DORPLEN® 3

Eszopiclona 3 mg

Comprimidos recubiertos

Venta bajo receta archivada Industria Argentina

FÓRMULA
Cada comprimido recubierto de Dorplen 3 contiene:
Eszopiclona 3mg.
Excipientes: Lactosa anhidra DT, Celulosa microcristalina pH101, Dióxido de silicio coloidal 200,Croscamelosa sódica, Estearato de magnesio, Oprady ll 85 F, Colorante FD&C azul N°2 laca aluminica, cs.

ACCIÓN TERAPÉUTICA
Hipnótico no benzodiazepínico
Código ATC: N05CF04

POSOLOGÍA
El tratamiento es por un corto plazo.
La dósis de Eszopiclona debe adaptarse a cada paciente en particular.
Adultos: La dósis inicial recomendada es de 2 mg, inmediatamente antes de acostarse. Como la dosis de 3 mg es más eficaz para mantener el sueño, el tratamiento puede iniciarse con esta dosis o puede ser aumentada hasta este valor si el tratamiento se ha iniciado con una dosis menor.
Ancianos: En los pacientes ancianos que sufren principalmente de dificultad para conciliar el sueño, la dosis inicial recomendada es de 1 mg antes de acostarse. En estos pacientes, la dosis puede aumentarse hasta 2 mg si existe indicación clínica.
En los pacientes ancianos, que sufren principalmente de dificultad para mantener el sueño, la dosis recomendada es de 2 mg inmediatamente antes de acostarse. Se recomienda no administrar Eszopiciona conjunta o inmediatamente después de ingerir alimentos con alto contenido en grasas, estos pueden retrasar la absorción del fármaco y reducir el efecto sobre la latencia del sueño.
Este medicamento debe ser administrado durante períodos no mayores de 7 a 10 días. Si el facultativo considera prolongar el tratamiento debe reevaluar al paciente.
Pacientes con insuficiencia Hepática: En pacientes con insuficiencia hepática grave la dosis inicial recomendada es de 1 mg. No es necesario modificar la dosis en la insuficiencia leve a moderada. Eszopiclona debe usarse con precaución en estos pacientes.
Administración concomitante con inhibidores de la CYP3A4:
La dosis inicial de Eszopiclona no debe ser mayor que 1 mg en pacientes que reciben la administración concomitantes de inhibidores potentes de la isoenzima CYP3A4. En caso necesario, la dosis puede aumentarse a 2 mg.

FARMACODINAMIA

La Eszopiclona es un hipnótico no benzodiazepínico perteneciente a la clase de las ciclopirrolonas. No presenta similitud estructural con las benzodiazepinas, los barbitúricos, ni con otros fármacos con propiedades hipnóticas reconocidas y se desconoce su mecanismo de acción exacto. Se supone que interactúa con los complejos receptores del ácido gamma amino butírico (GABA) cercanos o acoplados a los receptores benzodiazepínicos.

FARMACOCINÉTICA

La Eszopiclona se absorbe rápidamente después de su administración por vía oral. La concentración plasmática máxima se alcanza aproximadamente una hora después de la administración por vía oral. Los alimentos con alto contenido de grasas pueden demorar la absorción y sus efectos. La Eszopiclona presenta escasa unión a las proteínas plasmáticas (∼55%). Esto indicaría una carencia de interacciones por competencia de unión proteica con otras drogas. La Eszopiclona se metaboliza extensamente por oxidación y desmetilación. Los principales metabolitos plasmáticos son las (S)-zopiclona-N-óxido y la (S)-N-desmetilzoplicona; sólo este último metabolito presenta cierta actividad pero sustancialmente menor que la de la Eszopiclona. Se ha demostrado que las isoenzimas CYP3A4 Y CYP2E1 del citocromo P450 participan en el metabolismo de los Eszoplicona y que ésta no desarrolla inhibición de las CYP450 1A2, 2A6, 2C9, 2C19, 2D6, 2E1 y 3A4 en hepatocitos de seres humanos. La Eszopiclona presenta una vida media de eliminación terminal (t 1/2) de aproximadamente 6 horas. Un 75% de la dosis zoplicona racémica se elimina en orina, fundamentalmente en forma de metabolitos. Menos del 10% de las dosis de Eszopiclona administrada por via oral se elimina en orina como droga madre sin transformaciones.
En los individuos ancianos se ha informado un aumento significativo del AUC de la Eszopiclona y una eliminación más prolongada, por lo cual se recomienda emplear dosis menores que en los individuos adultos jóvenes.
Se ha informado una mayor exposición a la droga en pacientes con insuficiencia hepática grave, que indicaría la necesidad de emplear dosis menores. No es necesario ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia hepática leve a moderada.
No es necesario ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal, ya que en la orina sólo se elimina menos del 10% de la dosis como droga sin modificar.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad reconocida a la Eszopiclona, a la zopiclona o a cualquiera de los componentes del producto. Embarazo y lactancia.

ADVERTENCIAS

Los trastornos del sueño pueden ser manifestación inicial de una afección física y/o psiquiátrica. Por tal motivo, el tratamiento sintomático del insomnio sólo debería iniciarse despues de una meticulosa evaluación del paciente. La falta de respuesta luego de 7 a 10 días de tratamiento, el empeoramiento del insomnio o la aparición de nuevas anomalías del pensamiento o la conducta pueden indicar presencia de una enfermedad psiquiátrica y/o clínica de base que deben evaluarse. Debido a que algunas de las reacciones adversas importantes de la Eszopiclona aparentemente guardan relación con la dosis, es importante usar la mínima dosis efectiva posible, especialmente en los ancianos.
Se ha informado la aparición de diversas alteraciones del pensamiento y del comportamiento en asociación con el uso de sedante s/hipnóticos. Algunas de estas alteraciones pueden caracterizarse por una disminución de la inhibición (es decir, agresividad y extroversión fuera de lo normal), similares a los efectos producidos por el alcohol y otros depresores del sistema nervioso central. También se informaron comportamientos extraños, agitación, alucinaciones y despersonalización y puede aparecer amnesia y otros síntomas neuropsiquiátricos. En los pacientes con depresión primaria, se informó empeoramiento de la depresión, incluyendo pensamientos suicidas, con el uso de sedantes/hipnóticos. Raras veces puede determinarse con certeza si alguno de los comportamientos anómalos mencionados ha sido inducido por el fármaco, es de origen espontáneo o proviene de un trastorno psiquiátrico o físico subyacente. Sin embargo, es necesario evaluar de manera minuciosa e inmediata cualquier nuevo signo o síntoma preocupante relacionado con la conducta.
Con la disminución rápida de la dosis o la interrupción abrupta de los sedantes s/hipnóticos se han informado signos y síntomas similares a los asociados con la deprivación de otros depresores del sistema nervioso central.
Como ocurre con otros hipnóticos, la Eszopiclona desarrolla efectos depresores del sistema nervioso central.
Debido al rápido inicio de la acción, la Eszopiclona sólo debería tomarse inmediatamente antes de acostarse o una vez que el paciente se ha acostado y ya ha experimentado dificultad para conciliar el sueño.
Los pacientes no deben desarrollar actividades peligrosas que requieran de total atención o coordinación motriz, como operar maquinarias o conducir vehículos, después de haber tomado el medicamento. También se recomienda precaución por la posible disminución del rendimiento en estas actividades al día siguiente de haberlo tomado.
Como ocurre con otros hipnóticos, la Eszopiclona puede producir efectos aditivos, depresores del sistema nervioso central, al administrarse concomitantemente con otros psicotrópicos, anticonvulsivantes, antihistamínicos, alcohol y otros fármacos que deprimen el sistema nervioso central. Eszopiclona no debe administrarse en de concomitancia con alcohol.
Si se desea administrar Eszopiclona junto con otros depresores del sistema nervioso central, es posible que sea necesario ajustar la dosis debido a los potenciales efectos aditivos.

Reacciones anafilácticas y anafilactoides severas:
Se han reportado casos raros de angioedema que involucró lengua, glotis o laringe, en pacientes, luego de tomar la primera dosis o las dosis subsiguientes de sedantes-hipnóticos, incluyendo Dorplen. Algunos pacientes han tenido síntomas adicionales como disnea, edema de glotis, nauseas y vómitos, que sugieren anafilaxia.
Algunos pacientes requirieron tratamientos médico URGENTE.
Si el angioedema compromete garganta, glotis o laringe, puede ocurrir obstrucción en las vías aéreas y puede ser fatal.
Los pacientes que desarrollan angiodema luego de tratamiento con Dorplen no deben recibir nuevamente el fármaco.

Pensamiento anormal y cambios conductuales:
Se han reportado la ocurrencia de una variedad de pensamientos anormales y cambios conductuales asociados con un uso de sedantes/hipnóticos. Algunos de estos cambios pueden caracterizarse por una disminución de la inhibición (por ej., agresividad y extroversión ajenas al carácter), similar a los efectos producidos por el alcohol y otros depresores del SNC.
Se han reportado alucinaciones visuales y auditivas así como cambios conductuales, tales como: conductas bizarras, agitación y despersonalización.
Se han reportado comportamientos complejos como:
- Conducir no completamente despierto luego de la ingesta de un sedante-hipnótico con amnesia del evento.
- Estos eventos pueden ocurrir en pacientes que nunca han recibido sedantes-hipnóticos, así como en personas que ya los han recibido. Aunque los comportamientos complejos, como el citado, puede ocurrir únicamente con Dorplen a dósis terapéuticas. El uso de alcohol y otros depresores del SNC con Dorplen parece incrementar el riesgo de estos comportamientos, así como el uso de Dorplen a dosis que exceden la dosis máxima recomendada.
- Debido al riesgo para el paciente y para la comunidad, debe considerarse firmemente la discontinuación de Dorplen en pacientes que informan un episodio como el citado precedentemente.

PRECAUCIONES

Eszopiclona debe administrarse inmediatamente antes de acostarse. El consumo de un sedante/hipnótico mientras todavia se esta levantando y activo puede causar disminución de la memoria a corto plazo, alucinaciones, disminución de la coordinación, mareos y aturdimiento.
Administrar con precaución a pacientes ancianos y/o debilitados, estos pueden presentar una disminución del rendimiento motor y/o cognitivo después de una exposición repetida o por una sensibilidad atípica a los sedantes/hipnóticos. La dosis inicial recomendada de Eszopiclona para estos pacientes es de 1 mg.
La experiencia clínica con Eszopiclona en pacientes con enfermedades concomitantes es limitada. La Eszopiclona debe usarse con precaución en pacientes con enfermedades o estados que puedan afectar su metabolismo o las respuestas hemodinámicas.
Se recomienda administrar con precaución a pacientes con compromiso de la función respiratoria.
La dosis de Eszopiclona debe reducirse a 1 mg en pacientes con insuficiencia hepática grave. No parece necesario ajustar la dosis en la insuficiencia hepática leve o moderada. Tampoco parece necesario ajustar la dosis en la insuficiencia renal de cualquier grado, ya que menos del 10% de la dosis de Eszopiclona se elimina intacto en orina.
Se recomienda reducir la dosis de Eszopiclona en los pacientes que reciban concomitantemente otras drogas inhibidoras potentes de la isoenzima CYP3A4 como el ketoconazol u otros medicamentos conocidos por sus efectos depresores del sistema nervioso central.
Los sedantes/hipnóticos deben administrarse con precaución a pacientes que presentan signos y síntomas de depresión. Dichos pacientes pueden tener tendencia al suicidio y requieren medidas de protección. En este grupo de pacientes es más común la sobredosificación intencional, por tal motivo, se recomienda prescribir la mínima cantidad posible de medicamento en cada consulta.
Aunque la Eszopiclona es un hipnótico no relacionado estructuralmente con las benzodiazepinas, comparte algunas de sus prioridades farmacológicas. Se han informado efectos similares en pacientes con antecedentes de adicción a las benzodiazepinas (amnesia y alucinaciones).
No se han informado signos importantes de síndrome de abstinencia. Sin embargo, se han informado los siguientes eventos adversos de abstinencia no complicada dentro de las 48 horas de la interrupción del tratamiento, con una incidencia del 2% o menos: Ansiedad, sueños anómalos, nauseas y malestar de estómago.
El uso de benzodiazepinas y agentes similares pueden causar dependencia física y psicológica. El riesgo de drogadicción y farmacodependencia aumenta con la dosis y la duración del tratamiento, así como el uso concomitante de otros fármacos psicoactivos. El riesgo también es mayor para pacientes con antecedentes de alcoholismo, drogadicción o trastornos psiquiátricos. Si estos pacientes reciben Eszopiclona o cualquier otro hipnótico, se los deberá controlar cuidadosamente.
Puede observarse una cierta disminución de la eficacia hipnótica de la benzodiazepinas y otros agentes similares, con el uso repetido de estos medicamentos durante unas pocas semanas. Con la Eszopiclona se ha informado la ausencia de desarrollo de tolerancia en todos los parámetros de medición del sueño durante seis meses.
Uso pediátrico: No se ha establecido la seguridad y eficacia de la Eszopiclona en niños y adolescentes menores de 18 años de edad.
Uso geriátrico: Se recomienda emplear en dosis menores.

EMBARAZO Y LACTANCIA

Embarazo: No se han realizado estudios suficientes con Eszopiclona en mujeres embarazadas. Eszopiclona sólo debería usarse durante el embarazo si el beneficio potencial justifica el riesgo potencial para el feto.
Lactancia: Se desconoce si la Eszopiclona pasa a la leche humana. Eszopiclona no debe administrarse a mujeres que se encuentren amamantando.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Alcohol (etanol): Se ha informado un efecto aditivo sobre el rendimiento psicomotor durante un período de hasta 4 horas después de la administración de etanol.
Olanzapina: Se ha informado interacción farmacodinámica sin alteración de la farmacocinética de ninguno de los dos fármacos. Se recomienda precaución.
Medicamentos que inhiben la CYP3A4 (ketoconazol): Se ha informado un aumento significativo del área bajo la curva de concentración plasmática / tiempo (AUC), de la concentración máxima y de la vida media de la Eszopiclona con la administración concomitante de ketoconazol, un potente inhibidor de la CYP3A4.
Es de esperar que otros inhibidores potentes de la CYP3A4 (por ejemplo, Itraconazol, claritromicina, nefazodona, troleandomicina, ritonavir, nelfinavir) presenten un comportamiento similar.
Medicamentos con un alto grado de unión a las proteínas plasmáticas: Por no presentar un alto grado de unión a las proteinas plasmáticas es de esperar que no se produzcan alteraciones de la concentración libre de la Eszopiclona ni de otros fármacos con un grado alto de unión a las proteinas plasmáticas.
Existen informes que dan cuenta de la carencia de interacciones con paroxetina, lorazepan, digoxina y warfarina.

REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas informadas con mayor frecuencia (incidencia > =1%) son:
Organismo en su totalidad : Cefalea, infección viral, lesión accidental, dolor lumbar, síndrome gripal, dolor, astenia, dolor torácico.
Aparato digestivo: Sequedad Bucal, dispepsia, nauseas, vómitos, diarrea, dolor abdominal.
Aparato cardiovascular: Migraña, edema periférico.
Sistema nervioso: Ansiedad, confusión, depresión, mareos, alucinaciones, disminución de la líbido, nerviosismo, somnolencia, sueños anormales, euforia, neuralgia.
Aparato respiratorio: Infección, faringitis, rinitis.
Piel y anexos: Erupción cutánea, prurito.
Órganos de los sentidos: Sabor desagradable.
Aparato urogenital: Dismenorrea, ginecomastia, infección urinaria.
Osteomusculares: Mialgia
El sabor desagradable fue el evento adverso que presentó la relación dosis-respuesta más clara.
Más raramente (incidencia <1%) se han informado las siguientes reacciones adversas, sin establecerse claramente relación causal con la droga en todos los casos:
Reacción alérgica, celulitis, edema facial, fiebre, halitosis, golpes de calor, hernia, malestar general, rigidez de cuello, fotosensibilidad. Hipertensión, tromboflebitis. Anorexia, colelitiasis, aumento del apetito,melena, ulceración en la boca, sed, estomatitis ulcerosa, colitis, disfagia, gastritis, hepatitis, hepatomegalia, daño hepático, úlcera gástrica, estomatitis, edema lingual, hemorragia rectal. Anemia, linfadenopatía. Hipercolesterolemia, aumento de peso, pérdida de peso, deshidratación, gota, hiperlipemia, hipocalemia.
Artritis, bursitis, trastornos articulares (tumefacción, rigidez y dolor), calambres musculares, miastenia, espasmos, artrosis, miopatía, potosis.
Agitación, apatía, ataxia, labilidad emocional, hostilidad, hipertonía, incoordinación, insomnio, pérdida de la memoria, neurosis, nistagmo, parestesia, disminución de los reflejos, trastornos del pensamiento (principalmente dificultad para concentrarse), vértigo, marcha anormal, euforia, hiperquinesia, neuritis, neuropatía, estupor, temblores.
Asma, bronquitis, disnea, epistaxis, hipo, laringuitis. Acné alopecia, dermatitis de contacto, sequedad de piel, eczema, decoloración de la piel, sudoración, urticaria, eritema multiforme, forunculosis, herpes zoster, hirsutismo, exantema máculo-papular, erupción vesiculobullosa. Conjuntivitis, sequedad ocular, dolor de oído, otitis externa, otitis media, acúfenos, trastorno vestibular, hiperacusia, iritis, midriasis, fotofobia. Amenorrea, congestión mamaria, hipertrofia mamaria, neoplasia mamaria, mastalgia, cistitis, disuria, galactorrea, hematuria, cálculo renal, dolor renal, menorragia, metrorragia, polaquiuria, incontinencia urinaria, hemorragia uterina, hemorragia vaginal, vaginitis, oliguria, pielonefritis, uretritis.

SOBREDOSIS

Se ha informado un caso de sobredosis de hasta 36 mg de eszopiclona con recuperación completa. Existen antecedentes de sobredosis con zopiclona racémica de hasta 340 mg con recuperación completa. Los signos y síntomas de sobredosis corresponderían a una exageración de los efectos farmacológicos, incluyendo la alteración de la conciencia que va desde la somnolencia hasta el coma. Se han informado casos raros de evolución fatal por sobredosis simultánea de depresores del sistema nervioso central. Se recomienda efectuar lavado gástrico de inmediato, cuando corresponda, y medidas generales sintomáticas y de soporte (hidratación parenteral). Puede ser útil la administración de flumazenil. Controlar la función respiratoria y cardiovascular y otros signos pertinentes. La hipotensión arterial y la depresión del sistema nervioso central requieren tratamiento médico adecuado.
No se ha determinado el valor de la diálisis en el tratamiento de la sobredosificación. Debe considerarse la posibilidad de sobredosis con múltiples fármacos.

ANTE LA EVENTUALIDAD DE UNA SOBREDOSIFICACIÓN, CONCURRIR AL HOSPITAL MAS CERCANO O COMUNICARSE CON LOS CENTROS DE TOXICOLOGÍA:
HOSPITAL DE PEDIATRÍA RICARDO GUTIERREZ: (011)4962-6666/2247
HOSPITAL A. POSADAS: (011) 4654-6648 /4658-7777

PRESENTACIÓN
Envase conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

CONSERVACIÓN
Conservar en su envase original a temperatura inferior a 30°C.

"Este medicamento ha sido prescripto solo para su problema médico actual. No se lo recomiende a otras personas"
ANTE CUALQUIER DUDA CONSULTE A SU MEDICO
MANTENER FUERA DEL ALCANCE DELOS NIÑOS.

Este medicamento debe ser administrado solo bajo prescripción médica y no puede repetirse sin una nueva receta.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.
Certificado Nº 54.833

Fecha de última revisión: 16/12/2008

2005120109 A

Línea Neurociencias

Megalabs

Megalabs Argentina S.A.U
Cuba 2760 - Buenos Aires
Director Técnico: Gustavo H. Aguirre - Farmacéutico