

VENTA BAJO
RECETA

 **ANTIDEPRESIVO**

COMPRESIDOS
RECUBIERTOS
VIA ORAL

Neoxacina® 75 Venlafaxina 75 mg

Composición:

Cada comprimido recubierto de Neoxacina® 75 contiene:
Venlafaxina (como HCl).....75,0 mg.
Excipientes.....c.s.

Mecanismo de acción:

La *venlafaxina* es una nueva droga antidepressiva con una estructura química totalmente diferente a la de los tricíclicos clásicos, tetracíclicos y otros agentes antidepressivos conocidos. Su mecanismo de acción consiste en la inhibición de la recaptación presináptica de serotonina, noradrenalina, y en menor grado de dopamina, con lo que se potencia la acción de estos neurotransmisores. Sin embargo, no ejerce acción sobre los receptores muscarínicos, histaminérgicos, adrenérgicos (alfa o beta), benzodiazepínicos u opiáceos.

Farmacocinética:

La *venlafaxina* se absorbe sin inconvenientes en el tracto digestivo. Su biodisponibilidad es del 90 al 95%, alcanzando la concentración sérica máxima al cabo de 2 a 4 horas. Pero, el tiempo preciso para que aparezca la acción es de 1 a 2 semanas. Su unión a proteínas plasmáticas es de 30 %. Se metaboliza ampliamente en el hígado dando lugar a 2 metabolitos menores (dimetilvenlafaxina y N,O-didemetilvenlafaxina) y a un metabolito activo: O-desmetilvenlafaxina (ODV) con actividad farmacológica similar a la *venlafaxina*, que son eliminados en un 90 % con la orina. La vida media de eliminación de *venlafaxina* es cercana a las 4 horas y la de su metabolito activo alrededor de 10 horas.

Indicaciones

Tratamiento de la depresión, incluso de la asociada con ansiedad y fobia social, tanto en pacientes hospitalizados como en pacientes ambulatorios. Prevención de la recaída de un episodio de depresión o para la prevención de la recurrencia de nuevos episodios depresivos.

Posología:

La dosis inicial recomendada de *venlafaxina* es de 75 mg diarios administrados en 2 tomas fraccionadas con los alimentos. Según la tolerancia y el efecto clínico, esta dosis puede ser incrementada a 150 mg/día, y si fuese necesario hasta 225 mg/día. Cuando se incrementa la dosis, los aumentos no deberían superar los 75 mg/día y en intervalos no menores de 4 días. En pacientes ambulatorios moderadamente deprimidos no se ha encontrado evidencia que fuera necesario administrar dosis mayores de 225 mg/día, pero los pacientes internados con depresiones más severas respondieron a una dosis media de 350 mg/día. *Pacientes con deterioro hepático:* para pacientes con deterioro hepático es recomendable que la dosis se reduzca en un 50%, ya que disminuye la depuración y aumenta la vida media de eliminación, tanto de *venlafaxina* y de su metabolito activo.

Dado que se evidenció una marcada variación individual en la

depuración entre los pacientes con cirrosis, puede ser necesario reducir la dosis más allá del 50% y su individualización. *Pacientes con deterioro renal:* dada la disminución en el índice de depuración plasmática y el aumento de la vida media de eliminación de *venlafaxina* y su metabolito activo que se observa en pacientes con deterioro renal (índice de depuración plasmática de creatinina: 10 a 70 mL/minuto), es recomendable que la dosis diaria se reduzca en un 25%. En los pacientes sometidos a hemodiálisis, se recomienda que la dosis diaria total se reduzca en un 50% y que no sea administrada hasta que se termine la sesión (4 horas). *Pacientes de edad:* en pacientes ancianos no se recomienda un ajuste de la dosificación según la edad. Sin embargo siempre debe usarse la menor dosis efectiva y los pacientes deben monitorizarse cuidadosamente cuando se requiere un aumento en la dosis. *Dosis de mantenimiento o tratamiento prolongado:* no existe evidencia disponible sobre el tiempo durante el cual un paciente debe continuar el tratamiento. Por lo general se concuerda que los episodios agudos de depresión requieren de varios meses de tratamiento.

Modo de uso:

Este medicamento se debe administrar por vía oral, preferentemente con los alimentos. Se recomienda reducir la dosis gradualmente para evitar efectos adversos desagradables.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad o alergia a la *venlafaxina*. Insuficiencia hepática o renal graves. Embarazo y lactancia. Niños y adolescentes menores de 18 años. No se debe indicar en pacientes que estén recibiendo inhibidores de la monoaminooxidada (IMAO). Hipertensión o enfermedades cardiovasculares severas. Manía, convulsiones o trastornos neurológicos (incluyendo retardo mental).

Reacciones adversas:

Esta droga es en general bien tolerada, con evidencia de que algunas de las reacciones son dosis dependientes y que en otras se observa adaptación con el uso continuado de la droga como en el caso de náuseas, vómitos, somnolencia, y vértigos. Los siguientes efectos requieren de atención médica. *Incidencia más frecuente:* cefalea, hipertensión, anorgasmia, disminución de la libido, eyaculación retardada, impotencia, acomodación anormal del ojo, visión borrosa, hipercolesterolemia (especialmente tras la administración prolongada y a dosis elevadas), pérdida de peso. *Incidencia menos frecuente:* dolor precordial, palpitaciones, taquicardia, trastornos del pensamiento, agitación, confusión, labilidad emocional, tinnitus, despersonalización, reacciones de fotosensibilidad, equimosis y sangrado de mucosas.

Incidencia rara: disnea, edema, prurito o enrojecimiento cutáneo, cambios menstruales, rabdomiólisis, hipotensión ortostática, convulsiones, acatisia, trismus, glaucoma de ángulo cerrado, midriasis, síndrome neuroléptico maligno, síndrome serotoninérgico, prolongación del intervalo QT, fibrilación ventricular, taquicardia ventricular (incluyendo torsade de pointes), disuria, polaquiuria, incontinencia urinaria, retención urinaria. Los siguientes efectos sólo necesitan atención médica si persisten y son incómodos: *Incidencia más frecuente:* anomalías en el sueño, anorexia, ansiedad, nerviosismo, astenia, temblores por enfriamiento, constipación, diarrea, mareos, sequedad de boca, dispepsia, insomnio, epigastralgia, vómitos, pérdida de peso, rinitis, sudoración aumentada, parestesia. *Incidencia menos frecuente:* hipertonia, disgeusia (alteración en la percepción del gusto). Los siguientes efectos necesitan de atención médica sólo si persisten luego de suspender la droga: astenia, alteraciones del sueño, sequedad de boca, cefalea, sudoración aumentada, náuseas, nerviosismo.

Precauciones y advertencias:

Esta droga debe administrarse bajo control estricto del médico. En sujetos con insuficiencia renal se recomienda reducir la dosis diaria. La suspensión del tratamiento debe ser lenta y gradual; debe evitarse la supresión brusca. Cuando se desea cambiar la *venlafaxina* por un antidepressivo inhibidor de la monoaminooxidasa (IMAO) deberán pasar de 7 a 14 días. Las patologías depresivas severas requerirán tratamientos prolongados (3 a 6 meses) para la eutimia. En sujetos hipertensos deberá emplearse con precaución y control tensional periódico. Se debe llevar una supervisión cuidadosa en caso de utilizar esta droga en pacientes con tendencias suicidas, sobre todo al inicio del tratamiento. Se debe monitorizar siempre en los pacientes: presión arterial, frecuencia del pulso, trazado electrocardiográfico. Se aconseja limitar el consumo de alcohol durante el tratamiento. Se recomienda vigilar estrechamente a los pacientes con presión intraocular elevada o pacientes con riesgo de padecer glaucoma de ángulo cerrado. Pueden aparecer convulsiones en el tratamiento con *venlafaxina*, por lo que deberá administrarse con precaución en pacientes con antecedentes de crisis convulsivas, e interrumpir el tratamiento si se presentan cuadros de convulsiones. Al igual que con otros inhibidores de la recaptación de serotonina, debe usarse *venlafaxina* con precaución en pacientes con predisposición a hemorragias. El uso de *venlafaxina* se ha asociado con el desarrollo de acatisia caracterizada por una agitación subjetivamente molesta o desagradable y la necesidad de moverse acompañada con frecuencia por una incapacidad para sentarse o permanecer de pie. Esto es más probable que se produzca en el plazo de las primeras semanas de tratamiento. En los pacientes que desarrollan estos síntomas, el aumento de la dosis puede ser perjudicial.

Uso durante el embarazo y la lactancia

Embarazo: No hay datos adecuados del uso de *venlafaxina* en mujeres embarazadas. Por lo tanto, sólo deberá administrarse a mujeres embarazadas si los beneficios esperados compensan cualquier posible riesgo.

Lactancia: La *venlafaxina* y la O-desmetilvenlafaxina se excretan en la leche humana, por ello está contraindicada su administración durante la lactancia.

Uso en pediatría: No se ha establecido la inocuidad y eficacia del fármaco en pacientes de edades inferiores a 18 años, por lo que *venlafaxina* no debe utilizarse en este grupo etario.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas: Cualquier medicamento psicoactivo puede alterar la capacidad de juicio, pensamiento o las habilidades motoras. Por tanto, cualquier paciente que esté recibiendo *venlafaxina* debe tener precaución acerca de su capacidad para conducir o manejar máquinas peligrosas.

Restricciones de uso:

Este producto se deberá administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia hepática, renal y cardíaca, hipertensión arterial, epilepsia, discrasias sanguíneas, estados maniácos, cirrosis e hipercolesterolemia.

Interacciones:

La *venlafaxina* es un antidepressivo que por su reducida fracción ligada a proteínas y su mínima interacción con el sistema citocromo P450 posee una muy leve propensión a generar interacciones medicamentosas. El litio, el cual es usado en el tratamiento de manías, no es significativamente afectado por la farmacocinética de la *venlafaxina* cuando es coadministrado como una dosis simple de 600 mg. Asimismo, dosis simples de etanol o diazepam no tienen un efecto significativo en la farmacocinética de la *venlafaxina*. La cimetidina inhibe el primer paso metabólico de *venlafaxina*, resultando una disminución en el clearance de alrededor del 43% y un aumento en la

concentración plasmática de alrededor del 60%; sin embargo, esto no parece afectar la farmacocinética del O-desmetilvenlafaxina, la cual está presente en gran cantidad, pero, toda la actividad farmacológica de la *venlafaxina* más el ODV es sólo ligeramente incrementada, por lo que no es necesario ajustar la dosis para la mayoría de los pacientes. Esta interacción puede presentarse más pronunciada en pacientes de edad avanzada, con hipertensión, o con daño hepático y/o renal. El riesgo de utilizar *venlafaxina* en combinación con otras drogas activas sobre el SNC no ha sido evaluado sistemáticamente, excepto con el litio y el diazepam. Consecuentemente, se recomienda precaución en casos de ser necesaria la administración conjunta de *venlafaxina* y dichas drogas. Debe esperarse 2 semanas para usar *venlafaxina* luego de la suspensión de algún IMAO y 1 semana para usar IMAO luego de suspender la *venlafaxina*. La administración concomitante de *venlafaxina* y metoprolol, dio lugar a un incremento de aproximadamente un 30 a 40% de las concentraciones plasmáticas de metoprolol. La *venlafaxina* puede potenciar el efecto anticoagulante de la warfarina y disminuir el aclaramiento oral total de haloperidol.

Sobredosis:

El límite de dosis de la *venlafaxina* es de 375mg/día. Son síntomas de sobredosis con potencial significancia clínica: cambios electrocardiográficos (QT prolongado), letargia, parestesias, convulsiones, taquicardia sinusual, somnolencia, insomnio, temblores. Se han reportado casos letales por sobredosis especialmente asociados a ingesta de alcohol o asociación con otros fármacos. En algunos casos de sobredosis se desarrolló el síndrome serotoninérgico, un estado hiper serotoninérgico de consecuencias potencialmente letales cuyos síntomas incluyen: agitación, diaforesis, diarrea, fiebre, hiperreflexia, incoordinación, confusión, hipomanía, mioclonus, temblores. Las drogas ciproheptadina y metisergida se han reportado como efectivas para acortar la duración de este síndrome. No existe un antídoto específico para *venlafaxina*. El tratamiento es esencialmente sintomático e incluye medidas generales al igual que con otros antidepressivos. Para disminuir la absorción por una sobredosis de *venlafaxina* puede usarse carbón activado, inducir una emesis o bien un lavado gástrico. Realizar una diálisis, una diuresis forzada o hemoperfusión no son medidas adecuadas para aumentar la eliminación de la droga. Se deben monitorear la función cardíaca y los signos vitales. Los pacientes que intencionalmente toman una sobredosis deben ser remitidos a un psiquiatra. En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en Emergencias Médicas sito en Av. Gral. Santos y Teodoro Mongelós. Tel.: 220 418.

Presentación:

Caja con 50 comprimidos recubiertos.

**Almacenar a temperatura ambiente (inferior a 30°C).
Mantener fuera del alcance de los niños.**


ETICOS®

Elaborado por
Laboratorio de Productos ETICOS C.E.I.S.A.
Atilio Galfre N° 151 y Calle 1- San Lorenzo, Paraguay
Tel.: (595-21) 521 390 (R.A.) Fax: (595-21) 521 389
laboratorio@eticos.com.py www.eticos.com.py
D.T.: Q.F. Myriam Cabrera de Paredes - Reg. N° 2837
Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.

