OSELTA

OSELTAMIVIR 60 mg/5 mL

FORMULA:

Cada 5 mL de suspensión reconstituida contiene:

Oseltamivir (Equiv. a 78,7 mg de Oseltamivir Fosfato)..........60 mg.

Excipientes.............................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Inhibidor selectivo de la neuraminidasa.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

El Fosfato de Oseltamivir es la prodroga del metabolito activo Carboxilato de Oseltamivir, el cual es un potente inhibidor selectivo de las enzimas neuraminidasas del virus de la gripe, las cuales son glicoproteínas de la superficie del virión.

La actividad de las neuraminidasas es fundamental para que las partículas víricas abandonen las células infectadas y prosiga la diseminación de virus infecciosos por el organismo. El metabolito activo, Carboxilato de Oseltamivir reduce la liberación de los virus infecciosos de la gripe A y B de las células infectadas.

Farmacocinética: Absorción: Tras la administración oral de Fosfato de Oseltamivir, el Oseltamivir se absorbe rápidamente en el tubo digestivo y se convierte en su metabolito activo por acción de las esterasas hepáticas. A los 30 minutos ya se detectan las concentraciones plasmáticas del metabolito activo y alcanzan sus valores máximos entre las 2 y 3 horas después de la ingestión de la dosis. Al menos el 75% de una dosis alcanza la circulación general en forma de metabolito activo.

Distribución: El Carboxilato de Oseltamivir llega a todos los lugares fundamentales de la proliferación de los virus. Se une en muy bajo porcentaje, aproximadamente 3%, a las proteínas humanas.

Estos valores son insuficientes para provocar interacciones farmacológicas importantes.

Metabolismo: El Fosfato de Oseltamivir se transforma ampliamente en su metabolito activo por acción de las esterasas localizadas preferentemente en el hígado y la pared intestinal. Ni el Oseltamivir ni su metabolito activo son sustratos o inhibidores de las isoenzimas del sistema citocromo P450.

Eliminación: El Fosfato de Oseltamivir absorbido se elimina principalmente (90%) por biotransformación en su metabolito activo. Éste, por su parte, no se metaboliza y se elimina con la orina. Las concentraciones plasmáticas máximas del metabolito activo descienden con una vida media de 6 a 10 horas en la mayoría de las personas. El metabolito activo se elimina casi por completo (99%) por excreción renal.

Se recomienda ajustar la dosis en los pacientes con un clearance de creatinina inferior a 30 mL/min. Dado que no hay datos sobre pacientes con insuficiencia renal y cifras de clearance de creatinina inferiores a 10 mL/min, conviene extremar las precauciones cuando se administre este fármaco a tales pacientes.

Niños: Se encontró que en los niños de menor edad era más rápido el clearance del Fosfato de Oseltamivir y de su metabolito activo que en los de mayor edad, lo cual significa una exposición más reducida a una dosis dada en mg/kg. La exposición a una dosis de 2 mg/kg en niños de 2 a 8 años equivale a la de una dosis única de una cápsula de 75 mg en adultos (alrededor de 1 mg/kg). A medida que avanza la edad, la diferencia de exposición entre niños y adultos (en mg/kg) disminuye hasta desaparecer prácticamente después de los 12 años de edad.

Ancianos: La vida media del Carboxilato de Oseltamivir en plasma, es similar a la descrita para adultos jóvenes, sumado esto a la tolerancia a la droga demuestra que no hay necesidad de ajustar la dosis en pacientes ancianos.

Pacientes con insuficiencia renal: La administración de Carboxilato de Oseltamivir a pacientes con diversos grados de insuficiencia renal, demostró que la tolerancia a la exposición al Oseltamivir es inversamente proporcional al grado de insuficiencia. Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con clearance de creatinina inferior a 30 mL/min pero superior a 10 mL/min.

No hay datos disponibles en pacientes con cifras de clearance de creatinina inferiores a 10 mL/min y en pacientes dializados, por lo tanto, conviene extremar las precauciones cuando se administra Oseltamivir.

Pacientes con insuficiencia hepática: En estudios in vitro se encontró que no hay aumento significativo de exposición al Oseltamivir ni disminución significativa de la exposición a su metabolito activo en pacientes con insuficiencia hepática.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Tratamiento de la gripe:

Está indicado para la infección por virus de gripe tipos A y B en adultos y adolescentes mayores de 13 años.

Profilaxis de la gripe:

Está indicado en la profilaxis post-exposición en adultos y adolescentes mayores de 13 años, tras un contacto con un caso de gripe diagnosticado clínicamente, cuando el virus de la gripe está circulando en la comunidad.

POSOLOGIA:

Vía de administración oral.

Cada 1 mL de suspensión extemporánea reconstituida contiene 12 mg de Oseltamivir.

El Oseltamivir no está recomendado para uso en niños menores de 1 año de edad, debido a la escasez de datos sobre seguridad.

Puede tomarse con o sin alimentos. En algunos pacientes puede mejorar la tolerabilidad si se toma con alimentos.

Tratamiento de la gripe:

Para niños de 1 a 12 años de edad: La dosis recomendada para 5 días por peso corporal es: ≤ 15 kg, 30 mg dos veces al día; >15 kg a 23 kg, 45 mg dos veces al día; >23 kg a 40 kg, 60 mg dos veces al día; >40 kg, 75 mg dos veces al día.

Profilaxis de la gripe:

Para niños de 1 a 12 años de edad: La dosis recomendada para 10 días por peso corporal es: ≤ 15 kg, 30 mg una vez al día; >15 kg a 23 kg, 45 mg una vez al día; >23 kg a 40 kg, 60 mg una vez al día; >40 kg, 75 mg una vez al día.

Profilaxis durante una epidemia:

La dosis recomendada para la prevención de la gripe durante un brote en la población es de 75 mg de Oseltamivir, una vez al día hasta 6 semanas.

Poblaciones particulares:

Pacientes con alteración de la función renal: Tratamiento y profilaxis de la gripe: En pacientes con un clearance de creatinina superior a 30 mL/min, no es necesario ajustar la dosis.

En pacientes con clearance de creatinina inferior a 10 mL/min y pacientes dializados, conviene extremar las precauciones cuando se administra Oseltamivir.

Pacientes con alteración de la función hepática: No es necesario ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia hepática.

Ancianos: No se necesitan ajustes posológicos en pacientes ancianos.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al Fosfato de Oseltamivir o algún otro de los componentes de este producto.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

No existe evidencia de la eficacia del Oseltamivir en otra enfermedad excepto la causada por los virus de la influenza tipos A y B. Oseltamivir no es una alternativa a la vacunación antigripal. La utilización de este producto no debe influir sobre la decisión de vacunación antigripal. El Oseltamivir debe ser utilizado en tratamiento y profilaxis de la gripe únicamente si los datos epidemiológicos confirman la circulación del virus.

No se ha establecido la eficacia de Oseltamivir en sujetos con enfermedad cardíaca crónica y/o respiratoria; no se han informado diferencias en la incidencia de complicaciones entre grupos placebo y tratamiento en esta población.

No hay información disponible referente al tratamiento de la influenza en pacientes con alguna condición médica suficientemente severa o inestable como para considerar una urgente hospitalización.

No se ha demostrado la eficacia del Oseltamivir en pacientes inmunocomprometidos.

Una infección bacteriana seria puede comenzar con síntomas similares a la influenza o puede coexistir o aparecer como complicación durante la influenza. El Oseltamivir no previene dichas complicaciones.

Insuficiencia renal severa: Es recomendable el ajuste de dosis en pacientes con clearance de creatinina menor a 30 mL/min.

Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con clearance de creatinina menor a 30 mL/min. Dado que no hay datos sobre pacientes con insuficiencia renal y cifras de clearance de creatinina inferiores a 10 mL/min, conviene extremar las precauciones cuando se administre este fármaco a tales pacientes.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

De la información proporcionada por los estudios de farmacología y farmacocinética del Fosfato de Oseltamivir se deduce que no es probable que se produzcan interacciones medicamentosas clínicamente importantes. El Fosfato de Oseltamivir se convierte ampliamente en su metabolito activo por acción de las esterasas localizadas preferentemente en el hígado. Se han publicado pocas interacciones farmacológicas debidas a la competición por las esterasas. Dada la escasa unión del Oseltamivir y su metabolito activo a las proteínas plasmáticas, no son de esperar tampoco interacciones por desplazamiento farmacológico. De acuerdo con el mecanismo de acción, tampoco hay fundamentos para suponer interacciones con los anticonceptivos orales. Teniendo en cuenta el margen de seguridad de la mayoría de estos fármacos, las características de la eliminación del metabolito activo (filtración glomerular y secreción tubular aniónica) y la capacidad de excreción por estas vías, no es probable que se den interacciones medicamentosas clínicamente importantes. La coadministración de Paracetamol no altera las concentraciones plasmáticas de Oseltamivir, su metabolito activo ni las de Paracetamol. No se han descrito cambios ni en el tipo ni en la frecuencia de los efectos secundarios como resultado de la administración de Oseltamivir con compuestos de uso frecuente como el antibiótico Amoxicilina, analgésicos como Acetaminofen.

Carcinogénesis: Los resultados de estudios convencionales en ratas y ratones indican que el Oseltamivir no es carcinogénico.

Mutagenicidad: Los resultados de las pruebas de mutagenicidad indican que el Oseltamivir no presenta riesgo genético para el hombre.

Fertilidad: En estudios de reproducción animal el Oseltamivir no interfirió con la fertilidad.

Teratogénesis: Como resultado de estudios teratogénicos realizados en ratas y conejos no se ha observado alteración alguna en el desarrollo fetal.

Embarazo y lactancia: Hasta el presente no hay suficientes datos sobre mujeres embarazadas tratadas con Oseltamivir. Los estudios en animales no mostraron efectos indeseables directos o indirectos sobre la gestación y/o el desarrollo embrionario y/o fetal y/o el desarrollo postnatal. El Oseltamivir sólo se debe utilizar durante el embarazo cuando los beneficios esperados justifiquen el riesgo para el feto.

El Oseltamivir y su metabolito activo pasan a la leche de las ratas, no se sabe si son excretadas en la leche humana pero por una extrapolación se deduce que un pequeño porcentaje de ambos es excretado diariamente. Así pues, Oseltamivir sólo deberá utilizarse cuando los beneficios para la madre lactante justifiquen los riesgos para el niño amamantado.

Efectos sobre la capacidad de conducir vehículos y utilizar maquinarias: El Oseltamivir no tiene efecto alguno sobre la capacidad de conducir vehículos y utilizar maquinarias.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Tratamiento de la gripe en adultos y adolescentes:

Las reacciones adversas que pueden presentarse más frecuentemente son náuseas, vómitos, bronquitis, insomnio, vértigo y dolores abdominales. Estas reacciones suelen ser pasajeras y se producen generalmente tras la primera dosis, remitiendo espontáneamente en 1 o 2 días, sin necesidad de interrumpir el tratamiento.

Tratamiento de la gripe en ancianos:

Por lo general, la incidencia de efectos secundarios en pacientes ancianos es cualitativamente semejante al descrito en los adultos jóvenes sanos.

Profilaxis de la gripe:

Con una dosis diaria de 75 mg de Oseltamivir durante un máximo de 6 semanas una vez iniciada la epidemia gripal, los efectos adversos observados tanto en adultos jóvenes como en ancianos fueron semejantes a los registrados en los estudios terapéuticos.

SOBREDOSIFICACION:

Aunque hasta la fecha no se conoce ningún caso de sobredosificación, cabe prever que los síntomas de una sobredosis aguda consistirán en náuseas, con o sin vómitos y vértigo. Hasta ahora no existe antídoto conocido.

En caso de sobredosis o ingesta accidental, consultar al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Ter.: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

RESTRICCIONES DE USO:

Uso profesional.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30 °C

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 1 frasco con polvo para preparar 75 mL de suspensión extemporánea.

Caja conteniendo 1 frasco con polvo para preparar 50 mL de suspensión extemporánea.

Forma de preparar la suspensión: Hervir agua potable, dejar enfriar a temperatura ambiente, cargar el agua en el frasco, hasta la marca donde indica la etiqueta. Agitar el frasco. Volver a medir, y si el volumen de la suspensión no llega a la marca indicada en la etiqueta, agregar agua hasta alcanzarla.

AGITAR ANTES DE CADA USO.

La suspensión puede ser utilizada hasta 7 días después de la reconstitución. Mantenida en heladera.

Este medicamento debe ser usado únicamente por prescripción médica y no podrá repetirse sin nueva indicación del facultativo.

En caso de uso de este medicamento sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quien lo consuma.

Si ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma estos productos sin consultar con su médico.

Director Técnico: Q.F. Laura Ramírez

Reg. Prof. Nº 4.142

Autorizado por D.N.V.S. del M.S.P. y B.S.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.