

Antipsicóticos

JUAN ANTONIO SANCHEZ TRILLO

TOMÁS SANTA CECILIA MATEOS

También llamados neurolepticos, constituyen un grupo de medicamentos de naturaleza química muy heterogénea pero con mecanismo de acción común. Actúan fundamentalmente por bloqueo de los receptores dopaminérgicos D2, aunque muchos antipsicóticos tienen actividad sobre los receptores de otros neurotransmisores.

Existen dos grupos claramente diferenciados:

ATÍPICOS

Tienen acción antipsicótica sin producir reacciones extrapiramidales (trastornos motores), además bloquean simultáneamente los receptores dopaminérgicos D2 y los receptores serotoninérgicos 5HT2 y de los que cabe esperar:

- Efectos extrapiramidales mínimos o nulos.
- Acción sobre los síntomas negativos de la esquizofrenia (además de sobre los positivos).
- Un grado significativo de eficacia en cuadros refractarios a los antipsicóticos típicos.

TÍPICOS

Tienen principalmente dos efectos, reacciones extrapiramidales y sedación.

NOMBRE COMERCIAL	PRINCIPIO ACTIVO
ANSIUM LESVI	SULPIREDE DIAZEPAM
CISORDINOL	ZUCLOPENTIXOL
DOGMALTIL	SULPIRIDE
ESKAZINE	TRIFLUOPERAZINA
GUASTIL	SULPIRIDE
HALOPERIDOL	HALOPERIDOL
LARGACTIL	CLORPROMAZINA
LEBOPRIDE	SULPIRIDE
LEPONEX	CLOZAPINA
LONSEREN	
MELERIL	TIORIZADINA

MODECATE	
MUTABASE	AMITRIPTILINA
ORAP	PIMOZIDA
PLENUR	CARBONATO DE LITIO
RISPERDAL	RISPERIDONA
SINOGAN	LEVOMEPRMAZINA
TIAPRIZAL	TIAPRIDE

CISORDINOL (COMPRIMIDOS)

COMPOSICION POR UNIDAD

ZUCLOPENTIXOL DICLORHIDRATO 25 mg.

LACTOSA (EXCIPIENTE) 22 mg.

PRESENTACIÓN

AMPOLLAS 50, 200 mg.

GOTAS SOL.20 mg./ml.

COMPRIMIDOS 10, 20 mg.

ACCION Y MECANISMO

Agente antipsicótico de tipo tioxanténico. Antagonista de los receptores D1 y D2 de la dopamina, aunque actúa preferentemente sobre los D2.

FARMACOCINETICA

Vía oral (clorhidrato): su biodisponibilidad es del 44%, alcanzando la concentración sérica máxima al cabo de 4h. Vía im (decanoato): alcanza la concentración sérica máxima a los 3-7 días. El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 99%. Es metabolizado en más del 95% en el hígado siendo eliminado mayoritariamente con las

heces. Su semivida de eliminación es de 20 h (previsiblemente más en insuficiencia hepática).

INDICACIONES Y POSOLOGIA

- Esquizofrenia: crónica y subcrónica con crisis agudas, especialmente en pacientes agitados y/o depresivos.

Inicio del tratamiento de la fase aguda (acetato).

Vía oral (diclorhidrato):

- Adultos: inicialmente, 20-30 mg/día, pudiendo incrementar hasta 150 mg/día en varias dosis. Las dosis de mantenimiento en pacientes con formas crónicas de esquizofrenia son de 20 a 50 mg/día.
- Ancianos: inicialmente, 2-6 mg/día, pudiendo incrementar hasta 10-20 mg/día.
- Insuficiencia hepática: precaución en la dosis y si es posible, determinaciones de los niveles séricos del fármaco.

Vía intramuscular (acetato):

- Adultos: dosis habitual de 50-150 mg, pudiendo repetir tras 2-3 días (excepcionalmente otra dosis adicional dentro de las 24-48 h tras la 1ª inyección). No superar las 2 semanas de tratamiento, la dosis acumulada de 400mg, ni las 4 inyecciones. Cambio a zuclopentixol oral: comenzar con 40 mg/día (oral) en pacientes tratados con 100 mg de acetato de zuclopentixol, 2-3 días después de la última inyección, pudiendo aumentar en 10-20 mg cada 2-3 días hasta los 75 mg/día. Cambio a decanoato: simultáneamente con la última inyección de acetato (100mg), se administrarán 200-400 mg. Repetir las inyecciones de decanoato cada 2 semanas.
- Ancianos: reducir la dosis. Dosis máxima por inyección, 100 mg.
- Insuficiencia hepática: mitad de la dosis, y si es posible, determinar niveles plasmáticos del fármaco.

Vía intramuscular (decanoato):

- Adultos: Dosis usual de mantenimiento, 200-400 mg cada 2-4 semanas. Algunos pacientes necesitan dosis superiores o intervalos inferiores. Dosis máxima, 600 mg/semana. Cambio de la vía oral a decanoato: 25 mg/día (oral) equivalen a 200 mg/2 semanas ó 400 mg/4 semanas de decanoato. Los pacientes que hayan seguido tratamiento con otros neurolépticos depot recibirán una dosis de decanoato según: 200 mg de decanoato de zuclopentixol equivalen a 25 mg de decanoato de flufenacina.
- Insuficiencia hepática: precaución en la dosis y si es posible, determinar los niveles séricos del fármaco.
- Normas para la correcta administración: Vía oral: las dosis de mantenimiento podrán administrarse en forma única antes de acostarse. Vía im: Inyectar en el cuadrante superior y externo de la región glútea, repartiendo en 2 zonas si el volumen de inyección sobrepasa los 2 ml. Se recomienda realizar aspiración previa a fin de descartar la posibilidad de inyección intravascular. El acetato y decanoato de zuclopentixol se podrán mezclar en la misma jeringa, no pudiéndose mezclar con formulaciones depot que presenten como vehículo aceite de sésamo.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia al zuclopentixol y otros derivados tioxanténicos, así como en intoxicación por alcohol, opiáceos u otros depresores funcionales del Sistema Nervioso, estado de coma, discrasias sanguíneas y feocromocitoma, y en embarazo, lactancia y niños (menores de 18 años).

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en enfermedades cerebrales orgánicas, depresión, epilepsia, asma crónico, glaucoma de ángulo cerrado, parkinsonismo, insuficiencia cardíaca, insuficiencia coronaria e insuficiencia hepática y/o renal. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento.

EFFECTOS ADVERSOS

- Alteraciones neurológicas: Frecuentemente (más del 10%): temblor, rigidez muscular, parkinsonismo, acatisia, distonía, mareos. Ocasionalmente (1-10%): parestesia, discinesia, discinesia tardía, cefalea.

- Alteraciones psicológicas/psiquiátricas: Frecuentemente: somnolencia. Ocasionalmente: astenia, confusión.

- Alteraciones digestivas: Frecuentemente: sequedad de boca. Ocasionalmente: dispepsia, náuseas, estreñimiento.

- Alteraciones cardiovasculares: Ocasionalmente: taquicardia, hipotensión.

- Alteraciones oculares: Ocasionalmente: trastornos de la acomodación.

- Alteraciones genitourinarias: Ocasionalmente: retención urinaria.

- Alteraciones alérgicas/dermatológicas: Ocasionalmente:

sudoración.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

En tratamientos con neurolépticos es posible el desarrollo de un síndrome neuroléptico maligno (hipertermia, rigidez, etc), especialmente peligroso en pacientes

con síndromes cerebrales orgánicos, con retraso mental o con historial de abuso de drogas. La presencia de discinesia tardía obliga a la suspensión del tratamiento.

Embarazo:

Los estudios sobre animales no han registrado efectos adversos en la prole. No hay estudios adecuados y bien controlados en humanos. El uso de este medicamento sólo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras.

Madres lactantes:

El zuclopentixol se excreta con la leche materna (proporción leche/plasma, 0,29). Existe experiencia clínica limitada, no obstante, no se han registrado efectos adversos en los recién nacidos, desconociéndose los efectos a largo término. Uso no recomendado en madres lactantes.

Uso en niños:

La seguridad y eficacia del uso de zuclopentixol en niños no han sido establecidas. Uso no recomendado.

Uso en ancianos:

Los pacientes geriátricos parecen presentar una mayor predisposición a sufrir hipotensión ortostática y una mayor sensibilidad a los efectos anticolinérgicos y sedantes. También tienen más tendencia a padecer efectos secundarios extrapiramidales, como disquinesia tardía (con signos persistentes, difíciles de controlar y en algunos pacientes irreversibles). Se recomienda observación durante el tratamiento para detectar signos precoces de disquinesia tardía y la reducción o interrupción del tratamiento para evitar una manifestación más grave del síntoma. Asimismo, se recomienda el control de la función cardíaca. Los ancianos pueden presentar mayores concentraciones plasmáticas de zuclopentixol, por lo tanto, estos pacientes necesitarían una dosis inicial menor y un ajuste más gradual de la dosis. Uso precautorio (especialmente en ancianos en situación crítica o con riesgo de padecer hipotermia), recomendándose especial control clínico.

DOGMATIL

COMPOSICION POR UNIDAD

SULPIRIDA 50 mg.

LACTOSA (EXCIPIENTE) 67 mg.

PRESENTACIÓN

INYECTABLE, AMPOLLAS 100 mg.

DOGMATIL FUERTE COMPRIMIDOS 200 mg.

CÁPSULAS DE 50 mg.

SOL. 25 mg./5 ml.

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico derivado del grupo de las benzamidas sustituidas. Antidopaminérgico (especialmente sobre los receptores D2), estimula la producción de prolactina.

Presenta ligera actividad antiemética, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. Su actividad anticolinérgica es casi nula. Puede alterar la concentración sérica de gastrina, por lo que ha sido utilizado como antiulceroso.

FARMACOCINETICA

Vía oral, im: Su biodisponibilidad oral es pequeña (25-35%) y sujeta a variaciones interindividuales. El grado de unión a proteínas plasmáticas es > 40 %. No sufre a penas metabolismo, siendo eliminada mayoritariamente con la orina en un 92 % en forma inalterada. Su semivida de eliminación es de 7-9 h.

INDICACIONES Y POSOLOGIA

Neurosis de ansiedad. Neurosis fóbica. Neurosis obsesivo-compulsiva. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

Vértigo.

Vía oral:

- Neurosis y vértigo. Adultos: 50-100 mg/8 h.
- Psicosis: Adultos: 100-200 mg/6 h. Niños: 2-3 mg/kg/8 h.

Se recomienda administrar conjuntamente con las comidas.

Vía intramuscular:

- Adultos: 600-800 mg/día (durante 15-20 días).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a sulpirida o a otras benzamidas (ej: tiaprida), feocromocitoma, embarazo y lactancia.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, epilepsia, parkinsonismo y ancianos, debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante los primeros días de tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

Se puede potenciar la toxicidad de la sulpirida por el litio,carbonato. Se puede antagonizar mutuamente los efectos de la sulpirida y levodopa. El alcohol y otros depresores del S.N.C. (anestésicos,barbitúricos, etc.) pueden producir potenciación de los efectos depresores.

La sulpirida puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

-Sangre: aumento (biológico) de prolactina, TSH-RH y TSH.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de sulpirida son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Muy frecuentemente (>25%): somnolencia y sedación.

-Frecuentemente (10-25%): sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

-Ocasionalmente (1-9%): galactorrea, amenorrea, ginecomastia, mastalgia, incremento o reducción de la libido, hipotensión ortostática (más aguda e intensa tras la administración i.m.), hipertensión, taquicardia(principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Comunicar al médico si aparece temblores, ictericia, alteración de la visión o movimientos musculares involuntarios.

Embarazo:

Los estudios sobre animales de experimentación no han registrado efectos teratógenos. No hay estudios adecuados y bien controlados en humanos, no obstante, no se ha observado aumento del riesgo de malformaciones en un pequeño número de mujeres embarazadas. El uso de este medicamento sólo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras.

Madres lactantes:

La sulpirida se excreta con la leche en bajas concentraciones (se ha detectado 1 ng/ml con administración oral materna de 100 mg/día). No se esperan efectos adversos graves

en el lactante debido a la baja cantidad excretada, no obstante, se recomienda precaución en su uso.

Uso en niños:

Los pacientes pediátricos pueden ser más propensos a desarrollar reacciones neuromusculares o extrapiramidales, especialmente distonías, siendo especialmente proclives los niños con enfermedades agudas, como varicela, infecciones del SNC, sarampión, gastroenteritis o deshidratación. A causa de que los síntomas extrapiramidales pueden confundirse con los signos sobre el SNC de una enfermedad primaria no diagnosticada responsable del vómito (p. ej, síndrome de Reye y) otras encefalopatías, evitar el uso de antipsicóticos y otras hepatotoxinas en niños y adolescentes cuyos signos y síntomas sugieran la existencia de síndrome de Reye. Uso precautorio, recomendándose vigilancia estricta durante el tratamiento.

Uso en ancianos

Los pacientes geriátricos parecen presentar una mayor predisposición a sufrir hipotensión ortostática y una mayor sensibilidad a los efectos anticolinérgicos y sedantes. La sulpirida en particular presenta menor sedación, efectos anticolinérgicos e hipertensión ortostática que otros antipsicóticos. También tienen más tendencia a padecer efectos secundarios extrapiramidales, como disquinesia tardía (con signos persistentes, difíciles de controlar y en algunos pacientes irreversibles). Se recomienda observación durante el tratamiento para detectar signos precoces de disquinesia tardía y la reducción o interrupción del tratamiento para evitar una manifestación más grave del síntoma. Asimismo, es recomendable el control de la función cardiaca. Los ancianos pueden presentar mayores concentraciones plasmáticas de sulpirida, por lo tanto, estos pacientes podrían necesitar una dosis inicial menor y un ajuste más gradual de la dosis. Uso precautorio, recomendándose especial control clínico.

ESKAZINE 1 MG 25 GRAGEAS

PRESENTACIÓN

GAGEAS DE 1 / 2 / 5 mg.

COMPOSICION POR UNIDAD

TRIFLUOPERAZINA , DICLORHIDRATO 1 mg.

SACAROSA (EXCIPIENTE)

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico fenotiazínico.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina. Presenta actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica.

FARMACOCINETICA

Vía oral: Es absorbido rápidamente ($T_{max}=3$ h), presentando variaciones individuales importantes. El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 95%. Se metaboliza en el hígado, siendo eliminado mayoritariamente con las heces. Su semivida de eliminación es de aproximadamente 10 h.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

POSOLOGIA

Vía oral.

- Adultos: 2-5 mg/12 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta una dosis máxima de 25 mg/día.
- Ancianos y pacientes debilitados: 1-2,5 mg/12 h.
- Niños (>6 años): 1-2 mg/día, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 15 mg/día.
- Nota: Una vez controlados los síntomas agudos, es deseable reducir la dosis hasta un nivel mínimo efectivo como mantenimiento.
- Normas para la correcta administración: En tratamientos crónicos se aconseja administrar la mayor parte de la dosis a la hora de acostarse, así como ingerir las formas orales conjuntamente con las comidas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a trifluoperacina o a fenotiazinas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma y feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No es recomendable una exposición prolongada al sol ante el riesgo de que puedan producirse manifestaciones de fotosensibilidad. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Alcohol etílico: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con aparición de reacciones extrapiramidales.

- Antidepresivos tricíclicos (desipramina): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de antidepresivos, con potenciación de la toxicidad, por posible inhibición de su metabolismo hepático.
- Antidiabéticos: hay algún estudio en el que se ha registrado efecto hiperglucemiante de fenotiazinas como la clorpromazina, lo que podría inhibir el efecto de los antidiabéticos.
- Betabloqueantes (pindolol, propranolol, sotalol): hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina, tioridazina) en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de ambos fármacos, con posible potenciación de la acción y/o toxicidad. No se ha establecido el mecanismo.
- Diazóxido: hay un estudio con otra fenotiazina (bendroflumetiazida) en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con precoma diabético, por posible adición de sus efectos hiperglucemiantes.
- Fluoxetina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con manifestaciones neurológicas extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.
- Levodopa: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado aumento de la toxicidad e inhibición mutua de sus efectos, por antagonismo a nivel de la acción dopaminérgica - Metildopa: hay un estudio en el que se ha registrado inhibición del efecto hipotensor de metildopa, por posible bloqueo del falso neurotransmisor creado por metildopa.
- Sales de litio (carbonato de litio): hay estudios con otras fenotiazinas en los que se ha registrado potenciación de la neurotoxicidad. No se ha establecido el mecanismo.
- Trazodona: hay un estudio en el que se ha registrado hipotensión, por posible adición de sus efectos hipotensores.
- Trihexifenidilo: hay algún estudio con otra fenotiazina (clorpromazina) en el que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de fenotiazina, con inhibición de su efecto, por disminución de su absorción.

La trifluoperazina puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

- Sangre: aumento (biológico) de transaminasas (AST), fosfatasa alcalina, bilirrubina y prolactina.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de trifluoperazina son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Frecuentemente (10-25%): somnolencia, sedación, sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento; al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis.

-Ocasionalmente (1-9%): ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones acneiformes, erupciones maculopapulares, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): hipotensión ortostática, hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Evitar la exposición prolongada al sol, o utilizar protectores solares. Utilizar con precaución en climas calurosos, pues aumenta la susceptibilidad a la hipertermia.

Comunicar al médico si aparece fiebre, dolor de garganta, erupciones, temblores, ictericia o alteración de la visión. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas

GUASTIL (Cápsulas)

COMPOSICION POR UNIDAD

SULPIRIDA 50 mg.

PRESENTACIÓN

GUASTIL PEDIATRICO SUSPENSIÓN 25 mg./5 ml.

CÁPSULAS 50 mg.

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico derivado del grupo de las benzamidas sustituidas. Antidopaminérgico (especialmente sobre los receptores D2), estimula la producción de prolactina.

Presenta ligera actividad antiemética, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. Su actividad anticolinérgica es casi nula. Puede alterar la concentración sérica de gastrina, por lo que ha sido utilizado como antiulceroso.

FARMACOCINETICA

Vía oral, im: Su biodisponibilidad oral es pequeña (25-35%) y sujeta a variaciones interindividuales. El grado de unión a proteínas plasmáticas es > 40 %. No sufre a penas metabolismo, siendo eliminada mayoritariamente con la orina en un 92 % en forma inalterada. Su semivida de eliminación es de 7-9 h.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Neurosis fóbica. Neurosis obsesivo-compulsiva. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

Vértigo.

POSOLOGIA

Vía oral:

- Neurosis y vértigo. Adultos: 50-100 mg/8 h.
- Psicosis: Adultos: 100-200 mg/6 h. Niños: 2-3 mg/kg/8 h.

Se recomienda administrar conjuntamente con las comidas.

Vía intramuscular:

- Adultos: 600-800 mg/día (durante 15-20 días).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a sulpirida o a otras benzamidas (ej: tiaprida), feocromocitoma, embarazo y lactancia.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, epilepsia, parkinsonismo y ancianos, debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante los primeros días de tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

Se puede potenciar la toxicidad de la sulpirida por el litio,carbonato. Se puede antagonizar mutuamente los efectos de la sulpirida y levodopa. El alcohol y otros depresores del S.N.C. (anestésicos,barbitúricos, etc.) pueden producir potenciación de los efectos depresores.

La sulpirida puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

-Sangre: aumento (biológico) de prolactina, TSH-RH y TSH.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de sulpirida son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Muy frecuentemente (>25%): somnolencia y sedación.

-Frecuentemente (10-25%): sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

-Ocasionalmente (1-9%): galactorrea, amenorrea, ginecomastia, mastalgia, incremento o reducción de la libido, hipotensión ortostática (más aguda e intensa tras la administración i.m.), hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardíaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo parálítico.

-Raramente (<1%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Comunicar al médico si aparece temblores, ictericia, alteración de la visión o movimientos musculares involuntarios.

Embarazo:

Los estudios sobre animales de experimentación no han registrado efectos teratógenos. No hay estudios adecuados y bien controlados en humanos, no obstante, no se ha observado aumento del riesgo de malformaciones en un pequeño número de mujeres

embarazadas. El uso de este medicamento sólo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras.

Madres lactantes

La sulpirida se excreta con la leche en bajas concentraciones (se ha detectado 1 ng/ml con administración oral materna de 100 mg/día). No se esperan efectos adversos graves en el lactante debido a la baja cantidad excretada, no obstante, se recomienda precaución en su uso.

Uso en niños:

Los pacientes pediátricos pueden ser más propensos a desarrollar reacciones neuromusculares o extrapiramidales, especialmente distonías, siendo especialmente proclives los niños con enfermedades agudas, como varicela, infecciones del SNC, sarampión, gastroenteritis o deshidratación. A causa de que los síntomas extrapiramidales pueden confundirse con los signos sobre el SNC de una enfermedad primaria no diagnosticada responsable del vómito (p. ej, síndrome de Reye y) otras encefalopatías, evitar el uso de antipsicóticos y otras hepatotoxinas en niños y adolescentes cuyos signos y síntomas sugieran la existencia de síndrome de Reye. Uso precautorio, recomendándose vigilancia estricta durante el tratamiento.

Uso en ancianos:

Los pacientes geriátricos parecen presentar una mayor predisposición a sufrir hipotensión ortostática y una mayor sensibilidad a los efectos anticolinérgicos y sedantes. La sulpirida en particular presenta menor sedación, efectos anticolinérgicos e hipertensión ortostática que otros antipsicóticos. También tienen más tendencia a padecer efectos secundarios extrapiramidales, como disquinesia tardía (con signos persistentes, difíciles de controlar y en algunos pacientes irreversibles). Se recomienda observación durante el tratamiento para detectar signos precoces de disquinesia tardía y la reducción o interrupción del tratamiento para evitar una manifestación más grave del síntoma. Asimismo, es recomendable el control de la función cardiaca. Los ancianos pueden presentar mayores concentraciones plasmáticas de sulpirida, por lo tanto, estos pacientes podrían necesitar una dosis inicial menor y un ajuste más gradual de la dosis. Uso precautorio, recomendándose especial control clínico.

HALOPERIDOL

COMPOSICIÓN

HALOPERIDOL 10 mg.

PRESENTACIÓN

AMPOLLAS 5 mg. IV. / IM.

COPRIMIDOS 10 mg.

SOL. GOTAS 2 mg. / ml.

ACTIVIDAD FARMACOLOGICA Y MECANISMO

Antipsicótico tipo butirofenona.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina. Presenta actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. También posee débil actividad bloqueante ganglionar.

FARMACOCINETICA

Vía (Oral, IM): Su biodisponibilidad es del 60% (oral). Sufre metabolismo de primer paso. La absorción es rápida ($T_{max}=2-6$ h, oral; 10-20 min, IM). El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 92%. Es metabolizado en el hígado, dando lugar entre otros a hidroxihalooperidol con actividad farmacológica. Se elimina con las heces y la orina, en un 1% en forma inalterada.

Su semivida de eliminación es de 13-40 h.

INDICACIONES

Autorizadas en España: Neurosis de ansiedad.

Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía. Hipo. Náuseas y vómitos inducidos por quimioterapia. Síndrome de Tourette. Corea.

POSOLOGIA

- Psicosis aguda:

Oral. Adultos: 0,5-2 mg/8-12 h (síntomas moderados) o 3-5 mg/8-12 h (síntomas graves), debiendo ajustarse la dosis de mantenimiento en función de la respuesta clínica, usualmente 0,5-2 mg/6-12 h. Ancianos y pacientes debilitados: 0,5-2 mg/8-12 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica.

IM. Adultos: 2-10 mg/4-8 h.

- Esquizofrenia crónica. Oral. Adultos: 3-6 mg/8-12 h. Ancianos y pacientes debilitados: 0,5-1,5 mg/8-12 h, debiendo ajustarse la dosis de mantenimiento en función de la respuesta clínica, usualmente de 1-2,5 mg/8-12 h. Niños (>3 años): 0,5 mg, debiendo ajustarse la dosis de mantenimiento en función de la respuesta clínica, en incrementos diarios de 0,5 mg cada 5-7 días, usualmente 0,05-0,15 mg/kg/día.

- Náuseas y vómitos. Oral ó IM. Adultos: 1-5 mg/12 h.

Una vez controlados los síntomas agudos, es deseable reducir la dosis hasta un nivel mínimo efectivo como mantenimiento. En tratamientos crónicos se aconseja administrar la mayor parte de la dosis a la hora de acostarse, así como ingerir las formas orales conjuntamente con las comidas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a haloperidol o a butirofenonas, depresión severa del SNC, estados de coma, parkinsonismo, embarazo (se acepta en crisis psicóticas) y lactancia.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardiaca o coronaria), estado depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, hipertiroidismo, feocromocitoma, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, historial de alergia a otros medicamentos y niños (especialmente en aquellos con infección aguda o deshidratación), debiendo modificarse la dosificación inicial en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

El Haloperidol puede potenciar la toxicidad del diazóxido, así como el efecto y la toxicidad de los antidepresivos tricíclicos. Se puede potenciar la toxicidad del haloperidol por: alcohol etílico e indometacina. Se potencia el efecto y la toxicidad del haloperidol por carbamazepina. Se modifican mutuamente las acciones del haloperidol y: biperideno, bornaprina, orfenadrina, oxifenclimina, prociclidina y trihexifenidilo. Se inhiben mutuamente los efectos del haloperidol y metildopa. Se antagonizan mutuamente los efectos del haloperidol y levodopa. Se pueden potenciar mutuamente la toxicidad del haloperidol y litio,carbonato.

El haloperidol puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

-Sangre: aumento (biológico) de transaminasas (ALT y AST), fosfatasa alcalina, bilirrubina, gamma-glutamilttransferasa (GGT), litio, prolactina, TSH-RH, testosterona y TSH. Reducción (biológica) de TSH.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de haloperidol son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. El perfil toxicológico de este fármaco es similar al del resto de butirofenonas antipsicóticas. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Frecuentemente (10-25%): somnolencia, sedación, sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento; al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis.

-Ocasionalmente (1-9%): ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones acneiformes, erupciones maculopapulares, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): hipotensión ortostática (más aguda e intensa tras la administración i.v.), hipertensión,taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rapidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía

(después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Comunicar al médico si aparece temblores, ictericia, alteración de la visión o movimientos musculares involuntarios. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos

LARGACTIL

COMPOSICION POR UNIDAD

CLORPROMAZINA 100 mg.

LACTOSA (EXCIPIENTE)

GLUTEN (EXCIPIENTE) 0.20 mg.

SACAROSA (EXCIPIENTE) 160 mg.

PRESENTACIÓN

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico fenotiazínico.

Antidopaminérgico (especialmente sobre los receptores D2), estimula la producción de prolactina. Presenta intensa actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. También posee débil actividad bloqueante ganglionar, antihistamínica y antiserotonérgica.

FARMACOCINETICA

Vía oral, im: Su biodisponibilidad oral es variable, condicionada por variaciones interindividuales en su metabolismo de primer paso. La biodisponibilidad por vía im es aproximadamente del 50%. El tiempo preciso para que aparezca la acción es de 30-60 min. (oral) y la duración de la misma es de 4-6 h (oral). El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 95-98 %. Es metabolizado ampliamente en hígado y riñón. Se elimina mayoritariamente con la orina y parte con las heces en forma metabolizada. Su semivida de eliminación es de 30 h para la clorpromazina y de hasta 4 semanas para sus metabolitos.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía. Hipo. Náuseas y vómitos inducidos por quimioterapia. Síndrome de Tourette. Corea.

POSOLOGIA

- Indicaciones neuropsiquiátricas:.

Oral. Adultos: 10-25 mg/6-12 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, en 20-50 mg cada 3-4 días, hasta un máximo de 1500 mg/día; en procesos psicóticos graves se recomiendan dosis iniciales de 100-200 mg/12 h. Ancianos y pacientes debilitados: 5-15 mg/6-12 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, en 20-50 mg cada 3-4 días, hasta un máximo de 500-750 mg/día.

Niños: 0,5 mg/kg/4-6 h.

Vía im. Adultos: 25-100 mg/6-8 h. Ancianos y pacientes debilitados: 15-50 mg/6-8 h. Niños: 0,5 mg/kg/6-8 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 40 mg/día (menores de 5 años) o 75 mg/día (mayores de 5 años).

- Náuseas y vómitos:

Oral. Adultos: 10-25 mg/4-6 h. Niños: 0,5 mg/kg/4-6 h.

IM. Adultos: 25 mg, seguido (sí no se produce hipotensión en el paciente) de 25-50 mg/3-4 h. Niños: 0,5 mg/kg/6-8 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 40 mg/día (menores de 5 años) o 75 mg/día (mayores de 5 años).

Una vez controlados los síntomas agudos, es deseable reducir la dosis hasta un nivel mínimo efectivo como mantenimiento. En tratamientos crónicos se aconseja administrar la mayor parte de la dosis a la hora de acostarse, así como ingerir las formas orales conjuntamente con las comidas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a clorpromazina o a fenotiazinas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma y feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), niños, especialmente en aquellos con infección aguda o deshidratación, embarazo (administrada al final de éste, hay riesgo de efectos extrapiramidales en el neonato) y lactancia, debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No es recomendable la exposición prolongada al sol ante el

riesgo de que puedan producirse manifestaciones de fotosensibilidad. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

La clorpromazina puede inhibir el efecto de antidiabéticos orales, así como potenciar la toxicidad de diazóxido y petidina.

La clorpromazina potencia el efecto y la toxicidad de antidepresivos tricíclicos. Se puede inhibir el efecto de la clorpromazina por antiácidos, orfenadrina, prociclidina, prometazina y trihexifenidilo. Se potencia el efecto y la toxicidad de la clorpromazina por cimetidina. Se inhiben mutuamente los efectos de clorpromazina y fenobarbital.

Se antagonizan mutuamente los efectos de la clorpromazina y anfetaminas o levodopa. Se potencian mutuamente la toxicidad de la clorpromazina y alcohol etílico o piperazina.

Se potencian mutuamente el efecto y la toxicidad de la clorpromazina y propranolol y sotalol.

La clorpromazina puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

-Sangre: aumento (biológico) de transaminasas (ALT y AST), fosfatasa alcalina, bilirrubina, glucosa,

lactato-deshidrogenasa (LDH) y prolactina. Reducción (biológica) de HDL-colesterol y TSH-RH.

-Orina: aumento (interferencia analítica) de metadrenalina. Reducción (biológica) de ácido 4-hidroxi-3-metoxi-mandélico; reducción (interferencia analítica) de ácido 5-hidroxiindolacético.

EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de clorpromazina son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Muy frecuentemente (>25%): somnolencia y sedación.

-Frecuentemente (10-25%): sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

-Ocasionalmente (1-9%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; hipotensión ortostática (más aguda e intensa tras la administración i.m.), hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardíaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, ictericia colestática a veces con eosinofilia

(durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faringea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones. El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Evitar la exposición prolongada al sol, o utilizar protectores solares. Utilizar con precaución en climas calurosos, pues aumenta la susceptibilidad a la hipertermia. Comunicar al médico si aparece fiebre, dolor de garganta, erupciones, temblores, ictericia o alteración de la visión. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas.

Embarazo:

Estudios sobre roedores han registrado embriotoxicidad potencial, aumento de la mortalidad neonatal y disminución del rendimiento; no se ha podido excluir la posibilidad de lesiones neurológicas permanentes en la descendencia. La clorpromazina atraviesa la placenta. No hay estudios adecuados y bien controlados en humanos. Aunque existen divergencias, la mayoría de estudios consideran el uso ocasional y a bajas dosis de fenotiazinas seguro para la madre y el feto. Se han descrito casos aislados de ictericia prolongada, hipo o hiperreflexia y efectos extrapiramidales en neonatos con el uso de fenotiazinas cerca del final del embarazo. El uso de este medicamento, en especial durante el 1er trimestre (semanas 6-10), sólo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras. En los casos extremos en que la embarazada deba ser tratada, algunos clínicos recomiendan el uso de agentes de alta potencia. Se deberá utilizar la menor dosis eficaz durante menor periodo posible, descontinuoando el tratamiento al menos 5-10 días antes del parto.

Madres lactantes

La clorpromazina se excreta con la leche materna en bajas cantidades. No se han registrado efectos adversos en recién nacidos, con la excepción de un caso de adormecimiento y letargia en un lactante; por lo que se recomienda que los recién nacidos expuestos al fármaco vía leche sean observados con respecto a la sedación.

La Academia Americana de Pediatría clasifica la clorpromazina como un fármaco cuyo efecto en el lactante es desconocido pero puede ser de importancia a causa del adormecimiento y letargia observado en el niño descrito anteriormente y a causa de la galactorrea inducida en adultos.

Uso en niños:

Los pacientes pediátricos pueden ser más propensos a desarrollar reacciones neuromusculares o extrapiramidales, especialmente distonías, siendo especialmente proclives los niños con enfermedades agudas, como varicela, infecciones del SNC, sarampión, gastroenteritis o deshidratación. A causa de que los síntomas extrapiramidales pueden confundirse con los signos sobre el SNC de una enfermedad primaria no diagnosticada responsable del vómito (p. ej, síndrome de Reye y) otras encefalopatías, evitar el uso de antipsicóticos y otras hepatotoxinas en niños y adolescentes cuyos signos y síntomas sugieran la existencia de síndrome de Reye. Uso precautorio, recomendándose vigilancia estricta durante el tratamiento.

Uso en ancianos:

Los pacientes geriátricos parecen presentar una mayor predisposición a sufrir hipotensión ortostática y una mayor sensibilidad a los efectos anticolinérgicos y sedantes. También tienen más tendencia a padecer efectos secundarios extrapiramidales, como disquinesia tardía (con signos persistentes, difíciles de controlar y en algunos pacientes irreversibles). Se recomienda observación durante el tratamiento para detectar signos precoces de disquinesia tardía y la reducción o interrupción del tratamiento para evitar una manifestación más grave del síntoma. Además, la clorpromazina puede producir reacciones específicas de hipotermia e hipotensión ortostática, debiéndose controlar también la función cardíaca. Los ancianos pueden presentar mayores concentraciones plasmáticas

LEBOPRIDE

COMPOSICION POR UNIDAD

SULPIRIDA 50 mg.

PRESENTACIÓN

CÁPSULAS 50 mg.

COMPRIMIDOS 200 mg.

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico derivado del grupo de las benzamidas sustituidas. Antidopaminérgico (especialmente sobre los receptores D2), estimula la producción de prolactina.

Presenta ligera actividad antiemética, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. Su actividad anticolinérgica es casi nula. Puede alterar la concentración sérica de gastrina, por lo que ha sido utilizado como antiulceroso.

FARMACOCINETICA

Vía oral, im: Su biodisponibilidad oral es pequeña (25-35%) y sujeta a variaciones interindividuales. El grado de unión a proteínas plasmáticas es > 40 %. No sufre a penas

metabolismo, siendo eliminada mayoritariamente con la orina en un 92 % en forma inalterada. Su semivida de eliminación es de 7-9 h.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Neurosis fóbica. Neurosis obsesivo-compulsiva. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

Vértigo.

POSOLOGIA

Vía oral:

- Neurosis y vértigo. Adultos: 50-100 mg/8 h.
- Psicosis: Adultos: 100-200 mg/6 h. Niños: 2-3 mg/kg/8 h.

Se recomienda administrar conjuntamente con las comidas.

Vía im:

- Adultos: 600-800 mg/día (durante 15-20 días).

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a sulpirida o a otras benzamidas (ej: tiaprida), feocromocitoma, embarazo y lactancia.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, epilepsia, parkinsonismo y ancianos, debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática.

MELERIL 10 MG 500 GRAGEAS

PRESENTACIÓN

GRAGEAS DE 10 Y 100 mg.

GOTAS DE 30 mg. / ml.

COMPRIMIDOS RETARD 200 mg.

MELERIL SUSPENSIÓN 2 mg. / ml.

COMPOSICION POR UNIDAD

TIORIDAZINA , CLORHIDRATO 10 mg.

LACTOSA (EXCIPIENTE)

SACAROSA (EXCIPIENTE)

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico fenotiazínico.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina comportándose como antiemético débil. Presenta intensa actividad anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica.

FARMACOCINETICA

Vía oral: Es absorbida rápidamente y de forma completa ($T_{max}=2-4$ h). El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 90%. Es metabolizada intensamente en el hígado, dando lugar entre otros a dos metabolitos farmacológicamente activos (mesoridazina y sulforidazina), siendo eliminado mayoritariamente con las heces, y un 35 % con la orina. Su semivida de eliminación es de 10-21 h, tioridazina; 16 h, mesoridazina; 13 h, sulforidazina.

INDICACIONES

Adultos.

- Ansiedad (estados de ansiedad, angustia o emotividad alterada). Ansiedad-depresión. Transtornos psicósomáticos (referidos al aparato cardiovascular, gastrointestinal, neuromuscular, etc). Psicosis. Transtornos de la conducta y afectividad.

Niños.

- Niños difíciles. Inadaptación escolar. Terrores nocturnos. Anorexia nerviosa. Sonambulismo. Inquietud (en el curso de enfermedades infecciosas).

POSOLOGIA

- Adultos, oral.

Tranquilizante y ansiolítico (gotas, grageas de 10 mg): 10-60 mg/día, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta una dosis máxima de 100 mg diarios. Dosis mínima, 10 mg/día.

Psicosis y trastornos de la conducta y afectividad (grageas de 50, 100 y 200 mg): 50-600 mg/día. Formas retardadas: 100-600 mg al acostarse. Dosis mínima 50 mg/día. Dosis máxima: 800 mg/día.

- Niños, oral. Niños menores de 2 años: 3-9 mg/día. Niños de 2-6 años: 10-20 mg/día. Niños de 6-12 años: 10-30 mg/día. La dosis máxima diaria es de 40 mg en niños y 3 mg/kg en lactantes y la dosis mínima diaria es de 5 mg en niños y de 0,5 mg/kg en lactantes.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a tioridazina o a fenotiazinas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma y feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardiaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No es recomendable una exposición prolongada al sol ante el riesgo de que puedan producirse manifestaciones de fotosensibilidad. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Alcohol etílico: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la depresión del sistema nervioso central.
- Antidepresivos tricíclicos (amitriptilina, desipramina, nortriptilina): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de antidepresivos, con potenciación de la toxicidad, por posible inhibición de su metabolismo hepático.
- Antidiabéticos: hay algún estudio en el que se ha registrado efecto hiperglucemiante de fenotiazinas como la clorpromazina, lo que podría inhibir el efecto de los antidiabéticos.
- Betabloqueantes (pindolol, propranolol): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de ambos fármacos, con posible potenciación de la acción y/o toxicidad. No se ha establecido el mecanismo.
- Diazóxido: hay un estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con precoma diabético, por posible adición de sus efectos hiperglucemiantes.
- Fenitoína: hay algún estudio en el que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de fenitoína, con potenciación de la toxicidad, por posible inhibición de su metabolismo hepático.
- Fenilpropanolamina: hay un estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con resultado de muerte. No se ha establecido el mecanismo.
- Fenobarbital: hay estudios en los que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de la fenotiazina, con posible inhibición de su efecto, por posible inducción de su metabolismo hepático.
- Fluoxetina: hay algún estudio con otras fenotiazinas en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con manifestaciones neurológicas extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.

- Levodopa: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado aumento de la toxicidad e inhibición mutua de sus efectos, por antagonismo a nivel de la acción dopaminérgica - Naltrexona: hay un estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad con aparición de letargo y sueño. No se ha establecido el mecanismo.

- Sales de litio (carbonato de litio): hay estudios en los que se ha registrado potenciación de la neurotoxicidad, con presencia de akatisia o diskinesia. No se ha establecido el mecanismo.

- Trazodona: hay un estudio en el que se ha registrado potenciación de la hepatotoxicidad.

La tioridazina puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

- Sangre: aumento (biológico) de prolactina. Reducción (biológica) de fenobarbital, TSH-RH y testosterona.

EFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de tioridazina son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Muy frecuentemente (>25%): somnolencia y sedación.

-Frecuentemente (10-25%): sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.

-Ocasionalmente (1-9%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; hipotensión ortostática, hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Evitar la exposición prolongada al sol, o utilizar protectores solares. Utilizar con precaución en climas calurosos, pues aumenta la susceptibilidad a la hipertermia.

Comunicar al médico si aparece fiebre, dolor de garganta, erupciones, temblores, ictericia o alteración de la visión. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas.

MODECATE 25 MG 1 AMPOLLA 1 ML

PRESENTACIÓN

AMPOLLAS DE 1 ml.

COMPOSICION POR UNIDAD

FLUFENAZINA , DECANOATO 25 mg.

ALCOHOL BENCILICO (EXCIPIENTE)

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico fenotiazínico.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina. Presenta actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. También posee débil actividad bloqueante ganglionar, antihistamínica y antiserotoninérgica.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

POSOLOGIA

Vía im. Adultos: 12,5-25 mg/2-3 semanas, pudiendo incrementarse la dosis, en función de la respuesta clínica, en 12,5 mg por administración, hasta un máximo de 100 mg/2-4 semanas. Ancianos, pacientes debilitados o con historial de reacciones extrapiramidales: 2,5 mg, seguido de 2,5-5 mg/10-14 días durante el primer mes.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a flufenazina o a fenotiazinas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma, feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en

ancianos. No es recomendable la exposición prolongada al sol ante el riesgo de que puedan producirse manifestaciones de fotosensibilidad. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Alcohol etílico: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con depresión del sistema nervioso central y reacciones extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.

- Anticolinérgicos: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de la fenotiazina, con inhibición de su efecto, por disminución de su absorción.

- Antidiabéticos: hay algún estudio en el que se ha registrado efecto hiperglucemiante de fenotiazinas como la clorpromazina, lo que podría inhibir el efecto de los antidiabéticos.

- Antidepresivos tricíclicos (desipramina, imipramina): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos del antidepresivo, con potenciación de la toxicidad, por posible inhibición de su metabolismo hepático.

- Antiepilépticos (carbamazepina, fenitoína, fenobarbital, valproico): hay estudios con otras fenotiazinas en los que se ha registrado variaciones en los niveles plasmáticos de ambos fármacos por afectación de su metabolismo hepático.

- Clonidina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con aparición de síndrome cerebral, por posible antagonismo a nivel dopaminérgico.

- Fluoxetina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con manifestaciones neurológicas extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.

- Sales de litio (carbonato de litio): hay estudios en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con reacciones extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.

La flufenazina puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

- Sangre: aumento (biológico) de transaminasas (ALT y AST), fosfatasa alcalina, bilirrubina, creatina kinasa, gamma glutamiltransferasa (GGT), lactato deshidrogenasa (LDH) y prolactina.

EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de flufenazina son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación

de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Frecuentemente (10-25%): somnolencia, sedación, sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento; al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis.

-Ocasionalmente (1-9%): ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones acneiformes, erupciones maculopapulares, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): hipotensión ortostática, hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Evitar la exposición prolongada al sol, o utilizar protectores solares. Utilizar con precaución en climas calurosos, pues aumenta la susceptibilidad a la hipertermia.

Comunicar al médico si aparece fiebre, dolor de garganta, erupciones, temblores, ictericia o alteración de la visión. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas

MUTABASE 2/25 MG 40 GRAGEAS

PRESENTACIÓN

GRAGEAS

COMPOSICION POR UNIDAD

AMITRIPTILINA , CLORHIDRATO

PERFENAZINA

LACTOSA (EXCIPIENTE)

SACAROSA (EXCIPIENTE)

ACCION Y MECANISMO

Antidepresivo y antipsicótico.

INDICACIONES

Tratamiento de estados depresivos acompañados de ansiedad o episodios psicóticos.

POSOLOGIA

Individualizar la dosis para cada paciente.

Oral. Adultos. Dosis inicial: Neurosis leves, 1 gragea de 2/10, 3-4 veces al día. Ansiedad asociada a depresión leve, 1 gragea de 4/10, 3-4 veces al día. En casos más graves pueden administrarse las formas 2/25 ó 4/25. En esquizofrenia grave, 2 grageas de 4/25, 3 veces al día.

CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a alguno de los componentes.

Depresión de la médula ósea.

Insuficiencia hepática grave.

Glaucoma, hipertrofia prostática.

Infarto de miocardio recientes, taquicardia paroxística.

PRECAUCIONES

No se recomienda su uso en niños menores de 12 años ni en embarazo.

Precaución en pacientes con historial de enfermedad cardiovascular, epilepsia, insuficiencia renal e hipertensión.

Puede disminuir la capacidad de concentración y los reflejos. No conducir bajo su efecto.

Los ancianos son más susceptibles a su acción. Controlar la posología.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

El alcohol u otros depresores pueden potenciar su efecto sedante.

Puede antagonizar el efecto antihipertensivo de la guanetidina

ORAP 1 mg. 20 COMPRIMIDOS

PRESENTACIÓN

COMPRIMIDOS DE 1 Y 4 mg.

COMPOSICION POR UNIDAD

PIMOZIDA 1 mg.

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico derivado de la difenilbutilpiperidina estructuralmente relacionado con las butirofenonas.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina. Presenta intensa actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica.

FARMACOCINETICA

Vía oral: Su biodisponibilidad es del 40-50%, sufre amplio metabolismo de primer paso ($T_{max}=4-12$ h). Es metabolizado en el hígado, siendo su principal ruta metabólica la N-dealquilización, dando lugar a metabolitos inactivos que se eliminan principalmente por orina (>1% en forma inalterada) y en menor cantidad con las heces.

Su semivida de eliminación es de 55 h. Se han llegado a obtener valores de 150 h en un paciente con reacción distónica grave.

INDICACIONES

- Psicosis: psicosis agudas y crónicas (en pacientes sensibles a neurolépticos). Tratamiento de ataque en pacientes ambulatorios y hospitalizados, siempre que la agresividad, agitación o ansiedad graves no sean los síntomas dominantes. Tratamiento de los casos límite y de las alteraciones de la personalidad que requieren una mejor adaptación social.

- Síndrome de Tourette.

POSOLOGIA

Vía oral:

- Síndrome de Tourette. Adultos: 1-2 mg/24 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria cada dos días, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 0,2 mg/kg/día (10 mg/día). Niños: 0,05 mg/kg/24 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria cada tres días, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 0,2 mg/kg/día (10 mg/día).

- Psicosis paranoide. Adultos: 4 mg/24 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 16 mg/24 h.

- Resto de indicaciones neuropsiquiátricas: 4-12 mg/24 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria en 2-4 mg cada semana, hasta un máximo de 20 mg/24 h. Una vez controlados los síntomas agudos, es deseable reducir la dosis hasta un nivel mínimo efectivo como mantenimiento. En tratamientos crónicos se aconseja administrar la

mayor parte de la dosis a la hora de acostarse, así como ingerir las formas orales conjuntamente con las comidas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a pimozida o a fenotiazinas, historial de arritmias cardíacas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma y feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardíaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), deshidratación u otros estados que pudieran derivar en hipokalemia, debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Fluoxetina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad con aparición de bradicardia. No se ha establecido el mecanismo.

- Levodopa: hay estudios con clorpromazina en los que se ha registrado aumento de la toxicidad e inhibición mutua de sus efectos, por antagonismo a nivel dopaminérgico.

La pimozida puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

- Sangre: aumento (biológico) de prolactina, TSH-RH y TSH. Reducción (biológica) de hormona folículo estimulante (FSH), hormona luteinizante (LH) y hormona estimulante del tiroides (TSH).

EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de pimozida son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Las reacciones adversas más características son:

-Frecuentemente (10-25%): somnolencia, sedación, sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento; al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis.

-Ocasionalmente (1-9%): ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones acneiformes, erupciones maculopapulares, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.

-Raramente (<1%): hipotensión ortostática, hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardíaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento),

diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonia faringea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Comunicar al médico si aparece temblores, ictericia, alteración de la visión o movimientos musculares involuntarios. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse controles electrocardiográficos, recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas.

EFFECTOS ADVERSOS

Somnolencia, efectos anticolinérgicos (sequedad de boca, estreñimiento, retención urinaria, etc).

Hipotensión postural, palpitaciones, aumento de peso, disminución de la libido.

Excepcionalmente, reacciones alérgicas y agranulocitosis.

Con dosis elevadas: Reacciones extrapiramidales.

PLENUR 400 MG 100 COMPRIMIDOS

PRESENTACIÓN

COMPRIMIDOS DE 400 mg.

COMPOSICION POR UNIDAD

LITIO,CARBONATO 400 mg.

ACCION Y MECANISMO

Antimaniaco. Como catión monovalente que es, actúa compitiendo con otros iones monovalentes y divalentes a nivel celular (principalmente con el ión sodio), en diversos lugares del organismo; esta circunstancia le confiere una gran multiplicidad de acciones dependiendo del órgano o sistema de que se trate. SNC: antimaniaco y antidepresivo. Hematológico: activador del factor estimulante de neutrofilos y plaquetas.

Endocrino: antitiroideo. Etc.

Actualmente su empleo en terapéutica está basado exclusivamente en su actividad sobre el SNC inhibiendo la despolarización que provocan las catecolaminas, mecanismo relacionado con la manía y la depresión.

FARMACOCINETICA

Vía oral: Su biodisponibilidad es del 95- 100%. Es absorbido rápidamente ($T_{max}=1/2-3$ h). El tiempo preciso para que aparezca la acción antimanía es de 5-7 días, el efecto terapéutico total requiere de 10 a 21 días. No se une a proteínas plasmáticas. No se metaboliza, siendo eliminado mayoritariamente con la orina (90 %) y en muy pequeña cantidad con las heces. Su semivida de eliminación es de: 20-24 h (función renal normal), 2-4 días (pacientes sometidos a terapia durante más de 1 año), 36 h (pacientes geriátricos), 40-50 h (insuficiencia renal).

El litio es eliminable mediante diálisis, tanto hemodiálisis como diálisis peritoneal.

INDICACIONES

- Psicosis maniaco-depresiva: prevención y tratamiento.
- Depresión: depresión unipolar recurrente y depresión endógena resistente a tratamiento convencional.
- Neutropenia por quimioterapia. Aplasia medular. Síndrome de Felty.

POSOLOGIA

Vía oral.

- Adultos: generalmente, 200-600 mg/8 h, ajustando la dosis diaria en 300 mg cada dos días, en función de la respuesta clínica, hasta conseguir unos niveles séricos de litio de 0,75- 1,5 mEq/l. Se aconseja ingerir el medicamento entero, pudiendo ayudar la ingestión con agua u otro líquido.

- Nota: atenerse estrictamente a las indicaciones del médico. Las dosis anteriores son meramente orientativas.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia al medicamento.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en insuficiencia renal o cardíaca, diabetes, bocio o hipotiroidismo, deshidratación (vómitos, diarrea, sudoración profusa, infecciones severas, etc) y pacientes con dieta restrictiva en sal.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

El litio, carbonato puede inhibir el efecto de la clorpromazina, así como potenciar la toxicidad de clozapina y sulpirida. Se potencia el efecto del litio, carbonato por diuréticos tiazídicos. Se inhibe el efecto del litio, carbonato por: acetazolamida, aminofilina,

bicarbonato sodico, Plantago ovata (forsk.), poliestirensulfonato sodico, sodiocarbonato, sodio cloruro, sodio sulfato, teofilina. Se potencia la toxicidad del litio, carbonato por tioridazina.

Se potencia el efecto y la toxicidad del litio, carbonato por:alprazolam, carbamazepina, diclofenac, fluoxetina, furosemida, ibuprofeno, indapamida, indometacina,metildopa y piroxicam.

Se potencian mutuamente la toxicidad del litio, carbonato y:alcohol etílico, fenelzina, haloperidol y verapamilo.

El carbonato de litio puede alterar los valores de las siguientes determinaciones analíticas:

-Sangre: aumento (biológico) de calcio, glucosa y TSH.

-Orina: reducción (biológica) de calcio.

EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de carbonato de litio son, en general, frecuentes y moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, las reacciones adversas son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central y al aparato digestivo. Las reacciones adversas son más frecuentes con dosis que condicionan unos niveles plasmáticos superiores a 1,5 mEq/litro; por encima de 2 mEq/litro se presentan reacciones adversas graves, según las respuestas individuales. Las reacciones adversas más características son:

-Frecuentemente (10-25%): temblor fino de manos, poliuria y polidipsia durante el inicio del tratamiento, pero pueden persistir.

-Ocasionalmente (1-9%): náuseas leves y transitorias y malestar general pueden aparecer durante los primeros días; aumento de peso, alteraciones digestivas (sequedad de boca, dolor epigástrico, dolor abdominal, flatulencia), cambios en el ECG.

-Raramente (<1%): con niveles de litemia superiores a 2 mEq/litro: confusión, disfasia, mioclonía de los miembros completos, coreoatetosis, incontinencia urinaria, disartria, miotonía e hiperreflexia.

-Excepcionalmente (<<1%): bocio, leucocitosis, diabetes insípida nefrógena, pseudotumor cerebral.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente, después de comunicar con el médico, en el caso de que el paciente experimente algún episodio de diarrea, vómitos, agitación, somnolencia o miastenia.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Durante el tratamiento se debe beber diariamente de 8 a 12 vasos de agua u otro líquido. Se deben determinar los niveles plasmáticos de litio (rango: 0,6-1,2 mEq/litro) y las funciones tiroidea y renal, de forma periódica durante la terapia

SINOGAN

PRESENTACIÓN

AMPOLLAS DE 25 mg.

COMPRIMIDOS DE 25 Y 100 mg.

GOTAS 4 %

COMPOSICION POR UNIDAD

LEVOMEPRMAZINA , CLORHIDRATO 25 mg.

LACTOSA (EXCIPIENTE)

GLUTEN (EXCIPIENTE)

ACCION Y MECANISMO

Antipsicótico fenotiazínico.

Antidopaminérgico, estimula la producción de prolactina. Presenta intensa actividad antiemética, anticolinérgica, sedante y bloqueante alfa-adrenérgica. También posee cierta actividad antipruriginosa, anestésica local y analgésica.

FARMACOCINETICA

Vía oral, im: La biodisponibilidad oral es del 50%. Se absorbe rápidamente (Tmax=1-3 h, oral; 30-90 min,parenteral). La duración de la acción es de aproximadamente 4 h, (im). Se metaboliza en el hígado, teniendo actividad farmacológica alguno de sus metabolitos. Se elimina con las heces y la orina, el 1% en forma inalterada.

Su semivida de eliminación es de 15-78 h.

INDICACIONES

Neurosis de ansiedad. Esquizofrenia. Paranoia. Delirio. Manía.

POSOLOGIA

Adultos:.

- Vía oral: 12,5-25 mg/12 h, pudiendo incrementarse la dosis diaria, en función de la respuesta clínica, hasta un máximo de 50-75 mg/8 h (250 mg/día).

- Vía im: 25 mg/6-8 h.

- Nota: Una vez controlados los síntomas agudos, es deseable reducir la dosis hasta un nivel mínimo efectivo como mantenimiento.

- Normas para la correcta administración: En tratamientos crónicos se aconseja administrar la mayor parte de la dosis a la hora de acostarse, así como ingerir las formas orales conjuntamente con las comidas. El paciente deberá permanecer sentado o tumbado entre media y una hora después de las primeras dosis.

CONTRAINDICACIONES Y PRECAUCIONES

Contraindicado en alergia a levomepromazina o a fenotiazinas, depresión severa del SNC o de la médula ósea, estados de coma y feocromocitoma.

Precauciones: Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardiaca o coronaria), asma crónico, estados depresivos, glaucoma en ángulo cerrado, parkinsonismo, hipertrofia de próstata o retención urinaria, epilepsia, pacientes expuestos a temperaturas extremas (calor o frío intenso), debiendo modificarse la dosificación en insuficiencia renal o hepática y en ancianos. No es recomendable una exposición prolongada al sol ante riesgo de que puedan producirse manifestaciones de fotosensibilidad. No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante el tratamiento. Evitar el consumo de bebidas alcohólicas.

INTERACCIONES/INTERFERENCIAS ANALITICAS

- Alcohol etílico: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con depresión del sistema nervioso central y reacciones extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.

- Anticolinérgicos: hay estudios con otras fenotiazinas (clorpromazina) en los que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de la fenotiazina, con inhibición de su efecto, por disminución de su absorción.

- Antidiabéticos: hay algún estudio en el que se ha registrado efecto hiperglucemiante de fenotiazinas, lo que podría inhibir el efecto de los antidiabéticos.

- Antidepresivos tricíclicos (amitriptilina, nortriptilina): hay estudios en los que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos del antidepresivo, con potenciación de la toxicidad, por posible inhibición de su metabolismo hepático.

- Antidepresivos IMAO (tranilcipromina): hay un estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con resultado fatal. No se ha establecido el mecanismo.

- Antiepilépticos (carbamazepina, fenitoína, fenobarbital, valproico): hay estudios con otras fenotiazinas en los que se ha registrado variaciones en los niveles plasmáticos de ambos fármacos por afectación de su metabolismo hepático.
- Fluoxetina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con manifestaciones neurológicas extrapiramidales. No se ha establecido el mecanismo.
- Petidina: hay algún estudio en el que se ha registrado potenciación de la toxicidad de petidina, por inducción de su metabolismo hepático, aumentando así los niveles de metabolitos tóxicos de la petidina.
- Sales de litio (carbonato de litio): hay estudios en los que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de clorpromazina, con posible inhibición de su efecto, por disminución de su absorción.

EFFECTOS ADVERSOS

Los efectos adversos de levomepromazina son, en general, frecuentes, aunque moderadamente importantes. En la mayor parte de los casos, los efectos adversos son una prolongación de la acción farmacológica y afectan principalmente al sistema nervioso central. Los efectos adversos más característicos son:

- Muy frecuentemente (>25%): somnolencia y sedación.
- Frecuentemente (10-25%): sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento.
- Ocasionalmente (1-9%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; hipotensión ortostática (más aguda e intensa tras la administración i.m.), hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardíaca congestiva, arritmia cardíaca, colapso, ictericia colestática a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo paralítico.
- Raramente (<1%): agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; galactorrea, amenorrea, retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

ADVERTENCIAS ESPECIALES

Evitar la exposición prolongada al sol, o utilizar protectores solares. Utilizar con precaución en climas calurosos, pues aumenta la susceptibilidad a la hipertermia.

Comunicar al médico si aparece fiebre, dolor de garganta, erupciones, temblores, ictericia o alteración de la visión. Se aconseja la suspensión gradual de tratamientos prolongados, para evitar el riesgo de síndrome de retirada o la rápida recaída en la enfermedad. Durante tratamientos crónicos deben realizarse recuentos sanguíneos y revisiones oftálmicas periódicas.