

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

ELEBLOC 20 mg/ml colirio en solución

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Cada ml de Elebloc 20 mg/ml colirio contiene 20 mg de hidrocloreto de carteolol.

Excipiente con efecto conocido: 1 ml de solución contiene 0,05 mg de cloruro de benzalconio.

Para consultar la lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Colirio en solución.

Solución transparente e incolora, con un pH de 6,0 a 7,5.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1. Indicaciones terapéuticas

Elebloc está indicado en adultos para el tratamiento de la hipertensión intraocular y el glaucoma crónico de ángulo abierto.

4.2. Posología y forma de administración

Posología

Uso en adultos, incluidos pacientes de edad avanzada

Se recomienda iniciar el tratamiento con la dosis de carteolol más baja disponible. Si la respuesta clínica no es suficiente, se puede modificar la dosis a una gota de Elebloc 20 mg/ml instilada dos veces al día (mañana y tarde) en el ojo(s) afectado(s).

La dosis diaria no debe ser superior a dos gotas en cada ojo afectado.

La administración diaria de una sola gota de colirio puede ser suficiente en algunos pacientes, sobre todo cuando se ha obtenido la estabilización de la presión intraocular.

Dado que la normalización de la presión intraocular por el colirio de carteolol puede tardar varias semanas, la evaluación del tratamiento deberá incluir una determinación de la presión intraocular y una exploración de la córnea al inicio de la terapia y de forma periódica al cabo de aproximadamente 4 semanas de tratamiento.

El oftalmólogo puede considerar necesario combinar el colirio de carteolol con otro u otros tratamientos antiglaucoma (por vía tópica y/o sistémica). El otro colirio administrado de forma concomitante tiene que administrarse al menos 5 minutos antes que Elebloc.

Si el paciente olvida administrarse la dosis correspondiente, se debe recomendar que se la administre tan pronto como se acuerde. Sin embargo, si ya es casi la hora de la siguiente dosis, no se debe administrar la dosis olvidada y debe continuar con la siguiente dosis de su régimen habitual.

Pacientes de edad avanzada

No se dispone de datos que relacionen la edad con los efectos de carteolol en los pacientes de edad avanzada. Sin embargo, se recomienda precaución en la utilización de carteolol en pacientes de edad avanzada ya que dichos pacientes presentan con mayor probabilidad problemas cardíacos y enfermedades periféricas vasculares relacionadas con la edad (ver sección 4.4).

Uso en insuficiencia hepática y renal

No se ha establecido la seguridad y eficacia de este medicamento en pacientes con insuficiencia hepática o renal.

Población pediátrica

No se ha establecido la seguridad y eficacia de Elebloc en pacientes pediátricos. No se dispone de datos.

Forma de administración

Vía oftálmica.

Los pacientes deben ser instruidos para instilar el medicamento en el saco conjuntival con la cabeza hacia atrás y el ojo bien abierto. Después de la instilación, presionar el conducto nasolagrimal con la yema del dedo o cerrar los ojos durante 2 minutos. Esto puede producir una disminución de las reacciones adversas sistémicas y un aumento de la actividad local.

Para evitar una posible contaminación de la punta del cuentagotas y de la solución, se debe tener la precaución de no tocar los párpados, áreas circundantes ni otras superficies con la punta del frasco. Indique a los pacientes que deben mantener el frasco bien cerrado cuando no se utilice y que retiren el anillo de plástico del precinto antes de utilizar, para evitar lesiones en los ojos.

Si se emplea más de un medicamento por vía oftálmica, las aplicaciones deben espaciarse al menos 5 minutos. Las pomadas oftálmicas deben administrarse en último lugar.

4.3. Contraindicaciones

- Hipersensibilidad al principio activo, a otros betabloqueantes o a alguno de los excipientes incluidos en la sección 6.1.
- Enfermedad reactiva de las vías respiratorias incluyendo asma bronquial o antecedentes de asma bronquial, enfermedad pulmonar obstructiva crónica grave.

Bradicardia sinusal, síndrome del nodo sinusal enfermo, bloqueo sinoauricular, bloqueo auriculoventricular de segundo o tercer grado no controlado por marcapasos. Insuficiencia cardíaca manifiesta, shock cardiogénico.

4.4. Advertencias y precauciones especiales de empleo

General

Al igual que otros medicamentos oftálmicos de aplicación tópica, carteolol se absorbe sistémicamente. Debido al componente beta adrenérgico carteolol, se pueden producir el mismo tipo de reacciones adversas cardiovasculares, pulmonares y de otro tipo que se observan con beta bloqueantes sistémicos. La incidencia de reacciones adversas sistémicas después de administración oftálmica es menor a la de administración sistémica. Para reducir la absorción sistémica, ver sección 4.2.

Trastornos cardíacos

En pacientes con enfermedades cardiovasculares (p.ej. cardiopatía coronaria, angina Prinzmetal e insuficiencia cardíaca) e hipotensión, se debe valorar de manera estricta el tratamiento con betabloqueantes y se debe considerar el tratamiento con otros principios activos. Se debe vigilar a los pacientes con enfermedades cardiovasculares en busca de signos de deterioro asociados a estas enfermedades y de reacciones adversas.

Debido a su efecto negativo sobre el tiempo de conducción, los betabloqueantes solo se deben administrar con precaución en pacientes con bloqueo cardiaco de primer grado.

Trastornos vasculares

Los pacientes con alteraciones/trastornos circulatorios periféricos graves (p.ej. formas graves de la enfermedad de Raynaud o síndrome de Raynaud) se deben tratar con precaución.

Trastornos respiratorios

En pacientes asmáticos se han notificado reacciones respiratorias, incluyendo muerte debida a broncoespasmo, después de la administración de algunos betabloqueantes oftálmicos.

Elebloc se debe utilizar con precaución en pacientes con enfermedad pulmonar obstructiva crónica (EPOC) leve/ moderada y solamente si el beneficio potencial supera al riesgo potencial.

Hipoglucemia/diabetes

Los betabloqueantes se deben administrar con precaución en pacientes propensos a hipoglucemia espontánea o en pacientes con diabetes lábil, ya que los betabloqueantes pueden enmascarar los signos y síntomas de hipoglucemia aguda.

Hipertiroidismo/tirotoxicosis

Los beta-bloqueantes pueden enmascarar los síntomas de hipertiroidismo. Los betabloqueantes pueden enmascarar ciertos signos de tirotoxicosis, en particular los cardiovasculares.

Trastornos corneales

Los betabloqueantes oftálmicos pueden producir sequedad ocular. Los pacientes con enfermedades corneales se deben tratar con precaución.

Los pacientes de edad avanzada que utilizan betabloqueantes oftálmicos, pueden tener mayor riesgo de sensibilidad corneal reducida o anestesia corneal con el consiguiente riesgo de queratitis.

Otros betabloqueantes

Cuando se administra carteolol a pacientes que ya están recibiendo un betabloqueante sistémico, se puede potenciar el efecto sobre la presión intraocular o los efectos sistémicos conocidos de betabloqueo. Se debe controlar estrechamente la respuesta de estos pacientes. No se recomienda el uso de dos beta bloqueantes tópicos (ver sección 4.5).

Reacciones anafilácticas

Durante el tratamiento con betabloqueantes, los pacientes con antecedentes de atopia o de reacciones anafilácticas graves a diversos alérgenos pueden ser más reactivos a la exposición repetida a tales alérgenos. Estos pacientes pueden no responder a las dosis habituales de adrenalina utilizadas en el tratamiento de reacciones anafilácticas (ver sección 4.5).

Desprendimiento coroidal

Se ha notificado desprendimiento coroidal con administración de un tratamiento supresor del humor acuoso (p.ej. timolol, acetazolamida) tras procedimientos de filtración.

Anestesia quirúrgica

Los betabloqueantes oftálmicos pueden bloquear los efectos sistémicos de los agonistas beta-adrenérgicos, p.ej. los de la adrenalina. Se debe informar al anestesista si el paciente está utilizando carteolol.

Debe considerarse una retirada gradual de fármacos bloqueantes de receptores beta-adrenérgicos antes de la anestesia general, debido a que reducen la capacidad de respuesta del corazón a los estímulos reflejos simpáticos mediados por receptores beta-adrenérgicos.

Miastenia gravis

Usar con precaución en pacientes con miastenia gravis, puesto que pueden empeorar los síntomas de esta enfermedad, como debilidad muscular.

Pacientes con insuficiencia renal y/o hepática

Puede ser necesario realizar un ajuste posológico en estos pacientes cuando el colirio beta-bloqueante se administra de forma concomitante con otro beta-bloqueante por vía sistémica.

Tratamientos prolongados

Después de un tratamiento prolongado puede aparecer una disminución de la receptividad al carteolol: no tendría efecto aumentar las instilaciones. Por ello es conveniente, en los tratamientos prolongados, comprobar cada año la ausencia de tolerancia terapéutica.

Uso en deportistas

Se debe advertir a los pacientes que este medicamento contiene carteolol, que puede producir un resultado positivo en las pruebas de control del dopaje.

Usuarios de lentes de contacto

Durante el tratamiento se desaconseja utilizar lentes de contacto debido al riesgo de:

- Disminución de la secreción de las lágrimas unida a todos los betabloqueantes de una forma general.
- Absorción sobre la lentilla de algunos componentes del colirio.

Este medicamento contiene cloruro de benzalconio que puede causar irritación ocular y se sabe que altera el color de las lentes de contacto blandas. Se debe evitar el contacto con las lentes de contacto blandas. Se debe instruir a los pacientes para que se retiren las lentes de contacto antes de la aplicación y esperen 15 minutos después de la instilación de la dosis antes de volvérselas a colocar.

4.5. Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

No se han realizado estudios de interacciones farmacológicas con carteolol.

Existe un posible efecto aditivo que produce hipotensión y/o marcada bradicardia cuando se administra una solución oftálmica betabloqueante de forma concomitante con bloqueantes orales de los canales de calcio, bloqueantes beta-adrenérgicos, antiarrítmicos (incluyendo amiodarona), glucósidos digitálicos, parasimpaticomiméticos, guanetidina.

Se ha notificado ocasionalmente midriasis producida por el uso concomitante de betabloqueantes oftálmicos y adrenalina (epinefrina).

Aunque la cantidad de beta-bloqueante que pasa a la circulación sistémica tras la instilación ocular es muy escasa, el riesgo de interacción farmacológica existe. Por tanto se deben tener en cuenta las interacciones observadas con beta-bloqueantes administrados por vía sistémica.

Los betabloqueantes pueden disminuir la respuesta a la adrenalina usada para tratar reacciones anafilácticas. Se debe prestar una especial atención a los pacientes con antecedentes de atopía o anafilaxis.

4.6. Fertilidad, embarazo y lactancia

Embarazo

No se dispone de datos adecuados relativos al uso de carteolol en mujeres embarazadas. No se debe utilizar este medicamento durante el embarazo a menos que sea claramente necesario. Para reducir la absorción sistémica, ver sección 4.2.

Estudios epidemiológicos no han revelado efectos de malformación, pero muestran un riesgo de retraso en el crecimiento intrauterino cuando se administran betabloqueantes por vía oral. Además, se han observado en neonatos signos y síntomas de betabloqueo (p.ej. bradicardia, hipotensión, disnea e hipoglucemia)

cuando se administran betabloqueantes hasta el parto. Se debe monitorizar cuidadosa y rigurosamente al neonato durante los primeros días de vida, si se administra Elebloc hasta el parto.

Lactancia

Los betabloqueantes se excretan en la leche materna. Sin embargo, a las dosis terapéuticas de carteolol colirio no es probable que se pueda presentar una cantidad suficiente en la leche materna que pueda causar síntomas clínicos de betabloqueo en el lactante. Para reducir la absorción sistémica, ver sección 4.2.

No se debe utilizar este medicamento durante la lactancia a menos que la evaluación beneficio-riesgo justifique su uso. Si el tratamiento con carteolol se considera necesario para el beneficio de la madre, se debe considerar la posibilidad de interrumpir la lactancia.

Fertilidad

No se dispone de datos sobre el uso de este medicamento en relación a la fertilidad.

4.7. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

Este medicamento tiene una influencia nula o insignificante sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Sin embargo, como con cualquier otro colirio, puede aparecer visión borrosa transitoria y otras alteraciones visuales que pueden afectar la capacidad de conducir o utilizar máquinas. Si aparece visión borrosa durante la instilación, el paciente debe esperar hasta que la visión sea nítida antes de conducir o utilizar máquinas.

4.8. Reacciones adversas

Tabla resumen de reacciones adversas

Se han notificado las siguientes reacciones adversas después de la administración oftálmica con este medicamento. También las siguientes reacciones adversas se han observado con betabloqueantes oftálmicos y pueden ocurrir potencialmente con Elebloc. La frecuencia no puede estimarse a partir de los datos disponibles (frecuencia no conocida):

Sistema de clasificación de órganos	Término preferido MedDRA
Trastornos del sistema inmunológico	Reacciones alérgicas sistémicas incluyendo angioedema ² , urticaria ² , erupción cutánea generalizada y localizada ² , prurito ² , reacción anafiláctica ²
Trastornos del metabolismo y de la nutrición	Hipoglucemia ²
Trastornos psiquiátricos	Insomnio ² , depresión ² , pesadillas ² , pérdida de memoria ²
Trastornos del sistema nervioso	Síncope ² , accidente cerebrovascular ² , isquemia cerebral ² , incremento de los signos y síntomas de miastenia gravis ² , mareo ² , parestesia ² , cefalea ^{1,2}
Trastornos oculares	Signos y síntomas de irritación ocular ¹ (p.ej. quemazón, punzadas, picor, lagrimeo, enrojecimiento) ² , blefaritis ² , queratitis ² , visión borrosa y desprendimiento coroidal después de cirugía de filtración (ver sección 4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo) ² , sensibilidad corneal disminuida ² , sequedad ocular ² , erosión corneal ² , ptosis ² , diplopía ² , conjuntivitis ^{1,2} ,

	hipostesia ocular ¹
Trastornos cardíacos	Bradycardia ^{1,2} , dolor torácico ² , palpitaciones ² , edema ² , arritmia ² , insuficiencia cardíaca congestiva ² , bloqueo auriculoventricular ^{1,2} , parada cardíaca ² , insuficiencia cardíaca ²
Trastornos vasculares	Hipotensión ² , enfermedad de Raynaud ² , manos y pies fríos ²
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	Broncoespasmo (fundamentalmente en pacientes con enfermedad broncoespástica preexistente) ² , disnea ² , tos ²
Trastornos gastrointestinales	Disgeusia ² , náuseas ² , dispepsia ² , diarrea ² , sequedad de boca ² , dolor abdominal ² , vómitos ²
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	Alopecia ² , rash psoriasiforme o exacerbación de psoriasis ² , erupción cutánea ²
Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo	Mialgia ²
Trastornos del aparato reproductor y de la mama	Disfunción sexual ² , disminución de la libido ²
Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración	Astenia ^{1,2} /fatiga ²

¹ reacciones adversas observadas con Elebloc

² reacciones adversas adicionales observadas con betabloqueantes oftálmicos

Descripción de reacciones adversas seleccionadas

En algunos pacientes con córneas significativamente dañadas, se han notificado muy raramente casos de calcificación corneal relacionados con el uso de colirios que contienen fosfatos.

Al igual que otros medicamentos oftálmicos administrados de forma tópica, carteolol se absorbe en la circulación sistémica. Esto puede causar reacciones adversas similares a las observadas con betabloqueantes sistémicos. La incidencia de reacciones adversas sistémicas después de la administración oftálmica es menor que para la de administración sistémica. Las reacciones adversas enumeradas incluyen reacciones observadas dentro del grupo de los beta-bloqueantes oftálmicos. Para reducir la absorción sistémica, ver sección 4.2.

Notificación de sospechas de reacciones adversas

Es importante notificar sospechas de reacciones adversas al medicamento tras su autorización. Ello permite una supervisión continuada de la relación beneficio/riesgo del medicamento. Se invita a los profesionales sanitarios a notificar las sospechas de reacciones adversas a través del Sistema Español de Farmacovigilancia de Medicamentos de Uso Humano: www.notificaRAM.es

4.9. Sobredosis

Una sobredosis oftálmica de este medicamento puede eliminarse del ojo(s) con agua templada. En caso de ingestión accidental, puede ser adecuado evitar más absorción (lavado gástrico o carbón activado).

Los signos y síntomas más frecuentes de una sobredosis con betabloqueantes son bradicardia, hipotensión, broncoespasmo e insuficiencia cardíaca congestiva. Si esto ocurre, interrumpa el tratamiento e inicie un tratamiento de mantenimiento adecuado.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1. Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Oftalmológicos; Preparados contra el glaucoma y mióticos; Agentes betabloqueantes; Carteolol, código ATC: S01ED05

Mecanismo de acción

Elbloc contiene el principio activo hidrocloreto de carteolol. Carteolol es un betabloqueante no cardioselectivo, con actividad simpaticomimética intrínseca moderada (agonista parcial) y sin acción anestésica local (estabilizante de membrana).

El mecanismo exacto de la acción hipotensora de los betabloqueantes oftálmicos no ha sido establecido. Sin embargo, parece ser que reducen la producción de humor acuoso, como demuestran la tonografía y fluorofotometría. Se puede considerar como mecanismo adicional el ligero incremento en el drenaje del humor acuoso. El colirio de carteolol disminuye la presión intraocular, asociada o no a glaucoma. Los betabloqueantes oftálmicos tienen poco o ningún efecto sobre el tamaño de la pupila o la acomodación comparado con la miosis producida por los colinérgicos.

Efectos farmacodinámicos

Su actividad se manifiesta algunos minutos después de la instilación, alcanzando un máximo en 2-4 horas y es aún detectable al cabo de 24 horas.

Estabilidad del efecto hipotensor en el tiempo: el efecto puede permanecer estable durante un año.

Sin embargo, es posible una reducción de la sensibilidad al hidrocloreto de carteolol, fundamentalmente tras un tratamiento más prolongado.

5.2. Propiedades farmacocinéticas

Después de administración oftálmica, carteolol se absorbe rápidamente en el humor acuoso alcanzando en 1 hora concentraciones de aproximadamente 850 ng/ml. Las concentraciones en humor acuoso después de 12 horas se mantuvieron 300 veces mayores que las K_i *in vitro* y con una concentración plasmática todavía medible (1.61 ng/ml). Después de la administración oftálmica de 20 mg/ml de hidrocloreto de carteolol, la exposición plasmática fue relativamente baja con valores medios de AUCs de 10,27 ng·h/ml en pacientes y 9,36 ng·h/ml en voluntarios sanos.

Después de administración oral, la vida media de eliminación en plasma fue de aproximadamente 5 horas en humanos. Carteolol es poco propenso a acumularse tras dosis orales. El volumen de distribución después de la administración intravenosa de carteolol fue de aproximadamente 4 l/Kg en voluntarios sanos. Carteolol se une levemente a las proteínas plasmáticas (20-30%).

La principal vía de eliminación sistémica es la excreción renal y se deben ajustar las dosis orales con un aclaramiento de creatinina disminuido. En el metabolismo hepático oxidativo, el hidrocloreto de carteolol es metabolizado mayoritariamente por la isoforma CYP2D6 del citocromo P450. Carteolol no posee efectos estimulantes ni inhibitorios sobre las isoformas CYP1A2, 2C9, 2C19, 2E1 y 3A4. No se dispone de datos sobre el metabolismo tras la administración ocular de carteolol en humanos.

5.3. Datos preclínicos sobre seguridad

Pruebas de mutagenicidad que incluyen test de Ames, ensayo recombinante (rec), citogenética *in vivo* y ensayo letal dominante, no mostraron evidencia de potencial mutagénico.

El hidrocloreto de carteolol no provocó efectos carcinogénicos en estudios de 2 años de duración, realizados en ratas y ratones con dosis de hasta 40 mg/kg/día.

La fertilidad de ratas y ratones macho y hembra, no se vio afectada con la administración de hidrocloreto de carteolol con dosis de hasta 150 mg/kg/día.

El hidrocloreto de carteolol produjo materna toxicidad e incrementó la incidencia de reabsorciones y redujo los pesos fetales en conejos y ratas con dosis de aproximadamente 1052 y 5264 veces la dosis oral humana máxima recomendada (10 mg/70kg/día), respectivamente. Se observó un aumento dosis dependiente en costillas onduladas durante el desarrollo fetal de ratas cuando las hembras preñadas recibieron dosis diarias de aproximadamente 212 veces la dosis oral máxima recomendada en humanos. No se observaron estos efectos en ratones preñados que recibieron hasta 1052 veces la dosis oral humana máxima recomendada.

Carteolol se excreta en la leche de ratas lactantes.

Datos limitados procedentes de estudios realizados en ratones, ratas y conejos, no parecen indicar que carteolol presente efectos teratogénicos.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1. Lista de excipientes

Cloruro de benzalconio
Cloruro de sodio
Fosfato sódico monobásico
Hidrogenofosfato de disodio dodecahidrato
Agua purificada

6.2. Incompatibilidades

No procede.

6.3. Periodo de validez

Frasco sin abrir: 3 años.

Tras la primera apertura del frasco: 4 semanas.

6.4. Precauciones especiales de conservación

No conservar a temperatura superior a 25°C.

6.5. Naturaleza y contenido del envase

Frasco de polietileno con tapón de polipropileno que contiene 5 ml de colirio en solución.

6.6. Precauciones especiales de eliminación y otras manipulaciones

Ninguna especial.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

Immedica Pharma AB
SE-113 63 Estocolmo
Suecia

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

59.039

9. FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN/ RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN

Mayo 1991 / Mayo 2011

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Octubre 2016

La información detallada de este medicamento está disponible en la página web de Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS) <http://www.aemps.gob.es/>