

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	IODURO DE PRALIDOXIMA
Forma farmacéutica:	Solución inyectable IM, infusión IV.
Fortaleza:	25,0 mg/mL
Presentación:	Estuche por un bulbo de vidrio ámbar con 20 mL.
Titular del Registro Sanitario, país:	SGPHARMA PVT. LTD., MUMBAI, INDIA.
Fabricante, país:	SGPHARMA PVT. LTD., THANE, INDIA.
Número de Registro Sanitario:	M-16-054-V03
Fecha de Inscripción:	8 de abril de 2016.
Composición:	
Cada mL contiene:	
ioduro de pralidoxima*	25,0 mg
*Se incluye un 5 % de exceso	
Metilparabeno	
Propilparabeno	
Citrato de sodio	
Ácido cítrico monohidratado	
Agua para inyección	
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30°C. Protéjase de la luz. No refrigerar.

Indicaciones terapéuticas:

YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN se indica como un antídoto:

En el tratamiento del envenenamiento debido a los plaguicidas y productos químicos de la clase organofosforados que tienen actividad anticolinesterasa y

En el control de la sobredosis por fármacos anticolinesterásicos utilizados en el tratamiento de la miastenia gravis.

Las principales indicaciones para el uso de pralidoxima son debilidad muscular y depresión respiratoria. En la intoxicación severa, la depresión respiratoria puede ser debido a la debilidad muscular.

Contraindicaciones:

Yoduro de Pralidoxima está contraindicado en pacientes con hipersensibilidad a cualquier componente del producto.

Precauciones:

Pralidoxima ha sido muy bien tolerado en la mayoría de los casos, pero debe tenerse en cuenta que la condición desesperada del paciente intoxicado por organofosforados por lo general podría enmascarar los signos y síntomas menores que se han observado en los sujetos normales.

La administración intravenosa de YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN debe efectuarse lentamente y, preferentemente, por infusión, ya que se han atribuido ciertos efectos secundarios tales como taquicardia, laringoespasmo y rigidez muscular, en algunos casos cuya velocidad de la inyección fue demasiado rápida.

Debe utilizarse YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN con mucha precaución en el tratamiento de la sobredosis por organofosforados en los casos de miastenia gravis, ya que este puede provocar una crisis miasténica.

Debido a que pralidoxima se excreta en la orina, una disminución de la función renal se traducirá en un aumento de los niveles en sangre del fármaco. Por lo tanto, la dosis de pralidoxima debe reducirse en presencia de insuficiencia renal.

Como el uso de YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN para el tratamiento de la intoxicación del tipo carbamato es relativamente ineficaz, y el hecho de que su uso en el envenenamiento por carbamilo puede conducir a un aumento de la toxicidad, el uso de YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN no está recomendado en este tipo de veneno.

Pruebas de Laboratorio.

El tratamiento de la intoxicación por organofosforados debe instituirse sin esperar los resultados de las pruebas de laboratorio. Las mediciones de los glóbulos rojos, la colinesterasa plasmática y el paranitrofenol urinario (en el caso de exposición a paratión) pueden ser útiles para confirmar el diagnóstico y el seguimiento de la evolución de la enfermedad. Una reducción en la concentración de la colinesterasa en los glóbulos rojos por debajo del 50% de lo normal se ha observado sólo en el envenenamiento con éster organofosfato.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Pralidoxima no es eficaz en el tratamiento de la intoxicación por fósforo, fosfatos inorgánicos u organofosfatos que no poseen actividad anticolinesterasa.

Efectos indeseables:

Se han reportado mareos, visión borrosa, diplopía y problemas de acomodación, dolor de cabeza, somnolencia, náuseas, taquicardia, hiperventilación, y debilidad muscular después del uso de Yoduro de Pralidoxima Inyección, pero es muy difícil diferenciar los efectos tóxicos producidos por atropina o los compuestos organofosforados del correspondiente al fármaco. Cuando atropina y Yoduro de Pralidoxima Inyección se utilizan juntos, pueden ocurrir los signos de atropinización antes de lo que se podría esperar cuando se utiliza atropina solamente. Esto es especialmente válido si la dosis total de atropina ha sido alta y la administración de Yoduro de Pralidoxima Inyección se ha retrasado. Han sido reportados en varios casos excitación y comportamiento maniaco inmediatamente después de la recuperación de la conciencia. Sin embargo, un comportamiento similar se ha producido en casos de intoxicación por organofosforados que no fueron tratados con Yoduro de Pralidoxima Inyección.

Posología y método de administración:

Administración:

Para infusión intramuscular e intravenosa.

Dosis:

Yoduro de Pralidoxima Inyección es muy bien tolerado en voluntarios sanos. Dosis orales únicas de hasta 7 g han producido efectos secundarios mínimos. Dosis intravenosas son aún mejor toleradas con dosis tan grande como 40,5 g durante un período de siete días en el cual no se reportan efectos secundarios.

Envenenamiento por organofosforados:

Pralidoxima es más eficaz si se administra inmediatamente después de la intoxicación. En general, poco se logra si el fármaco se administra más de 36 horas después de la terminación de la exposición. Cuando el veneno se ha ingerido, sin embargo, la exposición puede continuar durante algún tiempo debido a la lenta absorción en el intestino grueso, y se han reportado las recaídas fatales después de la mejoría inicial. La administración continua durante varios días puede ser útil en estos pacientes. La supervisión del paciente se indica por lo menos de 48 a 72 horas. Si se ha producido la exposición cutánea, debe ser retirada la ropa y lavar el cabello y la piel minuciosamente con bicarbonato de sodio o alcohol tan pronto como sea posible. Puede administrarse Diazepam con precaución si las convulsiones no se controlan por la atropina.

La intoxicación severa (coma, cianosis, depresión respiratoria) requiere manejo intensivo. Esto incluye la eliminación de las secreciones, el manejo de las vías respiratorias, la corrección de la acidosis y la hipoxemia. Debe administrarse atropina lo antes posible después de que se mejora la hipoxemia. No debe administrarse atropina en presencia de hipoxia significativa debido al riesgo de fibrilación ventricular inducida por atropina. En los adultos, se puede administrar atropina por vía intravenosa en dosis de 2 a 4 mg. Esto debe repetirse a intervalos de 5 a 10 minutos hasta la completa atropinización (las secreciones son inhibidas) o aparecen los signos de toxicidad por atropina (delirio, hipertermia, espasmos musculares).

Debe mantenerse un cierto grado de atropinización durante al menos 48 horas y hasta que cualquier actividad depresora en sangre de la colinesterasa se revierta.

Están contraindicados morfina, teofilina, aminofilina y succinilcolina. Deben ser evitados los tranquilizantes del tipo reserpina o fenotiazina.

Después de que los efectos de la atropina se hacen evidentes, puede administrarse YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN.

Adultos

Yoduro de Pralidoxima Inyección se administra inicialmente como dosis intravenosa lenta de 1 a 2 g. Las señales de recuperación deben ocurrir rápidamente (aumento de la conciencia, disminución de fasciculaciones y debilidad). Si los síntomas vuelven a aparecer, a continuación, se infunde una infusión de 2,5% de Pralidoxima Yoduro a una velocidad de 0,5 g/hora. Una infusión continua mantiene los niveles adecuados en sangre de pralidoxima más que las inyecciones intermitentes.

La administración intramuscular y oral también es eficaz, pero se prefiere la intravenosa debido a la rapidez de acción.

En los casos graves, especialmente después de la ingestión del veneno, puede ser deseable para controlar el efecto de la terapia electrocardiográfica debido a la posibilidad del bloqueo cardíaco por la anticolinesterasa. Cuando el veneno se ha ingerido, es particularmente importante tener en cuenta la probabilidad de absorción continua de la parte inferior del intestino ya que esto constituye una nueva exposición. En estos casos, pueden ser necesarias dosis adicionales de YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN cada tres a ocho horas. En efecto, el paciente debe ser "valorado" ante YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN siempre que signos de intoxicación se repitan. Al igual que en todos los casos de intoxicación por organofosforados, se debe tener cuidado para mantener al paciente en observación durante al menos 24 horas.

Si las convulsiones interfieren con la respiración, pueden ser controladas por la inyección intravenosa lenta de diazepam, hasta 20 mg en adultos, o Tiopental de sodio (solución al 2%) por vía intravenosa.

En niños

La dosis debe ser de 20 a 50 mg por kg como dosis intermitente necesaria para aliviar los síntomas. Puede ser utilizada una infusión después que ha sido administrada una dosis

inicial. Se ha recomendado un gramo de YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN en 250 ml de dextrosa al 5% y solución salina al 0,2%.

El tratamiento será más eficaz si se administra dentro de unas pocas horas después de haber ocurrido la intoxicación. Por lo general, poco se logrará si el fármaco se administra por primera vez pasadas las 48 horas después de la exposición, pero en la intoxicación grave, sin embargo, este es indicado ya en ocasiones los pacientes han respondido después de tal intervalo.

En la ausencia de síntomas gastrointestinales graves, resultantes de la intoxicación por anticolinesterasa, YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN puede ser administrada por vía oral en dosis de 1 a 3 g cada cinco horas.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Su administración concomitante con atropina produce una aparición más precoz de sus efectos anticolinérgicos. Los barbitúricos se ven potenciados por los inhibidores de la colinesterasa.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: Categoría C

No se han llevado a cabo los estudios de reproducción en animales con pralidoxima. Tampoco se conoce si pralidoxima puede causar daño fetal cuando se administra a una mujer embarazada o si puede afectar la capacidad reproductiva. Pralidoxima debe administrarse a mujeres embarazadas sólo si es evidentemente necesario.

Lactancia:

No se conoce si este fármaco se excreta en la leche humana. Se debe tener precaución cuando se administra pralidoxima a una mujer lactante debido a que muchos fármacos se excretan en la leche humana.

Uso pediátrico:

No se ha establecido la seguridad y eficacia en niños.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

La capacidad de conducción y el manejo de máquinas pueden verse afectada ya que puede provocar trastornos en la visión.

Sobredosis:

Signos y Síntomas:

Lo observado solamente en sujetos normales: mareos, visión borrosa, diplopía, dolor de cabeza, problemas de acomodación, náuseas, taquicardia leve. En la terapia ha sido difícil diferenciar los efectos secundarios debidos a la droga con los efectos del veneno.

TRATAMIENTO DE LA SOBREDOSIS:

Se debe administrar según sea necesario respiración artificial y otros tratamientos de apoyo.

Toxicidad aguda

I.V. – DT baja Hombre: 14 mg/kg (efectos tóxicos: SNC)

I.V. - DL₅₀ rata: 96 mg / kg

I.M. - DL₅₀ rata: 150 mg / kg

ORAL - DL₅₀ ratón: 4100 mg / kg

I.P. - DL₅₀ ratón: 155 mg / kg

I.V. - DL₅₀ ratón: 90 mg / kg

I.M. - DL₅₀ ratón: 180 mg / kg

I.V. - DL₅₀ conejo: 95 mg / kg

I.M. - DL₅₀ cobayo: 168 mg / kg

Propiedades farmacodinámicas:

Yoduro de Pralidoxima es un reactivador de la colinesterasa.

La acción principal de pralidoxima es reactivar la colinesterasa (principalmente fuera del sistema nervioso central), la cual ha sido inactivada por la fosforilación debido a un pesticida organofosfato o compuesto relacionado. La destrucción de la acetilcolina acumulada puede entonces continuar y las uniones neuromusculares volverán a funcionar con normalidad. Pralidoxima también enlentece el proceso de "envejecimiento" de la colinesterasa fosforilada a una forma no reactivable y desintoxica ciertos organofosforados por reacción química directa. El fármaco tiene su efecto más crítico en el alivio de la parálisis de los músculos de la respiración. Debido a que pralidoxima es menos eficaz en el alivio de la depresión del centro respiratorio, siempre se requiere de atropina concomitantemente para bloquear el efecto de la acetilcolina acumulada en este sitio. Pralidoxima alivia los signos y síntomas muscarínicos, salivación, broncoespasmo, etc, pero esta acción es relativamente poco importante puesto que la atropina es la adecuada para este propósito.

Se ha reportado que el uso complementario de reactivadores de la colinesterasa oxima (tales como pralidoxima) reduce la incidencia y severidad de los defectos de desarrollo en embriones de pollo expuestos a tales teratógenos conocidos como paratión, Bidrin, carbacol y neostigmina. Este efecto protector de las oximas demostró estar relacionado con la dosis.

YODURO DE PRALIDOXIMA INYECCIÓN antagoniza los efectos sobre la unión neuromuscular de los anticolinesterásicos carbamato, neostigmina, piridostigmina y ambenonio, utilizados en el tratamiento de la miastenia gravis. Sin embargo, no es tan eficaz como antídoto a estos medicamentos, como es de los organofosforados.

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

Pralidoxima se distribuye por todo el agua extracelular, no se une a proteínas plasmáticas. El fármaco se excreta rápidamente en la orina una parte sin cambios, y otra parte como un metabolito producido por el hígado. En consecuencia, pralidoxima es de actuación relativamente corta y pueden ser necesarias dosis repetidas, especialmente cuando existe alguna evidencia de que continúa la absorción del veneno.

Yoduro de Pralidoxima se absorbe lentamente desde el tracto gastrointestinal.

Distribución:

Se distribuye por todo el agua extracelular.

Enlace a Proteína:

No se enlaza a proteínas plasmáticas

Biotransformación:

Es metabolizado en gran parte por el hígado.

Vida- Media:

El tiempo medio de eliminación es aproximadamente de 1 a 2 horas.

Eliminación:

Se excreta rápidamente en la orina, una parte sin cambios, y la otra parte como un metabolito producido por el hígado.

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

Desechar cualquier remanente no utilizado.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 8 de abril de 2016.

