



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

LOTEPREDNOL

2. VIA DE ADMINISTRACION

OFTALMICA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agentes antiinflamatorios. Corticosteroides, monoterapia.

Código ATC: S01BA14.

3.1. Farmacodinamia

El loteprednol es un corticosteroide sintético no fluorado de uso oftalmológico. Al aplicarse tópicamente a la conjuntiva suprime la respuesta inflamatoria a los agentes químicos, mecánicos e inmunológicos. Aunque no se conoce con precisión su mecanismo de acción, se sabe que los corticoesteroides reducen el edema, la deposición de fibrina, la dilatación capilar y la migración de leucocitos y fagocitos en la respuesta inflamatoria aguda. Adicionalmente, disminuyen la proliferación capilar y de fibroblastos, la deposición de colágeno y la formación de escaras. Se cree que la acción antiinflamatoria podría implicar la interacción con un receptor intracelular que induce la expresión de una proteína específica (lipocortina 1) inhibidora de la actividad de fosfolipasa A2, enzima que regula la síntesis de ácido araquidónico a partir de los fosfolípidos de la membrana celular, el cual constituye un precursor de mediadores químicos (leucotrienos y prostaglandinas) de inflamación.

El loteprednol se formula como sal etabonato en suspensión para administración tópica ocular.

3.2. Farmacocinética

La biodisponibilidad sistémica del loteprednol tras su administración oftálmica es mínima y carente de importancia clínica. Los estudios de farmacocinética revelan que posterior a la instilación en ambos ojos de 1 gota de loteprednol en suspensión al 0,5% 8 veces diarias por 2 días o 4 veces diarias por 42 días, sus concentraciones plasmáticas se ubican por debajo del límite de detección (< 1 mg/mL).

3.3. Información preclínica sobre seguridad

No se han desarrollado estudios a largo plazo en animales para evaluar el potencial carcinogénico del loteprednol.

Las pruebas de mutagenicidad realizadas (ensayo *in vivo* de micronúcleos de ratón y ensayos *in vitro* de linfoma tk de ratón, de aberraciones cromosómicas en linfocitos humanos y test de Ames) mostraron resultados negativos.





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>

Los estudios de reproducción en ratas con dosis orales de loteprednol equivalentes a 60 veces la dosis máxima recomendada en humanos (DMRH) mostraron embriotoxicidad y teratogenicidad (aumento de las pérdidas post-implantación, peso fetal reducido, trastornos de osificación, hendidura palatina, hernia umbilical y ausencia de arteria innominada), al igual que en conejos con dosis 35 veces la DMRH (retardos de osificación, meningocele y anomalía de la arteria carótida izquierda). Sin embargo, no se observaron alteraciones o trastornos de la fertilidad en ratas hembras y machos con dosis 300 y 600 veces, respectivamente, la DMRH.

4. INDICACIONES

Tratamiento de enfermedades alérgicas e inflamatorias de la conjuntiva, de la córnea y del segmento anterior del ojo e inflamación ocular post-quirúrgica que responden a corticosteroides.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos

Loteprednol etabonato al 0,5%:

Tratamiento de enfermedades alérgicas e inflamatorias de la conjuntiva, de la córnea y del segmento anterior del ojo

1 o 2 gotas en el ojo afectado cada 6 horas.

Inflamación ocular post-quirúrgica

1 o 2 gotas en el ojo afectado cada 6 horas, comenzando 24 horas antes del procedimiento y continuando durante las 2 semanas siguientes al mismo, conforme al criterio médico.

5.2. Dosis máxima

La dosis usual establecida. 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 requieren ajustes de dosificación.

Insuficiencia hepática

No se requieren ajustes de dosificación.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se requieren ajustes de dosificación.





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>

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Agitar antes de usar para homogenizar la suspensión.

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.

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 del loteprednol 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 nervioso

Poco frecuentes: Cefalea.

Trastornos oculares

Frecuentes: Trastornos corneales, secreción, lagrimeo, ardor, sensación de cuerpo extraño, hiperemia conjuntival, picazón, presión intraocular aumentada.

Poco frecuentes: Visión borrosa o anormal, irritación y/o dolor ocular, quemosis, conjuntivitis, queratoconjuntivitis, papilas conjuntivales, eritema palpebral, iritis, fotofobia, uveítis.

Frecuencia no conocida: Infecciones secundarias y retraso en la cicatrización, ojo seco.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Poco frecuentes: Rinitis, 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>

“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

No existen reportes de interacción medicamentosa con la administración tópica ocular de loteprednol. Debido a su muy limitada absorción sistémica, es poco probable la ocurrencia de alguna interacción clínicamente importante. Sin embargo, se debe tener en cuenta que el riesgo de aumento de presión intraocular asociado al uso prolongado de corticoesteroides en general (incluido el loteprednol) puede incrementarse con el uso sistémico de fármacos con actividad anticolinérgica.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

El uso prolongado de corticosteroides oftálmicos, incluido el loteprednol, puede suprimir la respuesta inmune y, como resultado, aumentar el riesgo de infecciones oculares secundarias (virales, micóticas y bacterianas), exacerbar una infección pre-existente y enmascarar sus signos clínicos.

El uso prolongado de corticosteroides oftálmicos puede provocar catarata subcapsular posterior, aumentos de la presión intraocular, glaucoma, lesión del nervio óptico y alteraciones de la agudeza y del campo visual.

Durante tratamientos prolongados (10 días ó más) con loteprednol se debe vigilar periódicamente la presión intraocular del paciente.

En enfermedades que causan adelgazamiento de la córnea y de la esclerótica el uso de corticosteroides oftálmicos aumenta el riesgo de perforación.

El uso de corticoesteroides después de una cirugía de catarata puede retardar la cicatrización.

La eficacia y seguridad del loteprednol en menores de 18 años no ha sido establecida.





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>

Usar con precaución en pacientes con queratitis o lesiones del epitelio ocular, predisposición al aumento de presión intraocular y formación de cataratas (p.e. diabéticos) y enfermedades que causan adelgazamiento de la córnea y la esclerótica.

8.2. Embarazo

Dado que en los ensayos experimentales con loteprednol por vía sistémica se ha evidenciado daño fetal y no hay estudios clínicos adecuados que demuestren la seguridad de su administración oftálmica en mujeres embarazadas, su empleo durante la gestación debe limitarse a situaciones de estricta necesidad.

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

8.3. Lactancia

En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Este producto puede causar visión borrosa transitoria que puede reducir la capacidad para conducir o utilizar máquinas. El paciente debe esperar hasta que este síntoma desaparezca antes de conducir o utilizar maquinas.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

Enfermedades virales de la córnea y la conjuntiva (queratitis epitelial por herpes simple, varicela) e infección por hongos, bacterias o micobacterias.

Cataratas.

Glaucoma de ángulo abierto.

Menores de 18 años.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

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





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>

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 estricta 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

AGITE ANTES DE USAR.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita.

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Noviembre de 2022



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

