

Haloperidol 5 mg / 1 mL
Solución Inyectable



Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

FOLLETO DE INFORMACION AL PROFESIONAL

HALOPERIDOL SOLUCION INYECTABLE 5 mg/1 mL

Composición

Cada ampolla de 1 mL contiene:

Haloperidol 5 mg

Excipientes: ácido láctico y agua para inyectables c.s

Clasificación terapéutica

Neuroléptico - Antipsicótico.

Farmacología

Los efectos farmacológicos del Haloperidol son similares a los efectos de las fenotiazinas derivadas de piperazina. El mecanismo preciso de acción antipsicótica del Haloperidol no ha sido establecido aún, pero la droga parece deprimir el SNC a nivel subcortical del cerebro, mesencéfalo y la formación reticular del encéfalo. El Haloperidol parece inhibir el sistema de activación reticular ascendente del encéfalo (posiblemente a través del núcleo caudado, interrumpiendo el impulso entre el diencefalo y la corteza. La droga puede antagonizar las acciones del ácido glutámico dentro del sistema extrapiramidal. La inhibición de los receptores de catecolaminas pueden ser también importantes en el mecanismo de acción del Haloperidol; la droga puede inhibir la recaptación de varios neurotransmisores en el mesencéfalo. El Haloperidol parece tener una fuerte actividad antidopaminérgica central y un débil efecto anticolinérgico central. Al igual que las fenotiazidas el Haloperidol produce catalepsia e inhibe la actividad motora espontánea. El Haloperidol inhibe los efectos central y periférico de la Apomorfina, produce bloqueo ganglionar y reduce la respuesta efectiva. El mecanismo preciso de la acción antiemética del Haloperidol no es claro, pero al igual que las fenotiazidas ha sido demostrado que el Haloperidol afecta directamente la zona quimiorreceptora desencadenante (ZQD), aparentemente bloqueando los receptores de Dopamina en esta zona.

Al igual que otros antagonistas de los receptores de Dopamina (por ej. Fenotiazidas), el Haloperidol puede causar reacciones extrapiramidales y parece

| |
|---|
| INSTITUTO DE SALUD PÚBLICA DE CHILE AGENCIA NACIONAL DE MEDICAMENTOS SUBDEPTO. REGISTRO Y AUTORIZACIONES SANITARIAS OFICINA PRODUCTOS FARMACÉUTICOS NUEVOS |
| 21 AGO 2012 |
| N° Ref.: MT316553/11 |
| N° Registro: F-6158/10 |
| Firma Profesional: |

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

tener un muy estrecho rango entre la dosis terapéutica efectiva para el manejo de los desórdenes psicóticos agudos y la que causa síntomas extrapiramidales.

~~El Haloperidol produce una menor sedación, hipotensión e hipotermia que la Clorpromazina.~~

Farmacocinética

Luego de una administración intramuscular de Haloperidol, la concentración plasmática peak ocurre dentro de los 10 a 20 minutos y la acción farmacológica peak ocurre dentro de 30 a 45 minutos; en pacientes con agitación aguda, el control de las manifestaciones psicóticas puede llegar a ser aparente dentro de los 30 a 60 minutos, a menudo ocurre dentro de 2 a 3 horas. Luego de una dosis simple se detecta concentraciones de Haloperidol en el plasma después de varias semanas.

La distribución de la droga en tejidos y fluidos humanos no se ha estudiado. En animales se ha encontrado que el Haloperidol se distribuye principalmente en el hígado, con bajas concentraciones en cerebro, pulmones, riñones, bazo y corazón.

El Haloperidol se une en un 92% a las proteínas plasmáticas.

El Haloperidol se distribuye en la leche materna.

La ruta metabólica exacta no se ha establecido claramente, parece que el Haloperidol se metaboliza principalmente en el hígado, la droga parece ser metabolizada principalmente por N-dealkilación oxidativa del nitrógeno piperidínico para formar ácido fluorofenilcarbónico y metabolitos piperidínicos (los cuales parecen ser inactivos), y por reducción de la carbonil butirofenona a carbinol, formando hidroxihaloperidol. Datos limitados sugieren que el metabolito reducido, hidroxihaloperidol, presenta alguna actividad farmacológica, aunque menor que el Haloperidol.

El Haloperidol y sus metabolitos son excretados lentamente por la orina y las heces.

Indicaciones y uso clínico

El Haloperidol inyectable está indicado para el tratamiento de las manifestaciones de trastornos psicóticos agudos y crónicos que incluyen esquizofrenia, estados maníacos y psicosis inducida por fármacos como la psicosis esteroidea. También puede ser útil en el tratamiento de pacientes agresivos y agitados incluyendo pacientes con síndrome cerebral crónico o retraso mental.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

Contraindicaciones

Excepto en circunstancias especiales este medicamento no debe usarse cuando exista:

- Depresión del Sistema Nervioso Central, intensa, inducida por fármacos y tóxica (puede potenciarse).

Debe evaluarse la relación riesgo-beneficio en las siguientes situaciones clínicas:

- Alcoholismo activo
(puede potenciarse la depresión del SNC; puede aumentar el riesgo de golpe de calor).
- Enfermedad cardiovascular grave, especialmente angina
(se puede provocar hipotensión o dolor anginal transitorios).
- Epilepsia
(puede disminuir el umbral de las crisis convulsivas).
- Glaucoma o predisposición al mismo
(se puede potenciar debido a los efectos secundarios anticolinérgicos del haloperidol).
- Disfunción hepática
(se puede alterar el metabolismo).
- Hipertiroidismo o tirotoxicosis
(se puede producir neurotoxicidad grave, como rigidez e incapacidad para andar o hablar).
- Enfermedad de Parkinson
(puede potenciarse)
- Insuficiencia pulmonar, como asma, enfisema o infecciones pulmonares agudas
(la potenciación de la insuficiencia respiratoria puede dar lugar a "neumonías silenciosas").
- Sensibilidad al haloperidol
(los pacientes con alergias conocidas o con antecedentes de reacciones alérgicas a otros medicamentos también pueden ser sensibles al haloperidol).

También el haloperidol está contraindicado en pacientes con desórdenes cardíacos clínicamente significativos, tales como infarto al miocardio reciente, insuficiencia cardíaca descompensada, arritmias tratadas con antiarrítmicos de la clase IA y III, prolongación del intervalo QT del electrocardiograma, historia de arritmia ventricular o

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

torsades de pointes, bradicardia clínicamente significativa, bloqueo cardíaco de segundo o tercer grado, hipocalemia. EL haloperidol no deberá ser usado con otros productos que prolonguen el intervalo QT del electrocardiograma.

Precauciones y advertencias

Carcinogenicidad/Tumorigenicidad

El haloperidol eleva las concentraciones de prolactina; la elevación persiste durante la administración crónica. Experimentos en cultivos de tejidos indican que aproximadamente un tercio de los cánceres de mama humanos son dependiente de prolactina in vitro, un factor potencialmente importante en caso que se tenga prevista la prescripción de este fármaco en un paciente con un cáncer de mama previamente detectado. Aunque se han descrito alteraciones tales como galactorrea, amenorrea, ginecomastia e impotencia, se desconoce la importancia clínica del aumento de las concentraciones séricas de prolactina para la mayoría de los pacientes. En roedores se ha observado un aumento de neoplasias de mama después de la administración crónica de antipsicóticos. Sin embargo, ni los estudios clínicos ni los epidemiológicos realizados hasta la fecha han demostrado que exista asociación entre la administración crónica del haloperidol y la tumorigénesis mamaria; los indicios existentes se consideran demasiado escasos para ser concluyentes hasta ahora.

Reproducción/Embarazo

Fertilidad: Estudios de reproducción animal han demostrado que la tasa de fertilidad disminuye con dosis de 2 a 20 veces la dosis máxima habitual de haloperidol en humanos.

Embarazo: No se han utilizado estudios adecuados en humanos. Sin embargo existen varios informes de malformaciones de las extremidades cuando la madre utiliza haloperidol junto con otros fármacos presuntamente teratógenos durante el primer trimestre.

Algunos estudios realizados con roedores han demostrado aumento de la incidencia de resorción fetal, retraso del alumbramiento y muerte neonatal con dosis de 2 a 20 veces superiores a la dosis máxima habitual para humanos de haloperidol. En un estudio realizado con ratones a los que se les administró una dosis 15 veces superior a la dosis humana de haloperidol se ha observado paladar hendido.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

Lactancia

El haloperidol se excreta en la leche materna. Estudios en animales han demostrado que el haloperidol se excreta en la leche en cantidades suficientes como para producir sedación y disfunción motora en la descendencia. No se recomienda la lactancia durante el tratamiento con haloperidol.

Pediatría

No se recomienda el haloperidol en niños menores de 3 años de edad. Los niños son muy sensibles a los efectos secundarios extrapiramidales del haloperidol, especialmente a las distonías.

Geriatría

Los pacientes geriátricos tienden a tener mayores concentraciones plasmáticas de haloperidol debido a los cambios en la distribución producidos por la disminución de la masa corporal muscular, del agua corporal total y de la albúmina, y a menudo por un aumento de la composición de la totalidad de la grasa del organismo. Estos pacientes suelen necesitar una dosis inicial menor y un ajuste más gradual de ésta.

Los pacientes geriátricos son más propensos a sufrir hipotensión ortostática y son más sensibles a los efectos anticolinérgicos y sedantes del haloperidol. Los ancianos también son más propensos a padecer efectos secundarios extrapiramidales, tales como discinesia tardía y parkinsonismo. Los síntomas de discinesia tardía son persistentes, difíciles de controlar, y en algunos pacientes, parecen irreversibles. Los síntomas pueden enmascarse durante el tratamiento prolongado, pero pueden aparecer al interrumpir el haloperidol. No se conoce un tratamiento eficaz. Una observación cuidadosa durante el tratamiento con haloperidol para detectar signos prematuros de discinesia tardía y la reducción de la dosificación o la interrupción del medicamento pueden evitar una manifestación más grave del síndrome.

Se ha sugerido que en los pacientes geriátricos se utilice la mitad de la dosis habitual para adultos. Los pacientes con síndrome orgánico cerebral o estados de confusión agudos pueden recibir inicialmente entre un tercio y la mitad de la dosis habitual para adultos, incrementando la dosis solamente cada 2 o 3 días, y preferiblemente a intervalos de 7 a 10 días. Se deben realizar intentos periódicos para interrumpir la medicación tan pronto como el paciente mejore.

La administración de haloperidol por vía intravenosa y/o en altas dosis, puede provocar un alargamiento del intervalo QT del electrocardiograma o torsades de pointes, incluso se han reportado

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

casos de muerte súbita, aún en situaciones de ausencia de factores predisponentes. Se deberá administrar con precaución en pacientes con enfermedades cardiovasculares, historia familiar de muerte súbita y/o prolongación del intervalo QT, bradicardia, hemorragia subaracnoidea y abuso de alcohol. Los disturbios en el balance de electrolitos, tales como hipocalcemia e hipomagnesemia incrementan el riesgo de arritmias y deberán ser corregidos antes del tratamiento con haloperidol. Se recomienda realizar el todos los pacientes un electrocardiograma antes de comenzar el tratamiento con haloperidol.

Interacciones

Depresores SNC

El Haloperidol puede potenciar la acción de otros depresores del SNC tales como opiáceos u otros analgésicos, barbitúricos u otros sedantes, anestésicos, o alcohol.

Litio

Aunque muchos pacientes que reciben concomitantemente Litio y un agente antipsicótico (ej. Haloperidol, Fenotiazidas), no desarrollan efectos adversos inusuales, puede ocurrir ocasionalmente un síndrome encefalopático agudo.

Anticoagulantes

Se ha reportado que el Haloperidol antagoniza la actividad anticoagulante de la fenindiona. Se requieren más estudios para determinar la importancia clínica de esta interacción.

Otras drogas

Puede ocurrir aumento de la presión intraocular en pacientes que reciben concomitantemente Haloperidol con drogas anticolinérgicas, incluyendo también agentes antiparkinsonianos.

Se ha reportado demencia en pacientes que recibieron concomitantemente Haloperidol y Metildopa. Aunque la importancia clínica de esta posible interacción no ha sido determinada, los pacientes deben ser cuidadosamente observados para sintomatología psiquiátrica adversa si estas drogas se usan juntas.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

El uso concomitante de haloperidol con otro fármacos que se conocen producen una prolongación del intervalo QT del electrocardiograma, tales como neurolepticos, antiarrítmicos de la clase IA y III, moxifloxacino, eritromicina, metadona, mefloquina, antidepresivos tricíclicos, litio o cisaprida, puede resultar en un aumento de riesgo de efectos secundarios a nivel cardíaco.

Reacciones adversas

Las reacciones adversas más frecuentes involucran al SNC.

- Efectos extrapiramidales parkinsonianos que se observan en los primeros días de la terapia, aumentan con el aumento de la dosificación, son más frecuentes en personas de edad avanzada y en niños incluyen los siguientes síntomas: dificultad para hablar o pérdida del control del equilibrio, marcha arrastrando los pies, rigidez de brazos y piernas, temblor y agitación de dedos y manos.

- Reacciones distónicas: Dificultad para tragar, fijación de ojos, espasmos musculares especialmente de cuello y de cara, movimientos de torsión de cuerpo.

- Inquietud o necesidad de permanecer en continuo movimiento.

Reacciones adversas menos frecuentes:

- Movimientos de masticación, movimientos involuntarios de brazos y piernas, movimientos rápidos de lengua, inflado de mejillas.
- Sensación de sed disminuida, cansancio o debilidad no habituales.
- Micción dificultosa (efectos antimuscarínicos).
- Mareos, sensación de mareo o desmayo (hipotensión ortostática).
- Rash cutáneo, rojo y elevado, o semejante al acné (reacción alérgica).

Incompatibilidades

La fenitoína y la heparina pueden precipitar el inyectable de haloperidol.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**

Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

Síntomas y tratamiento de la sobredosis

Los síntomas de sobredosis son una exageración de los efectos adversos. La sintomatología es: Reacciones extrapiramidales severas, hipotensión o sedación. El paciente puede parecer comatoso con depresión respiratoria e hipotensión lo que puede ser tan severo como para producir un estado semejante al shock. Las reacciones extrapiramidales se manifiestan por debilidad muscular, espasmos, rigidez o movimientos incontrolados severos, cansancio o debilidad no habitual.

El tratamiento es esencialmente sintomático, con posible utilización de lo siguiente:

- Establecer una vía aérea permeable.
- Respiración asistida mecánicamente, si fuera necesario.
- Contrarrestar la hipotensión y el colapso respiratorio mediante el uso de líquidos intravenosos, plasma o albúmina concentrada, y vasopresores como Metaraminol, Fenilefrina y Norepinefrina. La Epinefrina *no* debe usarse ya que puede producir hipotensión paradójica.
- Administrar Benzotropina o Difenhidramina para controlar las reacciones extrapiramidales severas.
- La diálisis no es eficaz para eliminar el excesivo Haloperidol sistémico.

Vías de administración y dosificación

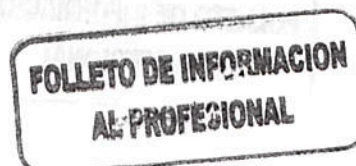
Vía de administración: Intramuscular, intravenosa.
Posología: Según indicación médica.

Dosis usual para adultos:

Psicosis aguda: Intramuscular, inicialmente de 2 a 5 mg, repitiendo la dosificación si fuera necesario a intervalos de una hora o a intervalos de cuatro a ocho horas si los síntomas se controlan satisfactoriamente.

Para un rápido control de la psicosis aguda o del delirio, el haloperidol también se puede administrar por vía intravenosa, en dosis de 0,5 a 50 mg a una velocidad de 5 mg por minuto, repitiendo la dosis cada 30 minutos según necesidad. También se puede diluir la dosis de haloperidol en 30 a 50 mL de un líquido intravenoso compatible y administrarlas durante 30 minutos.

Prescripción límite usual para adultos: 100 mg diarios.



Haloperidol 5 mg / 1 mL
Solución Inyectable



Ref.: MT316553/11Reg. I.S.P. N° F-6158/10
FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL
HALOPERIDOL SOLUCIÓN INYECTABLE 5 mg/1 mL

Dosis usual pediátrica: No se ha establecido su seguridad y eficacia.

Presentación

5 mg/mL, ampollas de 1 mL.

Envase Clínico: Caja con 100 ampollas de 1 mL.

Almacenamiento: Almacenar a no más de 30 °C. Proteger de luz. No congelar.

Fabricado y distribuido por **Laboratorio Sanderson S.A.**
Carlos Fernández N° 244, San Joaquín, Santiago.
Una empresa Fresenius Kabi.

**FOLLETO DE INFORMACION
AL PROFESIONAL**