

por cualquier otra razón, es necesaria una eliminación rápida del organismo del compuesto A771726 (metabolito activo de leflunomida).

PROCEDIMIENTO DE ELIMINACIÓN DE LA DROGA

El siguiente procedimiento de eliminación de la droga es recomendado para obtener niveles plasmáticos no-detectables (menos de 0.02 mg/L ó 0.02 µg/mL) después de parar el tratamiento con leflunomida.

Administrar 8 g de colestiramina, 3 veces al día, o bien, 50 g de carbón activo en polvo, 4 veces al día. La duración de un lavado completo es normalmente de 11 días, aunque puede modificarse dependiendo de las variables clínicas o de laboratorio.

USO GERIÁTRICO

No se necesita ajustar la dosis en pacientes mayores de 65 años.

ALMACENAMIENTO

Almacenar a menos de 30°C.

PRESENTACION

Caja con 30 tabletas recubiertas.

Elaborado por:

Para: Indo Gulf Company, India
Medsol S.A de C.V.
El Salvador. C.A.

Leflunomida 20 mg Tabletas recubiertas Flumida-20

COMPOSICIÓN

Cada tableta recubierta contiene:
Leflunomida.....20 mg
Excipientesc.s

DESCRIPCIÓN

La leflunomida es un derivado isoxazol, inhibidor selectivo y reversible de la dihidroorotato deshidrogenasa (DHODH), enzima clave en la síntesis de *de novo* de las piridinas, lo que bloquea el ciclo celular de los linfocitos T autoinmunes activados, deteniendo la proliferación linfocitaria, que es un elemento clave en la destrucción articular. Esta droga respeta otras líneas celulares, lo que explica la ausencia de citopenias e infecciones oportunistas. Además inhibe la tirosinquinasa en los linfocitos T activados, que se ha relacionado con el bloqueo en la producción de anticuerpos de la clase IgG. Otros efectos de la droga son:

- 1.- Disminución de la expresión de moléculas de adhesión y de las metaloproteasas de la matriz.
- 2.- Bloqueo de la activación y expresión génica de factor nuclear kappa B y supresión de citoquinas proinflamatorias (factor de necrosis tumoral e interleuquinas 1 y 6).
- 3.- Inhibición de la migración de neutrófilos e interferencia de la adhesión de leucocitos a células del endotelio vascular.
- 4.- Inhibición de la 5-lipooxigenasa y ciclooxigenasa 2.

INDICACIONES

Tratamiento de la artritis reumatoide activa en adultos para reducir signos y síntomas y retrasar la destrucción articular y mejorar la

funcionalidad física relacionada con la calidad de vida.

Tratamiento de la artritis psoriática. Si el paciente está recibiendo antiinflamatorios no esteroideos (AINES) y/o bajas dosis de corticosteroides, éstos pueden continuarse luego de comenzar el tratamiento con leflunomida.

DOSIS Y ADMINISTRACIÓN

Dosis de carga: Iniciar con 100 mg al día durante 3 días.

Dosis de mantenimiento: 20 mg al día, en caso que esta dosis no sea bien tolerada, puede disminuirse a 10 mg diarios.

Antes de iniciar el tratamiento debe:

- 1.- Controlar la ALT (SGPT) y durante los primeros seis meses del tratamiento a intervalos mensuales o mas frecuentes y después cada 8 semanas.
- 2.- Realizar una hematología completa, incluyendo un recuento diferencial de glóbulos blancos y plaquetas, cada 2 semanas por los primeros 6 meses de tratamiento y después cada 8 semanas.

CONTRAINDICACIONES

Pacientes con hipersensibilidad a leflunomida o a cualquiera de los componentes de la tableta. Durante el embarazo y la lactancia, o mujeres en edad fértil que no estén usando un método anticonceptivo confiable durante el tratamiento con leflunomida y después de eso mientras los niveles plasmáticos del metabolito activo, A771726, estén sobre 0.02 mg/l.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

Información para los pacientes

El aumento potencial del riesgo de defectos de nacimiento debe ser discutido con

pacientes con potencial de embarazo. Se recomienda que los médicos informen a las mujeres que pueden estar en alto riesgo de tener un bebé con defectos de nacimiento si están embarazadas cuando estén tomando leflunomida, embarazarse mientras están tomando leflunomida, o no esperan a resultar embarazadas hasta que han dejado de tomar leflunomida y han seguido el procedimiento de eliminación de la droga.

Los pacientes deben ser advertidos de la posibilidad de serias reacciones raras de la piel y de informar rápidamente a sus médicos si desarrollan una erupción de la piel o lesiones en las membranas mucosas así como de los potenciales efectos hepatotóxicos de leflunomida y de la necesidad de revisar las enzimas hepáticas.

Pacientes que están recibiendo concurrentemente otra terapia inmunosupresora con leflunomida, que recientemente han descontinuado esa terapia antes de comenzar el tratamiento con leflunomida, o que han tenido un historial de anomalías hematológicas significativas, deben ser informados del potencial de pancitopenia y de la necesidad de realizar con frecuencia una revisión hematológica. Ellos deben saber que deben notificar rápidamente a sus médicos si notan síntomas de pancitopenia (tales como heridas, tendencia a infecciones, palidez o cansancio inusual).

NECESIDAD DE ELIMINAR LA DROGA

Al sustituir leflunomida por otro DMARD (ej. metotrexato). Cuando aparezcan reacciones adversas graves (ej. hepatotoxicidad, hematotoxicidad hematológica o reacciones alérgicas, véase sección 4.4-Advertencias y precauciones especiales de empleo- de la Ficha Técnica). En caso de embarazo. O si

C863 B

C863 B