

KISA ÜRÜN BİLGİSİ

1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

RELESTAT® %0,05 Göz Damlası, Çözelti

Steril

2. KALİTATİF VE KANTİTATİF BİLEŞİM

Etkin madde: 1 ml çözelti etkin madde olarak 0,5 mg epinastin hidroklorür (0,436 mg epinastine eşdeğer) içerir.

Yardımcı maddeler:

Benzalkonyum klorür 0,1 mg/ml

Yardımcı maddeler için 6.1'e bakınız.

3. FARMASÖTİK FORM

Göz damlası, çözelti.

Berrak renksiz steril çözelti.

4. KLİNİK ÖZELLİKLER

4.1. Terapötik endikasyonlar

Mevsimsel alerjik konjunktivit semptomlarının tedavisinde kullanılır.

4.2. Pozoloji ve uygulama şekli

Pozoloji/uygulama sıklığı ve süresi:

Erişkinlerde önerilen doz, semptomatik süre boyunca etkilenmiş her göze günde iki kez bir damla damlatılmasıdır. RELESTAT®'ın klinik çalışmalarda 8 haftadan daha fazla kullanımına ilişkin deneyim yoktur.

Gözün veya göz damlasının kontamine olmasını önlemek için damlalığın ucunu herhangi bir yüzey ile temas ettirmeyiniz.

Birden fazla oftalmik tıbbi ilaç kullanılmaktaysa, diğer ilaç en az 10 dakika sonra uygulanmalıdır.

Uygulama şekli:

RELESTAT®, sadece topikal oftalmik kullanım içindir.

1. Şişeyi açmadan önce ellerinizi yıkayınız.

2. Başınızı arkaya eğiniz ve yukarı bakınız.
3. Şişenin kapağını saatin ters yönüne doğru çevirerek açınız.
4. Alt göz kapağınızı küçük bir cep oluşuncaya kadar yavaşça aşağı doğru çekiniz.
5. Şişeyi ters çevirerek tedavi edilmesi gereken göze bir damla damlatınız.
6. Göz kapağınızı bırakınız ve gözünüzü 30 saniye kapalı tutunuz.

İlk damla gözünüze isabet etmediyse tekrar bir damla damlatınız.

Kullandıktan hemen sonra vidalı kapağı kapatınız. RELESTAT®'ı uygulamayı unuttuysanız, hatırlar hatırlamaz tedavi gereken her bir göze tek bir damla uygulayınız ve daha sonra her zamanki şekilde uygulamaya devam ediniz. Bir dozu, unuttuğunuz dozların yerine iki katına çıkarmayınız.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Karaciğer yetmezliği:

RELESTAT® karaciğer yetmezliği olan hastalarda incelenmemiştir. Epinastin hidroklorür tablet formülasyonunun (günde bir kez 20 mg'a kadar) pazarlama sonrası güvenlilik verileri, bu gruptaki istenmeyen etki insidansının karaciğer yetmezliği bulunmayan erişkin hastalara kıyasla daha fazla olduğunu göstermektedir. Günlük 10 mg epinastin hidroklorür tablet dozu, RELESTAT® günlük dozunun 100 katından daha fazladır. Ayrıca epinastinin insandaki metabolizması minimaldir (<0%10). Bu nedenle doz ayarlaması gerekmediği düşünülmektedir.

Böbrek yetmezliği:

RELESTAT® böbrek yetmezliği olan hastalarda incelenmemiştir. Epinastin hidroklorür tablet formülasyonunun (günde bir kez 20 mg'a kadar) pazarlama sonrası güvenlilik verileri, böbrek yetmezliği olan hastalarda özel bir güvenlilik sorunu olmadığını göstermektedir. Bu nedenle doz ayarlaması gerekmediği düşünülmektedir.

Pediyatrik popülasyon:

Yaşı ≥ 12 olan çocuklardaki güvenlilik ve etkililik, klinik çalışmalarda kanıtlanmıştır. RELESTAT®, ergenlerde (yaşı 12 ve üzeri olan) erişkinlerdekiyle aynı dozajda kullanılabilir.

RELESTAT®'ın 3 yaşından küçük çocuklarda güvenliliği ve etkililiği kanıtlanmamıştır. Veri mevcut değildir.

Yaşı 3-12 olan çocuklarda güvenlilikle ilgili sınırlı veri bulunmaktadır (Bkz. Bölüm 5.1).

Geriyatrik popülasyon:

Yaşlı kişilerde RELESTAT® çalışılmamıştır. Epinastin hidroklorür tablet formülasyonunun (günde bir kez 20 mg'a kadar) pazarlama sonrası güvenlilik verileri yaşlı kişilerde yetişkin hastalardan farklı bir güvenlilik önlemi gerektirmediğini göstermektedir. Bu nedenle doz ayarlaması gerekmediği düşünülmektedir.

4.3. Kontrendikasyonlar

Etkin maddeye veya bölüm 6.1'de belirtilen yardımcı maddelerden herhangi birine karşı aşırı duyarlılık.

4.4. Özel kullanım uyarıları ve önlemleri

RELESTAT® , sadece topikal kullanım içindir ve enjeksiyon yoluyla ya da oral olarak uygulanmaz.

Benzalkonyum klorür oftalmik preparatlarda sık kullanılan bir koruyucudur ve nadiren noktalı keratopati ve/veya toksik ülseratif keratopati yaptığı bildirilmiştir.

Benzalkonyum klorür gözde iritasyona sebebiyet verebilir, yumuşak kontakt lensler tarafından absorbe edilebilir ve lensin rengini değiştirebilir, bu nedenle hastalar RELESTAT® uygulamadan önce kontakt lensleri çıkarmaları ve RELESTAT® damlattıktan sonra kontakt lensleri takmak için en az 15 dakika beklemleri konusunda bilgilendirilmelidir. Kontakt lens takılı iken RELESTAT® kullanılmamalıdır.

4.5. Diğer tıbbi ürünler ile etkileşimler ve diğer etkileşim şekilleri

Etkileşim çalışması yapılmamıştır.

Oküler uygulamadan sonra epinastinin sistemik konsantrasyonları son derece düşük olduğu için insanlarda hiçbir ilaç etkileşimi beklenmemektedir. Ek olarak, epinastin esas olarak değişmeden atılmaktadır, bu da düşük seviyede metabolize olduğunu göstermektedir.

Özel popülasyonlara ilişkin ek bilgiler:

Pediyatrik popülasyon

Pediyatrik popülasyon için yapılmış etkileşim çalışması bulunmamaktadır.

4.6. Gebelik ve laktasyon

Genel tavsiye

Gebelik kategorisi C'dir.

Çocuk doğurma potansiyeli bulunan kadınlar/Doğum kontrolü (Kontrasepsiyon)

Çocuk doğurma potansiyeli olan kadınlarla ilgili veri mevcut değildir.

Gebelik dönemi

Sınırlı sayıda (11) gebelikte maruz kalma olgularına ilişkin veriler, epinastinin gebelik üzerinde ya da fetusun/yeni doğan çocuğun sağlığı üzerinde advers etkileri olduğunu göstermemektedir. Bugüne kadar herhangi önemli bir epidemiyolojik veri elde edilmemiştir.

Hayvanlar üzerinde yapılan çalışmalar, gebelik ve/veya embriyonal/fetal gelişim ve/veya doğum ve/veya doğum sonrası gelişim ile ilgili olarak doğrudan ya da dolaylı zararlı etkiler olduğunu göstermemektedir (Bkz. Bölüm 5.3).

Gebe kadınlara verilirken dikkatli olunmalıdır.

Laktasyon dönemi

Epinastin sıçan sütüne geçmektedir, ancak epinastinin insan sütüne geçip geçmediği bilinmemektedir. Deneyim bulunmaması nedeniyle emziren kadınlara verilirken dikkatli olunmalıdır.

Üreme yeteneği /Fertilite

Epinastinin insanda üreme yeteneği/fertiliteye etkisi bildirilmemiştir.

4.7. Araç ve makine kullanımı üzerindeki etkiler

Farmakodinamik profil, bildirilen istenmeyen etkiler ve spesifik psikometrik çalışmalar baz alındığında RELESTAT®'ın araç ve makine kullanımı üzerinde etkisi bulunmamaktadır veya ihmal edilebilir.

Damlatma sırasında geçici görme bulanıklığı meydana gelirse, hasta araç veya makine kullanma öncesinde görmesi berraklaşana kadar beklemelidir.

4.8. İstenmeyen etkiler

Klinik çalışmalarda RELESTAT® kullanımı sonrası istenmeyen etkilerin genel insidansı %10'dan daha az olmuştur. Ciddi istenmeyen etki olmamıştır. Çoğu gözle ilgili ve hafiftir. En yaygın istenmeyen etki gözde yanmadır (genelde hafif); diğer bütün istenmeyen etkiler yaygın değildir.

Her sıklık grubunda istenmeyen etkiler, azalan ciddiyet sırasıyla Sistem Organ Sınıfı'na göre verilmektedir. İstenmeyen etkilerin meydana gelme sıklığı, aşağıdaki şekilde belirtilmiştir: Çok yaygın ($\geq 1/10$); yaygın ($\geq 1/100$ ila $< 1/10$); yaygın olmayan ($\geq 1/1.000$ ila $< 1/100$); seyrek ($\geq 1/10.000$ ila $< 1/1.000$); çok seyrek ($< 1/10.000$), bilinmiyor (eldeki verilerden hareketle tahmin edilemiyor).

RELESTAT® ile yapılan klinik çalışmalarda aşağıdaki istenmeyen etkiler bildirilmiştir:

Sinir sistemi hastalıkları

Yaygın olmayan: Baş ağrısı

Göz hastalıkları

Yaygın: Yanma hissi/göz iritasyonu

Yaygın olmayan: Konjunktival/oküler hiperemi, gözde akıntı, göz kuruluğu, göz pruriti, görme bozukluğu

Solunum, göğüs bozuklukları ve mediastinal hastalıkları

Yaygın olmayan: Astım, nazal iritasyon, rinit

Gastrointestinal hastalıklar

Yaygın olmayan: Disguzi

Aşağıdaki yan etkiler epinastinin pazarlama sonrası klinik deneyimlerinden bildirilmiştir:

Bağışıklık sistemi hastalıkları

Bilinmiyor: Gözde alerji semptom ve belirtileri ile anjiyoödem, ciltte döküntü ve kızarıklık gibi göz dışı alerjik reaksiyonları içeren aşırı duyarlılık reaksiyonları.

Göz hastalıkları

Bilinmiyor: Gözde artan lakrimasyon, göz ağrısı, gözde şişme, göz kapağında ödem

Pediyatrik popülasyon

Yaşı 12 ve üstü olan ergenlerde istenmeyen etkilerin sıklık, tip ve ciddiyetinin erişkinlerdekiyle aynı olması beklenmektedir.

3-12 yaşındaki çocuklarda istenmeyen etkilerin sıklık, tip ve ciddiyeti ile ilgili sınırlı deneyim mevcuttur.

Fosfat içeren damlalar için rapor edilen advers reaksiyonlar:

Ciddi kornea hasarına sahip bazı hastalarda fosfat içeren göz damlası kullanımına bağlı çok nadiren de olsa korneal kalsifikasyon vakaları raporlanmıştır.

Şüpheli advers reaksiyonların raporlanması:

Ruhsatlandırma sonrası şüpheli ilaç advers reaksiyonlarının raporlanması büyük önem taşımaktadır. Raporlama yapılması, ilacın yarar/risk dengesinin sürekli olarak izlenmesine olanak sağlar. Sağlık mesleği mensuplarının herhangi bir şüpheli advers reaksiyonu Türkiye Farmakovijilans Merkezi (TUFAM)'ne bildirmeleri gerekmektedir (www.titck.gov.tr; e-posta: tufam@titck.gov.tr; tel: 0 800 314 00 08; faks: 0 312 218 35 99).

4.9. Doz aşımı ve tedavisi

Günde 3 kez %0,3 epinastin hidroklorür göz damlasının damlatılmasından sonra (önerilen günlük dozun 9 katı) görme keskinliğini veya diğer oküler parametreleri etkilemeyen geri dönüşümlü miyozis gözlenmiştir.

RELESTAT® 5 ml şişe, 2,5 mg epinastin hidroklorür içermektedir. Tablet formülasyonu günde bir kez 20 mg'a kadar epinastin hidroklorür dozunda pazarlanmaktadır, dolayısıyla bütün şişenin içeriği içilmiş olsa dahi oftalmik formülasyonun oral olarak alınmasından sonra intoksikasyon beklenmemektedir. Hiçbir doz aşımı olayı bildirilmemiştir.

5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLER

5.1. Farmakodinamik özellikler

Farmakoterapötik Grup: Oftalmolojikler, dekonjestanlar ve antialerjikler, diğer antialerjikler
ATC Kodu: S01GX10

Etki mekanizması:

Epinastin, topikal olarak aktif, direkt bir H₁-reseptör antagonistidir. Epinastinin, histamin H₁-reseptörüne karşı yüksek bir bağlanma afinitesi ve histamin H₂-reseptörüne karşı 400 kat daha düşük bir afinitesi vardır. Ayrıca, epinastin α_1 -, α_2 - ve 5-HT₂-reseptörüne karşı da bir afiniteye sahiptir. Kolinerjik, dopaminerjik ve diğer çeşitli reseptör bölgeleri için afinitesi düşüktür. Epinastin kan/beyin bariyerini aşmaz ve bu nedenle merkezi sinir sistemini ilgilendiren yan etkilere neden olmamaktadır; yani, sedatif değildir.

Farmakodinamik etkiler:

Hayvanlarda göze lokal uygulamadan sonra antihistaminik aktivite göstermektedir, inflamatuvar hücrelerin birikimini modüle etmektedir ve mast hücrelerini stabilize edici etki göstermektedir.

İnsanlardaki allerjen provakasyon çalışmalarında epinastin, oküler antijen uygulanmasını takiben, oküler semptomları hafifletebilmiştir. Bu etki en az 8 saat sürmüştür.

Pediyatrik popülasyon:

Oküler-odaklı non-semptomatik, 3-12 yaşlarındaki sağlıklı 96 çocukta yapılan 6 haftalık, randomize, çift-kör, taşıyıcı (çözücü) kontrollü çalışma (2:1), RELESTAT®'ın iyi tolere edildiğini göstermiş ve herhangi bir güvenlik değişkeni açısından gruplar arasında önemli bir fark tespit edilmemiştir. Tedaviye bağlı reaksiyonlar, konjunktival folliküller (hem epinastin

hem de taşıyıcı (çözücü) grubunda %6,3) ve konjunktival hiperemidir (epinastin uygulananların %1,6'sında ve taşıyıcı (çözücü) grubundan hiçbirinde). Yaşı ≥ 12 olan hastalarda güvenlik ve etkililik, klinik çalışmalarda gösterilmiştir.

5.2. Farmakokinetik özellikler

Emilim:

Her bir göze günde iki kez bir damla RELESTAT® uygulanmasının ardından, yaklaşık iki saat sonra 0,042 ng/ml'lik ortalama maksimum plazma konsantrasyonuna ulaşılır.

Dağılım:

Epinastinin 417 litrelik bir dağılım hacmi vardır ve plazma proteinlerine bağlanma oranı %64'tür.

Biyotransformasyon:

%10'undan azı metabolize olmaktadır.

Eliminasyon:

Klinik öncesi *in vivo* ve *in vitro* çalışmalar, epinastinin melanine bağlandığı, tavşan ve maymunların renkli göz dokularında toplandığını göstermiştir. *In vitro* veriler melanine bağlanmanın reversibl ve orta şiddette olduğunu göstermiştir.

Klerensi 928 ml/dak'dır ve terminal plazma eliminasyon yarı ömrü yaklaşık 8 saattir. Epinastin, esas olarak değişmeden renal yoldan atılır. Renal eliminasyon esas olarak tübüler salgılamaya yoluladır.

5.3. Klinik öncesi güvenlik verileri

Klinik olmayan çalışmalar, güvenlik, farmakoloji, tekrarlanan doz toksisitesi, genotoksosite, karsinojenik potansiyel, üreme ve gelişim toksisitesi ile ilgili konvensiyonel çalışmalara dayanarak insanlarda özel zarar olmadığını göstermiştir.

6. FARMASÖTİK ÖZELLİKLER

6.1. Yardımcı maddelerin listesi

Benzalkonyum klorür
Sodyum dihidrojen fosfat dihidrat
Sodyum klorür
Disodyum edetat
Sodyum hidroksit ya da hidroklorik asit (pH ayarlaması için)
Saf su

6.2. Geçimsizlikler

Geçerli değildir

6.3. Raf ömrü

24 ay

6.4. Saklamaya yönelik özel tedbirler

25°C'nin altındaki oda sıcaklığında saklayınız.
Şişeyi kutusunda ve ışıktan koruyarak saklayınız.

Açıldıktan sonra 25°C'nin altında saklanmak koşuluyla 28 gün içerisinde kullanılmalıdır.

6.5. Ambalajın niteliği ve içeriği

Polistiren vida kapaklı 5 ml'lik polietilen şişelerde sunulur.

6.6. Beşeri tıbbi üründen arta kalan maddelerin imhası ve diğer özel önlemler

Kullanılmamış olan ürünler ya da atık materyaller “Tıbbi Atıkların Kontrolü Yönetmeliği” ve “Ambalaj ve Ambalaj Atıklarının Kontrolü Yönetmelikleri”ne uygun olarak imha edilmelidir.

7. RUHSAT SAHİBİ

Allergan İlaçları Ticaret A.Ş.
Bilim Sokak, No: 5
Sun Plaza, Kat: 21-22-23
Maslak/Sarıyer/İstanbul

Tel : 0212 365 50 00
Faks : 0212 290 72 11

8. RUHSAT NUMARASI

130/56

9. İLK RUHSAT TARİHİ/RUHSAT YENİLEME TARİHİ

İlk ruhsat tarihi: 31.12.2010
Ruhsat yenileme tarihi:

10. KÜB'ÜN YENİLENME TARİHİ