Ophtalmologie	6
Santé reproductive	6
7.1 Populations particulières	6
7.1.1 Grossesse	7
7.1.2 Allaitement	7
7.1.3 Enfants.....	7
7.1.4 Personnes âgées	7

8	Effets indésirables	7
8.1	Aperçu des effets indésirables.....	7
8.2	Effets indésirables signalés au cours d'essais cliniques.....	8
8.3	Effets indésirables peu courants observés lors des essais cliniques	8
8.5	Effets indésirables observés après la commercialisation	8
9	Interactions médicamenteuses	8
9.2	Aperçu des interactions médicamenteuses.....	9
9.3	Interactions médicament-comportement.....	9
9.4	Interactions médicament-médicament.....	9
9.5	Interactions médicament-aliment	9
9.6	Interactions médicament-plante médicinale	9
9.7	Interactions médicament-examens de laboratoire	9
10	Pharmacologie clinique	9
10.1	Mode d'action.....	9
10.2	Pharmacodynamie	10
10.3	Pharmacocinétique	10
11	Entreposage, stabilité et élimination	11
Partie 2 : Renseignements scientifiques		12
13	Renseignements pharmaceutiques	12
14	Essais cliniques.....	13
14.1	Études cliniques par indication.....	13
15	Microbiologie.....	14
16	Toxicologie non clinique	14
17	Monographies de référence.....	15
Renseignements destinés aux patient·e·s.....		16

Partie 1 : Renseignements pour le professionnel de la santé

1 Indications

La solution ophtalmique BLEXTEN (bilastine) à 6 mg/mL, est indiquée pour :

- le traitement des signes et symptômes oculaires de la conjonctivite allergique saisonnière et pérenne chez l'adulte.

1.1 Enfants

Enfants (moins de 18 ans) : Santé Canada ne dispose d'aucune donnée; par conséquent, l'indication d'utilisation dans la population pédiatrique n'est pas autorisée par Santé Canada.

1.2 Personnes âgées

Personnes âgées (> 65 ans) : Aucun ajustement posologique n'est nécessaire chez les patients de plus de 65 ans (voir [10 Pharmacologie clinique](#), [4 Posologie et administration](#)).

2 Contre-indications

BLEXTEN est contre-indiqué chez les patients présentant une hypersensibilité au produit, à tout ingrédient de la formulation, y compris à un ingrédient non médicinal, ou à un composant du contenant. Pour obtenir la liste complète des ingrédients, veuillez consulter la section [6 Formes pharmaceutiques, concentrations, composition et conditionnement](#).

4 Posologie et administration

4.1 Considérations posologiques

Il n'y a pas de considérations posologiques particulières concernant BLEXTEN.

4.2 Posologie recommandée et ajustement posologique

La dose quotidienne recommandée chez les adultes est d'une goutte dans l'œil atteint, une fois par jour.

Une fois l'amélioration symptomatique établie, le traitement doit être poursuivi aussi longtemps que nécessaire pour maintenir l'amélioration continue. La thérapie ne doit pas être utilisée pendant plus de 8 semaines sans avis médical.

Il n'est pas nécessaire de modifier la posologie chez les patients présentant une insuffisance hépatique ou rénale.

4.4 Administration

Destiné à un usage ophtalmique.

Pour éviter toute contamination de l'embout compte-gouttes et de la solution, il faut veiller à ne pas toucher les paupières, les zones environnantes ou d'autres surfaces avec l'embout compte-gouttes du flacon. L'embout de la buse doit être essuyé avec un mouchoir propre après utilisation pour éliminer tout résidu de liquide.

Les patients doivent être informés qu'ils doivent retirer leurs lentilles cornéennes avant l'administration des gouttes ophtalmiques BLEXTEN et d'attendre au moins 15 minutes avant de remettre leurs lentilles de contact.

En cas d'utilisation d'autres gouttes ophtalmiques, les patients doivent attendre au moins 5 minutes entre chaque application la solution ophtalmique BLEXTEN et les autres gouttes. Les onguents ophtalmiques doivent être appliqués en dernier.

4.5 Dose oubliée

En cas d'oubli d'une dose, la dose suivante doit être instillée comme prévu. Le patient ne doit pas instiller de dose supplémentaire.

5 Surdose

Il n'existe aucune réaction spécifique connue suite à un surdosage oculaire; en cas d'utilisation par voie ophtalmique, aucune réaction de surdosage ne devrait apparaître car l'excès de liquide s'écoulera rapidement de l'œil.

Dans les essais cliniques de phase I avec des formulations orales testées à des doses allant jusqu'à 11 fois (dose unique) et jusqu'à 10 fois (doses multiples) la dose orale recommandée chez l'humain, les étourdissements, les maux de tête et les nausées ont été les effets indésirables les plus fréquemment signalés, sans qu'aucun effet indésirable grave n'ait été signalé.

Pour obtenir l'information la plus récente pour traiter une surdose présumée, communiquez avec le centre antipoison de votre région ou avec le numéro sans frais de Santé Canada, 1-844 POISON-X (1-844-764-7669).

6 Formes pharmaceutiques, concentrations, composition et conditionnement

Tableau 1 – Formes posologiques, teneurs et composition

Voie d'administration	Forme posologique/teneur/composition	Ingrédients non médicinaux
ophtalmique	solution ophtalmique, 6 mg/mL.	eau pour préparations injectables, glycérol, hyaluronate de sodium, hydroxyde de sodium 1 N (pour l'ajustement du pH), hydroxypropyl β -cyclodextrine, méthylcellulose.

Description

BLEXTEN est une solution ophtalmique limpide et incolore. Chaque goutte contient 0,2 mg de bilastine.

Conditionnement

La solution ophtalmique BLEXTEN à 6 mg/mL est conditionnée dans un flacon multidose en PEBD (contenant 5 mL de solution sans conservateur), muni d'une buse blanche en PEHD et d'un bouchon à vis inviolable. Une boîte contient 1 flacon de 5 mL.

7 Mises en garde et précautions

Généralités

Destiné à un usage ophtalmique uniquement. Ne pas utiliser par injection ou par voie orale.

Effets sur la capacité de conduire un véhicule et d'utiliser des machines

Après avoir administré la solution ophtalmique BLEXTEN dans le sac conjonctival, l'acuité visuelle peut se détériorer pendant quelques minutes en raison de la formation de stries.

Une vision trouble temporaire ou d'autres troubles visuels peuvent affecter l'aptitude à conduire des véhicules ou à utiliser des machines. En cas de vision trouble après instillation, il doit être conseillé au patient d'attendre que sa vision soit nette avant de conduire un véhicule ou d'utiliser des machines.

Ophtalmologie

La bilastine est un agent antiallergique/antihistaminique et, bien qu'administrée par voie topique, elle fait l'objet d'une absorption générale. En cas de réactions graves ou d'hypersensibilité, le traitement doit être arrêté.

Réactions au site d'administration

Si des effets indésirables au point d'administration, tels qu'une irritation, une douleur, une rougeur oculaire ou une modification de la vision se produisent ou si l'état du patient s'aggrave, l'arrêt du traitement doit être envisagé.

Santé reproductive

- **Fertilité**

Aucune altération de la fertilité n'a été observée chez le rat (voir [16 Toxicologie non clinique](#)). Concernant la fertilité humaine, aucun effet n'est attendu car l'exposition générale à la bilastine après administration oculaire est négligeable (voir [10 Pharmacologie clinique](#)).

7.1 Populations particulières

7.1.1 Grossesse

Il existe peu ou pas de données sur l'utilisation par voie orale ou ophtalmique de la bilastine chez la femme enceinte.

Chez les animaux, la toxicité pour la reproduction n'a été observée qu'à des expositions orales plus de 1 000 fois supérieures aux concentrations observées chez l'humain après administration oculaire (voir [16 Toxicologie non clinique](#)).

Aucun effet n'est attendu pendant la grossesse, dans la mesure où l'exposition générale à la bilastine après administration oculaire est négligeable. La solution ophtalmique BLEXTEN peut être utilisée pendant la grossesse.

7.1.2 Allaitement

L'excrétion de la bilastine dans le lait n'a pas été étudiée chez l'humain.

Compte tenu de la faible absorption générale de la bilastine après administration oculaire (voir [10 Pharmacologie clinique](#)), aucun effet sur le nouveau-né/nourrisson allaité n'est attendu après administration oculaire chez l'humain. La solution ophtalmique BLEXTEN peut être utilisée pendant l'allaitement.

7.1.3 Enfants

Enfants (moins de 18 ans) : Santé Canada ne dispose d'aucune donnée; par conséquent, aucune indication de ce médicament en pédiatrie n'est approuvée par Santé Canada.

7.1.4 Personnes âgées

Aucun ajustement de la posologie n'est recommandé chez les sujets de plus de 65 ans (voir [10 Pharmacologie clinique](#) et [4 Posologie et administration](#)).

8 Effets indésirables

8.1 Aperçu des effets indésirables

Dans les études cliniques de phase II et de phase III portant sur les gouttes ophtalmiques de bilastine à 6 mg/mL, 682 patients ont participé, dont 340 ont reçu des gouttes ophtalmiques de bilastine à 6 mg/mL, dont 218 ont été traités pendant une période allant jusqu'à 8 semaines. Dans l'ensemble, l'incidence des effets indésirables liés au traitement (EILT) était équilibrée entre les groupes. Environ 9,7 % des sujets recevant des gouttes ophtalmiques de bilastine à 6 mg/mL et 13,6 % des sujets sous excipient ont signalé au moins 1 EILT. La plupart des EILT signalés dans le cadre des études de phase II et III étaient légers et aucun effet indésirable grave ou sévère n'a été observé.

8.2 Effets indésirables signalés au cours d'essais cliniques

Les essais cliniques sont menées dans des conditions très particulières. Par conséquent, la fréquence des effets indésirables observés au cours des essais cliniques peut ne pas refléter la fréquence observée dans la pratique clinique et ne doit pas être comparée à la fréquence déclarée dans les essais cliniques d'un autre médicament.

Aucun effet indésirable lié au traitement n'est survenu à une fréquence ≥ 1 %.

8.3 Effets indésirables peu courants observés lors des essais cliniques

Dans l'ensemble, la plupart des EIAT liés au médicament (EIM) étaient de nature oculaire et la plupart des effets ont été rapportés dans l'étude à long terme. Seul un événement (céphalée légère) dans l'étude de phase II et aucun dans l'étude d'efficacité de phase III a été considéré comme lié au médicament de l'étude.

Tableau 2 Effets indésirables liés au traitement signalés chez $\geq 0,1$ % des patients traités par des gouttes ophtalmiques de bilastine à 6 mg/mL dans le cadre des études oculaires de phase II et de phase III

Système ou organe/EI	BLEXTEN à 6 mg/mL N = 340	Excipient N = 192
Troubles oculaires		
Sécheresse oculaire	2	2
Écoulement oculaire	2	0
Irritation oculaire	1	1
Augmentation de la sécrétion lacrymale	1	0
Gêne oculaire	1	0
Troubles du système nerveux		
Dysgueusie	1	0
Céphalées	1	0

Dans l'étude à long terme (8 semaines de traitement), tous les EIAT ont été classés comme légers ou modérés. Le nombre d'effets indésirables oculaires considérés comme liés au traitement était faible, avec 7 effets indésirables chez 6 patients (2,8 %) dans le groupe de patients sous bilastine et 5 effets indésirables chez 5 patients (4,3 %) dans le groupe de patients sous excipient.

8.5 Effets indésirables observés après la commercialisation

Dans le cadre de l'expérience acquise après la commercialisation avec les formulations orales de bilastine, des réactions d'hypersensibilité ont été observées à une fréquence indéterminée.

9 Interactions médicamenteuses

9.2 Aperçu des interactions médicamenteuses

Aucune étude d'interaction n'a été réalisée. Compte tenu de la faible exposition générale à la bilastine après administration oculaire, aucune interaction cliniquement significative avec d'autres médicaments n'est attendue.

9.3 Interactions médicament-comportement

L'interaction de BLEXTEN avec les risques comportementaux individuels (p. ex. tabagisme, consommation de cannabis ou consommation d'alcool) n'a pas été étudiée.

9.4 Interactions médicament-médicament

- Produits oculaires topiques

En cas de traitement concomitant avec d'autres médicaments oculaires topiques, un intervalle de 5 minutes doit être respecté entre les applications successives. Les pommades ophtalmiques doivent être administrées en dernier.

- Lentilles de contact

La compatibilité physique avec les lentilles de contact a été démontrée *in vitro*. Les patients peuvent continuer à utiliser des lentilles de contact pendant le traitement par ce médicament.

9.5 Interactions médicament-aliment

Aucune interaction avec les aliments n'a été établie.

9.6 Interactions médicament-plante médicinale

Aucune interaction avec des produits à base de plantes médicinales n'a été établie.

9.7 Interactions médicament-examens de laboratoire

Aucune preuve selon laquelle le médicament nuirait aux épreuves de laboratoire n'a été établie.

10 Pharmacologie clinique

10.1 Mode d'action

La bilastine est un antagoniste de l'histamine de deuxième génération, non sédatif, avec une affinité sélective pour les récepteurs périphériques H1 et aucune affinité apparente pour les récepteurs muscariniques. La bilastine antagonise l'histamine, stabilise les mastocytes et prévient la production, induite par l'histamine, de cytokines inflammatoires par les cellules épithéliales conjonctivales humaines. Elle prévient ainsi le prurit, la vasodilatation et la fuite vasculaire qui entraînent une rougeur oculaire, un chémosis et une blépharite.

10.2 Pharmacodynamie

La solution ophtalmique de bilastine 6 mg/mL est conçue pour une application locale et agit localement au niveau de la conjonctive. Des études pharmacodynamiques ont été précédemment réalisées pour les formulations orales, et aucune nouvelle étude pharmacodynamique clinique n'a été effectuée pour la solution ophtalmique.

Électrophysiologie cardiaque : À la dose thérapeutique orale de 20 mg/jour et à une dose supratherapeutique de 100 mg/jour administrée à des volontaires sains, la bilastine a été associée à une prolongation de l'intervalle QTcF dépendante de la concentration. Toutefois, une prolongation de l'intervalle QTcF n'est pas attendue avec la solution ophtalmique Blexten en raison de la faible exposition systémique à la bilastine après administration oculaire (voir section [10.3 Pharmacocinétique](#))

10.3 Pharmacocinétique

Les propriétés pharmacocinétiques de la bilastine ont été largement étudiées avec la formulation orale. Les propriétés pharmacocinétiques de la solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL ont été évaluées lors d'une étude de phase I portant sur douze sujets en santé ayant reçu une goutte dans chaque œil par jour (0,42 mg/jour) pendant 5 jours.

Tableau 3 – Résumé des paramètres pharmacocinétiques de la solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL chez des volontaires en santé à la suite d'une administration unique quotidienne pendant 5 jours.

	$C_{max,ss}$ (ng/mL)	T_{max} (h)	$t_{1/2}$ (h)	$ASC_{(0-\tau)ss}$ (h*ng/mL)	CL_{ss} (L/h)	Vc/F (L)	Vp/F (L)
Moyenne à l'état d'équilibre	2,7	2,52 h	7,88 h	19,5	21,5	59,2	30,2

Absorption

La bilastine est rapidement absorbée dans la circulation sanguine après application oculaire. À l'état d'équilibre, la bilastine a atteint des concentrations sanguines maximales de 2,7 ng/mL dans les 2,52 heures suivant l'administration, soit environ 1,5 % de la C_{max} à l'état d'équilibre après administration orale de bilastine en comprimés de 20 mg.

Distribution

La bilastine est liée à 84 à 90 % aux protéines plasmatiques chez l'homme pour la fourchette de concentrations allant de 0,2 µg/mL à 1 µg/mL, qui inclut les concentrations plasmatiques observées aux doses thérapeutiques après administration orale de comprimés de bilastine. Le volume central apparent de distribution (Vc/F) était de 59,2 L et le volume périphérique apparent de distribution (Vp/F) était de 30,2 L.

Métabolisme

Un métabolisme faible ou inexistant a été observé *in vitro* et *in vivo* pour la bilastine, après

administration orale. Dans les études *in vitro*, la bilastine n'a ni induit ni inhibé l'activité des isoenzymes du CYP450. Aucune inhibition ou induction des enzymes hépatiques par la bilastine n'a été détectée.

Élimination

Dans une étude de bilan massique réalisée chez des volontaires adultes en santé, après administration d'une dose orale unique de 20 mg de ¹⁴C-bilastine, près de 95 % de la dose administrée a été retrouvée dans l'urine (28,3 %) et les selles (66,5 %) sous forme de bilastine inchangée. La demi-vie d'élimination moyenne après administration orale était de 14,5 h, tandis qu'elle était de 7,88 h après administration oculaire.

Linéarité

La bilastine présente une pharmacocinétique linéaire dans la plage de doses étudiée (administration orale de 5 à 220 mg), avec une faible variabilité interindividuelle.

Populations particulières et états pathologiques

Enfants : L'efficacité chez les enfants n'a pas été établie.

Personnes âgées : On ne dispose que de données pharmacocinétiques limitées chez des sujets de plus de 65 ans. Aucune différence statistiquement significative n'a été observée en ce qui concerne la pharmacocinétique de la bilastine chez les sujets âgés de plus de 65 ans par rapport à la population adulte âgée de 18 à 35 ans.

Insuffisance hépatique : Aucune donnée pharmacocinétique n'est disponible chez les sujets atteints d'insuffisance hépatique. La bilastine n'est pas métabolisée de manière significative chez l'humain. Les résultats d'une étude sur l'insuffisance rénale indiquent que l'élimination rénale est un contributeur majeur à l'élimination de la bilastine; par conséquent, l'excrétion biliaire ne devrait être que marginalement impliquée. Les modifications de la fonction hépatique ne devraient pas avoir d'influence cliniquement pertinente sur la pharmacocinétique de la bilastine.

Insuffisance rénale : La pharmacocinétique de la bilastine (administration orale, comprimés de 20 mg) chez les sujets atteints d'insuffisance rénale a démontré que la même dose et le même intervalle posologique de bilastine orale peuvent être administrés aux sujets indépendamment de la gravité de l'insuffisance rénale de manière sûre et efficace. Par conséquent, en raison d'une exposition systémique plus faible par rapport à la bilastine en comprimés de 20 mg, aucun ajustement posologique n'est recommandé pour la solution ophtalmique de bilastine chez les patients présentant une insuffisance rénale.

11 Entreposage, stabilité et élimination

Conditions d'entreposage recommandées : Conserver à une température comprise entre 15 °C et 30 °C. La solution ophtalmique BLEXTEN ne doit pas être utilisée si le flacon est ouvert depuis plus de 2 mois.

Garder hors de la portée et de la vue des enfants.

Partie 2 : Renseignements scientifiques

13 Renseignements pharmaceutiques

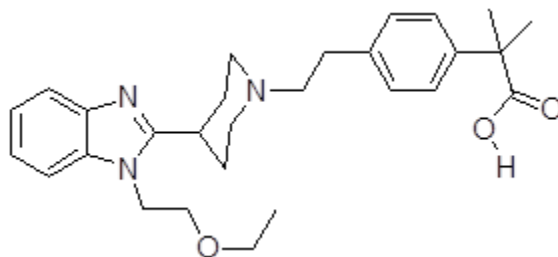
Substance pharmaceutique

Dénomination commune de la ou des substances médicamenteuses : bilastine

Nom chimique : acide 2-[4-(2-(4-(1-(2-éthoxyéthyl)-1H-benzimidazol-2-yl)pipéridin-1-yl)éthyl)phényl]-2-méthylpropionique
ou
acide p-[2-[4-[1-(2-éthoxyéthyl)-2-benzimidazolyl]pipéridino]éthyl]- α -méthylhydratropique

Formule moléculaire et masse moléculaire : $C_{28}H_{37}N_3O_3$ et 463,61 g/mol

Formule de structure :



Propriétés physicochimiques :

Aspect physique : Poudre cristalline blanche

Solubilité :

Pratiquement insoluble	Acétonitrile
Très légèrement soluble	Eau, tampon pH = 6, tampon pH = 4,5, tampon pH = 8, acétone et alcool isopropylique, glycérine
Légèrement soluble	NaOH à 0,01 N, éthanol, méthanol et diméthylsulfoxyde (DMSO), 1,2-propylèneglycol
Peu soluble	Diméthylformamide (DMF), acide chlorhydrique (HCl) à 0,1 N et tampon pH = 3,5
Très soluble	Chloroforme, HCl à 1 N et NaOH à 1 N

Valeurs du pKa : $4,15 \pm 0,06$ par spectrophotométrie ultraviolette et 4,18 par CLHP.

Hygroscopicité : La bilastine n'est pas testée par hygroscopie à température ambiante

(25,1 ± 0,1 °C) et dans des conditions d'humidité relative (85 % d'HR).

14 Essais cliniques

14.1 Études cliniques par indication

Conjonctivite allergique

Tableau 3 - Résumé des données démographiques des patients pour l'étude BOFT-0218 sur la conjonctivite allergique

N° de l'étude	Plan de l'étude	Posologie, voie d'administration et durée	Nombre de sujets (n)	Âge moyen (tranche)	Sexe
BOFT-0218/AC-CAC	Étude pivot à double insu, avec répartition aléatoire, en groupes parallèles et contrôlée par excipient et par médicament actif	Solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL	91	45,9 (18-72)	M/F 33/58
		Solution ophtalmique de kétotifène à 0,025 %	90	41,7 (18-65)	M/F 37/53
		Excipient	47	45,1 (18-87)	M/F 22/25
		Une goutte dans chaque œil le jour 1 et le jour 8 (0,21 mg/œil/jour de traitement) Voie ophtalmique 2 traitements en l'espace de 8 jours			

Étude pivot sur l'efficacité

L'efficacité et l'innocuité de la solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL ont été démontrées dans une étude de phase III multicentrique, à double insu, à répartition aléatoire, en groupes parallèles, contrôlée par excipient et comparateur actif, menée auprès de 228 sujets à l'aide du modèle de provocation allergénique conjonctivale (CAC). Le paramètre d'évaluation principal a été défini comme une démangeaison oculaire évaluée par le sujet à 3, 5 et 7 minutes après la CAC réalisée 16 heures après le traitement le jour 1 et 15 minutes après le traitement le jour 8. Cette étude a utilisé une analyse hiérarchique où la signification a été déterminée par une comparaison étape par étape de la bilastine par rapport à l'excipient. Pour démontrer son efficacité contre les démangeaisons oculaires, la solution ophtalmique de bilastine devait montrer une supériorité clinique par rapport à l'excipient d'au moins 0,5 unité sur une échelle de 5 points pour les trois (3) points temporels post-CAC : 3(±1), 5(±1) et 7(±1) minutes après le CAC et au moins 1 unité pour la majorité (2:3) de ces points temporels post-CAC le jour 1 et le jour 8.

Pour le paramètre d'évaluation principal, la bilastine à 6 mg/mL répondait aux critères établis par le paradigme hiérarchique : toutes les mesures de démangeaisons oculaires, à la fois 15 minutes et 16 heures après le traitement, étaient statistiquement significativement plus faibles pour la bilastine que pour l'excipient. De plus, la bilastine à 6 mg/mL a réduit les démangeaisons de > 1 unité par rapport à l'excipient 15 minutes après le traitement à tous les 3 points temporels, et de > 0,75 unité à 2 des 3 points temporels à 16 heures après le traitement. (voir Tableau 4).

Tableau 4 : Réponses de la moyenne des MC d'ANCOVA pour les démangeaisons oculaires à la solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL dans BOFT-0218

Moment de la réalisation du test	16 heures après le traitement			15 minutes après le traitement		
	3 minutes	5 minutes	7 minutes	3 minutes	5 minutes	7 minutes
Excipient	2,262	2,532	2,570	1,856	2,030	1,953
Bilastine à 6 mg/mL	1,595	1,736	1,732	0,664	0,822	0,818
Différence ¹	-0,667	-0,796	-0,839	-1,192	-1,208	-1,134
Valeur p	< 0,0001	< 0,0001	< 0,0001	< 0,0001	< 0,0001	< 0,0001

¹Bilastine – Excipient

Remarque : les différences en gras indiquent une efficacité clinique.

Pour le paramètre d'évaluation secondaire de rougeur conjonctivale, la solution ophtalmique de bilastine a démontré une amélioration par rapport à l'excipient ($p < 0,05$) 15 minutes après le traitement, mais pas 16 heures après le traitement.

Étude sur l'innocuité à long terme

Une étude multicentrique, à répartition aléatoire, à double insu, contrôlée par excipient, en groupes parallèles, de phase III, à long terme, a été menée pour évaluer l'innocuité, la tolérance et l'efficacité de la solution ophtalmique de bilastine à 6 mg/mL lorsqu'elle est utilisée jusqu'à 8 semaines. Il a été démontré que la solution ophtalmique BLEXTEN est bien tolérée et efficace lorsqu'elle a été utilisée pendant une période allant jusqu'à 8 semaines chez 218 patients adultes.

15 Microbiologie

Aucune information microbiologique n'est exigée pour ce produit médicamenteux.

16 Toxicologie non clinique

Toxicologie générale : Des données non cliniques révèlent que la bilastine ne pose pas de risque particulier chez l'homme, selon des études classiques de pharmacologie d'innocuité, de toxicité chronique, de génotoxicité et de cancérogénicité potentielle.

Toxicité – reproduction et développement : Dans les études sur la toxicité pour la reproduction, aucun effet sur la fertilité des mâles et des femelles ou sur le développement pré- et postnatal n'a été détecté

à des doses orales de bilastine allant jusqu'à 1 000 mg/kg de poids corporel chez le rat. Dans les études sur le développement embryo-fœtal avec administration orale de bilastine, une légère augmentation des pertes pré- et post-implantatoires chez le rat, ainsi qu'un retard d'ossification et de croissance chez le lapin n'ont été observés qu'à une dose plus de 1 000 fois supérieure à l'exposition humaine à la dose oculaire recommandée.

Études spéciales de toxicologie : Dans une étude sur la lactation, la bilastine a été détectée dans le lait de rates allaitantes ayant reçu une dose orale unique (20 mg/kg). Les concentrations de bilastine dans le lait équivalaient à environ la moitié de celles du plasma maternel. Compte tenu de la faible absorption générale de la bilastine après administration oculaire (voir [10 Pharmacologie clinique](#)), on peut donc s'attendre à des taux plus faibles de bilastine dans le lait maternel humain.

17 Monographies de référence

BLEXTEN (bilastine), comprimés orodispersibles (10 mg), comprimés (20 mg), solution orale (2,5 mg/mL); n° de contrôle 241318, Monographie de produit, Aralez Pharmaceuticals Canada Inc.

Renseignements destinés aux patient·e·s

LISEZ CE DOCUMENT POUR UNE UTILISATION SÉCURITAIRE ET EFFICACE DE VOTRE MÉDICAMENT

Pr **BLEXTEN**[®]

bilastine en solution ophtalmique

Ces Renseignements destinés aux patient·e·s sont rédigés pour la personne qui prendra **BLEXTEN**. Il peut s'agir de vous ou d'une personne dont vous vous occupez. Lisez attentivement ces renseignements. Conservez-les, car vous devrez peut-être les relire.

Ces Renseignements destinés aux patient·e·s sont un résumé. Ils ne sont pas complets. Si vous avez des questions au sujet de ce médicament ou si vous souhaitez obtenir de plus amples renseignements au sujet de **BLEXTEN**, adressez-vous à un professionnel de la santé.

À quoi sert BLEXTEN :

La solution ophtalmique BLEXTEN est utilisée pour traiter les signes et symptômes des troubles oculaires que vous rencontrez avec la conjonctivite allergique saisonnière et pérenne chez les adultes.

Comment fonctionne BLEXTEN :

BLEXTEN est un antihistaminique – il bloque l'action de l'histamine et soulage les signes et les symptômes des troubles oculaires tels que les démangeaisons dues à la conjonctivite allergique.

Les ingrédients de BLEXTEN sont :

Ingrédient médicamenteux : bilastine

Ingrédients non médicinaux : eau pour préparations injectables, glycérol, hyaluronate de sodium, hydroxyde de sodium 1 N (pour l'ajustement du pH), hydroxypropyl β -cyclodextrine, méthylcellulose.

BLEXTEN se présente sous la ou les formes pharmaceutiques suivantes :

Solution ophtalmique (gouttes ophtalmiques) : 1 mL de solution ophtalmique contient 6 mg de bilastine. Une goutte contient 0,2 mg de bilastine. BLEXTEN est une solution limpide et incolore, conditionnée dans un flacon multidose en PEBD contenant 5 mL de solution sans conservateur, muni d'une buse blanche en PEHD et d'un bouchon à vis inviolable.

Format : 1 flacon de 5 mL.

Ne prenez pas BLEXTEN si :

- Vous êtes allergique (hypersensible) à la bilastine ou à l'un des autres ingrédients de BLEXTEN.

Autres mises en garde :

Effectuer des tâches qui nécessitent une attention particulière :

Conduite d'un véhicule et utilisation de machines. L'instillation de ce médicament peut entraîner une vision floue temporaire ou d'autres troubles visuels affectant la capacité à conduire ou à utiliser des machines. Veuillez attendre que la vision redevienne normale avant de conduire ou d'utiliser des machines.

Lentilles de contact. L'utilisation de ce médicament n'a pas d'effet sur les propriétés des lentilles de contact. Vous pouvez continuer à porter des lentilles de contact pendant le traitement avec ce médicament. Retirez les lentilles de contact avant l'administration des gouttes ophtalmiques et attendez au moins 15 minutes avant de les remettre.

En cas d'inflammation, notamment de conjonctivite allergique, demandez à votre ophtalmologue si vous pouvez porter des lentilles de contact malgré les symptômes.

La solution ophtalmique BLEXTEN (6 mg/mL) ne convient pas aux patients de moins de 18 ans.

Mentionnez à votre professionnel de la santé toute la médication que vous prenez, y compris : médicaments, vitamines, minéraux, suppléments naturels ou produits de médecine parallèle.

Les produits suivants pourraient interagir avec BLEXTEN :

- Autres médicaments à usage ophtalmique. Après l'instillation de BLEXTEN, attendez au moins 5 minutes avant d'utiliser d'autres gouttes ophtalmiques. Les pommades ophtalmiques doivent être administrées en dernier.

Comment administrer BLEXTEN :

1. Avant d'administrer ce médicament, lavez-vous toujours les mains et séchez-les avec une serviette propre.
2. Nettoyez délicatement les paupières si elles présentent des croûtes. Pour ce faire, l'œil étant fermé, essuyez la paupière du coin interne au coin externe à l'aide d'une boule de coton imbibée d'eau tiède.
3. Ouvrez le flacon et évitez de toucher votre œil ou tout autre objet avec l'embout du compte-gouttes – les gouttes ophtalmiques et les compte-gouttes doivent rester propres.
4. Inclinez la tête vers l'arrière ou allongez-vous et regardez vers le haut (figure 1). Avec votre doigt, tirez doucement la paupière inférieure vers le bas (figure 2).
5. Regardez vers le haut et instillez une goutte dans l'œil.
6. Relâchez la paupière inférieure et gardez l'œil fermé jusqu'à ce que la goutte ait recouvert toute la surface de l'œil (figure 3).
7. Répétez l'opération pour l'autre œil, si nécessaire.



Figure 1

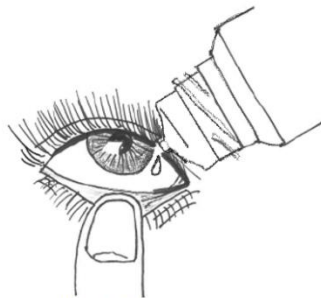


Figure 2



Figure 3

Pour éviter toute contamination pendant l'utilisation de ce médicament, ne touchez aucune surface (paupières, zones autour de l'œil ou autres surfaces) avec l'embout du compte-gouttes et nettoyez l'embout de la buse avec un mouchoir propre après utilisation pour éliminer tout résidu de liquide.

Dose habituelle :

Adultes : une goutte dans chaque œil atteint une fois par jour.

Le traitement par ce médicament doit être effectué régulièrement si possible jusqu'à ce qu'un soulagement des symptômes soit atteint et doit être poursuivi aussi longtemps que nécessaire pour maintenir le soulagement des symptômes. Ce médicament peut être utilisé pendant 8 semaines au maximum. Si vous arrêtez d'utiliser la solution ophtalmique BLEXTEN alors que vous êtes toujours exposé(e) à l'allergène ou aux allergènes, vous devez vous attendre à une réapparition des symptômes allergiques typiques.

Si vous avez d'autres questions sur l'utilisation de ce médicament, demandez plus d'informations à votre professionnel de la santé. Votre professionnel de la santé décidera et vous conseillera sur la durée d'utilisation en fonction de votre état de santé.

Surdose :

Si vous utilisez plus de solution ophtalmique BLEXTEN que vous ne le devriez, vous pouvez la rincer à l'eau tiède.

Si vous pensez que vous ou une personne dont vous vous occupez avez pris trop de BLEXTEN, contactez immédiatement votre professionnel de la santé, le service des urgences d'un hôpital, votre centre antipoison régional ou le numéro sans frais de Santé Canada, 1-844 POISON-X (1-844-764-7669), même en l'absence de symptômes.

Dose oubliée :

Si vous oubliez d'appliquer la goutte à temps, appliquez la dose oubliée dès que possible, puis appliquez la dose suivante à l'heure habituelle. N'appliquez pas deux doses en même temps pour compenser la dose oubliée.

Effets secondaires possibles de l'utilisation BLEXTEN :

En prenant BLEXTEN, vous pourriez avoir des effets secondaires autres que ceux qui figurent dans cette liste. Si c'est le cas, parlez-en à votre professionnel de la santé.

- Des problèmes oculaires comme :
 - Douleur oculaire
 - Rougeur des yeux
 - Changements au niveau de la vue
 - L'état de la maladie s'aggrave
 - Sécheresse oculaire
 - Écoulement oculaire
 - Irritation oculaire
 - Augmentation de la production de larmes
 - Gêne oculaire
- Perturbation du goût
- Céphalées
- Étourdissements
- Nausées

Déclaration des effets secondaires

Vous pouvez déclarer à Santé Canada des effets secondaires soupçonnés d'être associés à l'utilisation des produits de santé de l'une des deux façons suivantes :

- En consultant la page Web sur la déclaration des effets indésirables (Canada.ca/medicament-instrument-declaration) pour savoir comment faire une déclaration en ligne, par courriel, ou par télécopieur; ou
- En téléphonant sans frais au 1-866-234-2345.

Remarque : Consultez votre professionnel de la santé si vous souhaitez obtenir des renseignements sur la prise en charge des effets secondaires. Le Programme Canada Vigilance ne donne pas de conseils médicaux.

Conservation :

Conservez le médicament à une température comprise entre 15 et 30 °C.

N'utilisez pas BLEXTEN après la date de péremption indiquée sur l'étiquette ou sur la boîte après EXP. Cette date correspond au dernier jour du mois indiqué.

Après la première ouverture du flacon : n'utilisez pas ce médicament si le flacon est ouvert depuis plus de 2 mois.

Les médicaments ne devraient pas être jetés dans les eaux d'égout ou avec les ordures ménagères. Consultez votre pharmacien sur la façon d'éliminer adéquatement les médicaments dont vous n'avez plus besoin. Ces mesures aideront à protéger l'environnement.

Garder hors de la portée et de la vue des enfants.

Pour en savoir plus sur BLEXTEN :

- Parlez-en avec votre professionnel de la santé.
- Consultez la monographie intégrale rédigée à l'intention des professionnels de la santé, qui renferme également les Renseignements destinés aux patient·e·s. Ce document se trouve sur le site Web de Santé Canada ([Base de données sur les produits pharmaceutiques : Accéder à la base de données](#)); et sur le site Web du fabricant (<https://searchlightpharma.com/fr/commencer/>); ou en téléphonant au 1-855-331-0830.

Le présent feuillet été rédigé par Aralez Pharmaceuticals Canada Inc.

Date d'approbation : 2025-10-01