

CHARAKTERYSTYKA PRODUKTU LECZNICZEGO

1. NAZWA PRODUKTU LECZNICZEGO

Relestat 0,5 mg/ml krople do oczu, roztwór

2. SKŁAD JAKOŚCIOWY I ILOŚCIOWY

Jeden ml kropli do oczu zawiera 0,5 mg *Epinastini hydrochloridum* chlorowodoru epinastyny (co odpowiada 0,436 mg epinastyny)
Substancje pomocnicze – patrz punkt 6.1.

3. POSTAĆ FARMACEUTYCZNA

Krople do oczu, roztwór.
Przeźroczysty, bezbarwny roztwór

4. SZCZEGÓŁY KLINICZNE

4.1. Wskazania terapeutyczne

Leczenie objawów sezonowego alergicznego zapalenia spojówek.

4.2 Dawkowanie i stosowanie

Zalecaną dawką dla osób dorosłych jest jedna kropla wpuszczona do każdego zajętego oka 2 razy na dobę w okresie występowania objawów.

Nie ma doświadczenia w stosowaniu preparatu Relestat przez okres dłuższy niż 8 tygodni.

Zawartość buteleczki jest jałowa do momentu, gdy oryginalne zamknięcie jest naruszone poprzez obrót zakrętki w celu przedziurawienia końcówki zakraplacza. Aby uniknąć zanieczyszczenia, nie należy dotykać jakiegokolwiek powierzchni końcówką zakraplacza.

Jeśli stosowany jest więcej niż jeden okulistyczny lek miejscowy, leki należy stosować w odstępie co najmniej 10 minut.

Pacjenci w podeszłym wieku

Relestat nie był testowany u pacjentów w podeszłym wieku. Z danych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, zgromadzonych po dopuszczeniu do obrotu chlorowodoru epinastyny w postaci tabletek (do 20 mg na dobę), wynika, że nie ma szczególnych problemów bezpieczeństwa stosowania u pacjentów w podeszłym wieku w porównaniu z dorosłymi pacjentami. Z tego powodu zmiana dawkowania nie jest uważana za konieczną.

Dzieci oraz młodzież

Relestat może być stosowany u młodzieży (w wieku 12 lat oraz starszych) w takiej samej dawce jak u dorosłych.

Zaburzenia czynności wątroby

Relestat nie był badany u pacjentów z zaburzeniami czynności wątroby. Z danych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, zgromadzonych po dopuszczeniu do obrotu chlorowodoru epinastyny w postaci tabletek (do 20 mg na dobę), wynika, że częstość występowania objawów niepożądanych była większa w tej grupie w porównaniu do dorosłych pacjentów bez zaburzeń wątroby. Dobowa dawka równa 10 mg chlorowodoru epinastyny w tabletkach jest więcej niż 100 razy większa od dobowej dawki leku Relestat. Dodatkowo metabolizm chlorowodoru epinastyny jest u ludzi minimalny (<10%), z tego powodu zmiana dawkowania nie jest uważana za konieczną.

Zaburzenia czynności nerek

Relestat nie był badany u pacjentów z zaburzeniami czynności nerek. Z danych dotyczących bezpieczeństwa stosowania, zgromadzonych po dopuszczeniu do obrotu chlorowodoru epinastyny w postaci tabletek (do 20 mg na dobę), wynika że nie ma szczególnych problemów dotyczących bezpieczeństwa stosowania w przypadku pacjentów z zaburzeniami czynności nerek. Z tego powodu zmiana dawkowania nie jest uważana za konieczną.

4.3. Przeciwwskazania

Nadwrażliwość na epinastynę lub na którąkolwiek substancję pomocniczą leku.

4.4. Ostrzeżenia specjalne i zalecane środki ostrożności.

Chlorek benzalkoniowy jest powszechnie używany jako środek konserwujący w preparatach okulistycznych i rzadko były zgłaszane przypadki spowodowanej przez niego punktowej keratopatii lub toksycznej wrzodziejącej keratopatii.

Chlorek benzalkoniowy może być absorbowany przez miękkie soczewki kontaktowe oraz może zmienić ich barwę i dlatego pacjenci powinni być poinformowani, że należy odczekać 10 – 15 minut po wkropleniu leku Relestat przed założeniem soczewek kontaktowych. Relestat nie powinien być wkroplony podczas noszenia soczewek kontaktowych.

4.5. Oddziaływanie z innymi produktami leczniczymi oraz inne formy interakcji.

Nie przewiduje się żadnych interakcji z innymi lekami u ludzi, ponieważ ogólnoustrojowe stężenia epinastyny są bardzo małe ze względu na podanie do oka. Ponadto, epinastyna jest głównie wydalana u ludzi w postaci nie zmienionej co wskazuje na małego stopnia metabolizm. Specyficzne badania oddziaływania leku Relestat z innymi produktami leczniczymi nie były wykonane.

4.6. Ciąża i karmienie piersią.

Ciąża

Dane z ograniczonej ilości ciąż (11) wystawionych na działanie leku wskazują na brak niepożądanych skutków na ciążę lub na zdrowie płodu/novorodka. Obecnie nie ma dostępnych innych danych epidemiologicznych. Badania na zwierzętach nie wykazują bezpośrednich albo pośrednich szkodliwych skutków dotyczących

ciąży, rozwoju zarodka/płodu, porodu czy rozwoju pourodzeniowego (patrz punkt 5.3.).

Podczas przepisywania leku kobietom ciężarnym, należy zachować ostrożność..

Karmienie piersią

Epinastyna przenika do mleka karmiących szczurów, ale nie jest wiadomo czy epinastyna przenika do mleka ludzkiego. Z powodu braku doświadczenia, podczas przepisywania leku kobietom karmiącym piersią, należy zachować ostrożność.

4.7. Wpływ leku na zdolność kierowania pojazdami mechanicznymi i obsługę maszyn

W oparciu o farmakodynamiczny profil, zgłoszonych objawów niepożądanych oraz specyficznych badań psychometrycznych epinastyna nie ma żadnego lub ma pomijalny wpływ na zdolność kierowania pojazdami mechanicznymi i obsługę maszyn.

Jeśli zdarzy się przemijające zamglenie widzenia po zakropleniu leku, pacjent powinien poczekać, aby widzenie powróciło do normy, zanim zacznie kierować pojazdami mechanicznymi lub obsługiwać urządzenia mechaniczne.

4.8. Działania niepożądane

W badaniach klinicznych ogólna liczba przypadków wystąpienia niepożądanych objawów po zastosowaniu leku Relestat była mniejsza niż 10 %. Nie wystąpiły ciężkie objawy niepożądane. Większość objawów dotyczyła oczu i miała niewielkie nasilenie. Najczęstszą reakcją niepożądaną było uczucie pieczenia w oku (w większości o niewielkim nasileniu); wszystkie inne objawy niepożądane nie były częste.

Następujące reakcje niepożądane były zgłoszone podczas badań klinicznych leku Relestat:

Zaburzenia oka

Częste (>1/100, <1/10): uczucie pieczenia

Niezbyt częste (>1/1000, <1/100): alergiczne zapalenie spojówek, opadanie powiek, obrzęk spojówek, przekrwienie spojówek, wydzielina oczna, suchość oka, podrażnienie, świąd, podwyższona wrażliwość, światłowstręt, zaburzenia widzenia.

Zaburzenia układu nerwowego

Niezbyt częste (>1/1000, <1/100): ból głowy

Zaburzenia oddechowe, klatki piersiowej i śródpiersia

Niezbyt częste (>1/1000, <1/100): astma, podrażnienie nosa, nieżyt nosa

Zaburzenia żołądkowo-jelitowe

Niezbyt częste (>1/1000, <1/100): suchość w ustach, zmiana smaku

Zaburzenia skóry oraz tkanki podskórnej

Niezbyt częste (>1/1000, <1/100): świąd

4.9. Przedawkowanie leku

Po zastosowaniu 0,3% chlorowodoru epinastyny w postaci kropli do oczu 3 razy na dobę (jest to dawka 9 razy większa niż zalecana dobową dawką) zaobserwowano przemijające zwężenie źrenicy bez wpływu na ostrość widzenia czy też inne parametry oka.

5 ml pojemnik leku Relestat zawiera 2,5 mg chlorowodoru epinastyny. Wprowadzona do obrotu jednorazowa dobową dawką chlorowodoru epinastyny, w postaci tabletek, wynosi do 20 mg. Z tego powodu nie przewiduje się zatrucia po doustnym przyjęciu okulistycznej postaci nawet po przypadkowym połknięciu całej zawartości buteleczki.

Nie zgłoszono żadnego przypadku przedawkowania leku Relestat.

5. WŁAŚCIWOŚCI FARMAKOLOGICZNE

5.1 Właściwości farmakodynamiczne

Grupa farmakoterapeutyczna: Okulistyczne; zmniejszające przekrwienie i przeciwalergiczne; inne przeciwalergiczne
Kod ATC: S01GX 10

Epinastyna jest miejscowo aktywnym, bezpośrednim antagonistą receptora H_1 . Epinastyna ma duże powinowactwo wiązania do histaminowego receptora H_1 i 400 razy większe powinowactwo do histaminowego receptora H_2 . Epinastyna wykazuje również powinowactwo do receptorów: α_1 -, α_2 - oraz 5-HT₂. Ma ona małe powinowactwo do cholinergicznego, dopaminergicznego i innych różnych miejsc receptorowych. Epinastyna nie przenika przez barierę krew/mózg i dlatego nie powoduje objawów niepożądanych związanych z ośrodkowym układem nerwowym tzn. nie działa uspokajająco.

Zastosowanie epinastyny miejscowo do oka u zwierząt wykazało, że epinastyna ma działanie przeciwhistaminowe, modulujący wpływ na kumulację komórek zapalnych oraz działanie stabilizujące mastocyty.

W badaniach prowokacji allerganami u ludzi epinastyna łagodziła objawy oczne wywołane antygenem. Działanie to utrzymywało się przynajmniej przez 8 godzin.

5.2 Właściwości farmakokinetyczne

Po podaniu jednej kropli preparatu Relestat do każdego oka dwa razy na dobę, średnie maksymalne stężenie osocze w wysokości 0,042 ng/ml występuje po około dwóch godzinach. Objętość dystrybucji epinastyny wynosi 417 litrów. Epinastyna w 64% wiąże się z białkami osocza. Klirens wynosi 928 ml/min i końcowy okres połowicznej eliminacji wynosi około 8 godzin. Mniej niż 10% podlega metabolizmowi. Epinastyna jest głównie wydalana poprzez nerki w stanie nie zmienionym. Wydzielanie przez nerki dokonuje się głównie poprzez aktywne wydzielanie kanalikowe.

Z przedklinicznych badań *in vitro* i *in vivo* wynika, że epinastyna wiąże się z melaniną i gromadzi w pigmentowych tkankach oka u królików oraz u małp. Z danych *in vitro* wynika, że wiązanie z melaniną jest średniego stopnia oraz odwracalne.

5.3 Przedkliniczne dane na temat bezpieczeństwa

Dane przedkliniczne w oparciu o konwencjonalne badania farmakologiczne bezpieczeństwa stosowania, toksyczności po podaniu wielokrotnej dawki, genotoksyczności, rakotwórczości oraz szkodliwego wpływu na reprodukcję nie ujawniły specjalnych zagrożeń dla ludzi.

6. SZCZEGÓŁOWE DANE FARMACEUTYCZNE

6.1 Substancje pomocnicze

Benzalkoniowy chlorek, edetynian disodu, sodu chlorek, sodu wodorofosforan dwuwodny, sodu wodorotlenek /kwas solny (w celu regulacji pH), woda oczyszczona.

6.2 Niezgodności

Nie dotyczy.

6.3 Okres ważności

2 lata

Po pierwszym otwarciu: 4 tygodnie

6.4 Specjalne środki ostrożności przy przechowywaniu

W celu ochrony przed światłem przechowywać buteleczkę w opakowaniu zewnętrznym.

Nie przechowywać w temperaturze powyżej 25°C.

6.5 Rodzaj oraz zawartość pojemnika

5 ml butelka z polietylenu z białą polistyrenową zakrętką wyposażoną w spiczasty bolec do otwierania buteleczki.

6.6 Instrukcje dotyczące użytkowania leku

Nie ma specjalnych wymagań.

7. WYTWÓRCA POSIADAJĄCY POZWOLENIE NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

Allergan Pharmaceuticals Ireland
Castlebar Road
Westport
Co. Mayo
Irlandia

8. NUMER POZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

9. DATA PIERWSZEGO WYDANIA/PRZEDŁUZENIA ZEZWOLENIA NA DOPUSZCZENIE DO OBROTU

10. DATA ZATWIERDZENIA LUB CZĘŚCIOWEJ ZMIANY TEKSTU CHARAKTERYSTYKI PRODUKTU LECZNICZEGO