

FICHA TÉCNICA

1. NOMBRE DEL MEDICAMENTO

angileptol comprimidos para chupar

angileptol comprimidos para chupar sabor menta

angileptol comprimidos para chupar sabor miel-limón

angileptol comprimidos para chupar sabor menta-eucalipto

2. COMPOSICIÓN CUALITATIVA Y CUANTITATIVA

Descripción general

Composición cualitativa y cuantitativa

Cada comprimido para chupar contiene:

Principios activos:

Clorhexidina (DOE) dihidrocloruro 5 mg

Benzocaína (DOE) 4 mg

Enoxolona (DOE) 3 mg

Excipientes:

Sorbitol..... 1249 mg (en angileptol)

“ 1241 mg (en angileptol sabor menta)

“ 1238 mg (en angileptol sabor miel-limón)

“ 1219,25 mg (en angileptol sabor menta-eucalipto)

Para consultar la lista completa de excipientes, ver sección 6.1.

3. FORMA FARMACÉUTICA

Comprimidos para chupar.

Los comprimidos para chupar son de color blanco, redondos, con la letra σ en una de las caras.

4. DATOS CLÍNICOS

4.1 Indicaciones terapéuticas

Alivio sintomático local y temporal de procesos infecciosos e inflamatorios leves de boca y garganta: aftas bucales, irritación de garganta producida por agentes agresores externos como tabaco, cambios bruscos de temperatura, polvo, que cursan con dolor y sin fiebre.

4.2 Posología y forma de administración

Posología

Adultos y niños mayores de 12 años:

Dosis habitual: 1 comprimido cada 2-3 horas, dejando disolver el comprimido lentamente en la boca.
Dosis máxima: 8 comprimidos al día.

Niños mayores de 6 años:

Dosis habitual: 1 comprimido cada 4-5 horas, dejando disolver el comprimido lentamente en la boca.
Dosis máxima: 6 comprimidos al día.

Forma de administración

Uso bucofaríngeo.

Disolver lentamente en la boca, sin masticar ni tragar.

Si los síntomas empeoran, o si persisten después de 2 días, el médico evaluará la situación clínica.

4.3 Contraindicaciones

Hipersensibilidad a la clorhexidina, benzocaína, enoxolona o a alguno de los excipientes de este medicamento.

4.4 Advertencias y precauciones especiales de empleo

No deben utilizarse dosis superiores a las indicadas.

En relación con los anestésicos locales, existe una mayor tendencia en los ancianos, enfermos en fase aguda o debilitados, a que se produzca toxicidad sistémica de benzocaína, por lo cual se pueden necesitar concentraciones menores de este medicamento.

La enoxolona, en ancianos, a dosis altas y en tratamiento continuado puede producir retención de sodio, edema e hipertensión

Los pacientes que no toleran otros anestésicos locales de tipo éster (especialmente derivados del ácido para-aminobenzoico (PABA), los parabenes o la parafenilendiamina (un tinte para el pelo) también pueden ser intolerantes a la benzocaína.

La relación riesgo-beneficio debe evaluarse en los siguientes casos:

- Trauma severo de la mucosa (aumenta la absorción del anestésico).
- Empastes de los dientes incisivos; si la superficie del empaste o sus márgenes son rugosos, con la clorhexidina pueden adquirir una coloración permanente.

En pacientes con periodontitis, la clorhexidina causa un aumento de los cálculos supragingivales.

Mantener una adecuada higiene bucal, pasta de dientes especial antisarro, para reducir el acumulo de sarro y la coloración de los dientes ocasionada por la clorhexidina.

Los comprimidos no deben masticarse ni tragarse ya que su acción es totalmente local y sólo se pone de manifiesto su actividad si el producto está en contacto directo con la zona afectada.

Población pediátrica

Este medicamento debe usarse con precaución en niños, ya que son más sensibles a la toxicidad sistémica de la benzocaína, pudiendo producirse metahemoglobinemia.

Los niños pueden ser más sensibles a la toxicidad sistémica de benzocaína igual que los ancianos y enfermos debilitados.

No debe utilizarse en niños menores de 6 años sin control médico.

Advertencias sobre excipientes

Los comprimidos de angileptol contienen sorbitol. Los pacientes con intolerancia hereditaria a la fructosa no deben tomar este medicamento.

4.5 Interacción con otros medicamentos y otras formas de interacción

No se debe usar conjuntamente con otros medicamentos que contengan antisépticos.

Existen referencias bibliográficas de estudios en animales, en los que la administración concomitante, vía tópica, de enoxolona e hidrocortisona potencia la acción de ésta última en la piel. No se ha podido determinar si potencia también su absorción sistémica y la toxicidad.

Debido a la presencia de benzocaína, interfiere con:

- Inhibidores de la colinesterasa: inhiben el metabolismo del anestésico local, con el riesgo de mayor toxicidad sistémica.
- Sulfamidas: los metabolitos de la benzocaína pueden antagonizar la actividad antibacteriana de las sulfamidas.

Interferencias con pruebas de diagnóstico

Igualmente se presenta interferencia con la prueba de diagnóstico para determinar la función pancreática usando bentiromida. Los resultados se invalidan, ya que la benzocaína se metaboliza también a arilaminas y aumenta la cantidad aparente de PABA recuperado. Se recomienda suprimir el tratamiento al menos 3 días antes de la prueba.

4.6 Fertilidad, embarazo y lactancia

No utilizarlos durante el embarazo o la lactancia.

La enoxolona a dosis altas, por encima de 60 mg/día y uso continuado, puede producir retención de sodio, edema e hipertensión, lo cual debe ser tenido en cuenta en las pacientes embarazadas.

No existen datos suficientes sobre la utilización de clorhexidina y benzocaína en mujeres embarazadas.

Con la clorhexidina no se han descrito trastornos de la fertilidad, ni acciones fetotóxicas, ni toxicidad peri-post natal, en estudios realizados con animales de experimentación. Se desconoce si la clorhexidina se excreta en la leche materna.

Benzocaína: No se han descrito problemas con benzocaína en el embarazo, ni en la lactancia.

4.7 Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

La influencia de estos medicamentos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas es nula o insignificante.

4.8 Reacciones adversas

Durante el período de utilización de medicamentos con clorhexidina, benzocaína y enoxolona se han observado las siguientes reacciones adversas, cuya frecuencia no se ha podido establecer con exactitud.

Clorhexidina

Pueden producir pigmentación de las superficies orales (dientes, lengua, empastes dentales, dentaduras postizas y otros aparatos bucales). Esta pigmentación puede ser más pronunciada en los individuos que presentan placas de sarro en los dientes. Esta coloración puede ser visible a la semana de iniciar el tratamiento.

La coloración de la lengua desaparece espontáneamente y no es peligrosa. La coloración de los dientes no es permanente, puede eliminarse por limpieza bucal. La coloración de empastes sí puede ser permanente.

La alteración en la percepción del sabor durante el tratamiento y el aumento del sarro en los dientes, son dos reacciones adversas que con frecuencia han sido descritas en pacientes a los que se les administra clorhexidina en solución para enjuague bucal.

Se han descrito casos raros de irritación bucal por lesiones descamativas, en ocasiones dolorosas (sobre todo en niños entre 10 y 18 años), que suele ser pasajera, e irritación de la punta de la lengua. También se han descrito en raras ocasiones reacciones locales alérgicas en pacientes que usaban la clorhexidina en solución para enjuague bucal. Estas reacciones alérgicas, en ocasiones se presentaron acompañadas de congestión nasal, picor, *rash* cutáneo.

Benzocaína

Las reacciones adversas que pueden surgir por la presencia de benzocaína se deben a una dosificación excesiva o a la absorción rápida, así como a la idiosincrasia del enfermo, e incluyen sensibilización por contacto y angioedema (por reacción alérgica o dermatitis de contacto). También escozor, picor, hinchazón o enrojecimiento dentro de la boca o alrededor de ella, inexistentes con anterioridad al tratamiento.

Enoxolona

La enoxolona a dosis altas y en tratamientos continuados produce: edema (hinchazón producida por retención de líquido) e hipertensión.

No es probable que aparezcan las reacciones adversas descritas a las dosis utilizadas en estos medicamentos. No obstante, en caso de observarse la aparición de reacciones adversas debe suspenderse el tratamiento y notificarlas a los sistemas de farmacovigilancia.

4.9 Sobredosis

A las dosis propuestas es difícil que se produzca un cuadro de sobredosis. En caso de que se produjera, debido a la enoxolona, puede aparecer un cuadro de hipermineralocorticoidismo con retención de sodio y pérdida de potasio, edema, aumento de la presión sanguínea y depresión del sistema aldosterona-renina-angiotensina.

La sobredosificación con clorhexidina, sobre todo en niños, produce síntomas de intoxicación alcohólica (habla balbuceante, adormecimiento o marcha tambaleante). A pesar de que la absorción de la benzocaína es muy pequeña, en caso de absorción sistémica excesiva, los síntomas son visión borrosa o doble, mareos, convulsiones, tintineos de oídos, excitación (estimulación del SNC) seguida de somnolencia (depresión del

SNC), aumento de sudoración, presión arterial baja o latidos cardíacos lentos o irregulares, depresión de sistema cardiovascular.

El tratamiento de una sobredosis, en lo que se refiere a la clorhexidina es fundamentalmente sintomatológico.

El tratamiento incluye administrar oxígeno o en caso necesario instaurar respiración asistida, y para la depresión circulatoria administrar un vasoconstrictor y líquidos intravenosos. También puede aparecer metahemoglobinemia (dificultad para respirar, mareo, fatiga, cansancio, debilidad), cuyo tratamiento consiste en la administración de azul de metileno.

5. PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

5.1 Propiedades farmacodinámicas

Grupo farmacoterapéutico: Preparados para la garganta. Código ATC: R02AA

Los principios activos de estos medicamentos actúan complementando la acción antiséptica de la clorhexidina, con la acción antiinflamatoria de la enoxolona en la mucosa bucofaríngea, y la acción anestésica local de la benzocaína, suprimiendo de este modo las molestias típicas producidas por la irritación local de la garganta.

La clorhexidina es un antiséptico activo frente a distintas bacterias aerobias y anaerobias gram-positivas y gram-negativas, aunque no es tan potente frente a estas últimas.

A concentraciones bajas es bacteriostática, a concentraciones más elevadas es bactericida.

Entre los microorganismos con mayor sensibilidad a la clorhexidina se incluyen algunos estafilococos, *Streptococcus mutans*, *salivarius* y *Streptococcus sanguis*. Aunque presenta cierta actividad frente a algunas bacterias gram negativas como *Acinetobacter baumannii*, *Escherichia coli*, Klebsiella, Salmonella y Pseudomonas, muchas cepas de estas bacterias y otras gram negativas requieren concentraciones altas de clorhexidina para presentar actividad.

Respecto a las bacterias anaerobias, la clorhexidina presenta actividad frente a algunas cepas de Bacteroides, Propionibacterium, Selenomonas pero es menos activa frente a *Veillonella*.

Mecanismo de acción: La clorhexidina es un compuesto catiónico, su actividad antibacteriana es el resultado de la atracción entre la clorhexidina con carga positiva a la carga negativa de la superficie celular de las bacterias. La clorhexidina se adsorbe a las paredes celulares de los microorganismos susceptibles, adsorbiendo de forma fuerte y específica a ciertos compuestos que contienen fosfato. Esta acción altera la integridad de la membrana celular, aumentando su permeabilidad.

La benzocaína es un anestésico local tipo éster de uso tópico que actúa bloqueando tanto la iniciación como la conducción de los impulsos nerviosos mediante la disminución de la permeabilidad de la membrana neuronal a los iones de sodio y de esta manera la estabiliza reversiblemente.

La enoxolona presenta acción antiinflamatoria tópica sobre las mucosas. La semejanza estructural con los corticoides determina su actividad mineralocorticoide y antiinflamatoria, pero dicha estructura no esteroídica explica la ausencia de ciertos efectos secundarios que presentan los glucocorticoides.

5.2 Propiedades farmacocinéticas

Los estudios farmacocinéticos indican que aproximadamente el 30% de la clorhexidina se adsorbe en la cavidad bucal y posteriormente el medicamento adsorbido se libera lentamente a la saliva. Se absorbe muy poco en el tracto gastrointestinal y se elimina principalmente a través de las heces, y en muy pequeña proporción por la orina.

La benzocaína se absorbe en muy pequeña cantidad a través de las membranas mucosas hacia la circulación sistémica. Se metaboliza principalmente por la acción hidrolítica de las colinesterasas plasmáticas y en mucho menor grado por las colinesterasas hepáticas, que producen hidrólisis de la unión éster que libera el etanol y el ácido-aminobenzoico. El ácido p-aminobenzoico puede eliminarse sin modificación por la orina o conjugarse con la glicina, o bien transformarse por hidrólisis en ácido aminohipúrico. La degradación depende del pH.

La enoxolona se absorbe por vía oral lentamente a nivel del tracto gastrointestinal. La mayor parte se realiza a nivel del estómago debido a su acidez. No obstante, por las características del preparado, la absorción sistémica es muy baja. La mayor parte de la cantidad absorbida se excreta en la bilis y es eliminada posteriormente por las heces, principalmente en forma de metabolitos no activos; una pequeña parte es eliminada por la orina.

5.3 Datos preclínicos sobre seguridad

No se han realizado estudios bien controlados con clorhexidina en humanos. En estudios realizados en animales no se ha observado ninguna prueba de daño al feto en ratas y conejos a los que se administraron dosis de clorhexidina de hasta 300 mg/kg/día y de hasta 40 mg/kg/día, respectivamente. Además, en estudios en ratas no ha habido indicios de alteración del parto ni de efectos tóxicos en los cachorros lactantes cuando se administra clorhexidina a las madres a dosis más de 100 veces superiores a la dosis que una persona recibiría si ingiriera 30 ml de un enjuague oral de clorhexidina (0,12%) al día.

La toxicidad de la benzocaína es también baja. La dosis letal para el hombre no se conoce. La FDA no ha podido detectar ningún caso fatal por absorción oral de benzocaína.

6. DATOS FARMACÉUTICOS

6.1 Lista de excipientes

Estearato de magnesio,
Sorbitol (E420),
Acesulfamo de potasio (E950);

Además:

Aroma de menta (en angileptol sabor menta),
Aroma de menta-eucalipto (en angileptol sabor menta-eucalipto),
Aroma de miel y aroma de limón (en angileptol sabor miel-limón).

6.2 Incompatibilidades

No procede.

6.3 Periodo de validez

3 años

6.4 Precauciones especiales de conservación

No requiere condiciones especiales de conservación.

6.5 Naturaleza y contenido del envase

Estuche de 30 comprimidos para chupar, envasado en blister de lámina de aluminio/aluminio sellados por calor.

Estuche de 15 comprimidos para chupar, envasado en blíster de lámina de aluminio/aluminio sellados por calor, en Angileptol sabor menta, Angileptol sabor miel-limón y Angileptol sabor menta-eucalipto.

6.6 Precauciones especiales de eliminación

La eliminación del medicamento no utilizado y de todos los materiales que hayan estado en contacto con él, se realizará de acuerdo con las normativas locales o se procederá a su devolución a la farmacia.

7. TITULAR DE LA AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

SIGMA-TAU ESPAÑA, S.A.

Polígono Industrial Azque C/Bolivia 15, 28806 Alcalá de Henares (Madrid)

8. NÚMERO(S) DE AUTORIZACIÓN DE COMERCIALIZACIÓN

angileptol nº 65.000

angileptol sabor menta, nº 47.342

angileptol sabor miel-limón, nº 64.119

angileptol sabor menta-eucalipto, nº 69.196

9. FECHA DE LA PRIMERA AUTORIZACIÓN/ RENOVACIÓN DE LA AUTORIZACIÓN

Angileptol: 23/09/2002 / Revalidación: Septiembre 2007

Angileptol sabor menta: 20/03/1969/ Revalidación: Julio 2010

Angileptol sabor miel-limón: 24/07/2001/ Revalidación: Julio 2011

Angileptol sabor menta-eucalipto: 22/08/2007 / Revalidación: Julio 2012

10. FECHA DE LA REVISIÓN DEL TEXTO

Julio 2007