

**INFORMACIÓN PARA PRESCRIBIR.  
0074-08 del 20 de Julio de 2017  
Rev. Junio 2018**

**DULCOLAX®**

**Bisacodilo**

Grageas

**Laxante**

No. 0074-08 del 20 de Julio de 2017
-------------------------------------

**COMPOSICIÓN:**

1 gragea contiene 5 mg de bisacodilo.

4,4'-diacetoxi-difenil-(piridil-2)-metano (=bisacodilo)

Excipientes\*\*:

Grageas: Monohidrato de lactosa, almidón seco de maíz soluble, glicerol, estearato de magnesio, sucrosa ( sacarosa), talco, acacia, dióxido de titanio, ácido metacrílico – metil copolímero metacrilato (1:1) y (E172), aceite de castor, macrofol 6000, óxido férrico amarillo, miel de abeja blanca, miel carnauba, shellac.

**INDICACIONES:**

Laxante.

**ADMINISTRACIÓN Y POSOLOGÍA:**

A menos que el médico prescriba otra dosis, las siguientes dosis son recomendadas:

Para el estreñimiento:

- Adultos: 1-2 grageas (5-10 mg) al día

Se recomienda iniciar con la dosis más baja. La dosis puede ajustarse hasta la dosis máxima recomendada para producir deposiciones regulares. La dosis máxima diaria no debe excederse

- Población pediátrica

Niños mayores de 10 años: 1-2 grageas (5-10 mg) al día

Se recomienda iniciar con la dosis más baja. La dosis puede ajustarse hasta la dosis máxima recomendada para producir deposiciones regulares. La dosis máxima diaria no debe excederse.

Niños de 4 a 10 años: 1 gragea (5 mg) al día

La dosis máxima diaria no debe excederse.

Los niños de 10 años o menores con estreñimiento crónico o persistente sólo deben ser tratados bajo la guía de un médico.

Las grageas deben tomarse por la noche para que se produzca una evacuación a la mañana siguiente. Deben ser deglutidas enteras, con líquido adecuado.

Las grageas no se deben tomar en conjunto con productos que reducen la acidez del tracto gastrointestinal superior, como leche, antiácidos o ciertos inhibidores de la bomba de protones, en el orden de no disolver prematuramente la gragea.

Para la preparación de procedimientos diagnósticos y uso preoperatorio:

Para la preparación de procedimientos diagnósticos, en tratamiento pre y post-operatorio y en condiciones médicas las cuales requieren defecación para facilitarlas, Dulcolax® debe ser usado bajo supervisión médica.

Población pediátrica

En los niños de 4 años y mayores se recomienda una gragea por la noche.

### **CONTRAINDICACIONES:**

Dulcolax® está contraindicado en pacientes con íleo, obstrucción intestinal, cuadros abdominales quirúrgicos agudos como apendicitis aguda, enfermedades inflamatorias agudas del intestino, dolor abdominal severo asociado con náusea y vómito el cual puede ser indicativo de condiciones clínicas severas.

Dulcolax® está también contraindicado en deshidratación severa y en pacientes con hipersensibilidad conocida al bisacodilo u otro componente del medicamento.

En caso de condiciones hereditarias raras que puedan ser incompatibles con un excipiente del producto (por favor referirse a PRECAUCIONES ESPECIALES Y ADVERTENCIAS) el uso de este medicamento está contraindicado.

Niños menores de 4 años de edad.

Primer trimestre de embarazo.

Igual que todos los laxantes, Dulcolax® no debe tomarse con continuidad diariamente o durante extensos períodos, sin investigar la causa del estreñimiento. El uso excesivo prolongado puede producir un desequilibrio de los electrolitos e hipocalcemia.

#### **ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES ESPECIALES:**

La pérdida intestinal de líquidos puede promover la deshidratación. Los síntomas pueden incluir: sed y oliguria. En los pacientes que sufren de pérdida de líquidos en los que la deshidratación puede ser perjudicial (por ejemplo, insuficiencia renal, pacientes de edad avanzada) Dulcolax® deberá ser interrumpido y sólo se reiniciará bajo supervisión médica.

Los laxantes estimulantes incluyendo DULCOLAX® no ayudan con la pérdida de peso (ver Sección Propiedades farmacológicas)

Los pacientes pueden experimentar hematoquecia (sangre en las heces) que suele ser leve y autolimitado.

Mareo y síncope han sido reportados en pacientes tomando Dulcolax®. Los datos disponibles de estos casos sugieren que puede tratarse de síncope con la defecación (o síncope atribuible al esfuerzo de la defecación) o de una respuesta vasovagal a un dolor abdominal el cual se relaciona con el estreñimiento y no necesariamente a la administración de bisacodilo por sí mismo.

Una gragea contiene 33.2 mg de lactosa, resultando en 66.4 mg lactosa para una dosis máxima diariamente recomendada para el tratamiento de estreñimiento en adultos y niños mayores de 10 años. Para exámenes radiográficos esto resultará en 132.8 mg para dosis

máxima recomendada diaria en adultos. Pacientes con condiciones hereditarias raras de intolerancia a la galactosa, ej. galactosemia, no deben consumir este medicamento.

Una gragea contiene 23.4 mg de sucrosa (sacarosa), resultando en 46.8 mg de sucrosa (sacarosa) para una dosis máxima recomendada diaria para el tratamiento del estreñimiento en adultos y niños mayores de 10 años. Para exámenes radiológicos esto resultará en una dosis de 93.6 mg para una dosis máxima recomendada diaria en adultos. Pacientes con condiciones hereditarias raras de intolerancia a la fructuosa, no deben consumir este medicamento.

El bisacodilo se debe utilizar durante cortos períodos de tiempo, debido a que su uso continuado puede provocar dependencia o habituación.

Se debe diagnosticar antes del tratamiento la causa del estreñimiento, descartando la posibilidad de obstrucciones del tracto gastrointestinal.

En pacientes con sintomatología de apendicitis (náuseas, vómitos o calambres abdominales), se recomienda descartar la presencia de apendicitis y, si se diagnosticase, no se debería utilizar un laxante.

En pacientes ancianos o debilitados, se recomienda monitorizar periódicamente los niveles de electrolitos.

Este medicamento puede producir molestias de estómago y diarrea porque contiene aceite de ricino.

**INTERACCIONES:**

El uso concomitante de diuréticos o adrenocorticoesteroides puede aumentar el riesgo de desequilibrio electrolítico cuando se toman dosis excesivas de Dulcolax®.

El uso concomitante de otros laxantes puede aumentar los efectos secundarios gastrointestinales de Dulcolax®.

Un desequilibrio de los electrolitos puede dar lugar a una sensibilidad aumentada a los glucósidos cardíacos.

Puede elevar los niveles de glucosa en sangre, por lo que debe tenerse en cuenta en pacientes diabéticos.

Puede interferir con los resultados de las pruebas analíticas, debido a que el uso prolongado de laxantes puede dar lugar a una hipopotasemia.

**FERTILIDAD EMBARAZO Y LACTANCIA:**Embarazo

No existen estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas.

No existen datos suficientes sobre la utilización de bisacodilo en mujeres embarazadas. Se encuentra contraindicado en el primer trimestre de embarazo. Se desconocen los posibles efectos del bisacodilo sobre el feto, por lo que el bisacodilo no debe ser administrado durante el embarazo, excepto cuando el médico estime que los beneficios superen los posibles riesgos, debido a que el bisacodilo se absorbe en pequeña cantidad.

### Lactancia

La evidencia disponible no es concluyente o es inadecuada para determinar el riesgo infantil cuando se usa durante la lactancia. Considere los posibles beneficios del tratamiento farmacológico contra los posibles riesgos antes de recetar este medicamento durante la lactancia.

### Fertilidad

No se han realizado estudios para evaluar su efecto sobre la fertilidad humana.

## **EFFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD PARA CONDUCIR Y OPERAR MÁQUINAS:**

No se han realizado estudios sobre los efectos de Dulcolax<sup>®</sup> en la capacidad para conducir y utilizar máquinas.

Sin embargo, los pacientes deben ser advertidos de que debido a una respuesta vasovagal (por ejemplo, a un espasmo abdominal) pueden experimentar mareos y / o síncope. Si los pacientes experimentan espasmos abdominales, deben evitar tareas potencialmente peligrosas como conducir o manejar maquinaria.

## **EFFECTOS SECUNDARIOS:**

Las reacciones adversas más frecuentemente reportadas durante el tratamiento son dolor abdominal y diarrea.

### Desórdenes del sistema inmune

Reacciones anafilácticas, angioedema, Hipersensibilidad.

### Desórdenes del metabolismo y la nutrición

Deshidratación.

### Desórdenes del sistema nervioso

Mareo, síncope.

Mareos y síncope que ocurren después de tomar bisacodilo parecen ser compatibles con una respuesta vasovagal (por ejemplo, a espasmos abdominales, defecación).

### Desórdenes gastrointestinales

Calambres abdominales, dolor abdominal, diarrea, vómito, náusea, hematoquecia (sangre en las heces), malestar abdominal, malestar anorrectal, colitis, incluyendo colitis isquémica.

## **SOBREDOSIFICACIÓN:**

Síntomas: Si se ingieren altas dosis, pueden presentarse deposiciones acuosas (diarrea), cólicos abdominales y una pérdida clínicamente significativa de fluidos, potasio y otros electrolitos.

DULCOLAX®, como ocurre con otros laxantes, cuando se ingieren crónicamente pueden causar diarrea crónica, dolor abdominal, hipopotasemia, hiperaldosteronismo secundario y cálculos renales. Con el abuso crónico de laxantes también han sido descritos daño renal tubular, alcalosis metabólica y debilidad muscular secundaria a hipopotasemia.

Tratamiento: Después de la administración oral de Dulcolax®, la absorción puede minimizarse o prevenirse induciendo vómito o realizando lavado gástrico. Puede ser necesaria la sustitución de líquidos y la corrección del desequilibrio de electrolitos. Esto es

especialmente importante en las personas de edad y en los niños. La administración de antiespasmódicos puede ser útil.

**PROPIEDADES:**

ATC: A06AB02

El bisacodilo es un laxante de acción local del grupo de los derivados del difenilmetano. Como un laxante de contacto también hidragogo antiresortivo, y efectos del bisacodilo han sido descritos estimulando después de su hidrólisis en el intestino grueso, el peristaltismo del colon y promueve la acumulación de agua y electrolitos en la luz del colon. Estos resultados se ven en una estimulación de la defecación, reducción del tiempo del tránsito, y la suavidad de las heces.

Como un laxante que actúa sobre el colon, bisacodilo estimula específicamente el proceso de evacuación natural en la región inferior del tracto gastrointestinal. Por lo tanto, bisacodilo es ineficaz en la alteración de la digestión o absorción de calorías y nutrientes esenciales en el intestino delgado.

**FARMACOCINÉTICA:**

Luego de la administración oral, bisacodilo se hidroliza rápidamente en el principio activo bis-(p-hidroxifenil) - piridil -2- metano (BHPM) principalmente por las esterasas de la mucosa intestinal.

La administración de un comprimido de cubierta entérica genera como resultado concentraciones plasmáticas máximas de BHPM entre 4 - 10 horas posteriores a la administración mientras que el efecto laxante se produjo entre el 6 - 12 horas posteriores a la administración. Los comprimidos recubiertos de bisacodilo son formulados para ser

resistentes a los jugos gástricos del intestino delgado. Esto resulta en una liberación mayor del fármaco en el colon, que es el lugar de acción deseado.

Tras la administración oral, sólo pequeñas cantidades del fármaco son absorbidas y casi completamente conjugado en la pared intestinal y el hígado para formar el glucurónido inactivo BHPM. La vida media de eliminación del glucurónido BHPM se estimó en aproximadamente 16,5 horas. Tras la administración de bisacodilo comprimidos recubiertos con película, un promedio de 51,8% de la dosis se recuperó en las heces en forma de BHPM libre y un promedio de 10,5% de la dosis se recuperó en la orina como glucurónido BHPM. Después de la administración como un supositorio, un promedio de 3,1% de la dosis se recuperó como BHPM glucurónido en la orina. Heces contenían gran cantidad de BHPM (90% de la excreción total), además de pequeñas cantidades de bisacodilo intacto.

### **TOXICOLOGÍA:**

La toxicidad aguda de bisacodilo en roedores y no roedores es baja y excedió 2 g/kg. Perros toleraron niveles de hasta 15g /kg. Los signos clínicos de toxicidad aguda más importantes fueron diarrea, disminución de la actividad motora y piloerección.

Los estudios de toxicidad con dosis repetidas hasta 26 semanas fueron realizadas en ratas, minicerdos (*minipigs*) y monos resus. Como se esperaba, el medicamento causó diarrea severa dosis dependiente en todas las especies (excepto en minicerdos). No hubo cambios histopatológicos y, en particular, no nefrotoxicidad relacionada con el medicamento. Bisacodilo indujo lesiones proliferativas en la vejiga urinaria de ratas tratadas por 32 semanas. Estas lesiones proliferativas

no son atribuibles a bisacodilo per se. Los cambios morfológicos son considerados como secundarios a la formación de microcálculos debido a los cambios en los electrolitos urinarios y por eso no tienen relevancia para los humanos.

Datos de una amplia serie de sistemas de prueba de mutagenicidad en bacterias y mamíferos no mostró potencial genotóxico en el bisacodilo. El bisacodilo tampoco causó un aumento significativo en la transformación morfológica de células embrionarias de hamsters sirios (SHE). En contraste con el laxante genotóxico y carcinogénico fenofaleina, el bisacodilo no muestra potencial mutagénico en las pruebas apropiadas.

Para el bisacodilo no se encuentran disponibles estudios convencionales (vida real) de carcinogenicidad (estudios de por vida). Por la similitud terapéutica con la fenofaleina, el bisacodilo fue investigado en el modelo de ratones transgénicos p53 durante 26 semanas. No se observó ninguna neoplasia relacionada con el tratamiento hasta dosis orales de 8000 mg /kg /día.

No se observaron efectos teratogénicos en ratas y conejos. Las dosis de hasta 1000 mg /kg excedieron niveles terapéuticos en hasta 1000 veces.

#### **PRESENTACIONES COMERCIALES:**

Grageas de 5mg, caja x 10, 20, 30 y 50.

Registro sanitario No. INVIMA 2008 M-001357-R3

**CONDICIÓN DE VENTA:**

Venta sin Fórmula Facultativa.

**ALMACENAMIENTO:**

Almacenar a temperatura inferior a 30°C en el envase y empaque aprobado en el ítem presentaciones comerciales.