

FARMACODIVULGACIÓN. Medicamentos nuevos de la Industria Farmacéutica Cubana

Montelukast

Forma farmacéutica: tableta.

Denominación común internacional: montelukast sódico.

Composición: cada tableta contiene 10 mg de montelukast sódico, lactosa.

Categoría farmacológica: antagonista de los leucotrienos (categorías farmacológicas).

Farmacocinética: la concentración plasmática máxima se alcanza entre 2-4 horas después de su administración por vía oral con una biodisponibilidad del 64 %. La absorción no se ve modificada por la ingestión de los alimentos. La unión a proteínas plasmáticas es del 99 %. Se metaboliza de forma extensa en el hígado por las isoenzimas CYP3A4, CYP2A6 y CYP2C9 del citocromo P450. La semivida de eliminación del montelukast es de 2,7 a 5,5 horas, siendo eliminado, conjuntamente con sus metabolitos casi exclusivamente por vía biliar a través de las heces. Su metabolismo disminuye y su semivida de eliminación aumenta en presencia de disfunción hepática moderada. La farmacocinética es similar en pacientes jóvenes o ancianos y no es afectada por la insuficiencia renal.

Indicaciones: asma persistente leve a moderada en pacientes no controlados adecuadamente con corticoides inhalados y beta-2 de acción corta "a demanda". Profilaxis de asma cuyo componente principal es la broncoconstricción inducida por el ejercicio. Alivio sintomático de la rinitis alérgica estacional en pacientes asmáticos.

Contraindicaciones: hipersensibilidad al montelukast.

Uso en poblaciones especiales: ver información adicional en precauciones. Niño: se desconoce la eficacia y seguridad en esta población. LM: evitar, datos no disponibles. E: categoría de riesgo B. DH: usar con cautela.

Precauciones: no es efectivo en el ataque agudo de asma bronquial.

Reacciones adversas frecuentes: astenia, somnolencia, fiebre dolor abdominal, dispepsia, gastritis, dolor dental, mareos, cefaleas congestión nasal, tos y rash maculopapular. Algunos efectos (diarrea, faringitis, laringitis, náusea, sinusitis, otitis e infecciones víricas) son más frecuentes en los pacientes pediátricos. Raras: síndrome de Churg-Strauss (infiltración pulmonar, eosinofilia y miocardiopatía dilatada) asociado a la suspensión de corticoesteroides.

Sujeto a vigilancia intensiva: sí.

Interacciones: potentes inductores hepáticos como fenitoína, fenobarbital y rifampicina: aumentan su metabolismo y disminuyen su concentración plasmática.

Posología: adultos, dosis 10 mg 1 vez/día antes de acostarse; niños de 2-5 años: 4 mg, niños de 6-14 años: 5 mg antes de acostarse.

Tratamiento de la sobredosis aguda y efectos adversos graves: tratamiento sintomático.

Información básica al paciente: este medicamento no debe de ser utilizado en el ataque agudo de asma bronquial.

Nivel de distribución: farmacia principal municipal, especial y hospitalaria.

Regulación a la prescripción: medicamento por receta médica.

Clasificación VEN: medicamento vital.

Laboratorio productor: Empresa Laboratorio Farmacéutico MEDSOL.

Nimotuzumab

Forma farmacéutica: bulbo.

Denominación común internacional: nimotuzumab.

Composición: cada bulbo contiene 50 mg de nimotuzumab en una concentración de 5 mg/mL y un volumen total de 10 mL. Contiene además 4,5 mg de fosfato de sodio monobásico, 18 mg de fosfato dibásico, 86 mg de cloruro de sodio, 2 mg de polisorbato 80.

Categoría farmacológica: antineoplásico, anticuerpo monoclonal.

Farmacocinética: el análisis farmacocinético se realizó en pacientes que presentan tumores de origen epitelial los cuales recibieron dosis entre 50 y 400 mg de nimotuzumab. Las curvas de concentración contra tiempo se ajustaron mejor a una ecuación biexponencial. El tiempo de vida media correspondió a 62,91; 82,60; 302,95 y 304,51 horas para las dosis de 50, 100, 200 y 400 mg, respectivamente. Presenta un comportamiento no lineal entre las dosis de 50 y 200 mg. A valores crecientes del producto se obtiene un incremento del tiempo de vida medio de distribución, de eliminación y del volumen de distribución. Asimismo, concentraciones crecientes del monoclonal implican valores decrecientes del aclaramiento plasmático. Para este tipo de biofármacos la dosis óptima biológica se define como la menor dosis con la cual se alcanza la saturación del aclaramiento plasmático. A partir de la dosis de 200 mg se alcanza una cinética de orden cero, por lo que esta es una dosis biológicamente activa.

Indicaciones: tumores de cabeza y cuello en estadios avanzados, astrocitomas de alto grado de malignidad recurrentes y/o refractarios en niños; glioblastomas multiformes en adultos. Actualmente se encuentran en fase de investigación clínica: cáncer de esófago, colon, cuello uterino, mama, canal anal, tumores nasofaríngeos, hepatocarcinoma, entre otros.

Contraindicaciones: pacientes que presenten antecedentes de hipersensibilidad a este u otro producto derivado de células superiores u otro componente de la fórmula de este producto.

Uso en poblaciones especiales: ver información adicional en precauciones. LM: evitar, E: categoría de riesgo C.

Precauciones: LM: no se conoce su excreción por la leche humana; no obstante, se recomienda suspender la lactancia materna durante la administración del fármaco. Carcinogenicidad: grupo de riesgo 3. Actualmente se están realizando varias investigaciones clínicas de extensión de este producto en otras localizaciones de cáncer. Se debe realizar monitoreo hematológico antes, durante y luego de haber terminado con el tratamiento. Deberán chequearse los signos vitales antes de la infusión de nimotuzumab. Si se detectan cifras altas de tensión arterial deberá sedarse al paciente, y al normalizarse esta, se procederá a la infusión. No se necesitan realizar ajustes de la velocidad de infusión, pues no se han presentado problemas relacionados con esta. En algunas ocasiones, en los primeros 5-10 min, el paciente puede manifestar prurito y rubor facial; cuando esto sucede, disminuir el goteo y se le aplicará algún antihistamínico. Si se presentan reacciones alérgicas, se deben administrar corticosteroides (1 mg/kg de metilprednisolona o siIIVilar) con antihistamínicos (20 mg de difenhidramina o similar) por vía parenteral. Deberán realizarse medidas antitérmicas si hay fiebre mayor que 38 °C. Se administra con precaución en pacientes que hayan recibido tratamiento previo con anticuerpos murinos. El nimotuzumab se utiliza con precaución en pacientes con enfermedades crónicas en fase de descompensación, por ejemplo: cardiopatía isquémica, diabetes mellitus o hipertensión arterial.

Reacciones adversas: frecuentes: temblores, escalofríos, náuseas, cefalea, vómitos, anemia, hipotensión o hipertensión arterial. Ocasionales: somnolencia, desorientación, mialgias, disfasia motora, lenguaje incoherente, sequedad bucal, enrojecimiento facial, debilidad en los miembros inferiores, aumento de creatinina, leucopenia, hematuria, dolor torácico y cianosis peribucal. Estas reacciones adversas responden al tratamiento con analgésicos y antihistamínicos a las dosis convencionales. Raras: choque anafiláctico.

Sujeto a vigilancia intensiva: sí.

Interacciones: se desconocen interacciones con otros medicamentos. La interacción del nimotuzumab con otros fármacos citostáticos se encuentra en fase de evaluación. Se ha demostrado sinergismo o potenciación de la actividad antitumoral cuando se combina con la radioterapia.

Posología: el tratamiento con el nimotuzumab tiene 2 etapas en todas las indicaciones clínicas: una etapa de inducción y otra de mantenimiento: la dosis recomendada del nimotuzumab en los tumores avanzados de cabeza y cuello así como en los glioblastomas multiformes en los adultos es 200 mg administrado 1 vez a la semana durante 6 semanas concomitante con la radioterapia o quimioradioterapia. Luego se administrará una dosis de 200 mg cada 15 días (dosis de mantenimiento) hasta que el paciente presente progresión de la enfermedad. En los astrocitomas recurrentes pediátricos de alto grado de malignidad, la dosis recomendada del nimotuzumab es 150 mg/m², administrado una vez a la semana durante 6 semanas en monoterapia. Más tarde se administrará una dosis de 150 mg/m² cada 15 días como dosis de mantenimiento, hasta que el estado general del paciente lo permita. El nimotuzumab debe ser administrado por vía intravenosa en 100-250 mL de solución salina en infusión de 30 min.

Tratamiento de la sobredosis aguda y efectos adversos graves: no se conocen los efectos de la sobredosificación del nimotuzumab.

Información básica al paciente: los pacientes deben ser informados que el nimotuzumab presenta pocos eventos adversos. Debe consultar a su médico de asistencia ante los síntomas siguientes: disnea, hipotensión, sibilancias, hipertensión, broncospasmo, taquicardia, urticaria o náusea y vómitos severos. Se recomienda evitar su uso durante el período de lactancia.

Nivel de distribución: uso exclusivo de hospitales.

Regulación a la prescripción: medicamento para el Programa Especial de Cáncer.

Clasificación VEN: medicamento especial.

Laboratorio productor: Centro de Inmunología Molecular.