

**Siprax 1 mg:** Cada comprimido recubierto contiene Eszopiclona 1 mg y excipientes c.s.  
**Siprax 2 mg:** Cada comprimido recubierto contiene Eszopiclona 2 mg y excipientes c.s.  
**Siprax 3 mg:** Cada comprimido recubierto contiene Eszopiclona 3 mg y excipientes c.s.

**Indicaciones:**  
Según prescripción médica.

**Características farmacológicas:**

**Acción farmacológica:**

El mecanismo preciso de acción de la Eszopiclona es desconocido pero se cree que su efecto es resultante de su interacción con complejos receptores GABA al ligarse predominantemente en localizaciones cercanas o acopladas alostéricamente a receptores benzodiazepínicos. La Eszopiclona deriva de la pirrolopirazina, de la clase de la ciclopirrolona con una estructura química no relacionada a pirazolopirimidinas, imidazopiridinas, benzodiazepinas, ni barbitúricos.

**Farmacocinética:**

La Eszopiclona es rápidamente absorbida luego de su administración oral. Las concentraciones pico plasmáticas son alcanzadas dentro de aproximadamente una hora después de su administración oral. La Eszopiclona se liga débilmente a las proteínas plasmáticas (52-59 %) y es extensamente metabolizada a nivel hepático por oxidación y desmetilación. La Eszopiclona es eliminada con una media t<sub>1/2</sub> de aproximadamente 6 horas y los metabolitos plasmáticos primarios son (S)-óxido-N-zopiclona y (S)-N-desmetil zopiclona; ambos sin actividad farmacológica significativa. Como hasta el 75 % de una dosis oral de Zopiclona racémica es excretada en la orina, primariamente como metabolitos, un perfil de excreción similar debería esperarse para la Eszopiclona, el isómero-S de la zopiclona racémica. Sin embargo, menos del 10 % de la dosis de Eszopiclona administrada oralmente se excreta en orina como droga precursora. El efecto de Eszopiclona puede ser reducido si es tomado con o inmediatamente después de una comida pesada y elevada en grasas.

**Poblaciones especiales:**

**Edad:** En pacientes añosos se observaron diferencias de la cinética de la droga cuando se comparó con adultos. Por lo tanto, en estos pacientes la dosis de inicio deberá disminuirse a 1 mg y no deberá exceder los 2 mg.

**Sexo:** La farmacocinética de la Eszopiclona en hombres y mujeres es similar.

**Insuficiencia Hepática:** La dosis de Eszopiclona no deberá aumentarse por encima de los 2 mg en pacientes con insuficiencia hepática severa. No se requiere ajuste de dosis en insuficiencia hepática leve a moderada.

**Insuficiencia renal:** No se requiere ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal.

**Posología y modo de administración**

La dosis de **Siprax** deberá ser individualizada para cada paciente en particular. Se recomienda una dosis de inicio de 2 mg antes de acostarse. La dosis puede ser aumentada a 3 mg si está clínicamente indicado, ya que 3 mg es más efectivo.

Para pacientes añosos, se recomienda una dosis de inicio de 1 mg antes de acostarse. En estos pacientes, la dosis puede ser aumentada hasta 2 mg.

La toma de **Siprax** con o inmediatamente después de una comida de alto contenido graso resulta en una absorción más lenta por lo que deberá esperarse la reducción del efecto.

En pacientes con insuficiencia hepática severa la dosis inicial deberá ser de 1 mg.

La dosis inicial no deberá exceder 1 mg en pacientes a los que se les administran concomitantemente inhibidores potentes de CYP3A4. Si es necesario, la dosis puede elevarse a 2 mg.

**URUFARMA S.A.**

Monte Caseros 3260 - Montevideo - Uruguay - Teléfono 2487 2424

E-mail: depto\_medico@urufarma.com.uy

Pág. Web: www.urufarma.com.uy

**Contraindicaciones**

Hipersensibilidad al principio activo o a cualquiera de los componentes del producto.

**Precauciones y advertencias**

El tratamiento con **Siprax** debe iniciarse únicamente después de una evaluación cuidadosa del paciente.

Pensamientos anormales y cambios del comportamiento han sido referidos cuando el fármaco se asocia a fármacos sedantes y/o hipnóticos. Algunos de estos cambios pueden estar caracterizados por una inhibición disminuida, similar a los efectos producidos por el alcohol y otros depresores del SNC.

Es difícil determinar con certeza si los comportamientos anormales son inducidos por la droga, por eso, la aparición de cualquier signo o síntoma nuevo en el comportamiento requiere una evaluación cuidadosa e inmediata.

Debido al rápido inicio de acción, **Siprax** deberá administrarse inmediatamente antes de acostarse.

Se deberá advertir a los pacientes sobre la potencial insuficiencia en el desempeño de actividades peligrosas que requieren completa alerta mental o coordinación motora (por ejemplo, operar con máquinas o manejar vehículos), después de la ingesta y en el día posterior a la ingestión de **Siprax**.

Eszopiclona, como otros fármacos de su clase, puede producir efectos depresores aditivos sobre el SNC cuando se coadministra con anticonvulsivantes, antihistamínicos, Etanol y cualquier otra droga que produzca depresión del SNC, por lo que **Siprax** no debe ser ingerido con alcohol y puede ser necesario realizar un ajuste de dosis.

En pacientes añosos y/o debilitados se deberá tener en cuenta la disminución en el desempeño motor y/o cognitivo.

**Uso en Pacientes con Enfermedad Concomitante:** La Eszopiclona deberá ser usada con precaución en pacientes con enfermedades o condiciones que puedan afectar el metabolismo o las respuestas hemodinámicas.

Se aconseja administrar con precaución en pacientes con función respiratoria comprometida.

La dosis de **Siprax** deberá ser reducida en pacientes a quienes se les administran potentes inhibidores de CYP3A4, tales como Ketoconazol, mientras tomen **Siprax** y un criterio similar deberá observarse cuando se administre con fármacos depresores del Sistema Nervioso Central.

**Siprax** debe administrarse con precaución en aquellos pacientes que exhiban signos y síntomas de depresión ya que, la tendencia al suicidio puede estar presente en tales pacientes.

**Embarazo:** Categoría C. No hay estudios adecuados y bien controlados de Eszopiclona en mujeres embarazadas. La Eszopiclona deberá ser usada durante el embarazo sólo si los beneficios potenciales justifican el riesgo potencial del feto.

**Madres Lactantes:** No se conoce si **Siprax** es excretada en la leche humana. Debido a que muchas drogas son excretadas en la leche humana, deberá ejercerse la precaución cuando **Siprax** sea administrada a mujeres lactantes.

**Uso Pediátrico:** No se ha establecido la seguridad y la efectividad de Eszopiclona en menores de 18 años.

**Uso Geriátrico:** El patrón general de eventos adversos para los sujetos añosos no fue diferente de aquel visto en adultos jóvenes.

**Carcinogénesis, Mutagénesis, Deterioro de la fertilidad:**

**Carcinogénesis:** En algún estudio experimental se observó un incremento en la incidencia de adenocarcinomas de glándula mamaria y en la incidencia de adenoma en glándula tiroidea. El mecanismo de producción de cáncer mamario es desconocido, en tanto que para el caso del cáncer de tiroides parece ser debido a un incremento de los niveles de TSH. También se han observado casos de carcinoma de pulmón, y de fibromas y sarcomas de piel.

**Mutagénesis:** Se observaron algunos resultados positivos en la evaluación de respuestas mutagénicas.

**Deterioro de la Fertilidad:** Se observó un deterioro de la fertilidad, probablemente debido a su efecto tanto en el sexo femenino como en el masculino.

**Interacciones:**

**Alcohol:** Se ha visto un efecto aditivo sobre el desempeño psicomotor con la coadministración de Eszopiclona y alcohol hasta 4 horas después de la ingesta de Alcohol.

**Paroxetina:** La coadministración de Eszopiclona y Paroxetina no produjo interacción farmacocinética o farmacodinámica.

**Lorazepam:** La coadministración de Eszopiclona y Lorazepam no tuvo efectos clínicamente relevantes sobre la farmacodinamia o la farmacocinética de ninguna de las dos drogas.

**Olanzapina:** La coadministración de Eszopiclona y Olanzapina produjo una disminución en los valores de DSST. La interacción fue farmacodinámica; no hubo alteración en la farmacocinética de ninguna de las dos drogas. Drogas que Inhiben CYP3A4 (Ketoconazol): CYP3A4 es un pasaje metabólico mayor para la eliminación de Eszopiclona. La AUC de

Eszopiclona se aumentó por la coadministración de Ketoconazol, un potente inhibidor de CYP3A4. Es de esperar que otros fuertes inhibidores de CYP3A4 (por ejemplo, Itraconazol, Amiodarona, Diltiazem, Eritromicina, Claritromicina, Fluoxetina, Fluvoxamina, Nefazodona, Troleandomicina, Ritonavir, Nelfinavir) se comporten similarmente.

**Drogas que Inducen CYP3A4 (Rifampicina):** La exposición de Zopiclona racémica se vio disminuida 80 % por el uso concomitante de Rifampicina, un potente inductor de CYP3A4. Un efecto similar se esperaría con Eszopiclona.

**Drogas Altamente Ligadas a Proteínas Plasmáticas:** La Eszopiclona no está altamente ligada a proteínas plasmáticas, por lo tanto, no se espera que la disposición de Eszopiclona sea sensible a las alteraciones en el ligamento de proteínas.

**Drogas con Estrecha Ventana terapéutica:**

**Digoxina:** Eszopiclona no afecta la farmacocinética de la Digoxina.

**Warfarina:** La Eszopiclona no afecta la farmacocinética de Warfarina.

**Alimentos:** Los alimentos retrasan la absorción de **Siprax** lo que resulta en una demora en el inicio de acción.

**Reacciones Adversas:**

Los efectos adversos que pudieran aparecer en el tratamiento con **Siprax** (con una incidencia menor o igual al 1 %) son: migraña, somnolencia, reacciones alérgicas, mareos, dolor de pecho, sequedad de boca y edema periférico.

**Sobredosis:**

Las medidas sintomáticas generales y de soporte deberán ser usadas junto con lavaje gástrico inmediato cuando sea apropiado. Se deberán administrar fluidos intravenosos según necesidad. El Flumazenil puede ser útil. Como en todos los casos de sobredosis de drogas, la respiración, el pulso, la tensión arterial y otros signos apropiados deberán ser monitoreados y deberán emplearse las medidas de soporte generales. Deberán monitorearse la hipotensión y la depresión del SNC y deberán tratarse con intervención médica apropiada. El valor de la diálisis en el tratamiento de la sobredosis no ha sido determinada.

**Presentación:**

**Siprax 1 mg:** Envase conteniendo 30 comprimidos recubiertos.

**Siprax 2 mg:** Envase conteniendo 10 y 30 comprimidos recubiertos.

**Siprax 3 mg:** Envase conteniendo 10 y 30 comprimidos recubiertos.

Conservar a temperatura ambiente (15-30) °C.

En caso de intoxicación comunicarse con el C.I.A.T. Tel. (02) 1722.

Mantener fuera del alcance de los niños.

**MEDICAMENTO CONTROLADO**