

CLOROQUINA FOSTATO

ANTIPALÚDICO/ANTIAMEBIANO/ANTIINFLAMATORIO

COMPOSICIÓN:

Cada comprimido contiene:

Principio activo: Cloroquina fosfato - 250 mg.

Excipientes: Lactosa, starch, cab-o-si, kollidon k30, croscarmelosa sódica, estearato de magnesio.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Profilaxis y tratamiento del paludismo, excepto cepas resistentes; otras infecciones protozoarias o por helmintos tales como lambliasis, amebiasis extraintestinal, dístoma hepático, paragonimiasis y leishmaniasis mucosa americana.

Tratamiento de artritis reumatoide aguda o crónica, incluyendo la forma idiopática juvenil y la espondiloartritis; conectivopatías y enfermedades del colágeno tales como lupus eritematoso sistémico; lupus discoide, esclerodermia, sarcoidosis, actinodermatosis, rosácea, fotodermatosis y dermatitis herpetiforme maligna.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Posterior a la administración oral de cloroquina fosfato de 250 mg, se absorbe rápida y completamente a nivel del tracto gastrointestinal, alcanza sus concentraciones plasmáticas máximas en un periodo de tiempo de 3 horas.

Unión a proteínas: Presenta una unión a proteínas plasmáticas en un intervalo de 50 - 60%.

Metabolismo: Presenta un metabolismo hepático llevado a cabo principalmente por CYP2C8 y CYP3A4 a N-desetilcloroquina.

Distribución: El volumen de distribución de cloroquina es 200-800 L/ kg. Se distribuye ampliamente en los tejidos corporales, incluidos los ojos, el corazón, los riñones, el hígado, los leucocitos y los pulmones, donde la retención se prolonga.

Vida media: Posee una vida media de 30 - 60 días.

Excreción: La cloroquina se excreta de manera predominante por vía renal a través de la orina en un 70%, aproximadamente el 35% se excreta como fármaco inalterado. Un porcentaje del 10% se excreta por vía digestiva a través de las heces.

FARMACODINAMIA:

La cloroquina es un medicamento antipalúdico cuyo mecanismo de acción se da gracias a su fijación a las porfirinas, lo cual da lugar a la destrucción o inhibición de las formas asexuadas de los plasmodios no resistentes en los eritrocitos; de igual manera interfiere

en el desarrollo de las formas sexuadas conocidas como gametocitos del Plasmodium ovale, Plasmodium vivax, Plasmodium malariae y de las formas inmaduras de Plasmodium falciparum. En combinación con derivados de la emetina, la cloroquina es eficaz también en la amebiasis extraintestinal.

La cloroquina es una sustancia activa que posee un efecto antirreumático, por lo cual administrada durante un período de tiempo prolongado, puede modificar el curso de la artritis reumatoide en un grado suficiente para inducir una remisión. No posee actividad antiinflamatoria en la mayoría de modelos experimentales de inflamación. Su acción antirreumática podría ser debida a un efecto inmunosupresor. Se ha confirmado su eficacia en el lupus eritematoso sistémico.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Vía oral.

POSOLOGÍA:

Quimioprofilaxis de la malaria: **ADULTOS:** 500 mg (300 mg de cloroquina base) semanalmente el mismo día cada semana; comenzar 1 a 2 semanas antes de la exposición; continuar mientras se encuentre en el área endémica y durante 4 semanas después de salir del área endémica. **NIÑOS:** 5 mg de cloroquina base/kg de peso una semana antes de emprender el viaje, o, si se inicia el tratamiento al emprender el viaje administrar 10 mg de cloroquina base por kg divididos en 2 dosis iguales separadas por un intervalo de 6 horas.

Tratamiento de la malaria, sin complicaciones: **ADULTOS:** 1 g (600 mg de cloroquina base) el día 1, seguido de 500 mg (300 mg de cloroquina base) a las 6, 24 y 48 horas después de la primera dosis. **NIÑOS:** El primer y segundo día se administrarán 10 mg de cloroquina base /kg, y el tercer día, 5 mg de cloroquina base /kg.

Tratamiento de la amebiasis extraintestinal: **ADULTOS:** 1 g (600 mg de cloroquina base) /día durante 2 días, seguidos de 500 mg (300 mg de cloroquina base) diarios durante al menos 2 a 3 semanas; puede combinarse con un amebicida intestinal. **NIÑOS:** 10 mg de cloroquina base/kg de peso durante 2 días, seguido de 5 mg de cloroquina base /kg de peso durante 14 a 28 días.

Tratamiento de artritis reumatoide aguda o crónica, incluyendo la forma idiopática juvenil y la espondiloartritis; conectivopatías y enfermedades del colágeno: **ADULTOS:** 1 comprimido al día. **NIÑOS:** 2,5 mg de cloroquina base/kg de peso corporal.

Nota: Cada 250 mg de fosfato de cloroquina es equivalente a 150 mg de base de cloroquina.

LA DOSIS Y LA DURACIÓN DEL TRATAMIENTO DEBEN SER DEFINIDAS POR EL MÉDICO EN FUNCIÓN DEL ESTADO DEL PACIENTE.

CONTRAINDICACIONES:

Antecedentes de hipersensibilidad a la cloroquina y a las 4-aminoquinoleínas o a alguno de los componentes de la formulación. Retinopatía o deterioro del campo visual; trastornos del sistema hematopoyético; déficit de glucosa-6-fosfato deshidrogenasa

(anemia hemolítica, favismo); miastenia gravis; no debe administrarse a mujeres embarazadas o en período de lactancia.

PRECAUCIONES DE USO:

Tener precauciones en pacientes con insuficiencia renal, insuficiencia hepática de leve a moderada, epilepsia; no administrar a pacientes con psoriasis o porfiria, ni a niños para profilaxis a largo plazo del paludismo; Debe realizarse un control hematológico antes de iniciar un tratamiento a largo plazo y a intervalos de 2 meses durante el mismo. Los pacientes con epilepsia que reciben tratamiento con cloroquina requieren controles médicos regulares.

Las mujeres que tomen cloroquina para la profilaxis del paludismo durante un período largo de tiempo deberían utilizar métodos adecuados de contracepción durante este período y deberían evitar el embarazo durante los tres meses posteriores a la interrupción del tratamiento de profilaxis. La cloroquina puede causar hipoglucemia severa incluyendo pérdida de conciencia que puede amenazar la vida de los pacientes tratados con y sin medicamentos antidiabéticos orales.

Se debe tener especial precaución en pacientes con prolongación congénita o adquirida documentada del intervalo QT y factores de riesgo conocidos de prolongación del intervalo QT.

REACCIONES ADVERSAS:

Bloqueo auriculoventricular, bloqueo de rama, arritmia cardíaca, cardiomiopatía, cambios en el ECG, hipotensión, torsade de pointes, fibrilación ventricular, taquicardia ventricular; agitación, ansiedad, confusión, disminución del reflejo tendinoso profundo, delirio, depresión, reacción extrapiramidal (Distonía, discinesia, protrusión de la lengua, tortícolis), alucinaciones, dolor de cabeza, insomnio, disfunción motora (Trastorno sensoriomotor), cambios de personalidad, polineuropatía, psicosis, convulsiones, tendencias suicidas; alopecia, decoloración del cabello, pigmentación de la piel gris azulada, eritema multiforme, exacerbación de la psoriasis, dermatitis exfoliativa, liquen plano, erupción cutánea pleomórfica, prurito, fotosensibilidad de la piel, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis epidérmica tóxica, urticaria; hipoglucemia; calambres abdominales, anorexia, diarrea, náuseas, vómitos; agranulocitosis, anemia aplásica, anemia hemolítica (En pacientes con deficiencia de G6PD), neutropenia, pancitopenia, trombocitopenia; hepatitis, aumento de las enzimas hepáticas; reacción anafilactoide, anafilaxia, angioedema; miopatía, enfermedad neuromuscular, miopatía proximal; trastornos de acomodación, visión borrosa, opacidad corneal, degeneración macular, maculopatía, ambliopía nocturna, retinopatía (Incluidos cambios irreversibles en el tratamiento a largo plazo o en dosis altas de algunos pacientes) , escotomas transitorios, defectos del campo visual; óptico; sordera, pérdida auditiva (Riesgo aumentado en pacientes con daño auditivo preexistente), tinnitus.

ADVERTENCIAS ESPECIALES:

Embarazo: Categoría C: La cloroquina y sus metabolitos atraviesan la barrera placentaria y pueden detectarse en la sangre del cordón umbilical y la orina del recién nacido. Sin embargo, el beneficio de su uso en mujeres embarazadas puede aceptarse a pesar del riesgo. La cloroquina se puede usar en todos los trimestres del embarazo.

Lactancia: Atraviesa las membranas y pasa a la leche materna en un porcentaje del 2-4%. Aunque no se conocen casos de lactantes que hayan sufrido efectos nocivos se recomienda interrumpir la lactancia materna durante la administración de este fármaco.

Pediatría: Se contraindica la administración de cloroquina a niños como profilaxis a largo plazo del paludismo. Su uso es seguro siempre que se respeten las dosis/kg de peso.

Geriatría: El comportamiento terapéutico a largo plazo es similar al de los pacientes adultos por lo cual este grupo de pacientes deben tomar las mismas precauciones y sufrirán similares efectos adversos que la población adulta. Se debe tener especial precaución en pacientes con un deterioro de la función hepática y renal.

Precauciones al conducir vehículos y maquinaria: Debido a que la cloroquina puede provocar efectos secundarios relacionados con el sistema nervioso central tales como cefalea, mareo, somnolencia, estados de confusión, se debe guardar especial precaución ya que la capacidad de conducir y utilizar máquinas puede verse deteriorada.

USTED DEBE INFORMAR AL MÉDICO TODOS LOS MEDICAMENTOS QUE CONSUME, INCLUSIVE LOS QUE OBTIENE SIN RECETA.

INTERACCIONES:

La cloroquina disminuye el efecto terapéutico agalsidase alfa y beta, vacunas del cólera, rabia, neostigmina y piridostigmina; aumenta la concentración sérica de los antipsicóticos como la fenotiazida, glucósidos cardiacos, perhexilina, primaquina; disminuye la concentración sérica de la ampicilina, bacampicilina, praziquantel; disminuye el metabolismo de los betabloqueantes; disminuye la absorción de la ampicilina; aumenta el efecto hipoglucémico de domperidona, pequisomant, salicilatos, serotoninas, pequisomant, protionamida, quinolonas; aumenta el efecto de prolongación de Q-T de la primozida, antidepresivos, quinolonas, nitrito sódico, antipsicóticos; aumenta el efecto adverso de la dapsona, haloperidol, anestésicos locales, mefloquina, lumefantina, prilocaína, inhibidores de la monoaminoxidasa, penicilinas.

La cimetidina disminuye la excreción de la cloroquina; los antiácidos y caolín disminuyen su absorción; el óxido nítrico, tamoxifeno, fexinidaxol y el artemether aumentan su efecto tóxico; el bosetan, ergafitinib, lantano, mitotano, sarilumab, tocilizumab y la enzalutamida disminuyen la concentración sérica; el acetato de abiraterona, aprepitante, asunaprevenir, cimetidina, clobazan, clofazimina, conivaptan, docomitinib, duvelisib, fosaprepinat, ácido fusídico, matinib, netupitan, panobinostat, estiripentol y la ciclosporina aumentan la concentración sérica de la cloroquina.

SOBREDOSIFICACIÓN:

En caso de sobredosificación o ingestión accidental de 2 – 5 g de cloroquina se considera una situación emergente que puede comprometer la vida del paciente en un periodo de tiempo de 1-3 horas, la muerte puede darse como resultado de un paro cardiorespiratorio. Las manifestaciones que se pueden presentar en caso de sobredosificación son alteraciones electrocardiográficas tales como complejo QRS ensanchado, bradiarritmias, alteraciones del ritmo de la unión auriculoventricular, prolongación del intervalo QT, bloqueo auriculoventricular, taquicardia ventricular, torsade de pointes y fibrilación

ventricular. Durante la fase prodrómica de la intoxicación se pueden presentar síntomas como cefalea, alteraciones visuales, disnea, somnolencia y alteraciones del ritmo cardíaco que confluyen a un inminente descenso de la presión arterial, seguido de un estado de shock con pérdida del conocimiento y convulsiones.

El manejo terapéutico debe ser multidisciplinario, enfocado en evitar la absorción del principio activo y en abordar de manera sintomática al paciente y de manera gradual conforme progresa el cuadro clínico. No existe un antídoto conocido por lo cual se realizará un lavado gástrico lo antes posible, con la finalidad de eliminar el producto. En caso de que el cuadro progrese de manera no adecuada se debe proporcionar un sistema de respiración asistida y apoyo circulatorio con adrenalina.

Para el abordaje terapéutico de las convulsiones se administrarán benzodiazepinas como el diazepam, fenobarbital y en caso de ser necesario se usaran relajantes musculares periféricos. La hemodiálisis no está indicada.

EN CASO DE SOBREDOSIS O INGESTIÓN ACCIDENTAL CONSULTE DE INMEDIATO A SU MÉDICO.

PRESENTACIONES:

Caja de 100 tabletas (10 blíster con 10 comprimidos cada uno).

Caja de 200 tabletas (20 blíster con 10 comprimidos cada uno).

CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:

Manténgase fuera del alcance de los niños, en su envase original, a una temperatura no mayor de 30°, protegido de la luz y del calor.

- *Consultar al médico en caso de requerir mayor información o tenga cualquier inquietud adicional.*
- *En caso de que los síntomas continúen, consultar al médico.*
- *Conservar el prospecto para futura información que se requiera*



Kronos Laboratorios C. Ltda.

km 8.5 Vía Daule · Teléfonos: 2253143 - 2251445

Q.F. responsable: **Dr. Luis Carlo Paredes.**

www.kronoslaboratorios.com - info@kronoslaboratorios.com

Guayaquil - Ecuador