

## PRINCIPIO ACTIVO:

Cada tableta recubierta contiene:

Zopiclona 7,5 mg

Excipientes C.S.P

## VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Oral.

## PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS:

### Propiedades farmacocinéticas:

La zopiclona se absorbe rápidamente. La biodisponibilidad es de más del 75%. Las concentraciones plasmáticas pico son alcanzadas en menos de 2 horas y se elevan aproximadamente a 30 y 60 ng/mL después de la administración de 3,75 y 7,5 mg, respectivamente.

La absorción no es modificada por el sexo, la alimentación ni por la repetición de las dosis.

La zopiclona se distribuye rápidamente a partir del compartimiento vascular. La vida media de distribución es de 1,2 horas. Su unión a las proteínas plasmáticas es débil (45%) y no saturable. Debido a ello, existe poco riesgo de interacciones con otros fármacos.

La vida media de eliminación plasmática es de alrededor de 5 hs. (rango de 3,8 a 6,5 hs.). No se produce acumulación después de la repetición de las dosis.

Su eliminación es por biotransformación hepática. En los estudios in vitro se encontró que las principales isoenzimas involucradas en el metabolismo de zopiclona son el CYP3A4 (para la formación de los metabolitos N-óxido derivado y N-desmetilo) y el CYP2C8 (para el N-desmetilo). Sus vías metabólicas principales son la oxidación, la desmetilación y la descarboxilación oxidativa. Los metabolitos N-óxido y N-desmetilo son excretados por la orina y su vida media es aproximadamente de 4,5 y 7,5 horas, respectivamente.

Los productos descarboxilados son eliminados como dióxido de carbono por vía pulmonar.

## Propiedades farmacodinámicas:

La zopiclona es un hipnótico que pertenece a la familia química de las ciclopirononas.

Sus efectos están relacionados con una acción agonista sobre los receptores que forman parte del complejo receptor Gaba-A, llamados benzodiazepínicos (BZ) u omega ( $\omega$ ) que modulan la apertura de los canales del cloro, produciendo una hiperpolarización celular que disminuye la excitabilidad neuronal.

La acción de zopiclona se manifiesta sobre diferentes parámetros del sueño: aumenta la duración y mejora la calidad del sueño, disminuye la cantidad de despertares nocturnos y retrasa pero no reduce la duración total de los períodos REM.

En el electroencefalograma, los efectos de zopiclona están asociados con un perfil electroencefalográfico característico diferente de aquel de las benzodiazepinas. En los sujetos con insomnio, zopiclona disminuye el estadio I, prolonga el estadio II, respeta o prolonga los estadios de sueño lento o profundo (III y IV) y respeta el sueño paradójal.

## DATOS CLÍNICOS:

### Indicaciones terapéuticas:

Insomnio, cuando limita la actividad del paciente o lo somete a una situación de estrés importante.

Tratamiento del insomnio ocasional o transitorio

### Posología:

La dosis habitual para los adultos es de 7,5 mg (1 comprimido) administrado antes de acostarse.

En pacientes ancianos y/o debilitados, en pacientes con insuficiencia hepática o renal y en pacientes con insuficiencia respiratoria severa, la dosis inicial recomendada es de 3,75 mg (½ comprimido). Si fuera necesario, aumentar la dosis a 7,5 mg (1 comprimido) antes de acostarse.

El tratamiento con zopiclona no deberá exceder los 7-10 días consecutivos. El uso por más de 2-3 semanas deberá requerir de una reevaluación

completa del paciente.

Los hipnóticos no deben prescribirse por períodos mayores a 1 mes.

### **CONTRAINDICACIONES:**

Menores de 18 años. Hipersensibilidad al principio activo o a cualquier otro componente de este medicamento. Insuficiencia respiratoria severa. Insuficiencia hepática severa. Síndrome de apnea del sueño. Miastenia gravis. Debido a la presencia de lactosa entre los componentes de este medicamento, el mismo está contraindicado en pacientes con galactosemia congénita, síndrome de malabsorción de glucosa y de galactosa o con déficit de lactasa.

### **Advertencias y precauciones especiales de empleo:**

No es conveniente extender el tratamiento más allá de las 4 semanas siendo beneficioso un descenso progresivo de la dosis.

Es posible la amnesia anterógrada, particularmente cuando es interrumpido el sueño (despertar precoz por algún evento externo) o se produce un retraso en acostarse después de haber tomado el comprimido. Para prevenir este fenómeno eventual, zopiclona debe administrarse en el momento de acostarse.

Ha sido reportado en pacientes en tratamiento con hipnóticos no benzodiazepínicos la aparición de alteraciones del pensamiento o la conducta.

Debido a que algunos de los efectos adversos de estos fármacos son dosis dependiente, es importante recordar que la dosis diaria no deberá superar la máxima recomendada y que la misma deberá ser siempre la mínima necesaria para lograr los efectos terapéuticos deseados, especialmente en los ancianos.

**Reacciones anafilácticas y anafilactoides severas:** Se han reportado casos raros de angioedema que involucró lengua, glotis o laringe, en pacientes, luego de tomar la primera dosis o las dosis subsiguientes de sedantes-hipnóticos.

**Ansiedad y otros síntomas neuro-psiquiátricos impredecibles:** Se han reportado en pacientes que no estaban completamente despiertos luego de tomar un sedante-hipnótico. Los pacientes habitualmente no recuerdan estos eventos. Los pacientes deben ser

advertidos de no realizar tareas que requieran atención total y/o coordinación motora precisa, como ser operar maquinarias peligrosas o conducir vehículos, luego de la toma de este medicamento.

**Dependencia:** No puede excluirse el desarrollo de fármaco-dependencia. Diversos factores parecen favorecer su producción: duración del tratamiento, dosis, asociación con otros medicamentos (ansiolíticos, antipsicóticos, hipnóticos, etc.) y antecedentes de otras dependencias medicamentosas, incluido el alcohol.

En pacientes tratados por tiempo prolongado y, especialmente con dosis superiores a las recomendadas, se han descrito signos y síntomas compatibles con síndrome de abstinencia.

**Embarazo y lactancia:** No hay estudios que demuestren la seguridad y eficacia de zopiclona durante el embarazo, por lo que no se recomienda administrar este medicamento a mujeres embarazadas. Debido a que zopiclona se concentra en la leche materna, no se recomienda su uso en mujeres en periodos de lactancia.

**Uso en pediatría:** No hay estudios que demuestren la seguridad y eficacia de zopiclona en niños menores de 18 años.

**Uso en geriatría:** Los pacientes ancianos son más susceptibles a los eventos adversos dependientes de la dosis, tales como somnolencia, mareos o deterioro de la coordinación.

### **Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción.**

*Asociación no recomendada:* el consumo simultáneo de alcohol no es recomendado, dado que el efecto sedativo de zopiclona puede aumentarse.

*Asociaciones que deben tomarse en cuenta:* Combinación con depresores del SNC. Un aumento del efecto depresor central puede ocurrir en casos de uso concomitante con medicaciones psicotrópicas, analgésicos, narcóticos, drogas antiepilépticas, anestésicos y sedantes antihistamínicos.

### **REACCIONES ADVERSAS:**

El evento adverso más común observado con zopiclona es la sensación de "sabor amargo en la boca".

**Sistema nervioso central:** Somnolencia, astenia,

vértigo, confusión, amnesia anterógrada y/o deterioro de la memoria, sensación de embriaguez.

**Cardiovasculares:** *Poco frecuentes:* palpitaciones.

**Gastrointestinales:** Boca seca, lengua pastosa, mal aliento, dispepsia, constipación.

**Respiratorios:** *Poco frecuentes:* disnea.

**Sentidos especiales:** *Poco frecuentes:* ambliopía.

**Dermatológicos:** *Poco frecuentes:* rash, manchas en la piel, sudoración, prurito.

#### **SOBREDOSIS:**

La sobredosis se manifiesta habitualmente con diferentes grados de depresión del sistema nervioso central, que van desde somnolencia hasta coma, dependiendo de la cantidad ingerida.

En los casos leves, los síntomas incluyen mareos, confusión y letargo

#### **TRATAMIENTO:**

Se recomienda tratamiento sintomático y de soporte en un ambiente clínico, se debe prestar atención en la función respiratoria y cardiovascular.

#### **CONSERVACIÓN:**

Conservar a temperatura no mayor a 30 °C.

#### **ADVERTENCIA:**

Producto de uso delicado. Adminístrese bajo prescripción y vigilancia médica.

Mantener fuera del alcance de los niños.

#### **Venta bajo receta médica**

#### **PRESENTACIONES:**

Caja x 20 tabletas recubiertas

