

06/2006

# Epinastina (Relestat®)

## Otro antihistamínico tópico

**Clasificación del potencial terapéutico: Tipo C**  
*Nula o muy pequeña mejora terapéutica.*

### Indicaciones terapéuticas<sup>1</sup>

Tratamiento de los síntomas de la conjuntivitis alérgica estacional (CAE).

### Mecanismo de acción y farmacocinética<sup>1</sup>

La epinastina es un antagonista directo del receptor H<sub>1</sub> que posee también afinidad por los receptores  $\alpha_1$ ,  $\alpha_2$  y 5-HT<sub>2</sub>. Ejerce su actividad antialérgica modulando la actividad de células inflamatorias y estabilizando los mastocitos.

Tras la administración de una gota de epinastina 0,05% en cada ojo dos veces al día, la concentración sistémica es muy baja y no atraviesa la barrera hematoencefálica. Se metaboliza menos del 10% y la semivida de eliminación plasmática es de unas 8 horas, excretándose principalmente inalterada por vía urinaria.

La epinastina se une a la melanina. Los datos de estudios *in vitro* indican que es moderada y reversible.

### Posología y forma de administración<sup>1</sup>

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

No es necesario un ajuste posológico en pacientes ancianos, adolescentes (< 12 años) o con insuficiencia renal o hepática.

No se recomienda su administración en niños.

No se tiene experiencia en cuanto a su uso durante más de 8 semanas.

### Eficacia clínica

La epinastina se evaluó frente al placebo en un ensayo doble ciego en el que se midió el prurito y la hiperemia ocular en una

escala ascendente de 5 puntos (0=nulo, 1=leve, 2=moderado, 3=severo, 4=extremadamente severo) en 67 pacientes que habían recibido una dosis del fármaco 8 horas antes de la exposición al alérgeno. Se observó una mejoría tanto en la media del prurito ocular (0,92 frente a 1,86 del placebo  $p<0,001$ ) como en la media de la hiperemia conjuntival (1,37 frente a 1,93 del placebo  $p<0,001$ )<sup>2</sup>.

La eficacia comparativa de epinastina respecto a otros antihistamínicos administrados por vía oftálmica, ha sido evaluada en dos ensayos clínicos aleatorizados, doble ciego de 3 y 8 semanas de duración en un total de 394 pacientes con CAE<sup>3,4</sup>. Estos ensayos midieron, tal y como recomienda la EMEA, el prurito y la hiperemia ocular en la escala ascendente de 5 puntos<sup>5</sup>.

En un estudio<sup>3</sup> se evaluó la eficacia de epinastina frente a levocabastina medida en pacientes expuestos a alérgenos ambientales. Las diferencias en los resultados de la media del picor ocular diario y en la del prurito ocular no fueron significativas entre los dos tratamientos. El otro estudio<sup>4</sup> evaluó el control del prurito y la hiperemia conjuntival en pacientes que habían recibido olopatadina en un ojo y epinastina en el ojo contralateral en los cinco minutos previos a la exposición al alérgeno. Los resultados fueron favorables para olopatadina tanto en la diferencia entre las medias del prurito, medidas en la escala de 5 puntos, (-0,21  $p=0,049$  a los 5 minutos y -0,33  $p=0,005$  a los 7) como de la hiperemia conjuntival (-0,50 a los 10 minutos; -0,52 a los 15 minutos y -0,53 a los 20;  $p<0,001$  en todos los casos).

### Reacciones adversas

En los estudios clínicos<sup>2,3,4</sup>, que en ningún caso han sido de más de 8 semanas de duración, la incidencia global de reacciones farmacológicas adversas fue menor del 10% y no se presentaron reacciones adversas graves.

La calificación ha sido asignada conjuntamente por los Comités de Evaluación de Nuevos Medicamentos de Andalucía, Cataluña, País Vasco, Aragón y Navarra. La información que aquí se presenta es la disponible hasta el momento y es susceptible de modificaciones en función de los avances científicos que se produzcan. Se recuerda la gran importancia de notificar al Centro de Farmacovigilancia las sospechas de reacciones adversas de los nuevos medicamentos.

Las reacciones adversas notificadas agrupadas por frecuencia fueron<sup>1</sup>:

- **Frecuentes (1%-10%):** sensación de ardor.
- **Poco frecuentes (0,1%-1%):** conjuntivitis alérgica, blefaroptosis, edema conjuntival, hiperemia conjuntival, exudación ocular, sequedad ocular, irritación, prurito, aumento de sensibilidad, fotofobia, alteración visual, cefalea, asma, sequedad oral, alteración del sabor, irritación nasal, rinitis, prurito.

### Contraindicaciones<sup>1</sup>

Hipersensibilidad a epinastina o a cualquiera de sus excipientes.

### Precauciones especiales de empleo<sup>1</sup>

Para evitar la contaminación el gotero no debe tocar ninguna superficie.

Si se está usando más de un fármaco por vía oftálmica, las instilaciones deberán espaciarse con un intervalo de al menos 10 minutos.

El cloruro de benzalconio (conservante) en raras ocasiones ha provocado queratopatía punctata y/o queratopatía ulcerativa tóxica. Además puede decolorar las lentes de contacto blandas, por ello, una vez administrado es necesario esperar entre 10 y 15 minutos antes de ponerse las lentes de contacto.

No se debe administrar el producto con las lentes de contacto puestas.

Debe administrarse con precaución durante el embarazo y la lactancia.

### Interacciones<sup>1</sup>

Debido a las concentraciones sistémicas tan bajas no cabe esperar interacciones medicamentosas.

### Conclusiones

La CAE es frecuente y habitualmente remite de forma espontánea. El tratamiento se basa en identificar y evitar, cuando sea posible, la exposición a los alérgenos causantes. El uso de lágrimas artificiales y la aplicación de compresas frías pueden proporcionar un alivio sintomático<sup>6</sup>. El tratamiento farmacológico se basa en el uso de antihistamínicos tópicos o de estabilizadores de la membrana de los mastocitos. No se dispone de evidencia sobre la existencia de diferencias significativas entre estos medicamentos en cuanto a su eficacia o seguridad en el tratamiento de la CAE.

A la vista de la información disponible, no parece que la epinastina aporte ventaja alguna frente a los medicamentos de uso tópico ya disponibles para el tratamiento de la CAE.

### Bibliografía

1. Ficha técnica de epinastina: Relestat®. Laboratorio Allergan Pharmaceuticals Ireland, SA. Septiembre 2003. 2. Abelson MB, Gomes P, Crampton HJ, Schiffman RM, Bradford RR, Whitcup SM. Efficacy and tolerability of ophthalmic epinastine assessed using the conjunctival antigen challenge model in patients with a history of allergic conjunctivitis. Clin Ther. 2004 Jan;26(1):35-4 3. Whitcup SM, Bradford R, Lue J, Schiffman RM, Abelson MB. Efficacy and tolerability of ophthalmic epinastine: a randomized, double-masked, parallel-group, active- and vehicle-controlled environmental trial in patients with seasonal allergic conjunctivitis. Clin Ther. 2004 Jan;26(1):29-34. 4. Lanier BQ, Finegold I, D'Arienzo P, Granet D, Epstein AB, Ledgerwood GL. Clinical efficacy of olopatadine vs epinastine ophthalmic solution in the conjunctival allergen challenge model. Curr Med Res Opin. 2004 Aug;20(8):1227-33. 5. EMEA. Committee for medicinal products for human use (CHMP). Guideline on the clinical development of medicinal products for the treatment of allergic rhinoconjunctivitis. Accedido 17 de febrero de 2006. Disponible en: [http://www.emea.eu.int/pdfs/human/ewp/245\\_502en.pdf](http://www.emea.eu.int/pdfs/human/ewp/245_502en.pdf) 6. Vilaseca Canals J et al, coordinador. Guía Terapéutica en Atención Primaria Basada en la evidencia. 2ª ed. Barcelona: SEMFYC, 2004. p226

### Especialidades comercializadas con epinastina

NOMBRE REGISTRADO	PRESENTACIÓN	PRECIO
Relestat®*	0,5 mg/ml (5 ml)	10,71 €

PRINCIPIO ACTIVO	PVP (envase)	COSTE DIARIO*
Epinastina	10,71 €	0,43 €
Levocabastina	6,81 €	0,34 €
Azelastina	8,38 €	0,28 €
Olopatadina	11,07 €	0,37 €
Ketotifeno	9,57/11,63 €	0,34/1,16 €
Cromoglicato	3,09 €	0,06 €
Nedrocomilo	6,28 €	0,19 €

\* El precio tratamiento/día se ha calculado para la dosis recomendada de los principios activos y a partir de la aproximación de que un ml contiene 20 gotas.