**TRAZOPAX 50**

**TRAZODONA CLORHIDRATO 50 mg**

Venta Bajo Receta Simple Archivada Comprimidos Ranurados

Industria Paraguaya V.A.: Oral

FORMULA:

Cada comprimido ranurado contiene:

Trazodona Clorhidrato ….....................................................................50 mg.

Excipientes.............................................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Antidepresivo.

MECANISMO DE ACCION Y DATOS FARMACOCINETICOS:

Antidepresivo derivado de la triazolopiridina que químicamente no está relacionado con los demás antidepresivos. Actúa bloqueando la recaptación de serotonina por la membrana presináptica neuronal y también tiene actividad sobre los receptores 5-HT1. Posee intensa actividad sedante y prácticamente nula anticolinérgica. A diferencia de los antidepresivos tricíclicos la Trazodona no inhibe la recaptación periférica de norepinefrina aunque indirectamente puede facilitar su liberación neuronal. La Trazodona bloquea los receptores alfa-1-adrenérgicos centrales y parece no tener efecto en la recaptación de dopamina a nivel central. No parece tener propiedades antimuscarínicas demasiado significativas, aunque sí una notable actividad sedante.

FARMACOCINÉTICA:

Vía oral: La absorción es rápida y casi completa a nivel digestivo, aunque los alimentos pueden producir un aumento en la absorción (20%), una disminución en la concentración máxima y una prolongación en el tiempo para alcanzar la máxima concentración, en comparación con el estado de ayuno. Tiempo empleado en alcanzar la concentración máxima (Tmax) = 1 h (en ayunas), Tmax = 2 h (con alimentos). El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 89-95%.

Es metabolizado en el hígado, y las vías metabólicas comprenden N-oxidación e hidroxilación, dando lugar entre otros metabolitos a m-clorofenilpiperazina por la vía de la isoenzima CYP3A4 del citocromo P450, que ha demostrado tener actividad en animales. Se elimina principalmente con la orina en forma metabolizada (70%), < 1% inalterada y aproximadamente el 30% en heces en forma metabolizada. La eliminación plasmática de la Trazodona es de tipo bifásico, con una semivida de eliminación final de 5 a 9 horas. Pequeñas cantidades de Trazodona se excretan a través de la leche materna.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Depresión: Depresiones orgánicas, endógenas, psicógenas, sintomáticas e involutivas. Estados mixtos de depresión y ansiedad. Depresiones atípicas o enmascaradas (trastornos psicosomáticos). Temblor, discinesia. Trastornos de afectividad y alteraciones del comportamiento: irritabilidad, agresividad, labilidad emotiva, apatía, aislamiento, disminución en la duración del sueño.

Premedicación antes de una intervención: medicación preanestésica, preendoscópica y postoperatoria.

POSOLOGIA:

Para el tratamiento de la depresión, la dosis inicial es de 150 mg/día que puede incrementarse luego en 50 mg cada 3 a 4 días hasta un total de 300 a 400 mg/día si fuera necesario. La dosis diaria puede dividirse a lo largo del día después de las comidas o administrarse como una dosis única por la noche.

En ancianos y otros pacientes sensibles se recomienda una dosis inicial de 100 mg/día.

Para el tratamiento de la ansiedad, administrar dosis iniciales de 75 mg/día incrementándose hasta 300 mg/día si fuese necesario.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a la Trazodona u otras triazolpiridinas. Trastornos bipolares y manía: puede acelerar la transición hacia la fase hipomaníaca o maníaca e inducir un ciclo rápido y reversible entre la manía y la depresión. Postinfarto de miocardio: ante el riesgo de producir bloqueo cardíaco. Porfiria.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Los pacientes deben controlarse estrechamente durante el inicio del tratamiento antidepresivo hasta que se observe una mejoría en la depresión, ya que el suicidio es un riesgo inherente en los pacientes con depresión.

Alteraciones cardiovasculares (angina de pecho, arritmia cardíaca, hipertensión, insuficiencia cardíaca, insuficiencia coronaria que aumenta el riesgo de arritmias, bloqueo cardíaco, insuficiencia cardíaca congestiva, infarto de miocardio o accidente cerebrovascular).

Epilepsia: Puede disminuir el umbral convulsivo.

Esquizofrenia, psicosis: Puede aumentar el riesgo de alteraciones psicóticas.

Hipertiroidismo: Debido al riesgo de toxicidad cardiovascular.

Insuficiencia hepática: Dado que se metaboliza mayoritariamente en el hígado, deberá ajustarse la posología al grado funcional hepático.

Insuficiencia renal grave: Dado que se elimina mayoritariamente por vía renal, deberá ajustarse la posología de acuerdo al grado funcional renal.

Actividades especiales: No se aconseja la conducción de vehículos ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante los primeros días de tratamiento, debido al riesgo de hipotensión, mareos, etc. No tomar bebidas alcohólicas. El tratamiento con Trazodona debe cesar inmediatamente si el paciente presenta signos de disfunción hepática o discrasia sanguínea. Los pacientes que presenten una erección del pene inapropiada o prolongada deben también interrumpir el tratamiento con Trazodona inmediatamente.

En caso de anestesia general, es aconsejable interrumpir el tratamiento 1-2 días antes de la intervención. La Trazodona no debe administrarse a pacientes en tratamiento con un IMAO o, como mínimo, hasta que hayan transcurrido 14 días. También se recomienda no administrar fármacos que puedan producir una reacción grave (ej: Fenelzina) hasta transcurrida una semana después de la interrupción del tratamiento con Trazodona. Al igual que con otros antidepresivos, el tratamiento con Trazodona debe retirarse de forma gradual.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Los efectos adversos de Trazodona son, en general, infrecuentes aunque 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, se caracterizan por:

Ocasionalmente (1-9%): Somnolencia, hipotensión ortostática, mareos, agitación, adelgazamiento confusión, insomnio, cefalea, náuseas, vómitos, debilidad, temblor, sequédad de boca, bradicardia o taquicardia, edema, estreñimiento o diarrea, visión borrosa, priapismo.

Raramente (<1%): Prurito, urticaria, convulsiones, acatisia, temblor, manía, tinnitus, impotencia sexual, reducción de la libido, anemia, mialgia, anorexia, agranulocitosis y trombocitopenia.

También se han informado, excepcionalmente, de efectos adversos sobre la función hepática, como ictericia y lesión hepatocelular, que a veces puede ser grave. El tratamiento con antidepresivos, en especial en ancianos, puede producir hiponatremia, posiblemente por una alteración en la secreción de la hormona antidiurética. El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de priapismo o erección persistente y dolorosa, previa comunicación al médico.

INTERACCIONES CON ALIMENTOS Y MEDICAMENTOS:

- Alcohol etílico: Hay estudios en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad, con aumento de las alteraciones psicomotrices, por posible adición de sus efectos depresores sobre el sistema nervioso central.

- Carbamazepina: Hay un estudio en el que se ha registrado disminución de los niveles plasmáticos de Trazodona y de su metabolito, con posible inhibición de su efecto por inducción de su metabolismo hepático.

- Isoenzima CYP3A4 del citocromo P450: Debido a que la Trazodona se metaboliza a través de esta isoenzima, los inhibidores del mismo pueden limitar la eliminación de la Trazodona. En consecuencia, puede ser necesario administrar la Trazodona en dosis reducidas con fármacos con una potente acción inhibidora de la isoenzima CYP3A4 como los antimicóticos imidazólicos itraconazol, ketoconazol, los inhibidores de la proteasas indinavir y ritonavir.

- Digoxina o Fenitoína: Hay algún estudio en el que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de digoxina, con posible potenciación de su toxicidad.

- Fenotiazinas (clorpromazina, tioridazina, trifluoperazina): Hay estudios en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad, por posible efecto hepatotóxico o hipotensor aditivo.

- Fluoxetina: Hay algún estudio en el que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos de Trazodona, con posible potenciación de su acción y/o toxicidad, por inhibición de su metabolismo hepático.

- Haloperidol: Hay un estudio en el que se ha registrado aumento de los niveles plasmáticos del principal metabolito de Trazodona, con posible potenciación de su acción y/o toxicidad, por inhibición de su metabolismo hepático.

- Levodopa: Hay estudios con antidepresivos tricíclicos en los que se ha registrado potenciación de la toxicidad del antidepresivo, con aparición de hipertensión, por adición de sus efectos elevadores sobre los niveles de neurotransmisores vasopresores.

- Se considera improbable que la Trazodona altere los efectos de los antihipertensivos como la Guanetidina; sin embargo, puede producirse alguna interacción con la Clonidina. La dosis de otros antihipertensivos quizá deba reducirse si se administran con Trazodona.

- Relajantes musculares y anestésicos generales: Existe una potencial interacción entre la Trazodona y éstas sustancias, por lo que se recomienda retirar el tratamiento con Trazodona antes de una intervención quirúrgica programada y durante el tiempo que se considere clínicamente factible.

SOBREDOSIFICACION:

Se produjeron muertes por sobredosis en pacientes que consumían concurrentemente otras drogas (alcohol, alcohol + hidrato de cloral + diazepam, amobarbital, meprobamato, clordiazepóxido). Con Trazodona sola las reacciones más severas han sido: somnolencia, vómitos, vértigo, priapismo, paro respiratorio, convulsiones y cambios en el electrocardiograma. No existe tratamiento específico, se debe administrar tratamiento sintomático de sostén, someter al paciente a lavado o vaciamiento gástrico seguido de la administración de Carbón activado; la diuresis forzada puede ayudar a eliminar la Trazodona.

En caso de sobredosis o ingesta accidental, consultar al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

RESTRICCIONES DE USO:

No debe usarse en mujeres embarazadas a menos que el beneficio para ellas supere el riesgo potencial para el feto.

CONSERVACION:

Almacenar a temperatura entre 15° y 30°C.

PRESENTACION:

Caja conteniendo 30 comprimidos ranurados.

Este medicamento debe ser usado únicamente por prescripción médica y no podrá repetirse sin nueva indicación del facultativo.

En caso de uso de este medicamento sin prescripción médica, la ocurrencia de efectos adversos e indeseables será de exclusiva responsabilidad de quien lo consuma.

Si Ud. es deportista y está sometido a control de doping, no consuma este producto sin consultar a su médico.

Director Técnico: Q. F. Laura Ramírez

Reg. Prof. Nº 4.142

Autorizado por D.N.V.S. del M.S.P. y B.S.

MANTENER FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS