CECMED
CENTRO PARA EL CONTROL ESTATAL DE MEDICAMENTOS, EQUIPOS Y DISPOSITIVOS MÉDICOS
Ministerio de Salud Pública de Cuba

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	METILPREDNISOLONA-500
Forma farmacéutica:	Polvo liofilizado para solución inyectable IM, IV
Fortaleza:	500 mg/bulbo
Presentación:	Estuche por 18 ó 25 bulbos de vidrio incoloro.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) " LABORATORIOS JULIO TRIGO". Planta inyectables. Producto terminado.
Número de Registro Sanitario:	M-16-234-H02
Fecha de Inscripción:	12 de diciembre de 2016**.**
Composición:	
Cada bulbo contiene:	
Metilprednisolona (eq. a 662,9 mg de succinato sódico de metilprednisolona buffereada al 3 %)	500,0 mg
Agua para inyección csp	
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30°C. Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Insuficiencia adrenocortical primaria o secundaria.

Insuficiencia adrenocortical aguda.

En el preoperatorio, en caso de traumatismo o enfermedad grave en pacientes con insuficiencia adrenal evidente o cuando la reserva adrenocortical sea dudosa.

En el shock que no responda a la terapia convencional si existe o se sospecha insuficiencia adrenocortical.

Afecciones reumáticas, espondilitis anquilosante, bursitis aguda y subaguda, tenosinovitis aguda no específica, artritis gotosa aguda, artritis psoriática, artritis reumatoidea, osteoartritis postraumática, sinovitis de la osteoartritis, epicondilitis.

Colagenopatías.

Afecciones dermatológicas.

Estados alérgicos.

Afecciones oftálmicas.

Afecciones gastrointestinales.

Afecciones respiratorias.

Afecciones hematológicas.

Enfermedades neoplásicas.

Estados edematosos, sistema nervioso (tratamiento de lesiones de la columna vertebral) y trasplante de órganos (para reducir el riesgo de rechazo de los órganos trasplantados).

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad a cualquier componente de la fórmula.

Ulcera péptica.

Psicosis y Psiconeurosis.

Pacientes con enfermedades sistémicas graves por hongos.

Hipersensibilidad conocida a los glucocorticoides.

Embarazo y lactancia.

En presencia de infecciones bacterianas agudas, herpes zóster, herpes simple, ulceraciones oculares y otras afecciones virales.

Síndrome de Cushing.

Tuberculosis activa o dudosamente inactiva, exceptuando cuando se utiliza en conjunción con drogas tuberculostáticas.

La vía intramuscular en pacientes con púrpura trombocitopénica idiopática.

La vacunación contra enfermedades infectocontagiosas.

Precauciones:

Embarazo: categoría de riesgo: B

Lactancia materna: compatible (con dosis maternas superiores a 40 mg/día, vigilar función adrenal del recién nacido).

Niños y adolescentes: posible retardo del crecimiento irreversible.

Daño hepático: aumento de frecuencia de efectos adversos. Antecedentes de tuberculosis (realizar estudios radiográficos.

Los corticoides deben ser utilizados cuidadosamente en la colitis ulcerativa no específica, diverticulitis, anastomosis intestinales recientes, insuficiencia renal, hipertensión arterial, diabetes mellitus, insuficiencia cardíaca congestiva, osteoporosis, glomerulonefritis aguda, exantema, infecciones antibiótico resistentes, nefritis crónica, enfermedades tromboembolizantes, tromboflebitis, epilepsia, carcinomas metastásicos, miastenia grave y en pacientes de edad avanzada.

Los niños con tratamientos prolongados con corticosteroides deben ser observados cuidadosamente ya que estos agentes producen detención del crecimiento y el desarrollo infantil.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Sustancia de uso delicado que sólo debe ser administrada bajo vigilancia médica.

Las dosis intravenosas altas de metilprednisolona (mayor de 0,5 g) deben administrarse lentamente en un intervalo no menor de 10 minutos.

El uso prolongado o indiscriminado, así como su brusca suspensión puede afectar la salud del paciente de forma severa.

Se debe informar a los deportistas que este medicamento contiene un componente que puede establecer un resultado analítico de control de dopaje positivo.

Efectos indeseables:

En la mayor parte de los casos, las reacciones adversas son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema endocrino y al equilibrio electrolítico. Las reacciones adversas son más frecuentes con dosis altas, y en tratamientos prolongados.

Retención de sodio y agua. Edema. Hipertensión arterial. Insuficiencia cardíaca congestiva en pacientes sensibles. Arritmias cardíacas o alteraciones ECG debidas a depleción de potasio. Alcalosis hipocalémica. Hipocalcemia.

Debilidad muscular. Pérdida de las masas musculares. Rupturas tendinosas. Osteoporosis. Necrosis aséptica de las cabezas del fémur y del húmero. Fracturas espontáneas incluyendo aplastamiento vertebral y fractura patológica de los huesos largos.

Tromboembolismo. Tromboflebitis. Angeítis necrotizante. Pancreatitis. Distensión abdominal. Esofagitis, náuseas, vómitos. Perforación y sangramiento de úlceras gastroduodenales con el uso prolongado de corticosteroides.

Retardo en la cicatrización de las heridas. Piel delgada y frágil. Petequias y equimosis. Eritema facial. Hiperhidrosis. Púrpuras. Estrías atróficas. Hirsutismo. Hiperpigmentación. Erupciones acneiformes. Lesiones cutáneas de tipo lupus eritematoso. Reacción anafiláctica.

Convulsiones. Aumento de la presión intracraneal con papiledema. Vértigos. Cefalea. Parestesias. Insomnio. Agravamiento de alteraciones psiquiátricas pre-existentes.

Amenorrea y otras irregularidades menstruales. Síndrome de Cushing iatrogénico. Detención del crecimiento infantil. Bloqueo del mecanismo de respuesta hipofisiaria-corticosuprarrenal. Disminución de la tolerancia a los carbohidratos.

Aparición de manifestaciones de diabetes latente y aumento de los requerimientos de insulina e hipoglicemiantes orales en los diabéticos.

Cataratas sub-capsulares. Aumento de la presión intraocular. Glaucoma. Exoftalmía.

Balance nitrogenado negativo. Modificación de la motilidad y el número de los espermatozoides. Polifagia, propensión a infecciones (candidiasis orofaríngea), insuficiencia adrenocortical (con tratamientos prolongados), sudoración, tromboembolismo y miastenia.

Posología y modo de administración:

Adultos:

En terapia intensiva, o de emergencia se administra por vía vía intravenosa, intramuscular o infusión intravenosa.

Dosis inicial 10-500 mg; dosis i.v. mayores de 250 mg, deben ser, administradas al menos en 30 minutos y dosis menores de 250 mg,al menos en 5 minutos. Las dosis altas deben mantenerse solamente hasta alcanzar la estabilización del paciente.

Rechazo de injerto: 1g/día por infusión intravenosa durante 3 días. Por inyección intraarticular, o intrasinovial: adultos dosis 4-80 mg. De acuerdo con la extensión del área afectada: repetir si se considera apropiado a intervalos de 7-35 días.

Niños:

Las dosis parenterales en niños han variado considerablemente, dependiendo de la condición: se ha administrado por vía intravenosa o intramuscular un intervalo de 1 a 30 mg / kg de metilprednisolona diariamente. La dosis total diaria no debería excederse de 1 g.

Modo de administración**:** Intramuscular, intravenosa

Modo de preparación: Para la preparación de una solución para perfusión, el contenido de un bulbo se disolverá de forma previa y posteriormente se mezclará con soluciones de glucosa 5% o de cloruro sódico 0,9% (suero fisiológico).

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Bloqueadores de las neuronas adrenérgicos, alfa bloqueadores, IECA, antagonistas de receptores angiotensina II, β bloqueadores, bloqueadores de los canales de calcio, clonidina, diazóxido, metildopa, nitratos, hidralazina, minoxidil, nitroprusiato: se antagoniza su efecto hiportensor.

AINE' s: incremento del riesgo de sangramiento y ulceración gastrointestinal. Salicilatos: se reducen sus concentraciones plasmáticas.

Claritromicina: posible incremento de las concentraciones plasmáticas de metilprednisolona.

Eritromicina, ketoconazol: posible inhibición del metabolismo de los corticoides. Rifamicina: metabolismo de corticoides acelerado (reducción del efecto).

Coumarinas: pueden reducir, o aumentar (a altas dosis de corticoides) sus efectos anticoagulantes.

Antidiabéticos: los esteroidesantagonizan sus efectos hipoglumiantes.

Carbamacepina, fenitoína, barbitúricos: aceleran el metabolismo de los corticoides (reducen su efecto).

Anfotericín, glucósidos cardíacos, acetozolamida, diuréticos del ASA, tiacídas o relacionados, simpatomiméticos beta 2, teofilina, carbenoxolona: increnmenta el riesgo de hipocalemia (evitar su uso concominante).

Itraconazol: Inhibe el metabolismo de la metilprednisolona.

Indinavir, lopinavir, saquinavir: posible reducción de sus concentraciones plasmáticas por la metilprednisolona.

Ciclosporinas: altas dosis de metilprednisolona aumenta sus concentraciones plasmáticas (riesgo de convulsiones).

Metorexate: incremento del riesgo de toxicidad hematológica.

Diuréticos: se antagoniza su efecto diurético.

Aminoglutetimida: su metabolismo es acelerado por los corticoides.

Mifepristona: reduce el efecto de los corticoides (incluyendo los inhalados) 3 a 4 días después de su administración.

Contraceptivos orales (estrógenos): incrementan las concentraciones plasmáticas de los corticoides.

Somatropina: su efecto es inhibido por los corticoides.

Vacunas:altas dosis de corticoides deterioran la respuesta inmune a las vacunas.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazadas: Administrar en dosis fraccionadas y bajo estricta vigilancia médica, sobre todo para aquellas embarazadas con trastornos de Hipertension y Diabetes mellitus, debido a los efectos indeseables descritos que se puedan presentar

Embarazo: Categoría de riesgo: B

Lactancia Materna: Compatible (con dosis maternas superiores a 40mg/día, vigilar función adrenal del recién nacido).

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No procede.

Sobredosis:

La intoxicación aguda o muerte por sobredosis es rara.

Síntomas: ansiedad, depresión, confusión mental, espasmos o hemorragias gastrointestinales, hiperglucemia, hipertensión arterial y edema. Tratamiento sintomático y de sostén: incluye oxigenoterapia, mantenimiento de la temperatura corporal, ingesta adecuada de líquidos, vigilancia de electrolitos en suero y orina, con atención especial al equilibrio de sodio y potasio.

El succinato de metilprednisolona es dializable; grandes dosis pueden originar arritmias cardíacas y/o colapso circulatorio. No existe antídoto específico. En sobredosis deberá suspenderse su administración hasta normalización del paciente

Propiedades farmacodinámicas:

Código ATC: H02AB04

Grupo farmacoterapéutico: Preparados hormonales sistémicos, excl. hormonas sexuales e insulinas, Corticoides para uso sistémico, Glucocorticoides.

La metilprednisolona es un esteroide con propiedades antiinflamatorias potentes, mayores que la prednisolona y con menor tendencia a retener agua y sodio que la misma prednisolona. El Succinato Sódico de Metilprednisolona tiene las mismas acciones metabólicas y antiinflamatorias que la Metilprednisolona.

Mecanismo de acción:

Corticosteroide: Difunde a través de las membranas celulares y forma complejos con receptores citoplasmáticos específicos. Después estos complejos penetran en el núcleo de la célula, se unen al ADN y estimulan la transcripción del ARNm y la posterior síntesis de varias enzimas que, se piensa, son las responsables en última instancia de dos tipos de efectos de los corticosteroides sistémicos. Sin embargo, estos agentes pueden suprimir la transcripción del ARNm en algunas células (por ejemplo, los linfocitos).

Antiinflamatorio (esteroideo): Los glucocorticoides disminuyen o previenen las respuestas del tejido a los procesos inflamatorios, reduciendo así la manifestación de los síntomas de la inflamación sin tratar la causa subyacente. Los glucocorticoides inhiben la acumulación de las células inflamatorias, incluyendo los macrófagos y los leucocitos, en las zonas de inflamación. También inhiben la fagocitosis, la liberación de enzimas lisosomales y la síntesis y/o liberación de diversos mediadores químicos de la inflamación. Las acciones inmunosupresoras también pueden contribuir significativamente el efecto antiinflamatorio.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: tras la inyección intramuscular se absorbe rápidamente.

Concentraciones plasmáticas: 2 h.

Distribución: Se distribuye rápidamente en todos los tejidos del organismo, atraviesa la barrera placentaria.

Metabolismo: Principalmente hepático (rápido), también renal y tisular, la mayor parte a metabolitos inactivos.

Excreción: Principalmente por excreción renal de los metabolitos inactivos.

Vida media plasmática: Mayor de 3,5 horas.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

El volumen de solución reconstituida que no se utilice de inmediato, debe ser desechado.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 30 de junio de 2022.