

## RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

<b>Nombre del producto:</b>	Iliadin® (oximetazolina )
<b>Forma farmacéutica:</b>	Gotas nasales
<b>Fortaleza:</b>	0,50 mg/mL
<b>Presentación:</b>	Estuche por un frasco gotero de PEBD con 20 mL.
<b>Titular del Registro Sanitario, país:</b>	MERCK, S.A., BOGOTÁ DC, COLOMBIA.
<b>Fabricante, país:</b>	ALTEA FARMACÉUTICA, S.A., BOGOTÁ DC, COLOMBIA.
<b>Número de Registro Sanitario:</b>	M-17-028-R01
<b>Fecha de Inscripción:</b>	24 de febrero de 2017.
<b>Composición:</b>	
Cada mL contiene:	
Clorhidrato de oximetazolina	0,50 mg
Cloruro de benzalconio	0,150 mg
<b>Plazo de validez:</b>	24 meses
<b>Condiciones de almacenamiento:</b>	Almacenar por debajo de 30 °C.

### Indicaciones terapéuticas:

ILIADIN® Solución 0.050% Adulto está indicado para el alivio temporal de la congestión nasal en resfrío común, sinusitis, fiebre del heno y otras alergias de las vías respiratorias altas (rinitis alérgica). La acción aparece en pocos minutos y dura hasta 12 horas.

### Contraindicaciones:

ILIADIN® Solución 0.050% Adulto está contraindicado en personas con rinitis seca (inflamación de la piel y la mucosa nasal y costras en la nariz), ya que puede exacerbar la sequedad, en personas hipersensibles al medicamento y en niños menores de 6 años de edad salvo prescripción médica especial, ya que los niños son especialmente propensos a la absorción sistémica resultando en efectos adversos. No debe utilizarse después de intervenciones quirúrgicas transnasales o transorales.

### Precauciones:

Ver Advertencias.

### Advertencias especiales y precauciones de uso:

No debe utilizarse el mismo envase de ILIADIN® por más de una persona, ya que puede dar lugar a contagios.

La supervisión médica está indicada para pacientes con rinitis crónica. También se debe tener especial cuidado en pacientes que sufren de: presión intraocular alta, especialmente glaucoma. Enfermedades cardiovasculares severas como enfermedad coronaria, angina e hipertensión. Desórdenes metabólicos como hipertiroidismo, diabetes mellitus y porfiria. Feocitocroma, hiperplasia de próstata o alguna enfermedad de la próstata con dificultad al orinar (ya que tienen mayor riesgo a padecer de retención urinaria) y pacientes tratados simultáneamente con antidepresivos tricíclicos, inhibidores de monoaminoxidasa y otros medicamentos que aumentan la presión arterial.

Salvo prescripción médica, no administrar dosis mayores a la recomendada y por más de 3 días.

La dosificación excesiva y uso prolongado o continuo, puede disminuir su eficacia y puede dar lugar a congestión de rebote, rinitis medicamentosa, atrofia de la mucosa y rinitis sicca.

Contiene cloruro de benzalconio, puede ser irritante y provocar: reacciones en la piel, inflamación de la mucosa nasal y congestión nasal persistente especialmente con tratamientos de larga duración. Si se sospecha tal reacción, siempre que sea posible, se deberá utilizar un medicamento que no contenga este excipiente

#### **Efectos indeseables:**

ILIADIN® Solución 0.050% Adulto puede causar ardor, escozor, picor, resequedad o hinchazón de la mucosa nasal, estornudos, aumento de la secreción nasal, hemorragia nasal, apnea, "Efecto de rebote" (incremento de la congestión nasal por dosificación excesiva), somnolencia, sedación, dolor de cabeza, insomnio, inquietud, cansancio, fatiga, palpitaciones, taquicardia, hipertensión y reacciones de hipersensibilidad (angioedema, rash y prurito).

#### **Posología y método de administración:**

ILIADIN® Solución 0.050% Adulto está indicado en adultos y niños mayores de 6 años de edad. No debe utilizarse en niños pequeños y bebés.

Adultos: 2 - 3 gotas en cada fosa nasal cada 12 horas.

Niños de 6 a 12 años de edad: 2 gotas en cada fosa nasal cada 12 horas.

Dosis máxima: 8 gotas en total por día en niños de 6-12 años de edad y 12 gotas en total por día para adultos.

Antes de su aplicación se deben eliminar los fluidos nasales existentes, sonándose bien la nariz. Salvo prescripción médica, no administrar dosis mayores a la recomendada y por más de 3 días. La dosis que se olvide deberá aplicarse enseguida si se recuerda en una hora aproximadamente, no hacerlo si se recuerda más tarde. No duplicar la dosis. El uso prolongado debe evitarse, especialmente en niños. Debe transcurrir un intervalo de varios días antes de volver a administrar el producto.

Si los síntomas persisten, descontinuar el tratamiento y consultar al médico.

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

ILIADIN® Solución 0.050% Adulto interactúa con la maprotilina, fenotiazinas, metildopa, antiasmáticos y medicamentos con efecto hipertensivo como los inhibidores de la monoaminoxidasa (I-MAO) y antidepresivos tricíclicos). El uso simultáneo o previo de estos medicamentos, puede conducir a un aumento de la presión arterial debido a la actividad cardiovascular. Se deberá espaciar 2 semanas la toma de estos medicamentos con el uso de ILIADIN® Solución 0.050% Adulto.

#### **Uso en Embarazo y lactancia:**

La oximetazolina puede ser absorbida sistémicamente, por lo que el uso de ILIADIN® Solución 0.050% Adulto no está recomendado durante el embarazo y lactancia.

No se han reportado problemas en embarazadas o neonatos y se desconoce si la oximetazolina es excretada en la leche materna. Por lo que este producto no debe utilizarse sin supervisión médica y excederse en las dosis recomendadas.

Importante para la mujer: Si está embarazada, cree que pudiera estarlo o está dando lactancia materna, consulte a su médico o farmacéutico antes de tomar este medicamento. El consumo de medicamentos durante el embarazo puede ser peligroso para el embrión o para el feto, y debe ser vigilado por su médico.

#### **Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:**

No procede.

#### **Sobredosis:**

La sobredosis puede ocurrir luego de la administración nasal en dosis excesivas, continuas, prolongadas o por ingestión accidental.

En caso de intoxicación aguda con oximetazolina puede presentarse depresión del sistema nervioso central, cardiovascular y pulmonar, alternado con períodos de hiperactividad. Los síntomas de sobredosis pueden ser: taquicardia, palpitations, arritmia cardiaca, sudoración, agitación, midriasis o miosis, náusea, vómitos, cianosis, fiebre, espasmos, edema pulmonar, desórdenes respiratorios o psíquicos, mareos, palidez o disminución de la temperatura corporal. En niños, la sobredosis a menudo causa efectos nerviosos centrales con convulsiones, coma, bradicardia, apnea, así como hipertensión seguida de hipotensión.

Se deben tomar las medidas necesarias según la sintomatología presente y dar terapia de soporte para revertir los efectos tóxicos del sistema nervioso central y cardiovascular. Si es necesario, iniciar medidas para disminuir la fiebre, terapia anticonvulsiva y ventilación con oxígeno. En casos de sobredosis severa se recomienda terapia de cuidados intensivos. Se debe administrar carbón activado, sulfato de sodio (laxante) o realizar un lavado gástrico inmediatamente (en caso de cantidades grandes) debido a que la oximetazolina se absorbe rápidamente. Se puede utilizar un alfa-bloqueador no selectivo como antídoto. Los fármacos vasopresores están contraindicados en casos de sobredosis.

#### **Propiedades farmacodinámicas:**

Mecanismo de acción: La oximetazolina es una amina simpaticomimética de acción directa. Actúa sobre los receptores  $\alpha$ -adrenérgicos de las arteriolas de la mucosa nasal produciendo constricción, resultando en una disminución del riego sanguíneo y por lo tanto de la congestión nasal.

Derivado imidazólico de amina simpaticomimética. El fármaco está relacionado estructural y farmacológicamente con la nafazolina, tetrahidrozolina y xilometazolina.

La oximetazolina contenida en productos medicinales para uso intranasal tiene un efecto simpaticomimético, vasoconstrictor y por lo tanto un efecto descongestionante en las membranas de la mucosa.

La aplicación de oximetazolina en las fosas conlleva a la descongestión de la mucosa inflamada y por ende a la normalización de la respiración nasal.

La descongestión de la mucosa nasal también abre y dilata los ductos eferentes de los senos paranasales y limpia el tubo auditivo. Esto facilita la descarga de la secreción y combate la invasión bacteriana.

Los efectos antivirales de las soluciones que contienen oximetazolina fueron demostrados en estudios con células virales infectadas cultivadas (acercamiento terapéutico). Este

mecanismo de acción casual fue demostrado por la inhibición de la actividad de los virus, por ejemplo Rinovirus Humano (HR) y Virus de Influenza A.

La actividad antiviral fue demostrada utilizando una placa de reducción, determinación de infección residual (titulación de virus), así como el ensayo de inhibición CPE.

Los efectos antiinflamatorios y antioxidativos de la oximetazolina han sido demostrados en varios estudios.

La producción de los mediadores de lípidos del ácido araquidónico es significativamente influenciado por los macrófagos alveolares estimulados por la oximetazolina in ex vivo. Particularmente debido a la inhibición-inducida por oximetazolina de la actividad de la enzima 5-lipoxigenasa, la formación de las moléculas señales proinflamatorias (LTB<sub>4</sub>) es suprimida mientras en paralelo la síntesis de las sustancias mensajeras antiinflamatorias (PGE<sub>2</sub>, 15-HETE) aumentan.

La oximetazolina también inhibe la forma inducida de la sintasa nitrógeno monóxido (iNOS) en macrófagos alveolares cultivados de largo plazo.

La oximetazolina inhibe significativamente el estrés oxidativo desencadenado por las partículas ultrafinas de carbón en macrófagos alveolares primarios.

Suprime la peroxidación de lípidos de los microsomas a sistema hierro/Ascorbato (efecto antioxidativo).

Los efectos inmunomodulatorios de la oximetazolina fueron demostrados en células mononucleares periféricas de la sangre humana (PBMC). La oximetazolina reduce significativamente la formación de citoquinas (IL1 $\beta$ , IL6 y TNF $\alpha$ ). En adición, la oximetazolina inhibe las propiedades inmunoestimuladoras de las células dendríticas.

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

El efecto de la oximetazolina se da en pocos minutos y persiste hasta 12 horas.

La absorción relevante con una dosis farmacodinamicamente efectiva de oximetazolina, siguiendo el uso recomendado, se considera poco común pero no debe ser excluida. Consecuentemente no se esperan efectos sistémicos o reacciones adversas sistémicas con las recomendaciones de uso tópicos de la oximetazolina.

La tasa de absorción ha sido estimada en 3.5% en un estudio realizado en humanos. La máxima concentración plasmática encontrada fue de 8 a 10 horas. La vida media sérica fue 35 horas y la excreción fue medida en heces (1.1% de la dosis aplicada, luego de 48 horas) y orina (2.1% de la dosis aplicada, luego de 96 horas).

La administración oral a sujetos sanos demostró cambios no específicos ECG luego de la administración de 1.8 mg de oximetazolina- esto es equivalente a 3.6 ml de una solución 0.05%. La presión sanguínea y el ritmo del pulso no fueron afectados por la toma de esta cantidad de sustancia activa.

La biodisponibilidad sistémica de oximetazolina es de 0.0035 a 0.007 mg; mientras que los efectos sistémicos se alcanzan a dosis superiores a los 1.8 mg.

Datos preclínicos de seguridad: La dosis repetida de oximetazolina nasal en estudios toxicológicos en perros no revelaron ningún riesgo de seguridad para seres humanos. Un ensayo de mutagenicidad in vitro en bacteria resultó negativo. No hay ningún dato disponible con relación a carcinogenicidad. No se observaron efectos teratogénicos en ratas y conejos. Dosis mayores a la terapéutica tuvieron efectos embriofetales o condujeron al crecimiento fetal retardado. La producción de leche se inhibió en ratas. No hay evidencia de desórdenes de fertilidad.

Estudios preclínicos han indicado que el cloruro de benzalconio puede desencadenar un efecto ciliar tóxico, incluyendo inmovilidad irreversible dependiente del tiempo de exposición y concentración, así como también alteraciones histopatológicas de la mucosa nasal.

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

No procede.

**Fecha de aprobación/ revisión del texto:** 24 de febrero de 2017.