

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	DORZOLAMIDA 2%-TIMOLOL 0,5%
Forma farmacéutica:	Colirio
Fortaleza:	-
Presentación:	Estuche por un frasco gotero de PEBD blanco con 5 mL.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, LA HABANA, CUBA.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) "LABORATORIOS JU CUBA.
Número de Registro Sanitario:	M-16-245-S01
Fecha de Inscripción:	15 de diciembre de 2016
Composición:	
Cada mL contiene:	
dorzolamida (eq. a 22,30 mg de clorhidrato de dorzolamida)	20,0 mg
timolol (eq. a 6,80 mg de maleato de timolol)	5,0 mg
cloruro de benzalconio	0,075 mg
policoat F4M (HPMC)	
ácido cítrico monohidratado	
agua para inyección	
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Tratamiento de la presión intraocular (PIO) elevada en pacientes con glaucoma de ángulo abierto o glaucoma pseudoexfoliativo cuando la monoterapia con un betabloqueante tópico no sea suficiente.

Contraindicaciones:

La dorzolamida no debe administrarse en insuficiencia renal grave o acidosis hiperclorémica; embarazo y lactancia. Hipersensibilidad al principio activo.

El timolol está contraindicado en la hipersensibilidad a cualquiera de los componentes del producto o a otros α -bloqueantes.

Asma bronquial, EPOC, bloqueo cardíaco de segundo y tercer grados, angina de Prinzmetal, *shock* cardiogénico, insuficiencia cardíaca descompensada, bradicardia intensa, síndrome del

seno enfermo, acidosis metabólica, enfermedad arterial periférica severa, feocromocitoma (con un α -bloqueador).

Precauciones:

La dorzolamida no tiene estudios en pacientes con menos de 36 semanas de gestación y con menos de 1 semana de vida.

Insuficiencia hepática, glaucoma agudo de ángulo cerrado; la aplicación tópica se sigue de absorción por vía general; antecedentes de cálculos renales; defectos corneales crónicos, antecedentes de cirugía intraocular. En pacientes con defectos corneales crónicos y/o antecedentes de cirugía intraocular se han comunicado edemas corneales y descompensaciones irreversibles.

No se recomienda uso concomitante con inhibidores orales de anhidrasa carbónica.

El timolol, su uso en el embarazo, E: categoría de riesgo C.

Pueden producirse efectos adversos (especialmente hipoglucemia y bradicardia) en el feto y el neonato. Existe un aumento del riesgo de complicaciones cardíacas y respiratorias en el neonato durante el periodo posnatal. No debería utilizarse durante el embarazo, excepto que el beneficio terapéutico justifique los posibles riesgos.

LM: compatible.

Adulto mayor: riesgo de absorción sistemática y de efectos adversos.

Puede causar visión borrosa transitoria, los pacientes no deberán manejar u operar maquinarias hasta que se logre la recuperación total de la visión

Diabetes mellitus.

Enmascara la taquicardia asociada con la hipoglucemia.

Para minimizar los probables efectos secundarios sistémicos se recomienda comprimir el punto lagrimal con un dedo durante 2-3 min luego de su instilación.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Puede precipitar insuficiencia cardíaca severa, bradicardia sinusal e hipotensión.

Asma bronquial y EPOC: suele agravar el broncospasmo y disminuir la efectividad del tratamiento broncodilatador.

Contiene cloruro de benzalconio, evitar el contacto con lentes de contacto blandos.

Efectos indeseables:

Para la dorzolamida se reporta ardor, escozor y picor oculares, visión borrosa, lagrimeo, conjuntivitis, queratitis puntiforme superficial, inflamación y costras palpebrales, uveítis anterior, miopía pasajera, edema corneal, iridociclitis, cefalea, mareos, parestesia, astenia, sinusitis, rinitis, náuseas; reacciones de hipersensibilidad (entre ellas, urticaria, angioedema, broncospasmo); sabor amargo, epistaxis, urolitiasis.

El timolol tiene como efectos adversos frecuentes: blefaritis, conjuntivitis, queratitis, ardor, disminución de la sensibilidad corneal, diplopía, visión borrosa (aparece con alta incidencia al interrumpir el tratamiento), cambios refractivos.

Ocasionales: ptosis palpebral, cefalea, mareos, confusión, alucinaciones, fatiga, depresión, hipotensión, bradicardia, arritmias, bloqueo auriculoventricular, paro cardíaco, insuficiencia cardíaca congestiva, broncospasmo, principalmente en pacientes con enfermedades broncopásticas preexistentes, insuficiencia respiratoria, disnea.

Raras: agravamiento de la miastenia gravis, alopecia, náuseas, erupción cutánea, urticaria, astenia, impotencia, disminución de la libido, hiperpotasemia, diarrea, parestesias, insuficiencia circulatoria cerebral.

Posología y método de administración:

1 gota 2 veces al día.

Modo de administración: Ocular.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Para la dorzolamida no existen datos disponibles hasta el momento. Por su parte los α -bloqueadores aumentan su efecto sobre la presión arterial con antihipertensivos, alcohol, fenotiacinas, antidepresivos tricíclicos, IMAO, ansiolítico e hipnótico, dopaminérgicos como L-dopa, baclofen y alprostadil. Antagonizan su acción antihipertensiva los esteroides, AINE, estrógenos y carbenoxolona. Aumenta la presión arterial epinefrina, norepinefrina, dobutamina y tropisetron. Hipertensión «de rebote» con clonidina. Vasoconstricción periférica con ergotamina y metisergida. Junto con nifedipina y verapamil produce hipotensión severa e insuficiencia cardiaca. Diltiazem bloqueo A-V. Antiarrítmicos: inducen bradicardia, depresión miocárdica y bloqueo AV.

Glucósidos cardíacos: riesgo incrementado de bloqueo A-V y bradicardia. Antidiabéticos: enmascara signos de hipoglicemia y potencia los efectos hipoglicemiantes de la insulina. Cimetidina: aumenta sus niveles plasmáticos. Pilocarpina: induce arritmias. Antagoniza la acción de la teofilina y los β -agonistas. Propranolol aumenta riesgo de toxicidad por bupivacaina y lidocaína. Eleva concentraciones plasmáticas de rizatriptán. Antagoniza los efectos de la neostigmina y piridostigmina e incrementa las acciones de los relajantes musculares. Elevan concentraciones séricas del propranolol: cimetidina, propafenona, fluoxetina y clorpromacina. Rifampicina: acelera el metabolismo del propranolol.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: No hay estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas. Sólo se debe usar durante el embarazo si el beneficio que se espera obtener justifica el riesgo potencial para el feto.

Lactancia materna: No se sabe si este medicamento es excretado con la leche humana. Se debe decidir si se suspende la lactancia o la administración del medicamento, teniendo en cuenta la importancia de éste para la madre.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

Existe la posibilidad de reacciones adversas como mareo y trastornos visuales que pueden afectar la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

Puede causar visión borrosa transitoria, los pacientes no deberán manejar u operar maquinarias hasta que se logre la recuperación total de la visión

Sobredosis:

Debido a las características de este preparado no son de esperar fenómenos de intoxicación con el uso tópico. En caso de sobredosificación por ingestión accidental deberán ser tratados con medidas generales.

Propiedades farmacodinámicas:

Dorzolamida:

El clorhidrato de dorzolamida es un potente inhibidor de la AC-II humana. Tras su administración tópica ocular, disminuye la presión intraocular elevada, esté o no asociada con glaucoma.

Mecanismo de acción: La dorzolamida es una sulfonamida que inhibe la anhidrasa carbónica II en los procesos ciliares del ojo resultando en una disminución de la secreción del humor acuoso, al parecer retardando la formación de iones de bicarbonato con la consiguiente reducción del transporte de sodio y de líquido. El resultado es una disminución de la presión intraocular (PIO).

Timolol:

El maleato de timolol es un beta bloqueador beta 1 y beta 2 (no selectivo) sin acción simpaticomimética intrínseca, no deprime el miocardio y no posee acción estabilizadora de la membrana (anestésico local). La aplicación en el ojo produce una disminución de la presión intraocular tanto en ojos normales como en pacientes con glaucoma.

En los pacientes con opacidad del cristalino se mejora la visión alrededor de la opacidad por no haber modificación del diámetro pupilar.

Mecanismo de acción: El maleato de timolol es un bloqueador adrenérgico beta 1 y beta 2 (no selectivo). El mecanismo exacto de su acción hipotensiva en el ojo no se ha establecido. Los estudios de tonografía y fluorofotometría realizados en humanos sugieren que el timolol reduce la presión intraocular al reducir la producción de humor acuoso, pero además se mejora el drenaje. No modifica el diámetro pupilar como los mióticos utilizados en el tratamiento del glaucoma y no produce visión borrosa y alteraciones en la visión nocturna como los mióticos.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Dorzolamida:

Absorción: absorbido hacia la circulación sistémica.

Unión a proteínas plasmáticas: 33% aproximadamente.

Metabolismo: El medicamento primario forma un solo metabolito N-desetilado que inhibe menos la AC-II, pero que inhibe también otra isoenzima menos activa, la AC-I. El metabolito también se acumula en los eritrocitos, donde se une principalmente a la AC-I.

Semivida: cuatro meses aproximadamente.

Eliminación: Después de suspender su administración, la dorzolamida va saliendo de los eritrocitos en proporción no lineal, por lo que hay una rápida disminución inicial de su concentración, seguida de una fase de eliminación más lenta. La mayor parte es excretada sin cambio con la orina; el metabolito también es excretado por esta vía.

Timolol:

Comienzo de la acción: En 30 minutos después de una dosis única.

Tiempo hasta el efecto máximo: En 1 a 2 horas después de una dosis única.

Duración de la acción: Puede mantenerse una reducción significativa de la presión intraocular hasta 24 horas después de una dosis única.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

Mantenga el envase dentro del estuche.

Almacénese en el envase original.

Desechar al mes de abierto el envase.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 15 de diciembre de 2016.

