



SOLUCAPS®

Cada Cápsula contiene:

Mazindol.....2 mg
Excipiente cbp..... 1 cápsula

Cápsulas de Liberación Prolongada

Presentación: Caja con 30 cápsulas de 2 mg de Mazindol

INDICACIONES TERAPÉUTICAS

Anorexigénico. Está indicado como auxiliar en el tratamiento de la obesidad exógena.

Mecanismo de acción

El mazindol es un anorexigénico químicamente no relacionado con las anfetaminas ni con otras feniletilaminas (FEAs) simpaticomiméticas. Su mecanismo de acción está dado a nivel del sistema límbico, por una estimulación directa en el centro de la saciedad en el hipotálamo y la región límbica, induciendo una supresión del apetito.

El mazindol actúa tanto por medio de las vías adrenérgicas como las dopaminérgicas. Se ha propuesto un mecanismo de inhibición de la recaptura de catecolaminas y de su almacenamiento sobretodo de norepinefrina, esto sin depleción de estas aminas. En resumen: el mazindol no produce la estimulación del SNC característica de las anfetaminas, sino que, su actividad se sitúa principalmente en el hipotálamo y sistema límbico, regulando los centros de saciedad y de apetito, los cuales son sensibles a la estimulación noradrenérgica.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA

Farmacocinética

El mazindol se absorbe íntegra y rápidamente del tracto gastrointestinal V_{máx}. 30-60 minutos, C_{máx}. 2-4 horas, se distribuye en forma uniforme en todo el organismo, atraviesa la barrera hematoencefálica y placentaria, se desconoce si se distribuye a la leche materna. El mazindol no se biotransforma ni se conjuga.

Siendo su vida media de eliminación prolongada, se ha estimado en 33 a 55 horas, se elimina 75 a 80% por la orina y el resto por las heces sin cambios, se desconoce si la fracción fecal entra en el ciclo enterohepático.

Farmacodinamia

Origen y química: El mazindol es un derivado sintético estructuralmente diferente a las feniletilaminas, es un imidazo-isoindol (5-p-clorofenil-5-hidroxi-2,3-5H-imidazol [2,1^a] isoindol), forma tautómera de una p-cloro-benzoil-fenil imidazolina.

Actividad farmacológica por aparatos y sistemas: El perfil farmacológico del mazindol es diferente al de otros anorexigénicos de tipo FEAs, su mecanismo de acción aun relacionado con los sistemas catecolaminérgicos centrales parecen de mayor especificidad límbica, sin estimulación cortical.

La farmacología corresponde al de los fármacos adrenérgicos que actúan en forma indirecta, o sea, por liberación de catecolaminas. Este perfil se describe en los siguientes párrafos, siendo características generales, debemos hacer énfasis el que ciertas actividades no se presentan a las dosis terapéuticas habituales.

SNC: Anorexigénico de acción central a nivel limbo-hipotalámico en los centros de regulación del apetito y la saciedad.

Conducta y actividad psíquica: No se han reportado fenómenos de tolerancia ni farmacodependencia, durante su uso clínico.

Cardiovascular: A dosis terapéuticas usuales los efectos de estimulación cardíaca, taquicardia, hipertensión son raros o se encuentran atenuados. Puede potenciar la actividad de fármacos con propiedades adrenérgicas y reducir los efectos hipotensores de la guanetidina.

Respiratorio: Por activación de los receptores beta del tracto respiratorio puede inducir cierto grado de broncodilatación.

Gastrointestinal: Disminuye ligeramente la motilidad por aumento de la actividad simpática sobre el músculo liso.

Musculatura lisa uterina: Disminuye ligeramente la motilidad y el tono muscular, pudiendo ser más evidente en el útero grávido y sobretodo durante el último trimestre del embarazo.

Vías urinarias: Relaja el músculo detrusor contrayendo los trigonos y el esfínter vesical, pudiendo inducir retención urinaria.

Efectos metabólicos: Al disminuir los niveles de glucosa y lactato en sangre; se debe monitorear la administración de insulina en el paciente diabético. La glucogenólisis está asociada a estimulación beta.

El metabolismo puede aumentar hasta un 20% reflejándose un aumento en el consumo de oxígeno.

Farmacología clínica

Los efectos deseables del mazindol, han sido demostrados en diversos ensayos clínicos contra placebo y corresponden a su actividad anorexigénica, asociada a una disminución significativa del peso corporal y del IMC.

Esta actividad se presenta a los niveles de dosis que no acompañan efectos adversos centrales de tipo insomnio, hiperactividad, nerviosismo, etcétera, o bien periféricos: taquicardia, hipertensión, relajación de músculo liso, retención urinaria, etcétera. Sus efectos permiten el establecimiento de un régimen nutricional adecuado, actuando en forma sinérgica con los efectos anorexigénicos para los fines del tratamiento de la obesidad. De lo anterior, se deriva la tolerabilidad del producto en forma general. MZ1®, no induce tolerancia a sus efectos anorexigénicos, durante el tratamiento.

Sin embargo, en caso de tolerancia a los efectos deseados, no debe aumentarse la dosis, sino interrumpir el tratamiento. Se pueden recuperar niveles normales de apetito. A la dosis clínica recomendada hay normalmente ausencia de estimulación central significativa.

El mazindol ha sido sometido a estudios clínicos controlados para la evaluación de la seguridad del fármaco; se instituyó un régimen de 2 mg t.i.d. por más de 26 semanas sin interrupción, sólo y hasta por más de un año en combinación con otro medicamento alternativo, durante este periodo ningún paciente solicitó aumentar la dosis; la suspensión del fármaco en forma abrupta no presentó solicitud de los pacientes por la reinstalación del tratamiento. De esto, se concluye que el mazindol no induce el fenómeno de dependencia, ni tolerancia y su tolerabilidad es adecuada para el control ponderal.

CONTRAINDICACIONES

SOLUCAPS® no debe administrarse en pacientes con: Arteriosclerosis avanzada, enfermedad cardiovascular sintomática, hipertensión arterial severa, hipertiroidismo, hipersensibilidad o idiosincrasia a aminas simpaticomiméticas, glaucoma, estados de agitación, antecedentes de drogadicción, insuficiencia cardíaca y renal severa, arritmia. Conjuntamente con bloqueadores ganglionares o neurales ni con inhibidores



de la MAO. En niños menores de 12 años, embarazo ni lactancia.

PRECAUCIONES

Se recomienda no interrumpir el tratamiento en forma abrupta, sólo que la presencia de algún efecto adverso así lo requiera, dada su presentación en cápsulas se puede establecer un régimen de disminución alternada de administración cada 3er., 4o. y 5o. día, hasta la interrupción, que se debe adecuar a cada paciente. Además, durante todo el periodo de tratamiento los pacientes deberán ser avisados sobre la posibilidad de una disminución de los reflejos mientras se esté operando maquinaria peligrosa o conduciendo un automóvil. Los enfermos deberán ser advertidos del uso de anestésicos locales para procesos dentales sin consultar primero a su médico. Se les debe advertir a los pacientes que no deben abrir o masticar las cápsulas; deben deglutirlas para preservar la capa de protección de los gránulos.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA

No se recomienda la administración de SOLUCAPS® durante el embarazo ni la lactancia.

REACCIONES ADVERSAS

Pueden presentarse palpitaciones, taquicardia, arritmia, hipertensión, mareos, nerviosismo, intranquilidad, insomnio, debilidad o fatiga, agitación, dolor de cabeza, sequedad de boca, náuseas, vómito, constipación, rash, eritema, irritación ocular, midriasis, disuria, poliuria y trastornos menstruales.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS

Está contraindicada la administración concomitante de SOLUCAPS® y de drogas antihipertensivas del tipo de bloqueadores neurales como guanetidina. No debe administrarse durante el tratamiento con inhibidores de la MAO, se deberá esperar cuando menos 14 días después de la última administración de estos.

ALTERACIONES EN LOS RESULTADOS DE PRUEBAS DE LABORATORIO

Las alteraciones de los valores en sangre, suero u orina no son significativas clínicamente cuando ocurren a dosis terapéuticas.

SOLUCAPS® baja moderadamente los niveles de glucosa en sangre independientemente de los efectos supresores del apetito por incremento de la glucosa en el músculo esquelético del humano.

PRECAUCIONES EN RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGENESIS, TERATOGENESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD

No se han reportado efectos carcinogénicos, mutagénicos, teratogénicos, ni sobre la fertilidad. No obstante, el uso de este producto requiere de un estricto control médico.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN

Oral. Una tableta después del desayuno.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL

Se desconoce la dosis letal mínima en el humano, se ha reportado un caso de ingesta con fines suicidas de 80 mg de mazindol al cual sobrevivió la paciente. Sin embargo, otra paciente falleció por una ingesta de 200 mg. Algunos casos en pediatría (1-4 años) con sobrevida, han sido reportados con

dosis de 20 mg y hasta 40 mg. El mazindol por su carácter ácido no responde a la diálisis con productos neutros o alcalinos.

Síntomas: Temblor, hiperreflexia, respiración rápida, hiperpirexia, taquipnea, vértigo, confusión, alucinaciones, estados de pánico. Depresión y fatiga usualmente sigue a la estimulación central, taquicardia, hipertensión o hipotensión, colapso circulatorio, náuseas, vómito, diarrea, cólico abdominal. Tratamiento: Mantenimiento de vías aéreas y vasculares permeables, control y vigilancia de signos vitales. Diuresis ácida forzada. Una hemodiálisis puede estar indicada. El uso de simpaticolíticos puede contrarrestar o abolir la intoxicación simpática. El uso de clorpromazina o de ansiolíticos de tipo benzodiazepinas está indicado para evitar la sobreestimulación de SNC.

Consérvese a temperatura ambiente no mayor a 30°C y en lugar seco.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN

Literatura exclusiva para médicos. No se deje al alcance de los niños. Su venta requiere receta médica.

Hecho en México por Productos Medix, S. A. de C. V. Calzada del Hueso No. 39, Col. Ex Ejido de Santa Úrsula Coapa, C. P. 04650, Del. Coyoacán, D. F. México.