

Prulide

Prucaloprida 2 mg



Expendio bajo receta
Industria Argentina

Comprimidos recubiertos ranurados

FORMULA:

Cada comprimido recubierto ranurado contiene:
Prucaloprida (como prucaloprida succinato 2,64 mg) 2,00 mg.
Excipientes: Cellactose 80, crospovidona, dióxido de silicio coloidal, talco, estearato de magnesio, hidroxipropilmetilcelulosa, povidona, polietilenglicol 6000, propilenglicol, dióxido de titanio, óxido férrico pardo, óxido férrico amarillo, óxido férrico rojo, c.s.p. 1 comprimido.

ACCION TERAPEUTICA:

Agente contra el estreñimiento (Código ATC: A06AX05).

INDICACIONES:

Tratamiento sintomático de la constipación crónica en adultos en los cuales los laxantes no proporcionan un alivio adecuado.

CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS / PROPIEDADES:

ACCION FARMACOLOGICA

Prucaloprida es una dihidrobenzofurancarboxamida. Es un agonista selectivo de alta afinidad del receptor de serotonina (5-HT₄), con actividad procinética gastrointestinal.

In vitro, se ha detectado que su afinidad por otros receptores es 150 veces menor.

En animales, prucaloprida estimula la motilidad colónica proximal, potencia la motilidad gastroduodenal y acelera el vaciado gástrico lento. Asimismo, induce grandes contracciones peristálticas, que equivalen a movimientos de masa colónica en el ser humano, proporcionando la principal fuerza propulsora para la defecación. Estos efectos son sensibles al bloqueo con antagonistas selectivos del receptor 5-HT₄.

FARMACOCINETICA:

Absorción: prucaloprida se absorbe rápidamente. Tras la administración oral de una dosis única de 2 mg, la C_{max} se alcanza a las 2-3 horas de la toma. La biodisponibilidad absoluta es >90%. La ingesta con alimentos no afecta la biodisponibilidad oral de prucaloprida.

Distribución: prucaloprida se distribuye ampliamente, con un volumen de distribución en estado estacionario de 567 litros. La unión a proteínas plasmáticas es de aproximadamente 30%.

Metabolismo: el metabolismo hepático no es la principal vía de eliminación de prucaloprida. *In vitro*, el metabolismo hepático en seres humanos mostró ser muy lento, encontrándose los metabolitos en pequeñas cantidades. Luego de la administración de prucaloprida radiomarcada, se recuperaron pequeñas cantidades de siete metabolitos en heces y orina; aproximadamente el 92-94% de la dosis fue recuperada como droga sin metabolizar.

Eliminación: prucaloprida se excreta principalmente de forma inalterada (aproximadamente el 60-65% se elimina en orina y el 5% en heces). La excreción renal de prucaloprida inalterada se debe a filtración pasiva y a secreción activa. El clearance plasmático promedio de prucaloprida es de 317 ml/min. La vida media de eliminación es de aproximadamente 1 día. El estado estacionario se alcanza a los 3-4 días de iniciado el tratamiento con prucaloprida. La farmacocinética de prucaloprida es proporcional a la dosis dentro y, por encima, del rango terapéutico (hasta 20 mg). Prucaloprida, administrada una vez al día, muestra una cinética tiempo-independiente durante el tratamiento prolongado.

Poblaciones especiales:

Pacientes de edad avanzada: luego de la administración de dosis diarias de 1 mg de prucaloprida, los pacientes de edad avanzada presentaron un aumento del 26% y 28% en la C_{max} y el ABC, respectivamente.

Insuficiencia hepática: un estudio farmacocinético en pacientes con insuficiencia hepática moderada a severa ha mostrado aumentos del 10-20%, en la C_{max} y el ABC de prucaloprida, comparado con pacientes con función hepática normal.

Insuficiencia renal: luego de la administración de una dosis única de 2 mg de prucaloprida, la C_{max}, en pacientes con insuficiencia renal leve (Cl_{cr} 50-79 ml/min) y moderada (Cl_{cr} 25-49 ml/min), fue 25% y 51% mayor, respectivamente, en comparación con pacientes con función renal normal. En pacientes con insuficiencia renal severa (Cl_{cr} ≤ 24 ml/min), la C_{max} de prucaloprida fue 2,3 veces superior a la de pacientes con función renal normal.

POSOLOGIA Y MODO DE ADMINISTRACION:

La dosis recomendada es 2 mg de prucaloprida, una vez al día. No se espera que dosis diarias superiores a 2 mg de prucaloprida proporcionen mayor eficacia. En caso que la administración de 2 mg diarios de prucaloprida no sea eficaz luego de 4 semanas de tratamiento, se deberá volver a examinar al paciente y evaluar el beneficio de continuar con el tratamiento.

La eficacia de tratamientos de más de tres meses de duración no ha sido evaluada en estudios clínicos. En caso de tratamiento prolongado, se deberá reevaluar el beneficio del tratamiento a intervalos regulares.

Poblaciones especiales:

Insuficiencia renal: en pacientes con insuficiencia renal severa (filtrado glomerular <30 ml/min/1,73 m²), la dosis recomendada es de 1 mg, una vez al día. No se requiere ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia renal de leve a moderada.

Pacientes de edad avanzada: los pacientes mayores de 65 años de edad deben iniciar el tratamiento con dosis de 1 mg, una vez

al día. Si fuese necesario, la dosis puede aumentarse a 2 mg, una vez al día.

Insuficiencia hepática: los pacientes con insuficiencia hepática severa (Child Pugh C) deben comenzar el tratamiento con dosis de 1 mg, una vez al día. Se puede incrementar la dosis a 2 mg/día. No se requiere ajuste de dosis en pacientes con insuficiencia hepática leve o moderada.

Modo de administración:

Los comprimidos se pueden administrar con o fuera de las comidas.

CONTRAINDICACIONES:

- Hipersensibilidad a prucaloprida o a cualquiera de los componentes del producto.
- Insuficiencia renal que requiera hemodiálisis.
- Perforación u obstrucción intestinal debida a un trastorno estructural o funcional de la pared intestinal, íleo obstructivo, trastornos inflamatorios graves del tracto intestinal (como enfermedad de Crohn, colitis ulcerosa y megarrecto/megacolon tóxico).

ADVERTENCIAS:

Anticonceptivos orales (ACO): la eficacia de los ACO podría verse disminuida si la paciente presenta diarrea severa o prolongada durante el tratamiento con prucaloprida. Por lo tanto, se recomienda el uso de un método anticonceptivo adicional para prevenir posibles fallos del ACO. Asimismo, en mujeres en edad fértil se recomienda el uso de métodos anticonceptivos efectivos durante el tratamiento con prucaloprida.

Efectos sobre la capacidad de conducir o utilizar maquinaria: se han notificado casos de mareos y fatiga, especialmente durante el primer día de tratamiento. Por lo tanto, los pacientes deberán abstenerse de operar maquinarias peligrosas o conducir automóviles hasta que conozcan su susceptibilidad personal al fármaco.

PRECAUCIONES:

Enfermedades concomitantes o clínicamente inestables: no se ha establecido la seguridad y eficacia de prucaloprida en pacientes con enfermedades concomitantes o clínicamente inestables (como enfermedad cardiovascular o pulmonar, trastornos neurológicos o psiquiátricos, cáncer, pacientes con HIV, trastornos endocrinos). Por lo tanto, prucaloprida se debe utilizar con precaución en este grupo de pacientes, especialmente en pacientes con antecedentes de arritmias o enfermedad isquémica cardiovascular.

Poblaciones especiales:

Insuficiencia hepática: prucaloprida se debe utilizar con precaución en pacientes con insuficiencia hepática severa debido a que los datos disponibles en esta población son limitados.

Pacientes pediátricos: no se debe administrar prucaloprida en niños y adolescentes menores de 18 años de edad.

Embarazo: no se ha establecido la seguridad y eficacia de prucaloprida en mujeres embarazadas. En diferentes ensayos clínicos se han observado casos de aborto espontáneo, aunque se desconoce la relación de causalidad con el uso de prucaloprida en presencia de otros factores de riesgo. Estudios en animales no

muestran efectos dañinos directos ni indirectos en el embarazo, el desarrollo embrionario/fetal, el parto o el desarrollo postnatal. No se recomienda la administración de prucaloprida en mujeres embarazadas.

Lactancia: prucaloprida se excreta en la leche materna. Aunque no se esperan efectos en el lactante a las dosis terapéuticas indicadas, no se recomienda el uso de prucaloprida durante la lactancia.

Interacciones medicamentosas:

In vitro, prucaloprida no inhibe las actividades específicas de CYP450. Aunque prucaloprida puede comportarse como sustrato débil de la glicoproteína P (gp-P), no es un inhibidor de la misma a las concentraciones clínicamente relevantes.

Eritromicina: se ha observado un aumento del 30% en las concentraciones plasmáticas de eritromicina durante la coadministración con prucaloprida. El mecanismo de esta interacción no ha sido establecido. Dosis terapéuticas de eritromicina no afectan la farmacocinética de prucaloprida.

Ketoconazol: la coadministración de prucaloprida con ketoconazol (200 mg, dos veces al día), potente inhibidor de CYP3A4 y de gp-P, produjo un aumento en las concentraciones plasmáticas de prucaloprida de aproximadamente 40%. Este efecto no es considerado clínicamente significativo. Se pueden esperar interacciones de similar magnitud con otros inhibidores potentes de gp-P (como verapamilo, ciclosporina A, quinidina).

Otras terapias concomitantes: no se han observado efectos clínicamente significativos en la farmacocinética de warfarina, digoxina, alcohol, paroxetina y anticonceptivos orales si se administran concomitantemente con prucaloprida. La administración de dosis terapéuticas de probenecid, cimetidina y paroxetina no afectó la farmacocinética de prucaloprida.

REACCIONES ADVERSAS:

La seguridad de prucaloprida se evaluó en estudios doble ciego, controlados con placebo, incluyendo más de 3000 pacientes con constipación crónica. En estos estudios, más de 1500 pacientes recibieron 2 mg/día de prucaloprida, y otros 1300 pacientes recibieron 4 mg/día.

Las reacciones adversas más frecuentemente reportadas, asociadas al tratamiento con 2 mg/día de prucaloprida, fueron: cefalea (17,8%) y síntomas gastrointestinales, como dolor abdominal (13,7%), náuseas (13,7%) y diarrea (12,0%). Las reacciones adversas fueron de intensidad leve a moderada y ocurrieron principalmente al inicio del tratamiento con prucaloprida, desapareciendo al cabo de unos pocos días de continuado el mismo.

Otras reacciones adversas, observadas con menor frecuencia, fueron: disminución del apetito, mareos, temblor, palpitaciones, vómitos, dispepsia, flatulencia, ruidos gastrointestinales anormales, hemorragia rectal, polaquiuria, fatiga, pirexia y malestar general.

SOBREDOSIFICACION:

La sobredosis con prucaloprida puede producir síntomas derivados de una exacerbación de los efectos farmacodinámicos, e

incluyen cefalea, náuseas y diarrea. No se dispone de un tratamiento específico para la sobredosis con prucaloprida. En caso de sobredosis, administrar tratamiento sintomático y medidas de soporte. La pérdida extensa de líquidos ocasionada por diarrea o vómitos podría requerir la corrección de anomalías electrolíticas. Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o consultar a los centros toxicológicos de:

Hospital Posadas

(011) 4654-6648 / 4658-7777

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez

(011) 4962-2247 / 6666

PRESENTACION:

Envases conteniendo 15 comprimidos recubiertos ranurados.



Comprimido redondos, ranurados de color beige.

CONDICIONES DE CONSERVACION:

Mantener a temperatura entre 15°C y 30°C. Proteger de la humedad.



Este Medicamento
es Libre de Gluten

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 58.099

Director Técnico: Alejandro Herrmann, Farmacéutico.

Todo tratamiento exige un control periódico, debiendo consultarse al médico ante la menor duda o reacción adversa del medicamento. Siguiendo los criterios de la OMS se aconseja no administrar medicamentos durante el primer trimestre del embarazo y aún durante todo el transcurso del mismo, excepto cuando sean indicados por el médico. Todo medicamento debe mantenerse fuera del alcance de los niños.

Ultima revisión: Noviembre 2017



Baliarda S.A.

Saavedra 1260/62 - Buenos Aires