

**LEVOSUL[®]
LEVOSULPIRIDE****COMPOSICIÓN:**

Cada ampolla de 2 mL contiene:

Levosulpiride.....25,0 mg.
Excipientes.....c.s.

Mecanismo de acción:

El levosulpiride es un agente procinético digestivo con actividad en distintos niveles del tracto gastrointestinal, en base a un mecanismo antagonista selectivo sobre receptores periféricos de dopamina D2 de la pared gastrointestinal. Produce un aumento del tono del esfínter esofágico y facilita el vaciado gástrico. Además, normaliza el tránsito intestinal y disminuye el peristaltismo.

El levosulpiride es el enantiómero levógiro del sulpiride, lo que le confiere mayor selectividad y eficacia en su acción procinética con una buena tolerabilidad.

El levosulpiride posee también propiedades antieméticas, antivertiginosas y antidepressivas.

Farmacocinética:

El levosulpiride presenta una buena absorción cuando se administra por vía intramuscular o intravenosa.

La concentración plasmática máxima se obtiene entre las 3 +/- 1,2 horas. La cinética es lineal después de administrar una dosis que puede variar entre 25 y 300 mg.

El levosulpiride difunde rápidamente por los tejidos.

El volumen aparente de distribución es de 0,94 L/kg, siendo la tasa de fijación proteica del 40%. Difunde débilmente a la leche materna y pasa la barrera placentaria. Es débilmente metabolizado en el hombre. La excreción es esencialmente renal, por filtración glomerular. El clearance total es de 126 mL/min. La semivida de eliminación plasmática es de 7 horas.

Indicaciones:

Tratamiento del Síndrome dispéptico de depleción gástrica retardada relacionada con factores orgánicos (gastro-paresia diabética, neoplasia, etc.) y/o

funcionales (soma-tizaciones viscerales en sujetos ansioso- depresivos).

Vómitos y náuseas (post-operatorios o fármaco-inducidos).

Trastornos digestivos provocados por radioterapia, cobaltoterapia y quimioterapia antineoplásica.

Posología:

Solución inyectable en adultos:

Para el tratamiento de enfermedades gastrointestinales: se recomienda la solución inyectable de levosulpiride, cuando los pacientes presentan síntomas importantes como náuseas y vómitos y la administración oral es dificultosa, siendo la dosis usual de una ampolla de 25 mg vía I.V. o I.M., 2 ó 3 veces al día durante algunos días y, cuando los síntomas ya sean más leves, pasar a la administración por vía oral durante 10 a 15 días.

Para el tratamiento de vómitos inducidos por la quimioterapia, la dosis recomendada es de 2 ampollas de 25 mg de levosulpiride, por vía I.V. lenta o por perfusión, 30 minutos antes de la quimioterapia, y repetir la dosis 30 minutos después de terminarla.

Posología en poblaciones especiales:

Pacientes con daño renal: como levosulpiride es principalmente excretado por vía renal, se ha sugerido ajustar la dosis en pacientes con insuficiencia renal. Las siguientes modificaciones son recomendadas durante el tratamiento a largo plazo:

- 1). clearance de creatinina de 30 a 60 ml/min: 70% de la dosis normal.
- 2). clearance de creatinina de 10 a 30 ml/min: 50% de la dosis normal.
- 3). clearance de creatinina menor a 10 ml/min: 34% de la dosis normal.
- 4). Alternativamente, el intervalo de la dosificación puede ser prolongado.

Pacientes con insuficiencia hepática: No es necesario ajuste de dosis.

Pacientes ancianos: la posología debe ser establecida cuidadosamente por el médico, que deberá evaluar una eventual reducción de las dosificaciones mencionadas.

Pacientes pediátricos: No está indicado el uso de levosulpiride en niños menores de 14 años.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad o intolerancia al fármaco. Pacientes con feocromocitoma. Epilepsia. Estados maniacos. Crisis maniacas de las psicosis maniacodepresivas. Mastopatía maligna. Embarazo. Lactancia. No debe administrarse en casos de hemorragia gastrointestinal, obstrucciones mecánicas o perforaciones.

Reacciones adversas:

Los efectos colaterales que aparecen en forma muy frecuente (25%) incluyen: somnolencia y sedación. Frecuentemente (10-25%): aparecen sequedad de boca, visión borrosa, retención urinaria y estreñimiento. Ocasionalmente (1-9%): galactorrea, amenorrea, ginecomastia, mastalgia, incremento o reducción de la libido, hipotensión ortostática, hipertensión, taquicardia (principalmente al aumentar la dosis rápidamente), bradicardia, insuficiencia cardiaca congestiva, arritmia cardiaca, colapso, ictericia colestática, a veces con eosinofilia (durante el primer mes de tratamiento), leucopenia transitoria, fotodermatitis, urticaria, erupciones maculopapulares, erupciones acneiformes, prurito, angioedema, insomnio, mareos e íleo parálítico.

Raramente (<1%): al inicio del tratamiento: síntomas extrapiramidales como parkinsonismo, acatisia y distonía que están relacionados con la dosis; agranulocitosis (entre la cuarta y décima semana de tratamiento), diskinesia tardía (después de meses o años de tratamiento), síndrome neuroléptico maligno (puede ser mortal en el 15-20% de los casos) con síntomas como fiebre, rigidez muscular generalizada, akinesia, hipertonía faríngea y alteraciones respiratorias; retinopatía pigmentaria y convulsiones.

El tratamiento debe ser suspendido inmediatamente en el caso de que el paciente experimente algún episodio de fiebre (41°C) ó rigidez muscular grave, con alteraciones respiratorias.

Precauciones y advertencias:

El levosulpiride debe ser usado con precaución en pacientes con feocromocitoma, porque puede causar una crisis hipertensiva, probablemente debida a la liberación de catecolaminas por el tumor. Dichas crisis hipertensivas pueden ser controladas con fentolamina. Por la posible correlación entre el efecto hiperprolactinémico de la mayor parte de los fármacos psicótrópicos y las displasias mamarias, es oportuno no emplear en pacientes que ya son portadores de una mastopatía maligna.

El levosulpiride no debe utilizarse cuando la estimulación de la motilidad gastrointestinal puede ser nociva, por ejemplo en presencia de hemorragias gastrointestinales, obstrucciones mecánicas o perforaciones.

Los efectos de levosulpiride sobre la motilidad gastrointestinal pueden ser antagonizados por fármacos anticolinérgicos, narcóticos y analgésicos.

Deberá realizarse un especial control clínico en alteraciones cardiovasculares graves (ej: insuficiencia cardiaca o coronaria, prolongación del intervalo QT), asma crónico, estados depresivos, glaucoma de ángulo cerrado, epilepsia y parkinsonismo.

El levosulpiride debe administrarse con precaución a los pacientes maníacos o hipomaníacos, ya que podría empeorar sus síntomas. Se debe evitar el consumo de bebidas alcohólicas durante el tratamiento con levosulpiride. Con el uso de neurolépticos (en general en el curso del tratamiento antipsicótico), se ha reportado la aparición de un cuadro potencialmente fatal, denominado Síndrome neuroléptico maligno, que también podría presentarse con el uso de levosulpiride.

Uso durante el embarazo y la lactancia: No se recomienda su uso durante el embarazo y la lactancia.

Efectos sobre la conducción de vehículos y el manejo de maquinarias: No se aconseja la conducción de vehículos, ni el manejo de maquinaria peligrosa o de precisión durante los primeros días de tratamiento, debido a que este producto puede producir somnolencia.

Restricciones de uso:

Este producto se debe administrar con restricción en pacientes con antecedentes de insuficiencia renal y hepática, insuficiencia cardiaca, displasia mamaria, enfermedades convulsivas, estados depresivos, asma crónico, alcoholismo.

Interacciones:

El levosulpiride puede potenciar los efectos sedantes del alcohol, hipnóticos, tranquilizantes, anestésicos, antihistamínicos y presentar efecto aditivo si se administra junto con agentes antihipertensivos (causando ocasionalmente hipotensión ortostática). No es aconsejable su asociación con levodopa, por ser un potente antagonista de la dopamina. Los antiácidos (sales de aluminio y magnesio), pueden disminuir la biodisponibilidad de levosulpiride, con posible inhibición de su efecto, por disminución de su absorción.

Sobredosis:

Las manifestaciones clínicas de sobredosificación cambian de acuerdo con la cantidad de droga ingerida; van desde la agitación y obnubilación mental, síntomas extrapiramidales de variados grados, hasta hipotensión y coma. El tratamiento incluye monitoreo

apropiado, diuresis osmótica alcalina y, si fuere necesario, droga antiparkinsoniana. La inducción de la emesis no es efectiva, debido a la acción antiemética central del levosulpiride. En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en Emergencias Médicas, sito en Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós - Tel.: 220 418 Asunción, Paraguay.

Presentación:

Caja conteniendo 5 ampollas x 2 mL.

Almacenar a temperatura ambiente

(inferior a 30°C). Proteger de la luz

Mantener fuera del alcance de los niños.



ETICOS®

Elaborado por **QUIMFA S.A.**

Avda. Primer Presidente c/ Yrendague N° 1736,
Asunción.

Para **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 Cabriza de Paredes - Reg. N° 2837

Autorizado en Paraguay por el M.S.P. y B.S.