



Serlina® Sertralina

Comprimidos 50 mg y 100 mg.
Venta bajo receta archivada
Psicotrópico Lista IV

Industria Argentina

"Este medicamento debe ser usado exclusivamente bajo prescripción y vigilancia médicas y no puede repetirse sin nueva receta médica."

COMPOSICIÓN: Cada comprimido de SERLINA® 50 mg contiene: Sertralina (como clorhidrato) 50 mg. Excipientes: lactosa monohidrato; almidón de maíz; croscarmelosa sódica; povidona; estearato de magnesio, c.s. Cada comprimido de SERLINA® 100 mg contiene: Sertralina (como clorhidrato) 100 mg. Excipientes: lactosa monohidrato; almidón de maíz; croscarmelosa sódica; povidona; estearato de magnesio, c.s.

ACCIÓN TERAPEÚTICA: Antidepresivo. Código ATC: N06A /B06.

INDICACIONES: - Trastornos por depresión mayor. - Desórdenes obsesivo-compulsivos. - Desórdenes de pánico. - Trastornos por estrés post-traumático.

ACCIÓN FARMACOLÓGICA: Antidepresivo derivado de nortilamina. Químicamente no relacionado con antidepresivos tricíclicos, tetracíclicos u otros antidepresivos.

Mecanismo de acción/efecto: Sertralina es un potente y selectivo inhibidor de la captación de serotonina neuronal (5-HT) y sólo posee efectos débiles sobre la captación neuronal de norepinefrina y dopamina. La administración crónica de sertralina en animales ha resultado en la regulación hacia abajo de los receptores beta-adrenérgicos post-sinápticos. La inhibición por sertralina de la re-captación de serotonina incrementa la transmisión serotoninérgica, que resulta en la subsiguiente inhibición de la actividad adrenérgica en el locus ceruleus. Específicamente, la sertralina deprime el desencadenamiento de las neuronas serotoninérgicas del rafe; esto a su vez, aumenta la actividad del locus ceruleus, con la subsiguiente desensibilización de los beta-receptores post-sinápticos y los receptores alfa 2 presinápticos. Sertralina no presenta afinidad específica con los receptores adrenérgicos (alfa 1, alfa 2 o beta), los receptores muscarínicos - colinérgicos, el ácido gamma amino butírico (GABA), los receptores dopaminérgicos, los receptores histaminérgicos, los receptores serotoninérgicos (5HT 1A, 5HT 1B, 5HT2) o los receptores benzodiazepínicos. Sertralina no inhibe la monoamino oxidasa.

FARMACOCINÉTICA: Absorción: Lenta. La biodisponibilidad está aumentada si sertralina se toma con alimentos, debido posiblemente a un metabolismo de primer paso.

Distribución: Tanto la sertralina como sus metabolitos son ampliamente distribuidos a los tejidos. En estudios en animales, el volumen de distribución excedió los 20 litros/kg (L/Kg).

Combinación proteica: Muy alta (98%). **Biotransformación:** Experimenta un amplio metabolismo de primer paso en el hígado. La vía inicial primaria es la N-desmetilación para formar N-des-metil-sertralina, que es sustancialmente menos activa que el compuesto original, exhibiendo solo alrededor de 1/8 de su actividad. Las pruebas en animales han demostrado que la N-desmetilsertralina no contribuye a la actividad antidepresiva o a la toxicidad del compuesto original. Tanto la sertralina como la N-desmetilsertralina experimentan desaminación oxidativa y subsiguiente reducción, hidroxilación y conjugación con ácido glucurónico. **Vida media de eliminación: Sertralina:** 24 a 26 horas. **N-desmetilsertralina:** 62 a 104 horas. **Comienzo de la acción:** En el plazo de 2 a 4 semanas. **Tiempo hasta la concentración pico:** El tiempo hasta alcanzar la concentración plasmática pico media (T_{max}) después de la administración de 50 a 200 mg de sertralina una vez al día durante 14 días, osciló entre 4.5 a 8,4 horas. Cuando se administró sertralina con alimentos, el T_{max} se redujo de 8 horas a 5,5 horas post-dosaje.

Concentración plasmática pico: La concentración plasmática pico media (C_{max}) y el área bajo la curva de tiempo concentración en plasma (AUC) fueron proporcionales a la dosis en el rango de 50 a 200 mg de sertralina, se lograron concentraciones plasmáticas constantes en alrededor de 7 días en sujetos adultos y después de 2 a 3 semanas en pacientes de más edad.

Eliminación Renal: Alrededor de 40 al 45% de una dosis radioactiva administrada se recuperó en la orina en el término de 9 días, con menos del 12 al 14% de sertralina inalterada. **Fecal:** Alrededor de 40 al 45% de una dosis radioactiva administrada se recuperó en las heces en el plazo de 9 días, incluyendo del 12 al 14% de sertralina inalterada. **En diálisis:** Debido al gran volumen de distribución, no se cree que la diálisis sea efectiva. **Cinética en situaciones clínicas particulares: Pacientes geriátricos:** En un ensayo clínico con un grupo de 16 pacientes geriátricos tratados durante 14 días con una dosis de 100 mg/día, se observó que el clearance plasmático de sertralina era aproximadamente 40% más bajo que en individuos más jóvenes de otro grupo de ensayos (25 a 32 años). Por consiguiente, las concentraciones plasmáticas constantes se podrán alcanzar después de 2 a 3 semanas en pacientes geriátricos. El mismo estudio mostró un clearance de desmetilsertralina disminuido en los pacientes añosos varones pero no en las mujeres. **Niños:** La farmacocinética de sertralina fue evaluada en un grupo de estudios de 61 pacientes pediátricos, varones y niñas, (29 pacientes de 6 a 12 años y 32 de 13 a 17 años) con diagnóstico de depresión o desórdenes obsesivo-compulsivos. Los pacientes fueron administrados con sertralina durante 42 días, se tituló la dosis hasta 200 mg/día y se mantuvo en esa dosis por un mínimo de 11 días. El último día de administración de 200 mg/día de sertralina, el grupo de 6-12 años exhibió un AUC promedio de sertralina (0-24hs) de 3107 ng-h/mL, una C_{max} promedio de 165 ng/mL y una vida media de 26,2 hs. El grupo de 13-17 años exhibió un AUC promedio de sertralina (0-24hs) de 2296 ng-h/mL, una C_{max} promedio de 123 ng/mL y una vida media de 27,8 hs. Los niveles plasmáticos más elevados en el grupo de 6-12 años se atribuyeron al bajo peso corporal. No se observaron diferencias asociadas con el sexo de los pacientes. Por comparación, otro grupo de estudio de 22 adultos entre 18 y 45 años (11 hombres y 11 mujeres) recibió 30 días de 200 mg/día de sertralina y exhibieron un AUC promedio de sertralina (0-24 hs) de 2570 ng-h/mL, una C_{max} promedio de 142 ng/mL y una vida media de 27,2 hs. En relación con los adultos, tanto los de 6-12 años como los de 13-17 años mostraron alrededor de un 22% de disminución de AUC (0-24hs) y de valores C_{max} cuando la concentración plasmática fue ajustada según el peso. Esta información sugiere que los pacientes pediátricos metabolizan sertralina con una ligera mayor eficiencia que los adultos. Sin embargo, se recomienda dosis más bajas para pacientes pediátricos debido al menor peso corporal, especialmente en pacientes muy jóvenes, con el propósito de evitar niveles plasmáticos excesivos. **Insuficiencia hepática:** La sertralina es metabolizada extensivamente por el hígado. En un estudio de farmacocinética se observó que una dosis única administrada a pacientes que sufrían de cirrosis leve y estable prolongaba la vida media de eliminación y aumentaba el AUC, comparativamente a los valores observados en sujetos sanos. **Insuficiencia renal:** Dado que la sertralina se metaboliza esencialmente por el hígado, la excreción de sustancias inalteradas en la orina no es de relevancia. En estudios clínicos se observó que en pacientes que padecían de insuficiencia renal leve a moderada (clearance de creatinina entre 20 y 50 ml/min) o severo (clearance de creatinina <20 ml/min), los parámetros farmacocinéticos (AUC₀, C_{max}, T_{max}) no variaron de manera significativa después de una administración única de sertralina, comparados con los valores del grupo de control.

Posología y modo de administración: Tratamiento inicial: Adultos: Depresión y desórdenes obsesivos compulsivos: El tratamiento debe ser comenzado con una dosis de 50 mg una vez al día. **Desórdenes de pánico y trastornos por estrés post-traumático:** El tratamiento debe ser iniciado con una dosis de 25 mg una vez al día. Después de una semana, la dosis puede ser aumentada a 50 mg diarios. Debido a que una relación dosis-efecto no ha sido establecida para pacientes con síndrome obsesivo-compulsivo, depresión, desórdenes de pánico o trastornos por estrés post-traumático, se recomienda para estos casos una dosis inicial de 50 mg. Los pacientes que no responden a la dosis de 50 mg pueden beneficiarse con incrementos que llegan a un máximo de 200 mg/día. La vida media de eliminación de sertralina es de 24 horas, por lo que los cambios de dosis deben producirse con un lapso de, por lo menos, una semana. **Niños y adolescentes: Desórdenes obsesivos compulsivos:** El tratamiento con sertralina debe ser iniciado con una dosis de 25 mg una vez al día en niños (edades entre 6 - 12 años) y con una dosis de 50 mg una vez al día en adolescentes (edades entre 13 - 17 años). Si bien no se ha establecido una relación entre dosis y efecto para DOC, los pacientes fueron dosificados en un rango

Experiencia adversa	(% de pacientes informantes)		Experiencia adversa	(% de pacientes informantes)	
	Sertralina CIH (n = 861)	Placebo (n = 853)		Sertralina CIH (n = 861)	Placebo (n = 853)
Trastornos del SN autónomo			Trastornos metabólicos y nutricionales		
Sequedad bucal	16,3	9,3	Sed	1,4	0,9
Aumento de sudoración	8,4	2,9	Trastornos del sistema músculo esquelético		
Cardiovascular			Mialgia	1,7	1,5
Palpitaciones	3,5	1,6	Trastornos psiquiátricos		
Dolor torácico	1,0	1,6	Insomnio	16,4	8,8
Trastornos del sistema nervioso Central y periférico			Disfunción sexual (1) (masculina)	15,5	2,2
Cefalea	20,3	19,0	Somnolencia	13,4	5,9
Vértigo	11,7	6,7	Agitación	5,6	4,0
Tembor	10,7	2,7	Ansiedad	2,6	1,3
Parestesia	2,0	1,8	Bostezos	1,9	0,2
Hipoestesia	1,7	0,6	Disfunción sexual (2) (femenina)	1,7	0,2
Contorsiones	1,4	0,1	Deterioro de la concentración	1,3	0,5
Hipertonía	1,3	0,4	Reproductiva		
Trastornos de piel y apéndices			Trastorno menstrual	1,0	0,5
Rash	2,1	1,5	Trastornos del sistema respiratorio		
Trastornos gastrointestinales			Rinitis	2,0	1,2
Náuseas	26,1	11,8	Faringitis	1,2	0,9
Diarrea/Heces blandas	17,7	9,3	Trastornos especiales		
Constipación	8,4	6,3	Visión anormal	4,2	2,1
Dispepsia	6,0	2,8	Tinito	1,4	1,1
Vómitos	3,8	1,8	Perversión del sabor	1,2	0,7
Flatulencia	3,3	2,5	Trastornos del sistema urinario		
Anorexia	2,8	1,6	Frecuencia de micción	2,0	1,2
Dolor abdominal	2,4	2,2	Trastornos de la micción	1,4	0,5
Aumento del apetito	1,3	0,9			
General			(1) % basado solamente en pacientes masculinos: 271 sertralina CIH (demora eyaculatoria básicamente) y 271 pacientes a placebo.		
Fatiga	10,6	8,1	(2) % basado en pacientes femeninas solamente: 590 sertralina CIH y 582 pacientes a placebo.		
Llamaradas de calor	2,2	0,5	Hechos informados por lo menos por el 1% de los pacientes tratados con sertralina CIH están incluidos.		
Fiebre	1,6	0,6			
Dolor de espalda	1,5	0,9			

SOBREDOSIS: Se han comunicado sobredosis no fatales producidas con dosis entre 500 mg y 6000 mg; de los cuales 28 casos corresponden a ingestión de sertralina únicamente y dieciocho pacientes se constataron niveles en sangre que variaron de 5 ng/ml a 554 mg/ml. En el resto de los casos las intoxicaciones estaban asociadas a alcohol u otras drogas. Los síntomas de sobredosis con sertralina son: somnolencia, náuseas, vómitos, taquicardia, cambios del electrocardiograma, ansiedad y pupilas dilatadas. Aunque no han habido reportes de muerte cuando sertralina fue tomada sola, existen 4 casos de muertes que involucran sobredosis de sertralina en combinación con otras drogas y/o alcohol. Por lo tanto, los casos de sobredosis deberán ser tratados agresivamente. **Manejo de sobredosis:** Establecer y mantener la vía aérea, asegurar la adecuada oxigenación y ventilación. Se puede emplear carbón activado tomando a sorbos, esto puede ser tan o más efectivo que emesis o lavado y debe ser considerado para el tratamiento de la sobredosis. Se recomienda el monitoreo de los signos cardíacos y vitales conjuntamente con medidas sintomáticas generales y de apoyo. No hay antídotos específicos para el producto. En caso de sobredosis, acudir inmediatamente al médico y/o concurrir o consultar al centro toxicológico más cercano. Centros toxicológicos de referencia: - Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666 / 2247 - Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648 / 4658-7777 - Centro de Asistencia Toxicológica La Plata: (0221) 451-5555

PRESENTACIONES: SERLINA® / SERTRALINA 50 mg: Envases conteniendo 10 y 30 comprimidos. SERLINA® / SERTRALINA 100 mg: Envases conteniendo 30 comprimidos.

CONSERVAR POR DEBAJO DE 25°C EN SU ENVASE ORIGINAL. MANTENER ESTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS. Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud. Certificado N°: 42.134. Fecha de la última revisión: Junio 2012. Disp A.N.M.A.T. 3155/2012



Elaborado en: Virgilio 844, CABA
Laboratorio Rontag S.A. Tel.: 0800-555-766824 (RONTAG)
Director Técnico: Javier Matías Iglesias Abuín, Farmacéutico.

511372-V1



