

DOMPER AG FAPASA

Domperidona, Simeticona

Antiemético antiflatulento

- Susp. gotas fco. x 40 mL.

Forma Farmacéutica y
Formulación

Cada 100mL de gotas contiene:
Domperidona 1 g.
Simeticona 10 g.
Excipientes..... cs.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS

En el tratamiento del complejo de síntomas dispépticos, que a veces también se asocian con retardo en el vaciamiento gástrico, reflujo gastro-esofágico y esofagitis:

- 1- Sensación epigástrica de llenado, saciedad temprana, sensación de distensión abdominal, dolor abdominal alto,
 - 2- Náusea y vómito,
 - 3- Pirosis con o sin regurgitación del contenido gástrico en la boca.
- En el tratamiento de la náusea y vómito de origen funcional, orgánico, infecciosos o dietético, o inducido por radio o quimioterapia. Una indicación específica es la náusea y vómito inducido por agonistas de la dopamina, como los utilizados en la enfermedad de Parkinson (L-dopa y bromocriptina)

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMÍA

Farmacodinamia:

Domperidona es un antagonista de dopamina con propiedades antieméticas similares a las de metoclopramida y otros medicamentos neuroepilépticos. A diferencia de estos medicamentos, domperidona no atraviesa la barrera hematoencefálica. Los efectos extrapiramidales con el uso de domperidona son muy raros, especialmente en adultos, pero domperidona promueve la liberación de prolactina por la hipófisis. Su efecto antiemético puede deberse a la combinación de efectos (gastrocinéticos) periféricos y al antagonismo de los receptores de dopamina en la zona quimiorreceptora desencadenante, los cuales se encuentran fuera de la barrera hematoencefálica en el área postrema.

Los estudios en animales, junto con las bajas concentraciones encontradas en el cerebro, indican el efecto predominantemente periférico de domperidona en los receptores de dopamina.

Estudios en humanos muestran que la administración oral de domperidona aumenta la duración de las concentraciones del antro y duodeno, aumento el vaciamiento gástrico de líquidos y

semisólidos en voluntarios sanos y de sólidos en pacientes con retraso del vaciamiento, e incrementa la presión del esfínter esofágico inferior en sujetos sanos.

Domper® no tiene efectos sobre la secreción gástrica.

FARMACOCINÉTICA:

En los sujetos en ayunas, Domper® es rápidamente absorbido después de la administración oral, alcanzando las concentraciones plasmáticas máximas en aproximadamente una hora. La absolutamente baja biodisponibilidad oral de Domper® (aproximadamente 15%) es debida al extenso primer paso de metabolismo en la pared intestinal e hígado. Aunque la biodisponibilidad de Domper® está aumentada en los sujetos sanos cuando se toma antes de la comida, los pacientes con enfermedad gastrointestinal deben tomar Domper® de 15 a 30 minutos antes de la comida.

La reducción de la acidez gástrica perjudica la absorción de Domper®. La biodisponibilidad oral es disminuida por la administración previa de cimetidina o bicarbonato de Sodio. Cuando el medicamento es tomado después de la comida, el tiempo para el pico de absorción es ligeramente retrasado y el área bajo la curva es algo incrementada.

Domper® por vía oral no puede acumularse o inducir su propio metabolismo. El nivel plasmático pico después de 90 minutos es de 21 ng/mL después de dos semanas de administración oral de 30 mg por día, el cual es casi el mismo de 18 ng/mL después de la primera dosis. Domper® se une en un 91 – 93% a las proteínas plasmáticas. Estudios con Domper® marcado radiactivamente en animales, muestran una amplia distribución en los tejidos, pero una concentración baja en el cerebro.

En ratas, pequeñas cantidades del medicamento atraviesan la placenta: Las concentraciones de Domper® en la leche materna de mujeres lactantes son 4 veces más bajas que las correspondientes a las concentraciones plasmáticas.

Domper® presenta un rápido y extenso metabolismo hepático por hidroxilación y N-dealquilación. Experimentos de metabolismo in vitro con inhibidores diagnósticos revelan que el CYP3A4 es la principal forma del citocromo P-450 involucrada en la N-dealquilación de domperidona, mientras que CYP3A4, CYP1A2 y CYP2E1 están involucrados en la hidroxila-

ción aromática de domperidona.

La excreción urinaria y fecal equivalen respectivamente al 31 y 66% de la dosis oral.

La proporción del medicamento excretado sin cambios es pequeña (10% por excreción fecal y aproximadamente 1% por excreción urinaria).

La vida media plasmática después de una sola dosis oral es de 7-9 horas en pacientes sanos pero se prolonga en pacientes con insuficiencia renal severa.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

Domper® no debe ser utilizado cuando la estimulación de la motilidad gástrica puede ser peligrosa, p.ej. en presencia de hemorragia gastrointestinal, obstrucción mecánica o perforación.

Domper® está también contraindicado en pacientes con tumores hipofisarios liberadores de prolactina (prolactinoma).

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

Cuando son usados concomitantemente agentes antiácidos o antiseoretos, estos deben ser tomados después de las comidas y no antes, p.ej. no deben ser tomados simultáneamente con Domper® comprimidos o gotas.

Uso en niños:

En vista de que las funciones metabólicas y de la barrera hematoencefálica no están totalmente desarrolladas durante los primeros meses de vida, Domper® al igual que cualquier medicamento que se administre a lactantes menores, deberá ser usado con cautela y bajo estrecha supervisión médica.

Puesto que la ausencia típica de efectos secundarios neurológicos con Domper® se debe a la poca penetración a través de la barrera hematoencefálica, la aparición de estos efectos no pueden excluirse totalmente en bebés de menos de 1 año de edad.

Uso en trastornos hepáticos:

Como la domperidona es ampliamente metabolizada en el hígado, Domper® debe ser utilizado con precaución en pacientes con daño hepático.

Uso en alteraciones renales:

En pacientes con insuficiencia renal severa (creatinina sérica > 6 mg/10 mL, por ejemplo, 0,6 mmol/l) la vida media de eliminación de domperidona es incrementada de 7,4 a 20,8 horas, pero los niveles plasmáticos son menores que en los volun-

taros sanos. Ya que una pequeña cantidad del medicamento es excretada por los riñones, es improbable que la dosis de una única dosis aguda necesite ser ajustada en pacientes con insuficiencia renal. Sin embargo, con administraciones repetidas, la frecuencia de administración debe ser reducida a una o dos veces al día dependiendo de la severidad del daño, y también puede ser necesario disminuir la dosis. Generalmente, los pacientes con terapias prolongadas deben ser revisados regularmente.

Efectos sobre la habilidad o uso de maquinarias:
Domper® no afecta el estado de alerta mental.

Uso en embarazo y lactancia:
Domper®, como la mayoría de los medicamentos, sólo debe ser utilizado durante el primer trimestre del embarazo si es justificadopor el beneficio terapéutico anticipado.

El medicamento es excretado en la leche materna de ratas lactantes (mayormente como metabolitos: picos de concentración de 40 y 800 ng/mL después de administración oral e I.V. de 2,5 mg/kg, respectivamente). En mujeres las concentraciones de domperidona en la leche materna son 4 veces menores que las concentraciones plasmáticas correspondientes. No se sabe si esto puede causar daño en el recién nacido. Por lo tanto, no se recomienda la alimentación al pecho por madres que estén tomando Domper®, a menos que los beneficios potenciales superen el riesgo potencial.

REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS:

Los efectos secundarios son raros: excepcionalmente se han reportado cólicos intestinales transitorios. Manifestaciones extrapiramidales son raras en los niños pequeños y excepcionales en los adultos; estos revierten espontánea y completamente cuando el tratamiento es suspendido.

Como la glándula hipófisis se localiza fuera de la barrera hematoencefálica, Domper® puede inducir a un incremento en los niveles plasmáticos de prolactina. En raros casos, esta hiperprolactinemia puede aumentar el riesgo de manifestaciones neuroendocrinológicas como galactorrea y ginecomastia. Cuando la barrera hematoencefálica es inmadura (como en los infantes) o dañada, la posible aparición de efectos neurológicos secundarios no puede ser totalmente excluida.

También han sido reportadas raras reacciones alérgicas como rash y urticaria.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Dispepsia crónica (principalmente administración oral):

Adultos: 10 mg (1 Comprimidos) tres veces al día, de 15 a 30 minutos antes de los alimentos y, si es necesario, otra vez, antes de acostarse.

Estados agudos y subagudos (generalmente náusea y vómito):

Adultos: 20 mg (2 comprimidos) 3 a 4 veces al día antes de los alimentos y antes de acostarse.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL:

Los síntomas de sobredosis pueden incluir somnolencia, desorientación y síntomas extrapiramidales, principalmente en niños.

En caso de sobredosis, se recomienda la administración de carbón activado y la observación del paciente.

Los medicamentos anticolinérgicos, antiparkinsonianos o antihistamínicos con propiedades anticolinérgicas pueden ayudar en el control de los síntomas extrapiramidales.

PRESENTACIONES

Gotas: Frasco gotero con 40 mL.