DULOXETINA HCL

Evidence
manipulação farmacêutica

DULOXETINA HCL

Identificação

Fórmula Molecular: $C_{18}H_{19}NOS,HCl$

Peso molecular: 333.9

DCB: 03263

CAS: 54965-24-1

Fator de correção: Verificar certificado de análise

Uso: Interno

Propriedades Farmacológicas

O cloridrato de duloxetina, é um inibidor da receptação de serotonina e nor-adrenalina (IRSN), apresentando como resultado o aumento da disponibilidade das referidas substancias no Sistema Nervoso Central. Seu nome químico é (+)-(S)-Nmetil-γ-(1-naftaleniloxi)-2-cloridrato de tiofenopropanamina.

FARMACOCINÉTICA

Absorção: em humanos, o cloridrato de duloxetina é bem absorvido quando administrado por via oral e sua concentração plasmática máxima (Cmáx) ocorre 6 horas após sua administração. Quando administrado com alimento, o pico de concentração é atingido em 6 a 10 horas, ocorrendo também uma discreta diminuição na absorção (aproximadamente 11%). Observa-se um atraso de 3 horas na absorção e um aumento de um terço no clearance aparente da duloxetina após uma dose vespertina, quando comparada à dose matinal.

Distribuição: o volume de distribuição aparente do cloridrato de duloxetina é de aproximadamente 1.640 litros. A duloxetina encontra-se altamente ligada (> 90%) às proteínas plasmáticas, principalmente à albumina e à glicoproteína α 1 -ácida. A ligação proteica não é afetada pelas insuficiências renal ou hepática.

Metabolismo: o cloridrato de duloxetina é extensivamente metabolizado e seus metabólitos são excretados principalmente na urina. As principais vias de biotransformação da duloxetina envolvem a oxidação do anel naftil, seguida por conjugação e posterior oxidação. Tanto CYP2D6 quanto CYP1A2 catalisam a formação dos dois principais metabólitos da duloxetina, o conjugado glucuronídeo da 4-hidróxi duloxetina e o sulfato conjugado da 5- hidróxi-6-metóxi duloxetina. Os metabólitos circulantes não são farmacologicamente ativos.

Excreção: a meia-vida de eliminação da duloxetina é de 12,1 horas e o clearance plasmático é de 101 L/h. A maior parte da duloxetina (70%) é eliminada na urina na forma de metabólitos e aproximadamente 20% é eliminada nas fezes.

Indicações

O cloridrato de duloxetina é indicado para o tratamento de:

- Transtorno depressivo maior; - dor neuropática periférica diabética;
- Fibromialgia (FM) em pacientes com ou sem transtorno depressivo maior (TDM);
- Estados de dor crônica associados à dor lombar crônica;
- Estados de dor crônica associados à dor devido à osteoartrite de joelho em pacientes com idade superior a 40 anos e Transtorno de ansiedade generalizada. Transtorno de ansiedade generalizada é definido pelo DSM-IV como ansiedade e preocupação excessivas, presentes na maioria dos dias, por pelo menos seis meses. A ansiedade e preocupação excessivas devem ser difíceis de controlar e devem causar prejuízo as suas funções diárias. Deve estar associado a três dos seis sintomas seguintes: inquietação ou sensação de estar com os nervos à flor da pele, ficar facilmente cansado, dificuldade em concentrar-se ou sensações de "branco" na mente, irritabilidade, tensão muscular e perturbação do sono.

Posologia

O Cloridrato de duloxetina deve ser administrado por via oral, em dosagens usuais entre 20 – 60mg ao dia, independentemente das refeições. Não administrar mais que a quantidade total de cloridrato de duloxetina recomendada para períodos de 24 horas. Caso o paciente se esqueça de tomar uma dose, deverá tomá-la assim que lembrar. Entretanto, se for quase a hora da próxima dose, o paciente deverá pular a dose esquecida e tomar imediatamente a dose planejada.

Contraindicações

O cloridrato de duloxetina não deverá ser tomado por pacientes que estejam utilizando uma droga inibidora da monoaminoxidase (IMAO) como PARNATE® (sulfato de tranilcipromina) e AURORIX® (moclobemida) ou tiverem parado de tomar um IMAO nos últimos 14 dias. O uso de cloridrato de duloxetina com um IMAO pode causar efeitos colaterais graves ou provocar risco à vida. Não tomar um IMAO por, pelo menos, 5 dias após a interrupção do tratamento com cloridrato de duloxetina. Pergunte ao seu médico se algum medicamento que você usa é desta classe.

Sugestão de Fórmula

Componentes	Quantidade
Duloxetina	20 a 60mg
Excipiente...qsp	1 cápsula
Mande cápsulas	

Referências bibliográficas

DTG, Dicionário Terapêutico Guanabara, Edição 2013/2014.
BATISTUZZO, J.A; ITAYA, M; ETO, Y. Formulário Médico-Farmacêutico. São Paulo/SP: Atheneu, 5ª Ed. 2015

Rev.0 – 31/01/2019 RT/SAC