

GASTROZAC

RANITIDINA

Inyectable - Comprimidos recubiertos

Venta bajo receta

Industria Argentina

K-22/I

FÓRMULAS:

Cada comprimido recubierto contiene:

Ranitidina (como clorhidrato)150mg

Excipientes: Celulosa microcristalina, croscarmelosa sódica, dióxido de silicio coloidal, estearato de magnesio, hidroxipropilmetilcelulosa, talco, dióxido de titanio, polietilenglicol 6000, laca amarillo ocaso 14%, c.s.

Cada comprimido recubierto contiene:

Ranitidina (como clorhidrato)300mg

Excipientes: Celulosa microcristalina, croscarmelosa sódica, dióxido de silicio coloidal, estearato de magnesio, hidroxipropilmetilcelulosa, talco, dióxido de titanio, polietilenglicol 6000, laca amarillo ocaso 14%, c.s.

Cada ampolla contiene:

Ranitidina (como clorhidrato) 50mg

Excipientes: Fosfato monobásico de potasio anhidro, fosfato dibásico de sodio anhidro, fenol, agua para inyectables, c.s.

ACCIÓN TERAPÉUTICA:

Antagonista de los receptores de Histamina H₂. Agente antiulceroso. Inhibidor de la secreción gástrica ácida.

INDICACIONES:

Comprimidos

- Tratamiento a corto plazo de las úlceras gástricas y duodenales activas.
- Tratamiento de mantenimiento de las úlceras gástricas y duodenales administrando dosis reducidas una vez producida la cicatrización de la úlcera aguda, especialmente en pacientes con tendencia a la recidiva.
- Tratamiento de estados de hipersecreción patológica (por ej.: síndrome de Zollinger-Ellison y Mastocitosis sistémica).
- Tratamiento de la enfermedad por reflujo gastroesofágico (ERGE).

Inyectable

- El uso de ranitidina endovenosa se reserva para pacientes hospitalizados, como profilaxis de la hemorragia digestiva por estrés en pacientes severamente enfermos, como profilaxis de la hemorragia recurrente en pacientes con úlcera péptica sangrante o como alternativa de la administración oral en pacientes imposibilitados de utilizar esta vía.

POSOLOGÍA:

Comprimidos:

Adultos

- **Tratamiento de la úlcera gástrica y duodenal activas:** 150 mg dos veces al día. En aquellos pacientes en los que resulta importante administrar una dosis cómoda, se pueden administrar como alternativa 300 mg una vez al día después de la cena o al acostarse.

En caso de ser necesario, se deberán administrar antiácidos para calmar el dolor.

En la mayoría de los pacientes la cicatrización de la úlcera duodenal se logra dentro de las 4 semanas. Los estudios disponibles hasta la fecha no han evaluado la seguridad de ranitidina en la úlcera de duodeno no complicada durante períodos superiores a las 8 semanas.

La curación de la úlcera gástrica se logra en la mayoría de los pacientes dentro de las 6 semanas. Los estudios disponibles hasta la fecha no han evaluado la seguridad de ranitidina en la úlcera gástrica no complicada durante períodos superiores a las 6 semanas.

- **Mantenimiento de la cicatrización de las úlceras gástricas y duodenales:** 150 mg al acostarse. No se han realizado estudios comparativos controlados con placebo durante períodos superiores a 1 año.

- **Estados de hipersecreción patológica (Sme. de Zollinger-Ellison):** 150 mg tres veces al día. Puede ser necesario administrar dosis de 150 mg con mayor frecuencia. En pacientes con enfermedad severa se han administrado dosis de hasta 6 g por día.

- **ERGE:** 150 mg dos veces al día o 300 mg al acostarse. El alivio sintomático normalmente se produce al cabo de 24 hs de iniciado el tratamiento. La duración del tratamiento recomendada es de 8 semanas, pudiéndose extender a 12 semanas si es necesario.

Niños

Úlcera duodenal y gástrica: 2 a 4 mg por Kg de peso corporal, dos veces por día. Dosis máxima de 300 mg por día.

Ajuste de la dosis para pacientes con alteración de la función renal:

Pacientes con clearance de creatinina < 50ml/min: 150 mg cada 24 horas. Si el estado del paciente así lo requiere, se podrá aumentar la frecuencia de la dosis y administrarse cada 12 horas e incluso con un intervalo menor teniendo precaución.

Inyección intravenosa e intramuscular:

Intramuscular: 50 mg cada 6 u 8 horas.

Intravenoso: 50 mg cada 6 u 8 horas, diluido a un volumen total de 20 ml con solución intravenosa compatible en un período no mayor a 5 minutos.

Infusión intravenosa: 50 mg cada 6 u 8 horas, diluido a un volumen total de 100 ml con solución intravenosa compatible en un periodo de 15 a 20 minutos.

Infusión intravenosa continua: 6,25 mg por hora, diluido en una solución intravenosa compatible.

Pacientes con daño en la función renal (clearance de creatinina < 50 ml/minuto):

Intravenoso: 50 mg cada 18 a 24 horas, la frecuencia de las dosis se puede incrementar cada 12 horas o menos.

Pacientes con daño en la función hepática: se debe disminuir la dosificación

Dosis máxima en adultos: 400 mg por día.

La utilización de ranitidina inyectable en niños no ha sido evaluada.

INTERACCIONES:

Si bien ha sido reportado que la ranitidina se liga débilmente al citocromo P-450 *in vitro*, las dosis recomendadas de la droga no inhiben la acción del citocromo P-450 enlazado a enzimas oxigenasas en el hígado.

Hay reportes de interacciones de drogas que sugieren que la ranitidina puede afectar la bioaceptabilidad de ciertas drogas por algunos mecanismos (por ej.: pH, efecto dependiente en absorción o cambio en el volumen de distribución). El incremento o disminución de los tiempos de protombina ha sido reportado durante el uso de ranitidina y warfarina. Como también, en estudios farmacocinéticos en humanos con dosajes de ranitidina hasta 400 mg/día, no ocurrió interacción; la ranitidina no presenta efectos en la tolerancia a la warfarina y tiempo de protombina. La posibilidad de una interacción con warfarina en dosis de ranitidina mayores a 400 mg/día no ha sido investigada. Como con otros agentes con menos acidez gástrica, la ranitidina ha mostrado un incremento de absorción de triazolam, resultando un incremento en las concentraciones plasmáticas, en promedio 14 a 28%. La ranitidina no afecta el metabolismo o la eliminación de triazolam. La implicancia clínica de este encuentro es desconocida.

Dosis elevadas de sucralfato (2 g) o antiácidos como el hidróxido de magnesio, aluminio o calcio administradas al mismo tiempo que la ranitidina, podrían disminuir la absorción de esta última. Por lo tanto, se recomienda administrar estos medicamentos 2 horas después de la administración de ranitidina.

REACCIONES ADVERSAS:

Se ha reportado en ensayos clínicos o en tratamientos de rutina de pacientes tratados con ranitidina dolor de cabeza, en algunos casos bastante severo, lo cual podría estar relacionado con la administración de la droga.

Sistema Nervioso Central: Raramente, malestar, desvanecimiento, somnolencia, insomnio y vértigo. En algunos casos, confusión mental, agitación, depresión y alucinaciones, predominantemente en pacientes de edad avanzada severamente enfermos.

Cardiovascular: Como otros bloqueantes H₂, se reportaron arritmias como taquicardia, bradicardia, bloqueo aurículoventricular y fatiga ventricular prematura.

Gastrointestinal: Constipación, diarrea, náuseas, vómitos, dolor abdominal y en muy pocos casos, pancreatitis.

Hepático: Hubo reportes ocasionales de hepatitis hepatocelular, colestática, hepatitis mixta, con o sin ictericia. En estas circunstancias la ranitidina debe ser inmediatamente discontinuada. Estos eventos son reversibles y en muy pocos casos se ha llegado a la muerte.

Músculoesquelético: En raros casos artralgias y mialgias.

Hematológicos: Cambios en el valor sanguíneo (leucopenia, granulocitopenia y trombocitopenia) en pocos pacientes. Estos son usualmente reversibles. Algunos casos de agranulocitosis, pancitopenia y anemia.

Endócrino: Se han reportado muy pocos casos de ginecomastia, impotencia y pérdida de libido.

Piel: rash, eritema multiforme y raramente alopecia.

Otros: Reacciones de hipersensibilidad (por ej.: broncoespasmo fiebre, rash, eosinofilia), anafilaxis, edema angioneurótico y pequeños incrementos de creatinina en suero.

CONTRAINDICACIONES:

Está contraindicado en pacientes que presenten hipersensibilidad a cualquiera de los componentes de la fórmula.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA:

La ranitidina es un inhibidor reversible y competitivo de la acción de la histamina sobre los receptores H₂, incluyendo los receptores sobre las células gástricas.

Otras acciones farmacológicas:

a-La flora bacteriana gástrica se incrementa en nitrato, reduciendo organismos de significancia desconocida.

b-Los niveles prolácticos no causan efectos en dosis orales e intravenosas recomendadas, pero han sido reportados después de aplicaciones de 100 mg o más, incrementos en suero proláctico.

c-Otras hormonas pituitarias, no causan efecto en suero.

d-No se dan cambios en niveles de cortisolona, aldosterona, andrógeno o estrógeno.

e-No se observa acción antiandrogénica.

f-No se producen efectos en cantidad, movilidad o morfología en esperma.

FARMACOCINÉTICA:

La ranitidina es absorbida en un 50% después de la administración oral, comparada con la aplicación intravenosa, lo cual implica niveles entre 440 y 545 ng/ml, que aparecen a las 2 o 3 horas de recibir una dosis de 150 mg.

La absorción no es significativamente disminuida por la administración de comidas o antiácidos. La propantalina retarda levemente los niveles de incremento en sangre de ranitidina, probablemente dilatando los residuos gástricos transitoriamente. En un estudio, con administración simultánea de alta potencia de antiácidos (150 mmol) se ha reportado la disminución de absorción de ranitidina.

Las concentraciones de suero necesarias para inhibir el 50% de la secreción de ácidos gástricos estimulados se estima entre 36 y 94 ng/ml. Se mantienen dentro de este rango durante un máximo de 12 horas.

La principal ruta de excreción es la orina, aproximadamente el 30% de la dosis administrada oralmente es recolectada en la orina, como droga invariable en 24 hs. La tolerancia renal es alrededor de 410 ml/min, indicando excreción tubular activa. En cuatro pacientes con función renal en importante deterioro administrados con 50 mg de ranitidina intravenosa se reportó un promedio de vida-media plasmática de 48 hs a tolerancia de ranitidina de 29 ml/min y a volumen de distribución de 1.76 l/kg. En general, estos parámetros se pueden alterar en proporción a la tolerancia de creatinina.

Estudios en pacientes con disfunción hepática (cirróticos compensados) indicaron que son menores pero clínicamente insignificantes, las alteraciones en la vida-media de la ranitidina en cuanto a distribución, tolerancia y bioaceptabilidad.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Generales

1-La respuesta sintomática al tratamiento con ranitidina no impide la presencia de enfermedades gástricas.

2-Dado que la ranitidina es excretada básicamente por el riñón, la dosis debe ser ajustada en pacientes con problemas en la función renal (ver POSOLOGÍA). En pacientes con disfunción hepática se debe observar la metabolización de la ranitidina en el hígado.

3-Pocos reportes sugieren que la ranitidina puede precipitar ataques agudos de porfiria en pacientes con porfiria aguda. La ranitidina debe ser suspendida en pacientes con historia de porfiria aguda.

Carcinogénesis, mutagénesis, deterioro de la fertilidad

No hubo indicaciones de efectos tumorigénicos o carcinogénicos en estudios con ratas con dosis de hasta 2.000 mg/kg por día.

La ranitidina no es mutagénica en pruebas bacterianas estándar.

Embarazo

Efectos teratogénicos - Embarazo Categoría B

Estudios realizados de reproducción en ratas y conejos con dosis superiores a 160 veces las dosis humanas no se han revelado evidencias de deterioro de la fertilidad o daños al feto debido a la ranitidina. De todos modos, estos estudios no son directamente adecuables a mujeres embarazadas, por lo tanto la droga debe ser utilizada durante el embarazo sólo si es absolutamente necesario.

Lactancia

La ranitidina es excretada en la leche materna. Se deberá examinar cuando la ranitidina es administrada a una madre en periodo de lactancia.

Uso Pediátrico

La efectividad en pacientes pediátricos no ha sido establecida.

Uso en pacientes de edad avanzada

En grado comparativo, las úlceras en pacientes de edad avanzada (65 a 82 años) y las úlceras en pacientes jóvenes no presentan diferencias. La proporción de incidencias adversas no son diferentes a las de personas jóvenes.

Se han informado raramente casos de bradicardia que ocurrieron luego de la administración endovenosa rápida de ranitidina. Esta situación se produjo usualmente en pacientes con factores predisponentes a alteraciones del ritmo cardíaco. Por lo tanto, es aconsejable no exceder la velocidad de infusión recomendada.

Se han informado aumentos de las transaminasas luego de la administración intravenosa de ranitidina en dosis mayores a las recomendadas durante periodos que superaban los 5 días. Por lo tanto se recomienda monitorear diariamente las transaminasas luego del quinto día de tratamiento intravenoso, particularmente en pacientes en los que se superen los 400 mg/día.

Pruebas de laboratorio: puede dar falsos positivos para proteínas en orina con la prueba Multistix®.

SOBREDOSIFICACIÓN:

Cuando ocurre una sobredosificación deberán emplearse las medidas usuales para remover el material no absorbido del tracto gastrointestinal, monitoreo clínico y terapia de soporte.

En caso de intoxicación consulte inmediatamente a su médico o a los siguientes centros especializados:

Centro de intoxicaciones del hospital de niños Ricardo Gutiérrez: Tel. 4962-6666/2247.

Hospital de niños Pedro Elizalde: Tel. 4301-2115.

Hospital Posadas: Tel. 4658-7777/4654-6648.

Centro Nacional de Intoxicaciones: Tel. 0800-333-0160.

PRESENTACIONES:

Gastrozac 150 mg: Envases conteniendo 20, 30, 60, 80, 100, 200, 300, 500 y 1000 comprimidos recubiertos, siendo las últimas 5 presentaciones de uso hospitalario exclusivo.

Gastrozac 300 mg: Envases conteniendo 20, 30, 60 y 1000 comprimidos recubiertos, siendo la última presentación de uso hospitalario exclusivo.

Gastrozac ampollas: Envases con 6 y 100 ampollas, siendo éste último de uso hospitalario exclusivo.

«ESTE MEDICAMENTO DEBE SER UTILIZADO EXCLUSIVAMENTE BAJO PRESCRIPCIÓN Y VIGILANCIA MÉDICA Y NO PUEDE REPETIRSE SIN NUEVA RECETA MÉDICA».

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS

CONSERVAR LOS COMPRIMIDOS EN LUGAR SECO A UNA TEMPERATURA DE 8 °C A 30 °C, EN SU ESTUCHE ORIGINAL

CONSERVAR LAS AMPOLLAS EN LUGAR SECO A UNA TEMPERATURA DE 8 °C A 30 °C, AL ABRIGO DE LA INCIDENCIA DE LA LUZ.

EVITAR EL CONGELAMIENTO.

Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio de Salud de la Nación.

Certificado N° 42.046.

Director Técnico: Leonardo Iannello
Farmacéutico

Fecha de última revisión: 04/2001

Planta: Lamadrid 802 - Quilmes - Provincia de Bs. As., Argentina. C.P. (B1878CZV)
Tel. Fax: (54) (11) 4251-5954/5955

