

CLASIFICACIÓN TERAPÉUTICA Y/O FARMACOLÓGICA

Azelastina Clorhidrato ~~es un agente antihistamínico~~ es un agente antihistamínico con una eficaz acción antialérgica, y que además inhibe la liberación de mediadores inflamatorios de los mastocitos.

COMPOSICIÓN Y PRESENTACIÓN

Cada 100 ml de solución oftálmica estéril contienen
 Azelastina HCl 50,0 mg
 Excipientes c.s.

FOLLETO MEDICO
 EXCLUSIVO PARA INCLUIRLO EN
 EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO.

PRESENTACIÓN : frasco gotario con 6 ml de solución oftálmica estéril.

INDICACIONES Y USOS

Profilaxis y tratamiento sintomático de las afecciones oculares externas de naturaleza alérgica tales como conjuntivitis, queratoconjuntivitis y blefaritis.

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

La azelastina es un agente antihistamínico que, además de su acción bloqueante a nivel de los receptores histaminérgicos H1, inhibe la liberación de mediadores inflamatorios de los mastocitos. Se utiliza en administración tópica para tratar afecciones alérgicas perennes y estacionales.

Azelastina es un antialérgico eficaz que posee una vida media prolongada.

La aplicación local de Azelastina se caracteriza por la administración de una dosis baja y la rapidez del comienzo de acción. El efecto después de la aplicación tópica se observa a los 15 minutos de la administración y su duración alcanza las 12 horas.

Luego de la administración oral, la Azelastina es absorbida rápidamente y casi en su totalidad. La biodisponibilidad absoluta es del 81%.

Con la administración oral de 8,8 mg de Clorhidrato de Azelastina, la concentración máxima de Azelastina alcanza los 4 – 6 ng/ml, y la correspondiente al metabolito desmetilazelastina es de 0,8 – 1,0 ng/ml.

Con la misma dosis, el tiempo requerido para observar la concentración máxima es de 5 a 6 horas para la Azelastina y de 14 a 22 horas para el Desmetilazelastina. Luego de la aplicación local y a las dosis habituales, la Azelastina es esencialmente absorbida.

El volumen de distribución de la Azelastina puede llegar a representar 50 x el volumen corporal, lo que implica una distribución periférica elevada del producto.

Luego de la administración de Azelastina marcada con C₁₄, se detecta un nivel muy bajo de radioactividad en sangre(aproximadamente 1,4%).

La biotransformación de Azelastina es importante, siendo las vías metabólicas esenciales la hidroxilación cíclica, la N-desmetilación y la apertura oxidativa del ciclo de la Azepina.

La vida media plasmática, luego de dosis únicas y repetidas de Azelastina, es de aproximadamente 50 horas para el metabolito N-desmetilazelastina.

La unión a proteínas plasmáticas es del orden de 78-88%. Luego de una dosis oral, la captación por parte de los eritrocitos es de 50 – 53%.

El 75% de una dosis de Azelastina es eliminado en las heces y el 25% en la orina. Sólo el 6,5 % de la dosis es excretado en forma inalterada. La eliminación continua de pequeñas fracciones de la dosis administrada indica un grado leve de circulación enterohepática.

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA
 Departamento de Control Nacional
 Registro N° F-11830/02

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA
 Departamento de Control Nacional
 Sección Registro

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad conocida a los componentes de la fórmula.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Una vez abierto el frasco gotario de **BRIXIA** no utilizarlo por más de 4 semanas, aún cuando quede parte de la solución en el frasco al término de ese período.

No utilizar **BRIXIA** una vez pasada la fecha vencimiento.

NO UTILIZAR ESTE PRODUCTO EN INYECCION PERI O INTRAOCULAR.

NO UTILIZAR MIENTRAS SE LLEVAN LENTES DE CONTACTO.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Con la administración tópica intranasal de Azelastina no se ha observado hasta el presente interacción medicamentosa alguna.

No es aconsejable la asociación de Azelastina con alcohol, debido a que este último potencia el efecto sedante de Azelastina. La alteración de la vigilancia puede tornar peligrosa la conducción de vehículos o el manejo de máquinas.

Otra asociación a tener presente es la que se produce cuando el paciente se encuentra o inicia una terapia con otros depresores del sistema nervioso central, la que puede tener consecuencias importantes, especialmente en el caso de la conducción de vehículos o el manejo de máquinas.

EMBARAZO

En estudios experimentales en animales donde se emplearon dosis elevadas de Azelastina (400 a 500 veces la dosis oral de 4 mg administrada en humanos) se han constatado efectos teratogénicos. No se han efectuado estudios controlados en mujeres embarazadas. En tales circunstancias, el medicamento ~~debe ser administrado con precaución~~ ~~debe ser administrado con precaución~~ ~~debe ser administrado con precaución~~.

No debe administrarse durante el embarazo.

LACTANCIA

En ausencia de datos suficientes, **BRIXIA** no debe ser administrado a mujeres que amamanten.

EMPLEO EN PEDIATRÍA

No se han realizado estudios con **BRIXIA**

EMPLEO EN GERIATRÍA

Proporcionalmente a los sujetos jóvenes, la vida media de Azelastina en gerontes se multiplica por 1,6; los demás valores farmacocinéticos llegan a casi el doble.

EMPLEO EN INSUFICIENCIA HEPÁTICA Y RENAL.

La vida media de la Azelastina y de N-desmetilazelastina no se modifica significativamente en los casos de insuficiencia hepática. En cambio, en la insuficiencia renal se detectan concentraciones máximas significativamente más elevadas de Azelastina y N-desmetilazelastina. Aunque los otros parámetros de Azelastina no se modifican, en relación a, los valores registrados en sujetos sanos, el metabolito presenta una vida media significativamente prolongada.

REACCIONES ADVERSAS

Algunos pacientes experimentan una ligera irritación en los ojos luego de la instilación de Azelastina; esa irritación suele ceder en el lapso de unos pocos segundos.

Después de la instilación, puede aparecer un sabor amargo en la boca, que desaparece rápidamente.

El tratamiento crónico por vía oral puede provocar en raras ocasiones fatiga y somnolencia.

POSOLOGIA Y MODO DE ADMINISTRACIÓN

Antes de administrar un producto oftálmico asegúrese que esta indicado para administración oftálmica.

El régimen posológico se realiza según criterio médico

Como posología habitual orientativa en adultos y en ancianos : instilar 1 gota en el saco conjuntival del (de los) ojo(s) afectado(s) 2 veces por día, por la mañana y en la noche.

En cuadros severos esta posología puede elevarse hasta 1 gota en saco conjuntival del(de los) ojo(s) afectado(s) 4 veces por día.

Al momento de administrar **BRIXIA**, Lávese las manos, incline la cabeza hacia atrás y con el dedo índice de la misma mano separe el párpado inferior del ojo para formar una especie de saco, deje caer el medicamento en él y trate de mantener el ojo abierto alrededor de 30 segundos. Luego cierre los ojos suavemente durante 1 a 2 minutos. Inmediatamente después de aplicar las gotas lávese las manos para eliminar cualquier resto de medicamento.

Evite la contaminación de las gotas oftálmicas procurando que la punta del frasco gotario no entre en contacto con ninguna superficie(Incluido el ojo). Mantenga siempre el envase bien cerrado.

SOBREDOSIFICACIÓN

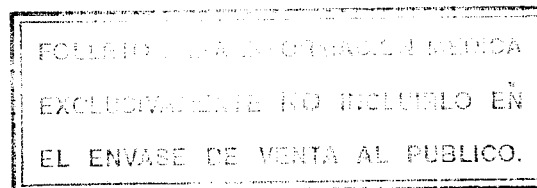
No se han informado casos de sobredosificación con **BRIXIA**.

La Azelastina posee un margen terapéutico suficientemente amplio. En experimentos con animales el aumento de la dosis más allá del margen terapéutico no ha provocado un aumento importante de los efectos indeseables.

En esos estudios los efectos tóxicos observados fueron de naturaleza nerviosa, p. Ejemplo: excitación temblor, convulsiones.

En caso de sobredosificación accidental o voluntaria debe instaurarse un tratamiento sintomático. No se conoce un antídoto específico para la Azelastina. Si la intoxicación es por vía oral y reciente, se recomienda un lavado gástrico. No obstante, los incidentes de sobredosificación por instilación ocular son muy poco probables.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al servicio de urgencia del hospital más cercano o comunicarse a algún centro toxicológico.



BIBLIOGRAFÍA

- 1°. Index Merck 12TH Edition page 156
- 2°. Giede-Tuch C, Westhoff M, Zarth A. Azelastine eye-drops in seasonal allergic conjunctivitis or rhinoconjunctivitis . adouble –blind, randomizad, placebo-controlled study. Allergy 1998 :53: 857-862
- 3°. Sabbah A and Marzetto M. Azelastine Eye Drops in the Treatment of Seasonal Allergic Conjunctivitis or Rhinoconjunctivitis in Young Children. Current Medical Research and Opinion. Vol. 14, N°3, 1998, 161 – 170
- 4°. Horak et al. Dose –dependent Protection by Azelastine Eye Drops against Pollen- induced Allergic Conjunctivitis . arzneim.-Forsch./Drug Res. 48(I), 379-384(1998).
- 5°. Ciprandi et al. Azelastine eye drops reduce and prevent allergic conjuntival reaction and exert anti-allergic activity. Clinical and Experimental Allergy, 1996, Vol. 27, pages 182 – 191.

