

## RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

<b>Nombre del producto:</b>	PIRIMETAMINA
<b>Forma farmacéutica:</b>	Tableta
<b>Fortaleza:</b>	25 mg
<b>Presentación:</b>	Estuche por un blíster de PVC/AL con 20 tabletas. Estuche por 2 blísteres de PVC/AL con 10 tabletas cada uno. Estuche por un blíster de PVC ámbar/AL con 20 tabletas. Estuche por 2 blísteres de PVC ámbar/AL con 10 tabletas cada uno.
<b>Titular del Registro Sanitario, país:</b>	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba. EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba.
<b>Fabricante, país:</b>	UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) "REINALDO GUTIERREZ", Planta "Reinaldo Gutiérrez".
<b>Número de Registro Sanitario:</b>	M-15-218-P01
<b>Fecha de Inscripción:</b>	22 de diciembre de 2015
<b>Composición:</b>	
Cada tableta contiene:	
Pirimetamina	25,00 mg
Lactosa monohidratada	54,00 mg
<b>Plazo de validez:</b>	24 meses
<b>Condiciones de almacenamiento:</b>	Almacenar por debajo de 30° C. Protéjase de la luz.

### Indicaciones terapéuticas:

Profilaxis y tratamiento de la malaria causada por *P. falciparum*, *P. vivax* y *P. malariae*. Actúa de manera sinérgica con las sulfonamidas en estos tratamientos.

Toxoplasmosis (en asociación con sulfadiazina).

Tratamiento de la isosporiasis.

### Contraindicaciones:

En pacientes con hipersensibilidad conocida a la pirimetamina

Pacientes con anemia megaloblástica debida a la deficiencia de folatos.

Este producto contiene lactosa, no administrar en pacientes con intolerancia a la lactosa.

**Precauciones:**

Embarazo: categoría de riesgo: C. Evítese en el primer trimestre riesgo teórico de teratogenia (antagonista del folato), pero se administra después si existe riesgo de transmisión congénita. Deben administrar suplementos adecuados de folato a la madre. Evítese en el primer trimestre si pneumocistosis y toxoplasmosis.

Lactancia materna: compatible, evitar lactante reciba otro fármaco antifolato.

Daño renal.

Daño hepático, o pacientes con déficit de folato (alcoholismo, síndrome de mala absorción). Administración de folato durante el tratamiento de la toxoplasmosis.

Tratamiento prolongado requiere conteo de células sanguíneas.

Pacientes con diabetes mellitus.

**Advertencias especiales y precauciones de uso:**

Acudir de inmediato al médico y detener el tratamiento si aparición de eritema cutáneo, dolor de garganta, glositis u otros signos de depresión de medula ósea.

Mujeres en edad fértil evitar embarazo durante el tratamiento.

Administración del fármaco con alimentos para evitar los trastornos gastrointestinales.

**Efectos indeseables:**

Frecuentes:

Las altas dosis empleadas en el tratamiento de la toxoplasmosis se asocian a trastornos gastrointestinales (náusea, vómito, glositis atrófica, dolor abdominal), anemia megaloblástica, leucopenia, trombocitopenia, pancitopenia, hematuria y trastornos del ritmo cardiaco. Reacciones de hipersensibilidad (eritema cutáneo, síndrome de Stevens-Johnson, necrólisis tóxica epidérmica, eritema multiforme, anafilaxia) aparece en el tratamiento con sulfadoxina.

Raras: eosinofilia pulmonar.

**Posología y modo de administración:**

Malaria:

Tratamiento:

Adulto:

75 mg de pirimetamina/1500 mg de sulfadoxina (3 tabletas) dosis única.

Niños

Mayores de 2 años: 1,25 mg/kg de pirimetamina con 25 mg/kg de sulfadoxina como dosis única.

Niños: 5-10 kg, media tableta, 11-20 kg, 1 tableta, 21-30 kg, 1½ tabletas, 31-45 kg, 2 tabletas, en dosis única.

Profilaxis:

Pirimetamina 25 mg/ sulfadoxina 500 mg (1 tableta) a la semana.

Debido a su toxicidad la profilaxis a largo tiempo no es recomendada.

Toxoplasmosis:

Adultos:

Pirimetamina (50 a 200 mg/d) con sulfadiazina (250 a 100 mg c/6h) por 1 ó 2 días seguido de pirimetamina 25 a 50 mg/d con sulfadiazina 125 a 500 mg c/6h por 2 a 4 semanas en pacientes inmunocompetentes, o de 4 a 6 en inmunocomprometidos.

Niños:

1 mg/kg/d por 1 a 3 d, seguido de 0,5 mg/kg/d por 4 a 6 semanas, debe administrarse las dosis usuales de sulfadoxina.

Tratamiento de mantenimiento de isosporiasis en pacientes con VIH: 50 a 75 mg

### **Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:**

Artemeter más lumefantrina: evitar su uso concomitante.

Fenitoína: antagoniza el efecto anticonvulsivante; aumenta el efecto antifolato.

Metotrexato, cotrimoxazol, sulfadiazina, trimetoprim, zidovudina: aumenta el efecto antifolato.

### **Uso en Embarazo y lactancia:**

Administrar con precaución durante el embarazo. Evitar en el primer trimestre.

Lactancia Materna: compatible, evitar lactante reciba otro fármaco antifolato.

### **Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:**

No procede.

### **Sobredosis:**

Medidas generales. Se debe dar el tratamiento de soporte, manteniendo las vías aéreas sin obstrucción y adecuado control de las convulsiones. Deber asegurarse la hidratación para una diuresis óptima. El folinato de calcio debe administrarse hasta que se hayan eliminado los signos de toxicidad. Pueden considerarse de 7 a 10 días antes que aparezcan los signos tardíos característicos de leucopenia, considerándose necesaria la administración del folinato de calcio mientras dure el período de riesgo.

### **Propiedades farmacodinámicas:**

ATC: P01BD01

Grupo Farmacoterapéutico: P-Productos antiparasitarios, insecticidas y Repelentes, P01-Antiprotozoarios, P01B-Antipalúdicos, P01BD- Diaminopridinas

Mecanismo de acción: Se une e inhibe reversiblemente a la enzima dihidrofolato reductasa del protozoo, bloqueando selectivamente la conversión del ácido dihidrofólico a su forma funcional, el ácido tetrahidrofólico. Esto agota las reservas de folato, un cofactor esencial en la biosíntesis de los ácidos nucleicos, interfiriendo la producción de proteínas y ácido nucleico del protozoo. La pirimetamina se une más a la dihidrofolato reductasa del protozoo que a la correspondiente enzima de mamíferos. Ejerce su efecto en la biosíntesis de folato en un paso inmediatamente posterior a aquel en que actúan las sulfamidas. Cuando se administra simultáneamente con sulfamidas se produce un sinergismo que se atribuye a la inhibición de la producción de etrahidrofolato en dos pasos secuenciales de su biosíntesis. Es efectiva frente a las formas eritrocitas asexuales y, en menor grado, contra las formas tisulares de la malaria del *P. falciparum*. No destruye los gametocitos pero detiene la esporogonia en el mosquito.

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

Absorción: Se absorbe bien por vía oral.

Distribución: Se distribuye ampliamente en el organismo; se concentra principalmente en los glóbulos blancos y rojos, riñones, pulmones, hígado y bazo. También atraviesa la placenta.

Metabolismo: Se metaboliza en el sistema enzimático microsomal hepático.

Excreción: Fundamentalmente renal; del 20 al 30 % se excreta inalterada en la orina. La excreción urinaria puede persistir durante 30 días o m s. En pequeñas cantidades se elimina en las heces fecales. También se excreta en la leche materna.

Vida media plasmática: La vida media es alrededor de 96 horas.

Unión a proteínas: La unión a proteínas plasmáticas es elevada.

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

No procede.

**Fecha de aprobación/ revisión del texto:** 30 de junio de 2021.