

VENTA BAJO
RECETA SIMPLE
ARCHIVADA



COMPRI-
MIDOS
RECUBIERTOS
VIA ORAL



Orizon® Eszopiclona

Composición:

Cada comprimido recubierto de Orizon® 2 contiene:

Eszopiclona.....2,0 mg.
Excipientes.....c.s.

Cada comprimido recubierto de Orizon® 3 contiene:

Eszopiclona.....3,0 mg.
Excipientes.....c.s.

Mecanismo de acción: La eszopiclona es un agente hipnótico no benzodiazepínico del grupo de las ciclopirolonas, reconocido como el isómero S de la zopiclona racémica (S-zopiclona). Sus propiedades hipnóticas al parecer están relacionadas a un agonismo específico sobre los receptores centrales Omega1 y Omega2, pertenecientes al complejo macromolecular GABA. Se ha encontrado que la eszopiclona reduce el tiempo para conciliar el sueño y la frecuencia de despertares nocturnos, incrementa la duración del sueño y mejora tanto la calidad del sueño como la calidad del despertar. Por lo tanto se puede concluir que la eszopiclona disminuye la etapa I, incrementa la etapa II, mientras que preserva o prolonga las etapas de sueño profundo (III y IV) y la de sueño paradójico.

La Eszopiclona es la única droga usada para tratar el insomnio que se ha demostrado es segura y efectiva por más de 6 meses, sin producir signos de tolerancia y de dependencia significativas en el paciente.

Farmacocinética: La eszopiclona se absorbe muy bien por vía oral. Las comidas ricas en grasa pueden disminuir su absorción. Su unión a las proteínas del plasma es de 52 a 59%. La concentración máxima en plasma se obtiene aproximadamente a la 1 hora después de su administración. Se metaboliza extensivamente por oxidación y desmetilación a través del sistema enzimático CYP3A4 y CYP2E1 dando lugar al zopiclone-N-óxido de S, y zopiclone-N-desmetil de S. La vida media de eliminación es de 6 horas. Un 75% de la dosis de zopiclona racémica se elimina en orina, fundamentalmente en forma de metabolitos. Menos del 10% de la dosis de eszopiclona administrada por vía oral se elimina en orina como droga madre sin transformaciones.

Indicaciones: Tratamiento del insomnio caracterizado por la dificultad para conciliar el sueño, frecuentes despertares nocturnos y despertar temprano en la mañana.

Posología: La dosis de eszopiclona, debe adaptarse a cada paciente en particular.

- *En adultos*, la dosis inicial recomendada es de 2mg a la noche, antes de acostarse. La dosis puede aumentarse a 3mg si el médico lo considera necesario.

- *En los ancianos*, la dosis sugerida es de 1mg cuando hay dificultad para conciliar el sueño, y de 2mg cuando la dificultad está en mantener el sueño.

Se recomienda no administrar eszopiclona conjunta o inmediatamente después de ingerir alimentos con alto contenido de grasas, pues estos pueden retrasar la absorción del fármaco y reducir el efecto sobre la latencia del sueño.

Posología en poblaciones especiales:

- **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.

- **Pacientes pediátricos:** En niños y jóvenes menores de 18 años, aún no se han establecido su seguridad y eficacia.

Modo de uso: Eszopiclona debe ingerirse por vía oral inmediatamente antes de irse a la cama, puesto que el inicio de la sedación puede ocurrir tan rápidamente como 10 minutos después de la ingestión. Debe ser tomado preferentemente alejado de las comidas para facilitar su absorción.

Contraindicaciones: Hipersensibilidad a la droga. Insuficiencia hepática severa. Síndrome de apnea del sueño grave. Embarazo. Lactancia.

Reacciones Adversas: Los efectos secundarios de la eszopiclona fueron clasificados por sistema corporal, y calificados de acuerdo a su frecuencia como: Frecuentes, poco frecuentes y raros:

- **Generales:** Frecuentes: Dolor en el pecho, cefalea, infección viral. *Poco frecuentes:* Reacción alérgica, celulitis, edema facial, fiebre, halitosis, malestar general, rigidez de cuello, fotosensibilidad. - **Sistema cardiovascular:** Frecuentes: Cefalea; *Poco frecuentes:* hipertensión arterial; Raros: Tromboflebitis. - **Sistema nervioso:** Frecuentes: Ansiedad, confusión, depresión, mareos, alucinaciones, disminución de la libido, nerviosismo, somnolencia; *Poco frecuentes:* Agitación, apatía, ataxia, labilidad emocional, hostilidad, hipertensión, hiperestesia, incoordinación, insomnio, pérdida de memoria, neurosis, nistagmo, parestesia, disminución de reflejos, trastornos del pensamiento (principalmente dificultad para concentrarse), vértigo; Raros: Marcha anormal, distonía, hipoquinesia, neuritis, neuropatías, estupor, temblores. - **Sistema digestivo:** Frecuentes: Sequedad bucal, dispepsia, náuseas, vómitos; *Poco frecuentes:* Anorexia, coledolitiasis, aumento del apetito, melena, ulceración de la boca, sed, estomatitis ulcerosa; Raros: Colitis, disfgia, gastritis, hepatitis, hepatomegalia, daño hepático, úlcera gástrica, edema lingual, hemorragia rectal. - **Metabólicos y nutricionales:** Frecuentes: Edema periférico; *Poco frecuentes:* Hipercolesterolemia, ganancia de peso, pérdida de peso; Raros: Deshidratación, gota, hiperlipemia, hipopotasemia.

- **Enfermedades hematológicas y sistema linfático:** *Poco frecuentes:* anemia, linfadenopatías - **Sistema musculoesquelético:** *Poco frecuentes:* Artritis, bursitis, trastornos articulares (sobre todo inflamación, rigidez y dolor), calambres en las piernas, miastenia; Raros: Artrosis, miopatía, ptosis. - **Sistema respiratorio:** Frecuentes: Infecciones; *Poco frecuentes:* Asma, bronquitis, disnea, epistaxis, hipo, laringitis. - **Piel y anexos:**

Frecuentes: Prurito; *Poco frecuentes:* Acné, alopecia, dermatitis por contacto, piel seca, eczema, decoloración de la piel, sudoración, urticaria. Raros: Eritema multiforme, furunculosis, herpes zoster, hirsutismo, exantema maculopapular, exantema vesiculobulboso. - **Sistema urogenital/mamas:** Frecuentes: dismenorrea, ginecomastia; *Poco frecuentes:* Amenorrea, congestión mamaria, neoplasia de mama, dolor mamario, cistitis, disuria, hematuria, litiasis renal, menorragia, metrorragia, frecuencia urinaria, incontinencia urinaria, vaginitis; Raros: oliguria, pielonefritis, uretritis. - **Organos de los Sentidos:** Frecuentes: sabor desagradable; *Poco frecuentes:* conjuntivitis, ojo seco, otalgia, otitis externa, otitis media, tinnitus, trastorno vestibular. Raros: Hiperacusia, iritis, midriasis, fotofobia.

Precauciones y advertencias: Los trastornos del sueño pueden ser la manifestación inicial de una afección física y/o psiquiátrica. Por tal motivo, el tratamiento sintomático del insomnio sólo debería iniciarse después de una minuciosa 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 la presencia de una enfermedad psiquiátrica y/o clínica de base que debe evaluarse. En los ancianos y en los pacientes con disfunción hepática es recomendable iniciar el tratamiento con dosis bajas. Se ha informado la aparición de diversas alteraciones del pensamiento y del comportamiento en asociación con el uso de sedantes/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, despersonalización, y amnesia. 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. Aunque el riesgo es mínimo, el desarrollo de farmacodependencia y/o abuso no puede ser excluido totalmente. Se recomienda disminuir la dosis gradualmente para evitar los síntomas de rebote o de privación.

Uso durante el embarazo y la lactancia:

- **Embarazo:** Eszopiclona no debe utilizarse durante el embarazo. - **Lactancia:** Se desconoce si la Eszopiclona pasa a la leche humana. Eszopiclona no debe administrarse a mujeres que se encuentren amamantando.

- **Uso pediátrico:** No se han establecido la seguridad y eficacia de la Eszopiclona en niños y adolescentes menores de 18 años de edad.

- **Uso geriátrico:** Se recomienda emplear dosis menores.

Efectos sobre el manejo de vehículos y/o maquinarias: Los pacientes deben ser advertidos de una posible disminución de la capacidad de alerta y de la habilidad psicomotora, por lo que no deben conducir vehículos ni operar maquinarias peligrosas mientras se hallen bajo los efectos del hipnótico.

Restricciones de uso: Este producto debe ser administrado con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia hepática y renal, enfermedades psiquiátricas, alcoholismo, y en pacientes tratados con otros depresores del SNC.

Interacciones: - **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 en la farmacocinética de ninguno de los dos fármacos. Se recomienda precaución al administrarlos conjuntamente.

- **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 que inducen la CYP3A4 (rifampicina):** Se ha informado que la rifampicina, un inductor potente de la CYP3A4, disminuye la exposición a la zopiclona racémica en un 80%.

- **Como ocurre con todos los medicamentos, las drogas que aceleran o retardan el vaciamiento gástrico (metoclopramida, atropina), pueden influir sobre la actividad terapéutica.**

- **Otros:** Existen informes que dan cuenta de la carencia de interacciones con paroxetina, lorazepam, digoxina y warfarina.

Sobredosis: La sobredosificación con eszopiclona usualmente se manifiesta por diferentes grados de depresión del SNC que van desde somnolencia hasta coma, de acuerdo a la cantidad ingerida. La sobredosificación no pone en riesgo la vida, a menos que esté combinada con otros depresores del SNC (incluyendo alcohol). Se recomienda tratamiento sintomático y de soporte en un ambiente clínico adecuado. La atención debe ser enfocada a las funciones cardiovasculares y respiratorias. El lavado gástrico solamente es útil cuando se realiza inmediatamente después de la ingestión. El valor de la hemodíalisis en el tratamiento de la sobredosis con eszopiclona no ha sido bien establecido. El flumazenil puede ser un antídoto útil. En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en Emergencias Médicas sito en Avda. Gray Santos y Teodoro S. Mongelós. Tel.: 220 418 - Asunción Paraguay

Presentación: Caja conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

Almacenar a temperatura ambiente (Inferior a 30°C). Mantener fuera del alcance de los niños.



ETICOS®

Elaborado por
Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.
Attilio Gallre N° 151 y Calle 1 - San Lorenzo, Paraguay
Tel.: (595-21) 521 390 (R.A.) Fax: (595-21) 521 389
laboratorio@eticos.com.py/www.eticos.com.py
D.T.: Q.F. Myriam Cabrera de Paredes - Reg. N° 2837
Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.