

HALOPERIDOL

ANTIPSICÓTICO/NEUROLÉPTICO

COMPOSICIÓN:

Cada tableta contiene:

Principios activo: Haloperidol..... 5 mg.

Excipientes: Lactosa, almidón de maíz, estearato de magnesio, ac-di-sol, color azul ariavit.

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Tratamiento de cuadros de delirios y alucinaciones en esquizofrenia aguda y crónica, paranoia, confusión aguda, alcoholismo, delirio hipocondríaco, alucinaciones en la abstinencia de alcohol y opioides.

Abordaje terapéutico de trastornos de la personalidad como personalidad paranoide, obsesivo compulsiva, esquizoide, histriónica, esquizotípica, antisocial, límite y otras personalidades.

Tratamiento de psicosis aguda inducida por drogas como el LSD, psilocibina, anfetaminas, ketamina y fenciclidina. Abordaje de psicosis asociada con fiebre alta o enfermedad metabólica y psicosis inducida por alcohol.

Abordaje terapéutico de agitación psicomotriz en cuadros de manía, demencia, retraso mental, alcoholismo, control de tics, hipo intratable, trastorno de Tourette, corea en niños y adultos, tratamiento a corto plazo de niños hiperactivos que muestran una actividad motora excesiva, agitación y confusión asociadas con la esclerosis cerebral.

Tratamiento sintomático de náuseas y vómitos intensos secundarios a radioterapia, quimioterapia, cuidados posoperatorios y paliativos.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Posterior a la administración oral de haloperidol, su absorción es rápida y adecuada a nivel del tracto gastrointestinal, alcanza sus concentraciones plasmáticas máximas en un periodo de tiempo de 1,7 a 6,1 horas.

Unión a proteínas: Posee una capacidad de unión a proteínas de 88.4% a 92.5%.

Metabolismo: Presenta un metabolismo hepático mediado por reacciones de glucuronidación en un 50% al 60%, reducción en un 23% por CYP3A4 a metabolitos inactivos, N-desalquilación en un 20% y el 30% mediada por CYP3A4.

Distribución: Posee un volumen de distribución aparente de 9,5 a 21,7 l/kg. Este alto volumen de distribución está de acuerdo a su lipofilidad, lo que también sugiere libre movimiento a través de varios tejidos, incluida la barrera hematoencefálica.

Vida media: Presenta una vida media de 14,5 a 36,7 horas.

Excreción: Alrededor del 60% de una dosis administrada por vía oral se excreta por vía digestiva a través de las heces y el 40% de la dosis se elimina por vía renal como metabolitos a través de la orina. Alrededor del 1% de la dosis ingerida se excreta de forma inalterada a través de la orina.

FARMACODINAMIA:

El haloperidol es un medicamento neuroléptico que pertenece a la familia de los antipsicóticos típicos, ejerce su mecanismo de acción al bloquear de manera competitiva los receptores de dopamina postsinápticos (D2) en el cerebro, de esta manera elimina la neurotransmisión de dopamina y da lugar al alivio de los delirios y las alucinaciones que se asocian comúnmente con la psicosis. También tiene un efecto sobre los receptores 5-HT₂, α 1 y efectos insignificantes sobre los receptores D1 de dopamina. El fármaco también ejerce cierto bloqueo de los receptores α -adrenérgicos del sistema autónomo.

VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Vía oral.

POSOLOGÍA:

ADULTOS:

Delirios, trastornos de la personalidad, psicosis: Dosis de inicio: 2 a 15 mg/día o 0,2 mg/kg/día en 1 o 2 dosis divididas. **Dosis máxima inicial:** 15 mg/día.

Dosis de mantenimiento: Se puede aumentar la dosis según la respuesta y la tolerabilidad del paciente, los incrementos deben ser graduales en aumentos de \leq 5 mg/dosis.

Dosis máxima de mantenimiento: 20 mg/día.

Agitación psicomotriz: Dosis de inicio: 1 a 10 mg/día en 1 a 3 dosis divididas.

Dosis de mantenimiento: Se puede aumentar la dosis en función de la respuesta y la tolerabilidad en incrementos de 0,5 a 2 mg cada 2 a 3 días hasta 12 mg/día.

Náuseas y vómitos: 0,5 a 2 mg cada 6 a 8 horas.

NIÑOS:

Trastornos de la personalidad, psicosis:

Niños de 3 a 12 años con un peso de 15 a 40 kg: Dosis de inicio: 0,5 mg/día en 2 a 3 dosis divididas. **Dosis de mantenimiento:** Se puede aumentar la dosis según la respuesta y la tolerabilidad del paciente, los incrementos deben ser graduales en aumentos de 0,5 mg cada 5 a 7 días hasta el rango de mantenimiento habitual de 0,05 a 0,075 mg / kg / día en 2 a 3 dosis divididas.

Agitación psicomotriz: 0.05 a 0.15 mg/kg. Puede repetirse cada hora según sea necesario; **Dosis máxima:** 5 mg/dosis.

La discontinuación del tratamiento no debe ser abrupta, se recomienda una reducción gradual de la dosis para evitar los síntomas de abstinencia.

LA DOSIS Y LA DURACIÓN DEL TRATAMIENTO DEBEN SER DEFINIDAS POR EL MÉDICO EN FUNCIÓN DEL ESTADO DEL PACIENTE.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al haloperidol, antipsicóticos típicos o a alguno de los componentes de la formulación, depresión severa del SNC, enfermedad de Parkinson, demencia con cuerpos de Lewy, lesión de los ganglios basales, pacientes con intolerancia hereditaria a la galactosa, insuficiencia de lactasa.

PRECAUCIONES DE USO:

Se han comunicado casos, clasificados como raros, de muerte súbita en pacientes psiquiátricos en tratamiento con medicamentos antipsicóticos. El uso de antipsicóticos en pacientes ancianos con demencia, se ha asociado con un incremento de la mortalidad.

Se recomienda extremar la precaución en los niños fundamentalmente si existe una infección aguda o deshidratación, pacientes con alteraciones de la función hepática o hepatitis colestásica fundamentalmente, pacientes con disfunción renal, en pacientes con prolongación del QT, pacientes con historia conocida de epilepsia u otras alteraciones predisponentes a las convulsiones.

En la esquizofrenia, la respuesta al tratamiento con medicamentos antipsicóticos puede ser tardía, también en caso de discontinuación del tratamiento, la recurrencia de los síntomas puede no ser aparente durante varias semanas o meses. El haloperidol no debe usarse aisladamente cuando la depresión sea predominante. No se recomienda la exposición al sol durante el tratamiento. La tiroxina puede facilitar la toxicidad de haloperidol.

EFECTOS SECUNDARIOS:

Muy frecuentes: Agitación, insomnio, trastorno extrapiramidal, hiperkinesia, cefalea.

Frecuentes: Depresión, trastorno psicótico, discinesia tardía, crisis oculogíricas, distonía, discinesia, acatisia, bradicinesia, deterioro visual, hipotensión ortostática, hipotensión, trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos, hipocinesia, hipertonía, somnolencia, fascies parkinsoniana, temblor, mareo, estreñimiento, boca seca, hipersecreción salival, náuseas, vómitos, trastornos hepatobiliares, prueba anormal de función hepática, retención urinaria, disfunción eréctil, peso aumentado, peso disminuido.

Poco frecuentes: Leucopenia, hipersensibilidad estado confusional, libido disminuida, pérdida de la libido, inquietud, convulsión, parkinsonismo, acinesia, rigidez en rueda dentada, sedación, contracciones musculares involuntarias, visión borrosa, taquicardia, disnea, hepatitis, ictericia, reacción de fotosensibilidad, urticaria, prurito, hiperhidrosis, torticolis, rigidez muscular, espasmos musculares, rigidez musculoesquelética, amenorrea, dismenorrea, galactorrea, molestia en las mamas, dolor en las mamas.

Frecuencia no conocida: Agranulocitosis, neutropenia, pancitopenia, trombocitopenia, reacción anafiláctica, secreción inadecuada de hormona antidiurética, hipoglucemia, trastornos psiquiátricos, fibrilación ventricular, Torsade de Pointes, taquicardia ventricular, extrasístoles, edema laríngeo, laringoespasma, insuficiencia hepática aguda, colestasis, trastornos de la piel y del tejido subcutáneo, vasculitis leucocitoclástica, dermatitis exfoliativa, ginecomastia, priapismo, muerte súbita, edema de cara, hipotermia.

Raras: Disfunción motora, síndrome neuroléptico maligno, nistagmus, trastornos oculares, broncoespasmo, trismo, sacudidas musculares, menorragia, trastorno menstrual, disfunción sexual, síndrome de supresión de fármacos en neonatos.

ADVERTENCIAS ESPECIALES DE USO:

Embarazo: Categoría C: Los estudios realizados en animales han demostrado efectos adversos en el feto, sin embargo hasta la actualidad no se han desarrollado estudios adecuados, ni bien controlados, en mujeres embarazadas. Por este motivo el uso de antipsicóticos como el haloperidol no se recomienda durante un proceso gestacional, sobre todo durante el tercer trimestre de embarazo debido que se corre el riesgo de que el recién nacido desarrolle síntomas extrapiramidales o de abstinencia.

Lactancia: El haloperidol se excreta en la leche materna. En caso de que se considere esencial su administración durante el periodo de lactancia, se deberán evaluar los beneficios de la lactancia frente a los posibles riesgos que representa el tratamiento. Se ha notificado el desarrollo de síntomas extrapiramidales en lactantes de madres tratadas con haloperidol, por lo antes descrito no se recomienda su uso durante la lactancia.

Pediatría: La dosificación debe individualizarse según la sintomatología, el peso y respuesta del paciente al tratamiento.

Geriatría: En este grupo etario se debe iniciar el tratamiento con dosis más bajas y estableciendo un mayor control que en pacientes adultos.

Precauciones al conducir vehículos y maquinaria: Debido a que existe el riesgo de que la administración del medicamento afecte el estado de alerta mental o la coordinación física, se debe tener especial cuidado al conducir o manejar maquinaria, sobre todo hasta que se cumpla el periodo de adaptación y se conozcan los efectos en el individuo.

INTERACCIONES:

El haloperidol aumenta el efecto depresor en el SNC del: alcohol, blonaserin, brexanolone, metirosine, agonistas opioides, orfenedrina, oxomemazine, oxybate, oxycodona, paraaldheido, suvorexant, talidomina y zoldipen; aumenta el efecto tóxico de: otros anticolinérgicos, glucagón, iohexol, lomeprol, lopamidol, metildopa, metilfenidato, sulpiride, topiramato, mirabegron, cloruro de potasio; disminuye el efecto terapéutico de: antiparkinsonianos, epinefrina, procinéticos, guanetidina, itupride, levosulpiride, metilfenidato, finbenil, quinogolide, secretina.

También disminuye el efecto anticolinérgico de: cimetropium, glycopirrolato, revefenacin, tiotropium; disminuye el efecto estimulante de las anfetaminas; aumenta el efecto neuroexcitatorio del aminfampridine; aumenta la concentración plasmática de las tiazidas; aumenta el efecto de constipación de la clozapina, fluxadine, ramosetron; aumenta el efecto de prolongar el intervalo Q-T del domperidone, fexinidazole, pentamidina; aumenta el efecto arritmogénico del mequitazine; aumenta la absorción de la nitroglicerina; aumenta el efecto depresor del SNC de la metadona, methotrimeprazime.

El bromopride, clorfenesina, deutetrabenazine, kava kava, litio, metoclorpramida, rufinamide y tetrabenazine aumentan el efecto tóxico del haloperidol; el perampel,

trimepazine, alizapride, azelastine, minocycline, brimonidine, buprenorfina, nabilone, cannabidiol, dimethindene, doxilamine, dronabinol, esketamine, flunitrazepan, hydroxydine, indometacina, lemborexant, lofexidine y sulfato de magnesio aumentan el efecto depresor del haloperidol; los inhibidores de las colinesterasas y la cabergolina disminuyen el efecto terapéutico.

La amiodarona, amilsupride, lefamulin, ondasetron, pimozide, prometazina y saquinovir aumentan el efecto de prolongación del efecto QT del haloperidol; el aclidinium, la toxina botulínica, glicopirronium, homoclorocycline, ipatropium, mianserin, oxotomide, pramlitide, siltuximab y umeclidinium aumenta el efecto anticolinérgico; el dabrafenid, deferasirox, enzalutamide, erdafitinib, glicopirrolato, sarilumab, tabaco, tozilizumab disminuye la concentración sérica.

El ácido fusídico, idelasib, larotrectinib, lumefantrine, abametapir, aprepitan, carbamazepina, clofazimine, fosaprepitant, fosnetupitan, mifeprisone, mitotane, netupitan, palbociclib, pozacunazol, simeprevir y el stiripentol aumenta la concentración sérica del haloperidol.

USTED DEBE INFORMAR AL MÉDICO TODOS LOS MEDICAMENTOS QUE CONSUME, INCLUSIVE LOS QUE OBTIENE SIN RECETA.

SOBREDOSIFICACIÓN:

En caso de sobredosificación o administración accidental masiva se pueden desarrollar síntomas como reacciones extrapiramidales graves, hipotensión, sedación, también es probable que aparezca hipertensión antes que hipotensión, puede llegar a un estado similar al estado de shock. También debe considerarse el riesgo de arritmias ventriculares, posiblemente asociadas con una prolongación del QT.

No existen antídotos disponibles que contrarresten los efectos neurolépticos del haloperidol. Por este motivo el abordaje de este tipo de pacientes es multidisciplinario y sintomático, se debe instaurar una monitorización continua de las funciones cardiovasculares y respiratorias de acuerdo con el estatus clínico. Las primeras medidas a aplicar se enfocan en evitar la absorción del principio activo mediante la administración de carbón activado y el posterior lavado gástrico, esta medida es adecuada siempre que no hayan pasado más de 60 minutos de la ingestión.

EN CASO DE INGESTA MASIVA ACCIDENTAL CONSULTE A SU MÉDICO DE INMEDIATO.

PRESENTACIONES:

Caja de 100 tabletas (10 blíster de 10 tabletas cada uno).

CONDICIONES DE ALMACENAMIENTO:

Conservar en su envase original a temperatura no mayor a 30°C para evitar alteraciones que repercutan en la acción terapéutica del producto.

Mantener fuera del alcance de los niños.

Guarde este medicamento en su envase original en un lugar fresco, protegido de la luz y la humedad. No use este producto después de la fecha de vencimiento indicada en el envase.

- *Consultar al médico en caso de requerir más información o tenga cualquier inquietud adicional.*
- *En caso de que los síntomas continúen, consultar al médico.*
- *Conservar el prospecto para futura información que se requiera.*



Kronos Laboratorios C. Ltda.

km 8.5 Vía Daule • Teléfonos: 2253143 - 2251445

Q.F. responsable: **Dr. Luis Carlo Paredes.**

www.kronoslaboratorios.com - info@kronoslaboratorios.com

Guayaquil - Ecuador