

Levopridel[®]

Levosulpiride 25mg
Comprimidos

COMPOSICIÓN	Comprimidos
Levosulpiride	25 mg
Excipientes, c.s.p.	1 comprimido

GRUPO FARMACOTERAPÉUTICO: Gastrocinético / Antidispéptico / Antipsicótico.

FORMA FARMACÉUTICA: Comprimido

VIA DE ADMINISTRACIÓN: Oral

CÓDIGO ATC: N05AL07

DENOMINACIÓN COMUN INTERNACIONAL: Levosulpiride

FÓRMULA MOLECULAR: C₁₆H₂₃N₃O₂S

PESO MOLECULAR: 341.4258 g/mol

NÚMERO CAS: 23672-07-3

PROPIEDADES FÍSICAS Y QUÍMICAS:

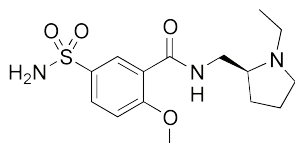
Apariencia: polvo cristalino blanco

Densidad: 1,236 g / cm³

Punto de fusión: 183-186°C

Solubilidad: Prácticamente insoluble en agua; poco soluble en alcohol y en diclorometano; poco soluble en alcohol metílico. Él se disuelve en soluciones diluidas de ácidos minerales y en hidróxidos alcalinos.

FÓRMULA ESTRUCTURAL



N-(1-Ethylpyrrolidin-2-ylmethyl)-2-methoxy-5-sulphamoylbenzamide

PROPIEDADES FARMACOLÓGICAS

PROPIEDADES FARMACODINÁMICAS

Levosulpiride es un antagonista selectivo de los receptores D₂ de la dopamina periféricos de la pared gastrointestinal, lo que le confiere acción gastro-procinética y favorecedora de la motilidad y el tránsito intestinal. Levosulpiride también es eficaz en el tratamiento del vómito, las náuseas y el vértigo.

Levosulpiride ha demostrado ser eficaz en el tratamiento de la dispepsia funcional tipo dismotilidad, que se caracteriza por una sensación no dolorosa molesta o desagradable en el hemiabdomen superior como síntoma predominante, y que puede identificarse o asociarse a saciedad precoz, plenitud o hinchazón abdominal, o náuseas.

Se considerará un diagnóstico de dispepsia funcional en aquellos pacientes que al menos durante 12 semanas (no necesariamente consecutivas) en el último año presenten dispepsia persistente o recurrente con ausencia de enfermedad orgánica (incluyendo endoscopia alta) que explique la sintomatología y ausencia de relación en la mejora de la dispepsia con la defecación o con cambios en la frecuencia o consistencia de las heces.

PROPIEDADES FARMACOCINÉTICAS

Absorción y distribución

Tras la administración de Levosulpiride por vía oral a dosis de 25 mg, se obtiene una concentración plasmática máxima a las 3 horas de la ingesta del fármaco, con unos niveles máximos de 94,2 ng/ml. La semivida de eliminación ha resultado de unas 4,3 horas, produciéndose esta eliminación preferentemente por vía renal.

Tras los ensayos de biodisponibilidad absoluta llevados a cabo con dosis de 50 mg de levosulpiride administradas por vía oral, en forma de comprimidos y gotas, no se han observado diferencias significativas en las respectivas áreas bajo la curva, por lo que ambas formas farmacéuticas pueden considerarse bioequivalentes.

Metabolismo

Este producto no se metaboliza en humanos.

Eliminación

La eliminación de levosulpiride es preferentemente por vía renal.

Acción Terapéutica:

El levosulpiride es un antagonista selectivo de los receptores de dopamina D₂ centrales y periféricos. A diferencia de la metoclopramida, que ejerce su acción sobre los dos subtipos de receptores D₁ y D₂. Debido a sus características farmacocinéticas y, a diferencia de otros antagonistas D₂, a bajas dosis tiene efecto sobre receptores periféricos y sobre algunos receptores centrales particulares situados en áreas donde la barrera hematoencefálica está menos desarrollada, mientras que a altas dosis penetra en el Sistema Nervioso Central (SNC) y actúa como droga neuroleptica. Por otra parte, el Levosulpiride, al igual que la metoclopramida, tiene efectos agonistas moderados sobre los receptores serotoninicos 5-HT₄, lo que contribuye a explicar su acción procinética. Los receptores 5-HT₄ se encuentran en neuronas colinérgicas en el sistema nervioso entérico, donde inducen la liberación de acetilcolina, la cual estimula la motilidad y el tránsito gastrointestinal.

En estudios comparativos con sulpirida, se ha demostrado que los efectos sobre la dispepsia son similares pero la incidencia de acontecimientos adversos es menor con levosulpiride que con la mezcla racémica. A las dosis habitualmente utilizadas en las alteraciones digestivas, el levosulpiride no presenta algunos de los efectos adversos graves que si presentan otros fármacos procinéticos. Cabe mencionar especialmente en este sentido la ausencia de efectos

electrofisiológicos cardíacos. Levosulpiride tampoco produce efectos adversos sobre el sistema nervioso central. Ello constituye una característica diferencial frente a otros fármacos procinéticos, siendo especialmente importante la ausencia de efectos extrapiramidales con la administración de levosulpiride. En estudios comparativos realizados con la droga. Se ha demostrado una disminución considerable del tiempo de vaciado gástrico en relación con el tratamiento con levosulpiride, significativamente más eficaz que el placebo e igual en eficacia a cisaprida y a domperidona.

INDICACIONES

Tratamiento a corto plazo del síndrome dispéptico (anorexia, distensión abdominal, sensación de sensibilidad epigástrica, cefalea postprandial, acidez estomacal, eructación, diarrea, estreñimiento) por retraso del vaciamiento gástrico relacionado con factores orgánicos (gastroparesia diabética, cáncer, etc.) y/o factores funcionales (somatización visceral en sujetos ansioso-depresivos) en pacientes que no respondieron a otra terapia.

Tratamiento sintomático a corto plazo de las náuseas y los vómitos (inducidos por medicamentos contra el cáncer) después del fracaso de la terapia de primera línea.

Tratamiento sintomático a corto plazo de mareos, tinnitus, pérdida auditiva y náuseas asociados con el síndrome de Ménière.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes incluidos en su formulación.

Levosulpiride no debe ser administrado a pacientes con historial conocido de epilepsia, estados y fase maniácos de pacientes con psicosis maniaco-depresivas.

Levosulpiride no debe administrarse cuando la estimulación de la motilidad intestinal esté producida por una hemorragia gastrointestinal, obstrucciones mecánicas o perforaciones.

Levosulpiride está contraindicada en pacientes con feocromocitoma debido a que la administración del fármaco puede causar una crisis hipertensiva, probablemente debida a una liberación de catecolaminas. Estas crisis hipertensivas pueden controlarse con fentolamina.

Debido a la posible relación entre efecto hiperprolactinémizante, y la aparición de displasia mamaria, levosulpiride no debe administrarse en pacientes con mastopatía maligna.

Levosulpiride está contraindicado en caso de embarazo y durante el período de lactancia.

ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES ESPECIALES DE EMPLEO:

Levosulpiride debe administrarse con precaución en aquellos pacientes en que un incremento de la motilidad gastrointestinal pueda resultar perjudicial para su correcto tratamiento.

Debe evitarse el consumo de alcohol simultáneamente con este fármaco.

Se han notificado casos de un trastorno potencialmente mortal, llamado síndrome neuroleptico maligno con el uso de neurolepticos (en general, durante el tratamiento con fármacos antipsicóticos).

El Síndrome Neuroleptico Maligno se caracteriza por hiperpirexia, rigidez muscular, acinesia, trastornos vegetativos (pulso y presión arterial irregulares, sudoración, taquicardia, arritmias), estado de conciencia alterado que puede progresar a estupor y coma. El tratamiento del síndrome neuroleptico maligno consiste en la interrupción inmediata de los medicamentos antipsicóticos y otros medicamentos no esenciales y el establecimiento de un tratamiento sintomático intensivo (se debe tener cuidado para reducir la hipertermia y corregir la deshidratación). En caso de que se considere esencial la reanudación del tratamiento con antipsicóticos, el paciente debe ser vigilado cuidadosamente. Se debe evitar la terapia concomitante con otros neurolepticos.

En pacientes con enfermedades cardiovasculares. Debido a que su eliminación es principalmente renal, debe administrarse con cuidado en caso de insuficiencia renal. Debe evitarse el consumo simultáneo de alcohol. El uso de neurolepticos (en general en el curso del tratamiento antipsicótico) ha reportado un conjunto de síntomas, potencialmente fatales, denominado Síndrome Neuroleptico Maligno. Las manifestaciones clínicas de dicho síndrome son: hiperpirexia, rigidez muscular, acinesia, trastornos vegetativos (irregularidad del pulso y de la tensión arterial, sudoración, taquicardia, arritmia), alteraciones del estado de conciencia que puede progresar hasta el estupor y el coma. Los efectos de levosulpiride sobre la motilidad gastrointestinal pueden ser antagonizados por fármacos anticolinérgicos, narcóticos y analgésicos.

USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA

Embarazo: Levosulpiride está contraindicado en caso de sospecha o confirmación de embarazo.

Lactancia: Levosulpiride está contraindicado durante el periodo de lactancia.

No se han descrito efectos secundarios a las dosis recomendadas. A dosis elevadas el levosulpiride puede dar lugar a somnolencia, estupor y disquinesia en el paciente, por lo que este deberá ser advertido para que evite conducir vehículos o utilizar maquinarias que requieran especial atención.

EFFECTOS ADVERSOS:

Las categorías de frecuencia de aparición de reacciones adversas se definen de la siguiente manera: muy frecuentes (≥ 1/10), frecuentes (> 1/100 a < 1/10), poco frecuentes (≥ 1/1000 a < 1/100), raras (≥ 1/10.000 a < 1/1000), muy raras (< 1/10.000) y de frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Las reacciones adversas más comúnmente reportadas por los pacientes tras el uso de Levogastrol se categorizan como muy raras (< 1/10.000), e incluyen:

Trastornos psiquiátricos: insomnio.

Trastornos del sistema nervioso: temblor, parkinsonismo, somnolencia, sedación, trastorno extrapiramidal, disquinesia, distonía.

Trastorno del oído y del laberinto: vértigo.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos: ronquera.

Trastornos gastrointestinales: dolor abdominal, hipersecreción salival, estreñimiento.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama: galactorrea, trastorno menstrual, ginecomastia, molestia en mama.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración: fatiga.

Exploraciones complementarias: prolactina elevada en sangre, peso aumentado.

Otros efectos adversos reportados, los cuales son reversibles luego de suspender el tratamiento y que se han asociado como son: Galactorrea, ginecomastia, alteraciones de la libido e incremento de los niveles de prolactina.

Otros efectos adversos reportados con dosis más altas que las recomendadas son: Sequedad de boca, incremento de la actividad motora, agitación, confusión mental, calores y alteraciones visuales. Aunque a las dosis recomendadas en gastroenterología no se han reportado efectos

extrapiramidales, estos podrían presentarse.

Otros efectos de ocurrencia rara son: Reacciones de hipersensibilidad y alérgicas, urticaria, enrojecimiento de la piel, incremento de la salivación, náuseas, estreñimiento, agitación, insomnio, temblor, entre otros.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

Los efectos de levosulpiride sobre la motilidad gástrica pueden ser antagonizados por fármacos de acción anticolinérgica, narcótica y analgésica.

Se recomienda especial precaución en caso de administrar levosulpiride junto con fármacos que interfieran con el sistema dopaminérgico, debido a que pueden aparecer reacciones adversas.

Se recomienda que la administración del fármaco se realice antes de las comidas.

Antiparkinsonianos dopaminérgicos (amantadina, bromocriptina, cabergolina, levodopa, pergolide). En caso de síndrome extrapiramidal, utilizar un anticolinérgico: Alcohol: al utilizar levosulpiride se debe evitar el consumo simultáneo de alcohol, ya que la alteración de la vigilancia puede resultar peligrosa para conducir vehículos y/o utilización de maquinaria. Antihipertensivos: por efecto aditivo existe mayor riesgo de hipotensión ortostática.

Algunos depresores del sistema nervioso central (derivados morfínicos, barbitúricos, benzodiazepinas, ansiolíticos, hipnóticos, antidepresivos, sedantes, antihistamínicos H1, antihipertensivos centrales, baclofeno, talidomida).

SOBREDOSIS:

Se carece de experiencia clínica en casos de sobredosificación, los síntomas esperados reflejarán una exageración de las acciones farmacológicas conocidas del fármaco. Los síntomas que pueden ocurrir son: somnolencia y posibles trastornos extrapiramidales tales como discinesia. En estos casos se recomienda instaurar medidas de soporte adecuadas.

DOSIS:

Levosulpiride: debe tomarse al menos 20 minutos antes de las comidas.

La dosis diaria recomendada en adultos es de 25 mg de levosulpiride 3 veces al día (1 comprimido cada 8 horas), por vía oral.

La duración habitual del tratamiento es de 4-8 semanas. La duración del tratamiento puede adecuarse en función del alivio de los síntomas y la remisión del cuadro clínico. No se recomienda realizar el tratamiento de forma permanente. El tratamiento puede reiniciarse cuando reaparezcan los síntomas.

Población pediátrica:

No hay datos disponibles. La eficacia y seguridad de levosulpiride en la población pediátrica no ha sido establecida.

Personas de edad avanzada:

En los pacientes de edad avanzada la posología debe ser establecida por el médico, quien valorará el posible ajuste de dosis en aquellos casos específicos que lo requieran.

Insuficiencia renal:

No es necesario ajuste de dosis.

Insuficiencia hepática:

No es necesario ajuste de dosis.

EFFECTOS SOBRE LA CAPACIDAD PARA CONDUCIR Y UTILIZAR MAQUINAS:

Levosulpiride actúa sobre el sistema nervioso central y puede producir: somnolencia, entumecimiento, disquinesia, mareos, alteraciones visuales y disminución de la capacidad de reacción. Estos efectos hacen que sea recomendable tener precaución a la hora de conducir vehículos o manejar maquinaria peligrosa, y evitar realizar actividades en las que se requiera un estado de alerta completo especialmente mientras no se haya establecido la sensibilidad particular de cada paciente al medicamento.

PRESENTACIÓN

Caja conteniendo 50 comprimidos.

CONSERVACIÓN:

Almacenar a una temperatura no mayor a 30°C. Protegido de la luz.

LISTA DE EXCIPIENTES :

Celulosa microcristalina

Lactosa monohidratada

Almidón glicolato sódico

Estearato de magnesio

Dioxido de silicio coloidal

LEYENDAS DE PROTECCIÓN

Producto medicinal.

Su venta requiere prescripción médica.

MANTENGA ÉSTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.



Elaborado por:
Laboratorios Sued, S.R.L.
Carretera La Isabela, Pantoja,
Santo Domingo, República Dominicana
Apartado Postal 847
www.labsued.com

Reg. Ind. No.: 18055

Reg. San. No.:

® Marca registrada.