

GLAUCOTENSIL T

ANTI GLAUCOMATOSO

COMPOSICIÓN

Cada 1 ml de solución contienen:

Dorzolamida ClH 22,6 mg

(base equivalente 20,00 mg)

Timolol maleato 6,83 mg

(base equivalente 5,0 mg)

Excipientes c.s.p.

ACCIÓN TERAPÉUTICA

GLAUCOTENSIL T contiene en su fórmula dos principios activos: dorzolamida clorhidrato y timolol maleato. Ambos componentes de la fórmula disminuyen la presión intraocular elevada al reducir la producción de humor acuoso, mediante mecanismos de acción diferentes.

Dorzolamida es un inhibidor de la anhidrasa carbónica para uso oftálmico por vía tópica. La anhidrasa carbónica es una enzima que se encuentra en muchos tejidos del cuerpo, incluyendo el ojo. La anhidrasa carbónica cataliza las reacciones reversibles que involucran la hidratación del dióxido de carbono y la deshidratación del ácido carbónico.

La inhibición de la anhidrasa carbónica II en el ojo reduce la secreción de humor acuoso debido a una menor formación de iones bicarbonato, con la subsecuente disminución en el transporte de iones sodio y líquidos. Cuando se aplica dorzolamida en forma tópica, ésta llega a la circulación luego de administraciones crónicas. Se une en forma moderada a las proteínas plasmáticas y es metabolizada en el hígado a un metabolito también activo, se elimina principalmente por vía urinaria como droga libre y como metabolito.

Timolol es un agente bloqueador β_1 , β_2 no selectivo de los receptores beta-adrenérgico, que carece de actividad simpaticomimética intrínseca, depresora miocárdica directa o anestésica local (estabilizadora de membrana) significativas.

El mecanismo de acción hipotensor de los betabloqueadores oftálmicos aún no se conoce, pero parece estar relacionada con la reducción de la formación del humor acuoso, como se ha demostrado por tonografía y fluorofotometría. Un mecanismo adicional puede ser un ligero aumento en el eflujo o drenaje de ese humor acuoso.

Timolol no posee actividad agonista intrínseca ni anestésica local. Sin embargo, puede producirse su absorción sistémica a través de los conductos lagrimales y debe usarse con precaución en los pacientes con asma, enfisema, insuficiencia cardíaca congestiva, diabetes y bloqueo cardíaco superior. La absorción sistémica también puede producir los efectos colaterales nerviosos centrales y periféricos típicos de los antagonistas β .

El inicio de acción con timolol se observa a los 30 minutos de administrada una sola dosis. El efecto peak se logra alrededor de 1 a 2 horas seguidas a la administración de una dosis única.

La duración de la acción de timolol solución oftálmica puede mantenerse sobre las 24 horas seguidas a la administración única, con una disminución significativa de la presión intraocular.

El efecto combinado de estos dos principios activos produce una reducción adicional de la presión intraocular cuando se la compara con la obtenida con cualquiera de estos

componentes administrados por separado. La administración tópica ocular de GLAUCOTENSIL T reduce la presión intraocular elevada, independientemente de la presencia o no de glaucoma.

GLAUCOTENSIL T reduce la presión intraocular elevada sin los efectos colaterales comunes de los agentes antiglaucomatosos parasimpaticomiméticos, como espasmo de la acomodación o miosis.

INDICACIONES

GLAUCOTENSIL T solución oftálmica está indicado en el tratamiento de la presión intraocular (PIO) elevada en pacientes con hipertensión ocular, glaucoma de ángulo abierto, glaucoma pseudoexfoliativo u otros glaucomas secundarios de ángulo abierto cuando esté indicado un tratamiento local con una combinación de un inhibidor de la anhidrasa carbónica y un bloqueador de los receptores betaadrenérgicos.

REACCIONES ADVERSAS

GLAUCOTENSIL T es generalmente bien tolerado. Las reacciones adversas más frecuentes fueron alteración del gusto (amargo, ácido o sabor inusual) y ardor o sensación de pinchazos en los ojos hasta en un 30% de los pacientes.

Entre el 5 y 15% de los casos reportaron hiperemia conjuntival, visión borrosa, queratitis superficial y picazón en los ojos. Los siguientes efectos adversos fueron informados entre el 1 y 5% de los pacientes: dolor abdominal, dolor lumbar, blefaritis, bronquitis, visión borrosa, descarga conjuntival, edema conjuntival, folículos conjuntivales, inyección conjuntival, conjuntivitis, erosión corneal, manchas corneales, opacidad del cristalino, tos, vértigo, sequedad de los ojos, dispepsia, detritus ocular, secreción ocular, dolor ocular, lagrimeo, edema palpebral, eritema palpebral, exudación palpebral, dolor o molestia palpebral, sensación de cuerpo extraño, excavamiento glaucomatoso, cefalea, hipertensión, gripe, coloración del núcleo del cristalino, opacidad subcapsular posterior, sinusitis, infección de las vías respiratorias superiores, infección del tracto urinario, defectos del campo visual, desprendimiento del vítreo.

Los siguientes eventos adversos se produjeron, ya sea, con una baja incidencia (<1%) en el curso de estudios clínicos o bien fueron comunicados voluntariamente durante el uso en la práctica clínica, aunque el tamaño de la población ni la frecuencia pueden ser establecidos con precisión. Se los ha seleccionado en base a factores tales como seriedad, frecuencia de comunicación, posible conexión causal con la asociación dorzolamida clorhidrato más timolol maleato, o una combinación de todos ellos: bradicardia, insuficiencia cardíaca, dolor torácico, accidentes cerebrovasculares, depresión, diarrea, sequedad de la boca, disnea, hipotensión, iridociclitis, infarto de miocardio, congestión nasal, erupción cutánea, parestesia, fotofobia, urolitiasis y vómitos.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Efectos cardiorrespiratorios: Al igual que con otros productos oftálmicos aplicados tópicamente, GLAUCOTENSIL T puede ser absorbido sistémicamente. El componente timolol es un bloqueador beta-adrenérgico, y por lo tanto pueden ocurrir las mismas reacciones adversas encontradas con la administración sistémica de bloqueadores beta-adrenérgicos. Debido a la presencia de timolol maleato, debe compensarse apropiadamente la insuficiencia cardíaca antes de iniciar el tratamiento con GLAUCOTENSIL T.

En pacientes con antecedentes de cardiopatía severa, deben vigilarse los posibles signos de una insuficiencia cardíaca y controlar la frecuencia del pulso.

Se han informado reacciones respiratorias y cardíacas, incluyendo muerte por broncoespasmos en pacientes con asma y, raramente, muerte asociada con insuficiencia cardíaca, con posterioridad a la administración del timolol maleato en solución oftálmica.

Insuficiencia renal y hepática: GLAUCOTENSIL T no ha sido estudiado en pacientes con insuficiencia renal severa (clearance de creatinina < 30 ml/min). Como dorzolamida y su metabolito son excretados principalmente por vía renal, el empleo de GLAUCOTENSIL T no está recomendado en este tipo de pacientes.

GLAUCOTENSIL T no ha sido estudiado en pacientes con insuficiencia hepática, razón por la cual el producto debe ser utilizado con precaución en estos casos.

Hipersensibilidad: Al igual que con otros agentes oftálmicos aplicados por vía tópica, los principios activos del producto pueden ser absorbidos sistémicamente. La dorzolamina es una sulfonamida, y por lo tanto pueden ocurrir las mismas reacciones adversas que las encontradas con la administración sistémica de sulfonamidas. Si se produjeran signos de reacciones serias o hipersensibilidad, interrumpir la aplicación de este producto.

En estudios clínicos se han comunicado efectos adversos oculares, principalmente conjuntivitis y reacciones palpebrales con la administración prolongada de dorzolamida clorhidrato en solución oftálmica. Algunas de estas reacciones tuvieron el aspecto y curso de una reacción de tipo alérgico y cedieron al suspender el tratamiento. Se han señalado reacciones similares con la combinación dorzolamida clorhidrato – timolol maleato. En caso de observarse tales reacciones, deberá considerarse la suspensión del tratamiento con GLAUCOTENSIL T.

Tratamientos concomitantes: Existe la posibilidad de un efecto sumatorio respecto de los efectos sistémicos debidos a la inhibición de la anhidrasa carbónica en los pacientes, cuando se administran por vía tópica y oral.

La administración concomitante de GLAUCOTENSIL T e inhibidores de la anhidrasa carbónica por vía oral no está recomendada.

Los pacientes que ya estén siendo tratados con un bloqueador beta-adrenérgico sistémico y se les administre GLAUCOTENSIL T deben ser controlados por la probabilidad de efectos aditivos tanto sobre la presión intraocular como sobre los efectos sistémicos conocidos de los bloqueadores beta-adrenérgicos. No se recomienda el uso concomitante de dos bloqueadores beta-adrenérgicos tópicos.

Glaucoma de ángulo cerrado: El tratamiento de pacientes con glaucoma de ángulo cerrado requiere otras intervenciones terapéuticas además de agentes hipotensores tópicos. GLAUCOTENSIL T no ha sido estudiado en pacientes con glaucoma agudo de ángulo cerrado.

Se ha comunicado desprendimiento de coroides con la administración de agentes supresores de la producción de humor acuoso (p.ej. timolol y acetazolamida).

Lentes de contacto: La formulación de GLAUCOTENSIL T contiene cloruro de benzalconio como preservante, el que puede depositarse o ser absorbido por los lentes de contacto blandos. Por lo tanto, GLAUCOTENSIL T no debe ser aplicado con los lentes de contacto puestos. Los lentes deben ser extraídos antes de la aplicación de las gotas de GLAUCOTENSIL T y no deben ser reinsertados durante un período de 15 minutos después de la administración.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

No se han realizado estudios específicos de interacción con GLAUCOTENSIL T. Durante el transcurso de los estudios clínicos, la combinación dorzolamida clorhidrato – timolol maleato se utilizó concomitantemente con los siguientes productos sistémicos, sin evidencias de interacciones adversas: inhibidores de la ECA, bloqueadores de los canales de calcio, diuréticos, antiinflamatorios no esteroideos (incluyendo ácido acetilsalicílico) y hormonas (estrógenos, insulina, tiroxina). Sin embargo puede haber efectos aditivos e hipotensión y/o bradicardias marcadas cuando se administra timolol maleato en solución oftálmica conjuntamente con bloqueadores de los canales de calcio, sustancias que provocan depleción de catecolaminas o bloqueadores beta-adrenérgicos.

Se ha informado betabloqueo sistémico potenciado durante el tratamiento combinado con quinidina y timolol, debido probablemente a que la quinidina inhibe el metabolismo de timolol por medio de la enzima P-450 CYP2D6.

El clorhidrato de dorzolamida en solución oftálmica no ha sido asociado con trastornos del equilibrio ácido-base. Sin embargo se han informado estos trastornos con inhibidores de la anhidrasa carbónica por vía oral y, en ciertos casos, han producido interacciones medicamentosas (p. Ej. Toxicidad asociada con la administración de dosis elevadas de salicatos). En consecuencia, debe considerarse esta posibilidad y dichas interacciones en pacientes tratados con GLAUCOTENSIL T.

EMBARAZO

No se han efectuado estudios específicos con GLAUCOTENSIL T en mujeres embarazadas. GLAUCOTENSIL T puede ser utilizado durante el embarazo sólo cuando el beneficio esperado justifique el riesgo potencial para el feto.

LACTANCIA

Se desconoce si el clorhidrato de dorzolamida se excreta en la leche materna. El maleato de timolol sí es detectado en la leche materna. Debido a la posibilidad de reacciones adversas serias en el lactante, debe considerarse la suspensión del amamantamiento o la interrupción del tratamiento tomando en cuenta la importancia del producto para la madre.

EMPLEO EN PEDIATRÍA: No se ha establecido la seguridad y eficacia de GLAUCOTENSIL T en niños.

CONTRAINDICACIONES

Pacientes con hipersensibilidad a algunos de los componentes de la fórmula.

Asma bronquial o antecedentes de asma bronquial o enfermedad pulmonar obstructiva crónica severa. Bradicardia sinusal; bloqueo aurículo-ventricular de segundo o tercer grado; insuficiencia cardíaca manifiesta; shock cardiogénico.

DOSIFICACIÓN Y MODO DE ADMINISTRACIÓN

La posología recomendada es de una gota de GLAUCOTENSIL T en el (los) ojo (s) afectado (s), dos veces al día, cada 12 horas. Cuando se reemplace (n) otro (s) antiglaucomatoso (s) de uso tópico oftálmico por GLAUCOTENSIL T, discontinuarlo (s) luego de la correspondiente administración de ese día y comenzar con GLAUCOTENSIL T al día siguiente. Si están siendo utilizados otros productos oftálmicos, GLAUCOTENSIL T y los otros productos deben ser administrados con un intervalo mínimo de 10 minutos.

SOBREDOSIFICACIÓN

No se dispone de datos relativos a la sobredosificación accidental o voluntaria con GLAUCOTENSIL T en humanos. La sobredosificación accidental con timolol maleato en solución oftálmica provoca efectos sistémicos similares a los observados con bloqueadores de los receptores beta-adrenérgicos sistémicos tales como mareos, cefalea, dificultades respiratorias, bradicardia, broncoespasmo y paro cardíaco. Los signos y síntomas más comunes que pueden esperarse con la sobredosificación de dorzolamida serían alteraciones del equilibrio electrolítico, acidosis y efectos sobre el sistema nervioso central. El tratamiento deberá ser sintomático y de apoyo. Deben controlarse los niveles séricos de electrolitos (especialmente potasio) y los valores de pH en sangre. Los estudios han demostrado que el timolol no es dializable con facilidad.

PRESENTACIÓN

GLAUCOTENSIL T se presenta en un envase conteniendo 1 frasco gotario con 5 ml de solución oftálmica.