

ΠΕΡΙΛΗΨΗ ΤΩΝ ΧΑΡΑΚΤΗΡΙΣΤΙΚΩΝ ΤΟΥ ΠΡΟΪΟΝΤΟΣ

1. ΟΝΟΜΑΣΙΑ ΤΟΥ ΦΑΡΜΑΚΕΥΤΙΚΟΥ ΠΡΟΪΟΝΤΟΣ

Relestat, 0,5 mg/ml, οφθαλμικές σταγόνες, διάλυμα.

2. ΠΟΙΟΤΙΚΗ ΚΑΙ ΠΟΣΟΤΙΚΗ ΣΥΝΘΕΣΗ

Ένα ml διαλύματος των οφθαλμικών σταγόνων, περιέχει 0,5mg epinastine hydrochloride. (που ισοδυναμεί με 0.436mg epinastine)

Έκδοχο: benzalkonium chloride 0,1mg/ml

Για τον πλήρη κατάλογο των εκδόχων, βλ. παράγραφο 6.1.

3. ΦΑΡΜΑΚΟΤΕΧΝΙΚΗ ΜΟΡΦΗ

Οφθαλμικές σταγόνες, διάλυμα.

Διαυγές άχρωμο διάλυμα.

4. ΚΛΙΝΙΚΕΣ ΠΛΗΡΟΦΟΡΙΕΣ

4.1 Θεραπευτικές ενδείξεις

Συμπτωματική θεραπεία της εποχιακής αλλεργικής επιπεφυκίτιδας.

4.2 Δοσολογία και τρόπος χορήγησης

Η συνιστώμενη δόση για ενήλικες είναι η ενστάλαξη μίας σταγόνας σε κάθε πάσχοντα οφθαλμό δύο φορές ημερησίως, κατά τη διάρκεια της περιόδου που διαρκούν τα συμπτώματα.

Δεν υπάρχει εμπειρία από τη χρήση του Relestat για διάστημα μεγαλύτερο των 8 εβδομάδων.

Το περιεχόμενο του φιαλιδίου παραμένει στείρο μέχρι να ανοίξει το αρχικό κάλυμμα, περιστρέφοντάς το έτσι ώστε να τρυνήσει η σταγονομετρική προεξοχή. Για να αποφευχθεί μόλυνση, η σταγονομετρική προεξοχή να μην αγγίζει σε καμία επιφάνεια.

Εάν χορηγούνται περισσότερα από ένα τοπικά οφθαλμολογικά φαρμακευτικά προϊόντα, τα φαρμακευτικά προϊόντα πρέπει να χορηγούνται με μεσοδιάστημα τουλάχιστον 10 λεπτών.

Υπερήλικες

Το Relestat δεν έχει μελετηθεί σε υπερήλικες ασθενείς. Δεδομένα ασφαλείας μετά την κυκλοφορία της epinastine hydrochloride υπό μορφή δισκίου (σε δόση μέχρι 20 mg άπαξ ημερησίως), δεν έδειξαν ιδιαίτερα προβλήματα ασφαλείας στους υπερήλικες ασθενείς σε σύγκριση με τους ενήλικες ασθενείς. Επομένως, δε θεωρείται απαραίτητη η προσαρμογή της δοσολογίας.

Παιδιά και Έφηβοι

Το Relestat μπορεί να χρησιμοποιηθεί σε εφήβους (ηλικίας 12 ετών ή μεγαλύτερους) στην ίδια δοσολογία με αυτή των ενηλίκων.

Ηπατική ανεπάρκεια

Το Relestat δεν έχει μελετηθεί σε ασθενείς με ηπατική ανεπάρκεια. Δεδομένα ασφαλείας μετά την κυκλοφορία της epinastine hydrochloride υπό μορφή δισκίου (σε δόση μέχρι 20 mg άπαξ ημερησίως), δείχνουν ότι η συχνότητα των ανεπιθύμητων ενεργειών ήταν μεγαλύτερη στην ομάδα αυτή σε σχέση

με τους ενήλικες ασθενείς χωρίς ηπατική ανεπάρκεια. Η ημερήσια δόση ενός δισκίου erinastine hydrochloride των 10 mg είναι περισσότερο από 100 φορές υψηλότερη από την ημερήσια δόση του Relestat. Επιπλέον, το ποσοστό μεταβολισμού της erinastine στον άνθρωπο είναι ελάχιστο (<10%). Επομένως, δε θεωρείται απαραίτητη η προσαρμογή της δοσολογίας.

Νεφρική ανεπάρκεια

Το Relestat δεν έχει μελετηθεί σε ασθενείς με νεφρική ανεπάρκεια. Δεδομένα ασφαλείας μετά την κυκλοφορία της erinastine hydrochloride υπό μορφή δισκίου (σε δόση μέχρι 20 mg άπαξ ημερησίως) δεν έδειξαν ιδιαίτερα προβλήματα ασφαλείας σε ασθενείς με νεφρική ανεπάρκεια. Επομένως, δε θεωρείται απαραίτητη η προσαρμογή της δοσολογίας.

4.3 Αντενδείξεις

Υπερευαισθησία στην erinastine ή σε κάποιο από τα έκδοχα.

4.4 Ειδικές προειδοποιήσεις και προφυλάξεις κατά τη χρήση

Το χλωριούχο βενζαλκόνιο χρησιμοποιείται συχνά ως συντηρητικό στα οφθαλμικά ιδιοσκευάσματα και έχει αναφερθεί ότι σπάνια προκαλεί στικτή κερατίτιδα και/ή τοξική ελκωτική κερατίτιδα.

Το χλωριούχο βενζαλκόνιο μπορεί να απορροφηθεί και να αποχρωματίσει τους μαλακούς φακούς επαφής, συνεπώς οι ασθενείς πρέπει να περιμένουν για 10-15 λεπτά μετά την ενστάλαξη του Relestat πριν φορέσουν τους φακούς επαφής. Το Relestat δεν πρέπει να χορηγείται ενώ φοράτε φακούς επαφής.

4.5 Αλληλεπιδράσεις με άλλα φαρμακευτικά προϊόντα και άλλες μορφές αλληλεπίδρασης

Δεν έχουν πραγματοποιηθεί μελέτες αλληλεπιδράσεων.

Δεν αναμένονται αλληλεπιδράσεις με άλλα φάρμακα στον άνθρωπο καθώς οι συστηματικές συγκεντρώσεις της erinastine μετά την οφθαλμική χορήγηση είναι εξαιρετικά χαμηλές. Επιπλέον, στον άνθρωπο η erinastine αποβάλλεται ως επί το πλείστον αμετάβλητη, γεγονός που δείχνει χαμηλό επίπεδο μεταβολισμού.

4.6 Κύηση και γαλουχία

Εγκυμοσύνη

Τα δεδομένα σχετικά με περιορισμένο αριθμό (11) περιπτώσεων έκθεσης κατά την εγκυμοσύνη στην erinastine, δεν καταδεικνύουν ανεπιθύμητες ενέργειες στην εγκυμοσύνη ή στην υγεία του εμβρύου/νεογέννητου. Έως σήμερα, δεν διατίθενται άλλα σχετικά επιδημιολογικά στοιχεία. Μελέτες σε ζώα δεν κατέδειξαν άμεσες ή έμμεσες επικίνδυνες επιπτώσεις στην εγκυμοσύνη, στην ανάπτυξη του εμβρύου, στον τοκετό ή στην ανάπτυξη του νεογνού (βλέπε 5.3)

Η χορήγηση σε έγκυες γυναίκες πρέπει να πραγματοποιείται με ιδιαίτερη προσοχή.

Γαλουχία

Η erinastine απεκκρίνεται στο γάλα αρουραίων, ωστόσο, δεν είναι γνωστό εάν απεκκρίνεται στο ανθρώπινο γάλα. Λόγω της έλλειψης εμπειρίας, πρέπει να δίνεται προσοχή όταν συνταγογραφείται σε γυναίκες κατά την περίοδο της γαλουχίας.

4.7 Επιδράσεις στην ικανότητα οδήγησης και χειρισμού μηχανών

Βάσει του φαρμακοδυναμικού προφίλ, των ανεπιθύμητων ενεργειών που έχουν αναφερθεί και των ειδικών ψυχομετρικών μελετών, η erinastine δεν έχει καμία ή έχει ασήμαντη επίδραση στην ικανότητα οδήγησης και χειρισμού μηχανών.

Σε περίπτωση που παροδικώς παρατηρηθεί θάμβος οράσεως κατά την ενστάλαξη, ο ασθενής θα πρέπει να περιμένει μέχρι να αποκατασταθεί η όρασή του πριν οδηγήσει ή χειριστεί μηχανές.

4.8 Ανεπιθύμητες ενέργειες

Σε κλινικές μελέτες, η συνολική συχνότητα εμφάνισης ανεπιθύμητων ενεργειών μετά τη χορήγηση του Relestat ήταν μικρότερη από 10%. Δεν παρατηρήθηκαν σοβαρές ανεπιθύμητες ενέργειες. Οι περισσότερες ήταν οφθαλμικές και ήπιες. Η συχνότερη ανεπιθύμητη ενέργεια ήταν το αίσθημα καύσου (κυρίως ήπιο) στον οφθαλμό. Όλες οι λοιπές ανεπιθύμητες ενέργειες ήταν σπάνιες.

Κατά τη διάρκεια κλινικών μελετών με Relestat αναφέρθηκαν οι ακόλουθες ανεπιθύμητες ενέργειες:

Οφθαλμικές διαταραχές

Συχνές ($\geq 1/100$, $< 1/10$): αίσθημα καύσου

Όχι συχνές ($\geq 1/1000$, $< 1/100$): αλλεργική επιπεφυκίτιδα, βλεφαρόπτωση, οίδημα του επιπεφυκότα, υπεραιμία του επιπεφυκότα, οφθαλμικό έκκριμα, ξηροφθαλμία, ερεθισμός, κνησμός, αυξημένη ευαισθησία, φωτοφοβία, οπτική διαταραχή

Διαταραχές του νευρικού συστήματος

Όχι συχνές ($\geq 1/1000$, $< 1/100$): κεφαλαλγία

Διαταραχές του αναπνευστικού συστήματος, του θώρακα και του μεσοθωράκιου

Όχι συχνές ($\geq 1/1000$, $< 1/100$): άσθμα, ρινικός ερεθισμός, ρινίτιδα

Διαταραχές του γαστρεντερικού

Όχι συχνές ($\geq 1/1000$, $< 1/100$): ξηροστομία, αλλαγές γεύσης

Διαταραχές του δέρματος και του υποδόριου ιστού

Όχι συχνές ($\geq 1/1000$, $< 1/100$): κνησμός

4.9 Υπερδοσολογία

Μετά την ενστάλαξη οφθαλμικών σταγόνων epinastine hydrochloride 0,3% 3 φορές ημερησίως (ποσότητα που αντιστοιχεί στο 9πλάσιο της συνιστώμενης ημερήσιας δόσης) παρατηρήθηκε αναστρέψιμη μύση, χωρίς επίδραση στην οπτική οξύτητα ή σε άλλες οφθαλμικές παραμέτρους.

Το φιαλίδιο των 5 ml του Relestat περιέχει 2,5 mg epinastine hydrochloride. Η κυκλοφορούσα σε δισκίο μορφή χορηγείται σε δόση έως και 20 mg epinastine hydrochloride άπαξ ημερησίως, επομένως, δεν αναμένεται δηλητηρίαση μετά την από του στόματος λήψη του οφθαλμικού διαλύματος, ακόμη και μετά την κατάποση ολόκληρου του περιεχομένου του φιαλιδίου.

Δεν αναφέρθηκε καμία περίπτωση υπερδοσολογίας.

5. ΦΑΡΜΑΚΟΛΟΓΙΚΕΣ ΙΔΙΟΤΗΤΕΣ

5.1 Φαρμακοδυναμικές ιδιότητες

Φαρμακοθεραπευτική κατηγορία: Οφθαλμικά: Αποσυμφορητικά και Αντιαλλεργικά: Άλλα αντιαλλεργικά, Κωδικός ATC: S01G X10

Η epinastine είναι ένας τοπικά ενεργός, άμεσος ανταγωνιστής των H_1 υποδοχέων. Η epinastine παρουσιάζει υψηλή δεσμευτική συγγένεια προς τους H_1 υποδοχείς ισταμίνης και 400 φορές χαμηλότερη δεσμευτική συγγένεια προς τους H_2 υποδοχείς ισταμίνης. Η epinastine παρουσιάζει

ακόμη συγγένεια προς τους α_1 -, α_2 - και 5-HT₂ υποδοχείς. Παρουσιάζει χαμηλή συγγένεια προς τις χολινεργικές, ντοπαμινεργικές και πολλές άλλες θέσεις υποδοχέων. Η erinastine δε διαπερνά τον αιματοεγκεφαλικό φραγμό και, επομένως, δεν προκαλεί ανεπιθύμητες ενέργειες στο κεντρικό νευρικό σύστημα, π.χ. δεν έχει κατασταλτική δράση.

Μετά την τοπική χορήγηση σε ζώα, η erinastine παρουσίασε αντιισταμινική δράση, ρυθμιστική δράση στη συσσωρευση φλεγμονωδών κυττάρων και σταθεροποιητική δράση στα μαστοκύτταρα.

Σε μελέτες πρόκλησης με αλλεργιογόνα σε ανθρώπους, η erinastine περιόρισε τα οφθαλμικά συμπτώματα έπειτα από πρόκληση με οφθαλμικά αντιγόνα. Η διάρκεια της επίδρασης ήταν τουλάχιστον 8 ώρες.

5.2 Φαρμακοκινητικές ιδιότητες

Μετά την εφαρμογή μιας σταγόνας Relestat σε κάθε οφθαλμό δύο φορές ημερησίως επιτυγχάνεται κατά μέσο όρο μέγιστη συγκέντρωση πλάσματος 0,042 ng/ml μετά από δύο περίπου ώρες. Η erinastine έχει όγκο κατανομής 417 λίτρων και συνδέεται σε ποσοστό 64% με πρωτεΐνες του πλάσματος. Η κάθαρσή της είναι 928 ml/λεπτό και η τελική ημιπερίοδος ζωής απομάκρυνσης από το πλάσμα είναι περίπου 8 ώρες. Ποσοστό μικρότερο του 10% μεταβολίζεται. Η erinastine αποβάλλεται κυρίως αμετάβλητη από τους νεφρούς. Η απομάκρυνση από τα νεφρά γίνεται κυρίως μέσω ενεργούς σωληναριακής έκκρισης.

Προκλινικές *in vitro* και *in vivo* μελέτες δείχνουν ότι η erinastine στα κουνέλια και τους πιθήκους, ενώνεται με τη μελανίνη και συσσωρεύεται στους οφθαλμικούς ιστούς που περιέχουν χρωστική. Δεδομένα *in vitro* δείχνουν ότι η ένωση με τη μελανίνη είναι περιορισμένη και αναστρέψιμη.

5.3 Προκλινικά δεδομένα για την ασφάλεια

Τα μη κλινικά δεδομένα δεν αποκαλύπτουν ιδιαίτερο κίνδυνο για τον άνθρωπο με βάση τις συμβατικές μελέτες φαρμακολογικής ασφάλειας, τοξικότητας επαναλαμβανόμενων δόσεων, γονοτοξικότητας, ενδεχόμενης καρκινογόνου δράσης, τοξικότητας στην αναπαραγωγική ικανότητα.

6. ΦΑΡΜΑΚΕΥΤΙΚΕΣ ΠΛΗΡΟΦΟΡΙΕΣ

6.1 Κατάλογος εκδόχων

Benzalkonium chloride,
Disodium edetate,
Sodium chloride,
Sodium dihydrogen phosphate dihydrate,
Sodium hydroxide/hydrochloric acid,
Κεκαθαρισμένο ύδωρ

6.2 Ασυμβατότητες

Δεν εφαρμόζεται.

6.3 Διάρκεια ζωής

2 χρόνια.

Μετά το άνοιγμα: 4 εβδομάδες.

6.4 Ιδιαίτερες προφυλάξεις κατά την φύλαξη του προϊόντος

Το φιαλίδιο να φυλάσσεται στον εξωτερικό περιέκτη για να προστατεύεται από το φως.

Μη φυλάσσετε σε θερμοκρασία μεγαλύτερη των 25°C.

6.5 Φύση και συστατικά του περιέκτη

Φιαλίδιο πολυαιθυλενίου των 5 ml με λευκό βιδωτό πώμα από πολυστυρένιο και ακίδα για το άνοιγμα του φιαλιδίου.

6.6 Ιδιαίτερες προφυλάξεις απόρριψης

Καμία ειδική υποχρέωση.

Κάθε μη χρησιμοποιηθέν προϊόν ή υπόλειμμα πρέπει να απορριφθεί σύμφωνα με τις κατά τόπους ισχύουσες σχετικές διατάξεις.

7. ΚΑΤΟΧΟΣ ΤΗΣ ΑΔΕΙΑΣ ΚΥΚΛΟΦΟΡΙΑΣ

Allergan Pharmaceuticals Ireland
Castlebar Road
Westport
Co. Mayo
Ιρλανδία

Αντιπρόσωπος στην Ελλάδα:
NEXUS MEDICALS A.E.
Λεωφ. Μαρκοπούλου-Σουνίου
190 03 Μαρκόπουλο Αττικής
Τηλ. 229 90 41 350

8. ΑΡΙΘΜΟΣ(ΟΙ) ΑΔΕΙΑΣ ΚΥΚΛΟΦΟΡΙΑΣ

32717/08/19-03-2009

9. ΗΜΕΡΟΜΗΝΙΑ ΠΡΩΤΗΣ ΕΓΚΡΙΣΗΣ / ΑΝΑΝΕΩΣΗΣ ΤΗΣ ΑΔΕΙΑΣ

09/08/2003 / 12 Σεπτεμβρίου 2008

10. ΗΜΕΡΟΜΗΝΙΑ ΑΝΑΘΕΩΡΗΣΗΣ ΤΟΥ ΚΕΙΜΕΝΟΥ

09/2008