

## Medicamentos nuevos del Grupo Empresarial Químico Farmacéutico QUIMEFA

### New drugs from the Chemical-Pharmaceutical Management Group QUIMEFA

Grupo Empresarial Químico Farmacéutico QUIMEFA  
Empresa Laboratorio Farmacéutico Líquidos Orales de Bayamo, MEDILIP

---

**CATEGORÍA FARMACOLÓGICA:** Ansiolítico.

#### **ALPRAZOLAM**

Solución oral

VENTA POR RECETA MÉDICA

DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL (DCI): Alprazolam

NOMBRE QUÍMICO: 8-cloro-1-metil-6-fenil-4H (1,2,4) triazolo (4,3,a)(1,4) benzodiazepina.

SIMILARES COMERCIALES: Tafil.

COMPOSICIÓN: Cada cucharadita (5 mL) contiene: alprazolam, 0,5 mg; sacarina sódica, 10,0 mg; tartrazina, 0,045 mg, vehículo, cs.

FARMACOLOGÍA:

El alprazolam es una triazolobenzodiazepina. Los blancos moleculares principales de este fármaco como los del resto de las benzodiazepinas son los receptores de los neurotransmisores inhibidores activados directamente por el ácido gamma aminobutírico (GABA), fundamentalmente el GABA<sub>A</sub>. Clínicamente, todas las benzodiazepinas causan una depresión del sistema nervioso central (SNC) dosis-dependiente variando desde mínimas alteraciones hasta la hipnosis.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Después de una administración oral, el alprazolam es rápidamente absorbido alcanzando los picos séricos entre 1 y 2 h después de la administración.

Vida media: La vida media de eliminación del alprazolam tiene una media de aproximadamente 11,2 h (rango: 6,3-26,9 h) en adultos sanos.

Distribución: El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 70-80 %. Como las otras benzodiazepinas, el alprazolam atraviesa la barrera placentaria y se excreta por la leche materna.

Metabolismo: Es metabolizado en el hígado, dando lugar a alfa-hidroxi alprazolam, 4-hidroxi alprazolam (con poca actividad farmacológica) y benzofenona (inactivo). Los niveles plasmáticos de estos metabolitos son extremadamente bajos. Empero, sus vidas medias parecen ser del mismo orden de magnitud que la del alprazolam.

Excreción: La orina es la principal vía de excreción. También se excreta por la leche materna.

#### INDICACIONES:

Está indicado en el tratamiento a corto plazo de la ansiedad: Ansiedad con síntomas de depresión y crisis de angustia (ataque de pánico), estados de ansiedad asociada a otros padecimientos como: fase crónica de abstinencia alcohólica, padecimientos orgánicos o funcionales (somatización).

#### CONTRAINDICACIONES:

El alprazolam está contraindicado en pacientes con sensibilidad conocida a las benzodiazepinas, glaucoma de ángulo cerrado y miastenia gravis.

#### PRECAUCIONES:

El alprazolam produce depresión del SNC por lo que deprime los reflejos osteotendinosos y debe tenerse precaución al manejar vehículos o maquinaria de precisión.

La dosis de alprazolam debe ser reducida o retirada gradualmente ya que en algunos pacientes que reciben dosis recomendadas o dosis altas de alprazolam por periodos relativamente breves (de 1 semana a 4 meses), se han reportado convulsiones cuando se disminuye rápidamente la dosis o si hay supresión del tratamiento abruptamente. Se sugiere que la dosis diaria se disminuya a razón de 0,5 mg cada 3 días.

Debe usarse con precaución en pacientes severamente deprimidos o potencialmente suicidas, disfunción renal o hepática, diagnóstico primario de esquizofrenia, inclinación al abuso de drogas y alcohol.

Embarazo: El uso de este producto en el embarazo aumenta el riesgo de malformaciones congénitas.

Lactancia: Se excreta en la leche materna. No recomendable la lactancia cuando se está consumiendo este producto.

Niños: No se ha establecido aún la seguridad y la eficacia.

Adulto mayor: Es recomendable que la dosis a utilizar sea la más baja y eficaz, a fin de evitar el desarrollo de ataxia o sobresedación.

#### ADVERTENCIAS:

Con el uso prolongado se desarrolla dependencia.

#### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

Las benzodiazepinas, incluyendo alprazolam, producen efectos depresivos adicionales en el SNC cuando se coadministran con sustancias como barbitúricos, alcohol, psicotrópicos, anticonvulsivantes, antihistamínicos y otros fármacos, los cuales por sí mismos producen depresión del SNC.

Se ha reportado que las concentraciones plasmáticas de imipramina y desipramina aumentan en un promedio de 31 y 20 %, respectivamente, cuando se administran concomitantemente con dosis superiores a 4 mg/día de alprazolam. La depuración del alprazolam puede ser retardada por la coadministración de cimetidina, nefazodona, fluvoxamina, fluoxetina, propoxifeno, anticonceptivos orales, sertralina, diltiazem o antibióticos macrólidos como la eritromicina y la troleandomicina.

Las interacciones que involucran inhibidores de la proteasa del VIH (por ejemplo, ritonavir) y alprazolam son complejas y dependen del tiempo. Las dosis bajas de ritonavir resultaron en un gran deterioro de la depuración de alprazolam, prolongaron su vida media de eliminación y aumento de los efectos clínicos.

Sin embargo, con una exposición prolongada a ritonavir, la inducción de algunas enzimas hepáticas(CYP3A) compensa esta inhibición. Esta interacción requerirá un ajuste de dosis o discontinuar el alprazolam.

#### REACCIONES ADVERSAS:

Frecuentes: Somnolencia, confusión y ataxia (especialmente en ancianos y debilitados), mareos, sedación, depresión, desorientación, disfasia o disartria, reducción de la concentración, temblor, cambios en la libido, incontinencia urinaria, retención urinaria, náuseas, vómitos, diarrea, estreñimiento, sequedad de boca, hipersalivación, dolor epigástrico.

Ocasionales: Aturdimiento, visión borrosa, incoordinación, manifestaciones autonómicas, cefaleas, depresión, insomnio, temor, variaciones de peso corporal y alteraciones en la memoria/amnesia hepatitis, ictericia, dermatitis, urticaria, prurito, leucopenia, agranulocitosis, anemia, trombocitopenia, eosinofilia, diplopia, nistagmo, alteraciones de la audición.

Raras: Reacciones paradójicas como estimulación, agitación, dificultad en la concentración, confusión, alucinaciones u otros efectos en el comportamiento, depresión respiratoria, hipotensión, hipertensión, bradicardia, taquicardia, palpitaciones.

#### POSOLÓGIA:

La dosis óptima de alprazolam debe ser individualizada en base a la severidad de los síntomas y la respuesta individual del paciente.

La dosis promedio cubre las necesidades de la mayoría de los pacientes; en el caso de pacientes que requieren dosis más altas, estas deben establecerse

cuidadosamente (con objeto de evitar efectos secundarios) y administrarse aumentando primero la dosis de la tarde o noche que la de las horas más activas.

En general, los pacientes que no han recibido previamente tratamiento con psicotrónicos requerirán dosis más bajas que aquéllos que han tomado tranquilizantes menores, antidepresivos, hipnóticos o aquéllos con antecedentes de alcoholismo crónico.

Se recomienda, como principio general, el empleo de la dosis más baja al iniciar en pacientes ancianos o debilitados, para evitar el riesgo de desarrollo de sobredosificación o ataxia.

Uso pediátrico: No se han establecido la seguridad y la eficacia en niños menores de 18 años de edad.

Estados de ansiedad: Dosis usual de inicio: 0,25 a 0,50 mg administrada 3 veces al día. Dosis usual en tratamiento: 0,50 a 4,0 mg diarios: administrar en dosis divididas.

Trastorno de pánico: Dosis usual de inicio: 0,5 a 1,0 mg administrados a la hora de dormir o 0,5 mg 3 veces al día. Dosis usual en tratamiento: La dosis se debe ajustar a la respuesta del paciente, con aumentos no mayores a 1 mg/día cada 3 a 4 días. Se pueden agregar dosis adicionales hasta que se logre un programa de 3 ó 4 veces al día.

Pacientes geriátricos o debilitados:

Dosis usual de inicio: 0,25 mg.

Dosis usual en tratamiento: 0,50 a 0,75 mg diarios en dosis divididas, las cuales se pueden incrementar si es necesario y se toleran. Si ocurren efectos secundarios, la dosis debe reducirse.

Alteraciones relacionadas con crisis de angustia: Iniciar con 0,50 a 1,0 mg proporcionado al momento de acostarse.

La dosis deberá ser ajustada de acuerdo con la respuesta del paciente. Los ajustes de la dosis deberán ser en incrementos no mayores de 1 mg cada 3 o 4 días.

Dosis adicionales pueden ser proporcionadas hasta que se alcance un esquema de dosificación de tres o cuatro veces al día.

Sobredosificación:

Las manifestaciones de sobredosificación de alprazolam incluyen extensiones de su actividad farmacológica, principalmente ataxia, somnolencia, confusión, alteraciones en la coordinación, disminución de reflejos y coma. Las secuelas graves son raras a menos que otros fármacos y/o etanol se ingieran simultáneamente. El tratamiento de la sobredosis es principalmente de apoyo a la función respiratoria y cardiovascular.

En caso de presentarse, es recomendable inducir el vómito y/o lavado gástrico como en todos los casos de sobredosificación por medicamentos.

Debe monitorearse la respiración, el pulso y la presión sanguínea; además, debe soportarse con medidas generales cuando sea necesario.

Se administrarán líquidos por vía intravenosa y se mantendrá una adecuada ventilación de las vías aéreas.

El valor de la diálisis no ha sido determinado. Flumazenil puede usarse como tratamiento adjunto para el manejo de la función respiratoria y cardiovascular asociada con la sobredosis.

#### PRESENTACIÓN:

Frasco de vidrio ámbar por 125 mL.

---

**CATEGORÍA FARMACOLÓGICA:** Bloqueante dopaminérgico; procinético; estimulante peristáltico; antiemético.

### **DOMPERIDONA**

Suspensión oral

VENTA POR RECETA MÉDICA

DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL (DCI): Domperidona.

NOMBRE QUÍMICO: 5-cloro-1-{1-[3-(2-oxobenzimidazolin-1-il) propil]-4-piperidil} benzimidazolin-2-ona.

COMPOSICIÓN: Cada cucharadita (5 mL) contiene: domperidona, 5,0 mg; sacarina sódica, 5,0 mg; vehículo, cs.

#### FARMACOLOGÍA:

Domperidona es antagonista dopaminérgico con acciones y usos similares a la metoclopramida. Es usado como antiemético en tratamientos cortos y como procinético. Estimula la motilidad del tracto gastrointestinal.

#### FARMACOCINÉTICA:

Biodisponibilidad: Aproximadamente 15 % en ayuno lo que se hace más marcado cuando se administra después de las comidas. Se piensa que la baja biodisponibilidad se debe al efecto del metabolismo de primer paso hepático. Se obtienen concentraciones plasmáticas máximas 30 minutos después de la dosis.

Distribución: unión a proteínas plasmáticas: más del 90 %. Prácticamente no cruza la barrera hematoencefálica. Pequeñas cantidades son distribuidas en la leche materna. Metabolismo extenso.

Vida media de eliminación: aproximadamente 7,5 h.

Excreción: 30 % eliminado por la orina como metabolitos. El resto de la dosis es excretada en las heces fecales, durante varios días y aproximadamente el 10 % de forma inalterada.

Pequeñas cantidades se eliminan por la leche materna y alcanzan concentraciones alrededor de una cuarta parte de las determinadas en sangre materna.

#### INDICACIONES:

En el tratamiento del complejo de síntomas dispépticos, que a veces también se asocian con retardo en el vaciamiento gástrico, reflujo gastro-esofágico y esofagitis: sensación epigástrica de llenado, saciedad temprana, sensación de distensión abdominal, dolor abdominal alto. Tratamiento a corto plazo de náusea y vómito. Pirosis con regurgitación o sin esta del contenido gástrico en la boca.

En el tratamiento de la náusea y vómito de origen funcional, orgánico, infeccioso o dietético, o inducido por radio o quimioterapia. Una indicación específica es la náusea y vómito inducido por agonistas de la dopamina, como los utilizados en la enfermedad de Parkinson (como L-dopa y bromocriptina). Combinado con paracetamol para el tratamiento de la migraña sintomática.

#### CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

No debe ser utilizado cuando la estimulación de la motilidad gástrica puede ser peligrosa, p.ej. en presencia de hemorragia gastrointestinal, obstrucción mecánica o perforación.

Pacientes con tumores hipofisarios liberadores de prolactina (prolactinoma). Daño hepático.

#### PRECAUCIONES:

Embarazo/lactancia: sólo debe ser utilizado si el beneficio supera el riesgo.

Niños: administrar con cuidado.

En pacientes con insuficiencia renal severa con administraciones repetidas, la frecuencia de administración debe ser reducida a una o dos veces al día dependiendo de la severidad del daño, y también puede ser necesario disminuir la dosis.

Generalmente, los pacientes con terapias prolongadas deben ser revisados regularmente.

#### ADVERTENCIAS:

Este producto contiene sacarina sódica, contraindicado en pacientes con intolerancia a este edulcorante. No se recomienda su empleo para el tratamiento a largo plazo o como profilaxis sistemática de las náuseas y los vómitos del período postoperatorio.

Agítese bien antes de usarse.

#### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

Anticolinérgicos: Antagonizar el efecto antidiséptico de domperidona.

Antiácidos y antiseoretos: Disminuyen la biodisponibilidad oral de Domperidona.  
Antimicóticos azólicos, antibióticos macrólidos, inhibidores de proteasas HIV, nefazodona (Inhibidores del citocromo P450): Incremento de los niveles plasmáticos de Domperidona.

Medicamentos con cubierta entérica o de liberación prolongada: Se afecta la absorción de estos. Sin embargo, en pacientes ya estabilizados con digoxina o paracetamol, la administración concomitante de domperidona no altera los niveles sanguíneos de estos medicamentos.

Domperidona también puede asociarse con:

- neurolépticos, la acción de los cuales no es potenciada.

- agonistas dopaminérgicos (bromocriptina, L-dopa) cuyos efectos secundarios periféricos como trastornos digestivos, náusea y vómito son suprimidos sin afectar sus efectos centrales.

#### REACCIONES ADVERSAS:

Raras: cólicos intestinales transitorios. Manifestaciones extrapiramidales, reacciones distónicas agudas (menos frecuentes que con metoclopramida) que se revierten espontánea y completamente cuando el tratamiento es suspendido.

Hiperprolactinemia que puede aumentar el riesgo de manifestaciones neuroendocrinológicas como galactorrea y ginecomastia. Reacciones alérgicas como rash y urticaria. Disminución de la libido.

#### POSOLÓGÍA:

Adultos y jóvenes con peso corporal mayor de 35 kg: 10-20 mg, 3-4 veces/día; Máx: 80 mg/día.

Niños (peso menor 34 kg): 250-500 µg/kg, 3-4 veces/día; Máx: 2,4 mg/kg/día.

Migraña: 20 mg/4 h asociado con el paracetamol.

Tratamiento de la sobredosis y efectos adversos graves:

Los síntomas de sobredosis pueden incluir somnolencia, desorientación y síntomas extrapiramidales, principalmente en niños.

En caso de sobredosis, se recomienda la administración de carbón activado y la observación del paciente.

Los medicamentos anticolinérgicos, antiparkinsonianos o antihistamínicos con propiedades anticolinérgicas pueden ayudar en el control de los síntomas extrapiramidales.

#### PRESENTACIÓN:

Frasco de vidrio ámbar por 125 mL de capacidad nominal, conteniendo 115 mL.

**CATEGORÍA FARMACOLÓGICA:** Epiteliógeno; fibrinolítico; antiinflamatorio; regenerativo de la piel; inhibidor de proliferación.

## **HEPALCE**

Jalea

VENTA POR RECETA MEDICA.

NOMBRE QUÍMICO: Heparina sódica

Alantoína: (2,5dioxo4imidazolidinil) urea.

Extracto de cebollas.

SIMILARES COMERCIALES: Contractubex.

COMPOSICIÓN: Cada 100 g de jalea contiene 1 g de alantoína, 5 000 UI equivalente a 0,0268 g de heparina sódica, 10 g de extracto de cebolla.

### FARMACOLOGÍA:

La jalea cicatrizante ha dado excelentes resultados en el tratamiento de cicatrices hipertróficas, limitadoras del movimiento y en forma de queloides.

Las sustancias que integran la composición de la jalea cicatrizante logran, en la combinación en que están presentes, un efecto específico en cicatrices. Se complementan e intensifican respecto a sus propiedades, poseyendo, entre otras, funciones promotoras de la irrigación sanguínea, humectantes y alisadoras. Su efecto es visible y duradero.

Consta de 3 principios activos: alantoína, heparina sódica y extracto de cebollas.

La alantoína es un producto final del metabolismo de la purina en tejidos animal y vegetal. Estimula la multiplicación celular y promueve el desarrollo de células sanas. Gracias a estas propiedades, la alantoína es particularmente aprobada para el tratamiento de cicatrices. Promueve la epitelización y la formación de una superficie elástica y actúa contra la generación de queloides. El prurito que se presenta frecuentemente durante la cicatrización puede ser aliviado mediante alantoína.

La heparina se obtiene de tejido animal (hígado, pulmón, corazón), en donde se halla localizada en las células cebadas. Al ser aplicada localmente se verifica una heparinización regional. Así, la heparina, aplicada tópicamente, fortalece las propiedades fibrinolíticas en el tejido cutáneo. Incrementa la hidratación tisular y contribuye al reblandecimiento del tejido endurecido. Actúa como vasodilatador y mejora la circulación sanguínea y el suministro de sustancias esenciales. Las propiedades antiflogísticas contribuyen a evitar eventuales inflamaciones.

El extracto de cebollas se obtiene mediante extracción de *Allium cepa*, que contiene numerosas sustancias de las cuales surgen efectos especiales sobre la piel.

Con los carbohidratos (glucosa, fructosa y otros) son, asimismo, sustratos para la regeneración celular. Diversas sustancias constitutivas (flavonoides y otros) presentan propiedades antiinflamatorias e inhibidoras de la proliferación. Es también importante el contenido de vitamina A de la droga, considerada también vitamina para la protección epitelial. También contiene vitaminas B<sub>1</sub>, B<sub>2</sub>, C, ácido pantoténico, así como minerales (cobalto e hierro) y oligoelementos.

#### INDICACIONES:

Cicatrices y queloides:

En dermatología: cicatrices después de quemaduras, acné, forunculosis, herpes zoster, ulceraciones, quemaduras por agentes químicos, posvacunación.

En cirugía: cicatrices posoperatorias, cicatrices originadas en el transcurso de cirugía reparadora de larga duración con trasplantes y plástica, cicatrices de amputación.

En ginecología: cicatrices quirúrgicas posoperatorias; incisiones en el bajo vientre que tienden a causar cicatrizaciones protuberantes, cicatrices de episiotomía de gran amplitud; biopsias y amputaciones mamarias.

En ortopedia: contractura de Dupuytren.

#### CONTRAINDICACIONES:

No debe aplicarse en pacientes con antecedentes de hipersensibilidad a alguno de sus componentes.

#### ADVERTENCIAS:

En caso de presentar dermatitis, eritemas o agravarse las lesiones preexistentes, descontinúe su uso y consulte al médico.

#### REACCIONES ADVERSAS:

Es poco frecuente reacciones cutáneas localizadas.

#### POSOLOGÍA:

Aplicar varias veces al día introduciéndolo en el tejido cicatrizal masajeando suavemente hasta que la jalea haya sido absorbida por la piel. En los casos de cicatrices antiguas, resistentes, dejar actuar, eventualmente, durante la noche bajo un vendaje o apósito. Según la extensión e intensidad de la cicatriz o contractura existentes el tratamiento se prolongará por espacio de varias semanas y hasta meses. Particularmente en el tratamiento de cicatrices recientes se evitará irritaciones físicas como por ejemplo temperaturas extremadamente bajas o luz ultravioleta, y un masaje excesivamente fuerte.

Sobredosificación:

Descontinuar el tratamiento. Tratamiento sintomático y de sostén.

#### PRESENTACIÓN:

Tubo por 15 g.

Frasco plástico por 30 g.