

MIOTEC

Sestamibi

Liofilizado para inyección E.V.

COMPOSICIÓN por vial:

Tetrafluoroborato de tetrakis (2-metoxi isobutil isonitrilo) cobre (I) (sestamibi)..... 1,00 mg
Excipientes.....csp

FARMACOCINÉTICA

El mecanismo de captación miocárdica del producto no es bien conocido, ocurre aparentemente por un proceso de difusión pasiva y está directamente relacionado con el flujo sanguíneo en el tejido, siendo la proporción de captación determinada por la permeabilidad de la membrana y la superficie del lecho vascular a la que está expuesta la droga. Su distribución parece ser en forma análoga a la del cloruro de talio ²⁰¹Tl. El ^{99m}Tc-Sestamibi inyectado en reposo se acumula en el tejido miocárdico viable y las zonas infartadas se delimitan como áreas sin acumulación. Inyectado en estrés (por ejercicio o por vasodilatación farmacológica), el ^{99m}Tc-Sestamibi se acumula en el tejido miocárdico en relación al flujo sanguíneo en esa zona; es así que las áreas isquémicas (ej aquellas irrigadas por vasos estenosicos) se detectan como áreas de menor acumulación.

El mecanismo preciso de localización tumoral en imágenes de tiroides y paratiroides no está claro, se sugiere que el ^{99m}Tc-Sestamibi cruza por mecanismo pasivo la membrana celular concentrándose principalmente en el citoplasma y mitocondrias. Se supone que las células malignas debido a sus rangos metabólicos incrementados mantienen potenciales mitocondriales y de membrana más negativos, favoreciendo así la acumulación intracelular del ^{99m}Tc-Sestamibi.

En el hipertiroidismo, se puede explicar la captación del ^{99m}Tc-Sestamibi por las glándulas tiroides debido a que tanto el flujo sanguíneo como el número de mitocondrias están incrementados. La localización del ^{99m}Tc-Sestamibi depende del flujo sanguíneo tisular, la concentración de ^{99m}Tc-Sestamibi disponible al tejido y del tamaño de la glándula.

El ^{99m}Tc-Sestamibi tiene un volumen de distribución alto y una redistribución cardíaca mínima. La unión a proteínas plasmáticas es muy baja (< 1 %).

Luego de su administración endovenosa, el producto es aclarado rápidamente del plasma, con una vida media del componente de eliminación rápida de 4,3 minutos (en reposo) acumulándose en el miocardio normal en proporción al flujo sanguíneo.

A los 5 minutos después de la inyección, alrededor del 8% de la actividad administrada permanece en la circulación. La captación pulmonar es baja generalmente, pero la captación hepática es considerable, excretándose a través del sistema biliar hacia el intestino.

La vida media biológica después de su administración en reposo es de 6 horas en el miocardio y de 30 minutos en el hígado.

La vida media efectiva después de su administración en reposo (incluye vida media biológica y decaimiento del radionúclido) en el miocardio es de 3 horas y en el hígado de 28 minutos.

Dentro de las 48 horas después de su administración, se excreta por vía renal y fecal 27% y 33% respectivamente.

INDICACIONES

El ^{99m}Tc-Sestamibi es un agente de ayuda diagnóstica para la obtención de imágenes cardíacas. Permite obtener imágenes de la perfusión miocárdica para localizar y estimar la gravedad de las zonas miocárdicas infartadas. El ^{99m}Tc-Sestamibi ayuda a demostrar si una terapia trombolítica ha mejorado la perfusión. Además, se le emplea en pacientes que se sospecha o se sabe que padecen de enfermedades arteriales coronarias, para ayudar en el diagnóstico de isquemias miocárdicas, orientar los procedimientos de investigación y guiar el tratamiento. En pacientes con angina inestable el ^{99m}Tc-Sestamibi se emplea para confirmar el diagnóstico

debiendo ser administrado en el momento que ocurre el dolor de pecho espontáneo.

^{99m}Tc-Sestamibi es empleado en la determinación de la fracción de eyección ventricular derecha y/o izquierda por angiocardiógrafa radionúclida de primer paso y en la evaluación de la motilidad de la pared cardíaca regional. ^{99m}Tc-Sestamibi es usado como un complemento de la electrocardiografía en estrés en el diagnóstico de enfermedades arteriales coronarias, permitiendo la evaluación simultánea de la perfusión miocárdica y la función ventricular.

En pacientes con hiperparatiroidismo sirve para detectar y localizar las glándulas paratiroides agrandadas.

También es empleado en la detección y localización de diversos carcinomas tiroideos (ej medular, linfoma, células de Hurthle).

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y ALIMENTARIAS

No se han reportado hasta la fecha.

INTERFERENCIAS DIAGNÓSTICAS

En pacientes con radioterapia, la radiación puede afectar la unión del ^{99m}Tc-Sestamibi a las proteínas intracelulares, lo que originaría una disminución de la captación del producto en las células miocárdicas.

CONTRAINDICACIONES

El riesgo-beneficio debe considerarse cuando exista sensibilidad al preparado radiofarmacéutico.

PRECAUCIONES

En mujeres en edad reproductiva se tendrá en consideración la posibilidad de embarazo limitando su uso hasta los 10 primeros días luego de iniciada la menstruación. El tecnecio 99m como pertecnetato libre cruza la placenta, no habiéndose realizado estudios en humanos que demuestren la transferencia transplacentaria del ^{99m}Tc-Sestamibi.

El médico evaluará las situaciones clínicas donde exista el beneficio al paciente y feto, a partir del uso del radiofármaco, que supere el riesgo del feto a la exposición radiactiva, reduciendo la dosis radiofarmacéutica al menor valor posible.

El porcentaje de la dosis inyectada del ^{99m}Tc-Sestamibi que se distribuye en la leche materna es muy bajo (0,0084% durante las primeras 24 horas), no siendo necesaria la interrupción de la lactancia; sin embargo se conoce que el tecnecio Tc-99m como pertecnetato libre se distribuye en la leche materna, recomendándose la interrupción de la lactancia por un período de 24 horas después de la administración del producto marcado.

No se han realizado estudios específicos en niños que evalúen su seguridad y eficacia. Previamente a su uso, se debe evaluar el beneficio diagnóstico frente al riesgo potencial de irradiación.

En la población geriátrica no se han realizado estudios apropiados que relacionen la edad con los efectos del ^{99m}Tc-Sestamibi. Sin embargo, en estudios y pruebas clínicas realizados en pacientes mayores no se presentaron problemas geriátricos específicos que pudieran limitar su uso en esta población.

INCOMPATIBILIDADES

Si la solución salina de pertecnetato usada en la marcación contiene oxidantes tales como peróxidos o hipocloritos se afectará la preparación final, por lo cual ésta deberá ser descartada.

REACCIONES ADVERSAS

Necesitará atención médica sólo si persisten o son molestos:

De incidencia más frecuente; sabor metálico o amargo.

De incidencia poco frecuente o rara; rubor de piel, dolor de cabeza o erupción cutánea.

Nota: Se ha reportado un caso de hipersensibilidad severa, caracterizado por disnea, hipotensión, bradicardia, astenia y vómitos dentro de las 2 horas después de la segunda inyección del ^{99m}Tc-Sestamibi.

ADVERTENCIAS

La cantidad de radiactividad usada en el diagnóstico es mínima, por lo que la dosis de radiación recibida es baja y considerada segura.

Antes de administrar el radiofármaco al paciente se considerará su sensibilidad al preparado.

El tecnecio 99m como pertecnetato libre cruza la placenta; el riesgo fetal a la exposición radiactiva debe considerarse frente al beneficio derivado de su uso.

Se distribuye una cantidad muy pequeña en la leche materna; sin embargo, para evitar la exposición innecesaria del infante se recomienda suspender temporalmente la lactancia.

En niños, se debe considerar el beneficio diagnóstico frente al riesgo de exposición a la radiación.

DOSIS Y VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

El radiofármaco será administrado solamente bajo la supervisión de un médico con entrenamiento en el uso y manejo seguro de material radiactivo y autorizado por la Autoridad Nacional de Protección y Seguridad Radiológica correspondiente.

En pacientes que han recibido el producto antes de o en el inicio de una terapia trombolítica (menos de 4 horas); es posible obtener imágenes para estimar la distribución de la perfusión miocárdica al mismo tiempo que detectar las zonas infartadas, hasta 6 horas después de la administración endovenosa del ^{99m}Tc-Sestamibi, debido a que no hay una redistribución significativa en el miocardio. Esto permite estimar la cantidad de miocardio hipoperfusionado (ej el área de riesgo) sin tener que retrasar la administración de la terapia trombolítica.

En las pruebas de estrés farmacológico o por ejercicio, el ^{99m}Tc-Sestamibi debe ser administrado en el inicio de un período de estrés máximo que dure aproximadamente hasta 1 a 3 minutos después de la inyección.

Luego de la administración endovenosa la redistribución del producto en el miocardio es mínima o no existe; por esta razón, se requieren inyecciones separadas en estrés y en reposo, para distinguir isquemias reversibles inducidas por estrés de los defectos de perfusión irreversibles.

Factores técnicos tales como, artefactos topográficos reconstruidos, movimientos del paciente, atenuación diafragmática y atenuación por los senos en mujeres pueden causar resultados falsos positivos (falsos defectos de perfusión).

Una alta extracción hepática del ^{99m}Tc-Sestamibi puede interferir con la visualización de la pared inferior del corazón. Postergando la obtención de la imagen por al menos 1 hora debe facilitar el aclaramiento hepático del trazador.

Cuando es usado para examinar la perfusión miocárdica, el intervalo de tiempo óptimo para la obtención de imágenes es de aproximadamente 1 a 4 horas después de la administración del ^{99m}Tc-Sestamibi.

Actividad usual administrada a adultos y adolescentes:

Imagen cardíaca; inyección endovenosa de 370 a 1110 MBq (10 a 30 mCi).

Se han realizado estudios en estrés y reposo en un mismo día encontrándose resultados similares a los realizados en 2 días, estos estudios son útiles para diferenciar isquemias de cicatrices, debiéndose administrar una dosis baja (7 mCi) en reposo seguida 2 horas más tarde de una dosis alta (25 mCi) en estrés

Imagen de paratiroides; inyección endovenosa de 370 a 740 MBq (10 a 20 mCi)

Imagen de tiroides; inyección endovenosa de 370 a 740 MBq (10 a 20 mCi).

Actividad usual administrada en pediatría:

No se ha establecido la dosis mínima.

Actividad usual administrada en geriatría:

Ver actividad usual administrada a adultos y adolescentes.

TRATAMIENTO EN CASO DE SOBREDOSIS

Debido a que la aplicación (dosificación radiactiva) del ^{99m}Tc-Sestamibi se limita a un centro especializado bajo

supervisión médica, es poco probable una sobredosis. En caso de ocurrir, el paciente deberá ingerir alimentos ricos en grasa e hidratarse, miccionando tan frecuentemente como sea posible.

PRESENTACIÓN

Caja con dos viales multidosis

INSTRUCCIONES PARA LA PREPARACIÓN DEL ^{99m}Tc-Sestamibi (RESERVADO AL USO PROFESIONAL)

Para preparar la inyección se usa una solución de pertecnetato de sodio Tc-99m estéril, libre de pirógenos y de agentes oxidantes.

Radioisótopo de marcación.....^{99m}Tc
Período de semidesintegración.....6.03 horas
Emisión principal.....Gamma de 140 Kev

El producto debe estar a temperatura ambiente antes de su marcación.

Durante el procedimiento de marcación, mantener condiciones de asepsia.

1. Antes de proceder al marcado, registrar en la etiqueta que lleva el símbolo característico de las sustancias radiactivas; la actividad estimada, volumen, fecha y hora de preparación. Pegar la etiqueta al vial que contiene el producto a marcar y colocarlo dentro de un blindaje de plomo.
2. Colocarse guantes a prueba de agua (polietileno, látex, etc.), retirar el disco de aluminio del vial y desinfectar la superficie de goma con alcohol.
3. Con una jeringa estéril inyectar al vial de 1 a 3 mL de la solución de pertecnetato de sodio Tc 99m con la actividad requerida (actividad máxima 180 mCi). Agitar el contenido del vial por algunos segundos e inmediatamente introducirlo en un baño de agua en ebullición durante 15 minutos.
4. Dejar enfriar a temperatura ambiente.
5. Determinar la pureza radioquímica del producto marcado, la cual no debe ser menor de 90%. NO USAR si fuera menor.
6. Medir la actividad radiactiva contenida en el vial de reacción usando un equipo de calibración.
7. Extraer con otra jeringa estéril el volumen con la actividad requerida, examinar rápidamente el contenido para detectar partículas extrañas o cambio de color, NO USAR si se observasen.

El producto es estable dentro de las 6 horas después de su preparación.

ALMACENAMIENTO

Almacenar entre 2 a 8 °C (36 a 46 °F). Proteger del congelamiento.



INSTITUTO PERUANO DE ENERGÍA NUCLEAR
PLANTA DE PRODUCCIÓN DE RADIOISÓTOPOS
Av. José Saco s/n Km. 13 Carretera a Huarangal - Carabayllo. Lima - Perú.
Telef./Fax - 548-4801
Email: radioisotopos@ipen.gob.pe