FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

Relestat, 0,5 mg/ml, colirio en solución.

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Un ml de colirio en solución contiene 0,5 mg de hidrocloruro de epinastina (equivalente a 0,436 mg de epinastina)

Composición cualitativa y cuantitativa

Excipiente(s) con efecto conocido

Cloruro de benzalconio 0,1 mg/ml y fosfato 4,75 mg/ml

Para consultar la lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Colirio en solución.
Solución incolora estéril transparente.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

Tratamiento de los síntomas de la conjuntivitis alérgica estacional.

4.2. Posología y forma de administración

Posología

La dosis recomendada para adultos es una gota instilada en cada ojo afectado dos veces al día, durante el período sintomático.

No se tiene experiencia en estudios clínicos en cuanto al uso de Relestat durante más de 8 semanas.

Pacientes de edad avanzada

Relestat no se ha estudiado en pacientes de edad avanzada. Los datos de seguridad postcomercialización sobre la formulación en comprimido de hidrocloruro de epinastina (hasta 20 mg una vez al día) indican que no hay ningún problema de seguridad específico en pacientes de edad avanzada en comparación con los pacientes adultos. Por consiguiente, no se considera que sea necesario hacer ningún ajuste de la dosis.

Población pediátrica

La seguridad y eficacia en niños de 12 años o mayores ha sido establecida mediante estudios clínicos. Relestat puede ser usado en adolescentes (de 12 años o mayores) en la misma dosis que en adultos.

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

No se ha establecido la seguridad y eficacia de Relestat en niños menores de 3 años. No se dispone de datos. Los datos de la eficacia en niños de 3 a 12 años son limitados, descritos en la sección 5.1.

Pacientes con insuficiencia hepática

Relestat no se ha estudiado en pacientes con insuficiencia hepática. Los datos de seguridad postcomercialización de la formulación en comprimido de hidrocloruro de epinastina (hasta 20 mg una vez al día) indican que la incidencia de reacciones adversas fue mayor en este grupo que en los pacientes adultos sin insuficiencia hepática. La dosis diaria de un comprimido de hidrocloruro de epinastina de 10 mg es más de 100 veces superior que la dosis diaria con Relestat. Además, el metabolismo de la epinastina en los seres humanos es mínimo (<10%). Por consiguiente, no se considera que sea necesario hacer ningún ajuste de la dosis.

Pacientes con insuficiencia renal

Relestat no se ha estudiado en pacientes con insuficiencia renal. Los datos de seguridad postcomercialización de la formulación en comprimido de hidrocloruro de epinastina (hasta 20 mg una vez al día) indican que no hay ningún problema de seguridad específico en los pacientes con insuficiencia renal. Por consiguiente, no se considera que sea necesario hacer ningún ajuste de la dosis.

Forma de administración

Relestat es sólo para uso oftálmico tópico.

No tocar con el gotero ninguna superficie para evitar la contaminación del ojo o del colirio.

Si se está usando más de un fármaco tópico por vía oftálmica, las diferentes instilaciones se deberán espaciar al menos 10 minutos.

4.3. Contraindicaciones

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes incluidos en la sección 6.1.

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo

Relestat se utiliza para uso oftálmico tópico y no para uso oral o parenteral.

Excipientes con efecto conocido

Cloruro de benzalconio

El cloruro de benzalconio se usa comúnmente como conservante en productos oftálmicos y se ha notificado que en raras ocasiones causa queratopatía puntiforme y/o queratopatía ulcerativa tóxica.

El cloruro de benzalconio se puede absorber por las lentes de contacto blandas y puede alterar el color de las lentes de contacto. Se debe aconsejar a los pacientes que se retiren las lentes de contacto antes de usar este medicamento y que esperen 15 minutos antes de volver a colocarlas.

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

Se ha notificado que el cloruro de benzalconio puede causar irritación ocular, síntomas de ojo seco y puede afectar a la película lacrimal y a la superficie de la córnea. Debe utilizarse con precaución en pacientes con ojo seco y en pacientes en los que la córnea pueda estar afectada.

Se debe vigilar a los pacientes en caso de uso prolongado.

Fosfatos

Relestat contiene fosfatos. Se han notificado, de forma muy rara, casos de calcificación corneal asociados al uso de colirios que contienen fosfatos en algunos pacientes con afectación significativa de la córnea (ver sección 4.8).

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

No se han realizado estudios de interacciones
No cabe esperar interacciones medicamentosas en la especie humana debido a que las concentraciones sistémicas de epinastina son sumamente bajas después de la aplicación de la dosis ocular. Además, la epinastina se excreta principalmente inalterada en los seres humanos, indicando un metabolismo reducido.

4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia

Embarazo

Los datos obtenidos a partir de un número limitado (11) de mujeres embarazadas expuestas no muestran efectos adversos de la epinastina sobre el embarazo ni sobre la salud del feto/recién nacido. Hasta la fecha, no se dispone de otros datos epidemiológicos relevantes. Los estudios en animales no sugieren efectos perjudiciales directos ni indirectos con respecto al embarazo, el desarrollo embrionario/fetal, el parto o el desarrollo posnatal (ver sección 5.3).

Debe tenerse cuidado al prescribirse a mujeres embarazadas.

Lactancia

La epinastina se excreta en la leche materna de las ratas, pero no se sabe si se excreta en la leche humana. Debido a falta de experiencia, se deberá tener precaución al prescribir el producto a mujeres en período de lactancia.

Fertilidad

No existen datos adecuados sobre el uso de epinastina en la fertilidad en humanos.

4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

En base al perfil farmacodinámico, las reacciones adversas observadas y los estudios psicométricos específicos, la influencia de Relestat sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas es nula o insignificante.

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

Si aparece visión borrosa pasajera durante la instilación, el paciente debe esperar hasta que se aclare su visión antes de conducir o utilizar maquinaria.

4.8. Reacciones adversas

Resumen del perfil de seguridad

En los estudios clínicos, la incidencia global de reacciones adversas después de la aplicación de Relestat fue menor del 10%. No se presentaron reacciones adversas graves. La mayoría fueron oculares y leves. La reacción adversa más frecuente fue la sensación de ardor en el ojo (leve en la mayoría de los casos); todas las demás reacciones adversas no fueron frecuentes.

Tabla de reacciones adversas

Las reacciones adversas se presentan en orden decreciente de gravedad dentro de cada intervalo de frecuencia. Se ha utilizado la siguiente terminología para clasificar la frecuencia de las reacciones adversas: Muy frecuentes (≥1/10); Frecuentes (≥1/100 a <1/10); Poco frecuentes (≥1/1.000 a <1/100); Raras (≥1/10.000 a <1/1.000); Muy raras (<10.000), frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Se han notificado las siguientes reacciones adversas con epinastina:

Clasificación por órganos y sistemas	**Frecuencia**	**Reacción adversa**
Trastornos del sistema inmunológico	Desconocida	Reacción de hipersensibilidad, incluidos síntomas o signos de alergia ocular y reacciones alérgicas extraoculares, incluidos angioedema, erupción cutánea y enrojecimiento
Trastornos del Sistema nervioso	Poco frecuentes	Dolor de Cabeza
Trastornos oculares	Frecuentes	Sensación de quemazón, irritación ocular
	Poco frecuentes	Hiperemia conjuntival/ocular, exudación ocular, sequedad ocular, prurito ocular, alteración visual
	Desconocida	Aumento de la secreción lacrimal, dolor ocular, hinchazón ocular, edema palpebral
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	Poco frecuentes	Asma, irritación nasal, rinitis
Trastornos gastrointestinales	Poco frecuentes	Disgeusia

Población pediátrica

Se espera que la frecuencia, el tipo y la severidad de las reacciones adversas en pacientes adolescentes mayores de 12 años sean las mismas que en adultos.
La experiencia es limitada en niños de 3 a 12 años en cuanto a la frecuencia, el tipo y la severidad de los efectos adversos.

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

Reacciones adversas notificadas con colirios que contienen fosfato:
Se han notificado de forma muy rara casos de calcificación corneal asociados al uso de colirios que contienen fosfato en algunos pacientes con afectación significativa de la córnea (ver sección 4.4).

Notificación de sospechas de reacciones adversas
Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a adversas a través del Sistema Español de Farmacovigilancia de Medicamentos de Uso Humano: https://www.notificaRAM.es.

4.9. Sobredosis

Tras la instilación 3 veces al día del colirio de hidrocloruro de epinastina 0,3%, (corresponde a 9 veces la dosis diaria recomendada), se observó miosis reversible, sin influencia alguna sobre la agudeza visual u otros parámetros oculares.

El envase de 5 ml de Relestat contiene 2,5 mg de clorhidrato de epinastina. Se comercializa una formulación en comprimido a una dosis de una vez al día de hasta 20 mg de clorhidrato de epinastina, por consiguiente, no se espera que se manifieste intoxicación alguna tras la ingestión oral de la formulación oftálmica incluso si se ingiere el contenido completo del envase.

No se han descrito casos de sobredosis.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Oftalmológicos; Descongestionantes y Antialérgicos; Otros antialérgicos
Código ATC: S01GX10

Mecanismo de acción

La epinastina es un antagonista directo del receptor H_1, activo por vía tópica. La epinastina tiene una alta afinidad de unión por el receptor H_1 de la histamina y una afinidad 400 veces inferior por el receptor H_2 de la misma. La epinastina también posee afinidad por el receptor α_1, α_2 y el receptor 5-HT_2. Tiene baja afinidad por los receptores colinérgicos, dopaminérgicos y una variedad de otros receptores. La epinastina no atraviesa la barrera hematoencefálica y, por lo tanto, no induce efectos secundarios del sistema nervioso central, es decir, no es sedante.

Efectos farmacodinámicos

Tras la aplicación ocular tópica en animales, la epinastina mostró evidencia de actividad antihistamínica, un efecto modulador sobre la acumulación de las células inflamatorias, y actividad estabilizadora de los mastocitos.

En los estudios de provocación con alérgenos en seres humanos, la epinastina fue capaz de mejorar los síntomas oculares tras la exposición ocular a antígeno. La duración del efecto fue de 8 horas, como mínimo.

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

Población pediátrica

Un estudio de 6 semanas de duración, aleatorizado, doble ciego, controlado con vehículo (2:1) realizado en 96 niños asintomáticos desde el punto de vista ocular ocular de entre 3 y 12 años, demostró que Relestat fue bien tolerado y no mostró diferencias significativas entre los grupos respecto a ninguna variable de seguridad. Las reacciones relacionadas con el tratamiento fueron folículos conjuntivales (6,3% en pacientes tratados con epinastina y vehículo) e hiperemia conjuntival (1,6% en pacientes tratados con epinastina y ninguno en el grupo tratado con vehículo). La seguridad y eficacia en pacientes mayores de 12 años ha sido establecida mediante ensayos clínicos.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Absorción

Después de la administración de una gota de Relestat en cada ojo dos veces al día, se alcanza una concentración plasmática máxima promedio de 0,042 ng/ml después de unas dos horas.

Distribución

La epinastina tiene un volumen de distribución de 417 litros y se halla en un 64% unida a las proteínas plasmáticas.

Metabolismo o Biotransformación

Se metaboliza menos del 10%.

Eliminación

El aclaramiento es de 928 ml/min y la semivida de eliminación plasmática terminal es de unas 8 horas.

La epinastina se excreta principalmente inalterada por vía renal. La eliminación renal se produce principalmente mediante secreción tubular activa.

Los estudios preclínicos *in vitro* e *in vivo* demuestran que la epinastina se une a la melanina y se acumula en los tejidos oculares pigmentados de conejos y monos. Los datos i*n vitro* indican que la unión a la melanina es moderada y reversible.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Los datos de los estudios preclínicos no muestran riesgos especiales para los seres humanos según los estudios convencionales de farmacología de seguridad, toxicidad a dosis repetidas, genotoxicidad, potencial carcinogénico, toxicidad para la reproducción y el desarrollo.

6 . DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Cloruro de benzalconio
Edetato disódico
Cloruro sódico
Dihidrógeno fosfato de sodio dihidrato

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios

Hidróxido sódico/ácido clorhídrico (ajuste del pH)
Agua purificada

6.2. Incompatibilidades

No procede.

6.3. Periodo de validez

2 años.

Después de la primera apertura: 4 semanas.

6.4. Precauciones especiales de conservación

No conservar a temperatura superior a 25ºC.
Conservar el envase en el embalaje exterior para protegerlo de la luz.

6.5. Naturaleza y contenido del envase

Envase de polietileno de 10 ml con tapón de rosca de poliestireno de color blanco. El volumen de llenado es de 5 ml.

6.6. Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

Ninguna especial
La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con la normativa local.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

AbbVie Spain, S.L.U.
Avenida de Burgos 91,
28050 Madrid
España

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

65.574

9. FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN/ RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN

Fecha de la primera autorización: 18/10/2002
Fecha de la última renovación: 18/10/2007

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Abril 2025

MINISTERIO DE SANIDAD, POLITICA SOCIAL E IGUALDAD
Agencia española de medicamentos y productos sanitarios