

Apracal®



Haloperidol 5 mg

Vía oral

Tabletas Recubiertas

Fórmula

Cada tableta recubierta contiene **Haloperidol 5 mg**.

Indicaciones

Como agente neuroléptico en:

- Ilusiones y alucinaciones en: Esquizofrenia aguda y crónica. Paranoia. Estado de confusión agudo, alcoholismo
- Ilusiones hipocondríacas.
- Desórdenes de la personalidad: Paranoide, esquizoide, esquizotipo, antisocial, algunas personalidades "límitrofes" y otras.

Como agente contra la agitación psicomotora en

- Manía, demencia, retardo mental, alcoholismo.
- Desórdenes de la personalidad: compulsiva, paranoide, histriónica y otras.
- Agitación, agresividad e impulsos de desvarío en ancianos.
- Desórdenes del comportamiento y carácter en niños.
- Movimientos coreicos.
- Hipo.
- Tics, tartamudeo.

Como adyuvante en el tratamiento del dolor crónico: En base de su actividad límbica, **Apracal** a menudo permite que la dosis del analgésico sea reducida.

Como antiemético en: Náusea y vómito de variado origen. **Apracal** es la droga de preferencia si las medicinas clásicas para la náusea y el vómito son insuficientemente activas.

Dosis y vía de administración

Adultos

Como agente neuroléptico

- **Fase aguda:** Episodios agudos de esquizofrenia, delirium tremens, paranoia, confusión aguda, síndrome de Korsakoff, paranoia aguda, 10-20 mg vía oral, a ser repetido cada hora hasta que se obtenga suficiente control de la sintomatología, hasta un máximo de 60 mg/día.
- **Fase crónica:** Esquizofrenia crónica, alcoholismo crónico, desórdenes crónicos de la personalidad. 1-3 mg vía oral, tres veces al día, puede incrementarse a 10-20 mg tres veces al día, dependiendo de la respuesta.

Como agente para el tratamiento de agitación psicomotora

- **Fase crónica:** 0.5-1 mg tres veces al día oralmente, puede incrementarse a 2-3 mg tres veces al día, si se requiere, para obtener respuesta.
- Como adyuvante en el tratamiento del dolor crónico: 0.5-1 mg tres veces al día oralmente, puede ajustarse de ser necesario.
- En pacientes ancianos: El tratamiento debe iniciarse con la mitad de la dosis establecida para los adultos y de ser necesario, ajustar la dosis de acuerdo con los resultados.

En niños: 0.1 mg/kg de peso corporal tres veces al día por vía oral; puede ajustarse la dosis de ser necesario.

Acción farmacodinamia y farmacocinética

Farmacodinamia:

Apracal es un neuroléptico que pertenece al grupo químico de las butirofenonas.

Es un potente antagonista central de los receptores dopaminérgicos y, por tanto, se lo clasifica dentro de los neurolépticos mayores. Como consecuencia directa de su efecto bloqueante dopaminérgico central, tiene una actividad incisiva en las alucinaciones y en las ilusiones y una actividad en los ganglios basales.

Apracal causa sedación psicomotora eficiente, lo que explica su efecto benéfico en la manía y otros síndromes de agitación. En base a su actividad límbica, ejerce una actividad neuroléptica sedante y ha mostrado ser útil como adyuvante en el tratamiento del dolor crónico. La actividad sobre los ganglios basales incrementa los efectos colaterales motores extrapiramidales (distoria, acatisia y parkinsonismo).

Los efectos antidopaminérgicos periféricos explican su actividad contra la náusea y el vómito, la relajación de los esfínteres gastrointestinales y el incremento en la secreción de prolactina.

Farmacocinética:

Los niveles plasmáticos pico de **Apracal** ocurren entre 2 y 6 horas de la dosificación oral. Luego de la administración oral, la biodisponibilidad de la droga es del 60-70%.

La vida media plasmática es de 24 horas (12-38) luego de la administración oral.

Se ha sugerido que el rango de concentración plasmática de **Apracal** de 4 µg/l a un límite superior de 20 a 25 µg/l, es requerida para una respuesta terapéutica.

Apracal atraviesa la barrera hematoencefálica fácilmente. La unión a proteínas plasmáticas es del 92%. La excreción se da en las heces (60%) y en la orina (40%). Alrededor del 1% de la droga se elimina sin cambios por la orina. El volumen de distribución en el estado estable es amplio (7.9 ± 2.5 l/kg).

Contraindicaciones

Estado de coma; depresión del SNC debido al alcohol o a medicamentos sedantes; enfermedad de Parkinson; hipersensibilidad conocida al **Apracal**; lesiones de los ganglios basales.

Precauciones y Advertencias

Casos raros de muerte súbita se han reportado en pacientes psiquiátricos que han estado recibiendo drogas antipsicóticas, como **Apracal**. Puesto que se ha observado prolongación del segmento QT durante el tratamiento con **Apracal**, se recomienda tener precauciones con pacientes que tengan condiciones que prolonguen el QT.

Como **Apracal** se metaboliza en el hígado, se recomienda precaución en pacientes con hepatopatías previas.

Se recomienda precaución en pacientes que sufren de epilepsia y en condiciones que predisponen a crisis convulsivas (como por ejemplo, abstinencia alcohólica y lesiones cerebrales).

La tiroxina puede facilitar la toxicidad de **Apracal**. En consecuencia debe usarse con el máximo cuidado en pacientes con hipertiroidismo.

En casos de esquizofrenia, la respuesta al tratamiento con drogas antipsicóticas puede ser lenta. Asimismo, al suspender su administración, es posible que los síntomas no vuelvan a manifestarse hasta pasadas varias semanas o meses.

Tras la suspensión repentina de dosis altas de drogas antipsicóticas se han descrito, muy raras veces, síntomas agudos como náuseas, vómitos e insomnio. Asimismo pueden darse recidivas y se recomienda una suspensión gradual.

Restricciones de uso durante el embarazo y la lactancia

Apracal deberá ser utilizado durante el embarazo, sólo si el beneficio justifica el potencial riesgo del feto.

Apracal se excreta por la leche materna. Si el uso de **Apracal** se considera imprescindible, los beneficios de la lactancia materna deberán sopesarse frente a sus riesgos potenciales.

Se han observado síntomas extrapiramidales en infantes alimentados con el seno de madres tratadas con **Apracal**.

Efectos sobre la aptitud para conducir y manejar máquinas: Sobre todo a dosis

elevadas y en la fase inicial del tratamiento puede darse un cierto grado de sedación o una disminución de la agudeza mental, efectos que pueden acentuarse bajo la influencia del alcohol. Se le recomendará al paciente que no conduzca ni maneje máquinas durante el tratamiento hasta que no se conozca su propensión a dichos efectos.

Reacciones adversas

Los más comunes son los efectos neurológicos.

Síntomas extrapiramidales: Al igual que con todos los neurolépticos, pueden presentarse síntomas extra-piramidales, tales como temblor, rigidez, hipersalivación, bradiquinesia, acatisia, distonía aguda.

Disquinesia tardía: Como ocurre con todas las drogas antipsicóticas, se puede presentar disquinesia tardía en algunos pacientes sometidos a un tratamiento prolongado o después de interrumpirlo. El síndrome se caracteriza sobre todo por movimientos rítmicos involuntarios de la lengua, el rostro, la boca o las mandíbulas. El tratamiento debe discontinuarse tan pronto como sea posible.

Síndrome neuroléptico maligno: Al igual que ocurre con otras drogas antipsicóticas, se ha relacionado a **Apracal** con el síndrome neuroléptico maligno, una rara respuesta idiosincrática caracterizada por hipertermia, rigidez muscular generalizada, inestabilidad autonómica, alteración de la conciencia. La hipertermia es a menudo un síntoma precoz de este síndrome.

Otros efectos sobre el SNC: Se han descrito alguna que otra vez e incluyen: depresión, sedación, agitación, somnolencia, insomnio, dolor de cabeza, confusión, vértigo, crisis convulsivas tipo gran mal y aparente exacerbación de los síntomas psicóticos.

Síntomas gastrointestinales: Se han registrado casos de náuseas, con vómitos, pérdida del apetito y dispepsia. Pueden darse variaciones de peso.

Efectos endocrinos: Los efectos hormonales de las drogas antipsicóticas incluyen la hiperprolactinemia, que puede causar galactorrea, ginecomastia y oligorrea o amenorrea. Se han descrito casos aislados de hipoglucemia y del síndrome de secreción inapropiada de ADH.

Efectos cardiovasculares: En algunos pacientes se ha registrado taquicardia e hipotensión. Muy raras veces se han descrito prolongación del intervalo QT y/o arritmias ventriculares, predominantemente durante el uso de **Apracal** parenteral.

Misceláneos: Se han registrado ocasionalmente casos de reducciones ligeras y señaladamente transitorias de los recuentos de las células de la sangre.

Se han descrito casos aislados de anomalías de la función hepática o de hepatitis, más a menudo colestática.

Sólo en casos excepcionales se dan reacciones de hipersensibilidad como salpullido, urticaria y anafilaxia.

Otros efectos secundarios descritos en ocasiones son: estreñimiento, visión borrosa, sequedad de boca, retención urinaria, priapismo, edema periférico, hipersudoración e hipersalivación, pirosis, alteraciones en la regulación de la temperatura.

Interacciones medicamentosas y de otro género

Al igual que todos los neurolépticos, **Apracal** puede aumentar la depresión del sistema nervioso central producida por otras drogas depresoras del SNC como el alcohol, los hipnóticos, los sedantes o los analgésicos fuertes. Asimismo se ha descrito una intensificación de su efecto sobre el SNC cuando se combina con metildopa.

Apracal puede menoscabar los efectos antiparkinsonianos de la levodopa.

Apracal inhibe la metabolización de antidepresivos tricíclicos, aumentando así las concentraciones plasmáticas de estos medicamentos.

En estudios farmacocinéticos se ha reportado incremento leve a moderado de los niveles de **Apracal** cuando se administra concomitantemente con las siguientes drogas: quinidina, buspirona, fluoxetina. Puede ser necesario reducir la dosis de **Apracal**. Cuando tratamientos prolongados con drogas inductoras enzimáticas como carbamazepina, fenobarbital o rifampicina se añaden a la terapia con **Apracal**, se observa una reducción significativa de las concentraciones plasmáticas del **Apracal**. Por consiguiente, de ser necesario, se debe ajustar la dosis de **Apracal** durante un tratamiento combinado. Después de suspender la administración de dicha droga, puede ser necesario reducir la dosis de **Apracal**.

En casos raros se han reportado los siguientes síntomas durante el tratamiento concomitante de litio y **Apracal**: encefalopatía, síntomas extrapiramidales, disquinesia tardía, síndrome neuroléptico maligno, desórdenes del tallo cerebral, síndrome agudo cerebral y coma. La mayoría de estos síntomas fueron reversibles. Se mantiene obscuro si esto representa una entidad clínica distinta.

Sea como fuere, se recomienda suspender inmediatamente el tratamiento simultáneo de litio y **Apracal** si el paciente presenta estos síntomas.

Se ha descrito efecto antagónico con el anticoagulante fenindiona. **Apracal** puede asimismo antagonizar con la acción de la adrenalina y de otros agentes simpaticomiméticos y contrarrestar el efecto hipotensor de agentes bloqueantes adrenérgicos como la guanetidina.

Sobredosificación

Sintomatología: Se manifiesta por una exageración de los efectos farmacológicos conocidos y de los efectos adversos. Los síntomas más destacados son: reacciones extrapiramidales severas, hipotensión, sedación. La reacción extrapiramidal se manifiesta por la rigidez muscular y un temblor generalizado o localizado. También puede producirse hipertensión en lugar de hipotensión.

Tratamiento: No existe antídoto específico. El tratamiento es de apoyo pero se recomienda lavado de estómago o inducción de vómito (a no ser que el paciente esté aturdido, comatoso o en estado convulsivo), seguido de la administración de carbón activado.

En los pacientes comatosos se establecerá una vía respiratoria utilizando un método de apoyo orofaríngeo o un tubo endotraqueal. La depresión respiratoria puede requerir respiración artificial.

El ECG y los signos vitales se monitorizarán permanentemente hasta que el ECG sea normal. Las arritmias severas se tratarán con medidas antiarrítmicas adecuadas.

La hipotensión y el colapso circulatorio se pueden contrarrestar usando líquidos intravenosos, plasma o albúmina concentrada y agentes vasoconstrictores como la dopamina o la noradrenalina. No se usará adrenalina, ya que en combinación con **Apracal** podría causar hipotensión profunda.

En caso de reacciones graves de tipo extrapiramidal se administrará medicación antiparkinsoniana (mesi-lato de benzotropina 1 ó 2 mg IM o IV) por vía parenteral.

Presentación

APRACAL 5mg Tableta Recubierta cajas por 20, 30, 50, 60, 100 y 250 Tabletas.

Contraindicado en el embarazo o cuando se supone su existencia.

Producto de uso delicado, adminístrese bajo prescripción y vigilancia médica.

Venta bajo receta médica.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Consérvese a temperatura no mayor a 30°C.

Registros Sanitarios:

Ecuador No. H3220113

Elaborado por **Laboratorios Siegfried S.A.S.**, Bogotá, D.C. - Colombia.

Importado y Distribuido por **Laboratorios Siegfried S.A.** Quito - Ecuador