



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

AZELASTINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

OFTALMICA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Descongestivos y antialérgicos. Otros antialérgicos.
Código ATC: S01GX07.

3.1. Farmacodinamia

La azelastina es un derivado de la ftalazinona con actividad antagonista selectiva de los receptores H₁ de histamina. La evidencia experimental revela que, además de competir con la histamina por sus sitios de unión a los receptores H₁, inhibe su liberación y la de otros mediadores químicos (como: leucotrienos, factor activador de plaquetas y serotonina) involucrados en la respuesta alérgica.

3.2. Farmacocinética

Tras su aplicación oftálmica la azelastina genera una acción antihistamínica local a los 3 minutos que se mantiene por 8 horas. Se absorbe sistémicamente en cantidades mínimas y produce concentraciones séricas entre 0,02 y 0,25 ng/mL.

Cuando se administra por vía oral e intravenosa exhibe un volumen de distribución de 14,5 L/kg y se une a proteínas plasmáticas en un 88%. Se desconoce si difunde a la leche materna y si atraviesa la placenta. Se metaboliza parcialmente en el hígado (vía citocromo P-450) dando lugar a un producto activo, desmetilazelastina, que se une a proteínas en un 97% y se excreta en un 75% con las heces, junto a menos de un 10% de azelastina intacta. Su vida media de eliminación es de 22 horas y de 54 horas la del metabolito.

Aunque en pacientes de edad avanzada o con disfunción hepática la cinética de la azelastina no varía, en presencia de insuficiencia renal (depuración de creatinina < 50 mL/min) su concentración sérica máxima y su exposición sistémica total se elevan en un 70 - 75%.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Los estudios de carcinogenicidad en ratas y ratones expuestos por 2 años a dosis orales diarias de azelastina equivalentes a 25.000 veces la dosis ocular máxima recomendada en humanos (DOMRH) resultaron negativos, al igual que las pruebas de genotoxicidad realizadas (ensayo *in vivo* de micronúcleos de ratón y ensayos *in*





vitro de mutación bacteriana de Ames, de anomalía cromosómica en médula ósea de rata, de reparación de ADN y de células de linfoma de ratón).

Los estudios de fertilidad en ratas con dosis orales de azelastina equivalentes a 25.000 veces la DOMRH no mostraron alteraciones o trastornos de la capacidad reproductiva. Con dosis 57.000 veces la DOMRH, sin embargo, hubo prolongación del ciclo estral y disminución de la actividad copulatoria y del número de embarazos.

En los estudios de reproducción se evidenció actividad embriotóxica, fetotóxica y teratogénica (anomalías esqueléticas) en ratones y ratas con dosis orales de azelastina 25.000 a 57.000 veces la DOMRH.

4. INDICACIONES

Prevención y tratamiento sintomático de la conjuntivitis alérgica estacional.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos y niños mayores de 4 años

Azelastina Solución oftálmica al 0,05%

1 gota en el ojo afectado cada 12 horas.

5.2. Dosis máxima

La dosis señalada. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

No se ha descrito la necesidad de ajustes de dosis.

Insuficiencia hepática

No se ha descrito la necesidad de ajustes de dosis.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se ha descrito la necesidad de ajustes de dosis.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Lavar bien las manos antes de cada aplicación.

Inclinar la cabeza hacia atrás e instilar la dosis prescrita en el fondo de saco conjuntival del ojo afectado mientras se tira suavemente del párpado inferior hacia abajo y se mira hacia arriba.

Evitar el contacto de la boquilla del dispensador con la zona afectada o con alguna otra superficie u objeto.

Lavar bien las manos después de cada aplicación.





No aplicar en exceso, con mayor frecuencia, ni por más tiempo del indicado por el médico.

Si además de la azelastina se usan concomitantemente otros medicamentos por vía oftálmica, la aplicación de éstos debe espaciarse al menos 5 minutos. Si uno de los productos es ungüento, deberá administrarse de último.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante el uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos del sistema inmunológico

Muy raras: Reacciones de hipersensibilidad (como erupción y prurito).

Trastornos del sistema nervioso

Muy frecuentes: Cefalea.

Trastornos oculares

Muy frecuentes: Sensación quemante o punzante.

Frecuentes: Irritación ocular, dolor ocular, conjuntivitis.

Poco frecuentes: Visión borrosa.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Frecuentes: Disnea, asma, faringitis, rinitis.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Sabor amargo.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuentes: Prurito.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Síntomas similares a la gripe, fatiga.

“Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita los profesionales de la salud y a la





comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: <http://www.inhrr.gob.ve/ram1.php>".

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No se han reportado interacciones asociadas a la administración oftálmica de azelastina. Debido a sus bajas concentraciones plasmáticas (nanogramos por mililitro) tras la aplicación de dosis terapéuticas, es poco probable la ocurrencia de alguna interacción clínicamente importante.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se ha descrito

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Advertir a los pacientes que durante la instilación deben evitar el contacto del gotero o dispensador con la zona afectada o con alguna otra superficie u objeto a fin de prevenir la contaminación del producto.

La seguridad y eficacia de la azelastina oftálmica en niños menores de 4 años no han sido establecidas.

Debido a que el producto tiene en su composición cloruro de benzalconio como preservativo, el cual podría ser absorbido y acumulado por el material de los lentes de contacto blandos y causar irritación ocular en el usuario, se recomienda evitar el uso de estos lentes durante el tratamiento. De no ser posible, se aconseja retirar los lentes previo a la instilación y esperar al menos 15 minutos luego de la misma antes de colocarlos nuevamente. No colocar si el ojo está rojo. (Texto aplicable sólo a productos que contienen cloruro de benzalconio).

8.2. Embarazo

Dado que en los ensayos experimentales con azelastina por vía oral se ha evidenciado daño fetal y no hay estudios clínicos adecuados que demuestren la seguridad de su administración oftálmica en mujeres embarazadas.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que el balance beneficio/riesgo sea favorable.





8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si la azelastina se distribuye en la leche materna tras su administración oftálmica, su uso durante la lactancia dependerá de la valoración previa del balance beneficio/riesgo.

No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la azelastina o a los excipientes del producto.
Niños menores de 4 años.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han descrito casos de sobredosificación por la administración tópica ocular de azelastina. La limitada capacidad de contención del saco conjuntival para un producto oftálmico dificulta que ello ocurra. No cabe esperar que se produzca alguna manifestación local o sistémica distinta a las reportadas con el uso de dosis terapéuticas.

10.2. Tratamiento

No amerita tratamiento.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VIA DE ADMINISTRACION: Oftálmica.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo vigilancia médica.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, ni durante la lactancia, a menos que el médico lo indique.

Para evitar la contaminación del producto, no toque ni ponga en contacto la punta del dispensador con la zona afectada o con alguna otra superficie u objeto.

No exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Diciembre de 2020

