



Mestinon[®]

brometo de piridostigmina

Forma farmacêutica e apresentação:

Comprimido: cartucho contendo 1 frasco com 60 comprimidos.

USO ADULTO

Composição

Cada comprimido contém:

brometo de piridostigmina 60 mg
(excipientes: dióxido de silício coloidal, amido, estearato de magnésio, lactose, talco).

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

O produto

Este medicamento está indicado para o tratamento de doenças que afetam os músculos. Estas doenças, no entanto, são muito especiais (específicas) e só podem ser tratadas por um médico. Portanto não faça uso deste medicamento sem prescrição médica e, pelas mesmas razões, não o indique a outras pessoas. Os efeitos deste medicamento começam a se manifestar de forma lenta, portanto é necessário continuar a tomar o remédio pelo período que o médico recomendou.

O Mestinon[®] não pode ser tomado por pacientes que apresentem outras doenças graves, em especial localizadas no estômago, intestino, vias urinárias e ainda por pessoas que sejam sensíveis a este remédio. Informe ao seu médico caso você tenha doenças renais. Apenas o seu médico poderá avaliar as condições para prescrever o Mestinon[®].

Antes de tomar o Mestinon[®], informe seu médico sobre outros remédios que esteja fazendo uso. Mestinon[®] é incompatível com alguns medicamentos e que, portanto, não podem ser usados conjuntamente.

Caso você apresente problemas no coração, asma, diabetes ou vá se submeter a intervenções cirúrgicas, avise com antecedência seu médico antes de tomar este remédio.

O Mestinon[®] não deve ser tomado por mulheres que estejam grávidas ou amamentando.

O Mestinon[®] geralmente é bem tolerado. No entanto, alguns efeitos indesejáveis podem ocorrer, tais como: náuseas, vômitos, diarreia, cólicas abdominais, aumento dos movimentos do intestino, aumento das secreções dos pulmões, excesso de saliva, batidas lentas do coração, problemas nos olhos, contrações musculares, fraqueza muscular e erupções na pele. Alguns outros efeitos indesejáveis aqui não citados também podem aparecer. Caso ocorra qualquer tipo de efeito indesejável, suspenda a medicação e informe imediatamente a seu médico.

Siga corretamente a prescrição de seu médico quanto a forma de tomar os comprimidos de Mestinon[®] e com relação ao intervalo entre as tomadas. Não altere as doses e os horários das tomadas por sua própria conta. Isso pode, inclusive, prejudicar o seu tratamento.

O prazo de validade está indicado na embalagem do produto. O uso de qualquer remédio com prazo de validade vencido não é aconselhável.

Manter o frasco fechado e conservar em temperatura ambiente (15 a 30°C).

TODOS OS MEDICAMENTOS DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

NÃO TOMAR REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DE SEU MÉDICO. PODE SER PERIGOSO PARA A SUA SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS

Propriedades e efeitos

O brometo de piridostigmina, princípio ativo do Mestinon[®], é um inibidor eficaz da colinesterase. Ele se diferencia por um lento início de ação, pela uniformidade de efeito, duração de ação relativamente longa e uma diminuição progressiva do efeito colinérgico.

Farmacocinética

A piridostigmina, como os demais medicamentos pertencentes ao mesmo grupo, é absorvida apenas parcialmente pelo trato gastrointestinal. A biodisponibilidade, após administração oral, é de 3 a 8%. As concentrações plasmáticas máximas, estando o paciente em jejum, são alcançadas entre 1 1/2 a 2 horas, após a ingestão de 120 mg de piridostigmina. Quando o produto é ingerido juntamente com as refeições, a concentração aumenta mais lentamente.

O volume médio de distribuição é de 1,4 litros/kg de peso. A piridostigmina não se liga fortemente às proteínas plasmáticas e não atravessa a barreira hematoencefálica.

Com respeito ao tempo de meia-eliminação, os valores médios estão situados em torno de 1 1/2 hora. Em alguns casos, este tempo pode triplicar. A clearance plasmática média em indivíduos saudáveis, varia entre 0,36 a 0,65 L/h/kg.

Não existem dados conclusivos sobre a possibilidade de acúmulo da piridostigmina inalterada ou de metabólitos ativos no organismo. Na prática clínica este ponto reveste-se de menor importância, uma vez que a posologia do Mestinon[®] deve ser sempre adaptada a cada caso em particular.

A piridostigmina é eliminada em sua maior parte (75 - 81%) sob forma inalterada por via renal. Uma pequena fração (18 - 21%) aparece na urina sob a forma de metabólito 3-hidroxi-N-metil-piridina. Outros metabólitos não identificados representam 1 a 4% do total e revestem-se de pouca importância.

As concentrações plasmáticas necessárias para a obtenção do efeito terapêutico no tratamento da **miastenia gravis** são de 20 a 60 ng/mL.

As alterações da função hepática não exercem qualquer influência importante sobre a cinética da piridostigmina. No caso de insuficiência renal devido a idade ou em decorrência de uma doença, o tempo de meia-eliminação pode estar quadruplicado, e a clearance plasmática pode reduzir-se à quinta parte de seu valor normal.

Indicações

O campo de indicações do Mestinon[®] compreende afecções nas quais se deseja obter uma estimulação do sistema nervoso parassimpático e uma ação favorável sobre a transmissão do influxo na junção mioneural.

É principalmente usado, por via oral, no diagnóstico e tratamento da miastenia grave, por seu efeito prolongado e poucos distúrbios gastrointestinais formando alívio sintomático mais sustentado, particularmente à noite.

Pode ser usado nos casos de doença de Little, esclerose múltipla e na esclerose lateral amiotrófica, mioatrofias espinhais e paralisias consecutivas à poliomielite.

Também pode ser usado na prevenção dos distúrbios pós-punção lombar e do meningismo pós-eletroencefalografia, assim como no tratamento da enxaqueca e cefaléia.

Também é usado eventualmente na reversão da taquicardia paroxística e na modificação do estado reacional dos tuberculosos.

Restrições de uso

O Mestinon[®] está contra-indicado nos casos de obstáculo mecânico ao nível do trato gastrointestinal ou nas vias urinárias, bem como nos casos de conhecida hipersensibilidade à droga.

O Mestinon[®] não deve ser administrado em associação com os miorelaxantes despolarizantes, como o suxametônio. Mestinon[®] deve ser administrado com extrema precaução a pacientes com bradicardia, asma brônquica, diabetes mellitus e após intervenções cirúrgicas sobre o estômago e intestino.

A ausência de resposta ao tratamento com Mestinon[®] pode eventualmente estar relacionada a uma superdosagem. Deve-se também observar o princípio médico de não se administrar medicamentos durante a gravidez e a lactantes, a não ser em casos de extrema necessidade e mesmo assim utilizando-se dose bem ajustada e sob observação médica.

Precauções

Mestinon[®] é principalmente excretado inalterado pelo rim. Doses menores podem ser necessárias para pacientes com patologias renais e o tratamento deve ser feito com base na titulação da dosagem e seu efeito. Usar com cautela na epilepsia, hipertireoidismo, úlceras pépticas, oclusão coronária, arritmias cardíacas.



Interações medicamentosas.

O brometo de piridostigmina antagoniza a ação dos miorrelaxantes não despolarizantes do tipo curare.
A atropina anula os efeitos colinérgicos da piridostigmina, especialmente a bradicardia e a hipersecreção.
Antibióticos aminoglicosídeos - pela ação própria de bloqueio não despolarizante dessas drogas.
Corticosteróides - reduz o efeito anticolinesterase dessas drogas.
Relaxantes musculares despolarizantes (succinilcolina, decametônio) - somente utilizar nos pacientes miastênicos recebendo piridostigmina quando absolutamente necessário, dada a ação depressiva respiratória.
Anestésicos, antiarrítmicos e drogas anticolinesterásicas - somente utilizar em miastênicos quando necessário, dada a ação sinérgica. Magnésio - pode antagonizar o efeito benéfico do colinérgico.

Reações adversas

O Mestinon®, bem como todos os medicamentos colinérgicos, pode apresentar repercussões funcionais indesejáveis sobre o sistema neurovegetativo. Os efeitos secundários do tipo muscarínico podem traduzir-se por náuseas, vômitos, diarreia, cólicas abdominais, aumento do peristaltismo e das secreções brônquicas, hipersalivação e ainda bradicardia e miose.

Foram ainda eventualmente relatados sintomas nicotínicos, tais como:

- Lacrimejamento, miose, diplopia, hiperemia conjuntival, espasmo de acomodação;
- Convulsões, disartria, disfonía, tontura, cefaléia, vertigem;

- Aumento de secreções tráqueo-brônquicas, laringo espasmos;

Na superdose: paralisia respiratória, muscular e central, parada respiratória, bronco espasmo e morte. Também podem ocorrer arritmias, bradicardia, bloqueio A-V, parada cardíaca.

- Fraqueza muscular, fasciculações, câibras;

- Aumento da frequência urinária;

- Alopécia.

Como os produtos que contêm bromo, Mestinon® em casos raros, pode provocar o aparecimento de erupções cutâneas que, em geral, desaparecem rapidamente após a suspensão da medicação. Neste caso, o retorno do tratamento com Mestinon® ou por qualquer outro produto que contenha bromo está formalmente contra-indicado.

Advertências

Crise miastênica/Crise colinérgica

A superdose de piridostigmina pode resultar na crise colinérgica, caracterizada por fraqueza muscular progressiva e paralisia dos músculos respiratórios levando à morte. A crise miastênica resultante do agravamento da miastenia pode levar à fraqueza muscular intensa sendo difícil o diagnóstico diferencial, que é de crucial importância para o tratamento.

O tratamento da crise miastênica requer o aumento de dose do colinérgico e o da crise colinérgica se faz com a retirada imediata da piridostigmina e o uso de atropina (1 mL de atropina IV).

Uso na gravidez

A segurança do uso de Mestinon® durante a gravidez não foi estabelecida. Embora aparentemente seguras para o feto, podem afetar o neonato: fraqueza muscular transitória em cerca de 20% das crianças de mães utilizando essas drogas na gravidez.

As drogas anticolinérgicas podem causar irritabilidade uterina e induzir trabalho de parto quando administradas IV em mulheres no pré-parto.

Uso na lactação

Não está determinado se essas drogas são excretadas no leite materno. Dado o risco de efeitos maléficos sobre o latente, o uso em lactantes deve pesar risco/benefício e a importância do medicamento para a mãe.

Posologia padrão

Durante o tratamento com Mestinon®, deve-se levar em consideração que o efeito se estabelece de forma progressiva, em geral, 15 a 30 minutos após administração oral.

Atonia intestinal, constipação atônica: 1 comprimido a intervalos regulares (4/4 horas, por exemplo).

Miastenia gravis pseudoparalítica: 1 a 3 comprimidos 2 a 4 vezes ao dia; nos casos mais graves a posologia pode ser aumentada.

Na miastenia gravis, o efeito de uma dose dura cerca de 4 horas durante o dia e até aproximadamente 6 horas durante a noite, devido à diminuição da atividade física.

Doença de Little, esclerose múltipla, esclerose lateral amiotrófica, mioatrofias espinhais, paresias consecutivas à poliomielite - 1 a 6 comprimidos de 60 mg por dia.

Prevenção dos distúrbios pós-punção lombar e do meningismo pós-eletroencefalografia - 1 comprimido de 60 mg, 15 minutos antes de punção ou de exame.

Cefaléia, enxaqueca - 1/4 a 1/2 comprimido, 3 vezes ao dia.

Taquicardia paroxística, taquicardia sinusal supraventricular - 1/4 a 1/2 comprimido de 60 mg, 3 a 4 vezes ao dia.

Modificação do estado reacional dos tuberculosos - 1/4 a 1/2 comprimido de 60 mg, 3 a 4 vezes ao dia.

Recomenda-se administrar o Mestinon® de forma que seu efeito máximo coincida com o período de maior esforço físico, por exemplo ao levantar-se ou durante as refeições.

Em casos especiais para antagonizar o efeito do curare pode-se utilizar preferencialmente a neostigmina (Prostigmine®) em lugar de piridostigmina (Mestinon®).

Nos casos de alterações da função renal, devido à idade ou patologia específica, o intervalo entre as doses deve ser mais espaçado ou, caso necessário, reduzir as doses subseqüentes.

Sintomas e tratamento de superdosagem

Quadro clínico

Quando há superestimulação, o quadro sintomatológico é o de aumento de ação parassimpaticomimética se não houver mascaramento atropínico.

Os sinais e sintomas da crise colinérgica são muito variáveis. Manifestam-se por: cólicas abdominais, diarreia, vômitos, salivagem excessiva, palidez, suores frios, frio, urgência urinária, distúrbios visuais e, eventualmente, fasciculação e paralisia dos músculos voluntários (incluindo a língua), dos ombros, pescoço e braços.

Miose, hipertensão com ou sem bradicardia, sensações subjetivas de tremores internos, ansiedade e pânico, podem completar o quadro.

A crise colinérgica se diferencia da crise miastênica pelo fato desta última não apresentar os sintomas acima, exceto ansiedade e pânico.

O tratamento consiste em interrupção imediata do Mestinon® ou de outros colinérgicos e administração de 1 a 2 mg de sulfato de atropina por via intravenosa lenta. De acordo com a frequência cardíaca observada, a dose poderá ser repetida, de acordo com o caso, de 2 em 2 horas ou de 4 em 4 horas.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA.

Nº do lote, data de fabricação e prazo de validade: vide embalagem.

Resp. Técnica: Edilene A. Campos - CRF-SP nº 17625

M.S. 1.0575.0045.002-0 - Frasco com 60 comprimidos

© Marca Registrada

Valeant Farmacêutica do Brasil Ltda.

R. Mário Junqueira da Silva, 736/766

Campinas - SP

CNPJ 61.198.136/0001-22

Indústria Brasileira

Uma empresa do grupo

Valeant Pharmaceuticals

International - USA

Produzido por: Blanver Farmoquímica Ltda.

Rua Dr. Mário Augusto Pereira, 91 - Taboão da Serra - SP

VALEANT



VA1199/A