

Nuevos principios activos

EPINASTINA

RELESTAT 05, mg/ml 1 frasco colirio sol PVP: 11,17 € Allergan, S.A.E.

Con receta médica. Aportación: 40%.
Código ATC: S01GX.

Epinastina es un nuevo antihistamínico (anti-H₁) antialérgico, autorizado por vía oftálmica a través de procedimiento europeo de Reconocimiento Mutuo, siendo el país de referencia Suecia. Es un derivado dibenzoazepínico, química y farmacológicamente relacionado con la azelastina y emedastina.

Su indicación autorizada es el tratamiento de los síntomas de la conjuntivitis alérgica estacional.

Actúa como antagonista directo de los receptores H₁ de la histamina inhibiendo su liberación de los mastocitos que, al aplicarse ocularmente produce su efecto antialérgico modulando la acumulación de células inflamatorias y estabilizando los mastocitos, principales responsables de la respuesta alérgica. Presenta también afinidad por los receptores α_1 y α_2 adrenérgicos y 5HT₂ y baja en el caso de los receptores H₂.

La dosis recomendada es de una gota en cada ojo afectado dos veces al día, por un periodo máximo de 8 semanas, no necesitándose ajuste de dosis en ningún caso.

Por su aplicación oftálmica, se absorbe poco a nivel sistémico y no atraviesa la barrera hematoencefálica. Se metaboliza menos del 10% excretándose prácticamente de forma inalterada por orina con una semivida de eliminación de unas 8 horas.

El dossier clínico de evaluación incluye varios ensayos clínicos (unos experimentales en 200 pacientes y otros ambientales en 1.029 pacientes), todos ellos aleatorizados, doble-enmascarado y controlados con placebo, algunos multicéntricos. La principal variable de eficacia fue la medida de la sintomatología (prurito, lagrimeo y sensación de cuerpo extraño) según puntuación total a través de una escala analógica visual (0-100). De todos los estudios se destacan dos de ellos en los que se evidenció la eficacia (en relación a la reducción del picor conjuntival) de la *epinastina* frente a placebo o levocabastina, siendo superior en el primer caso y similar en el segundo.

En todos los estudios la *epinastina* presentó una buena tolerancia, con una incidencia de reacciones adversas inferior al 10%, citándose como mas frecuente la sensación de quemazón en el ojo; dado que no atraviesa la BHE no produce sedación.

Se encuentra contraindicada sólo en caso de hipersensibilidad y se debe tener precaución en su administración en personas que utilicen lentes de contacto. Dado que se desconoce su efecto en embarazo y lactancia, se desaconseja su uso y, en cuanto a las interacciones no cabe esperar que ocurran dado su escasa absorción sistémica.

COSTE TRATAMIENTO/DÍA*	Dosis**	Euros
Epinastina	2 gotas	0,22
Emedastina	2 gotas	0,24
Azelastina	2 - 4 gotas	0,15 - 0,30

(*): Por ojo afectado. (**): 1 gota = 0,05 ml.

BIBLIOGRAFÍA RECOMENDADA

- Relestat®. Ficha Técnica de la especialidad e Informe de Evaluación . AGEMED. Mº Sanidad y Consumo 2004.
- *Drugdex Drug Evaluations y P&T Quik Reports: Epinastine*. Micromedex® Healthcare Series. Vol. 121 (2004).
- Anon. Epinastine ophthalmic solution. *Med Lett Drugs Ther* 2004; 46: 35-36
- Anon. Nuevos productos: Epinastina. *PAM* 2004; 29 (274): 469-473.

TERIPARATIDA

FORSTEO 20 mcg/80 mcl sol.iny.jer.prec. PVP: 403,17 € Lilly, S.A.

Con receta médica. Aportación: 40%.
Código ATC: H05AA02.

Teriparatida es el primer anabólico análogo de la parathormona (PTH) que actúa estimulando la formación de ósea (los ya autorizados actúan por inhibición de la reabsorción ósea), que ha sido autorizado por procedimiento europeo centralizado. Es un polipéptido sintético de origen recombinante con estructura similar a la PTH humana endógena, ya que es un fragmento activo desde el N-terminal (secuencia de los aminoácidos 1-34) de la hormona.

Se encuentra indicada en el tratamiento de la osteoporosis establecida en mujeres postmenopáusicas.

Actúa estimulando la formación ósea por efecto directo sobre las células formadoras de hueso (osteoblastos) aumentando de forma indirecta la absorción de calcio y aumentando en riñón la reabsorción tubular de calcio y excreción de fosfato.

La dosis recomendada es de 20 mcg administrados una vez al día vía subcutánea (sc) durante un máximo de 18 meses, junto a un aporte de calcio y vitamina D si no suficiente el del aporte dietético.

Presenta un biodisponibilidad alta del 95% alcanzando la $C_{máx}$ a los 30 minutos de su administración, con escaso metabolismo a nivel hepático y excreción renal; su semivida de eliminación es de 1 hora.

El dossier de evaluación clínica incluye varios ensayos clínicos destacándose principalmente tres de ellos, uno pivotal y dos comparativos (vs alendronato o terapia hormonal sustitutiva-THS); la variable principal de eficacia en ambos fue la reducción en el número de nuevas fracturas vertebrales (determinadas por radiografía) y como secundarias la reducción en el número de fracturas no vertebrales y el aumento de la densidad mineral ósea (DMO):

- Pivotal.- doble-ciego, multicéntrico, randomizado y controlado con placebo evaluó la eficacia y seguridad de dos dosificaciones de *teriparatida* (20 y 40 mcg) en 1.637 mujeres postmenopáusicas (de al menos 5 años) tratadas durante un periodo medio de 19 meses junto a suplementos de calcio (100mg/día) y vitamina D (400 UI/día). Al finalizar el tratamiento se observó una reducción de las fracturas estadísticamente significativa:
 - Nuevas fracturas: 14,3% placebo vs 5 y 4,4% *teriparatida* (20 y 40 mcg respectivamente).
 - Fracturas múltiples: 4,9% placebo vs 1,1 y 0,7% *teriparatida* (20 y 40 mcg respectivamente). Riesgo relativo *teriparatida* vs placebo 0,35%.
 - Frecuencia de fracturas no vertebrales: 9,7% placebo vs 6,3 y 5,8% *teriparatida* (20 y 40 mcg respectivamente). Reducción del riesgo relativo *teriparatida* (20 y 40 mcg) vs placebo 0,35 y 0,40% respectivamente.
 - DMO: aumentó significativamente en un 9% en lumbar y 4% en cadera.
- Comparativo vs alendronato.- doble-ciego y randomizado en 146 mujeres tratadas con *teriparatida* (40mcg/día, sc) o alendronato (10 mg/día, oral) durante una media de 14 meses junto a suplementos de calcio (100mg/día) y vitamina D (400-1.200 UI/día) en el que la variable principal de eficacia fue el cambio de DMO en lumbar y como secundaria la DMO en cadera. Al final del estudio se observó una

variación media de la DMO lumbar del 5,62% alendronato vs 12,21% *teriparatida*.

- Comparativo vs THS.- doble-ciego y randomizado en 247 mujeres tratadas o no previamente (durante al menos 1 año) con THS a las que se administró conjuntamente *teriparatida* (40mcg/día, sc) o placebo durante una media de 14 meses junto a suplementos de calcio (100mg/día) y vitamina D (400-1.200 UI/día) en el que la variable principal de eficacia fue el cambio de DMO en columna vertebral y como secundaria la DMO en cadera, femoral y total. Al final del estudio se observó un aumento de la DMO vertebral del 1,47% con THS y 11,19% con *teriparatida* en pacientes previamente tratadas con THS; en aquellas no tratadas previamente los incrementos de la DMO fueron mayores 4,58% con THS y 16,93% con *teriparatida*.

En los ensayos clínicos, la incidencia de reacciones adversas fue similar al grupo placebo, siendo las mas frecuentes: nauseas, dolor en extremidades, cefalea y mareo.

Se encuentra contraindicado su uso en caso de hipersensibilidad, insuficiencia renal grave, hipercalcemia, elevación inexplicada de fosfatasa alcalina, pacientes tratados con radioterapia ósea o con enfermedades óseas metabólicas, niños, embarazo y lactancia. Debe utilizarse con precaución en pacientes con insuficiencia renal moderada o urolitiasis activa.

Los estudios de interacción no han mostrado, por el momento, ninguna interacción importante.

COSTE TRATAMIENTO/DÍA*	Dosis	Euros
Teriparatida	20 mcg (sc)	10,75
Alendronato	10 mg (oral)	1,44
Raloxifeno	60 mg (oral)	1,34
Calcitonina salmón	200 UI (nasal)	2,70 - 3,16*

(*): Por variabilidad de precio.

BIBLIOGRAFÍA RECOMENDADA

- Forsteo®. Ficha Técnica de la especialidad . The European Agency for the Evaluation of Medicinal Products (EMA). Committee for Proprietary Medicinal Products (CPMP). European Public Assessment Report (EPAR): Forsteo®. <http://www.eudra.org/emea.html>
- *Drugdex Drug Evaluations* y *P&T Quik Reports: Teriparatide*. Micromedex® Healthcare Series. Vol. 121 (2004).

- UK Medicines Information Pharmacists Group (NHS). New medicines: Teriparatide (issue 03/05). <http://www.ukmi.nhs.uk/NewMaterial/html/docs/teriparatide.pdf>
- Cappuzzo KA, Delafuente JC. Teriparatide for severe osteoporosis. *Ann Pharmacother* 2004; 38: 294-302.
- Cada DJ, Levien T, Baker DE. Teriparatide (Formulary drug reviews). *Hosp Pharm* 2003; 38: 463-470.
- Anon. Teriparatide for osteoporosis. *Med Lett Drugs Ther* 2003; 45: 9-10
- Anon. Nuevos productos: Teriparatida. *PAM* 2004; 28 (274): 446-456.