

## BUPRION SR 150 ©

DALLAS-GAUTIER

### Bupropión

Antidepresivo - coadyuvante para dejar de fumar

- 150 mg. x 30 comp.recub. de lib. prolong.

### COMPOSICIÓN

Cada comprimido recubierto de liberación prolongada de Buprion® SR 150 contiene: Bupropión clorhidrato.....150 mg. Excipientes .....c.s.

### MECANISMO DE ACCIÓN Y DATOS FARMACOCINÉTICOS

Farmacodinámicas: el bupropión actúa a nivel del sistema nervioso central inhibiendo en forma selectiva la recaptación de catecolaminas (noradrenalina y dopamina) con efectos mínimos sobre la recaptación de serotonina. Estas acciones sobre los neurotransmisores le confieren efectos como antidepresivo y si bien no se conoce con exactitud el mecanismo de acción, se cree que por mecanismos noradrenérgicos y/o dopaminérgicos posee un efecto que neutraliza la adicción a la nicotina, constituyendo un adyuvante no nicotínico para dejar de fumar. La administración de Buprion® SR 150 (bupropión) reduce los síntomas característicos de la abstinencia (irritabilidad, frustración, ansiedad, dificultad para concentrarse, humor deprimido, etc.) y disminuye la compulsión a fumar, potenciando la capacidad para lograr el abandono del cigarrillo y otras formas de tabaquismo.

Farmacocinéticas: Buprion® SR 150 (bupropión) se absorbe bien por vía oral. La unión a las proteínas del plasma del bupropión es de un 84 %. El bupropión presenta un extenso metabolismo hepático, a partir del cual se forman 3 metabolitos activos: hidroxibupropión, treohidrobupropión y eritrohidrobupropión. Todos alcanzan concentraciones plasmáticas más altas que el propio bupropión. La principal isoenzima involucrada en la formación de hidroxibupropión es el citocromo P4502B6. La vida media promedio de bupropión es de aproximadamente 21 horas.

### INDICACIONES TERAPÉUTICAS

Según prescripción médica. Buprion® SR 150 (bupropión) está indicado como coadyuvante para dejar de fumar.

### POSOLÓGIA

El tratamiento con Buprion® SR 150 (bupropión) para dejar de fumar debe realizarse en concordancia con las guías para ce-

sación de tabaquismo.

Los comprimidos de Buprion® SR 150 (bupropión) se deben ingerir enteros, sin masticar ni fraccionar.

El tratamiento se debe comenzar mientras el paciente está fumando y elegir una fecha, preferentemente en la segunda semana del tratamiento, para iniciar el abandono del cigarrillo. La dosis inicial recomendada es de 150 mg/día durante 6 días y luego aumentar a 300 mg/día en 2 dosis de 150 mg, separadas por un intervalo nunca menor de 8 horas. La dosis máxima recomendada es de 150 mg por toma y 300 mg/día y no deben emplearse dosis mayores por el riesgo de convulsiones.

Se recomienda mantener el tratamiento durante 7 a 12 semanas. Si no se logró un progreso significativo hacia la abstinencia alrededor de la semana 7 del tratamiento, es poco probable que se logre en este intento, por lo que debería suspender el tratamiento farmacológico.

Se puede asociar Buprion® SR 150 (bupropión) con formulaciones sustitutivas de nicotina controlando la presión arterial dado que es un posible efecto secundario de esta combinación. Se debe tener especial cuidado en pacientes con algún grado de deterioro en la función renal o hepática y ancianos. La dosis recomendada en estos casos es de 150 mg/día.

### CONTRAINDICACIONES

Buprion® SR 150 (bupropión) está contraindicado en las siguientes situaciones: historia previa o actual de convulsiones; hipersensibilidad al bupropión; pacientes portadores de tumores en el sistema nervioso central; suspensión abrupta de alcohol o medicamentos asociados a riesgo de convulsiones; particularmente benzodiazepinas o agentes similares; historia actual o pasada de bulimia o anorexia; tratamiento con inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO) (se deben dejar transcurrir 14 días desde el retiro de los IMAO antes de comenzar el tratamiento con bupropión); cirrosis hepática severa, en pacientes con historia de trastornos bipolares.

### PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

A la dosis máxima recomendada de 300 mg/día, el Buprion® SR 150 (bupropión) puede producir convulsiones con una incidencia de 0,1 %. El riesgo de convulsiones está ligado a la presencia de factores predisponentes como administración concomitante de

medicación que descienda el umbral convulsivo (antipsicóticos, antidepresivos, antimalaricales, tramadol, teofilina, esteroides sistémicos, quinolonas y antihistamínicos sedantes), historia de traumatismo encefálico, abuso de alcohol, adicción a cocaína o estimulantes, diabéticos tratados con hipoglucemiantes orales o insulina y uso de estimulantes anorexígenos.

En estos pacientes se recomienda una dosis máxima de 150 mg/día. Buprion® SR 150 (bupropión) deberá discontinuarse y no se recomienda en pacientes que presenten convulsiones durante el tratamiento.

Se han reportado casos de psicosis y síndromas de manía en pacientes con historia previa de enfermedad psiquiátrica. El humor depresivo puede ser un síntoma de abstinencia nicotínica. La depresión, rara vez con ideación suicida, se han reportado durante la cesación tabáquica, generalmente en forma temprana durante el tratamiento, por lo cual los pacientes deben ser advertidos de esta posibilidad. Pacientes portadores de una depresión mayor tanto adultos como niños en tratamiento con Buprion® SR 150 (bupropión) pueden presentar ideación y conductas suicidas por lo que deben ser observados estrechamente por este riesgo especialmente al inicio y frente a los cambios de dosificación.

El tratamiento con Buprion® SR 150 (bupropión) debe discontinuarse si aparecen reacciones de hipersensibilidad durante el tratamiento. Se han reportado casos de hipertensión arterial, en algunos casos severa, durante el tratamiento con Buprion® SR 150 (bupropión) solo o en combinación con sustitutos nicotínicos, tanto en pacientes con o sin hipertensión previa. Debe realizarse control periódico de la presión arterial al inicio del tratamiento y considerar la suspensión del mismo si se observan incrementos significativos de la presión arterial. El uso de Buprion® SR 150 (bupropión) en niños no está recomendado por la ausencia de suficiente experiencia clínica.

### EMBARAZO Y LACTANCIA

El uso en mujeres embarazadas solo debe realizarse cuando el beneficio para la madre supera, según el criterio médico, el potencial daño fetal. Dado que el bupropión y sus metabolitos se secretan por la leche materna, se debe decidir si la madre discontinúa el amamantamiento o suspender el tratamiento.

### REACCIONES ADVERSAS

## Y COLATERALES

El efecto adverso más comúnmente observado es el insomnio. La ocurrencia del mismo puede evitarse alejando la 2a toma de la hora de acostarse (respetando el intervalo de 8 horas inter-dosis). Otros efectos adversos frecuentes son temblores, mareos, perturbaciones de la concentración, cefaleas, depresión, agitación, ansiedad, sequedad bucal, alteraciones gastrointestinales como náuseas, vómitos, dolor abdominal y constipación, fiebre, reacciones de hipersensibilidad cutánea y desórdenes del sentido del gusto. Pueden presentarse convulsiones si se administra dosis mayores a 300 mg/día o en pacientes con factores predisponentes.

## INTERACCIONES CON MEDICAMENTOS Y ALIMENTOS

El bupropión y sus metabolitos por ser inhibidores del citocromo CYP2D6 pueden afectar el metabolismo de los fármacos que utilizan esta vía, como ser algunos antidepresivos (ej desipramina, imipramina, paroxetina), antipsicóticos (ej risperidona, tioridazina), betabloqueadores (ej metoprolol) y antiarrítmicos de la clase 1C (ej propafenona, flecainida). Si se agrega bupropión al tratamiento de un paciente que ya recibe algunos de estos fármacos se debe considerar bajar la dosis del mismo, sobre todo si se trata de una sustancia con estrecho margen terapéutico.

Existe riesgo potencial de interacción entre el bupropión y los fármacos que afectan el citocromo CYP2B6 (ej orfenadrina, ciclofosfamida). Pueden afectar la actividad terapéutica del bupropión fármacos como carbamazepina, fenobarbital y fenitoína que inducen su metabolismo, y valproato que bloquea su metabolismo.

Los cambios fisiológicos por el propio abandono del cigarrillo, pueden alterar la farmacocinética de fármacos que se metabolizan por vía del citocromo CYP1A2 (ej. teofilina, tacrine, clozapina) lo que podría requerir ajuste de dosis.

Los efectos adversos pueden aumentar en pacientes que reciben levodopa o amantadina en forma concomitante, por lo que se recomienda administrar con cuidado en estos casos. Se recomienda minimizar o evitar el consumo de alcohol. Los antidepresivos IMAO no deben asociarse a bupropión.

Buprion® SR 150 (bupropión) estuches conteniendo 30 comprimidos recubiertos de liberación prolongada.

## PRESENTACIÓN

