



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

ANTIMONIATO DE MEGLUMINA

2. VÍA DE ADMINISTRACIÓN

INTRAMUSCULAR (IM)

3. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agentes antipalúdicos y antiparasitarios. Agentes contra la leishmaniasis y otras tripanosomiasis. Compuestos antimoniales pentavalentes. Antimoniato de meglumina.

Código ATC: P01CB01.

3.1. Farmacodinamia

Es un agente antimonial pentavalente con actividad leishmanicida. Aunque no se conoce con precisión su modo de acción, parece inhibir la actividad de algunas enzimas que modulan procesos bioquímicos vitales del parásito.

3.2. Farmacocinética

Tras su administración intramuscular el antimoniato de meglumina se absorbe rápidamente y genera niveles séricos pico en aproximadamente 2 horas. Produce un inicio de acción apreciable a las 2 semanas en pacientes con leishmaniasis visceral y mucocutánea, y en 8 semanas en los casos de leishmaniasis cutánea. Exhibe un volumen de distribución de 0,22 mL/kg. Se desconoce si difunde a la leche materna o si atraviesa la placenta en humanos. Se metaboliza parcialmente en el hígado a antimonio trivalente y se elimina en su mayoría (> 90%) por la orina (> 80% inalterado). Presenta un patrón de eliminación bifásico con una vida media terminal de 76 horas, probablemente debido a su conversión hepática en antimonio trivalente, el cual se acumula en algunos tejidos y se libera lentamente.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

No se han realizado estudios para evaluar el potencial carcinogénico y mutagénico del antimoniato de meglumina, ni sus efectos sobre la fertilidad.

Un estudio de reproducción en ratas expuestas durante la gestación a dosis del fármaco superiores a las equivalentes usadas en humanos mostró acumulación de antimonio en los fetos, embrioletalidad y malformaciones esqueléticas.

4. INDICACIONES

Tratamiento de la leishmaniasis visceral, cutánea y mucocutánea.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

5. POSOLOGÍA

Las dosis se expresan en términos de antimonio pentavalente.

Nota: Cada fabricante especificará la cantidad de antimonio pentavalente que aporta su producto por unidad posológica.

5.1. Dosis

20 mg de antimonio pentavalente/kg/día IM, por 20 a 28 días.

La dosis puede repetirse o continuarse en caso necesario, según criterio médico

5.2. Dosis máxima

No descrita. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

Uso contraindicado.

Insuficiencia hepática

Uso contraindicado.

Edad avanzada (≥ 65 años)

Deberá ser usado con precaución en esta población y siempre teniendo en cuenta su función renal.

Edad pediátrica (≤ 18 años)

Se debe seguir las mismas pautas posológicas utilizadas para el adulto.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Administrar mediante inyección profunda en un músculo grande (nalga o muslo). Si el volumen a administrar excede los 10 mL, se debe dividir en 2 dosis e inyectar cada una en sitios diferentes.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia según Diccionario Médico para Actividades Regulatorias (MedDRA) en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Trastornos de la sangre y del sistema linfático

Frecuencia no conocida: Leucopenia, agranulocitosis, anemia.

Trastornos del sistema inmunológico

Frecuencia no conocida: Reacciones anafilactoides.

Trastornos del metabolismo y de la nutrición

Frecuentes: Anorexia.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Cefalea, letargia, neuritis periférica.

Trastornos cardiacos

Frecuentes: Alteraciones electrocardiográficas (inversión de la onda T y prolongación del intervalo QT), bradicardia, fibrilación auricular, taquicardia ventricular (torsades de pointes).

Trastornos vasculares

Frecuencia no conocida: Hipotensión.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Poco frecuentes: Disnea, tos.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Náusea, vómitos, dolor abdominal.

Frecuencia no conocida: Pancreatitis.

Trastornos hepatobiliares

Poco frecuentes: Aumento de enzimas hepáticas, hepatitis.

Frecuencia no conocida: Daño hepatocelular (se observa especialmente en asociación con insuficiencia renal).

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Erupción, edema facial.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo

Muy frecuentes: Rigidez articular, artralgia, mialgia.

Trastornos renales y urinarios

Frecuencia no conocida: Prueba de función renal alterada, insuficiencia renal aguda, proteinuria.



Instituto Nacional de Higiene “Rafael Rangel”

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Al comienzo del tratamiento, puede aparecer una reacción febril pasajera acompañada de escalofríos o de sensación de desmayo con sudoración, tos asociada al antimonio.

Poco frecuentes: Malestar general.

Frecuencia no conocida: Edema facial; tromboflebitis cuando se administra de forma inapropiada, dolor en el sitio de inyección.

Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita a los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene “Rafael Rangel”, a través de la página web: <https://inhrr.gob.ve>.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

El uso combinado de antimonio de meglumina y medicamentos que producen prolongación del intervalo QT puede incrementar el riesgo de dicha reacción. Algunos fármacos con este potencial incluyen: antiarrítmicos clase IA (como disopiramida y procainamida) o clase III (como amiodarona y sotalol), antidepresivos (como citalopram, fluoxetina y los tricíclicos), antipsicóticos (como haloperidol, pimozida y clorpromazina), quinolonas (como moxifloxacino y ciprofloxacino), macrólidos (como eritromicina, azitromicina y claritromicina), domperidona y ondansetrón, entre otros.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Durante el tratamiento se deben practicar exámenes periódicos de la función renal, hepática y cardíaca (electrocardiograma) en todos los pacientes y, además, realizar hematología completa.

Dado que el tratamiento con antimonio de meglumina se ha asociado con prolongación del intervalo QT, se recomienda usar con cautela en pacientes que reciben medicamentos con ese potencial (ver: Interacciones).

Durante el tratamiento se recomienda una alimentación rica en proteínas y, de ser posible, corregir previamente cualquier deficiencia específica del paciente, en especial la carencia de hierro.

Usar con precaución en menores de 18 años, en ancianos y en pacientes malnutridos, debilitados o con historia de pancreatitis.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

8.2. Embarazo

Dado que en ensayos de experimentación se ha evidenciado embriotoxicidad y teratogénesis con el antimonio de meglumina y no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.

8.3. Lactancia

Dado que no se conoce si el antimonio de meglumina se distribuye en la leche materna, ni se dispone de información sobre su seguridad durante la lactancia, se debe evitar su empleo en ese período. En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

8.4. Fertilidad

No hay datos disponibles.

8.5. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se han realizado estudios sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

Insuficiencia renal, cardíaca o hepática.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis de antimonio de meglumina puede causar vómitos, cefalea, polineuritis, bradicardia, inversión de la onda T, prolongación del intervalo QT, ictericia e insuficiencia renal aguda.

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte, según necesidad.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Intramuscular.

INDICACIONES Y POSOLOGÍA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia.

De ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspenda la lactancia materna mientras dure el tratamiento.



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACIÓN DEL TEXTO

Febrero de 2022