



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

LEVOCABASTINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

OFTALMICA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Descongestivos y antialérgicos. Otros antialérgicos.
Código ATC: S01GX02.

3.1. Farmacodinamia

La levocabastina es un antihistamínico de segunda generación derivado de ciclohexil-piperidina con potente actividad antagonista selectiva de los receptores H₁ de histamina. En estudios experimentales no exhibe una afinidad apreciable por los receptores colinérgicos, serotoninérgicos, dopaminérgicos o de ácido gamma-aminobutírico (GABA).

3.2. Farmacocinética

Tras su administración oftálmica como suspensión al 0,05% la levocabastina genera una acción antihistamínica local a los 10 - 15 minutos que se mantiene por 2 - 4 horas. Se absorbe sistémicamente en un 30 - 60% alcanzando concentraciones séricas pico de 1 - 2 ng/mL en aproximadamente 1,2 horas.

Exhibe un volumen de distribución de 1,1 L/kg y se une a proteínas plasmáticas en un 55%. Se distribuye en cantidades mínimas a la leche materna. En animales de experimentación atraviesa la placenta, pero se desconoce si ocurre lo mismo en humanos posterior a su administración oftálmica.

Se metaboliza escasamente (10%) en el hígado mediante glucuronidación a productos inactivos y se excreta como levocabastina intacta en un 70% por vía renal (junto a los metabolitos) y en un 10 - 20% con las heces.

Presenta una eliminación bifásica con una vida media terminal de 39 - 40 horas que se incrementa en ancianos y en pacientes con insuficiencia renal de intensidad moderada a severa.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Los ensayos de potencial carcinogénico en ratas y ratones de ambos sexos expuestos por 24 meses a dosis orales diarias de levocabastina entre 5.000 y 21.500 veces superiores a sus equivalentes por vía oftálmica en humanos revelaron una incidencia incrementada de adenomas en glándula pituitaria y adenocarcinomas mamarios en ratones hembras, presumiblemente asociados a niveles aumentados de





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

prolactina. En las ratas y en los ratones machos, sin embargo, no se evidenció carcinogenicidad

Las pruebas realizadas para evaluar mutagenicidad de levocabastina (ensayo de mutación reversa de Ames en *Salmonella typhimurium*, ensayo de letales recesivos ligados al sexo en *Drosophila melanogaster*, ensayo de letales dominantes en ratón y ensayo de micronúcleos de rata) mostraron resultados negativos.

En los estudios de toxicidad reproductiva no se observó teratogenicidad en ratas con dosis orales de levocabastina 8.300 veces superiores a sus equivalentes por vía ocular en humanos. Con dosis entre 16.500 y 66.000 veces superiores, sin embargo, hubo evidencia de malformaciones fetales (polidactilia, hidrocefalia y braquignatia) y de embriotoxicidad (reabsorción embrionaria). No se registraron alteraciones o trastornos de la fertilidad.

4. INDICACIONES

Tratamiento y profilaxis de los síntomas de la conjuntivitis alérgica.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos y niños mayores de 12 años

Suspensión oftálmica 0,5 mg/mL

1 gota (0,025 mg) en cada ojo 2 - 4 veces al día.

5.2. Dosis máxima

Las dosis recomendadas. 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.

Si el paciente usa lentes de contacto, los mismos deben retirarse antes de aplicar el producto y colocarse nuevamente 15 minutos después de la instilación.

Agitar antes de usar para homogenizar la suspensión.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

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 levocabastina se emplean 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 uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos del sistema inmunológico

Muy raras: Hipersensibilidad, angioedema.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Somnolencia.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea.

Trastornos oculares

Muy frecuentes: Ardor, sensación punzante, irritación ocular.

Frecuentes: Visión borrosa.

Muy raras: Conjuntivitis, hiperemia, edema palpebral, dolor ocular, lacrimación anormal, resequedad ocular, prurito ocular, fotofobia.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Muy raras: Epistaxis, tos, faringitis.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Boca seca.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Muy raras: Dermatitis de contacto, erupción, urticaria.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: 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://inhrr.gob.ve/?page_id=4493".

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

En los estudios realizados no se evidenciaron interacciones medicamentosas con la levocabastina y no se han reportado casos en tal sentido.

Debido a sus bajas concentraciones plasmáticas tras la administración de dosis terapéuticas, es poco probable la ocurrencia de alguna interacción clínicamente importante.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Se debe advertir a los pacientes que durante la instilación deben evitar el contacto del gotero o dispensador con la zona afectada a objeto prevenir la posibilidad de una lesión ocular y/o la contaminación del producto.

Como la levocabastina se excreta principalmente por la orina y se ha demostrado que su eliminación se prolonga en pacientes con disfunción renal, se recomienda usar con precaución en pacientes con insuficiencia renal.

La seguridad y eficacia de la levocabastina oftálmica en niños menores de 12 años no ha sido establecida.

8.2. Embarazo

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





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

8.3. Lactancia

Aunque existe evidencia de excreción de levocabastina en la leche materna tras su administración por vía oftálmica, los estudios de farmacocinética han demostrado que las concentraciones detectadas son muy bajas y no parecen representar un riesgo para el lactante. Aun así, para su uso durante la lactancia se recomienda precaución y la valoración previa del balance beneficio/riesgo.

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

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Este producto puede causar visión borrosa y/o somnolencia, se debe advertir a los pacientes que comprueben si su capacidad se ve afectada antes de conducir o utilizar máquinas.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la levocabastina o a los excipientes de la formulación.

Niños menores de 12 años.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se han descrito casos de sobredosificación por la administración tópica ocular de levocabastina. 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

Lavar el ojo con abundante agua tibia.

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.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

AGITE ANTES DE USAR

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

Niños menores de 12 años.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Enero de 2017



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

