



esbelcaps®

Fenproporex, Diazepam
20 mg / 6 mg

COMPOSICION:

Cada cápsula contiene:

Clorhidrato de Fenproporex

Equivalente a 20 mg
de Fenproporex

Diazepam 6 mg

Excipientes c.b.p. 1 cápsula

INDICACIONES:

Anorexigénico. Auxiliar en el tratamiento de la obesidad. Obesidad exógena, coadyuvante al establecimiento de una dieta baja en calorías.

FARMACOLOGÍA CLÍNICA

Farmacocinética

El fenproporex se absorbe bien por el tracto gastrointestinal, su concentración inicial en plasma se presenta a los 30 minutos ($V_{m\acute{a}x.}$) de administración, llegando a su máximo en 60 minutos ($C_{m\acute{a}x.}$) y con un estado estable de 6 horas ($T_{m\acute{a}x.}$) eliminándose en forma de metabolitos activos por la orina. El diazepam es rápidamente absorbido por el tracto gastrointestinal, llegando al máximo de su concentración en una hora ($C_{m\acute{a}x.}$), tiene una vida media de 15 días, eliminándose por la orina en forma de metabolitos activos (óxidos) o inactivos (glucuronizados). En la presentación de dialicels se mantiene una liberación prolongada por un tiempo de 8 horas, llegando a producir concentraciones terapéuticas durante 10 a 12 horas en la administración inicial, coadyuvando a la adherencia al tratamiento.

Farmacodinamia

El fenproporex produce un efecto anoréxico con modificación de la conducta alimentaria, por medio de una actividad selectiva en los centros hipotalámicos del apetito y la saciedad. Adicionalmente, su propiedad lipolítica debida a su acción de activación de la adenilciclasa, induciendo la formación de 3-5 AMP cíclico a partir del ATP, aumentando el catabolismo lipídico, resultado de una activación de la lipasa que actúa sobre los triglicéridos, desdoblándolos en glicerol y ácidos grasos libres que son oxidados rápidamente, produciendo la pérdida ponderal deseable en el tratamiento de la obesidad. El fenproporex, a dosis terapéuticas, no estimula la corteza cerebral ni el sistema nervioso autónomo simpático. La interacción con un ansiolítico de tipo benzodiazepínico como el diazepam mantiene al paciente en una situación óptima, sin angustia, disminuyendo la neurosis bulímica y los automatismos de consumo. Además, sus propiedades hipnagógicas, son deseables en los tratamientos de regulación ponderal. El diazepam ejerce su actividad ansiolítica, por medio de un aumento de la eficacia de la actividad GABA-érgica a todos los niveles del SNC, al activar el complejo del receptor benzodiazepínico, induciendo una disminución en la reactividad neural excitatoria.

Actividad farmacológica por aparatos y sistemas

SNC: Anorexigénico de acción central a nivel limbo-hipotalámico en los centros de regulación del apetito y la saciedad. El fenproporex puede inducir nerviosismo, irritabilidad, alteraciones del sueño. Sin embargo, el fenproporex ha sido utilizado con éxito en los trastornos invalidantes del sueño (i.e. narcolepsia e hipersomnia).

El diazepam reduce la ansiedad y el nerviosismo, puede inducir somnolencia, disminución en la reactividad, etcétera.

Conducta y actividad psíquica: No se han reportado fenómenos de tolerancia ni fármacodependencia durante su uso clínico. Los efectos interactivos del fenproporex y el diazepam equilibran la conducta, tanto nutricional como relacional.

Cardiovascular: A las dosis terapéuticas usuales los efectos de estimulación cardíaca, taquicardia, hipertensión son raros o se encuentran atenuados.

En algunos puede aumentar la TA y en otros disminuirla, se puede presentar taquicardia o bradicardia dependiendo del tono autonómico de cada paciente. Puede potenciar la actividad de fármacos con propiedades adrenérgicas y reducir los efectos hipotensores de la guanetidina.

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

Gastrointestinal: Sequedad de boca, náuseas, 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 trigónos y el esfínter vesical, pudiendo inducir retención urinaria.

Efectos metabólicos: Lipólisis y termogénesis.

Farmacología clínica: El fenproporex ha sido utilizado en estudios clínicos controlados por periodos mayores a seis meses sin presentarse fenómenos de tolerancia, ni dependencia, sólo y hasta por más de un año en combinación con otro medicamento alternativo. Además, no se reportaron eventos adversos no descritos, ni reacciones adversas serias o severas.

CONTRAINDICACIONES:

ESBELCAPS® no debe administrarse a pacientes cursando con hipertrofia prostática, glaucoma o cualquier padecimiento obstructivo de vías urinarias o tracto gastrointestinal. Anorexia, insomnio crónico, personalidad psicopática. Insuficiencia hepática y/o renal. Tendencias suicidas u homicidas. Hipertensión arterial. Pacientes que en su trabajo manejan instrumentos de precisión, herramientas o utensilios en los que se requiere una atención permanente, vehículos de cualquier tipo y maquinaria pesada. Pacientes en tratamiento con inhibidores de la monoaminoxidasa (IMAO). Durante el embarazo o la lactancia. A menores de 12 años.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

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 3o, 4o o 5o día, hasta la interrupción, que se debe adecuar a cada paciente. Además, durante 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 pacientes 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.



Alteraciones en los resultados de pruebas de laboratorio: excepcionalmente la citología hemática puede presentar leucopenia y granulocitopenia.

INTERACCIONES:

La administración concomitante fenproporex con:

- Inhibidores de la monoamina oxidasa: puede inducir crisis hipertensiva grave, esta interacción está contraindicada.
- Inhibidores selectivos de la recaptura de serotonina: puede producir síndrome serotoninérgico.

La administración concomitante de diazepam con:

- Barbitúricos: cuando se usan en combinación, estos medicamentos pueden tener efectos adictivos del SNC y depresión respiratoria.
- Hierba de San Juan: reducción de la efectividad de las benzodiacepinas.
- Teofilina: se ha demostrado que la teofilina revierte los efectos sedantes de las benzodiacepinas.
- Isoniazida: monitorear a los pacientes que reciben isoniazida y diazepam para detectar signos de toxicidad por benzodiacepinas, incluyendo depresión respiratoria, somnolencia y sedación.
- Antibiótico macrólidos: aumento de la toxicidad de las benzodiacepinas (depresión del SNC, ataxia, letargo).
- Amitriptilina: los pacientes pueden experimentar un deterioro psicomotor adictivo o puede afectar la conducción u otras tareas que requieran un motor complejo habilidades.
- Fluvoxamina: puede causar efecto prolongado del diazepam, por lo que se recomienda monitorear los signos de efectos excesivos de benzodiacepinas.
- Omeprazol: puede causar efecto prolongado del diazepam, por lo que se recomienda monitorear los signos de efectos excesivos de benzodiacepinas.
- Cimetidina: se han reportado efectos adversos tales como sedación pronunciada y deterioro de la función cognitiva y psicomotora, por disminución en el metabolismo de diazepam.
- Anticonceptivos combinados: los anticonceptivos combinados pueden aumentar el efecto del diazepam en el rendimiento psicomotor.
- Jugo de toronja: aumento de las concentraciones plasmáticas del diazepam.
- Cafeína: reducción de los efectos sedantes y ansiolíticos del diazepam.
- Bebidas con alcohol: esta combinación da como resultado aumento de la sedación y efectos aditivos o sinérgicos en la disminución de las habilidades de conducción y el rendimiento psicomotor general.
- Relajantes musculares de acción central: en combinación puede tener efectos aditivos sobre el SNC y los depresores respiratorios.

Rifampicina: disminución de la eficacia de diazepam, no tiene efecto terapéutico.

REACCIONES ADVERSAS:

Pueden presentarse: rubor o palidez de tegumentos, palpitations, disritmias, dolor precordial de tipo ágor. Espasmo gastrointestinal, dolor de tipo cólico, diarrea o constipación, somnolencia, ataxia, náusea, vómito, vértigo, mareo, midriasis y trastornos de acomodación visual, aumento o disminución de la presión arterial, resequedad de boca y

mucosas, sensación de sed y polidipsia, cefalea, fiebre, diaforesis, gusto metálico, retención urinaria.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: Oral.

Dosis: 1 cápsula 30 o 60 minutos antes del desayuno.

No exceder la dosis recomendada.

No debe prescribirse a pacientes ancianos.

RECOMENDACIONES EN CASO DE SOBREDOSIFICACIÓN SEGÚN EL PERFIL TOXICOLÓGICO:

Los síntomas que pueden presentarse en caso de una sobredosificación, están asociados principalmente a la estimulación del SNC, así como al SNA, estos consisten en estado de excitación, confusión, temblor generalizado, hipereflexia, taquipnea, alucinaciones, reacción de pánico, depresión, fatiga intensa, hipertensión, hipotensión, colapso vascular, taquicardia, ágor, náusea, vómito y diarrea. Algunos de estos síntomas y/o signos, pueden estar atenuados por la acción del Diazepam.

Síntomas y signos de vigilancia estrecha del pacientes y medidas específicas. Interrumpir el producto/hospitalización. Hemodiálisis.

CONDICIONES DE CONSERVACIÓN Y

ALMACENAMIENTO:

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

PRESENTACION:

Caja conteniendo 30 cápsulas de liberación prolongada.

Hecho en México por:

PRODUCTOS MEDIX, S. A. de C.V.

Ciudad de México, México.

Reg. Núm. 79875, S. S. A.

www.medix.com.mx