

ALKET®**EPINASTINA HCl 0,05%****Poen****SOLUCIÓN OFTÁLMICA ESTÉRIL**Industria Argentina
VENTA BAJO RECETA**Fórmula:**Cada 100 ml de solución contiene:
Epinastina clorhidrato 0,050 g (equivalente a Epinastina 0,044 g)
Cloruro de sodio 0,460 g; Fosfato monosódico dihidrato 0,420 g; Fosfato disódico anhidro 0,567 g; EDTA disódico dihidrato 0,010 g; Hidroxipropilmetilcelulosa 0,200 g; Cloruro de benzalconio 0,010 g; Agua purificada c.s.p.**Acción terapéutica:**

ALKET® (epinastina HCl solución oftálmica 0,05%) es un antihistamínico e inhibidor de la liberación de histamina desde los mastocitos, para la administración ocular tópica.

Indicaciones:

ALKET® solución oftálmica está indicada para la prevención del prurito ocular asociado a la conjuntivitis alérgica.

Características farmacológicas/Propiedades:**Acción farmacológica:**

ALKET® (epinastina HCl solución oftálmica 0,05%) es una solución estéril isotónica transparente que contiene epinastina HCl, un antihistamínico e inhibidor de la liberación de histamina desde los mastocitos, para la administración ocular tópica.

Farmacología clínica:Epinastina es un activo tópico, antagonista de los receptores H1 e inhibidor de la liberación de histamina desde los mastocitos. Epinastina es selectivo para los receptores H1 de la histamina y posee afinidad hacia los receptores H2. Epinastina también tiene afinidad hacia los receptores $\alpha 1$, $\alpha 2$ y 5-HT2. Epinastina no penetra en la barrera sanguínea cerebral y, además, no ha demostrado provocar efectos secundarios sobre el sistema nervioso central.**Estudios clínicos:** Epinastina HCl 0,05% demostró ser significativamente superior como medio para mejorar el prurito ocular en pacientes con conjuntivitis alérgica en los estudios clínicos realizados utilizando dos modelos diferentes:

1. Estimulación de los antígenos de la conjuntiva: donde los pacientes recibieron la dosis y luego fueron instilados con un antígeno en el fornix conjuntival inferior.
2. Estudios ambientales de campo: donde los pacientes recibieron la dosis y fueron examinados durante el período alérgico en su ambiente natural. Los resultados demostraron una rápida acción de la epinastina HCl 0,05% entre los 3 a 5 minutos después de la estimulación de los antígenos conjuntivales. La duración del efecto fue de 8 horas, haciendo aconsejable la aplicación dos veces por día. Este régimen de administración demostró ser seguro y efectivo por hasta ocho semanas, sin evidencias de taquifilaxis.

Farmacocinética:

Catorce pacientes con conjuntivitis alérgica fueron tratados con una gota de ALKET® en cada ojo, dos veces por día durante siete días. Al séptimo día el promedio máximo de la concentración de epinastina en plasma

de $0,040 \pm 0,014$ ng/ml fue alcanzado después de dos horas indicando una baja exposición sistémica. Mientras que estas concentraciones representan un aumento sobre aquellas obtenidas con una única dosis, los valores del área por debajo de la curva de los días 1 a 7 no variaron, lo que indica que la dosis múltiple no incrementa la absorción sistémica. Epinastina se une a las proteínas del plasma en un 64%. La eliminación sistémica total es 56L/hr aproximadamente y la vida media en plasma hasta la eliminación es de 12 hs aproximadamente. Epinastina se elimina principalmente sin alteración. Casi el 55% de la dosis intravenosa puede ser recuperada sin alteración en la orina con el 30% aproximado en las heces. Menos del 10% es metabolizado. La eliminación renal es vía secreción tubular.**Posología y Modo de administración:**

La dosis recomendada es de una gota en cada ojo, dos veces al día. El tratamiento puede continuarse durante todo el período de exposición (ej. la época de polinización o hasta terminarse las molestias alérgicas), aún cuando no se presenten síntomas.

Contraindicaciones:

ALKET® solución oftálmica está contraindicada en aquellos pacientes con hipersensibilidad a la epinastina o a alguno de los componentes de la fórmula.

Advertencias:

ALKET® es para uso tópico solamente. No debe inyectarse ni administrarse en forma oral.

Precauciones:**Carcinogénesis, Mutagénesis, Deterioro de la fertilidad**

En estudios carcinogénicos realizados durante 18 meses y dos años en ratones y ratas respectivamente, epinastina no fue cancerígeno en dosis superiores a 40 mg/kg (aproximadamente 30.000 veces superior a la dosis ocular máxima recomendada en humanos de 0,0014 mg/kg/día sobre una base de mg/kg, asumiendo una absorción del 100% en humanos y animales).

En cúmulos nuevamente sintetizados, epinastina fue negativa en la mutagénesis en los ensayos Ames/Salmonella y en ensayos in vitro de aberración cromosómica utilizando Linfocitos humanos. Se obtuvieron resultados positivos en las primeras acumulaciones de epinastina en dos estudios de aberración cromosómica in vitro realizados en 1980 con linfocitos periféricos humanos y con células V79, respectivamente. Epinastina fue negativa en dos estudios clastogénicos in vitro, incluyendo el ensayo en el micronúcleo de ratones y el ensayo de aberración cromosómica hamsters chinos. Epinastina también fue negativa en el ensayo de transformación de células utilizando células de embriones de hamster sirio, el ensayo de mutación en células V79/HGPRT de mamíferos, y en el ensayo in-vivo/in-vitro de síntesis no programada de DNA utilizando hepatocitos primarios de ratas.

Epinastina no tuvo efectos sobre la fertilidad de las ratas macho. Se observó la disminución en la fertilidad de las ratas hembra con dosis orales superiores a 90.000 veces la dosis ocular máxima recomendada para humanos.

Embarazo: Efectos teratogénicos:

En estudios embriofetales realizados en ratas preñadas, no se observaron efectos de toxicidad embriofetal con dosis orales de 150.000 veces la dosis ocular máxima recomendada para humanos. En estudios embriofetales realizados en conejas preñadas se observaron la resorción total y aborto con dosis orales de 55.000 veces la dosis ocular máxima recomendada para humanos. En ambos estudios no se notaron efectos teratogénicos inducidos por la droga. Epinastina redujo el aumento de peso de los cachorros de las ratas preñadas que recibieron la dosis oral, que era 90.000 veces la dosis ocular máxima recomendada para humanos.

Sin embargo, no existen estudios controlados adecuados en mujeres embarazadas. Debido a que los estudios sobre reproducción en animales no son predictivos acerca de la respuesta humana, ALKET® solución oftálmica sólo puede ser utilizada durante el embarazo cuando el beneficio potencial justifique el riesgo potencial para el feto.

Lactancia:

Un estudio realizado en ratas lactantes reveló la excreción de epinastina a

través de la leche. Se desconoce si la droga es excretada en la leche humana. Debido a que numerosas drogas son excretadas en la leche humana, debe tenerse especial cuidado con la administración de ALKET® solución oftálmica en mujeres en período de lactancia.

Uso pediátrico:

No han sido determinadas la seguridad y efectividad en pacientes pediátricos menores de 3 años.

Uso geriátrico:

No se observaron diferencias en cuanto a seguridad o efectividad entre pacientes ancianos y jóvenes.

Reacciones adversas:

Las reacciones adversas más frecuentes ocurren en un 1 a 10% de pacientes, que experimentan sensación de ardor en los ojos, foliculosis, hiperemia y prurito.

Las reacciones adversas no-oculares más frecuentes son infección (síntomas de resfrío e infecciones en las vías respiratorias superiores) en aproximadamente el 10% de los pacientes, y dolores de cabeza, rinitis, sinusitis, aumento de la tos y faringitis entre el 1 y 3% de los pacientes.

Algunos de estos hechos fueron similares a la patología en estudio.

Sobredosificación:

No existe información disponible de sobredosificación en humanos. En el caso de sobredosificación con ALKET® 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.

Información para el paciente:

Los pacientes deben ser advertidos de no utilizar lentes de contacto si tienen enrojecimiento ocular. ALKET® no debe utilizarse para el tratamiento de la irritación provocada por las lentes de contacto. El conservante de ALKET®, cloruro de benzalconio, puede ser absorbido por las lentes de contacto blandas. Las lentes de contacto deben ser removidas antes de la instilación de ALKET® y no pueden ser colocadas hasta diez minutos de la administración.

Se han informado queratitis bacterianas asociadas con el uso de productos oftálmicos tópicos multidosis. Esos envases habían sido contaminados inadvertidamente por los pacientes quienes, en muchos casos habían tenido enfermedades corneales concomitantes o una lesión de la superficie epitelial ocular. Los pacientes deben ser instruidos para manipular correctamente el pico del frasco gotero evitando el contacto con el ojo y estructuras adyacentes o cualquier otra superficie. Los pacientes deben ser informados que el manipuleo inapropiado del frasco gotero puede contaminarlo provocando infecciones oculares. La utilización de productos contaminados puede causar serios daños oculares con la subsecuente disminución de la visión. El envase debe conservarse cerrado cuando no se esté utilizando.

Presentación:

Frasco gotero con 5 ml de solución oftálmica estéril.

Condiciones de conservación:

Mantener a temperatura entre 15 y 25°C.

Una vez abierto el envase por primera vez, utilizarlo dentro de las 4 semanas.

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° S2.151.Director Técnico:
Victor D. Colombari, Farmacéutico.

Fecha de última revisión: Mayo / 2005.

Información al Consumidor
☎ 0800-333-7636LABORATORIOS POEN S.A.C.I.F.I.
Bermúdez 1004 - C1407BDR Buenos Aires, Argentina
www.poen.net.ar

289

4021901843
289
C.V. 1 - 22

| | | | | |
|--|---|--|---|---|
| | SURCAN S.R.L. Álvarez Thomas 198 3°A Buenos Aires - C1427CCO Tel/Fax: 4553-2422 disenografico@surcan.com.ar www.surcan.com.ar | Laboratorio/Laboratory: LABORATORIOS POEN | Tamaño/Size: ancho/wide: 150 mm alto/high: 180 mm | Fecha/Date: 10/NOV/09 Version N°: 2 |
| | | Producto/Product: ALKET Contenido/Content: SOLUCIÓN País/Country: ARGENTINA | N° Material: 4021901843 Pharmacode N°: 289 Código visual/Visual code: 1 - 22 | Guía de colores/Colours Guide Pantone Black C |
| | | Elemento/Item: PROSPECTO (FRENTE Y DORSO) | | Colores/Colours: 1 |
| | | | | |

289