

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto: Dulcolax®
(Bisacodilo)

Forma farmacéutica: Gragea

Fortaleza: 5,0 mg

Presentación: Estuche por 2 blísteres de PVDC/Al con 10 grageas cada uno.

Titular del Registro Sanitario, país: Boehringer Ingelheim Promeco S.A. de C.V., México.

Fabricante, país: Boehringer Ingelheim Promeco S.A. de C.V., México.

Número de Registro Sanitario: M-07-090-A-06

Fecha de Inscripción: 10 de mayo de 2007.

Composición:

Cada gragea contiene:

Bisacodilo	5,00 mg
Glicerol al 85 %	0,20 mg
Sacarosa	21,363 mg
Tartrazina 85 %	0,179 mg

Plazo de validez: 36 meses

Condiciones de almacenamiento: Almacenar por debajo de 30 ° C.

Indicaciones terapéuticas:

Para su uso en pacientes que sufren estreñimiento.

En preparación de procedimientos diagnósticos, tratamiento pre- y postoperatorio y en condiciones en las que se requiere facilitar la defecación.

Contraindicaciones:

Dulcolax® está contraindicado en pacientes con íleo paralítico, obstrucción intestinal, condiciones abdominales agudas como: apendicitis, enfermedad intestinal inflamatoria aguda y en caso de dolor abdominal severo asociado con náusea y vómito que podría ser indicativo de condiciones severas.

Dulcolax® También está contraindicado en casos de deshidratación severa y en pacientes con hipersensibilidad conocida al Bisacodilo o cualquier otro componente de la fórmula.

El uso de este producto está contraindicado en caso de condiciones hereditarias raras que sean incompatibles con algún excipiente del producto (ver "Precauciones Generales").

Contraindicaciones asociadas al contenido de excipientes:

Lactosa: Este medicamento contiene lactosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, insuficiencia de lactasa de Lapp (insuficiencia observada en ciertas poblaciones de Laponia) o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

Sacarosa: Este medicamento contiene sacarosa. Los pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa, malabsorción de glucosa o galactosa o insuficiencia (o deficiencia) de sacarasa – isomaltasa, no deben tomar este medicamento.

Precauciones:

Como sucede con todos los laxantes, Dulcolax® no debe ser tomado en forma diaria o por períodos extensos de tiempo sin investigar la causa del estreñimiento. Su uso prolongado y excesivo puede conducir a un desbalance de líquidos y electrolitos e hipocalcemia.

La pérdida intestinal de fluidos puede promover deshidratación. Los síntomas pueden incluir sed y oliguria. En pacientes que sufren de pérdida de fluidos donde la deshidratación puede ser peligrosa (p.ej. insuficiencia renal, pacientes ancianos) Dulcolax® debe descontinuarse e iniciarse nuevamente sólo bajo supervisión médica.

Los pacientes pueden experimentar hematoquecia (sangre en las heces) que generalmente es leve y auto limitada.

Se han reportado mareo y/o síncope en pacientes que han estado tomando Dulcolax®. Los detalles disponibles de aquellos casos sugieren que tales sucesos pueden concordar con síncope de defecación (o síncope atribuible al esfuerzo por defecación), o con una respuesta vasovagal al dolor abdominal que puede estar relacionada con el estreñimiento y no necesariamente a la administración del Dulcolax® en sí.

Una gragea de Dulcolax® contiene 34.9 mg de lactosa resultando en 69.8 mg de lactosa por dosis máxima recomendada al día para el tratamiento de constipación en adultos y niños mayores de 10 años. Para examinación radiológica resultará en 139.6 mg por dosis máxima recomendada al día para adultos. Los pacientes con la rara condición hereditaria de intolerancia a la galactosa, por ejemplo galactosemia, no deben tomar este medicamento.

Una gragea de Dulcolax® contiene 21.4 mg de sacarosa, resultando en 42.8 mg de sacarosa por dosis máxima recomendada al día para el tratamiento de constipación en adultos y niños mayores de 10 años. Para examinación radiológica resultará en 85.6 mg por dosis máxima recomendada al día para adultos. Los pacientes con la rara condición hereditaria de intolerancia a la fructosa no deben tomar este medicamento.

Precauciones relacionadas con los excipientes:

Almidón de maíz: Este producto contiene almidón de maíz.

Glicerol: Este medicamento puede producir dolor de cabeza, molestias de estómago y diarrea porque contiene glicerol.

Tartrazina: Este medicamento puede producir reacciones alérgicas porque contiene Tartrazina. Puede provocar asma, especialmente en pacientes alérgicos al ácido acetilsalicílico. Se reportó decoloración en la orina, sudor, y piel.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

PRECAUCIONES EN RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD:

La toxicidad oral aguda de bisacodilo en roedores y no roedores es baja y excedió 2g/kg. Los perros toleraron niveles de hasta 15mg/kg. Los signos clínicos mayores de toxicidad aguda fueron diarrea, actividad motora disminuida y piloerección.

Estudios de toxicidad con dosis repetidas hasta por 26 semanas fueron realizadas en ratas, cerdos pequeños y monos Rhesus. Como se esperaba, el medicamento causó diarrea severa dosis dependiente en todas las especies, excepto en los cerdos pequeños. No hubo cambios histopatológicos distintos y, en particular, nefrotoxicidad relacionada al fármaco. El bisacodilo indujo lesiones proliferativas observadas en la vejiga urinaria en ratas tratadas durante 32 semanas. Estas proliferaciones no se atribuyen al bisacodilo per se; se considera

que son secundarias a la formación de microcálculos debido a cambios en los electrolitos urinarios y, por tanto, no son de relevancia biológica para el humano.

La evidencia de una extensa batería de pruebas sistémicas de mutagenicidad bacteriana y de mamíferos no mostró ningún potencial genotóxico del bisacodilo. Además, el bisacodilo no provocó ningún incremento significativo en la transformación morfológica de las células embrionarias de hámster Syrian (SHE). En contraste con el laxante genotóxico y carcinogénico fenolftaleína, el bisacodilo no mostró potencial mutagénico en pruebas apropiadas.

No hay estudios disponibles de carcinogenicidad no convencionales (de ciclo de vida) con bisacodilo. Debido a la similitud terapéutica con la fenolftaleína, se investigó el bisacodilo en el modelo de ratón p53 trasngénico por 26 semanas. No se observaron neoplasias relacionadas con el tratamiento a dosis orales de hasta 8,000 mg/kg/día.

No se encontraron efectos teratogénicos en ratas y conejos (riesgo de embarazo categoría B de la FDA) en dosis de hasta 1,000 mg/kg/día que excedieron la dosis diaria humana máxima recomendada (basada en mg/m²) por al menos 800 veces. En la rata, se observó toxicidad en el embrión y materna con dosis 80 veces por arriba de la dosis diaria humana máxima recomendada.

Efectos indeseables:

Las reacciones adversas reportadas más comúnmente durante el tratamiento son dolor abdominal y diarrea.

Trastornos del sistema inmune:

Reacciones anafilácticas, angioedema y otras reacciones de hipersensibilidad.

Trastornos del metabolismo y nutrición:

Deshidratación.

Desórdenes del sistema nervioso.

Mareo, síncope.

Mareo y síncope que se presenta después de tomar bisacodilo parece ser consistente con una respuesta vasovagal (p. ej. Debido a espasmo abdominal, defecación)

Trastornos gastrointestinales:

Colitis, cólicos abdominales (retortijones), dolor abdominal, diarrea, vómito, náusea, hematoquecia (sangre en heces), molestia abdominal y molestia anorectal.

Posología y método de administración:

Vía de administración: Oral.

Para constipación:

Adultos: 1 - 2 grageas (5 - 10 mg) al día

Se recomienda iniciar con la dosis más baja. La dosis puede ser ajustada hasta la dosis máxima recomendada para producir heces regulares.

La dosis diaria máxima no debe excederse.

Población pediátrica:

Niños > 10 años: 1 - 2 grageas (5 - 10 mg) al día

Se recomienda iniciar con la dosis más baja. La dosis puede ser ajustada hasta la dosis máxima recomendada para producir heces regulares.

La dosis diaria máxima no debe excederse.

Niños 4 – 10 años

1 gragea (5 mg) al día

La dosis diaria máxima no debe excederse.

Los niños menores de 10 años con constipación crónica o persistente deben ser tratados únicamente bajo supervisión médica.

Instrucciones de uso:

Se recomienda tomar las grageas por la noche para facilitar la evacuación por la mañana siguiente. Deben ser deglutidas con una cantidad adecuada de agua.

Las grageas no deben ser tomadas junto con productos que reducen la acidez del tracto gastrointestinal superior, como la leche, antiácidos, o inhibidores de la bomba de protones; esto con la finalidad de evitar la disolución prematura de la cubierta entérica.

Para casos de preparación de procedimientos diagnósticos y en preparación preoperatoria:

Para la preparación de procedimientos diagnósticos, en el tratamiento pre- y postoperatorio y en condiciones médicas que requieran facilitar la evacuación, debe administrarse Dulcolax® bajo supervisión médica.

Con la finalidad de estimular la evacuación completa del intestino, la dosis recomendada de Dulcolax® para adultos es de dos a cuatro grageas por la noche, previo al procedimiento o exploración, seguido de un laxante de efecto inmediato (p. ej. supositorio) en la mañana del procedimiento.

Población pediátrica

Para niños de 4 años en adelante, se recomienda una gragea en la noche y un laxante pediátrico de efecto inmediato (p. ej. supositorio) a la mañana siguiente.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

El uso concomitante de diuréticos o adreno-corticosteroides puede incrementar el riesgo de desequilibrio electrolítico si se administran dosis excesivas de Dulcolax®.

El desequilibrio electrolítico puede favorecer el incremento de la sensibilidad a glucósidos cardíacos.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo

No se cuenta con estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas. La amplia experiencia no ha demostrado evidencia de eventos adversos o dañinos durante el embarazo.

Sin embargo, como cualquier otro medicamento, el uso Dulcolax® durante el embarazo debe ser bajo supervisión médica.

Lactancia

La evidencia clínica no ha mostrado que ni el componente activo de bisacodilo (bis-(p-hidroxifenil)-piridil-2-metano) o sus glucurónidos se excretan en la leche materna de mujeres sanas lactando.

Por lo tanto Dulcolax® puede ser utilizado durante la lactancia.

Fertilidad

No se han realizado estudios sobre el efecto en la fertilidad humana

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No se han realizado estudios acerca de los efectos sobre la habilidad para manejar y operar maquinaria.

Sin embargo, los pacientes deben ser aconsejados que debido a la respuesta vasovagal (p. ej. debido a espasmo abdominal) pueden experimentar mareo y/o síncope. Si los pacientes experimentan espasmo abdominal deben evitar tareas potencialmente riesgosas como conducir u operar maquinaria.

Sobredosis:

Síntomas:

Si se administran dosis elevadas de Dulcolax®, pueden presentarse evacuaciones líquidas (diarrea), cólicos abdominales (retortijones) y una pérdida clínicamente significativa de fluidos, potasio y otros electrolitos.

La sobredosis crónica de Dulcolax®, al igual que cualquier otro laxante, puede causar diarrea, dolor abdominal, hipocalcemia, hiperaldosteronismo secundario y cálculos renales.

Ha sido descrito el daño tubular renal, alcalosis metabólica y contracciones musculares secundarias a hipocalcemia en asociación con el abuso crónico de laxantes.

Tratamiento:

Después de la ingestión oral de Dulcolax®, la inducción del vómito o el lavado gástrico pueden prevenir o minimizar la absorción del mismo. Se requiere del reemplazo de líquidos y la corrección del desequilibrio electrolítico. Esto es especialmente importante en los ancianos y en los jóvenes.

La administración de antiespasmódicos puede ser valiosa.

Propiedades farmacodinámicas:

Bisacodilo es un laxante de acción local derivado del grupo del difenilmetano. Es un laxante de contacto, con efecto hidragogo antiresortivo, que estimula, después de su hidrólisis en el intestino grueso, la peristalsis del colon y promueve la acumulación de agua y consecuentemente electrolitos en la luz colónica. Esto resulta en la estimulación de la defecación, reducción del tiempo de tránsito y reblandecimiento de las heces.

Como un laxante que actúa en el colon, el bisacodilo estimula específicamente el proceso de evacuación natural en la región baja del tracto gastrointestinal. Por lo tanto, el bisacodilo es inefectivo en alterar la digestión o absorción de calorías o nutrientes esenciales en el intestino delgado.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Después de la administración oral o rectal, el bisacodilo es rápidamente hidrolizado al principio activo bis-(p-(hidrofenil)-piridil-2-metano) (BHPM) principalmente por esterases de la mucosa entérica.

La administración en forma de grageas resultó en concentraciones plasmáticas máximas de BHPM entre 4 y 10 horas posteriores a la administración mientras que el efecto laxante ocurrió entre 6 y 12 horas después de la administración. Por tanto el efecto laxante del bisacodilo no se correlaciona con el nivel plasmático del BHPM. En cambio, el BHPM actúa localmente en la parte baja del intestino y no hay una correlación entre el efecto laxante y los niveles plasmáticos del componente activo. Por esta razón, las grageas de bisacodilo están formuladas para resistir el jugo gástrico y del intestino delgado. Esto resulta en una liberación principal del fármaco en el colon, que es el sitio de acción deseado.

Después de la administración oral, sólo pequeñas cantidades del medicamento se absorben y se conjugan casi por completo en la pared intestinal y en el hígado para formar el glucurónido inactivo del BHPM. La vida media de eliminación plasmática del glucurónido de BHPM fue estimada en aproximadamente 16.5 horas. Después de la administración de grageas de bisacodilo, se recuperó en promedio el 51.8% de la dosis en las heces como

BHPM libre, y un promedio de 10.5% de la dosis se recuperó en la orina como glucurónido de BHPM.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 31 de agosto de 2016.