



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO (DCI)

COLESTIRAMINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Agentes modificadores de los lípidos, monoterapia.

Código ATC: C10AC.01

3.1. Farmacodinamia

La colestiramina es una resina de intercambio iónico derivada de un copolímero de estireno y divinilbenceno con actividad hipolipémica. Tras su administración por vía oral libera iones cloruro y adsorbe ácidos biliares en el intestino formando complejos no absorbibles que se excretan con las heces. El "secuestro" y remoción de los ácidos biliares del intestino genera un aumento compensatorio de la conversión en el hígado (vía oxidación) de colesterol en ácidos biliares dando lugar con ello a un incremento de la captación hepática de lipoproteínas de baja densidad (LDL) circulantes y a la consecuente reducción de sus niveles séricos y del colesterol total.

Adicionalmente, en pacientes con obstrucción biliar parcial la reducción de los niveles séricos de ácidos biliares disminuye el prurito causado por el depósito de éstos en el tejido dérmico.

La respuesta hipocolesterolemica, por lo general, es apreciable antes de los 7 días de iniciada la terapia y alcanza su máximo en 1-3 semanas. En algunos pacientes los niveles de triglicéridos podrían aumentar. En pacientes con prurito asociado a colestasis se observa el alivio de la condición en 1-3 semanas.

3.2. Farmacocinética

La colestiramina no se absorbe sistémicamente. Se elimina por completo con las heces como colestiramina intacta o acoplada con ácidos biliares.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

No existen ensayos que evalúen el potencial carcinogénico, mutagénico o teratogénico de la colestiramina, ni sus efectos sobre la fertilidad.

4. INDICACIONES

- Tratamiento de la hipercolesterolemia primaria tipo II (clasificación Fredrickson) en pacientes que no responden adecuadamente a medidas dietéticas.
- Alivio del prurito asociado a obstrucción parcial de las vías biliares.





5. POSOLOGÍA

La dosis para ambas indicaciones es la misma.

5.1. Dosis

Polvo para suspensión oral en sobres con 4 g de colestiramina:

Adultos: Un (1) sobre (4 g) 2-6 veces al día.

Se recomienda iniciar con una dosis de 4 g 1 ó 2 veces al día, seguida por incrementos graduales basados en la respuesta clínica y tolerancia individual de cada paciente, sin exceder los 24 g/día. En la mayoría de los casos se logra la respuesta deseada con dosis diarias de 8-16 g.

5.2. Dosis máxima diaria

Adultos: 24 g/día.

5.3. Dosis en pacientes especiales

Insuficiencia renal: No se requieren ajustes de dosificación

Insuficiencia hepática: No se requieren ajustes de dosificación

Ancianos: No se requieren ajustes de dosificación

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Polvo para suspensión oral:

Añadir el contenido de un sobre a un vaso con agua, leche, jugo de frutas o alguna otra bebida no carbonatada (150-180 ml); mezclar bien hasta obtener una suspensión uniforme y beber de inmediato. Se puede administrar antes o durante alguna comida.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante el uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos del sistema sanguíneo y linfático

Frecuencia no conocida: Hipoprotrombinemia, hemorragias





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

Trastornos gastrointestinales

Muy frecuentes: Constipación

Frecuentes: Náuseas, vómito, flatulencia, dispepsia

Poco frecuentes: Dolor abdominal, distensión abdominal, acidez estomacal, anorexia, diarrea, esteatorrea, irritación de la lengua, prurito anal

Raras: Impactación fecal

Frecuencia no conocida: Hemorroides, disfagia, sangrado rectal, obstrucción intestinal, hipo, pancreatitis

Trastornos hepato-biliares

Frecuencia no conocida: Cólico biliar

Trastornos del metabolismo y de la nutrición

Frecuencia no conocida: Acidosis hiperclorémica, desequilibrio electrolítico

Trastornos músculo-esqueléticos

Frecuencia no conocida: Osteoporosis (asociado a disminución de la absorción de calcio y vitamina D).

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Frecuencia no conocida: Eritema, erupción, irritación cutánea

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Dado que la colestiramina es una resina de intercambio iónico, podría acomplejarse en el tracto gastrointestinal con otras sustancias cargadas negativamente (distintas a las sales biliares) y comprometer su biodisponibilidad. Como resulta difícil predecir cuáles fármacos podrían ser susceptibles a dicho efecto y en qué magnitud, se recomienda como regla general la administración de cualquier medicamento 1 hora antes ó 4-6 horas (o más) después de la administración de la colestiramina.

Se debe considerar también la posibilidad de alteración de la farmacocinética de fármacos que sufren circulación enterohepática.

Existe evidencia de interferencia con la absorción gastrointestinal o circulación enterohepática de: digoxina, warfarina, hormonas tiroideas, amiodarona, diuréticos tiazídicos, propranolol, fenobarbital, cloroquina, diclofenaco, ibuprofeno, doxepina, imipramina, sales de hierro, ácido fólico, tetraciclina, penicilina G, suplementos de fosfato, fenilbutazona, loperamida, clofibrato, estrógenos y progestina, entre otros.

Debido a la remoción intestinal de ácidos biliares, la colestiramina podría interferir con la digestión y absorción de vitaminas liposolubles (A, D, K y E) de la dieta diaria.





7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

- Previo al inicio de la terapia los pacientes deben someterse a una dieta baja en grasas sumada a un programa de ejercicios y control de peso, los cuales deben mantenerse durante todo el tratamiento.
- Antes de iniciar un tratamiento y periódicamente durante su desarrollo (cada 3-6 meses) se deben realizar determinaciones séricas de colesterol y triglicéridos.
- Se debe informar a los pacientes la importancia de evitar la administración de otros medicamentos dentro del período comprendido entre 1 hora antes y 4-6 horas después de la administración de colestiramina (ver "INTERACCIONES").
- La colestiramina puede interferir con la digestión y absorción normal de vitaminas liposolubles (ver "INTERACCIONES") y dar lugar a estados deficitarios. Se han reportado casos de ceguera nocturna, osteoporosis e hipoprotrombinemia por deficiencias de vitamina A, D y K, respectivamente, además de reducciones del folato sérico y eritrocitario. Por ello, en pacientes sometidos a tratamiento prolongado se recomienda como medida preventiva la administración de suplementos de estas vitaminas y ácido fólico.
- La colestiramina puede provocar constipación o agravarla si ya existía. Para minimizar el riesgo se recomienda aumentar la ingesta de líquidos y alimentos ricos en fibra. En caso necesario podría administrarse de manera ocasional un laxante ablandador de heces. En pacientes con constipación pre-existente se recomienda iniciar con dosis reducidas e incrementos graduales (a intervalos mensuales) con evaluación periódica de la respuesta clínica. Si la condición empeora o no se logra la respuesta deseada con la dosis máxima tolerable se deberá considerar la posibilidad de combinación con otros hipolipemiantes o un tratamiento alternativo.
- En pacientes sometidos a tratamiento prolongado se debe considerar la posibilidad de acidosis hiperclorémica. El riesgo es mayor en pacientes con insuficiencia renal o con depleción de volumen.
- La experiencia con colestiramina demuestra que los adultos mayores de 60 años son más propensos a la constipación asociada al tratamiento y a la





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

posibilidad de impactación fecal. Por ello, se recomienda usar con precaución extrema en estos pacientes.

- Se debe advertir a los pacientes que mantener por mucho tiempo el producto en la cavidad bucal durante su administración, podría ocasionar alteraciones en la superficie dental como descoloración, erosión del esmalte y caries. Así mismo, se debe advertir la importancia de mantener una adecuada higiene dental durante el tratamiento.
- Si los niveles de colesterol no disminuyen luego de 1-3 meses de terapia o si los triglicéridos aumentan de manera substancial y se mantienen elevados, el tratamiento debe ser discontinuado.

8.2. Embarazo

Como la colestiramina no se absorbe sistémicamente tras su administración oral, no cabe esperar que se produzcan daños fetales cuando se usa en el embarazo. De hecho, se ha empleado para el tratamiento de la colestasis intrahepática del embarazo sin evidencias de daños al feto y/o a la madre. Sin embargo, ante la posibilidad de una interferencia con la absorción de vitaminas que pudiese afectar el desarrollo fetal y dado que no existen estudios clínicos adecuados que demuestren su seguridad en mujeres embarazadas, los especialistas recomiendan manejar las dislipidemias durante la gestación preferiblemente con medidas dietéticas.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance riesgo-beneficio sea favorable.

8.3. Lactancia

Como la colestiramina no se absorbe sistémicamente, no cabe esperar su presencia en la leche materna.

No se administre durante la lactancia a menos que el médico lo indique.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula
Obstrucción biliar completa

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

El mayor riesgo asociado a la sobredosificación de colestiramina lo constituye la posibilidad de obstrucción del tracto gastrointestinal.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

10.2. Tratamiento

El tratamiento dependerá del grado y localización de la obstrucción, así como de la presencia o no de motilidad intestinal normal.

11. TEXTOS DE EMPAQUE Y ETIQUETA

Vía de administración: Oral

Indicación y Posología: A juicio del facultativo

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, ni durante la lactancia, a menos que el médico lo indique.

Manténgase fuera del alcance de los niños

No exceda la dosis prescrita

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula

CON PRESCRIPCIÓN FACULTATIVA

