

INTESUL® MOSAPRIDE

COMPRIMIDOS RECUBIERTOS

Venta bajo receta

Industria Argentina

FORMULA

Cada comprimido recubierto contiene:

Citrato de mosapride dihidrato.....	5,30 mg
(equivalente a 5 mg de citrato de mosapride)	
Ludipress (lactosa 91,0 - 95,0 %, povidona 3,0 - 4,0 % y crospovidona 3,0 - 4,0 %), croscarmelosa sódica, lauril sulfato de sodio, estearato de magnesio, lactosa, povidona, Opadry YS1-7003 y laca aluminica	
FD&C azul N° 2	c.s.

INDICACIONES

Trastornos asociados con el reflujo gastroesofágico (pirosis, regurgitación). Esofagitis por reflujo. Síntomas digestivos asociados a gastritis crónica (ardor epigástrico, náuseas y/o vómitos). Distensión postprandial. Gastroparesia.

CARACTERISTICAS FARMACOLOGICAS

Acción farmacológica

Gastroprocinético. Estimulante de la motilidad gastrointestinal.

Mecanismo de acción

El mosapride, principio activo de INTESUL®, es un agonista selectivo del receptor 5-HT₄ a nivel del plexo nervioso gastrointestinal, cuya estimulación aumenta la liberación de acetilcolina, mejorando la motilidad gastrointestinal y el vaciamiento gástrico.

Farmacodinamia

El mosapride incrementa la motilidad gástrica y duodenal. A nivel experimental, el mosapride mejoró el vaciamiento gástrico de líquidos y sólidos en ratas y ratones. La droga incrementó, en perros en estado conciente, la motilidad gástrica y duodenal después de las comidas, mostrando un efecto menor sobre la motilidad colónica. En estudios clínico-farmacológicos en adultos sanos y en pacientes con gastritis crónica, la administración de 5 mg de mosapride mejoró el vaciamiento gástrico.

Farmacocinética

La concentración plasmática máxima (C_{máx}) de mosapride en adultos sanos después de una administración única de 5 mg en ayunas fue de 30,7 ng/ml. El tiempo para alcanzar la concentración máxima (T_{máx}) fue de 0,8 h y la vida media de eliminación de 2,0 h.

La ligadura proteica es del 99 % (*in vitro* en suero humano, en concentraciones de 1 µg/ml). El citrato de mosapride es principalmente metabolizado por el hígado, mediante el sistema del citocromo P450 (especialmente CYP3A4). El grupo 4-fluorobencilo es removido y ocurre una oxidación del anillo morfolino en posición 5 y una hidroxilación del anillo bencénico en posición 3. El principal metabolito del citrato de mosapride es el compuesto des-4-fluorobencilo.

El mosapride se excreta por orina y heces. Después de 48 horas de la administración de una dosis única de 5 mg de citrato de mosapride en ayunas, se encuentra en orina el 0,1 % de la droga sin cambios, en tanto que el 7 % es excretado como el principal metabolito (des-4-fluorobencilo).

POSOLOGIA Y MODO DE ADMINISTRACION

La dosis usual total diaria en adultos es de 15 mg, la cual se divide en 3 (tres) tomas orales (5 mg cada 8 horas), antes o después de las comidas. No se debe continuar el tratamiento con INTESUL® si no se consigue una mejoría de los síntomas gastrointestinales luego de la administración del producto durante 2 semanas consecutivas.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad conocida al principio activo.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

Interacciones con otros medicamentos

La administración conjunta de agentes anticolinérgicos (por ej.: sulfato de atropina, butilscopolamina), puede disminuir el efecto del mosapride.

Dado que el mosapride, acelera la evacuación gástrica, puede modificar la velocidad de absorción de algunas drogas. El mosapride es metabolizado por la enzima CYP3A4, por lo tanto aquellos agentes que inhiben esta enzima pueden disminuir su metabolismo (por ej.: ketoconazol, itraconazol, miconazol, fluconazol, eritromicina, claritromicina y troleandomicina). Se aconseja tener precaución cuando se empleen en forma concomitante estas drogas con INTESUL®, así como inhibidores de proteasas (ritonavir, indinavir y nefazodona).

Insuficiencia hepática y/o renal

La dosis inicial no debe exceder 2,5 mg, 3 veces al día, adaptándola posteriormente según la respuesta terapéutica (ver **Uso en ancianos**).

Parámetros Farmacocinéticos

T _{máx} (h)	C _{máx} (ng/ml)	T _{1/2} (h)
0,8	30,7	2,0



BETA

TECNOLOGIA
FARMACEUTICA
INNOVADORA

LABORATORIOS BETA S.A.
Av. San Juan 2266 (C1232AAR) - CABA.
Director Técnico: Daniel H. Ventura - Farmacéutico.
Especialidad Medicinal autorizada por el Ministerio
de Salud. Certificado N° 48.952.
Elaborado en Ruta 5 N° 3753 -
Parque Industrial - La Rioja.

255750-g

Uso en pediatría

La seguridad de la droga en pacientes pediátricos no ha sido establecida.

Uso en ancianos

Los pacientes ancianos pueden tener disminución de la función renal o hepática, por lo que se recomienda tener precaución cuando se emplee INTESUL® en este grupo etario. En tales casos puede ser suficiente una dosis de 2,5 mg, 3 veces al día.

Uso durante el embarazo, parto y lactancia

El uso de INTESUL® en mujeres embarazadas o con posibilidad de estarlo, es justificable sólo si el beneficio terapéutico esperado supera los potenciales riesgos asociados al tratamiento. La seguridad de esta droga en mujeres embarazadas no ha sido establecida.

En mujeres que amamantan, el uso de mosapride debe evitarse. Si la administración es necesaria, debería suspenderse la lactancia por el tiempo que dure el tratamiento.

Carcinogénesis

En estudios a largo plazo en roedores (104 semanas en ratas y 92 semanas en ratones), se observó un aumento en la incidencia de adenomas a nivel hepático o tiroideo (de células foliculares) cuando se administraron dosis entre 100 y 330 veces superiores (30 a 100 mg/kg/día) a las empleadas en humanos.

REACCIONES ADVERSAS

En un estudio clínico llevado a cabo en 998 pacientes, la incidencia de eventos adversos fue del 4 %. Las principales reacciones adversas fueron: heces blandas/diarrea (1,8 %), sequedad de boca (0,5 %) y malestar general (0,3 %).

Se observaron alteraciones en los análisis clínicos de laboratorio en 30 casos (3,8 %) de 792 pacientes tratados; ellos fueron: aumento de eosinófilos (1,1 %), triglicéridos (1,0 %) y enzimas hepáticas (GOT, GPT, fosfatasa alcalina y γ GTP 0,4 %).

SOBREDOSIFICACION

No se han reportado casos de intoxicación en humanos. Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital General de Niños "Dr. Ricardo Gutiérrez"
Tel.: (011) 4962-6666/2247.

Hospital General de Niños "Dr. Pedro de Elizalde"
Tel.: (011) 4300-2115 / 4362-6063.

Hospital Nacional "Prof. A. Posadas"
Tel.: (011) 4654-6648 / 4658-7777.

Hospital de Pediatría "Sor María Ludovica"
Tel.: (0221) 451-5555.

PRESENTACIONES

Envases con 30 y 60 comprimidos recubiertos.

CONDICIONES DE CONSERVACION Y ALMACENAMIENTO

Conservar en su envase original, a temperaturas inferiores a los 30 °C.

MANTENGA ESTE MEDICAMENTO FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

Ante cualquier duda consultar al 0-800-444-2382 (BETA).

Fecha de la última revisión: 08.00.

Eventos adversos	Incidencia $\geq 0,1\%$ < 5%
Gastrointestinales	Diarrea/heces blandas, sequedad de boca, dolor abdominal.
Hepáticos	Aumento de GOT, GPT, ALP, γ GTP.
Cardiovasculares	Palpitaciones.
Otros	Malestar general, eosinofilia, aumento de triglicéridos, mareo y embotamiento.