

## **FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**

### **ANESTALCON® SOLUCIÓN OFTÁLMICA 0,5%**

#### **1 NOMBRE DEL PRODUCTO FARMACÉUTICO**

ANESTALCON® Solución Oftálmica 0,5%

#### **2 COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA**

Activo: Proparacaína clorhidrato 5,0 mg

Conservante: Cloruro de benzalconio 0,1 mg

Excipientes: glicerina, ácido clorhídrico y/o hidróxido de sodio (para ajustar pH) y agua purificada.

#### **3 FORMA FARMACÉUTICA**

Gotas oftálmicas incoloras variando a amarillo pálido o marrón

#### **4 DATOS CLÍNICOS**

##### **4.1 Indicación terapéutica**

ANESTALCON Solución Oftálmica está indicado como anestésico local en intervenciones quirúrgicas oftálmicas.

Usos: Procedimientos en los cuales se requiere una acción anestésica local de inicio rápido y corta duración, incluyendo examinación y pequeñas intervenciones tales como cirugía de catarata y remoción de suturas de la córnea, tonometría, gonioscopía, remoción de cuerpos extraños desde la córnea, raspado conjuntival para propósitos diagnósticos y otros procedimientos de corta duración en córnea y/o conjuntiva.

##### **4.2 Posología y método de administración**

###### Adultos:

Para una examinación tópica simple, administrar 1 o 2 gotas antes del procedimiento. Si fuera necesario, se pueden agregar más gotas.

Para procedimientos menores tal como remover cuerpos extraños del ojo o suturas, administrar 1 gota o 2 cada 5 a 10 minutos, 1 a 3 veces, o administrar 1 a 2 gotas cada 2 o 3 minutos antes del procedimiento.

Para anestesia prolongada, como extracción de cataratas, administrar 1 gota cada 5 o 10 minutos, hasta un total de 5 a 7 aplicaciones.

###### Población pediátrica:

La seguridad y eficacia de ANESTALCON Solución Oftálmica 0,5% no han sido establecidas. Sin embargo, la literatura cita el uso de proparacaína como un agente anestésico tópico en niños.

### Uso en pacientes mayores

No existe información que sugiera un ajuste de dosis en pacientes mayores de 65 años.

### Uso en pacientes con insuficiencia renal o hepática

La seguridad y eficacia de ANESTALCON Solución Oftálmica 0,5% no han sido establecidas en estos pacientes.

### **Método de administración**

Para uso ocular.

Para prevenir la contaminación de la punta del frasco y la solución se debe tener cuidado de no tocar los párpados, áreas cercanas y otras superficies con la punta del frasco. Mantener el frasco debidamente cerrado cuando no se esté utilizando.

Si se administra más de un producto farmacéutico tópico, los medicamentos deben administrarse con una diferencia de al menos 5 minutos. Los ungüentos se deben administrar al final.

### **4.3 Contraindicaciones**

Hipersensibilidad a las sustancias activas o a cualquiera de los excipientes.

### **4.4 Advertencias especiales y precauciones de uso**

- Se debe tener precaución en la anestesia local en pacientes con insuficiencia cardíaca o hipertiroidismo.
- El uso prolongado de anestésicos oculares tópicos puede disminuir la duración de la anestesia.
- El uso prolongado, o abuso, puede conducir a toxicidad epitelial corneal y puede manifestarse como defectos en el epitelio, lo cual podría progresar a un daño corneal permanente (Ver Sección 4.8).
- Advertir a los pacientes que, debido al efecto anestésico, sus ojos estarán insensibles por lo que deben evitar lesiones oculares accidentales.
- La proparacaína puede causar dermatitis alérgica por contacto. Evitar el contacto de ANESTALCON® Solución Oftálmica 0,5% con la piel.
- ANESTALCON Solución Oftálmica 0,5% contiene cloruro de benzalconio el cual puede causar irritación y se sabe que puede decolorar los lentes de contacto blandos. No se recomienda el uso de lentes de contacto hasta que el efecto anestésico haya pasado.

### **4.5 Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción**

No se han descrito interacciones relevantes.

### **4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia**

#### Fertilidad

No se han realizado estudios para evaluar el efecto de la administración ocular tópica de proparacaína sobre la fertilidad.

#### Embarazo

No existen datos, o son limitados, en relación al uso de proparacaína en mujeres embarazadas. No se recomienda el uso de ANESTALCON Solución Oftálmica 0,5% durante el embarazo.

#### Lactancia

Se desconoce si la proparacaína o sus metabolitos se excretan en la leche humana; sin embargo, no se puede excluir el riesgo para el lactante. Se debe tomar una decisión sobre discontinuar la lactancia o discontinuar/abstenerse de usar ANESTALCON® Solución Oftálmica 0,5% tomando en cuenta el beneficio de la lactancia para el niño contra el beneficio del tratamiento para la madre.

#### **4.7 Efectos en la capacidad de manejar y utilizar máquinas**

La visión borrosa temporal u otras alteraciones visuales pueden afectar la capacidad de conducir o utilizar máquinas. Si ocurre visión borrosa después de la administración, los pacientes deben esperar hasta que la visión se aclare para conducir o utilizar maquinaria.

#### **4.8 Reacciones adversas**

Las siguientes reacciones adversas tras la administración de ANESTALCON® Solución Oftálmica 0,5% han sido identificadas a partir de la vigilancia post-comercialización. La frecuencia no puede ser estimada desde los datos disponibles. Dentro de cada Clase Órgano-Sistema, las reacciones adversas se presentan en orden decreciente de seriedad.

<b>Clasificación Órgano sistema</b>	<b>Término preferido MedDRA (v.18.1)</b>
Alteraciones del sistema inmune	Hipersensibilidad
Alteraciones del sistema nervioso	Síncope
Alteraciones oculares	Erosión corneal, opacidad corneal, queratitis, visión borrosa, fotofobia, midriasis, dolor ocular, irritación ocular, hinchazón ocular, molestia ocular, hiperemia ocular, aumento del lagrimeo

Adicionalmente, el uso descontrolado o abuso del producto puede causar lesiones oculares debido a los efectos tóxicos de la anestesia en el epitelio. (Ver sección 4.4)

#### **4.9 Sobredosis**

Ante el evento de una sobredosis o ingestión accidental, los efectos sistémicos pueden manifestarse como una estimulación del sistema nervioso central (SNC) y puede incluir nerviosismo, temblores, o convulsiones; seguido de depresión en el SNC, lo cual puede llevar a la pérdida de conciencia y depresión respiratoria.

### **5 PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS**

#### **5.1 Propiedades Farmacodinámicas**

Grupo farmacoterapéutico: Anestésico local, código ATC: S01HA04

#### Mecanismo de acción:

La proparacaína clorhidrato (proximetacaína clorhidrato) es un anestésico de superficie del tipo éster. Los anestésicos de superficie causan un bloqueo reversible de la conducción a través de fibras nerviosas, conduciendo a anestesia local. El principal sitio de acción anestésico es la membrana celular

nerviosa donde la proparacaína interfiere con el gran aumento transitorio en la permeabilidad de la membrana a los iones de sodio que se produce internamente por una ligera despolarización de la membrana. A medida que se desarrolla la acción anestésica en el nervio, el umbral para la estimulación eléctrica aumenta gradualmente y la seguridad del factor para la conducción disminuye; cuando esta acción está suficientemente desarrollada, se produce un bloqueo de la conducción eléctrica. El mecanismo exacto por el cual la proparacaína y otros agentes anestésicos locales influyen en la permeabilidad de la membrana celular es desconocido; sin embargo, varios estudios indican que los anestésicos locales pueden limitar la permeabilidad del ion sodio a través de la capa lipídica de la membrana celular nerviosa. Esta limitación impide el cambio fundamental necesario para la generación del potencial de acción.

#### Farmacodinamia

La solución de proparacaína es un anestésico local de acción rápida adecuada para el uso oftálmico. El inicio de la anestesia generalmente comienza en segundos y dura un período relativamente corto de tiempo.

#### Eficacia y seguridad clínica

La proparacaína es un medicamento establecido

#### Población pediátrica

La seguridad y eficacia de ANESTALCON® gotas oftálmicas no ha sido establecida en niños; sin embargo, en la literatura se cita a la proparacaína clorhidrato como un agente anestésico tópico de uso en niños.

### **5.2 Propiedades farmacocinéticas**

#### **Absorción**

Tras la administración tópica, la exposición local y sistémica de proparacaína (también conocida como proximetacaína) no ha sido determinada. Sin embargo, el rápido inicio de la anestesia dentro de 30 segundos sugiere que el compuesto se absorbe rápidamente y persiste por un período de tiempo relativamente corto (entre 15 a 20 minutos).

#### **Distribución**

No hay información disponible sobre la distribución de proparacaína.

#### **Biotransformación**

La proparacaína se hidroliza por esterasas plasmáticas, y en una proporción mucho menor en el hígado, al metabolito PABA (ácido *p*-aminobenzoico).

#### **Eliminación**

La proparacaína solo se administra tópicamente. No hay información disponible sobre su eliminación.

#### **Linealidad / no linealidad**

La linealidad de la farmacocinética de proparacaína es desconocida.

## **Relación farmacocinética / farmacodinámica**

Ya que la exposición sistémica u ocular es desconocida tras la administración ocular, la relación farmacocinética/farmacodinámica no ha sido establecida.

## **5.3 Datos preclínicos de seguridad**

Tras la administración ocular tópica en conejos, la proparacaína provocó un retraso en la cicatrización de la córnea y causó toxicidad epitelial.

# **6 DATOS FARMACÉUTICOS**

## **6.1 Excipientes**

Cloruro de benzalconio

Glicerina

Hidróxido de sodio y/o ácido clorhídrico (para ajuste de pH)

Agua destilada c.s.p

## **6.2 Incompatibilidades**

No aplicable.

## **6.3 Período de eficacia**

No utilizar más allá de la fecha de vencimiento indicada en el estuche.

Descartar el producto tras 4 semanas después de abierto el frasco.

## **6.4 Precauciones especiales de almacenamiento**

Almacenar entre 2°C a 8°C.

## **6.5 Naturaleza y contenido del envase**

Frasco de polietileno de baja densidad con 15 mL de solución.

## **6.6 Instrucciones de uso y manejo**

No aplicable.

Registro I.S.P. N° F-2798

Fabricado por: NOVARTIS BIONCIENCIAS S.A., Av. N. S. da Assunção, 736, São Paulo – SP, Industria Brasileira

Importado por: Alcon Laboratorios Chile Ltda., Rosario Norte 615 piso 10, Las Condes, Santiago, Chile, bajo licencia de Novartis AG, Suiza.

Distribuido por: Kuehne + Nagel Ltda. Carlos Fernández 260, Santiago, por cuenta de Alcon Laboratorios Chile Ltda.

\*Marca de Novartis

©2012, 2016 Novartis

## REFERENCIAS

1. Abelson M, Vashishan A. The truth about tachyphylaxis [Internet].[Place unknown]:Review of Ophthalmology; [updated 16 March 2006; cited 16 February 2016]. Available from: <http://www.reviewofophthalmology.com/>.
2. Archer M. Topical Analgesic and Anesthetic Agents: Drug Class Review. University of Utah College of Pharmacy. Final Report. December 2013.
3. Aronson JK, Dukes MNG, editors. Meyler's side effects of drugs. The international encyclopedia of adverse drug reactions and interactions. 15th ed. Amsterdam:
4. Elsevier Science B.V.; 2006. p. 2978.
5. Bartlett JD, Jaanus SD, editors. Clinical Ocular Pharmacology, 5th edition. St. Louis. Butterworth-Heinemann, 2008. pp. 87-95.
6. Bartlett JD, Fiscella RG, Bennett E, et.al., eds. Ophthalmic drug facts, 21st ed., St. Louis: Wolters Kluwer Health, 2010a. pp.34-7.
7. Bartlett JD, Fiscella RG, Bennett E, et.al., eds. Ophthalmic drug facts, 21st ed., St. Louis: Wolters Kluwer Health, 2010b. pp.112-3.
8. Bartlett JD, Fiscella RG, Bennett E, et.al., eds. Ophthalmic drug facts, 21st ed., St. Louis: Wolters Kluwer Health, 2010c. p.122.
9. Baudouin C. Detrimental effect of preservatives in eye drops: implications for the treatment of glaucoma. *Acta Ophthalmologica*. 2008; 86:716-26.
10. Blaha GR, Tilton EP, Barouch FC, Marx JL. Randomized trial of anesthetic methods for intravitreal injections. *Retina*. 2011;31:535-9.
11. Bras A. Safety Alert: Risks associated with ophthalmic anesthetics. Winnipeg Regional Health Authority [cited 09/02/2016]. Available from: <http://mpa.in1touch.org/uploaded/web/Legislation/Practice%20Resources/OPHTHALMIC%20TOPICAL%20ANESTHETICS%20AND%20SIDE%20EFFECTS%20REVIEW.pdf>.
12. Caterall WA, Mackie K. Chapter 20. Local Anesthetics [Internet]. In: Brunton LL, Chabner BA, Knollmann BC, eds. Goodman & Gilman's the pharmacological bases of therapeutics, 12e. New York, NY: McGraw-Hill; 2011.[Cited 2016 Feb 19]; [About 27 p.]. Available from: <http://accessmedicine.mhmedical.com/content.aspx?bookid=374&sectionid=41266226>.
13. Chapman JM, Cheeks L, Green K. Interactions of benzalkonium chloride with soft and hard contact lenses. *Arch Ophthalmol*. 1990;108:244-6.
14. Craig EL. Chapter 5: Anesthesia. In: Havener's Ocular Pharmacology. 6th ed. St. Louis

(MO): Mosby; 1994. pp. 201-7.

15. Dannaker CJ, Maibach HI, Austin E. Allergic contact dermatitis to proparacaine with subsequent cross-sensitization to tetracaine from ophthalmic preparations. *Am J Contact Dermat.* 2001; 12(3):177-9.
16. Davis MJ, Pollack JS, Shott S. Comparison of topical anesthetics for intravitreal injections: a randomized clinical trial. *Retina.* 2012;32:701-5.
17. Dempsey E, McCreery K. Local anaesthetic eye drops for prevention of pain in preterm infants undergoing screening for retinopathy of prematurity. *Cochrane Database of Systematic Reviews* 2011, Issue 9. Art. No.: CD007645. DOI: 10.1002/14651858.CD007645.pub2.
18. Domingo D. Local anesthetics (Part III): use in medically complex patients. *Clinical Update.* 2002;24(11):22-4.
19. Dukes MNG, Aronson JK, editors. *Meyler's side effects of drugs. An encyclopedia of adverse reactions and interactions.* 14th ed. Amsterdam: Elsevier Science B.V.; 2000. pp. 1642.
20. Fraunfelder, FT, Fraunfelder, FW, editors. *Drug induced ocular side effects.* 5th ed. Woburn (MA): Butterworth-Heinemann; 2001. pp. 615-19.
21. Hamilton R, Claoué C. Topical anesthesia: proxymetacaine versus amethocaine for clear corneal phacoemulsification. *J Cataract Refract Surg.* 1998;24:1382-4.
22. Henderer JD, Rapuano CJ. Chapter 64: Ocular Pharmacology [Internet]. In: Brunton LL, Chabner BA, Knollmann BC, eds. *Goodman & Gilman's the pharmacological bases of therapeutics*, 12e. New York, NY: McGraw-Hill 2011;[Cited 2016 Feb 18];[About 30 p.]. Available from: <http://accessmedicine.mhmedical.com/content.aspx?sectionid=102164457&bookid=1613>.
23. Hou Y, Wang I, Hu F. Ring keratitis associated with topical abuse of a dilute anesthetic after refractive surgery. *J Formos Med Assoc.* 2009;108(12):967-72.
24. JFC, Joint Formulary Committee. Administration of drugs to the eye. [cited 2015 Nov 30]. In: *British National Formulary* [Internet]. London: BMJ Group and RPS Publishing; 2015. [about 4 p.]. Available from: <http://www.medicinescomplete.com>.
25. Joshi RS. A single drop of 0.5% proparacaine hydrochloride for uncomplicated clear corneal phacoemulsification. *Middle East Afr J Ophthalmol.* 2013;20:221-224.
26. Krachmer JH, Mannis MJ, Holland EF, editors. *Cornea: Fundamentals, Diagnosis and Management*; 2nd ed. Philadelphia: Elsevier Mosby, 2005, pp.887-95.
27. Lam CSY. Chapter 7. Diagnostic Drugs. In: Rosenfield M, Logan N, Edwards K, editors. *Optometry: science, techniques and clinical management*, 2nd ed.: Elsevier Ltd., 2009;p. 89-99.
28. Liesegang TJ, Perniciaro C. Fingertip dermatitis in an ophthalmologist caused by proparacaine. *Am J Ophthalmol.* 1999;127:240-1.
29. Liu JC, Steinemann TL, McDonald MB, Thompson HW, Beuerman RW. Topical bupivacaine and proparacaine: a comparison of toxicity, onset of action, and duration of action. *Cornea.* 1993.12(3):228-32.

30. Mauger TF, Craig EL. Havener's Ocular Pharmacology. 6th ed. St. Louis (MO): Mosby; 1994. pp. 201-7.
31. McEvoy GK, editor. EENT anti-inflammatory agents, miscellaneous. In: AHFS Drug Information 2011. American Society of Health-System Pharmacists; 2011. p. 2912-6.
32. McEvoy GK, editor. Proparacaine Hydrochloride (EENT). In: AHFS Drug Information 2016. American Society of Health-System Pharmacists; 2016.
33. McGee HT, Fraunfelder FW. Toxicities of topical ophthalmic anesthetics. *Expert Opin Drug Saf.* 2007;6(6):637-40.
34. Nesargi SV, Nithyanandam S, Rao S, Nimbalkar S, Bhat Swarnarekha. Anesthesia or oral dextrose for the relief of pain in screening for retinopathy of prematurity: a randomized controlled double-blinded trial. *J Trop Ped* 2015;61(1):20-4.
35. O'Conner Davies PH, Hopkins GA, Pearson RM. The Actions and Uses of Ophthalmic Drugs. Local Anesthetics, pp 142-3. Elsevier 1989.
36. Patel M, Fraunfelder FW. Toxicity of topical ophthalmic anesthetics. *Expert Opin Drug Metab Toxicol.* 2013;9(8):983-8.
37. Peyman GA, Rahimy MH, Fernandes ML. Effects of morphine on corneal sensitivity and epithelial wound healing: implications for topical ophthalmic analgesia. *Br J Ophthalmol.* 1994;78(2):138-41.
38. Ralph RA. Chemical injuries of the eye. [cited 2014 Mar 04]. In: Tasman W, Jaeger EA, editors. *Duane's ophthalmology* [Internet]. 13th ed. Philadelphia: Lippincott, Williams & Wilkins; 2013. [about 53 p].from: <http://oph.ucsd.edu/residents/learning/duanes/index.html>.
39. Riddell CE, Reed J, Shaw S, Duvall-Young J. Allergic contact fingertip dermatitis secondary to proxymetacaine in an ophthalmologist. *Eye.* 2000;14:907-8.
40. Rosenwasser, G. Complications of topical ocular anesthetics. *International Ophthalmology Clinics* 1989;29:3:153-158.
41. Rowe RC, Sheskey PJ, Quinn ME, editors. Benzalkonium chloride. [cited 2014 Mar 10]. In: *Handbook of pharmaceutical excipients* [Internet]. London: Pharmaceutical Press and American Pharmacists Association; 2013. [about 8 p.]. Available from: <http://www.medicinescomplete.com>.
42. Sinha R, Chandralekha, Batra M, Ray BR, Mohan VK, Saxena R. A randomised comparison of lidocaine 2% gel and proparacaine 0.5% eye drops in paediatric squint surgery Anaesthesia. 2013;68:747–52.
43. Steiner M. On the correct use of eye drops. *Aust Prescr.* 2008;31:16-7.
44. Stephen M (editor). The Journal of the British Ophthalmic Anaesthesia Society (BOAS). *Ophthalmic Anaesthesia News.* 2008.
45. Sweetman SC, editor. Local anesthetics: precautions. [cited 2010 Feb 24]. In: *Martindale: the complete drug reference* [Internet]. London: Pharmaceutical Press; 2010a. [about 2 p.]. Available from: <http://www.medicinescomplete.com>.



46. Sweetman SC, editor. Local anesthetics: adverse effects. [cited 2010 Feb 24]. In: Martindale: the complete drug reference [Internet]. London: Pharmaceutical Press; 2010b. [about 2 p.]. Available from: <http://www.medicinescomplete.com>.
47. Sweetman S, editor. Martindale: The Complete Drug Reference [Internet]. London:Pharmaceutical Press; 2016. Proxymetacaine Hydrochloride; [Cited 2016 Feb04];[About 5 p.] Available from <https://www.medicinescomplete.com/mc/martindale/current/7647-k.htm>.
48. Taketomo CK, Hodding JH, Kraus DM, editors. Pediatric dosage handbook. 10th ed. Hudson (OH): Lexi- Comp, Inc; 2003. pp. 946-8.
49. Tindall WN, Sedrak M, and Boltri J. Patient-Centered Pharmacology: Learning System for the Conscientious Prescriber. Chapter 5: Drug Used in the Treatment of Eye and Ear Disorders. pp70-71 Section: Ophthalmic Anesthetics. Publisher: FA Davis 2013.
50. Tok OY, Tok L, Atay IM, Argun TC, Demirci N, Gunes A. Toxic keratopathy associated with abuse of topical anesthetics and amniotic membrane transplantation for treatment. Int J Ophthalmol. 2015 Oct 18;8(5):938-44.