Relugoli

Relugolix INN

COMPOSITION

Relugoli Tablet: Each film coated tablet contains Relugolix INN 120 mg.

PHARMACOLOGICAL INFORMATION

Therapeutic Class: Gonadotropin-releasing hormone antagonists.

PHARMACOLOGICAL ACTIONS

Mechanism of Action

Relugolix is a nonpeptide GnRH receptor antagonist that competitively binds to pituitary GnRH receptors, thereby, reducing the release of luteinizing hormone (LH) and follicle-stimulating hormone (FSH), and consequently testosterone.

Pharmacodynamics

Cardiac Electrophysiology

In a randomized, double-blind, placebo- and positive-controlled (open-label moxifloxacin), parallelgroup thorough QT/QTc study, no increase in mean QTc interval > 10 ms was identified after administration of single 60 or 360 mg doses of relugolix (0.2 or 1 times the recommended loading dose, respectively).

PHARMACOKINETICS

After administration of single doses ranging from 60 mg to 360 mg (0.17 to 1 times the recommended loading dose), the AUC from time zero extrapolated to infinity (AUC0-inf) and the maximum observed plasma concentration of relugolix increase approximately proportionally with dose. After administration of multiple 20 mg to 180 mg doses of relugolix once daily (0.17 to 1.5 times the recommended once daily dose), the AUCtau of relugolix increases approximately proportionally with dose and the Cmax increases greater than proportionally to dose. After administration of a single 360 mg loading dose in patients, the mean (± standard deviation [± SD]) of AUC_0-24 and Cmax of relugolix were 985 (± 742) ng.hr/mL and 215 (± 184) ng/mL, respectively. After administration of a 120 mg dose once daily in patients, the mean (± SD) of AUC0-24 and Cmax of relugolix at steady-state were 407 (± 168) ng.hr/mL and 70 (± 65) ng/mL, respectively. The accumulation of relugolix upon once daily administration is approximately 2-fold.

Absorption

Relugolix is a substrate for intestinal P-gp. The mean (CV%) absolute bioavailability of Relugolix is approximately 12% (62%). The median (range) Tmax of relugolix is 2.25 hours (0.5 to 5.0 hours).

Distribution

Plasma protein binding of relugolix is 68 to 71%, primarily to albumin and to a lesser extent to α1-acid glycoprotein. The mean blood-to-plasma ratio is 0.78.

Metabolism

Relugolix is metabolized primarily by CYP3A and to a lesser extent by CYP2C8 in vitro.

Elimination

The mean effective half-life of relugolix is 25 hours and the mean (CV%) terminal elimination half-life is 60.8 (11%) hours. The mean (CV%) total clearance of relugolix is 29.4 (15%) L/h and the renal clearance is 8 L/h.

Excretion

After oral administration of a single 80-mg radiolabeled dose of relugolix, approximately 81% of the radioactivity was recovered in feces (4.2% as unchanged) and 4.1% in urine (2.2% as unchanged).

THERAPEUTIC INDICATIONS

Relugolix is indicated for the treatment of patients with:

• Advanced Prostate cancer

DOSAGE & ADMINISTRATION

Recommended Dosage

The recommended dose of Relugolix is 120 mg administered orally once daily. Relugolix can be taken with or without food

Swallow tablets or tablets whole. Do not chew, dissolve, or open the tablets. Do not cut, crush, or chew the tablets

Dose Modification

Dose Modification for Use with P-gp Inhibitors:

Avoid co-administration of Relugolix with oral P-gp inhibitors. If co-administration is unavoidable, take Relugolix first and separate dosing by at least 6 hours. Treatment with Relugolix may be interrupted for up to two weeks if a short course of treatment with a P-gp inhibitor is required.

Dose Modification for Use with Combined P-gp and Strong CYP3A Inducers:

Avoid co-administration of Relugolix with combined P-gp and strong CYP3A inducers. If co-administration is unavoidable, increase the Relugolix dose to 240 mg once daily. After discontinuation of the combined P-gp and strong CYP3A inducer, resume the recommended Relugolix dose of 120 mg once daily and Clinical Pharmacology.

CONTRAINDICATIONS

None.

SIDE EFFECTS

• Hot flush

• Musculoskeletal pain

• Fatigue

• Diarrhea

• Constipation

USE IN SPECIFIC POPULATIONS

Pregnancy

Based on findings in animals and mechanism of action, Relugolix can cause fetal harm and loss of pregnancy when administered to a pregnant female. There are no human data on the use of Relugolix in pregnant females to inform the drug-associated risk. In an animal reproduction study, oral administration of relugolix to pregnant rabbits during organogenesis caused embryo-fetal lethality at maternal exposures that were 0.3 times the human exposure at the recommended dose of 120 mg daily based on AUC (see Data). Advise patients of the potential risk to the fetus.

Lactation

The safety and efficacy of Relugolix at the recommended dose of 120 mg daily have not been established in females. There are no data on the presence of relugolix in human milk, the effects on the breastfed child, or the effects on milk production. Relugolix and/or its metabolites were present in milk of lactating rats

Contraception

Males

Based on findings in animals and mechanism of action, advise male patients with female partners of reproductive potential to use effective contraception during treatment and for 2 weeks after the last dose of Relugolix.

Infertility

Males

Based on findings in animals and mechanism of action, Relugolix may impair fertility in males of reproductive potential.

Pediatric Use

The safety and efficacy of Relugolix in pediatric patients have not been established.

Geriatric Use

Of the 622 patients who received Relugolix in the HERO study, 81% were 65 years of age or older, while 35% were 75 years of age or older. No overall differences in safety or effectiveness were observed between these subjects and younger subjects. There was no clinically relevant impact of age on the pharmacokinetics of Relugolix or testosterone response based on population pharmacokinetic and pharmacokinetic/pharmacodynamic analyses in men 45 to 91 years of age.

DRUG INTERACTIONS

Combined P-gp and Moderate CYP3A Inhibitor:

Co-administration with erythromycin (P-gp and moderate CYP3A inhibitor) increased the AUC and Cmax of relugolix by 6.2-fold.

Combined P-gp and Strong CYP3A Inducer:

Co-administration with rifampin (P-gp and strong CYP3A inducer) decreased the AUC and Cmax of relugolix by 55% and 23%, respectively.

Cytochrome P450 (CYP) Enzymes:

Relugolix is a substrate of CYP3A and CYP2C8. Relugolix is not an inhibitor of CYP1A2, CYP2B6, CYP2C8, CYP2C9, CYP2C19, CYP2D6, or CYP3A4. Relugolix is an inducer of CYP3A and CYP2B6, but not an inducer of CYP1A2.

Transporter Systems:

Relugolix is a substrate of P-gp, but not a substrate of BCRP. Relugolix is an inhibitor of BCRP and P-gp, but not an inhibitor of OATP1B1, OATP1B3, OAT1, OAT3, OCT2, MATE1, MATE2-K, or BSEP

PHARMACEUTICAL INFORMATION

Storage

Store below 30^0C and dry place, away from light and moisture. Keep out of the reach of children.

PACKING

Relugoli Tablet: Each Commercial box contains 30 tablets in Alu-Alu blister pack.

Manufactured By
BEACON®
Pharmaceuticals Limited
Bhaluka, Mymensingh, Bangladesh

LF44001

রেলুগোলি

রেলুগোলিক্স আইএনএন

উপাদানঃ

রেলুগোলি ট্যাবলেটঃ প্রতিটি ফিল্ম কোটেড ট্যাবলেটে আছে রেলুগোলিক্স আইএনএন ১২০ মিগ্রা।

নির্দেশনাঃ

রেলুগোলিক্স এডভান্সড প্রোস্টেট ক্যান্সার রোগীদের জন্য নির্দেশিত।

সেবনমাত্রা ও বিধিঃ

প্রতিদিন একবার ১২০ মিগ্রা রেলুগোলিক্স মুখে সেবন করতে হবে। রেলুগোলিক্স খাদ্য গ্রহণের সঙ্গে বা ব্যতীত সেবন করা যায়।

নির্দিষ্ট জনসংখ্যার উপর ব্যবহারঃ

গর্ভাবস্থায় ব্যবহারঃ

রেলুগোলিক্স নারীদের ক্ষেত্রে নির্দেশিত নয়। রেলুগোলিক্স গর্ভবতী নারীদের ক্ষেত্রে নির্দেশিত নয়।

স্তন্যদানকালীন সময়ে ব্যবহারঃ

মাতৃদুগ্ধে রেলুগোলিক্স উপস্থিতি, দুগ্ধ সেবনকারী শিশুর ওপর প্রভাব এবং মাতৃদুগ্ধ উৎপাদনের সক্ষমতার ব্যাপারে কোন তথ্য নেই। স্তন্যদানকালীন নারীদের ক্ষেত্রে রেলুগোলিক্স নির্দেশিত নয়।

পুরুষদের ক্ষেত্রে ব্যবহারঃ

প্রাণির ওপর পরীক্ষালব্ধ তথ্যের ভিত্তিতে রেলুগোলিক্স পুরুষের প্রজনন ক্ষমতার হানি করতে পারে। রেলুগোলিক্সের কার্যকরণ এবং প্রাণির ওপর পরীক্ষালব্ধ তথ্যের ভিত্তিতে, রেলুগোলিক্স সেবনকালে এবং রেলুগোলিক্সের সর্বশেষ ডোজের পরবর্তী তিন মাস পর্যন্ত পুরুষদের কার্যকরি গর্ভনিরোধ ব্যবহারের পরামর্শ দেয়া হয়।

শিশুদের ক্ষেত্রে ব্যবহারঃ

শিশু রোগীদের ক্ষেত্রে রেলুগোলিক্সের নিরাপদ ব্যবহার এখনও প্রতিষ্ঠিত হয়নি।

বয়স্কদের ক্ষেত্রে ব্যবহারঃ

রেলুগোলিক্সের ক্লিনিকাল পরীক্ষার ভিত্তিতে, বয়স্ক ও যুবকদের ক্ষেত্রে এর কার্যকারিতার সামগ্রিক পার্থক্য পরিলক্ষিত হয়নি।

প্রতিনির্দেশনা

নাই

পার্শ্বপ্রতিক্রিয়া

- শরীর জ্বালাপোড়া
- হাড় ও পেশিতে ব্যথা
- অবসাদগ্রস্ত
- ডায়রিয়া
- কোষ্ঠকাঠিন্য

সংরক্ষণঃ

30^0 সে. তাপমাত্রার নিচে, শুকনো স্থানে, আলো ও আর্দ্রতা থেকে দূরে রাখুন। সকল ওষুধ শিশুদের নাগালের বাইরে রাখুন।

সরবরাহঃ

রেলুগোলি ট্যাবলেটঃ প্রতিটি বাণিজ্যিক মোড়কে আছে ৩০ টি ট্যাবলেট অ্যালু-অ্যালু ব্লিস্টার প্যাকে।

প্রস্তুতকারক
বীকন ফার্মাসিউটিক্যালস্ লিমিটেড
ভালুকা, ময়মনসিংহ, বাংলাদেশ

বিস্তারিত ইংরেজী অংশে দেখুন