

- Código: 71903BR12A
- DWN: 0235301
- Dimensões: 125 x 600 mm
- Laetus: 230
- Escala 100%

Nº DE CORES: 01 COR

PMS
Black U



ALLERGAN

Relestat®

cloridrato de
epinastina 0,05%

FORMA FARMACÊUTICA, VIA DE ADMINISTRAÇÃO E APRESENTAÇÃO
Solução Oftálmica

Via de administração tópica ocular
Frasco plástico conta-gotas contendo 5ml ou 10ml de solução oftálmica estéril.

USO ADULTO E PEDIÁTRICO (acima de 3 anos)

COMPOSIÇÃO
SOLUÇÃO OFTÁLMICA

Cada ml (32 gotas) contém 0,5mg* de cloridrato de epinastina

Veículo: cloreto de benzalcônio, fosfato monobásico de sódio diidratado, cloreto de sódio, edetato dissódico, hidróxido de sódio, ácido clorídrico e água purificada q.s.p.
(* equivalente a 0,44 mg de epinastina)

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

AÇÃO DO MEDICAMENTO

Relestat® é um colírio com propriedades antialérgicas. Após a aplicação, o colírio começa a agir rapidamente, atingindo pico máximo de ação dentro de uma a duas horas. Seus efeitos se mantêm por oito horas, de modo que a administração duas vezes ao dia é suficiente para controlar a alergia nos olhos.

INDICAÇÕES DO MEDICAMENTO

Relestat® é um colírio indicado para o tratamento e prevenção dos sintomas de irritação e coceira nos olhos, que caracterizam a conjuntivite alérgica sazonal.

RISCOS DO MEDICAMENTO

Contra-indicações

Relestat® não pode ser usado em pessoas com alergia a qualquer dos componentes da fórmula.

Advertências/ Precauções

Você deve prestar atenção ao aplicar as gotas do colírio nos olhos e não encostar a ponta do frasco nos olhos ou ao redor dos olhos, nem em nenhuma outra superfície externa. O manuseio errado pode contaminar o colírio e causar infecções nos olhos. Procure imediatamente o seu médico para receber orientação adequada, se tiver algum traumatismo ou infecção.

Usuários de lentes de contato

Tire as lentes antes de aplicar Relestat® e aguarde pelo menos 10-15 minutos para recolocá-las. **Interferência na capacidade de dirigir veículos e operar máquinas**

A aplicação do colírio em geral não causa alterações da visão. Caso ocorra leve borramento de visão logo após a aplicação, recomenda-se aguardar até que a visão retorne ao normal antes de dirigir veículos ou operar máquinas.

Pacientes idosos

Não foram observadas diferenças de eficácia e segurança entre pacientes idosos e de outras faixas etárias, de modo que não há recomendações especiais quanto ao uso em idosos.

Uso em crianças

A eficácia e segurança de Relestat® foi estudada em pacientes pediátricos com idade superior a 3 anos.

Este medicamento é contra-indicado na faixa etária de 0 a 3 anos.

Mulheres grávidas ou que estejam amamentando

Não foram realizados estudos sobre o uso de Relestat® em pacientes grávidas ou que estejam amamentando.

Não deve ser utilizado durante a gravidez e a amamentação, exceto sob orientação médica. Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista se ocorrer gravidez ou se iniciar a amamentação durante o uso deste medicamento.

Interações medicamentosas

Não são previstas interações entre a epinastina e outras drogas em humanos.

Não foram realizados estudos específicos sobre interações entre a epinastina e outras substâncias. Não são conhecidas incompatibilidades.

Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista o aparecimento de reações indesejáveis.

Informe ao seu médico ou cirurgião-dentista se você está fazendo uso de algum outro medicamento.

Não use medicamento sem o conhecimento do seu médico. Pode ser perigoso para a sua saúde.

MODO DE USO:

Relestat® é uma solução límpida incolor.

- Você deve usar este medicamento exclusivamente nos olhos.
- Antes de utilizar o medicamento, confira o nome no rótulo, para não haver enganos. Não utilize Relestat® caso haja sinais de violação e/ou danificações do frasco.
- A solução já vem pronta para uso. Não encoste a ponta do frasco nos olhos, nos dedos e nem em outra superfície qualquer, para evitar a contaminação do frasco e do colírio.
- Você deve aplicar o número de gotas da dose recomendada pelo seu médico em um ou ambos os olhos. A dose usual é de 1 gota aplicada no(s) olho(s) afetado(s), duas vezes ao dia.
- Instile a dose recomendada dentro do olho, no saco conjuntival, evitando tocar a ponta do frasco nos tecidos oculares.
- A duração do tratamento deve ser estabelecida pelo seu médico.
- Se você usa lentes de contato gelatinosas ou hidrofílicas, tire as lentes antes de aplicar Relestat®. Aguarde pelo menos 10-15 minutos para recolocar as lentes após a aplicação do colírio.
- Se você for utilizar Relestat® concomitantemente com outros colírios, aguarde um intervalo de 5 minutos entre a aplicação de cada medicamento.
- Feche bem o frasco depois de usar.

Siga a orientação de seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.

Não interrompa o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Não use o medicamento com o prazo de validade vencido. Antes de usar observe o aspecto do medicamento.

REAÇÕES ADVERSAS

Assim como qualquer medicamento, podem ocorrer reações indesejáveis. Nos estudos clínicos realizados com Relestat® a maioria das reações indesejáveis foi transitória e não apresentou gravidade exigindo a interrupção do tratamento. As reações oculares mais freqüentes foram: manifestações de irritação local após a aplicação, como ardor nos olhos e visão turva leve e passageira. Outras reações possíveis são: olhos vermelhos, inchaço, olhos secos, aumento de sensibilidade, intolerância à luz e coceira, entre outras. Foram relatadas também, raramente, reações gerais como: dor de cabeça, asma, irritação nasal, rinite, boca seca, alteração do paladar e coceira na pele, entre outras.

Avise o seu médico se aparecerem reações desagradáveis.

ATENÇÃO: Este produto é um novo medicamento e, embora as pesquisas tenham indicado eficácia e segurança aceitáveis para comercialização, podem ocorrer efeitos indesejáveis não conhecidos. Se isto ocorrer, o médico responsável deve ser comunicado.

CONDUTA EM CASO DE SUPERDOSE

Não foram relatados casos de superdose com Relestat® (cloridrato de epinastina) solução oftálmica em humanos. É pouco provável a ocorrência de superdosagem já que um frasco de 5 ml de Relestat® contém 2,2 mg, que é uma quantidade de epinastina muito menor que a dose contida nos comprimidos de epinastina administrados por via oral. Portanto não é provável a ocorrência de intoxicação após ingestão oral, mesmo se todo o conteúdo do frasco for ingerido.

CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO E USO

Relestat® não requer condições especiais para armazenamento, antes ou depois de aberto, deve ser mantido em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C).

O prazo de validade encontra-se impresso na embalagem externa. Não use medicamento com prazo de validade vencido.

Este medicamento, depois de aberto, somente poderá ser consumido em 30 dias.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

1. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Farmacodinâmica

Relestat®, solução oftálmica, apresenta como princípio ativo o cloridrato de epinastina, que é uma substância com potente atividade antialérgica. É um antagonista direto dos receptores H₁ com elevada afinidade de ligação para os receptores H₁ e afinidade 400 vezes mais baixa para os receptores H₂ da histamina. Além disso, apresenta também afinidade para os receptores α₁-, α₂- e HT₂. Sua afinidade para os receptores colinérgicos, dopaminérgicos e vários outros, é baixa. Além da atividade anti-histamínica, a epinastina apresenta um efeito sobre as células inflamatórias, inibindo a degranulação dos mastócitos e reduzindo o acúmulo de neutrófilos inflamatórios; apresenta uma atividade estabilizadora sobre os mastócitos, efeito este atribuído à inibição da incorporação de cálcio nos mastócitos. A epinastina não atravessa a barreira hemoliquórica e, portanto não induz o aparecimento de efeitos secundários no sistema nervoso central, isto é, não é sedativa. Estudos experimentais mostraram que a epinastina não apresenta propriedades pró-arritmicas, já que não produz efeitos eletrofisiológicos ao nível do intervalo QT, mesmo em doses até três mil vezes superiores à dose preconizada para uso tópico oftálmico e que não influencia a função renal. A epinastina não induziu taquifilaxia em tratamentos contínuos por até seis semanas, e foi bem tolerada.

Após administração oral em humanos, a epinastina apresentou efeitos anti-histamínicos e antialérgicos na reação de rubor e urticária induzidos por histamina, bem como no broncoespasmo induzido por histamina e antígeno. O cloridrato de epinastina exerce apenas pequenos efeitos anticolinérgicos, mesmo, com uma dose única oral de 100mg. A função psicomotora não foi afetada por doses orais únicas de até 40 mg.

Farmacocinética

A cinética ocular e distribuição de epinastina marcada radiativamente (¹⁴C) foram estudadas após aplicação tópica em coelhos albinos e não albinos. Os tecidos com maiores níveis de radioatividade foram observados na córnea, conjuntiva, membrana nictitante, esclerótica, corpo ciliar da íris e coróide, sendo a radioatividade indiscutivelmente mais baixa no humor aquoso, retina, cristalino, humor vítreo e plasma.

Nessas estruturas o T_{max} experimental foi de 0,5 horas, exceto para o humor aquoso no qual foi de 1 hora, e corpo ciliar, cristalino e coróide que foi de 4 horas. Após administração única ocular em coelhos, a biodisponibilidade absoluta da epinastina na circulação sistêmica é de aproximadamente 5%. A concentração plasmática máxima em coelhos após administração de dose única de 50 µl (0,3%) é de 5 ng/ml e ocorre dentro de 5 minutos após a dose. A absorção sistêmica provavelmente ocorre através da via trabecular.

Em humanos, após administração ocular da solução oftálmica a 0,05%, a concentração sistêmica de epinastina é menor que 1ng/ml. Após administração sistêmica em ratos, a epinastina e seus metabólitos atravessaram a barreira placentária produzindo exposição fetal. A epinastina marcada radiativamente também foi excretada no leite.

A ligação às proteínas plasmáticas é da ordem de 64% em humanos na concentração de 20 ng/ml. O volume de distribuição no estado de equilíbrio foi de 417,3l.

O metabolismo em humanos é mínimo porque a epinastina inalterada foi o principal componente encontrado na urina (81% da dose total). A meia vida de eliminação plasmática terminal foi de cerca de 8 horas após administração oral e intravenosa em humanos. A depuração sistêmica e renal foi de 55,7 e 30-32 l/hora respectivamente, indicando que a excreção renal é a principal via de eliminação. A farmacocinética da epinastina é linear dentro de uma variação de dose oral de 10 a 40 mg/dia.

Carcinogenicidade e Mutagenicidade

Os dados dos estudos pré-clínicos mostraram que não existem riscos específicos para o uso em humanos, com base nos estudos convencionais de segurança, farmacologia, toxicidade de doses repetidas, genotoxicidade, potencial carcinogênico e toxicidade reprodutiva.

Os estudos de mutagenicidade evidenciaram uma resposta negativa nos testes de Ames / *Salmonella* e em estudos atogenéticos em linfócitos humanos. A epinastina foi negativa nos outros estudos *in vitro* de determinação uvrA em *E. coli* WP2, na avaliação de transformação celular em células de embrião de hamster sírio, e foi negativa nos estudos *in vivo* e *in vitro* (avaliação da síntese de DNA não planejada em hepatócitos de ratos). A epinastina foi negativa nos estudos citogenéticos *in vivo* de avaliação micronuclear em camundongos, e avaliação citogenética da medula óssea em hamster chinês.

Um estudo de 18 meses ou 2 anos de administração da epinastina por via oral em ratos ou camundongos, mostrou que a epinastina não é carcinogênica na dose de 40 mg/kg/dia, que é 40 mil vezes maior do que a dose terapêutica ocular prevista para uso em humanos.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

O programa de desenvolvimento de Fases II e III incluiu estudos clínicos de modelo de alergia.

Ao todo foram realizados 13 estudos clínicos, sendo dois em voluntários sadios adultos; um em indivíduos pediátricos; dos restantes, em pacientes com conjuntivite alérgica sazonal, um foi estudo de provocação alérgica conjuntival, quatro foram realizados em câmara de provocação de Viena e cinco foram estudos ambientais de campo.

Ao todo foram estudados 710 indivíduos tratados com cloridrato de epinastina a 0,05% em solução oftálmica. Foram realizados estudos comparativos com placebo (veículo) e com a levocabastina, outro anti-histamínico de uso tópico ocular aprovado para o tratamento da conjuntivite alérgica.

A solução de cloridrato de epinastina a 0,05% foi eficaz no tratamento dos sintomas da conjuntivite alérgica sazonal, sendo que a concentração escolhida proporcionou o melhor equilíbrio entre eficácia e tolerabilidade. A análise em separado dos sintomas de conjuntivite alérgica mostrou que a epinastina 0,05% (n=118) foi superior ao veículo (n=62) e não inferior a levocabastina 0,05% (n=118) na redução do escore do pior prurido do dia (p<0,05) e que tanto a epinastina quanto a levocabastina reduziram a hiperemia ocular (p=0,126). Em um estudo a epinastina (n=168) se mostrou superior a levocabastina (n=85) na redução dos sintomas de prurido (p=0,048) e na soma dos escores de prurido, lacrimejamento e sensação de corpo estranho nos olhos (p=0,01) nos pacientes com conjuntivite alérgica durante as seis semanas de duração do estudo. De acordo com a avaliação de eficácia global feita pelo pesquisador, em um dos estudos, a epinastina (n=68) foi mais eficaz do que o placebo (n=264) [epinastina - 63% versus placebo - 44% (p<0,05)] e, em outro estudo, a epinastina (n=168) não foi inferior à levocabastina (n=85) [epinastina - 68% versus levocabastina - 60% (p=0,012)].

3. INDICAÇÕES

Tratamento e/ou prevenção de sintomas de conjuntivite alérgica sazonal.

Sentido de Leitura
Cód. Laetus nº 230

Sentido de Leitura
Cód. Laetus nº 230

- Código: 71903BR12A
- DWN: 0235301
- Dimensões: 125 x 600 mm
- Laetus: 230
- Escala 100%

Nº DE CORES: 01 COR

PMS
Black U



4. CONTRA-INDICAÇÕES

Conhecida hipersensibilidade a algum dos componentes do produto.

5. MODO DE USAR E CUIDADOS DE CONSERVAÇÃO DEPOIS DE ABERTO

Condições de conservação: manter em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C).

Este medicamento, depois de aberto, somente poderá ser consumido em 30 dias.

Manuseio e aplicação: a solução já vem pronta para uso. Para evitar contaminação, não encostar a ponta do frasco nos olhos, nos dedos e nem em outra superfície qualquer. Aplicar o número de gotas da dose recomendada em um ou ambos os olhos. Relestat® não deve ser aplicado durante o uso de lentes de contato, pois o cloreto de benzalcônio presente na fórmula pode ser absorvido pelas lentes de contato hidrofílicas. Os pacientes devem ser instruídos a aguardar pelo menos 10-15 minutos para recolocar as lentes após a administração do colírio. Se Relestat® for utilizado concomitantemente com outros medicamentos de aplicação tópica ocular, os produtos devem ser administrados com intervalos de pelo menos 5 minutos entre as aplicações.

Via de administração: tópica oftálmica.

6. POSOLOGIA

Dose recomendada para pacientes pediátricos, adultos e idosos: 1 gota no saco conjuntival do olho afetado 2 vezes ao dia, ou a critério médico. O tratamento deve ser mantido até desaparecimento completo dos sintomas, ou durante o período de exposição (até que a estação alérgica tenha passado ou até que a exposição ao agente alérgico tenha terminado). Não há experiência com o uso de Relestat® por mais de oito semanas.

7. ADVERTÊNCIAS

Informação aos usuários de lentes de contato

As lentes de contato devem ser retiradas antes da instilação de Relestat®, e podem ser recolocadas depois de 10-15 minutos após a administração do colírio.

Quando mais de um colírio estiver sendo utilizado pelo paciente, deve ser respeitado o intervalo de pelo menos cinco minutos entre a administração dos medicamentos.

Operar máquinas e dirigir automóvel

Com base no perfil farmacodinâmico, no relato de reações adversas e estudos psicométricos específicos, verificou-se que a epinastina não influenciou, ou apenas apresentou influência desprezível na capacidade de dirigir e operar máquinas. Entretanto, pacientes que apresentem a visão embaçada após aplicação do colírio Relestat® (cloridrato de epinastina) não devem dirigir ou lidar com máquinas até que sua visão esteja normalizada.

Gestação e lactação

Não foram realizados estudos clínicos controlados com Relestat® em mulheres durante a gestação. Os estudos em animais não indicaram efeitos maléficis diretos ou indiretos com relação à gestação, ao desenvolvimento embrionário e fetal, ao parto, ou ao desenvolvimento pós-natal. Entretanto, considerando que nem sempre os resultados dos estudos sobre reprodução em animais permitem prever a resposta em humanos, Relestat® somente deve ser utilizado durante a gestação se os benefícios justificarem os potenciais riscos para o feto.

Não se sabe se a epinastina é excretada pelo leite humano ou não. Considerando que muitas substâncias são excretadas no leite humano, recomenda-se cautela quando Relestat® for administrado a mulheres durante a lactação. Um estudo em ratas lactantes mostrou que a epinastina é excretada pelo leite. Embora não tenham sido evidenciados efeitos adversos nas crias dos animais tratados durante a lactação, Relestat® somente deve ser utilizado durante a lactação se os benefícios justificarem os potenciais riscos para o lactente.

8. USO EM IDOSOS, CRIANÇAS E OUTROS GRUPOS DE RISCO.

Uso em idosos: Não há recomendações especiais com relação ao uso de Relestat® (cloridrato de epinastina) solução oftálmica em pacientes idosos. O produto não foi estudado especificamente em pacientes com idade superior a 65 anos, porém, a segurança sistêmica da epinastina em comprimidos para administração oral, nas doses de 10mg a 20mg uma vez ao dia, foi avaliada em mais de 1500 pacientes com idade >65 anos. Não foi observada diferença na incidência das reações adversas em comparação com indivíduos mais jovens. A dose de 10mg de epinastina em comprimidos é mais de 100 vezes maior do que a dose diária preconizada para o Relestat®, solução oftálmica. Portanto a dose para indivíduos idosos deve ser a mesma preconizada para adultos mais jovens.

Uso pediátrico: A segurança e eficácia de Relestat® foi avaliada em 155 crianças entre 3 e 16 anos de idade. A administração da solução tópica de epinastina por até 8 semanas foi segura e bem tolerada. A segurança e eficácia de Relestat®, solução oftálmica, não foi estabelecida em crianças abaixo de 3 anos de idade. A segurança sistêmica da epinastina em comprimidos (10 ou 20 mg uma vez ao dia), foi avaliada em mais de 200 crianças com menos de 15 anos de idade. Não foi observada diferença na incidência de reações adversas relacionadas ao tratamento em comparação com adultos. A dose diária de epinastina de 10 mg em comprimidos é mais de 100 vezes maior que a dose diária de Relestat® (cloridrato de epinastina) solução oftálmica. Portanto a posologia de Relestat® solução oftálmica em crianças com mais de 3 anos de idade deve ser a mesma dos adultos.

Uso em pacientes com insuficiência renal ou hepática: Não há recomendações especiais com relação ao uso de Relestat® em pacientes com insuficiência renal e/ou hepática. O produto não foi estudado especificamente em pacientes com insuficiência renal e/ou hepática, porém, a segurança sistêmica da epinastina em comprimidos para administração oral, nas doses de 10mg a 20mg uma vez ao dia, foi avaliada em mais de 130 pacientes com insuficiência hepática, e, em mais de 60 pacientes com insuficiência renal. No grupo de indivíduos com insuficiência renal não foram observadas reações adversas; no grupo de indivíduos com insuficiência hepática, não foi observada diferença na incidência das reações adversas em comparação com indivíduos sem insuficiência hepática. A dose de 10mg de epinastina em comprimidos é mais de 100 vezes maior do que a dose diária preconizada para o Relestat® solução oftálmica. Além disso, o metabolismo da epinastina em humanos é mínimo (<10%). Portanto a posologia para indivíduos com insuficiência renal e/ou hepática deve ser a mesma preconizada para adultos sem insuficiência renal e/ou hepática.

9. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Não são previstas interações entre a epinastina e outras drogas em humanos uma vez que as concentrações sistêmicas de epinastina são extremamente baixas após administração tópica ocular. Além disso, a epinastina é excretada principalmente sob a forma inalterada em humanos indicando um baixo nível de metabolismo.

Não foram realizados estudos específicos sobre interações entre a epinastina e outras substâncias. Não são conhecidas incompatibilidades.

10. REAÇÕES ADVERSAS A MEDICAMENTOS

Em indivíduos que participaram de estudos clínicos controlados, duplo-cegos, a incidência de eventos adversos relacionados ao tratamento com Relestat® foi menos de 10%. A maioria dos eventos adversos foi ocular e de intensidade leve; não foram observados eventos adversos graves. A reação mais comum foi sensação ocular de ardor e queimação que ocorreu em aproximadamente 5%. Outros eventos relacionados ao tratamento, com incidência menor que 1% foram:

Reações locais: prurido ocular, alterações da visão, hiperemia conjuntival, secagem ocular, edema conjuntival, reação ocular, alergia ocular, irritação ocular.

Reações gerais: cefaléia, alterações do paladar, asma, prurido cutâneo, irritação nasal e boca seca.

Sistema nervoso central: *Raramente* (>1/1000, <1/100): cefaléia.

Distúrbios oculares: *Comuns* (>1/100, <1/10): sensação de ardor. *Raramente* (> 1/1000, <1/100): conjuntivite alérgica, blefaroptose, edema conjuntival, hiperemia conjuntival, olhos secos, irritação, prurido, aumento de sensibilidade, fotofobia, distúrbios visuais.

Distúrbios respiratórios, torácicos e do mediastino: *Raramente* (> 1/1000, <1/100): asma, irritação nasal, rinite.

Distúrbios gastrintestinais: *Raramente* (> 1/1000, <1/100): boca seca, alteração do paladar.

Distúrbios da pele e subcutâneos: *Raramente* (> 1/1000, <1/100): prurido.

11. SUPERDOSE

Após instilação de epinastina 0,3% em solução oftálmica três vezes ao dia, que corresponde a 9 vezes a dose diária recomendada para Relestat® (cloridrato de epinastina) solução oftálmica, foi observada miose, sem influência sobre a acuidade visual ou outros parâmetros oculares. Não há relatos de superdose decorrente de uso tópico da solução de epinastina a 0,05%. É pouco provável a ocorrência de superdosagem já que um frasco de 5 ml de Relestat® solução oftálmica contém 2,2 mg, que é uma quantidade de epinastina significativamente menor que a dose diária indicada para a epinastina administrada por via oral. Portanto não é provável a ocorrência de intoxicação após ingestão oral, mesmo se todo o conteúdo do frasco for ingerido.

12. ARMAZENAGEM

Relestat® não requer condições especiais para armazenamento, antes ou depois de aberto, deve ser mantido em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C).

DIZERES LEGAIS

Reg. ANVISA/MS - 1.0147.0163
Farm. Resp.: Dra. Flávia Regina Pegorer
CRF-SP nº 18.150

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Nº de lote e data de fabricação:
vide cartucho.



 **ALLERGAN**

Qualidade e Tradição a Serviço da Oftalmologia

ALLERGAN PRODUTOS FARMACÊUTICOS LTDA.
Av. Guarulhos, 3.272 - CEP 07030-000
Guarulhos - SP - CNPJ nº 43.426.626/0009-24
Indústria Brasileira

Serviço de Atendimento ao Consumidor:
0800-14-4077 - Discagem Direta Gratuita

® Marca Registrada
Licenciado pela Boehringer Ingelheim Int.