



Material: PROSPECTO  
Medida: 210 x 297 mm  
Código de Material Nuevo: 120680-00  
Código Visual: 13 - 41 - 57  
Código de Material Anterior: 120138-00  
Soporte: Según Especificación  
Gramaje: Según Especificación  
Color: Negro

Referencias (No imprimir Filete)  
Cotas

Proceso#	Fecha - Sector	Modificaciones Realizadas
P00		
P01	30-11-2023	Modificaciones AR
P02	30-11-2023	Modificaciones AR
P03	5-12-2023	Modificación AR
P04		
P05		
P06		
P07		
P08		
P09		
P10		

210 mm

**Knight®**

**Agucort®**

Oseltamivir 75mg

VIA ORAL

Cápsulas.  
Venta bajo receta  
Industria Argentina

### FORMULA CUALICUANTITATIVA:

#### Cada cápsula contiene:

Fosfato de Oseltamivir

(equivalente a 75 mg de Oseltamivir)..... 98,53 mg

Excipientes:

Povidona.....8,00mg

Almidón pregeletanizado ..... 77,47mg

Croscarmellosa sódica .....6,00mg

Estearilfumarato sódico .....2,00mg

Talco .....8,00mg

### ACCION FARMACOLOGICA

El Fosfato de Oseltamivir es el profármaco de un potente inhibidor selectivo de las neuraminidasas. La actividad neuraminidásica es esencial para que las partículas víricas formadas recientemente abandonen las células infectadas y continúe la diseminación de virus infecciosos en el organismo. El metabolito activo de Oseltamivir inhibe las neuraminidasas de los virus de la gripe de los tipos A y B. Las concentraciones del metabolito activo necesarias para inhibir en un 50% la actividad enzimática (CI<sub>50</sub>) se sitúan en el intervalo nanomolar. In vitro, el metabolito activo bloquea asimismo el crecimiento de los virus gripales, e in vivo inhibe su replicación y patogenicidad.

El metabolito activo reduce la eliminación de los virus de la gripe A y B por medio de un mecanismo inhibidor de la liberación de virus infecciosos de las células infectadas.

**Resistencia viral:** No se han observado indicios de resistencia con el virus de la gripe B, ni in vitro ni en los estudios con cepas clínicas.

#### Farmacocinética:

**Absorción:** el Oseltamivir se absorbe rápidamente en el tubo digestivo luego de la administración oral de Fosfato de Oseltamivir, y se convierte ampliamente en su metabolito activo por acción de las esterasas hepáticas. Las concentraciones plasmáticas del metabolito activo son ya detectables al cabo de 30 minutos, alcanzan sus valores máximos entre las 2 y 3 horas después de la dosis, y superan ampliamente (> 20 veces) las concentraciones plasmáticas del profármaco. Al menos el 75% de una dosis oral alcanza la circulación general en forma de metabolito activo. Las concentraciones plasmáticas del metabolito activo son proporcionales a la dosis y no varían cuando se administra con los alimentos.

**Distribución:** el volumen medio de distribución en equilibrio (V<sub>e</sub>) del metabolito activo se sitúa en torno a los 23 litros en el ser humano.

El metabolito activo llega a todos los lugares fundamentales de la infección gripal, según se ha demostrado.

El metabolito activo apenas se **une a las proteínas plasmáticas humanas (fracción de fijación a las proteínas: aproximadamente 3%)**. El grado de fijación del profármaco a las proteínas plasmáticas humanas es del 42%. Estos valores son insuficientes para provocar interacciones farmacológicas importantes.

**Metabolismo:** el Fosfato de Oseltamivir se transforma ampliamente en su metabolito activo por acción de las esterasas localizadas preferentemente en el hígado y la pared intestinal. Ni el Oseltamivir ni su metabolito activo son substratos o inhibidores de las isoenzimas del sistema citocromo P450.

**Eliminación:** el Oseltamivir absorbido se elimina principalmente (>90%) por biotransformación en su metabolito activo. Éste, por su parte, no se metaboliza, y se elimina con la orina. Las concentraciones plasmáticas máximas del metabolito activo descienden con una semivida de 6 a 10 horas en la mayoría de las personas.

El metabolito activo se elimina casi por completo (>99%) por excreción renal. El aclaramiento renal (18,8 l/h) es superior a la filtración glomerular (7.5 l/h), lo cual es indicativo de que además de la filtración glomerular, interviene también un mecanismo de secreción tubular. Con las heces se elimina menos del 20% de una dosis radiomarcada administrada por vía oral.

#### Farmacocinética en poblaciones especiales:

**Insuficiencia renal:** la administración a pacientes con insuficiencia renal de diverso grado de 100 mg de Oseltamivir dos veces al día durante cinco días, demostró que la exposición al metabolito activo es inversamente proporcional al deterioro de la función renal. Se recomienda ajustar la dosis en los pacientes con un aclaramiento de creatinina inferior a 30 ml/min. Dado que no hay datos sobre pacientes con insuficiencia renal y cifras de aclaramiento de creatinina inferiores a 10 ml/min, conviene extremar las precauciones cuando se administra este fármaco a tales pacientes.

**Insuficiencia hepática:** los estudios han revelado que la exposición al Oseltamivir no aumenta significativamente ni que la exposición al metabolito activo disminuya de manera significativa.

**Ancianos:** No es necesario ajustar la dosis para los pacientes ancianos.

**Niños:** los datos farmacocinéticos provenientes de estudios muestran que en los niños de menos edad es más rápido el aclaramiento del profármaco y del metabolito activo que en los de mayor edad, lo cual significa una exposición más reducida a una dosis dada en mg/kg. La exposición a una dosis de 2 mg/kg en niños de 5 a 8 años equivale a la de una dosis única de una cápsula de 75 mg en adultos (Aproximadamente 1 mg/kg). A medida que avanza la edad, la diferencia de exposición entre niños y adultos (en mg/kg) disminuye hasta desaparecer prácticamente después de los 12 años de edad.

### INDICACIONES

Este medicamento está indicado para el tratamiento de la gripe en adultos y niños mayores de 12 años.

### DOSIS Y ADMINISTRACION

**Dosis habitual:** la dosis oral recomendada es de 75 mg dos veces al día, durante 5 días. El tratamiento debe iniciarse dentro de los dos primeros días siguientes a la aparición de los síntomas gripales. Puede ingerirse con o sin alimentos. De todas maneras debe tenerse en cuenta que en algunos pacientes la tolerancia puede mejorar si se ingiere con alimentos.

#### Poblaciones especiales

**Insuficiencia renal:** no es necesario ajustar la dosis en aquellos pacientes que demuestran un aclaramiento

de creatinina superior a 30 ml/min. En pacientes con un aclaramiento de creatinina inferior a 30 ml/min, se recomienda reducir la dosis a 75 mg diarios en una toma única, administrada durante 5 días. Dado que los efectos de esta droga no se han investigado en pacientes con insuficiencia renal con cifras de aclaramiento de creatinina inferiores a 10 ml/min, se recomienda extremar las precauciones cuando se administre a tales pacientes.

**Insuficiencia hepática:** no es necesario ajustar la dosis en los pacientes con insuficiencia hepática.

**Ancianos:** no es necesario ajustar la dosis en pacientes ancianos.

**Niños:** no se han determinado la seguridad y eficacia en niños menores de 13 años. La información farmacocinética para este grupo es muy reducida.

### CONTRAINDICACIONES

Este medicamento está contraindicado a pacientes con hipersensibilidad al Fosfato de Oseltamivir o a algún componente de la fórmula.

### PRECAUCIONES

Se recomienda ajustar la dosis en los pacientes con un aclaramiento de creatinina inferior a 30 ml/min. Dado que no hay datos relaciones con pacientes que padezcan insuficiencia renal y cifras de aclaramiento de creatinina inferiores a 10 ml/min, es conveniente extremar la medidas de precaución cuando se administre este fármaco a tales pacientes.

**Embarazo y lactancia:** hasta el presente no hay suficiente información de mujeres embarazadas tratadas con este medicamento a fin de evaluar si el Fosfato de Oseltamivir puede provocar malformaciones fetales u otras formas de toxicidad fetal, por lo cual este medicamento sólo debe ser administrado durante el embarazo cuando los beneficios esperados justifiquen el riesgo para el feto.

Se desconoce si el Oseltamivir y el metabolito activo pasan a la leche materna humana, por lo cual este medicamento sólo deberá administrarse durante la etapa de lactancia cuando los beneficios para la madre justifiquen los riesgos para el niño.

**Interacciones:** no es probable que se produzcan interacciones medicamentosas clínicamente importantes. El Fosfato de Oseltamivir se convierte ampliamente en su metabolito activo por acción de las esterasas localizadas preferentemente en el hígado. Debido a la escasa unión de Oseltamivir y su metabolito activo a las proteínas plasmáticas, no son de esperar interacciones por desplazamiento farmacológico. Teniendo en cuenta el mecanismo de acción tampoco son esperables interacciones con los anticonceptivos orales.

La Cimetidina no altera las concentraciones plasmáticas del Oseltamivir ni de su metabolito activo.

La coadministración de Probenecid aumenta, aproximadamente, al doble la exposición al metabolito activo. De todas maneras no es necesario efectuar ningún ajuste en la dosis cuando el Fosfato de Oseltamivir se administra en forma simultánea al Probenecid.

La coadministración de Paracetamol no altera las concentraciones plasmáticas de Oseltamivir, su metabolito activo, ni del Paracetamol.

No se observaron cambios ni en el tipo ni en la frecuencia de las reacciones adversas cuando se coadministró Fosfato de Oseltamivir junto a fármacos de uso frecuente.

### REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas reportadas con más frecuencia son náuseas y vómitos, éstas fueron generalmente pasajeras y se presentaron tras la administración de la primera dosis y en la gran mayoría no fue necesario suspender el tratamiento a causa de estas reacciones.

A continuación se detallan las reacciones adversas observadas con el uso de Oseltamivir 75 mg administrado dos veces al día. Náuseas, vómitos, diarrea, bronquitis, dolor abdominal, mareo, cefalea, tos, insomnio, vértigo y fatiga.

### SOBREDOSIS

Aunque hasta la actualidad no se conoce ningún caso de sobredosis, cabe prever que los síntomas de una sobredosis aguda consistirían en náuseas con o sin vómitos.

Han sido bien toleradas las dosis únicas de hasta 1000 mg de Oseltamivir excepto en lo referido a náuseas y vómitos.

ANTE LA EVENTUALIDAD DE UNA SOBREDOSIS, CONCURRIR AL HOSPITAL MAS CERCANO O COMUNICARSE CON LOS CENTROS DE TOXICOLOGÍA:

HOSPITAL DE PEDIATRÍA RICARDO GUTIERREZ:

(011 )4962-6666 / 2247.

HOSPITAL A. POSADAS: (011)4654-6648 / 4658-7777.

### Información para los pacientes:

**Si usted está tomando algún medicamento, esta embarazada o amamantando consulte a su médico antes de tomar este medicamento.**

**Conserve este y todos los medicamentos fuera del alcance de los niños.**

Este medicamento ha sido prescripto para su problema médico actual, no se lo recomiende a otras personas.

Este medicamento se expende bajo receta médica y no puede repetirse sin mediar una nueva receta.

### CONSERVACION

A temperatura menor a 30°C.

**CODIGO ATC:** J05AH02



Knight® es una Marca Registrada de Knight Therapeutics Inc.  
Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de salud. Certificado N°51.680.  
Laboratorio LKM S.A.  
Lynch 3461/63, C.A.B.A., Argentina.  
Dirección Técnica: Farm. M. Yanina Sanchez.  
Elaborado alternativamente en Av. Brig. Juan Manuel de Rosas 2969, José León Suárez,  
Partido de San Martín, Prov. de Buenos Aires y en Santa Rosa 3676, Victoria,  
Partido de San Fernando, Provincia de Buenos Aires.