

MESTINON[®]
Comprimido

BROMETO DE PIRIDOSTIGMINA – 60 MG

Mestinon®

brometo de piridostigmina

APRESENTAÇÕES

Comprimidos 60 mg - embalagem contendo um frasco de vidro com 60 comprimidos.

USO ORAL USO ADULTO**COMPOSIÇÃO**

Cada comprimido contém 60 mg de brometo de piridostigmina

Excipientes: dióxido de silício, amido, estearato de magnésio, lactose monoidratada, talco.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE**1. 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 paresias consecutivas à poliomielite.

Também pode ser usado na prevenção dos distúrbios pós-punção lombar e do meningismo pós-eletroencefalografia.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

Um estudo de um ano com um novo análogo da prostigmina, o **Mestinon®** (piridostigmina), mostrou em 7 dos 11 pacientes do estudo ser mais eficaz devido à sua superior capacidade de controlar os fenômenos miastênicos e à ausência de efeitos adversos após uso prolongado. Canad M A J 75:98-100,1956. MESTINON (PYRIDOSTIGMINE BROMIDE) IN MYASTHENIA GRAVIS. SCHWARZ H.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

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.

4. CONTRAINDICAÇÕES

O **Mestinon®** está contraindicado 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 suxamêtomio.

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.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista. (Categoria C).

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES 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.

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 **Mestinson**[®] 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.

Este medicamento não deve ser utilizado por mulheres grávidas sem orientação médica ou do cirurgião-dentista. (Categoria C).

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

O brometo de piridostigmina antagoniza a ação dos miorelaxantes 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.

Corticosteroides - 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.

7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO

Conservar em temperatura ambiente (entre 15°C e 30°C). Mantendo os comprimidos no frasco original bem fechado.

Mestinson[®] possui 24 meses de validade a partir de sua data de fabricação.

Número de lote e datas de fabricação e validade: vide embalagem.

Não use medicamento com o prazo de validade vencido. Guarde-o em sua embalagem original. Após aberto, válido por 60 dias.

Mestinson[®] é um comprimido cilíndrico, plano, de coloração branca a quase branca, nenhum odor a fraco, liso em uma das faces e sulcos na forma de cruz na outra.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

Durante o tratamento com **Mestinson**[®], 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.

Recomenda-se administrar o **Mestinson**[®] 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 em lugar de piridostigmina (**Mestinson**[®]). 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 subsequentes.

9. REAÇÕES ADVERSAS

O **Mestinson**[®], 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, disfonia, tontura, cefaleia, vertigem;
- Aumento de secreções traqueo-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, **Mestinson**[®] 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 **Mestinson**[®] ou por qualquer outro produto que contenha bromo está formalmente contraindicado.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificação de Eventos Adversos a Medicamentos - VIGIMED, disponível em <http://portal.anvisa.gov.br/vigimed>, ou para a Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal

10. SUPERDOSE

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, salivação 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 **Mestion®** ou de outros colinérgicos e a 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.

Em caso de intoxicação ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações. DIZERES LEGAIS

DIZERES LEGAIS

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Reg. MS nº 1.0440.0192

Farm. Resp.: Dr. Phellipe Honório Amaral - CRF-SP nº 56.787

Cellera Farmacêutica S.A.

Alameda Capovilla, 129 – Indaiatuba - SP

CNPJ 33.173.097/0002-74 - Indústria Brasileira



Embalagem reciclável