PRINOSIL®

FENTANILO 0,05 mg/mL

Venta Bajo Receta Cuadruplicada Solución Inyectable

Industria Paraguaya V.A.: IV - IM

FORMULA:

Cada mL de solución inyectable contiene:

Fentanilo (Equiv. a 0,07855 mg de Fentanilo citrato)..................................0,05 mg.

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

ACCION TERAPEUTICA:

Analgésico y Anestésico Narcótico.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS:

El Fentanilo es un potente analgésico narcótico (100 veces más eficaz que la morfina y 700 veces más eficaz que la meperidina), inhibe las sensaciones dolorosas e induce una analgesia quirúrgica. El efecto analgésico máximo se logra a los 2 a 3 minutos luego de la inyección endovenosa y su duración es alrededor de 30 a 60 minutos. El grado de analgesia es dosis dependiente y bien regulable. El Fentanilo se caracteriza por conservar en forma estable los parámetros cardiovasculares y no provoca liberación de histamina.

La acción analgésica de una dosis de 100 µg (2,0 mL) es aproximadamente equivalente a la de 10 mg de morfina. Luego de la inyección intramuscular el efecto analgésico se manifiesta a los 7-8 minutos y es máximo en promedio a los 20 minutos. El enlace del Fentanilo con la proteína plasmática es de 84% aproximadamente.

El Fentanilo se distribuye rápidamente en los tejidos, el volumen de distribución compartimental central Vc es de 13L y el volumen de distribución total en equilibrio es de 339L. Se obtienen concentraciones elevadas del fármaco a nivel del músculo esquelético y tejido adiposo, en el que el Fentanilo forma depósitos debido a la alta afinidad por los lípidos. La redistribución se produce lentamente a partir de los reservorios periféricos. Las dos fases de distribución poseen vidas medias breves: t½b alrededor de 1 minuto y t½b de 18 minutos aproxi-madamente. A nivel sanguíneo, y a un pH de 7.4, la fracción conjugada es de un 84%. La concentración de Fentanilo libre aumenta cuando el pH disminuye. La tasa plasmática para la obtención de un efecto analgésico oscila entre 1 a 25 ng/mL dependiendo de la medicación concomitante, el tipo de intervención y las diferencias interindividuales.

El Fentanilo atraviesa fácilmente la barrera hematoencefálica, no obstante la concentración de la droga en LCR corresponde a la fracción plasmática libre. La droga sufre una importante biotransformación hepática, con un índice de depuración de 574 mL/minuto. Las principales vías de degradación son la N-desalquilación y la hidroxilación oxidativa. La actividad farmacológica de los metabolitos es nula o escasa.

La vida media de eliminación terminal t½b es de 475 minutos. Luego de la administración endovenosa, alrededor del 75% de la dosis es eliminada en orina, principalmente bajo la forma de metabolitos (fracción eliminada sin cambios en orina <10%).

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Como suplemento narcótico analgésico en anestesia general o local. Para administración con un neuroléptico, tal como el Droperidol, como premedicación anestésica para inducir anestesia y como droga auxiliar para el mantenimiento de anestesias locales y generales; para administración como agente anestésico con oxígeno en pacientes seleccionados con riesgo alto de sufrir una intervención de cirugía mayor.

POSOLOGIA:

La dosis debe determinarse según la edad del paciente, el peso, el estado físico, las condiciones patológicas subyacentes, el empleo de otras drogas y el tipo de intervención quirúrgica y anestesia.

Empleo como analgésico auxiliar de anestesia general.

Dosis baja: 2 µg/kg, resulta efectivo para intervenciones quirúrgicas menores pero dolorosas.

Dosis moderadas: 2-20 µg/kg, En intervenciones quirúrgicas complicadas se requerirán dosis mayores. La duración del efecto de la droga depende de la dosificación.

Dosis altas: 20-50 µg/kg, durante intervenciones quirúrgicas graves y de larga duración, durante las cuales la tensión nerviosa constituiría un sector perjudicial para el bienestar del paciente, ésta dosis de Fentanilo combinado con óxido nitroso/oxígeno ha demostrado tener efectos atenuantes, pero la observación y ventilación operatoria son esenciales en virtud de una prolongada depresión respiratoria postoperatoria.

Se administran dosis suplementarias de 250 µg (0,5-5 mL) según los requerimientos del paciente y el tiempo que falta para la terminación de la operación.

Empleo como agente anestésico: Si la atenuación de la reacción a la tensión quirúrgica es un factor especialmente importante, puede administrarse dosis de 50-100 µg/kg simultáneamente con oxígeno y un relajante muscular. Esta técnica permite anestesiar sin necesidad de emplear agentes anestésicos auxiliares. En ciertos casos, pueden requerirse dosis de hasta 150 µg/kg a fin de producir el efecto anestésico. El Fentanilo ha sido administrado de este modo en intervenciones quirúrgicas a corazón abierto y en otros casos de operaciones de mayor importancia en pacientes en los que se debe proteger el miocardio contra una demanda excesiva de oxígeno.

En niños de 2 a 12 años: Se recomienda una dosis reducida de 2 a 3 µg/Kg.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al Fentanilo y a otros opiáceos. Depresión respiratoria, Enfermedades obstructivas de las vías respiratorias. Embarazo y lactancia.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Citrato de Fentanilo debe ser administrado únicamente por personal entrenado en el uso de la anestesia intravenosa y en el debido manejo de los eventuales efectos respiratorios producidos por potentes opiáceos.

Se deberá contar con un respirador mecánico y antagonistas de agentes opiáceos.

Cuando se administra concomitantemente con droperidol, es indispensable conocer la acción de cada fármaco por separado y contar con los equipos y medios necesarios para el manejo de una eventual hipotensión arterial. Si las medidas tomadas para corregir la hipotensión no produjeran el efecto deseado (cambio postural, infusión de fluidos en forma endovenosa), se podrá administrar agentes vasopresores, con excepción de la epinefrina.

Se advierte que la depresión respiratoria puede ser más prolongada que el efecto analgésico. Es por lo tanto de importancia calcular la dosificación total a ser administrada, incluyendo el período postoperatorio. Se recomienda una reducción del 60 al 75% de la dosis de analgésicos narcóticos, en ese período.

El fármaco puede ocasionar rigidez en músculos, en especial los intercostales, esqueléticos varios, del cuello y oculares, tales efectos se relacionan con la dosificación y rapidez de la administración. Estos efectos pueden ser controlados con la administración de hasta un 25% de la dosis paralizante total de un agente bloqueante neuromuscular no-despolarizante, antes de la administración de Fentanilo.

El fármaco debe ser utilizado con precaución en pacientes susceptibles a depresión respiratoria, tales como pacientes comatosos con tumor cerebral o lesión cerebral.

Fentanilo puede producir dependencia de tipo morfínica, en tal caso de dependencia, una posología más elevada debe ser suministrada para lograr el efecto terapéutico.

Se reducirá la dosis en pacientes ancianos o debilitados. El efecto producido por la dosis inicial determinará incrementos futuros en dosificación.

El óxido nitroso puede provocar depresión cardiovascular cuando se asocia con dosis altas de citrato de Fentanilo.

Algunas formas de anestesia, tal como la espinal o inducida por determinados anestésicos peridurales, pueden provocar bloqueo en la musculatura intercostal. Fentanilo también puede provocar alteración en la mecánica respiratoria. En tales casos se recomienda extremar los cuidados preventivos.

La analgesia profunda suele ser acompañada por depresión respiratoria y sensibilidad disminuida a la estimulación por CO2. La hiperventilación intra-operatoria puede alterar aún más la respuesta a Co2. Es de fundamental importancia controlar el restablecimiento del ritmo respiratorio normal en el paciente operado. Se deberá actuar con suma precaución en pacientes con disfunción pulmonar obstructiva, los que deberán recibir respiración controlada auxiliar.

En la disfunción hepática o renal, en pacientes que padecen bradiarritmia cardíaca, hipotiroidismo descontrolado, enfermedad pulmonar, disminución de la reserva respiratoria y alcoholismo se administrará con precaución. La eventual bradicardia puede ser contrarrestada con atropina. En la concomitancia con depresores del SNC, estas drogas pueden potenciar la acción del fármaco.

La droga no es teratogénica, sin embargo el Fentanilo mostró tener efectos embriotóxicos en ratas. Por lo tanto se deberá evaluar si los beneficios de la administración del fármaco justifican los eventuales riesgos en el feto.

El Fentanilo atraviesa la barrera placentaria, siendo el centro respiratorio fetal altamente sensible a los morfinomiméticos, por lo tanto, durante el parto o en la cesárea, dada la ausencia de casuística adecuada, no se recomienda su uso.

El Fentanilo pasa a través de la leche materna, por lo tanto está contraindicada la lactancia durante el tratamiento con Fentanilo.

No se ha establecido seguridad en niños menores a 2 años. Se recomienda reducir la dosis en los ancianos y en los pacientes debilitados.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Se ha observado depresión respiratoria, apnea, rigidez, bradicardia, síntomas que deben ser contrarrestados de inmediato. Además se presenta hipertensión, hipotensión, mareo, visión borrosa, náuseas, vómitos, espasmo de laringe, diaforesis. Ocasionalmente se ha observado depresión respiratoria de rebote secundaria, debiendo tomarse las contramedidas necesarias.

El Fentanilo puede provocar reacciones de hipersensibilidad (anafilaxia, broncoespasmo, prurito, urticaria) y de asistolia que puede ser causado también por las drogas administradas en forma concomitante durante la cirugía. En concomitancia con droperidol se han observado temblor, inquietud, escalofrios y/o estremecimientos, desasosiego, episodios de alucinación postoperatoria, síntomas extrapiramidales (pueden neutralizarse por medio de los agentes antiparkinsonianos). Efectos sobre la función cognitiva: El Fentanilo afecta las facultades mentales y la actividad motora en individuos sanos, pero no la memoria inmediata y diferida. Efecto sobre el sistema nervioso: Se han descrito convulsiones con dosis tanto elevada como bajas de Fentanilo y sufentanilo. Sin embargo, el EEG de un paciente que presento movimientos musculares de tipo convulsivo durante la perfusión de Fentanilo no reveló actividad convulsivante cortical. Los movimientos musculares pudieron deberse a mioclonias provocadas por la depresión de los centros inhibidores superiores del S.N.C. o una pronunciada rigidez muscular inducida por opioides.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

Los drogas activas a nivel del S.N.C. (barbitúricos, benzodiazepinas, neurolépticos, gases halogenados y otros depresores del S.N.C. como el alcohol) pueden reforzar la depresión respiratoria inducida por los narcóticos. Se puede reducir la dosis de Fentanilo o disminuir la dosis de las drogas depresoras del SNC administradas en forma concomitante.

El itraconazol es un potente inhibidor del citocromo 3A4, por lo tanto administrado por vía oral, puede alterar la farmacocinética del Fentanilo administrado en forma endovenosa.

El Ritonavir, también es un potente inhibidor del citocromo 3A4, que administrado por vía oral, disminuye la depuración del Fentanilo, pudiendo incrementarse la vida media del fármaco al doble luego de una dosis única intravenosa.

Se recomienda discontinuar la administración de inhibidores de la MAO por lo menos dos semanas antes de la intervención quirúrgica.

SOBREDOSIFICACION:

Se sugiere en caso de producirse una hipoventilación, efectuar oxigenoterapia o practicar una intubación endotraqueal y la eventual asistencia mecánica respiratoria.

En caso de observar rigidez muscular, aplicar I.V. un agente bloqueante neuromuscular. Se deberá observar al paciente durante no menos de 24 horas, después de la operación, manteniéndolo abrigado y con administración parenteral de fluidos para contrarrestar la posibilidad de una hipovolemia.

En caso de depresión respiratoria administrar un antagonista específico como la Naloxona, teniendo en cuenta que la depresión respiratoria puede ser más prolongada que la acción del fármaco.

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

RESTRICCIONES DE USO:

Uso profesional.

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 1/5 ampollas de 2 mL.

Caja conteniendo 1/5 ampollas de 5 mL.

Panal conteniendo 100 ampollas de 2 mL. (Uso Hospitalario)

Panal conteniendo 100 ampollas de 5 mL. (Uso Hospitalario)

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15 ° y 30 °C.

Este medicamento debe ser usado 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 quien lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma éste producto 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