PIROFLEX® 8

DEXAMETASONA FOSFATO SODICO 8 mg/2 mL

Venta Bajo Receta Solución Inyectable

Industria Paraguaya V.A.: IV/IM

FÓRMULA:

Cada ampolla contiene:

Dexametasona Fosfato Sódico……...................................................................…….........8 mg.

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

ACCION TERAPEUTICA:

Corticosteroide sistémico de acción prolongada - Antiinflamatorio esteroideo - Inmunosupresor.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

La Dexametasona es un glucocorticoide 25 veces más potente que la Hidrocortisona; tiene menor efecto sobre la retención de sodio que ésta y sus derivados. Se absorbe efectivamente cuando se administra por vía intramuscular, con una disponibilidad casi inmediata y se excreta por la orina. Se une en un 68% a las proteínas del plasma, con una vida media de 3–4 horas y vida media biológica de 36 a 54 horas. El volumen de distribución es 0.75 L/Kg; se une linealmente a la albúmina, pero no a la transcortina. La Dexametasona difunde a través de la membrana celular y se une a receptores citoplasmáticos específicos. Luego este complejo entra al núcleo, donde se une a otros factores transcripcionales y al ADN produciendo inducción y represión de genes que llevan a su efecto antiinflamatorio, inmunosupresor y mineralocorticoide leve. La Dexametasona, previene la respuesta tisular y la reacción en cascada del proceso inflamatorio por bloqueo en la producción de prostaglandinas y leucotrienos. Su concentración en los tejidos estabiliza las enzimas lisosomales y actúa manteniendo la integridad capilar y evitando la migración de complejos inmunes a través de las membranas basales. Su efecto sobre los distintos componentes celulares del proceso inflamatorio se ejerce alterando la función de los monocitos, macrófagos y linfocitos–T. Durante la reacción antígeno anticuerpo previene la reacción del macrófago y del mastocito a los factores de migración y de la granulación de este último; asimismo inhibe la fagocitosis y digestión del antígeno.

Inhibe la producción de interleukinas 1 y 2, y el mediador de proliferación de linfocitos–T que normalmente se produce con la exposición de mitógenos. Estos efectos se consideran la base de su efecto antiinflamatorio y bloqueador de la respuesta inmune. Estas acciones corresponden con un mismo mecanismo que consiste en la inhibición de la síntesis de la fosfolipasa A2, enzima que libera los ácidos grasos poliinsaturados precursores de las prostaglandinas y leucotrienos.

La inhibición de los procesos anteriormente descritos por efecto de los glucocorticoides a nivel celular disminuye las manifestaciones clínicas de los procesos patológicos inflamatorios y algunos de tipo inmunológico. La administración a dosis terapéuticas de Dexametasona inyectable en los estadíos tempranos de estos procesos determina un efecto regresivo del proceso celular y en algunos casos puede evitar la fase tardía de fibrogénesis (cicatrizal) del proceso inflamatorio.

La Dexametasona inyectable es uno de los compuestos glucocorticoides más solubles, por lo que las preparaciones inyectables en vehículo acuoso permiten una biodisponibilidad inmediata por vía intravenosa y ligeramente más lenta cuando se administra por vía intramuscular.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Trastornos en los que son deseables los efectos antiinflamatorios e inmunosupresores de los corticosteroides especialmente para el tratamiento intensivo durante periodos cortos.

Traumatología: En enfermedades reumáticas, como terapia adyuvante por períodos cortos (para sobrellevar un episodio agudo o una exacerbación). Osteoartritis post traumática, sinovitis por osteoartritis, artritis reumatoidea incluyendo artritis reumatoidea juvenil. Bursitis aguda y subaguda, epicondilitis, tenosinovitis aguda inespecífica, artritis gotosa aguda y psoriásica. Espondilitis anquilosante.

Endocrinología: Preoperatorio o frente a un traumatismo o enfermedad severa en pacientes con insuficiencia suprarrenal conocida o cuando la reserva suprarrenal es dudosa. Shock que no responde a terapia convencional cuando existe o se sospecha insuficiencia suprarrenal. Hiperplasia adrenal congénita. Tiroiditis no supurativa. Hipercalcemia asociada con cáncer. Test diagnóstico de hiperfunción adrenocortical.

Enfermedades del colágeno: Durante la exacerbación o en casos seleccionados como terapia de mantenimiento en lupus eritematoso sistémico, carditis reumática aguda.

Enfermedades dermatológicas: Pénfigo, eritema multiforme severo (síndrome de Stevens Johnson), dermatitis exfoliativa, dermatitis herpetiforme bullosa, dermatitis seborréica severa,psoriasis severa, micosis fungoides.

Alergias: Severas o incapacitantes que no respondan a las terapias de tratamiento convencionales en asma bronquial, dermatitis de contacto, dermatitis atópica, enfermedad del suero, rinitis alérgica estacional o perenne, reacciones de hipersensibilidad a drogas,reacciones transfusionales, urticarianas, edema laríngeo agudo no infeccioso.

Enfermedades oftálmicas: Severas, agudas o crónicas, como herpes zóster oftálmico, iritis, iridociclitis, coriorretinitis, uveítis y coroiditis difusa posterior, neuritis óptica, oftalmía simpática, inflamación de la cámara anterior, conjuntivitis alérgica, queratitis, úlceras corneales marginales alérgicas.

Enfermedades gastrointestinales: Para estabilizar al paciente en un período crítico en colitis ulcerosa y enteritis regional (en ambos casos como terapia sistémica).

Enfermedades respiratorias: Sarcoidosis sintomática, beriliosis, tuberculosis diseminada o fulminante junto a la terapia antituberculosa correspondiente, síndrome de Loeffler no manejable por otros medios, neumonitis aspirativa.

Desórdenes hematológicos: Anemia hemolítica adquirida (autoinmune), púrpura trombocitopénica idiopática en adultos (la inyección sólo puede administrarse intravenosa, la administración intramuscular está contraindicada), trombocitopenia secundaria en adultos, eritroblastopenia (anemia RBC), anemia hipoplásica congénita (eritroide).

Enfermedades neoplásicas con fines paliativos: Leucemias y linfomas en adultos, leucemia aguda en niños.

Estados edematosos: Para inducir diurésis o remisión de la proteinuria en síndrome nefrótico idiopático no urémico.

Misceláneas: Meningitis tuberculosa con bloqueo subaracnoideo o bloqueo subaracnoideo inminente junto a la terapia antituberculosa correspondiente, triquinosis con compromiso miocárdico o neurológico. Edema cerebral asociado con tumor primario o metastásico, craneotomía, o injuria cefálica.

POSOLOGÍA:

En inyección IM o IV, la dosificación inicial usual puede variar de 0.5 a 24 mg al día. La dosis diaria total no debe ser mayor de 80 mg en infusión continua o fraccionada cada 4, 6 u 8 horas. Dado que las dosificaciones requeridas son variables, éstas se deben individualizar de acuerdo con la enfermedad que se esté tratando y con la respuesta del paciente. Para su empleo en infusión, sólo se pueden utilizar suero glucosado o suero fisiológico. La inyección IV se aplicará lentamente, en un tiempo de al menos 4 o 5 minutos por mL (1 mL = 4 mg). El número de inyecciones y los intervalos entre ellas dependerán enteramente de la reacción del paciente y de la gravedad del caso.

Tratamiento del shock: Dosis IV de 2 a 6 mg/kg administrados lentamente por varios minutos. Las dosis elevadas pueden repetirse al cabo de 2 a 6 horas y es preciso continuar el tratamiento hasta que el paciente se encuentre estable y durante un máximo de 48 a 72 horas.

Edema cerebral: Inicialmente se administra una dosis IV de 10 mg de Fosfato Sódico de Dexametasona seguido de 4 mg por vía IM cada 6 hs dando una respuesta al cabo de 12 a 24 hs así la dosis puede reducirse en 2 a 4 días.

Náuseas y vómitos: Especial para éstos síntomas inducidos luego de la quimioterapia oncológica administrados mediante vía IV 20 mg.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a la Dexametasona y otros glucocorticoides. En general no hay contraindicaciones en los estados en que, con el empleo de glucocorticoides se pueda salvar la vida. Ulcera péptica, infecciones micóticas sistémicas, osteoporosis grave, psicosis o antecedentes de las mismas. En cuadros clínicos no tratados de: Infecciones por herpes simple ocular, psicosis agudas, tuberculosis activa, cuadros infecciosos crónicos, úlcera gastroduodenal activa o latente, insuficiencia renal e hipertensión.

Está contraindicada la administración de vacunas de virus vivos, incluyendo de la viruela, en individuos que reciben dosis inmunosupresoras de corticosteroides, ya que es muy posible que no se tenga la respuesta de anticuerpos séricos que se espera.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Adminístrese con precaución en pacientes con insuficiencia cardíaca congestiva grave, diabetes mellitus, hipertensión arterial, tuberculosis activa a menos que se utilicen medicamentos quimioterapeúticos.

Las dosis medias o elevadas de corticosteroides pueden causar aumento de la presión arterial, retención de sal y agua, y aumento de la excreción de potasio. Existe un efecto aumentado del corticosteroide en pacientes con hipotiroidismo y en aquellos con cirrosis. La suspensión brusca del tratamiento puede causar una insuficiencia adrenocortical secundaria, puede aparecer síndrome de abstinencia que incluye fiebre, mialgias, artralgias y malestar general. El uso prolongado de los corticosteroides puede producir cataratas subcapsulares posteriores, glaucoma con posible daño a los nervios ópticos y aumentar el establecimiento de infecciones oculares secundarias ocasionada por hongos o por virus.

Los reportes de la literatura sugieren una asociación aparente entre el uso de corticosteroides y la ruptura de la pared ventricular izquierda libre, después de un infarto de miocardio reciente; por tanto, se debe tener mucho cuidado al aplicar la terapia con corticosteroides a estos pacientes. Las preparaciones de adrenocorticosteroides pueden causar atrofia en el sitio de la inyección. Para minimizar la probabilidad y/o la severidad de la atrofia, la inyección no debe ser subcutánea, debe evitarse la inyección en el músculo deltoides y, de ser posible, evitar aplicar inyecciones intramusculares repetidas en el mismo sitio. Si es necesario emplear corticosteroides en pacientes con tuberculosis latente o reacción positiva a la tuberculina, es preciso vigilar estrechamente a esos pacientes pues puede ocurrir una reactivación de la enfermedad. Los corticosteroides se usarán con precaución en: Colitis ulcerosa inespecífica, si hay probabilidad de perforación inminente, absceso u otra infección piógena; diverticulitis; anastomosis; insuficiencia renal; hipertensión arterial; osteoporosis y miastenia grave.

Los corticosteroides pueden enmascarar algunos signos de infección y durante su empleo pueden aparecer nuevas infecciones. La insuficiencia adrenocortical secundaria inducida por fármacos puede resultar de una remoción muy rápida de corticosteroides y puede minimizarse mediante una reducción gradual de la dosis. Este tipo de insuficiencia relativa puede persistir por meses después de haber descontinuado la terapia; por consiguiente, en cualquier situación de estrés que suceda durante este periodo, la terapia con hormonas debe restituirse. Puesto que se han dado casos raros de reacciones anafilácticas que han ocurrido en pacientes que reciben tratamiento parenteral con corticosteroides, deben tomarse medidas de precaución adecuadas previas a la administración del fármaco, en especial, cuando el paciente tiene antecedentes de alergia a cualquier fármaco.

Los corticosteroides pueden exacerbar las infecciones micóticas sistémicas y, por tanto, no deben emplearse en presencia de dichas infecciones a menos que sean necesarios para controlar las reacciones ocasionadas por la Anfotericina B. Además, se han reportado casos en las cuales el uso concomitante de la Anfotericina B y la Hidrocortisona ocasionó agrandamiento cardíaco y paro congestivo

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Alteraciones electrolíticas y fluidos: Retención de sodio y de fluidos, insuficiencia cardíaca congestiva en pacientes susceptibles, pérdida de potasio, alcalosis hipokalémica, hipertensión. Musculoesquelético: Debilidad muscular, miopatía esteroidea, pérdida de masa muscular, osteoporosis, fractura vertebral, necrosis aséptica de la cabeza humeral y femoral, fracturas patológicas de huesos largos, ruptura tendinosa.

Gastrointestinal: Ulcera péptica y posible subsecuente perforación y hemorragia, perforación de intestino delgado o grueso, especialmente en pacientes con enfermedad inflamatoria intestinal, pancreatitis, distensión abdominal, esofagitis ulcerativa.

Dermatológicas: Cicatrización alterada, piel delgada y frágil, petequias, equimosis, eritema, sudoración aumentada, falsos negativos de test cutáneos, ardor o picazón especialmente en el área perineal (luego de inyección IV), dermatitis alérgica, urticaria o edema angioneurótico.

Neurológicos: Convulsiones, presión intracraneal aumentada con papiledema (pseudotumor cerebral) usualmente luego del tratamiento, vértigo, cefalea, alteraciones psíquicas.

Endócrinos: Irregularidades menstruales, desarrollo de estado endócrino alterado, supresión del crecimiento en pacientes pediátricos, insuficiencia suprarrenal secundaria (especialmente frente a estrés, traumatismo, cirugía, o enfermedad), intolerancia a la glucosa, manifestación de diabetes mellitus latente, aumento del requerimiento de insulina o de hipoglucemiantes orales en diabéticos, hirsutismo.

Oftálmicas: Catarata subcapsular posterior, aumento de la presión intraocular, glaucoma, exoftalmos, retinopatía de la prematurez.

Metabólicas: Balance nitrogenado negativo por catabolismo proteico.

Cardiovasculares: Ruptura miocárdica consecutiva a infarto de miocardio reciente, miocardiopatía hipertrófica en neonatos con bajo peso al nacer.

Otras: Reacciones anafilactoides o de hipersensibilidad, tromboembolismo, aumento de peso, aumento del apetito, náusea, malestar, hipo, hiper o hipopigmentación, atrofia cutánea y subcutánea, absceso estéril, quemazón post inyección, artropatía tipo Charcot.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

El riesgo de hipopotasemia debe ser tenido en cuenta especialmente en las siguientes situaciones:

Cuando se administran concomitantemente diuréticos perdedores de potasio, laxantes o Anfotericina B o cuando el paciente sufra vómitos y diarrea. Cuando el paciente recibe concomitantemente alguna medicación cuya toxicidad aumenta por hipopotasemia como Digoxina o agentes bloqueantes neuromusculares.

Cuando existe riesgo de torsión de puntas, por ejemplo en pacientes con QT prolongado, administración concomitante de otras medicaciones productoras de torsión de puntas (Cisaprida, Astemizol, Terfenadina, Amiodarona, Quinidina, Bepridil, Eritromicina IV, Halofantrina, Pentamidina, Sparfloxacina, Sultoprida, Vincamina, Bretilio, Disopiramida. Sotalol, etc.)

En presencia de hipoprotrombinemia debe tenerse cuidado si se asocian Aspirina y corticoides, por el riesgo aumentado de sangrado. Los corticoides pueden aumentar el metabolismo de la Aspirina y disminuir su concentración, es decir que se debería aumentar la dosis, e inversamente se debería disminuir la dosis al suspender los corticoides. Fenitoína, Fenobarbital, Efedrina, Carbamazepina, Rifabutina, Primidona y Rifampicina pueden aumentar el clearance metabólico de los corticosteroides disminuyendo los niveles sanguíneos y actividad fisiológica, requiriendo ajuste de dosis.

El tiempo de protrombina debe ser chequeado frecuentemente en pacientes recibiendo corticosteroides y anticoagulantes orales concomitantemente debido a la posible alteración de la respuesta a anticoagulantes; esta alteración de la respuesta usualmente consiste en disminución del efecto anticoagulante, aunque han habido reportes de potenciación del efecto. Los corticoides (especialmente en dosis altas o prolongadas) pueden producir aumento del riesgo de hemorragia en pacientes tratados con heparina o anticoagulantes orales, por fragilidad vascular o gastritis.

Interacción con hipoglucemiantes/insulina: Los corticoides requieren ajuste de la dosis del tratamiento antidiabético.

El uso concomitante de corticoides y Ritodrina puede causar edema pulmonar en la madre, ante el primer signo de este trastorno se deberían discontinuar ambas drogas.

En caso de usarse Aminoglutetimida es común que se requiera suplementar corticoides, en tal caso es preferible no usar Dexametasona porque Aminoglutetimida disminuye la vida media de este corticoide (en cambio es preferible usar Hidrocortisona). Por retención hidrosalina puede disminuir el efecto de antihipertensivos. Pueden disminuir la acción del interferón alfa. Pueden disminuir la concentración de Praziquantel.

SOBREDOSIFICACIÓN:

Es factible que se presenten alteraciones de la conducta, nerviosismo, insomnio, variación del estado de ánimo, etc.

Tratamiento de urgencia: En caso de sobredosificación, el tratamiento es de sostén y sintomático. No existe antídoto específico.

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

RESTRICCIONES DE USO:

Se restringe el uso durante el embarazo y la lactancia.

CONSERVACIÓN:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30 °C.

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 1 ampolla con solución inyectable x 2 mL.

Porta ampollas conteniendo 100 ampollas con solución inyectable x 2 mL.– Uso Hospitalario.

Este medicamento debe ser utilizado únicamente por prescripción médica y no podrá repetirse sin nueva indicación del facultativo. En caso de uso de éste medicamento sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quién lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma éstos productos sin consultar a 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