

**FOLLETO DE INFORMACIÓN AL PROFESIONAL**  
**Sertralina**

**Presentación:**

Estuche de cartulina impreso que contiene X comprimidos recubiertos de Sertralina de 100 mg en blister de PVCD ámbar y aluminio impreso.

**Composición:**

Cada comprimido recubierto contiene:

Sertralina clorhidrato 100 mg

Excipientes: Lauril sulfato de sodio, Croscarmelosa sódica, Dióxido silícico Coloidal, Almidón Pregelatinizado, Behenato de glicerilo (compritol 888), Estearato de magnesio, Celulosa microcristalina, Alcohol polivinílico parcialmente hidrolizado, Macrogol 3000, Dióxido de titanio, Talco Venecia.

**Categoría**

Antidepresivo.

**Indicaciones**

- Tratamiento de los síntomas de depresión.
- Tratamiento de desórdenes obsesivo-compulsivos.
- Ataques de pánico con o sin agorafobia.



**Posología**

Sertralina es administrada oralmente, puede ser administrada con o sin comida, y con el estómago lleno o vacío. La dosis usual, para el tratamiento de la depresión mental o desórdenes obsesivo-compulsivos es de 50 mg una vez al día por la mañana o en la tarde. Si no existe mejora evidente, la dosis puede aumentarse a intervalos no menores a 1 semana hasta 200 mg diarios. ~~En niños menores de 6 años la dosis debe ser ajustada por el médico.~~ En adultos mayores se comienza con una dosis de 12,5 a 25 mg diarios, pudiendo ser aumentada por el médico, si es necesario.

La terapia para pacientes pediátricos con Trastorno obsesivo compulsivo (TOC) en edades de 13 a 17 años, debe comenzar con 50 mg/día. La terapia para pacientes pediátricos con TOC en edades de 6 a 12 años, debe comenzar con 25 mg/día, aumentando a 50 mg/día luego de 1 semana.

Las dosis subsecuentes pueden ser aumentadas en caso de falta de respuesta en aumentos de 50 mg/día, hasta 200 mg/día, de acuerdo con lo necesario.

## Farmacología

### Mecanismo de Acción

El mecanismo exacto no está muy claro, pero se ha demostrado que Sertralina inhibe en forma selectiva la recaptación de serotonina en la membrana presináptica neuronal, aumentando la concentración sináptica de serotonina en el sistema nervioso central. Parece tener poco efecto en la recaptación de noradrenalina o dopa mina, y no presenta importancia clínica anticolinérgica, antihistamínica o adrenérgica. En estudios hechos en animales, Sertralina produce desensibilización del sistema transmembrana del receptor 5-HT 2.

El mecanismo de acción responsable de la eficacia de Sertralina en el tratamiento de desórdenes obsesivo - compulsivos es poco claro, sin embargo se postula la hipótesis de que la desregularización de serotonina es responsable del desorden obsesivo - compulsivo y que la Sertralina es efectiva al corregir tal desbalance.

### Farmacocinética

#### Absorción.

Sertralina se absorbe bien desde el tracto gastrointestinal luego de la administración oral, sin embargo la biodisponibilidad no ha sido dilucidada debido a que la preparación de Sertralina IV no está disponible. El porcentaje de Sertralina inalterada, luego de la administración oral, que alcanza la circulación sistémica es relativamente pequeño, debido al metabolismo de primer paso que sufre la droga. El principal metabolito, N-desmetilsertralina, exhibe una relación dosis dependiente en el área bajo la curva, aumentando las concentraciones plasmáticas, al aumentar la dosis.

#### Distribución.

Se sugiere que la droga y sus metabolitos se distribuyen débilmente hacia los tejidos corporales. El volumen de distribución no ha sido determinado en humanos, pero se han reportado valores que exceden los 20 L/kg en ratas y perros. La droga atraviesa la barrera hematoencefálica en humanos y animales.

In vitro, cerca del 98 % de Sertralina se encuentra unida a proteínas plasmáticas, principalmente a albúmina y a alfa-ácido glicoproteína. Sertralina y su metabolito N-desmetilsertralina se distribuyen hacia la leche en mujeres que amamantan y que reciben dosis de 25 - 200 mg diarios.

#### Eliminación.

**Sertralina**  
La vida media de eliminación de Sertralina es de 25-26 horas, y de su metabolito desmetilsertralina de 62-104 horas, pudiendo ser mayor en pacientes geriátricos. Sertralina es metabolizada mediante N-desmetilación, a N-desmetilsertralina y otros metabolitos extensamente en el hígado. Ambos, droga y metabolito, sufren deaminación oxidativa, y subsecuente reducción, hidroxilación y conjugación con ácido glucurónico.

Luego de la administración oral, Sertralina y sus metabolitos son excretadas en la orina y heces. Sertralina inalterada no es detectable en la orina.

#### Información para su Prescripción

##### Advertencias

En un análisis de 24 estudios a corto plazo (4 meses), que involucraron a 4400 pacientes niños con depresión mayor, desorden obsesivo-compulsivo u otras alteraciones psiquiátricas, placebo controlados, quienes fueron tratados con antidepresivos inhibidores selectivos de la recaptación de serotonina y antidepresivos de otra clase, se observó un incremento del doble en riesgo de suicidio del grupo que recibió el antidepresivo versus el grupo que recibió placebo (4 % versus 2 %).

Antes de iniciar la terapia con un antidepresivo se deben investigar cuidadosamente los antecedentes psiquiátricos del paciente, incluyendo historia familiar y personal de suicidios y desorden bipolar.

Este medicamento no debe administrarse a menores de 18 años de edad. Se ha visto que el uso de antidepresivos en niños y adolescentes aumenta el riesgo de pensamientos y conductas suicidas.

Todos los pacientes pediátricos tratados con antidepresivos por cualquier indicación deben ser estrechamente vigilados, especialmente al inicio de la terapia o al realizar ajustes de dosis, debido a que pueden experimentar empeoramiento del cuadro clínico, cambios en la conducta y surgimiento de ideas suicidas. Se debe controlar al paciente todas las semanas durante las primeras 4 semanas de tratamiento, luego semana por medio durante las siguientes 4 semanas y posteriormente a las 12 semanas o cuando sea clínicamente necesario. Se debe considerar la posibilidad de cambiar el régimen posológico o incluso discontinuar la medicación si el paciente presenta un empeoramiento de su condición o en quienes la ideación suicida es severa, abrupta en aparición o no fue parte de los síntomas iniciales.

Se debe instruir a los familiares o quienes estén a cargo de los pacientes de reportar inmediatamente al médico tratante si el paciente desarrolla en forma abrupta o severa los siguientes síntomas: agitación,

irritabilidad, ansiedad, ataques de pánico, insomnio, agresividad, impulsividad, acatisia, hipomanía o manía, así como el surgimiento de ideas suicidas.

**Precauciones y Contraindicaciones:**

Debido a los efectos de Sertralina, la droga debe ser usada con precaución en Pacientes con:

- a) Depresión o tendencia de suicidio.
- b) Enfermedad sistémica u otra condición que pueda alterar el metabolismo de la droga, o afectar la función hemodinámica.
- c) Insuficiencia renal y/o hepática.
- d) Historia de manía o hipomanía.
- e) Problemas de coagulación, debido a que la hemostasis puede ser exagerada.
- f) Anorexia o pérdida de peso.

El paciente debe notificar a su médico si está tomando medicamentos de venta libre o preparaciones o bebidas que contengan alcohol. En pacientes que operan maquinarias o manejan vehículos deben suspender tales actividades mientras estén en tratamiento. El uso de sertralina está asociado a sangramiento anormal o púrpura (enfermedad del tejido conjuntivo).

Si se presenta hiponatremia durante, el tratamiento con sertralina, se debe suspender la droga.

Sertralina está contraindicada en pacientes que han recibido terapia (2 semanas) con inhibidores de la Mono Amino Oxidasa (MAO). Se debe esperar al menos 2 semanas de terminado el tratamiento con Sertralina, antes de iniciar terapia con inhibidores MAO y viceversa.

La seguridad y eficacia de Sertralina en niños no ha sido establecida.

**Embarazo y Lactancia**

A dosis mayores de 500 mg diarios, Sertralina produce retardo en la osificación del feto. Al administrar 5 veces la dosis máxima (1 g) durante el embarazo, se puede producir aborto.

La droga durante el embarazo debe ser usada con precaución y sólo cuando sea estrictamente necesario. Durante la terapia con Sertralina se debe notificar al médico cuando la mujer este embarazada o planea estarlo.

Debido a que Sertralina se distribuye a la leche, debe ser usada con precaución en mujeres que amamantan.

#### **Sertralina**

##### **Uso en niños y adolescentes**

La seguridad y eficacia de la sertralina han sido establecidas en pacientes pediátricos entre 6 y 17 años, con Trastorno obsesivo-compulsivo.

##### **Interacciones con otros Fármacos**

##### **Inhibidores Mono Amino Oxidasa**

Importantes reacciones se han desarrollado algunas horas luego de iniciado el tratamiento con Sertralina en una mujer que recibió Fenalazina, Litio, Tioridazina y Doxepina, tales reacciones también han sido reportadas en pacientes que discontinúan la terapia con inhibidores de la recaptación de Serotonina en forma abrupta y comienzan con inhibidores MAO. Tales reacciones reciben el nombre de Síndrome Serotoninérgico, donde se incluyen ataques epilépticos, coagulación intravascular diseminada, falla respiratoria, hipertermia severa y ocasionalmente muerte. Este síndrome ocurre generalmente cuando 2 o más agentes serotoninérgicos con diferentes mecanismos de acción, son administrados conjuntamente o en forma muy cercana.

##### **Moclobemida**

Es un inhibidor selectivo reversible MAO, que ha sido asociado a Síndrome Serotoninérgico, resultando en algunos casos fatal, administrado con Citalopram o Clomipramina.

##### **Selegilina**

Es un inhibidor selectivo MAO-B que se utiliza en el manejo del Síndrome de Parkinson, el cual produce Síndrome Serotoninérgico al ser administrado en altas dosis (que exceden los 10 mg/kg) con inhibidores de la recaptación de serotonina (fluoxetina, paroxetina, sertralina).

##### **Isoniazida**

Es un agente antituberculosis, que al igual que los anteriores ha demostrado tener alguna actividad como inhibidor MAO.

##### **Sumatriptán**

Es un inhibidor de la recaptación de serotonina, utilizado en los ataques de migraña. Disminución en la efectividad de Sumatriptán y aumento de la frecuencia de ataques de migraña se han detectado al administrar en conjunto con otro inhibidor de la recaptación de serotonina, como Fluoxetina. Algunos síntomas que se presentan son: debilidad, agitación progresiva, descoordinación, dolor al pecho, disnea, entre otros.

##### **Drogas unidas a proteínas**

SALEVO 30 mg/ml

---

Sertralina puede ser desplazada de sus sitios de unión por otras drogas que posean alta unión a proteínas, como anticoagulantes o Digitoxina, pudiendo presentarse un efecto adverso potencial, asociado con terapia combinada.

#### **Anticoagulantes**

Al administrar anticoagulantes, como Warfarina, en forma conjunta con Sertralina, se observa un aumento de 8 % en el tiempo de Protombina.

#### **Alcohol**

Al disminuir el consumo de alcohol, por aumento de los niveles de Serotonina, Sertralina no potencia los efectos cognitivos o psicomotores, inducidos por el alcohol en individuos sanos.

#### **Cimetidina**

Al administrar Sertralina al segundo día (de un total de 8 días) de tratamiento con Cimetidina, se observa un aumento substancial en el área bajo la curva y en la vida media de eliminación de la Sertralina, en un 50, 24 Y 26 % respectivamente, siendo desconocida su importancia clínica.

#### **Benzodiazepinas**

Al administrar Diazepam IV al cabo de 21 días de tratamiento con Sertralina, se observó un 32 % de disminución en el clearance del Diazepam, y un 23 % de aumento en el tiempo de concentración máxima del desmetildiazepam.

#### **Clozapina**

El uso con Sertralina puede aumentar las concentraciones de este agente antipsicótico.

#### **Litio**

Aunque la concentración en estado estacionario del litio o el clearance renal de litio no presenta mayores cambios al administrarlo en forma conjunta con Sertralina, se recomienda monitorear a los pacientes que reciben litio, luego de la administración de Sertralina, y ajustar la dosis de éste si fuese necesario.

#### **Drogas hipoglicémicas**

#### **Sertralina**

La administración de Sertralina produce una disminución en el clearance de una inyección IV de Tolbutamida en un 16 0/0, aumentando la vida media de eliminación de ésta desde 6,9 a 8,6 horas.

#### **Digoxina**

La dosis de Digoxina no debe ser ajustada en pacientes que reciben Sertralina, ya que la droga no parece alterar las concentraciones séricas o el clearance renal de digoxina.

#### **Reacciones Adversas**

##### **Efectos del Sistema Nervioso**

Dolor de cabeza, somnolencia, cansancio, fatiga, mareos, insomnio, temblor, nerviosismo o ansiedad, parestesia, agitación, hipoestesia, movimientos de temblores e hipertonia, episodios de epilepsia, hipomanía y manía, astenia y confusión, se han presentado en pacientes en tratamiento con Sertralina.

##### **Efectos Gastrointestinales**

Principalmente son: náuseas, sequedad bucal y diarrea. Otros efectos adversos menos frecuentes son: constipación, dispepsia, vómitos, flatulencia, dolor abdominal, anorexia, disfagia, eructación y aumento de salivación.

##### **Reacciones dermatológicas y de sensibilidad**

Efectos adversos dermatológicos como Rush eritematoso, folicular o maculopapular, acné, alopecia, piel seca, prurito y sudoración son frecuentes.

##### **Efectos metabólicos**

Se han presentado: pérdida o ganancia de peso, anorexia, aumento del apetito, disminución en la concentración de ácido úrico, aumento en el colesterol sérico total y en los triglicéridos.

##### **Efectos óticos y oculares**

Visión anormal (incluyendo visión borrosa), anormalidad en la acomodación, conjuntivitis, diplopía, xeroftalmia, dolor ocular, midriasis, dolor de oídos y otitis media ha sido reportada.

##### **Efectos cardiovasculares**

Se presentan palpitaciones, dolor al pecho, hipotensión ortostática, efectos posturales y síncope.

##### **Efectos músculo-esqueléticos**

FOLLETO DE INFORMACION

#### **Sertralina**

Mialgia y dolor en la espalda principalmente, también se han presentado artralgia, artrosis, calambres musculares y debilidad muscular.

#### **Efectos hematológicos**

Alteración en la función plaquetaria, resultados anormales de laboratorio, y neutropenia, sin embargo esta última no es razón para suspender la droga.

#### **Efectos respiratorios**

Rinitis, faringitis, broncospasmo, disnea, epistaxis y resfriós.

#### **Efectos renales, electrolitos y genitourinarios**

Hiponatremia (posiblemente asociado a una inapropiada secreción de hormona antidiurética), la cual es reversible luego de discontinuada la droga. Disfunción sexual (principalmente eyaculación retardada), frecuencia urinaria y desordenes menstruales se han presentado en pacientes que reciben Sertralina.

#### **Efectos hepáticos**

Se han presentado elevaciones de las concentraciones séricas de la SGOT y la SGPT, aumento de las concentraciones de la aminotransferasa, fosfatasa alcalina sérica y bilirrubina, las cuales vuelven a sus niveles normales al discontinuar la droga.

#### **Información Toxicológica**

##### **Toxicidad crónica.**

Los signos y síntomas de toxicidad crónica con Sertralina se presentan al terminar la terapia en forma abrupta; dentro de estos síntomas en dos pacientes se ha detectado fatiga, calambres severos abdominales, y síntomas de influenza.

Sensaciones de electro shock se presentaron en algunos pacientes luego de la última administración de Sertralina.

Los síntomas más comunes observados son aquellos relacionados con la influenza, como fatiga, complicaciones estomacales, mareos o fotofobia, temblor, ansiedad, descoordinación. Otros síntomas reportados son: pérdida de la memoria, insomnio, parestesia, dolor de cabeza, palpitaciones, agitación o agresión.

Sin embargo, la terapia con Sertralina debe ser discontinuada en forma gradual para evitar y/o prevenir los posibles síntomas.



## **Sertralina**

### **Toxicidad aguda.**

Casos reportados de sobredosis incluyen somnolencia, náuseas, vómitos, taquicardia, cambios en el electroencefalograma, ansiedad y pupilas dilatadas.

En niños que han ingerido por accidente Sertralina se presenta taquicardia prolongada, hipertensión, alucinaciones, hipertermia, temblores en las extremidades y enrojecimiento de la piel.

En general, los casos fatales se han presentado al ingerir Sertralina en conjunto con otras drogas y lo con alcohol, pero la toxicidad por si sola no se le ha atribuido.

### **Tratamiento.**

El tratamiento de la intoxicación con Sertralina comprende tratamiento de los síntomas y de soporte. Se debe mantener estable al paciente con oxigenación y ventilación. No existe un antídoto específico.

Si el paciente es comatoso, tiene ataques de epilepsia o sufre de reflujo esofágico, un tubo endotraqueal puede ser insertado para prevenir la aspiración del contenido gástrico.

La administración de carbón activo (en conjunto con sorbitol) a veces es más efectivo que la inducción del vómito o que el lavado gástrico.

Debido al gran volumen de distribución de Sertralina y su principal metabolito, la diálisis peritoneal, diuresis forzada, hemoperfusión y/o transfusión es inefectiva para remover cantidades sustanciales de la droga del cuerpo.

### **Bibliografía.**

AHFS DRUGS INFORMATION, Published by American Society of Hospital Pharmacists, American Society of Hospital Pharmacists Inc., USA, 1996.

THE MERCK INDEX, Susan Budavari, Ed., 12 ed., Merck & Co. Inc., New Jersey, USA, 1996.