

QUIETAL 2 © LASCA**Clonazepam**

Tranquilizante. Ansiolítico.

Anticonvulsivo

• 2 mg. Caja x 50 comp.

Comprimidos
VIA ORALFórmula: Cada comprimido
contiene:

Clonazepam.....2 mg.

Excipientes.....c.s.

CARACTERÍSTICAS:

Quietal 2 mg es un derivado benzodiazepínico similar al diazepam; depresor del SNC desde leve sedación hasta llegar a la hipnosis. Su acción parece estar relacionada con la estimulación de los receptores GABA (ácido gama aminobutírico) en el sistema reticular activador ascendente. Posee además propiedades antiepilépticas - anticonvulsivante por supresión de la generalización de las descargas convulsivas, con punto de partida en focos epileptícos cortical - subcortical.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: El clonazepam se absorbe bien en tracto gastrointestinal. La concentración máxima se alcanza en aproximadamente 4 horas.

Aunque la concentración en plasma del clonazepam requerida para los efectos terapéuticos no fue establecida, algunos estudios indican que puede ser 20-80 ng/mL. Las concentraciones en plasma en este rango fueron reportadas, que pueden ser mantenidas en adultos recibiendo 6 mg diarios de clonazepam divididos en tres dosis y en niños de 6-13 años de edad recibiendo de 1,5-4 mg diarios del fármaco en tres dosis. Usualmente la acción inicia de 20-60 minutos y la duración es de 6-8 horas en infantes y jóvenes, y más de 12 horas en adultos.

Distribución: Hay muy poca información sobre la distribución del clonazepam. Similar a otras benzodiazepinas, el fármaco aparentemente cruza la placenta y la barrera cerebrospinal y se distribuye en la leche materna. En un estudio, las concentraciones máximas en sangre de 6,5-13,5 ng/mL, fueron encontradas de 1-2 horas después de una dosis única oral de 2 mg de clonazepam micronizado en adultos sanos.

Eliminación: El clonazepam es metabolizado en el hígado a varios metabolitos incluyendo el 7-amino-clonazepam (de ésta actividad antiepiléptica), otros metabolitos menores son el 7-acetaminoclonazepam y derivados 3-hidroxi. Los metabolitos

del clonazepam son excretados en orina principalmente casi totalmente en forma de sus metabolitos libres o conjugados (glucurónicos y/o sulfatos). Una cantidad mínima del fármaco es excretada sin cambio alguno. Unión proteica de aproximadamente 86%. Vida media plasmática que oscila entre 20 y 40 horas. Es una benzodiazepina de vida media intermedia.

MECANISMO DE ACCIÓN:

Quietal 2 mg cuyo principio activo el clonazepam actúa como depresor del Sistema Nervioso Central (SNC) produciendo todos los niveles de depresión desde una sedación leve hasta hipnosis y coma, dependiendo de la dosis. Aunque los mecanismos precisos de acción no han sido completamente establecidos, se considera que las benzodiazepinas incrementan o facilitan la acción del ácido gama aminobutírico (GABA), el mayor neurotransmisor inhibitorio del SNC, generando una unión más fuerte entre el GABA y los receptores GABA tipo A (GABAA). Actúa como agonista de los receptores de benzodiazepinas (al cual se une en forma alostérica), el cual es componente de una unidad funcional supramolecular del complejo receptor GABA - benzodiazepina - ionóforo cloruro, que funciona como compuerta de los canales de cloro. La activación del receptor GABA genera la apertura de los canales de cloro permitiendo el flujo de iones cloruro dentro de las neuronas, esto produce hiperpolarización, lo que inhibe la actividad neuronal que se traduce en una disminución de la excitabilidad neuronal, de esta manera atenúa los efectos de transmisores excitatorios.

La acción altamente específica sobre la subunidad 2 gama del receptor GABA en el hombre determina la alta potencia y mayor eficacia de esta benzodiazepina. A dicha acción se le atribuyen las propiedades antiepilépticas, ansiolítica, relajante muscular, hipnótica y sedante.

La hiperpolarización producida por las benzodiazepinas reduce la capacidad de despolarización de la neurona. Se incrementa el umbral convulsivo. Se suprime la diseminación de la actividad convulsiva producida por un foco epileptógeno pero no se produce abolición de las descargas anormales del foco.

Estudios neurofisiológicos llevados a cabo en el hombre permiten suponer que el clonazepam inhibe selectivamente la actividad del foco epileptógeno e impide así la generalización de

las convulsiones.

INDICACIONES:

Anticonvulsivante.

En el síndrome de Lennox-Gastaut.

Epilepsia crónica generalizada: Crisis mioclónicas, ausencias, pequeño mal.

Epilepsia crónica parcial: Crisis focales y complejas.

Tratamiento del desorden o trastorno de pánico con o sin agorafobia.

Trastorno de ansiedad del adulto. Trastorno del sueño.

MODO DE EMPLEO Y DOSIS USUAL:

El clonazepam es administrado oralmente. Es recomendable administrar 3 dosis iguales diarias. Las dosis mayores deben darse en la noche si no son divididas iguales. La dosificación del clonazepam debe ser cuidadosa y lentamente ajustada de acuerdo a los requerimientos y respuesta. El clonazepam no debe suspenderse abruptamente, sobre todo después de largos períodos de uso o de dosis terapéuticas altas, debido a que puede precipitar crisis convulsivas, estados epileptícos u otra sintomatología de abstinencia.

Si el clonazepam debe ser discontinuado en pacientes que han recibido una terapia prolongada con el fármaco se recomienda disminuir la dosis gradualmente. En pacientes con problemas de adicción (alcohólicos o dependientes de otro fármaco) deben ser cuidadosamente controlados cuando reciben clonazepam u otros psicotrópicos debido a la predisposición de estos pacientes a la habituación o adicción. Se puede indicar la sustitución de otro anticonvulsivo durante la suspensión del tratamiento con clonazepam.

La dosis usual inicial para niños mayores de 10 años o con peso mayor de 30 kg es de 0,01 - 0,03 mg/kg diarios.

La dosis pediátrica inicial no debe exceder a 0,05 mg/kg diario dado en 2 ó 3 dosis. La dosificación puede incrementarse en no más de 0,25 a 0,5 mg cada tercer día hasta que se controlen las crisis con un mínimo de efectos secundarios. La dosis de mantenimiento pediátrico no debe exceder de 0,2 mg/kg diariamente.

La dosis inicial para adultos de clonazepam no debe exceder 1,5 mg diarios. La dosis puede ser incrementada en 0,5 a 1 mg cada tercer día hasta que las crisis sean controladas con un mínimo de efectos secundarios. La dosis de mantenimiento para adultos no debe exceder

er de 20 mg diarios cuando se utiliza como anticonvulsivante y no más de 4 mg diarios como agente antipánico.

CONTRAINDICACIONES:

Quietal 2 mg está contraindicado en embarazo, miastenia gravis, también en pacientes con evidencia clínica o bioquímica de alguna alteración hepática significativa o con un historial de sensibilidad a las benzodiazepinas. El fármaco debe ser usado con precaución en pacientes con enfermedades respiratorias crónicas o insuficiencia renal.

Cuando deba ser administrado por tiempo prolongado, la función hepática debe ser observada. Contraindicado en pacientes con glaucoma agudo ángulo-cerrado, pero éste puede ser usado con precaución en pacientes con glaucoma ángulo-abierto quienes han estado recibiendo una terapia apropiada (uso exclusivo bajo estricta vigilancia médica en cualquier tipo de glaucoma). Hipersensibilidad al clonazepam.

INTERACCIONES:

Depresores del S.N.C.: La depresión aditiva en el S.N.C., puede ocurrir cuando el clonazepam es administrado concomitantemente con otros depresores incluyendo el alcohol y otros anticonvulsivos. En estos casos deben ser usados con mucha precaución para evitar una sobredosificación.

La administración simultánea de inductores de las enzimas hepáticas como el fenobarbital, la carbamazepina y la fenitoína puede incrementar el metabolismo del clonazepam.

Fenitoína: En un estudio, el incremento de la concentración en suero de la fenitoína, fue reportada cuando se administró concomitantemente con clonazepam.

En otro estudio, la disminución de la concentración en plasma del clonazepam se mostró cuando se administraron los dos fármacos. Aunque la importancia clínica de estos reportes no están bien establecidos, pueden monitorearse las concentraciones en suero de ambos fármacos durante el tratamiento concomitante inicial ajustando la dosis.

SOBREDOSIS:

La sobredosificación del clonazepam puede producir somnolencia, confusión, ataxia, disminución de los reflejos o coma. Tratamiento: Consiste en un lavado gástrico inmediato, teniendo cuidado en prevenir la aspiración del contenido gástrico.

En general una terapia de soporte manteniendo la ventilación adecuada y administración de fluidos I.V.

Control hemodinámico estricto, controlar el pulso y la presión sanguínea. Si ocurre una hipotensión severa se recomienda el uso de norepinefrina y metaraminol. La depresión en el S.N.C., puede ser aliviada por la administración de metilfenidato o cafeína con benzoato de Sodio. Aunque la administración de rutina de estimulantes no específicos del S.N.C., es racionalmente cuestionable, se hace énfasis en que el tratamiento debe ser con medidas de soporte. Como en sobredosis con otras benzodiazepinas no se conoce el valor de la diálisis en dosis altas de clonazepam.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Centro Nacional de Toxicología del Centro de Emergencias Médicas "Dr. Luis María Argaña" – Av. Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós - Asunción

PRESENTACIÓN:

Caja con 50 comprimidos.