

HALOPERIDOL, Solución Inyectable 5 mg/mL

Neuroléptico - Antipsicótico.

Composición: Cada ampolla de 1 mL contiene: Haloperidol5 mg

Excipientes: ácido láctico y agua para
inyectables c.s.

Indicaciones y usos. 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.

Contraindicaciones. Excepto en circunstancias especiales este medicamento no debe usarse cuando en presencia de: Depresión del Sistema Nervioso Central, intensa, inducida por fármacos y tóxica.

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).

Acción Farmacológica. 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. 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 su mecanismo de acción; la droga puede inhibir la recaptación de varios neurotransmisores en el mesencéfalo. Además, 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. Al igual que las fenotiazidas, se ha demostrado que el Haloperidol afecta directamente la zona quimiorreceptora desencadenante, aparentemente bloqueando los receptores de Dopamina en esta zona. El Haloperidol produce una menor sedación, hipotensión e hipotermia que la Clorpromazina.

Interacciones. Los siguientes medicamentos interaccionan con este medicamento: Alcohol o medicamentos que producen depresión en el SNC; anfetaminas, Medicamentos con actividad anticolinérgica, Agentes antidiscinéticos o antihistamínicos,; anticoagulantes (derivados de la cumarina o indandiona); anticonvulsivantes incluyendo los barbituratos; antidepresivos tricíclicos, maprotilina, inhibidores de la monoamino oxidasa (incluyendo furazolidona, procabazina) silegilina o trazodone; Bromocriptina; Brupropión; Diazoxida; Dopamina; Efedrina; Epinefrina; Otros medicamentos que causan efectos extrapiramidales; Fluoxetina; Guanadrel o guanetidina; Levodopa o pergolide; Litio; Metaraminol; Metoxamina; Metildopa; Fenilefrina.

Precauciones. Carcinogenicidad/Tumorigenicidad: El haloperidol eleva las concentraciones de prolactina, que 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 tumorgénesis 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.

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.

Pediatria - No se recomienda el haloperidol en niños menores de 3 años de edad. Los niños son muy sensibles a los efectos secundarios extrapiiramidales 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 extrapiiramidales, tales como discinesia tardía y parkinsonismo. Los síntomas de discinesia tardía son persistentes, difíciles de controlar, y en algunos pacientes, parecen irreversibles.

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

Reacciones adversas. Efectos extrapiiramidales parkinsonianos: 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).

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 orteostática); rash cutáneo, rojo y elevado, o semejante al acné (reacción alérgica).

Advertencias. Mantener fuera del alcance de los niños. Puede causar dependencia.

Tratamiento de sobredosis. Los síntomas de sobredosis son: Reacciones extrapiiramidales 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 extrapiiramidales 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 extrapiiramidales severas. La diálisis no es eficaz para eliminar el excesivo Haloperidol sistémico.

Dosis y vía de administración. Vía de administración: intramuscular.

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.

Prescripción límite usual para adultos: 100 mg diarios.

Dosis usual pediátrica: No se ha establecido dosificación.

Presentación. 5 mg/mL, ampollas de 1 mL. Caja con 100 ampollas de 1 mL.

Condición de almacenamiento. Manténgase a temperatura inferior a 30°C, protegido de la luz. Evitar la congelación.

Fabricado en Chile por: **LABORATORIO SANDERSON S.A.**

Carlos Fernández 244 - Santiago.