

BUPREX FLEX®

Ibuprofeno + Ticolchicósido
Comprimidos recubiertos

DESCRIPCIÓN DEL PRODUCTO

BUPREX FLEX combina la acción analgésica de un antiinflamatorio no esterooidal como el ibuprofeno y tiocolchicósido, un relajante muscular de acción central, indicado en procesos dolorosos musculo esqueléticos que se acompañan de contractura muscular.

COMPOSICIÓN

Cada comprimido contiene 600 mg de ibuprofeno y 4 mg de tiocolchicósido.

EXCIPIENTES: ácido esteárico, croscarmellosa sódica, dióxido de silicio coloidal, celulosa microcristalina y opadry AMB II blanco.

FARMACODINÁMICA

Ibuprofeno es un derivado del ácido propiónico que posee propiedades analgésicas, antiinflamatorias y antipiréticas.

Como todos los antiinflamatorios no esteroideos de la familia de los ácidos aril-propiónicos, el ibuprofeno inhibe la actividad de las enzimas COX-1 y COX-2. Los efectos antiinflamatorios del ibuprofeno son el resultado de la inhibición periférica de la síntesis de prostaglandinas subsiguiente a la inhibición de la ciclooxigenasa. El ibuprofeno inhibe la migración leucocitaria a las áreas inflamadas, impidiendo la liberación por los leucocitos de citoquinas y otras moléculas que actúan sobre los receptores nociceptivos. El efecto antipirético es consecuencia de la vasodilatación periférica debido a una acción central sobre el centro regulador de la temperatura del hipotálamo.

Ticolchicósido es un relajante muscular que inhibe las contracciones y que se utiliza en procesos reumáticos, traumatismos y para alivio de la hipertonia uterina.

Los datos experimentales demuestran que el tiocolchicósido actúa sobre el SNC como un agonista del neurotransmisor inhibitor GABA, al interaccionar, de forma altamente selectiva, con los receptores gabaminérgicos. También se ha evidenciado una afinidad elevada por los receptores glicinérgicos, sensibles a estriquina. La elevada actividad por los receptores gabaminérgicos y glicinérgicos y su acción agonista sobre los mismos, explican, razonablemente, su acción inhibitoria sobre el SNC que se manifiesta por una disminución del tono muscular, o sea, actúa como relajante muscular. Este mecanismo de acción es comparable al que ejerce el baclofeno, derivado lipófilo del GABA, que actúa como agonista selectivo de los receptores GABA (B) presinápticos y reduce los espasmos dolorosos flexores o extensores. En modelos experimentales y estudios con animales, se ha evidenciado que el tiocolchicósido posee actividad analgésica y antiinflamatoria.

INDICACIONES Y USO

Está indicado para el tratamiento de trastornos dolorosos musculoesqueléticos que se acompañan de contractura muscular, de origen traumático o no traumático, como: luxaciones, esguinces, lumbalgias, cialgias, desgarros musculares, tortícolis, síndrome cervical, etc.

ADMINISTRACIÓN Y DOSIS RECOMENDADAS

Para adultos se recomienda un comprimido recubierto cada 8 horas.

MODO DE ADMINISTRACIÓN

La vía de administración es por vía oral.

FARMACOCINÉTICA

El **ibuprofeno** se absorbe rápidamente en el tracto gastrointestinal. La concentración plasmática máxima es de 1 a 2 horas después de la administración oral. Tiene una vida media de eliminación de aproximadamente 2 horas. Se une a las proteínas en un 99 %; se metaboliza a nivel hepático, dando lugar a dos metabolitos inactivos que, junto con el ibuprofeno, se excretan por vía renal de forma rápida y completa, bien sea en forma inalterada o como metabolitos conjugados.

Luego de la administración oral de **tiocolchicósido** es completamente metabolizado a nivel intestinal, por lo tanto, no se detecta tiocolchicósido en el plasma, únicamente se observan: dos metabolitos: un metabolito farmacológicamente activo SL18.0740, con una actividad farmacológica similar a la de la molécula original y un metabolito inactivo SL59.0955. Para ambos, las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan 1 hora después de la administración del medicamento. La vida media es de 7.3 y 0.8 horas respectivamente. Posterior a la administración oral de tiocolchicósido, el 79 % de la dosis se elimina por las heces y un 20 % por la orina, exclusivamente como metabolitos.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al ibuprofeno o tiocolchicósido o a alguno de los excipientes, antecedentes de poliposis nasal, broncoespasmo, angiodema o rash cutáneo, inducidos por el uso de otros antiinflamatorios no esteroideos, úlcera péptica activa, insuficiencia hepática severa, insuficiencia renal severa, insuficiencia cardíaca severa, miastenia y glaucoma. Está contraindicado en pacientes con diagnóstico o antecedentes de enfermedad convulsiva, pacientes con lesión cerebral y pacientes con factores de riesgo o predisposición a desarrollar síndrome convulsivo. No debe utilizarse en embarazadas, mujeres en periodo de lactancia y menores de 18 años.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Al igual que todos los antiinflamatorios no esteroideos, debido al contenido de ibuprofeno, podría haber riesgo de úlcera péptica y sangrado gastrointestinal. Algunos pacientes presentan trastornos de la visión, escotomas y cambios en la percepción de colores. En estos casos discontinuar el tratamiento. Así mismo, puede observarse edema y retención de fluidos; por tanto, se aconseja usar ibuprofeno con precaución en pacientes con descompensación cardíaca o hipertensión. En pacientes con función renal alterada es conveniente reducir las dosis para evitar su acumulación. Ibuprofeno inhibe la agregación plaquetaria, aunque en menor intensidad y duración que la aspirina. Por otro lado, prolonga el tiempo de sangrado en sujetos normales; por esta razón, en pacientes con alteraciones de la hemostasia o bajo tratamiento anticoagulante, ibuprofeno debe utilizarse con máxima precaución.

El tiocolchicósido puede precipitar crisis epilépticas en pacientes con epilepsia o con riesgo de convulsiones. Estudios preclínicos de la molécula han demostrado que uno de los metabolitos del tiocolchicósido (SL59.0955 – metabolito M2) indujo aneuploidia (es decir, un número desigual de cromosomas en células en división), en concentraciones próximas a la exposición humana observada con dosis de 8 mg dos veces al día por vía oral. La aneuploidia se considera como un factor de riesgo de teratogenicidad, toxicidad embrio-fetal, aborto espontáneo y reducción de la fertilidad masculina, así como un posible factor de riesgo para cáncer. Como medida de precaución se debe evitar el uso de tiocolchicósido a dosis superiores a las recomendadas o un tratamiento prolongado.

Embarazo: hay datos limitados relativos al uso de tiocolchicósido en mujeres embarazadas, Por tanto, se desconoce el riesgo potencial para el embrión y el feto. Los estudios realizados en animales han mostrado efectos teratogénicos, por lo tanto, Buprex Flex está contraindicado

durante el embarazo y en mujeres en edad fértil que no estén utilizando métodos anticonceptivos adecuados.

Lactancia: debido a que el producto se excreta por la leche materna, está contraindicado en las madres durante el periodo de lactancia.

Pediatría: se recomienda no utilizar en menores de 18 años.

Geriatría: no se han demostrado diferencias farmacocinéticas con adultos de menor edad, sin embargo, se recomienda utilizar el medicamento con precaución.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas: el tiocolchicósido puede inducir somnolencia como un evento muy raro, por lo cual, es necesario tener en cuenta esta posibilidad cuando se conducen vehículos o se opera maquinaria pesada.

INTERACCIONES

ibuprofeno interacciona con la digoxina dando como resultado un incremento de sus niveles plasmáticos. Puede producir una disminución de la concentración sérica de los salicilatos, por lo que no es aconsejable utilizar ibuprofeno asociado a aspirina o similares puesto que el efecto antiinflamatorio final es menor. Ibuprofeno disminuye la acción diurética y antihipertensiva de diferentes medicamentos usados en el tratamiento de la hipertensión arterial.

Por el contenido de **tiocolchicósido** se ha establecido que dadas las propiedades de unión a las proteínas plasmáticas y a las células del compartimiento sanguíneo por parte del tiocolchicósido, se estima una baja probabilidad de presentar desplazamiento de sus sitios de unión por causa de interacciones con otros fármacos. A la fecha no se han publicado interacciones farmacológicas clínicamente significativas con otros fármacos cuando se utiliza a la dosis y tiempo de tratamiento recomendadas.

EFFECTOS ADVERSOS

El medicamento es muy bien tolerado. Entre los efectos adversos más reportados debido al ibuprofeno están los trastornos gastrointestinales, como: náusea, vómito, epigastralgia, dispepsia y pirosis. En forma ocasional se ha presentado mareo, vértigo, depresión, insomnio, rash, prurito, tinitus, alteraciones de la visión (visión borrosa, escotomas centellantes, etc.) y edema.

Debido al tiocolchicósido se han reportado con más frecuencia algunos efectos adversos como: cefalea, dispepsia, epigastralgia, pirosis, alteración en la consistencia de las heces y/o diarrea. Otros efectos adversos reportados con menor frecuencia son: reacciones de fotosensibilidad, reacciones alérgicas (eritema, rash, dermatitis, prurito, urticaria, angioedema, broncoespasmo y excepcionalmente shock anafiláctico), fotofobia, dolor abdominal, náusea, vómito, aumento de la salivación, estreñimiento, fasciculaciones, incontinencia urinaria y rubor facial.

Se ha reportado somnolencia, cansancio, insomnio y mareos, pero con una incidencia significativamente menor en comparación con otros relajantes musculares.

SOBREDOSIS

La mayor parte de casos de sobredosis con ibuprofeno han sido asintomáticos. Existe un riesgo de sintomatología con dosis mayores de 80 – 100 mg/kg del medicamento.

La aparición de síntomas de sobredosis se produce habitualmente en un plazo de 4 horas. Los síntomas de sobredosis pueden incluir dolor abdominal, náusea, vómito, así como trastornos del SNC, tales como cefalea, mareo y aturdimiento. Además de una caída en la presión arterial, se pueden producir trastornos funcionales de los riñones y pérdida de la conciencia. En raras ocasiones se ha reportado casos de nistagmus, acidosis metabólica, hipotermia, alteración de la función renal, hemorragia gastrointestinal. En casos de intoxicación grave se puede producir acidosis metabólica.

El tratamiento es sintomático y la administración de agua puede reducir las molestias gastrointestinales, el paciente debe acudir a un centro médico para su atención. No se han reportado síntomas de sobredosis en pacientes tratados con tiocolchicósido. Si se producen sobredosis se recomienda supervisión médica y tomar medidas de soporte sintomático.

VIDA ÚTIL

24 meses

CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:

Almacenar a temperatura menor a 30 °C, protegido de la luz y la humedad.

Mantener fuera del alcance de los niños.

PRESENTACIONES COMERCIALES

BUPREX FLEX caja por 10 comprimidos recubiertos y caja por 2 comprimidos.