

## KISA ÜRÜN BİLGİSİ

### 1. BEŞERİ TIBBİ ÜRÜNÜN ADI

RELESTAT® 0.5 mg/ml göz damlası

### 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 çalışmalarında 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<sup>®</sup>, 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<sup>®</sup>'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<sup>®</sup> 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<sup>®</sup> günlük dozunun 100 katından daha fazladır. Ayrıca epinastinin insandaki metabolizması minimaldir (<%10). Bu nedenle doz ayarlaması gerekmediği düşünülmektedir.

**Böbrek yetmezliği:**

RELESTAT<sup>®</sup> 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  $\geq 12$  olan çocuklardaki güvenlilik ve etkililik, klinik çalışmalarda kanıtlanmıştır. RELESTAT<sup>®</sup>, ergenlerde (yaşı 12 ve üzeri olan) erişkinlerdekiyle aynı dozajda kullanılabilir.

RELESTAT<sup>®</sup>'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).

**Geriatrik popülasyon:**

Yaşlı kişilerde RELESTAT<sup>®</sup> 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<sup>®</sup>, 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<sup>®</sup> uygulamadan önce kontakt lensleri çıkarmaları ve RELESTAT<sup>®</sup> damlattıktan sonra kontakt lensleri takmak için en az 15 dakika beklemleri konusunda bilgilendirilmelidir. Kontakt lens takılı iken RELESTAT<sup>®</sup> 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 embriyonel/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**

Epınastın sıçan sütüne geçmektedir, ancak epınastının insan sütüne geçip geçmediđi bilinmemektedir. Deneyim bulunmaması nedeniyle emziren kadınlara verilirken dikkatli olunmalıdır.

### **Üreme yeteneđi /Fertilite**

Epınastının insanda üreme yeteneđi/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. Çođu gözle ilgili ve hafiftir. En yaygın istenmeyen etki gözde yanmadır (genelde hafif); diđer 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  $\leq 1/10$ ); yaygın olmayan ( $\geq 1/1.000$  ila  $\leq 1/100$ ); seyrek ( $\geq 1/10.000$  ila  $\leq 1/1.000$ ); çok seyrek ( $\leq 1/10.000$ ), 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 kuruluđu, göz pruriti, görme bozukluđu, artan lakrimasyon\*, göz ağrısı\*

#### **Solunum, göğüs hastalıkları ve mediastinal hastalıkları**

Yaygın olmayan: Astım, nazal iritasyon, rinit

#### **Gastrointestinal hastalıklar**

Yaygın olmayan: Disguzi

\*Artan lakrimasyon ve göz ağrısı, RELESTAT®'ın pazarlama sonrası kullanımında tanımlanmıştır.

### **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. Hiç bir doz aşımı olayı bildirilmemiştir.

## **5. FARMAKOLOJİK ÖZELLİKLERİ**

### **5.1. Farmakodinamik özellikler**

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

#### Etki mekanizması:

Epinastin, topikal olarak aktif, direkt bir H<sub>1</sub>-reseptör antagonistidir. Epinastinin, histamin H<sub>1</sub>-reseptörüne karşı yüksek bir bağlanma afinitesi ve histamin H<sub>2</sub>-reseptörüne karşı 400 kat daha düşük bir afinitesi vardır. Ayrıca, epinastin  $\alpha_1$ -,  $\alpha_2$ - ve 5-HT<sub>2</sub>-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®'in 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  $\geq 12$  olan hastalarda güvenlilik 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 dağılıma 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 salgılama yoluyla.

## **5.3. Klinik öncesi güvenlilik verileri**

Klinik olmayan çalışmalar, güvenlilik, farmakoloji, tekrarlanan doz toksisitesi, genotoksisite, 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.  
Şişe, ilk açılışını takiben 4 hafta sonra atılmalıdır.  
Şişeyi kutusunda ve ışıktan koruyarak saklayınız.

### **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 Atıkları Kontrolü Yönetmeliği"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  
34398 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**