

#ficha técnica

Insumo Farmacologicamente Ativo (IFA)

Olanzapina



Elaborado por
Jéssica Monteiro da
Silva Carvalho

Revisado por
Prof^a Jaise Silva
Ferreira

Indicações

A olanzapina é indicada para o tratamento agudo e de manutenção da esquizofrenia e outros transtornos mentais (psicoses) onde sintomas positivos (ex.: delírios, alucinações, alterações de pensamento, hostilidade e desconfiança) e/ou sintomas negativos (ex.: afeto diminuído, isolamento emocional/social e pobreza de linguagem) são proeminentes. Alivia também os sintomas afetivos secundários, comumente associados com esquizofrenia e transtornos relacionados. É eficaz na manutenção da melhora clínica durante o tratamento contínuo nos pacientes adultos que responderam ao tratamento inicial. É indicada para prolongar o tempo de eutimia e reduzir as taxas de recorrência dos episódios de mania, mistos ou depressivos no transtorno bipolar.

Farmacocinética

A olanzapina é bem absorvida após administração oral, atingindo concentrações plasmáticas máximas em 5 a 8 horas. A absorção não é afetada por alimentos. As concentrações plasmáticas foram lineares e proporcionais à dose em estudos clínicos nas doses de 1 a 20 mg. É metabolizada no fígado pelas vias conjugativa

e oxidativa. O maior metabólito circulante é o 10-Nglucuronida, que, em teoria, não ultrapassa a barreira hematoencefálica. As isoenzimas CYP1A2 e CYP2D6 do citocromo P450 contribuem para a formação dos metabólitos N-desmetil e 2-hidroximetil, ambos exibindo significativamente menor atividade farmacológica in vivo do que a olanzapina em estudos animais.

Modo de usar

A olanzapina deve ser administrada por via oral.

A dose diária pode ser ajustada com base na condição clínica individual, dentro da variação de 5 a 20 mg/dia. Pode ser administrada independentemente das refeições, já que a absorção não é afetada pelo alimento.

Mecanismo de ação

A olanzapina é uma droga antipsicótica com perfil farmacológico amplo, através da ação em vários sistemas de receptores. Em estudos pré-clínicos, demonstrou afinidade pelos receptores de serotonina 5HT_{2A/C}, 5HT₃, 5HT₆; dopamina D₁, D₂, D₃, D₄, D₅; muscarínicos M₁₋₅; α 1-adrenérgico e histamina H₁. Os estudos de comportamento em animais sobre os efeitos

ficha técnica

Olanzapina

da olanzapina indicaram antagonismo aos receptores 5HT, dopaminérgicos e colinérgicos, consistente com o perfil de ligação a esses receptores. Demonstrou maior afinidade *in vitro* ao receptor da serotonina 5HT₂, bem como maior atividade *in vivo*, comparada à afinidade e atividade para o receptor da dopamina D₂. Os estudos eletrofisiológicos demonstraram que a olanzapina reduziu seletivamente a ativação dos neurônios dopaminérgicos mesolímbicos (A10), enquanto demonstrou pouco efeito sobre as vias estriatais (A9) envolvidas na função motora.

Reduziu uma resposta condicionada de aversão, que é um teste indicativo de atividade antipsicótica, em doses abaixo das que produzem catalepsia, que é um resultado indicativo de efeitos motores adversos. Ao contrário de outras drogas antipsicóticas, a olanzapina aumenta a resposta em um teste “ansiolítico”. Nos dois estudos controlados com placebo e em dois dos três estudos controlados comparativos, com mais de 2.900 pacientes esquizofrênicos com sintomas positivos e negativos, a olanzapina foi associada a melhoras significativamente maiores, tanto dos sintomas negativos quanto dos positivos.

Interações medicamentosas

As concentrações de equilíbrio de olanzapina não têm efeito na farmacocinética do etanol. No entanto, podem ocorrer efeitos farmacológicos aditivos, como o aumento de sedação, quando o etanol é ingerido junto com a olanzapina; Carbamazepina.

Reações adversas

As reações adversas mais comuns relacionadas ao tratamento com olanzapina são: ganho de peso, aumento na glicemia, aumento nos níveis de colesterol total, aumento da prolactina, elevações transitórias das transaminases hepáticas, eosinofilia, sonolência.

Contraindicações

A olanzapina é contraindicada em pacientes com hipersensibilidade conhecida a qualquer um dos componentes da formulação do medicamento. Não deve ser usado por mulheres grávidas ou amamentando sem orientação médica.

Dados sobre intoxicação

Sinais e sintomas: os sintomas mais comumente relatados (> 10% de incidência) em caso de superdose com olanzapina incluem: taquicardia, agitação/agressividade, disartria, vários sintomas extrapiramidais e redução do nível de consciência, variando da sedação ao coma. Outras consequências significativas do ponto de vista médico incluem delirium, convulsão, possível síndrome neuroléptica maligna, depressão respiratória, aspiração, hipertensão ou hipotensão, arritmias cardíacas (< 2% dos casos de superdose) e parada cardiorrespiratória. Casos fatais foram descritos com superdose agudas tão baixas quanto 450mg de olanzapina por via oral, porém também foram relatados casos de sobrevida após uma superdose aguda de aproximadamente 2g de olanzapina por via oral.

Tratamento: não existe antídoto específico para olanzapina. A indução de vômito não é recomendada. Alguns procedimentos padrões podem ser usados no caso de superdose como lavagem gástrica e administração de carvão ativado. A administração concomitante de carvão ativado mostrou reduzir a biodisponibilidade oral da olanzapina de 50% a 60%. O tratamento sintomático e a monitoração das funções orgânicas vitais devem ser instituídos de acordo

com o quadro clínico, incluindo o tratamento da hipotensão e do colapso circulatório e o suporte da função respiratória. Não usar adrenalina, dopamina ou outros agentes simpato-miméticos com atividade beta-agonista, pois a estimulação beta pode piorar a hipotensão.

Formas de apresentação

Comprimidos revestidos de 2mg, 5mg e 10mg (embalagens contendo 30 comprimidos).

Nomes comerciais

Zyprexa®

Nome comercial de medicamentos similares:

Opinox®, Axonium®, Expolid®, Neupine®, Olazofren®, Zap®, Zopine®

Referências

Olanzapina. Bula do medicamento. São Paulo-SP. Eurofarma Laboratórios S.A. Disponível em: <https://eurofarma.com.br/produtos/bulas/patient/pt/bula-olanzapina-comprimido.pdf>.

Olanzapina. Bula do medicamento. Hortolândia-SP. EMS S/A. Disponível em: https://www.ems.com.br/arquivos/produtos/bulas/bula_olanzapina_10956_1158.pdf.