

Acción y mecanismo

- [ANTIALERGICO], [ANTAGONISTA HISTAMINERGICO (H-1)]. El dimenhidrinato es un complejo equimolecular de difenhidramina y un derivado de la teofilina, la 7-cloro-teofilina. La difenhidramina es un derivado de la etanolamina, que bloquea de forma competitiva, reversible e inespecífica a los receptores H1, disminuyendo los efectos sistémicos de la histamina. Da lugar a vasoconstricción y disminución de la permeabilidad vascular, disminuyendo el enrojecimiento y el edema asociado a la alergia. Mitiga parcialmente síntomas asociados a los procesos alérgicos como enrojecimiento ocular o congestión nasal. Además produce un ligero efecto broncodilatador y una disminución del prurito dérmico.

El dimenhidrinato es un antagonista H1 inespecífico, por lo que es capaz de antagonizar a otros receptores como los colinérgicos centrales y periféricos. Al atravesar la barrera hematoencefálica y bloquear receptores H1 y muscarínicos va a dar lugar a sedación, pero más ligera que las etanolaminas.

- [ANTAGONISTA COLINERGICO MUSCARINICO (M)], antiemético. El dimenhidrinato es un antagonista inespecífico capaz de bloquear además otros receptores como los muscarínicos centrales o periféricos. El bloqueo de los receptores H1 y colinérgicos centrales podría ejercer un efecto antiemético, aunque no está totalmente esclarecido. Se ha podido comprobar que este fármaco es capaz de inhibir la estimulación vestibular, inhibiendo en primer lugar los estímulos formados en el sistema otólico, y a dosis superiores, en los conductos semicirculares. Tras el uso continuado, se ha apreciado una tolerancia a los efectos antieméticos.

Farmacocinética

Vía oral:

- Absorción: El dimenhidrinato se absorbe bien en el intestino, pero sufre un intenso efecto de primer paso hepático. Tras la administración de una dosis, los efectos aparecen a los 15-30 minutos, y su duración es de 3-6 horas. El T_{max} es de 2 horas.

- Distribución: El dimenhidrinato se distribuye ampliamente por el organismo, atravesando la barrera hematoencefálica y placentaria. También se excreta en pequeñas cantidades con la leche.

- Metabolismo: Es metabolizado de forma rápida y casi completa en el hígado.

- Eliminación: Los metabolitos se eliminan con la orina.

Indicaciones

- [CINETOSIS]. Prevención y tratamiento de síntomas tales como [NAUSEAS], [VOMITOS] y/o [VERTIGO] asociados a [MAREO] en los viajes.

Posología

DOSIFICACIÓN:

- Adultos, oral: 1-2 comprimidos (50-100 mg)/4-6 horas, hasta un máximo de 400 mg/24 horas, o bien un chicle (20 mg)/1-3 horas.

- Niños, oral:

* Niños y adolescentes de 13-18 años: 1-2 comprimidos (50-100 mg)/4-6 horas, hasta un máximo de 400 mg/24 horas, o bien un chicle (20 mg)/1-3 horas.

- * Niños de 7-12 años: 1-2 comprimidos (25-50 mg)/8 horas, hasta un máximo de 150 mg/24 horas, un chicle (20 mg)/1-3 horas, o bien 6-12 ml (24-48 mg)/6-8 horas.
- * Niños de 2-6 años: 1/2-1 comprimido (12.5-25 mg)/6-8 horas, hasta un máximo de 75 mg/24 horas, o bien 3-6 ml (12-24 mg)/6-8 horas.
- * Niños menores de 2 años: No se ha evaluado la seguridad y eficacia en niños menores de 2 años.

NORMAS PARA LA CORRECTA ADMINISTRACIÓN:

Se recomienda tomar el dimenhidrinato preferiblemente 1-2 horas antes del viaje, y si no fuese posible, al menos 30 minutos antes. Las dosis se repetirán cada si fuera necesario durante la duración del viaje, respetando los intervalos recomendados.

Se recomienda ingerir los comprimidos con alimentos, agua o leche para reducir las molestias gástricas. Los comprimidos pueden ingerirse enteros o desleídos en cualquier líquido, para lo que se pulverizará el comprimido dentro de un vaso con una cucharilla, se añadirá agua y se agitará.

Se debe introducir la jeringa dosificadora, presionando en el orificio del tapón perforado. A continuación se invertirá el frasco y se retirará la dosis adecuada. Se podrá administrar la solución directamente con la jeringa o bien poner su contenido en una cuchara.

La jeringa dosificadora debe lavarse después de cada toma, y puede esterilizarse hirviéndola en agua o sumergiéndola en la solución esterilizante utilizada para biberones.

Contraindicaciones

- Hipersensibilidad a cualquier componente del medicamento. Pueden existir reacciones cruzadas con otros antihistamínicos, por lo que no se recomienda emplear ningún antihistamínico H1 en pacientes que hayan presentado hipersensibilidad a cualquier compuesto del grupo.
- [CRISIS ASMÁTICA]. Para algunos autores, el dimenhidrinato podría empeorar el asma, por lo que no se recomienda su empleo en una crisis aguda.
- [PORFIRIA]. Los antihistamínicos H1 se han asociado con la aparición de brotes porfíricos, por lo que no se consideran seguros en estos pacientes.

Precauciones

- [INSUFICIENCIA RENAL]. No se ha evaluado la seguridad y eficacia en pacientes con insuficiencia renal, pero los metabolitos del dimenhidrinato se eliminan con la orina, por lo que se podría producir una acumulación de los mismos. Ya que estos metabolitos podrían ser activos, podría ser necesario prolongar los períodos de administración en pacientes con insuficiencia renal, sobre todo en cuadros moderados o severos (CLcr menor a 60 ml/minuto).
- [INSUFICIENCIA HEPÁTICA]. El dimenhidrinato se metaboliza intensamente por metabolismo hepático. En caso de insuficiencia hepática podría producirse un aumento de la concentración plasmática, con el consiguiente riesgo de efectos adversos. Puede ser necesario un reajuste posológico en estos pacientes según el grado de funcionalidad hepática.
- Pacientes aquejados de [GLAUCOMA], [HIPERTROFIA PROSTÁTICA] u

[OBSTRUCCION DE LA VEJIGA URINARIA], [HIPERTENSION ARTERIAL], [ARRITMIA CARDIACA], [MIASTENIA GRAVE], [ULCERA PEPTICA] estenosante u [OBSTRUCCION INTESTINAL]. Debido a los efectos anticolinérgicos del dimenhidrinato, se podría producir un agravamiento de estos cuadros, por lo que se recomienda extremar las precauciones y suspender el tratamiento en caso de que se produjese un empeoramiento.

- Enfermedades del árbol respiratorio inferior, como [ASMA], [ENFISEMA PULMONAR] o [ENFERMEDAD PULMONAR OBSTRUCTIVA CRONICA]. Según algunos autores, los antihistamínicos H1 podrían disminuir el volumen de las secreciones bronquiales, aumentando su viscosidad, debido a sus efectos anticolinérgicos, por lo que podrían agravar estos cuadros. Sin embargo, no existen demasiadas evidencias clínicas, a pesar de lo cuál, se recomienda extremar las precauciones en estos pacientes. Por regla general, no se recomienda su utilización en pacientes con crisis asmáticas (Véase Contraindicaciones).

- [EPILEPSIA]. Se debe tener precaución en pacientes epilépticos, ya que los antihistamínicos se han asociado en ocasiones con reacciones paradójicas de hiperexcitabilidad, incluso a dosis terapéuticas, por lo que podrían disminuir el umbral de convulsiones.

- [APENDICITIS]. Debido a sus efectos antieméticos, podría interferir con el diagnóstico de la apendicitis. Se recomienda descartar previamente la presencia de apendicitis en pacientes con vómitos de origen desconocido.

- Ototoxicidad. El dimenhidrinato puede ejercer un efecto beneficioso en caso de vértigos, tinnitus y mareos, por lo que podría enmascarar la ototoxicidad inducida por fármacos ototóxicos como los aminoglucósidos parenterales, carboplatino, cisplatino, cloroquina y eritromicina entre otros.

- Fotosensibilidad. El dimenhidrinato podría dar lugar a fenómenos de fotosensibilidad, por lo que se recomienda no tomar el Sol durante el tratamiento, y protegerse mediante filtros solares.

- Temperaturas extremas. Los antihistamínicos H1 podrían agravar el síndrome de agotamiento-deshidratación y el golpe de calor debido a la disminución de la sudoración ocasionada por sus efectos anticolinérgicos. Se recomienda a aquellos pacientes en tratamiento con estos medicamentos evitar la exposición a temperaturas muy altas, sobre todo en caso de niños pequeños, ancianos o personas con enfermedades crónicas graves. También es aconsejable seguir unas medidas higiénico-dietéticas adecuadas, como una adecuada aireación e hidratación.

Advertencias/consejos

CONSEJOS AL PACIENTE:

- Este medicamento se administrará junto con alimentos o bebidas.
- Se aconseja administrar el dimenhidrinato al menos media hora antes del viaje, y continuar las dosis a lo largo del mismo si fuera necesario, respetando los intervalos de dosificación recomendados.
- Puede provocar somnolencia, por lo que se recomienda tener precaución a la hora de conducir, y no combinarlo con fármacos u otras sustancias sedantes como el alcohol.
- No se aconseja a aquellos pacientes en tratamiento con fármacos sedantes que se automediquen con productos con dimenhidrinato sin consultarlo con un médico.
- Se aconseja no tomar el Sol durante el tratamiento.
- Se deben notificar al médico cualquier patología crónica que presente el paciente antes de iniciar el tratamiento.

- Se debe evitar la exposición a temperaturas extremas durante la utilización de este medicamento, manteniéndose en un ambiente fresco, hidratándose adecuadamente.

CONSIDERACIONES ESPECIALES:

- El dimenhidrinato podría enmascarar los efectos ototóxicos de algunos fármacos, por lo que se recomienda evaluar periódicamente la funcionalidad acústica en pacientes tratados con estos fármacos.

- Antes de utilizar este medicamento en pacientes con vómitos de origen desconocido se recomienda descartar la presencia de apendicitis.

- Se recomienda vigilar la hidratación del paciente en caso de ola de calor, y sobre todo si el paciente es un niño pequeño, un anciano o una persona con una enfermedad grave.

- Debido a los efectos antialérgicos de este medicamento, podría dar falsos negativos en pruebas dérmicas de hipersensibilidad a extractos antigénicos. Se recomienda suspender la administración de este medicamento al menos 72 horas antes de la prueba.

Interacciones

El dimenhidrinato podría enmascarar los síntomas inducidos por fármacos ototóxicos al disminuir el vértigo o los mareos. De igual manera, podría potenciar los efectos fotosensibilizadores de otros principios activos que den lugar a reacciones de fotosensibilidad. Además se han descrito interacciones medicamentosas con los siguientes principios activos:

- Alcohol etílico. La administración conjunta de alcohol y dimenhidrinato podría potenciar los efectos sedantes de ambas sustancias. Se recomienda evitar el consumo de alcohol durante el tratamiento.

- Anticolinérgicos (antiparkinsonianos, antidepresivos tricíclicos, IMAO, neurolépticos). La administración de dimenhidrinato junto con otros fármacos anticolinérgicos podría potenciar los efectos anticolinérgicos, por lo que se recomienda evitar la asociación.

- Sedantes (analgésicos opioides, barbitúricos, benzodiazepinas, antipsicóticos). La administración conjunta de dimenhidrinato junto con un fármaco sedante podría potenciar la acción hipnótica. Se recomienda extremar las precauciones.

Análisis clínicos

- Pruebas cutáneas de hipersensibilidad a extractos alérgicos. Falsos negativos. Se recomienda suspender la administración de este medicamento al menos 72 horas antes de realizar la prueba.

Embarazo

Categoría B de la FDA. En estudios realizados en ratas y conejos usando dosis 20-25 veces superiores a las humanas no han evidenciado daño para el feto. No se han realizado estudios adecuados y bien controlados en seres humanos. Sin embargo, el dimenhidrinato se ha utilizado en caso de hiperemesis gravídica sin haberse apreciado efectos adversos significativos. No obstante, existen informes sobre una posible asociación entre la administración durante las dos últimas semanas de embarazo y la aparición de fibroplasia retrolenticular en niños prematuros. Aunque parece remota la posibilidad de dañar al feto, sólo se debe emplear este medicamento cuando los beneficios superen los posibles riesgos.

Lactancia

El dimenhidrinato podría inhibir la lactancia debido a sus efectos anticolinérgicos. Además se excreta con la leche materna en pequeñas cantidades, aunque se desconoce si éstas podrían presentar efectos sobre el lactante. Sin embargo, los niños son más sensibles a las reacciones anticolinérgicas, y pueden presentar con mayor frecuencia reacciones paradójicas de hiperexcitabilidad. Se recomienda suspender la lactancia materna o evitar la administración de este medicamento.

Niños

No se recomienda la utilización de dimenhidrinato en niños menores de dos años, sobre todo en neonatos y lactantes, debido a que pueden ser más susceptibles a los efectos adversos anticolinérgicos. En niños mayores de 2 años se han descrito casos de reacciones paradójicas con hiperexcitabilidad, sobre todo a dosis altas, por lo que se recomienda emplearlo con precaución.

Ancianos

Los ancianos son más sensibles a los efectos adversos de los antihistamínicos, tales como mareos, sedación, confusión, hipotensión e hiperexcitabilidad, así como a los efectos anticolinérgicos (sequedad de boca, retención urinaria, precipitación de glaucoma). Los antihistamínicos se pueden utilizar en pacientes mayores de 65 años, pero se deben extremar las precauciones. Si los efectos secundarios persisten o son graves, se aconseja suspender el tratamiento.

Efectos sobre la conducción

El dimenhidrinato puede afectar sustancialmente a la capacidad para conducir y/o manejar maquinaria. Los pacientes deberán evitar manejar maquinaria peligrosa, incluyendo automóviles, hasta que tengan la certeza razonable de que el tratamiento farmacológico no les afecta de forma adversa.

Reacciones adversas

Los efectos secundarios del dimenhidrinato suelen ser leves y transitorios, siendo más frecuentes durante los primeros días de tratamiento. Al igual que otras etanolaminas, el dimenhidrinato da lugar sobre todo a somnolencia y fenómenos anticolinérgicos, pero existe gran variabilidad interindividual con respecto a la frecuencia e intensidad de los síntomas, afectando sobre todo a niños pequeños y ancianos. Las reacciones adversas más comunes son:

- Digestivas. [NAUSEAS], [VOMITOS], [ESTREÑIMIENTO], [DIARREA], [DOLOR EPIGASTRICO], [ANOREXIA], [SEQUEDAD DE BOCA]. Estos síntomas pueden disminuirse al administrar el antihistamínico con las comidas.
- Neurológicas/psicológicas. Es frecuente (1-9%) la aparición de [SOMNOLENCIA], sobre todo al inicio del tratamiento, y que suele disminuir al cabo de 2-3 días. También se ha descrito [CEFALEA], [VERTIGO] y [MAREO]. Excepcionalmente se han observado casos de [EXCITABILIDAD] paradójica, sobre todo en niños pequeños. Esta hiperexcitabilidad cursa con [INSOMNIO], [NERVIOSISMO], [CONFUSION], [TEMBLOR], [IRRITABILIDAD], [EUFORIA], [DELIRIO], palpitaciones e incluso

[CONVULSIONES].

- Cardiovasculares. En ocasiones puntuales, y normalmente en caso de sobredosis, se pueden producir [TAQUICARDIA], [PALPITACIONES] y otras [ARRITMIA CARDIACA] como [EXTRASISTOLE] o [BLOQUEO CARDIACO]. Estos efectos se podrían deber a la actividad anticolinérgica. En ocasiones se han descrito [HIPOTENSION] o [HIPERTENSION ARTERIAL].
- Respiratoria. En ocasiones se puede producir un aumento de la viscosidad de las secreciones bronquiales, que pueden dificultar la respiración.
- Genitourinarias. Puede aparecer [RETENCION URINARIA] e [IMPOTENCIA SEXUAL] por el bloqueo colinérgico.
- Hematológicas. Raramente se ha descrito [ANEMIA HEMOLITICA], [AGRANULOCITOSIS], [LEUCOPENIA], [TROMBOPENIA] o [PANCITOPENIA].
- Oculares. Debido a la actividad anticolinérgica podría producirse una [GLAUCOMA] y [TRASTORNOS DE LA VISION] como [MIDRIASIS], [VISION BORROSA] o [DIPLOPIA].
- Alérgicas/dermatológicas. Pueden aparecer [REACCIONES HIPERSENSIBILIDAD] tras la administración sistémica de antihistamínicos, que puede llegar a producir incluso una [ANAFILAXIA]. También pueden aparecer [REACCIONES DE FOTOSENSIBILIDAD] tras la exposición intensa a la luz solar, con [DERMATITIS], [PRURITO], [ERUPCIONES EXANTEMATICAS] y [ERITEMA].

Sobredosis

Síntomas: Los síntomas suelen aparecer al cabo de 2 horas, aunque pueden prolongarse durante 18 horas, y suelen ser variables, presentando mayor gravedad en niños y mayores de 65 años. Se ha descrito depresión nerviosa moderada, con sedación y apnea, colapso cardiovascular, hiperexcitabilidad con insomnio, alucinaciones, temblores o convulsiones, y síntomas anticolinérgicos como sequedad de boca, visión borrosa y retención urinaria. También puede aparecer fiebre superior a 41.8 °C.

En los casos más graves, sobre todo en niños, los síntomas podrían agravarse, apareciendo hipotensión, convulsiones, depresión respiratoria, pérdida de la conciencia coma y muerte.

Tratamiento: El tratamiento consistirá en las medidas habituales destinadas a favorecer la eliminación del fármaco. La administración de eméticos suele ser ineficaz. Aunque puede resultar beneficioso un lavado gástrico si han transcurrido menos de 3 horas desde la ingesta.

Se mantendrá al paciente tranquilo para minimizar la estimulación del sistema nervioso central. Las convulsiones pueden tratarse con diazepam en adultos y fenobarbital en niños a dosis de 5-6 mg/kg. La hipotensión puede tratarse con vasopresores, aunque la epinefrina debe evitarse ya que puede disminuir aún más la presión.

Si fuera necesario, se podrá recurrir a la intubación y respiración asistida. No se recomienda la utilización de analépticos ya que podrían inducir la aparición de convulsiones.

Referencias bibliográficas

- AHFS Drug Information. American Society of Health-system Pharmacists, Bethesda. 44th Edition, 2002.
- British National Formulary. British Medical Association, London. 44th Edition, 2002.
- Drug Facts and Comparisons. Facts and Comparison, Saint Louis. 57th Edition, 2003.

- Ficha técnica, dimenhidrinato (Cinfamar, Cinfa, 1995).
- Martindale. The Complete Drug Reference. Pharmaceutical Press, London. 33th Edition, 2002.
- Micromedex.
- PDR. Thomson, Montvale. 57th Edition, 2003.
- United States Pharmacopoeia, Dispensation Information. 14th Edition, 1994.

Fecha de aprobación/revisión de la ficha

Marzo, 2005.

Principios activos

- **Dimenhidrinato:**50 mg. indicaciones: tratamiento sintomatico de nauseas y vomito, especialmente los producidos por viaje (cinetosis) o.m: 17-09-82

Laboratorio:

Cinfa