

TRALER® LC

BEPOTASTINA BESILATO 1,5%



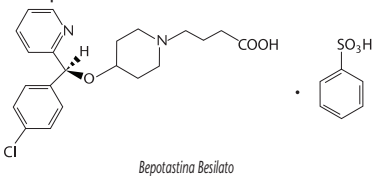
SOLUCIÓN OFTÁLMICA ESTÉRIL

Industria Argentina
VENTA BAJO RECETA

Fórmula:

Cada 100 ml de solución oftálmica contiene:
Bepotastina besilato 1,5 g
Cloruro de sodio 0,6 g; Fosfato monosódico dihidrato 0,1 g;
Hidróxido de sodio 10 N c.s.p. pH 6,3 - 7,3; Agua purificada c.s.p.
100 ml.

Estructura química:



Bepotastina Besilato

C₂₁H₂₅ClN₂O₃ · C₆H₆O₃S
547,1 g/mol

Acción terapéutica:

TRALER® LC es una solución estéril que contiene Bepotastina besilato, un antihistamínico e inhibidor de histamina desde los mastocitos para administración tópica ocular.
Clasificación ATC: S01 GX

Indicaciones:

TRALER® LC (Bepotastina besilato 1,5% solución oftálmica) está indicado para el tratamiento del prurito ocular asociado con los signos y síntomas de la conjuntivitis alérgica.
TRALER® LC difiere de los colirios multidosis habituales en que es libre de conservante (LC). Los conservantes pueden provocar serias reacciones alérgicas e inflamatorias en los ojos con el uso reiterado o a largo plazo en condiciones crónicas. Los colirios sin conservantes, en cambio, permiten preservar la integridad de la superficie ocular. Por esta razón, TRALER® LC está recomendado en pacientes con ojos sensibles.

Características farmacológicas:

Mecanismo de acción:

TRALER® LC (Bepotastina besilato 1,5% solución oftálmica) es un antagonista directo del receptor H₁ e inhibidor de la liberación de histamina desde los mastocitos, tópicamente activo, para la administración tópica ocular.

La Bepotastina es un antagonista del receptor H₁ de histamina muy selectivo. Ensayos *in vitro* de unión con radioligandos han demostrado que la Bepotastina posee una gran afinidad con el receptor histamínico H₁ (IC₅₀ = 101 nM) y carece de actividad significativa para histamina H₃, adrenérgicos, dopamina D_{2L}, serotonina (5-HT₂), muscarínicos y receptores de benzodiazepina.

Farmacocinética:

Absorción: Se evaluó el grado de exposición sistémica a la Bepotastina siguiendo la administración tópica oftálmica de Bepotastina besilato 1% y 1,5% en 12 adultos sanos. Luego de una gota de 1% o 1,5% de Bepotastina besilato solución oftálmica en ambos ojos cuatro veces por día (QID) durante siete días, las concentraciones plasmáticas de Bepotastina alcanzaron su nivel más alto en aproximadamente una o dos horas después de la instilación. La concentración máxima en plasma fue 5,1 ± 2,5 ng/mL y 7,3 ± 1,9 ng/mL, respectivamente, para Bepotastina 1% y 1,5%. Las concentraciones en plasma 24 horas después de la instilación fueron el límite más bajo cuantificable (2 ng/mL) en 11/12 sujetos en los dos grupos de dosis.

Distribución: La Bepotastina se une a las proteínas del plasma, aproximadamente, en un 55%, independientemente de la concentración de Bepotastina.

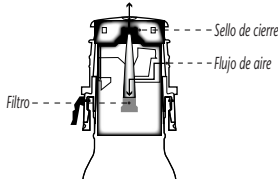
Metabolismo: Estudios *in vitro* de metabolismo con microsomas de hígado humano demostraron que la Bepotastina es mínimamente metabolizada por isoenzimas CYP450. Estudios *in vitro* demostraron que la Bepotastina besilato no inhibe el metabolismo del sustrato de citocromo P450 sustrato a través de la inhibición de CYP3A4,

CYP2C9 y CYP2C19. El efecto de la Bepotastina besilato en el metabolismo de sustratos de CYP1A2, CYP2C8 y CYP2D6 no fue estudiado. La Bepotastina besilato tiene un bajo potencial para la interacción de droga a través de CYP3A4, CYP2C9 y CYP2C19.

Excreción: La principal ruta de eliminación de la Bepotastina besilato es la excreción urinaria (aproximadamente entre 75-90% es excretada sin cambios en la orina).

LIBRE DE CONSERVANTE - NUEVO ENVASE OFTÁLMICO LC

TRALER® LC se presenta en frasco gotero OSD (Opthalmic Squeeze Dispenser, Preservative-Free Multidose System), especialmente diseñado para formulaciones oftálmicas Libres de Conservantes (LC), el cual consiste en un sistema de filtración que impide la contaminación del contenido del envase al filtrar el aire que ingresa al frasco durante su uso. Al presionar envase, la presión obliga al sello de cierre a abrirse, permitiendo la formación de la gota. Al mismo tiempo, el flujo de aire para equilibrar presiones dentro del sistema es forzado a pasar a través de un filtro estéril (0,2 µm), frenando el ingreso de partículas y microorganismos, evitando así la contaminación del producto y prolongando la vida útil del mismo una vez abierto el envase.



Este novedoso sistema permite la dosificación de fórmulas oftálmicas sin conservantes, evitando la irritación y citotoxicidad que puede ser producida por el uso prolongado de los conservantes tradicionales, representando significativos beneficios para los pacientes que utilizan reiteradamente el producto.

Estudios clínicos

La eficacia clínica de la solución oftálmica de Bepotastina besilato al 1,5% fue evaluada en dos estudios de provocación alérgica conjuntival (237 pacientes), resultando ésta más efectiva que su vehículo para aliviar la picazón ocular, inducida por provocación alérgica conjuntival, con dosis administradas a los 15 minutos y a las 8 horas posteriores a la provocación alérgica conjuntival. La seguridad fue evaluada en un estudio clínico aleatorio de 861 sujetos durante un periodo de 6 semanas.

Varios estudios controlados realizados en voluntarios sanos y pacientes, a corto y largo plazo, han demostrado que los colirios sin conservante son mejor tolerados por la superficie corneconjuntival que los colirios con conservante, resultando menos citotóxicos con respecto al epitelio corneal, menos dañinos con respecto a la película lagrimal y, además, reducen de forma significativa los síntomas referidos por los pacientes, proporcionando una mayor comodidad de uso.

Posología y Modo de administración:

Vía de administración: USO TÓPICO OFTÁLMICO.

Instilar una gota de TRALER® LC en el(los) ojo(s) afectado(s) dos veces por día. Si están siendo utilizados otros productos oftálmicos tópicos, TRALER® LC y los otros productos deben ser administrados con un intervalo mínimo de 10 minutos entre una aplicación y la otra.

Forma de administración: Inclinar el frasco gotero hacia abajo, presionarlo, y administrar la dosis en la conjuntiva.

Contraindicaciones:

TRALER® LC está contraindicado en aquellos pacientes con hipersensibilidad a la Bepotastina o a alguno de los componentes de la fórmula.

Advertencias:

No inyectar. No ingerir. Producto destinado únicamente para uso oftálmico. No utilizar el medicamento después de la fecha de vencimiento indicada en el envase.

Utilizar el producto sólo si el envase se halla intacto.

Mantener el frasco gotero cuidadosamente cerrado. En caso de presentarse dolor en el(los) ojo(s) tratado(s), irritación o cambios en la visión, si la condición empeora o persiste más de 72 horas, suspender el uso del producto y consultar a su médico.

Prevención de la contaminación de los productos tópicos oftálmicos

El producto es envasado en condiciones estériles. Para prevenir la contaminación del pico del frasco gotero, se debe evitar tocar con el envase párpados, pestañas y zonas adyacentes del ojo, o cualquier otra superficie. El manipuleo incorrecto del frasco gotero puede contaminarlo; y luego causar serios daños oculares, con la subsecuente disminución de la visión. El frasco debe cerrarse inmediatamente después de cada instilación.

Uso de lentes de contacto

Los pacientes deben ser advertidos de no utilizar lentes de contacto si tienen enrojecimiento ocular. TRALER® LC no debe utilizarse para el tratamiento de la irritación provocada por las lentes de contacto. Si bien el producto no altera las lentes de contacto, para evitar modificar la farmacocinética del producto, se recomienda remover las lentes antes de la instilación y esperar 15 minutos para volver a colocarlas.

Precauciones:

Carcinogénesis - Mutagénesis - Trastornos de la fertilidad

Fueron llevados a cabo estudios de largo plazo en ratones y ratas para evaluar el potencial carcinogénico de la Bepotastina besilato. Este fármaco no indujo significativamente la formación de neoplasmas en ratones que recibieron una dosis nominal de hasta 200 mg/kg/día por 21 meses o en ratas que recibieron una dosis nominal de hasta 97 mg/kg/día durante 24 meses. Estas dosis representan exposiciones sistémicas aproximadas a 350 y 200 veces la alcan-

zada con el uso tópico ocular. No se observaron efectos adversos en test carcinogénicos para la Bepotastina besilato basado en dosis nominales de 18,7 y 19,9 mg/kg/día en ratones y de 9,6 a 9,8 mg/kg/día en ratas (representando márgenes de exposición de aproximadamente 60 y 20 veces la exposición sistémica recomendada para el uso tópico humano). No hubo evidencia de genotoxicidad en el test de Ames, en ensayos de aberración cromosómica, en hepatocitos de ratón (en síntesis de ADN no programadas), o en el ensayo de micronúcleo de ratones. Cuando la Bepotastina oral fue administrada a ratas machos y hembras en dosis de hasta 1000 mg/kg/día, hubo una leve reducción en el índice de fertilidad y sobrevivencia de fetos. No se observó infertilidad en ratas a las que se les suministró 200 mg/kg/día de Bepotastina besilato oral (aproximadamente 3300 veces la concentración sistémica recomendada para el uso tópico ocular en humanos).

Embarazo

Se han realizado estudios teratogénicos en animales. La Bepotastina besilato no resultó teratogénica en ratas durante el período de organogénesis y el desarrollo fetal en dosis orales de hasta 200 mg/kg/día (representando una concentración sistémica de aproximadamente 3300 veces la dosis ocular máxima recomendada en humanos), pero sí mostró algún potencial a causar anomalías óseas con 1000 mg/kg/día. No se han observado efectos teratogénicos en conejos con dosis orales de hasta 500 mg/kg/día administrados durante el período de organogénesis y el desarrollo fetal (>13000 veces la dosis en humanos sobre una base en mg/kg). Se ha observado evidencia de infertilidad en ratas que recibieron dosis orales de 1000 mg/kg/día de Bepotastina besilato, sin embargo, no se observó evidencia de infertilidad en ratas a las que se les dio 200 mg/kg/día (aproximadamente 3300 veces la dosis máxima ocular recomendada en humanos). La concentración de Bepotastina besilato radiomarcada fue similar en el hígado fetal y en el plasma sanguíneo materno luego de una única dosis oral de 3 mg/kg. La concentración en otros tejidos fetales fue de un tercio a un décimo la concentración en el plasma de la sangre materna. Se observó un aumento en la mortalidad fetal y una disminución en el crecimiento y el desarrollo de las crías nacidas de ratas que recibieron dosis orales de 1000 mg/kg/día durante los períodos perinatal y de lactancia. No se observaron efectos en ratas tratadas con 100 mg/kg/día.

No existen estudios adecuados y bien controlados de Bepotastina besilato en mujeres embarazadas. Debido a que los estudios de reproducción en animales no son siempre predictivos acerca de la respuesta humana, TRALER® LC (Bepotastina besilato 1,5% solución oftálmica) debería ser usado en el embarazo sólo si el beneficio potencial para la madre justifica el riesgo potencial para el feto.

Lactancia

Luego de una única dosis oral de 3 mg/kg de Bepotastina besilato radiomarcada en ratas amamantando, 11 días después del parto, la concentración máxima de droga detectada en la leche fue de 0,40 µg eq/mL 1 hora después de la administración; la concentración fue menor que los límites de detección a las 48 horas de la administración. La concentración de Bepotastina en la leche fue mayor que la concentración en el plasma de la sangre materna en cada momento de la evaluación. Se desconoce si la Bepotastina besilato es excretada en la leche humana. Debe tenerse especial cuidado al administrar TRALER® LC (Bepotastina besilato 1,5% solución oftálmica) a mujeres en período de lactancia.

Empleo en pediatría

La seguridad y eficacia de TRALER® LC (Bepotastina besilato 1,5% solución oftálmica) no han sido establecidas en pacientes pediátricos menores de 2 años de edad. La eficacia en pacientes pediátricos menores de 10 años de edad fue extrapolada de ensayos clínicos realizados en pacientes pediátricos mayores de 10 años y en adultos.

Uso geriátrico

En general, no se han observado diferencias en la seguridad o en la eficacia entre pacientes ancianos y jóvenes.

Reacciones adversas:

La reacción adversa reportada más frecuentemente y que ocurrió en aproximadamente un 25% de pacientes, fue alteración del gusto o disgeusia leve después de la instilación. Otras reacciones adversas que ocurrieron en 2-5% de los sujetos fueron irritación ocular, dolor de cabeza y nasofaringitis.

Sobredosificación:

No existe información disponible de sobredosificación en humanos. En el caso de sobredosificación con TRALER® LC solución oftálmica se debe instituir tratamiento sintomático.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los siguientes Centros de toxicología: Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666 / 2247. Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777.

Presentación:

Frasco gotero conteniendo 5 ml de solución oftálmica estéril.

INFORMACIÓN PARA EL PACIENTE

"Lea con cuidado esta información antes de utilizar este medicamento. Conserve este prospecto ya que puede tener que volver a leerlo. Si tiene alguna duda, consulte a su médico o farmacéutico. Este medicamento se le ha recetado sólo a usted; no lo administre (o recomiende) a otras personas, aunque tenga los mismos síntomas, ya que puede perjudicarlas. Esta información no reemplaza el hablar con su médico acerca de su enfermedad o el tratamiento. Este medicamento debe ser indicado por su médico y prescripto bajo una receta médica. Si considera que alguno de los efectos adversos que sufre es grave o si aparece cualquier efecto no deseado no mencionado en este prospecto, informe a su médico o a su farmacéutico."

¿QUÉ ES Y PARA QUE SE USA TRALER® LC?

TRALER® LC es una solución estéril que contiene Bepotastina besilato, un antialérgico para administración tópica ocular, indicado para el tratamiento de la picazón ocular asociada con los signos y síntomas de la conjuntivitis alérgica.

TRALER® LC difiere de los colirios multidosis habituales en que es libre de conservante (LC). Los conservantes pueden provocar serias reacciones alérgicas e inflamatorias en los ojos con el uso reiterado o a largo plazo en condiciones crónicas. Los colirios sin conservantes, en cambio, permiten preservar la superficie ocular. Por esta razón, TRALER® LC está recomendado en pacientes con ojos sensibles.

CONSULTE A SU MÉDICO ANTES DE USAR TRALER® LC

- Si Ud. es alérgico a alguno de los componentes de la fórmula.

- Si Ud. está embarazada o en período de lactancia.

- Si un niño recibirá el tratamiento.

- Si posee irritación ocular provocada por el uso de las lentes de contacto.

¿QUÉ PERSONAS NO DEBEN USAR TRALER® LC?

Pacientes alérgicos a alguno de los componentes de la fórmula.

USO APROPIADO DEL MEDICAMENTO:

Para uso tópico oftálmico solamente.

¿CUÁNTO, CUÁNDO Y CÓMO SE USA TRALER® LC?

Instilar una gota de TRALER® LC en el(los) ojo(s) afectado(s) dos veces por día. Si están siendo utilizados otros productos oftálmicos tópicos, TRALER® LC y los otros productos deben ser administrados con un intervalo mínimo de 10 minutos entre una aplicación y la otra.

Forma de administración: Inclinar el frasco gotero hacia abajo, presionarlo, y administrar la dosis en la conjuntiva.

No inyectar. No ingerir. Producto destinado únicamente para uso oftálmico.

No utilizar el medicamento después de la fecha de vencimiento indicada en el envase.

Utilizar el producto sólo si el envase se halla intacto.

Mantener el frasco gotero cuidadosamente cerrado.

En caso de presentarse dolor en el(los) ojo(s) tratado(s), irritación o cambios en la visión, si la condición empeora o persiste más de 72 horas, suspender el uso del producto y consultar a su médico.

PREVENCIÓN DE LA CONTAMINACIÓN

El producto es envasado en condiciones estériles. Se debe manipular correctamente el pico del frasco gotero evitando el contacto con el ojo, pestañas y zonas adyacentes o cualquier otra superficie, con el fin de evitar la contaminación con bacterias que comúnmente provocan infecciones oculares. La utilización de productos contaminados puede causar serios daños oculares con la subsecuente disminución de la visión. Cerrar el frasco gotero inmediatamente después del uso.

INFORMACIÓN ADICIONAL

No utilice TRALER® LC para el tratamiento de la irritación provocada por las lentes de contacto. Se recomienda removerlas antes de la instilación del producto y esperar 15 minutos para volver a colocarlas.

POSIBLES EFECTOS ADVERSOS

La reacción adversa más frecuentemente reportada fue alteración leve del gusto después de la instilación. Otras reacciones adversas que ocurrieron con menor frecuencia fueron irritación ocular, dolor de cabeza e inflamación de la nasofaringe.

RECORDATORIO

Este medicamento ha sido prescripto sólo para su problema médico actual. No lo recomiende a otras personas.

Condiciones de conservación:

Conservar a temperatura entre 15 y 25°C.

Una vez abierto debe usarse dentro de los 3 (tres) meses.

Mantener los medicamentos fuera del alcance de los niños.

Este medicamento debe ser usado exclusivamente bajo prescripción y vigilancia médica y no puede repetirse sin nueva receta médica.

Medicamento autorizado por el Ministerio de Salud. Certificado N° 56.542.

Director Técnico:

Victor D. Colombari, Farmacéutico.

Fecha de última revisión: Agosto / 2019.

Información al Consumidor

© 0800-333-7636

LABORATORIOS POEN S.A.U.

Bermúdez 1004 - C1407BDR Buenos Aires, Argentina

www.poen.com.ar



4006702840
665
C.V. 30