

SUCRAFILM®
sucralfato

EMS Sigma Pharma Ltda

Comprimido Mastigável 1 g
Suspensão Oral 200 mg/mL

I – IDENTIFICAÇÃO DO MEDICAMENTO

SUCRAFILM®

sucralfato

APRESENTAÇÕES

Sucrafilm® comprimido mastigável 1 g: Embalagens contendo 4, 30, ou 40 comprimidos mastigáveis.

Sucrafilm® suspensão oral 200mg/ml: Embalagens contendo 4 flaconetes com 5 mL, 20 flaconetes com 10 mL ou 40 flaconetes com 5 mL.

USO ORAL

USO ADULTO E PEDIÁTRICO

COMPOSIÇÃO

Cada comprimido mastigável de Sucrafilm® contém:

sucralfato.....1,0 g

excipiente* q.s.p1 com. mast.

*talco, aspartamo, lactose monoidratada, óleo vegetal hidrogenado, essência de hortelã, dióxido de silício, estearato de magnésio, sorbitol.

Cada mL de Sucrafilm® suspensão oral contém:

sucralfato200 mg

veículo* q.s.p1 mL

* sorbitol, digliconato de clorexidina, simeticona, glicerol, citrato de sódio di-hidratado, hidróxido de sódio, essência de hortelã, sacarina sódica, água purificada.

II - INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

1. INDICAÇÕES

Este medicamento é destinado ao tratamento da úlcera duodenal, úlcera gástrica e gastrite crônica. **Sucrafilm®** tem efeito citoprotetor devido à sua característica polianiónica. O sucralfato liga-se às proteínas de cargas positivas através da formação de um gel que adere à mucosa gástrica e duodenal, proporcionando uma proteção uniforme contra o ataque ácido, a pepsina e os sais biliares.

2. RESULTADOS DE EFICÁCIA

Em artigo de revisão sobre o uso do sucralfato foi concluído que a substância é uma escolha eficaz e confiável em doenças ácido-pépticas e lesões de mucosa do trato gastrointestinal.

Em outro estudo com dados de mais de 2000 pacientes, foi concluído que o sucralfato é eficaz na cicatrização de úlceras, bem tolerado e livre de efeitos colaterais sérios.

Referência:

1- Candelli M, Carloni E, Armuzzi A, Cammarota G, Ojetto V, Pignataro G, et al. Role of sucralfate in gastrointestinal diseases. Panminerva Med. 2000 Mar;42(1):55-9.

2- Fisher RS. Sucralfate: a review of drug tolerance and safety. J Clin Gastroenterol. 1981;3(Suppl 2):181-4.

3. CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

O complexo sucralfato formado pelo octossulfato de sacarose e hidróxido de polialumínio tem uma unidade primária que pode ser representada como $C_{12}H_6O_{11}[SO_3-Al_2(OH)_5]^8 \cdot NH_2O$. É, portanto, o sal de hidróxido de alumínio e da sacarose sulfatada.

Quando o pH está abaixo de 4, há substancial polimerização e ligação cruzada de sucralfato para formar um gel pegajoso, viscoso, branco-amarelado. A reação continuada com o ácido gradualmente consome $Al_2(OH)_5^+$ até que algumas frações de octossulfato de sacarose estejam totalmente livres de Al_3 . Muito embora o pH no duodeno seja muito acima de 4, o gel mantém suas propriedades viscosas e demulcentes.

A ação terapêutica do sucralfato é exclusivamente local. Isto decorre da natureza polianiónica de sua molécula, formando complexos com as proteínas de carga positiva, presente em altas concentrações nas lesões mucosas. A adesividade viscosa deste complexo no pH ácido propicia uma barreira protetora sobre a lesão ulcerosa, proporcionando proteção uniforme às mucosas gástrica e duodenal, contra penetração e ação do ácido gástrico, pepsina e bile. O sucralfato liga-se à mucosa lesionada com maior afinidade (seis vezes) que à mucosa gastrointestinal normal. O sucralfato também inibe diretamente a atividade da pepsina e absorve os sais biliares. Não altera o período de esvaziamento gástrico, nem a função digestiva normal pela sua fraca atividade antiácida. O sucralfato apresenta pouco efeito sobre a coagulação sanguínea.

Terapia com sucralfato:

A camada de muco que reveste a mucosa gástrica e duodenal, tamponada pelo bicarbonato secretado nesta camada pelas células epiteliais subjacentes, fornece a defesa citoprotetora primária contra a digestão péptica induzida por ácido. A camada de muco retarda a difusão para dentro tanto de H^+ quanto de proteínas grandes, excluindo efetivamente a pepsina e protegendo contra a erosão ácida. A erosão da mucosa e a ulcerção característica de doenças pépticas resultam da hidrólise mediada por pepsina das proteínas da mucosa.

A observação de que os polissacarídeos sulfatados inibem a hidrólise de proteínas mediadas por pepsina foi o ponto-chave para o desenvolvimento de agentes citoprotetores que mimetizariam este efeito. Outros estudos demonstraram que a magnitude da sulfatação, e não o peso molecular do polímero de polissacarídio, era crítica. Observou-se que o octossulfato de sacarose inibia a hidrólise péptica in vitro. A reação do octossulfato de sacarose com $Al(OH)_3$ forma uma substância viscosa, o sucralfato, que é um complexo de hidróxido de alumínio e sacarose sulfatada, insolúvel em água e tem uma fraca ação tamponadora. O sucralfato mostrou, em estudos duplo-cegos, promover a cicatrização de úlceras avaliadas endoscopicamente. O sucralfato atua revestindo a superfície da úlcera, ligando-se às moléculas protéicas positivamente carregadas expostas na base da úlcera. O sucralfato também liga sais biliares, que estão comprometidos com a patogenia de úlceras gástricas, proporcionando assim outro meio pelo qual o sucralfato teria utilidade terapêutica. O sucralfato não apresenta aderência tão boa à mucosa normal. A afinidade do sucralfato à mucosa lesionada é seis vezes maior que à mucosa gastrointestinal normal. Estudos in vitro indicam que o sucralfato pode inibir a ação da pepsina e impedir a difusão dos íons de hidrogênio. Também estimula a secreção de muco e bicarbonato e a produção de

prostaglandina PgE₂ e PgI₂ que protegem as células profundas da mucosa da lesão necrótica experimental, e alguns estudos sugerem que a deficiência na produção de prostaglandinas pode contribuir para a formação de úlcera. A PgE₂ e a PgI₂ também possuem um efeito inibitório sobre a secreção de ácido gástrico.

Em síntese, a terapia com sucralfato tem como finalidade, e baseada em inúmeros trabalhos científicos, acelerar a cicatrização de lesões esofágicas gástricas e duodenais, além de reduzir a incidência de úlceras secundárias ao uso de anti-inflamatórios e úlceras de estresse. A multiplicidade de propriedades do sucralfato reflete as múltiplas ações da medicação:

- Ação antipéptica e adsorção de sais biliares;
- Promoção da secreção de bicarbonato de sódio;
- Aumento da resistência da mucosa pela promoção da secreção de muco e mudanças em seus componentes;
- Estimulação da secreção de prostaglandina;
- Promoção da integridade do vasos sanguíneos e aumento do fluxo sanguíneo;
- Promoção da regeneração epitelial por meio da proteção e da estimulação da zona proliferativa da mucosa;
- Estimulação de fatores de crescimento, como, por exemplo, o fator de crescimento epidérmico.

Farmacologia:

O sucralfato adere às células epiteliais e muito fortemente à base das crateras das úlceras, tornando difícil lavar o gel da cratera. Em seres humanos, o gel continua a aderir ao epitélio ulcerado por mais de 6 horas. Ele adere mais às úlceras duodenais do que às gástricas. Acredita-se que essa ligação às crateras das úlceras é a principal ação terapêutica do sucralfato. Os antiácidos e os alimentos não parecem afetar a integridade do gel aderente. As proteínas nos alimentos são adsorvidas pela sua superfície, portanto, adicionam uma camada citoprotetora.

Inúmeros mecanismos já foram propostos para explicar os efeitos citoprotetores e cicatrizantes do sucralfato, incluindo a estimulação da síntese de prostaglandina, adsorção de pepsina e estimulação da produção local de fator de crescimento epidérmico.

Farmacocinética

Sucralfato é pouco absorvido no trato gastrintestinal (3% a 5%) após a sua administração oral, não havendo relatos de efeitos sistêmicos. Entretanto, pode ocorrer alguma liberação de íons de alumínio e sulfato de sacarose. O sulfato de sacarose pode ser absorvido e excretado, principalmente pela urina. Alguns íons de alumínio podem também ser absorvidos.

A atividade da pepsina no suco gástrico é reduzida em 32% nos pacientes que recebem sucralfato à medida em que absorve sais biliares no duodeno. Há indícios de que sua ação protetora da mucosa gástrica deva-se também ao aumento da concentração da prostaglandina muco protetora (PgE₂).

Uso clínico:

O sucralfato (1 g, uma hora antes de cada refeição e ao deitar, por 4 a 8 semanas) promove a cicatrização de úlceras gástricas e duodenais tão eficazmente quanto os antagonistas dos receptores H₂. Como terapia de manutenção, o sucralfato parece ser mais eficaz na doença de úlcera duodenal do que na gástrica.

Sucrafilm® 2 comprimidos mastigáveis de 1 g, uma hora antes das principais refeições ou ao deitar, promove citoproteção da mucosa gástrica e duodenal contra hiperacidez.

O sucralfato (1 g, duas vezes ao dia) foi aprovado nos EUA para terapia de manutenção de úlcera duodenal. O sucralfato também pode ser usado para evitar úlcera de estresse. As taxas de cicatrização e o período de tempo necessário para se obter o alívio da dor com sucralfato em geral são melhores que com os antagonistas dos receptores H₂. Como a preparação é ativada por ácido, o sucralfato é mais eficaz quando administrado antes das refeições. Pela mesma lógica, o sucralfato não deve ser administrado nos 30 minutos seguintes à administração de antiácidos.

Sucrafilm® 1 flaconete de 2 g, uma hora antes das principais refeições ou ao deitar, promove citoproteção da mucosa gástrica e duodenal contra hiperacidez.

O sucralfato também pode ser usado para evitar úlcera de estresse. As taxas de cicatrização e o período de tempo necessário para se obter o alívio da dor com sucralfato em geral são melhores que com os antagonistas dos receptores H₂. Como a preparação é ativada por ácido, o sucralfato é mais eficaz quando administrado antes das refeições. Pela mesma lógica, o sucralfato não deve ser administrado nos 30 minutos seguintes à administração de antiácidos.

4. CONTRA-INDICAÇÕES

Sucrafilm® é contra-indicado para os casos de pacientes que apresentam hipersensibilidade ao sucralfato e aos demais componentes da formulação.

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

5. ADVERTÊNCIAS E PRECAUÇÕES

A úlcera péptica é uma doença crônica recorrente. Não se deve esperar que o sucesso numa série de tratamento com sucralfato altere a freqüência ou a severidade da doença, após a cicatrização.

Após a administração de sucralfato (via oral), pequena quantidade de alumínio é absorvida pelo trato gastrintestinal. Administração concomitante com outros produtos que contenham alumínio (por exemplo antiácidos) pode aumentar o nível de alumínio no organismo. Em pacientes com função renal normal recebendo estes agentes concomitantes, o alumínio é excretado pela urina. No entanto, os pacientes com disfunção renal e nos que fazem diálise, apresentam deficiência de excreção do alumínio, podendo ocorrer um acúmulo e intoxicação por alumínio (osteodistrofia alumínica, osteomalácia, encefalopatia).

Comprimido mastigável de Sucrafilm® contém aspartamo.

Atenção Fenilcetonúricos: Sucrafilm® comprimido mastigável contém fenilalanina.

Agite antes de usar Sucrafilm® suspensão oral.

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

6. INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS

Os estudos laboratoriais indicam que o sucralfato consegue adsorver e, portanto, reduzir a biodisponibilidade de vários fármacos, incluindo a tetraciclina, sulpirida, fenitoína, cimetidina, ranitidina, cetoconazol, ciprofloxacino, norfloxacino, ofloxacino e fluorquinolonas em estudos animais, e com digoxina e teofilina em estudos com seres humanos. As interações podem ser minimizadas pela administração de outras medicações duas horas antes da administração de sucralfato.

O sucralfato pode prejudicar a absorção de varfarina, por isso deve-se ter cautela com a administração concomitante.

O sucralfato pode reduzir os efeitos dos anticoagulantes orais.

7. CUIDADOS DE ARMAZENAMENTO DO MEDICAMENTO

Manter à temperatura ambiente (15°C a 30°C). Proteger da luz e manter em lugar seco.
Este medicamento tem validade de 24 meses a partir da data de sua 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.

Comprimido mastigável: comprimido na cor branca, circular, de faces planas e bordas chanfradas, com odor e sabor de hortelã.

Suspensão oral: suspensão na cor branca, com sabor e odor de hortelã, isenta de partículas e material estranho.

Antes de usar, observe o aspecto do medicamento.

Todo medicamento deve ser mantido fora do alcance das crianças.

8. POSOLOGIA E MODO DE USAR

ADULTOS

Antiulceroso:

A dose oral recomendada é de:

- Comprimido mastigável: 1 comprimido mastigável de 1g quatro vezes ao dia ou 2 comprimidos mastigáveis de 1g duas vezes ao dia, com o estômago vazio, uma hora antes ou duas horas após as refeições ou ao deitar.
- Flaconete: 1 flaconete duas vezes ao dia, com o estômago vazio, uma hora antes ou duas horas após as refeições ou ao deitar.

Citoprotetor da mucosa gástrica:

A dose oral recomendada é 2 comprimidos mastigáveis de 1g uma hora antes das principais refeições ou ao deitar, para promover a citoproteção da mucosa gástrica e duodenal contra hiperacidez.

A dose oral recomendada é de 1 flaconete de 2g uma hora antes das principais refeições ou ao deitar, para promover a citoproteção da mucosa gástrica e duodenal contra hiperacidez.

Terapia de manutenção:

A dose recomendada para manutenção é de 1g duas vezes ao dia.

Doses de 250 mg três vezes ao dia e 500 mg à noite, por nove meses, têm sido efetivas na prevenção da recorrência da úlcera.

Instruções de uso:

Antácidos podem ser prescritos nos primeiros dias de tratamento, conforme necessário, para alívio da dor, porém não devem ser tomados dentro de meia hora antes ou após o sucralfato.

Embora a cicatrização com o sucralfato possa ocorrer na primeira ou segunda semana, o tratamento deve ser continuado por pelo menos 6 semanas, a não ser que a cicatrização tenha sido demonstrada por raio X ou exame endoscópico. Nos casos resistentes podem ser necessárias até 12 semanas.

Insuficiência renal:

Não é necessário ajuste de dosagem na insuficiência renal, uma vez que o sucralfato não é significativamente absorvido. No entanto, a absorção de alumínio tem sido reportada em pacientes com uremia. Em pacientes com excreção prejudicada o risco de acumulação de alumínio e toxicidade são aumentados. Portanto, o sucralfato deve ser usado com precaução em pacientes com insuficiência renal crônica.

Ajuste de dosagem durante diálise: O ajuste de dosagem não é necessário durante a diálise, desde que a ação do sucralfato não dependa de níveis sistêmicos do fármaco. Absorção tem sido relatada em pacientes com uremia. O alumínio é ligado à proteína plasmática e à transferrina plasmática, portanto não atravessa prontamente a membrana de diálise. Caso a excreção do alumínio absorvido seja prejudicada em pacientes submetidos à diálise, o risco de acúmulo de alumínio e toxicidade aumentam. Portanto, o uso de sucralfato em pacientes dialisados requer cuidados.

Insuficiência hepática:

Não é necessário ajuste de doses, uma vez que o sucralfato não é significativamente absorvido.

Pacientes Geriátricos:

Não é necessário o ajuste de doses para pacientes idosos.

CRIANÇAS

Dosagem pediátrica:

Em triagens clínicas o sucralfato tem sido usado no tratamento de úlceras duodenais crônicas e esofagites de refluxo. A dose para tratamento de esofagite é 0,5 g quatro vezes ao dia para pacientes com menos de 6 anos, e 1 g quatro vezes ao dia para pacientes com mais de 6 anos. Para o tratamento de úlcera duodenal a dosagem é de 1 g quatro vezes ao dia para crianças de todas as idades. Pesquisadores informam que ajustes de dosagem para idade ou peso não são necessárias porque o sucralfato não é significativamente absorvido.

Terapia de manutenção:

A dose de manutenção é de 1 g uma vez por noite, que deve ser administrada às crianças com idade entre 1 e 10 anos para o tratamento de úlcera duodenal crônica.

9. REAÇÕES ADVERSAS

Reações adversas/ colaterais e alterações de exames laboratoriais:

Em experiências clínicas, as reações adversas ao sucralfato foram mínimas e raramente levaram a interrupção da droga. Em estudos envolvendo mais de 2.500 pacientes tratados com sucralfato, foram relatados efeitos adversos em 4,7 %, sendo o mais comum a constipação intestinal (2,2%).

Efeitos colaterais

A incidência e a gravidade dos efeitos colaterais do sucralfato são muito baixas. Apenas a constipação devida ao Al₃⁺ (em 2% dos casos) e uma sensação de boca seca (< 1%) parecem significativas. Ocassionalmente, entretanto, pacientes se queixam de desconforto abdominal. Os efeitos no metabolismo de fosfato e no Al₃⁺ plasmático são similares aos já descritos para o Al(OH)₃.

Em casos de eventos adversos, notifique ao Sistema de Notificações em Vigilância Sanitária - NOTIVISA, disponível em <http://www.anvisa.gov.br/hotsite/notivisa/index.htm>, ou para a Vigilância Sanitária Estadual ou Municipal.

10. SUPERDOSE

O risco associado à superdosagem do medicamento é mínimo. O tratamento deve ser sintomático.

Em caso de intoxicação ligue para 0800 722 6001, se você precisar de mais orientações sobre como proceder.

III – DIZERES LEGAIS

Registro MS - 1.3569.0617

Farm. Resp.: Dr. Adriano Pinheiro Coelho – CRF-SP 22.883

Registrado por: EMS SIGMA PHARMA LTDA.

Rod. Jornalista Francisco Aguirre Proença, KM 08

Bairro Chácara Assay

CEP 13186-901, Hortolândia – SP

CNPJ: 00.923.140/0001-31

INDÚSTRIA BRASILEIRA

Fabricado por: EMS S/A

Hortolândia - SP

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

SAC 0800-191222



Histórico de alteração para a bula

Dados da submissão eletrônica			Dados da petição/notificação que altera bula				Dados das alterações de bulas		
Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data do expediente	Nº do expediente	Assunto	Data de aprovação	Itens de bula	Versões (VP/VPS)	Apresentações relacionadas
18/06/2014	N/A	(10458) MEDICAMENTO NOVO - Inclusão Inicial de Texto de Bula – RDC 60/12	N/A	N/A	N/A	N/A	Submissão eletrônica apenas para disponibilização do Texto de Bula no Bulário Eletrônico da ANVISA	VP / VPS	Comprimido Mastigável Embalagens contendo 4, 30, ou 40 comprimidos mastigáveis Suspensão Oral Embalagens contendo 4 flaconetes com 5 mL, 20 flaconetes com 10 mL ou 40 flaconetes com 5 mL.