

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	SAQUINAVIR
Forma farmacéutica:	Cápsula
Fortaleza:	200,0 mg
Presentación:	Estuche por un frasco de PEAD con 135 cápsulas.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, LA HABANA, CUBA.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) NOVATEC, LA HABANA, CUBA.
Número de Registro Sanitario:	M-16-126-J05
Fecha de Inscripción:	23 de junio de 2016
Composición:	
Cada cápsula contiene:	
saquinavir (eq. a 228,70 mg de mesilato de saquinavir)	200,00 mg
lactosa anhidra	79,51 mg
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	No requiere condiciones especiales de almacenamiento. Producto reconstituido:

Indicaciones terapéuticas:

Infección por Virus de Inmunodeficiencia Humana (VIH) en combinación con otros agentes antirretrovirales.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad clínicamente significativa al saquinavir o a otro de los componentes de la formulación.

Este producto contiene lactosa, que está contraindicado en pacientes con galactosemia congénita, síndrome de malabsorción a la glucosa y a la galactosa o déficit de lactasa. Hepatitis severa.

Administrar saquinavir concomitantemente con ritonavir está contraindicado en pacientes con insuficiencia hepática severa.

Precauciones:

Niños: la seguridad y eficacia en niños o adolescentes menores de 16 años no ha sido establecida.

Diabetes mellitus.

Daño hepático.

Daño renal.

Hemofilia.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica. Debe tomarse alejado de las comidas.

Efectos indeseables:

Frecuentes: diarrea, malestar abdominal, náuseas, vómito, alteraciones del sentido del gusto, dispepsia, anorexia, aumento del apetito, flatulencia, astenia, fatiga.

Raras: confusión, ataxia, debilidad, leucemia mieloblástica aguda, anemia hemolítica, intentos suicidas, Síndrome de Stevens-Johnson, reacciones cutáneas severas, ulceraciones mucosas, elevaciones aisladas de transaminasas, tromboflebitis, cefalea, trombocitopenia, exacerbación de enfermedades hepáticas, ictericia, dolor abdominal, pancreatitis que puede provocar la muerte, obstrucción intestinal, hipertensión, vasoconstricción periférica, fiebre, nefrolitiasis e insuficiencia renal aguda, dolor precordial, neuropatía periférica, trastornos de la libido, nefrolitiasis, lipodistrofia, hiperglucemia, exacerbación de la diabetes mellitus.

Posología y método de administración:

Adultos (≥ 16 años):

1000mg (5 cápsulas x 200 mg) 2 veces/día (2 horas después de ingerir alimentos) en combinación con ritonavir 100 mg 2 veces al día.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Inhibidores de la proteasa del VIH: todos los Inhibidores de la proteasa del VIH compiten por las mismas rutas metabólicas lo que da lugar a un aumento simultáneo de sus concentraciones plasmáticas, aumentando los efectos adversos.

Fenobarbital, fenitoína, dexametasona, carbamazepina, rifampicina y rifabutina, efavirenz: pueden reducir las concentraciones de saquinavir en el plasma por inducción del citocromo P450.

La coadministración con cisaprida, terfenadina, triazolam, diazepam, alprazolam, clorazepato, flurazepam, estazolam, astemizol, midazolam o derivados del ergot está contraindicada ya que estas últimas tienen una ventana terapéutica estrecha y son metabolizadas de un modo similar al saquinavir. Warfarina: incremento del efecto anticoagulante de la warfarina debido a una inhibición competitiva del metabolismo de este anticoagulante.

Ketoconazol, itraconazol, delavirdina: incremento de la concentración del saquinavir. Incremento del riesgo de toxicidad.

Ergotamina: el saquinavir inhibe el metabolismo de la ergotamina. Claritromicina, fluoxetina, desisaprina: incremento de las concentraciones en plasma de este medicamento y del saquinavir. Incremento del riesgo de toxicidad.

Teofilina, anticonceptivos hormonales: el saquinavir disminuye la concentración plasmática de estos fármacos. Dextropropoxifeno o petidina: junto con el saquinavir se producen interacciones complejas.

Piroxicam: el saquinavir puede dar lugar a concentraciones tóxicas del piroxicam. Amiodarona, flecainida, propafenona, quinidina:

Se pueden producir concentraciones plasmáticas potencialmente tóxicas de estos fármacos. Clozapina, pimozida: el saquinavir puede aumentar la concentración plasmática de estos medicamentos. Ciclosporina: la administración conjunta de la ciclosporina y el saquinavir puede producir un aumento mutuo del área bajo la curva de la concentración plasmática-tiempo.

Lovastatina, sinvastatina: se puede inhibir el metabolismo de las estatinas metabolizadas por la isoenzima CYP3A4.

Fenilpropanolamina: Puede ocurrir posibles interacciones.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: Experiencia clínica limitada en gestantes; emplear sólo si el beneficio supera el riesgo potencial.

Lactancia: No hay datos de laboratorio, a nivel animal o humano, sobre la secreción de saquinavir en la leche materna. Antes de recibir saquinavir se debe interrumpir la lactancia, ya que no puede evaluarse el potencial de reacciones adversas debidas a saquinavir en lactantes. Se recomienda que las mujeres infectadas por el VIH no comiencen la lactancia bajo ninguna circunstancia, con el fin de evitar la transmisión del VIH.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No procede.

Sobredosis:

No se conoce ningún antídoto específico del saquinavir. En caso de sobredosis de saquinavir deben aplicarse las medidas de apoyo habituales, incluidas la vigilancia de los signos vitales del paciente.

Propiedades farmacodinámicas:

Es un inhibidor de la proteasa del VIH. Mecanismo de acción: La proteasa VIH se une a los precursores de poliproteína viral y genera proteínas funcionales en células infectadas con VIH. La unión es esencial para la maduración del virus infeccioso. Saquinavir es un sustrato sintético semejante a un péptido que es un análogo que inhibe la actividad de la proteasa VIH y previene la unión de las poliproteínas virales.

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

Absorción: es limitada (aproximadamente 30%).

Metabolismo: extenso primer paso hepático. Metabolizado por el sistema citocromo P450, específicamente la isoenzima CYP3A4 a compuestos mono y dihidroxilados que son inactivos.

Biodisponibilidad: después de ingerir alimentos es de un 4%.

Distribución: se une a proteínas plasmáticas aproximadamente en un 98%. Se distribuye extensamente en los tejidos, aunque las concentraciones reportadas en sistema nervioso central son desatendibles.

Vida media de eliminación: 13.2 horas.

Excreción: predominantemente por las heces.

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

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 23 de junio de 2016.