

BENTAZEPAM

J.Honorato*/J.R.Azanza*/R.Cuena*/A.Rubio*

El bentazepam es una nueva tienodiacepina con marcada acción ansiolítica. Químicamente es la 2,3-tetrametilen-4-fenil-7-oxo-tieno (2,3-f) diacepina.

Mecanismo de acción y efectos

Al igual que los ansiolíticos benzodiacepínicos, el bentazepam actúa produciendo una potenciación gabérgica. La actuación se realiza a nivel del receptor benzodiacepínico integrado en el complejo GABA/receptor benzodiacepínico/ionóforo Cl^- , produciendo un aumento de la afinidad del receptor GABA por su neurotransmisor, incrementando la eficacia en la apertura del ionóforo¹.

La heterogeneidad de los receptores benzodiacepínicos BZ_1 , responsables de la acción miorrelajante e hipnótico sedante, y BZ_2 , responsables de la acción ansiolítica, hace posible el poder actuar hasta cierto punto sobre solamente uno de estos dos tipos de receptores². En este sentido el bentazepam parece mostrar una mayor afinidad sobre los receptores BZ_2 por lo que su acción ansiolítica es marcada, mientras que la acción relajante e hipnótica que produce tiene menor entidad.

Farmacocinética

El bentazepam se absorbe bien por vía oral alcanzando la concentración plasmática máxima aproximadamente una hora después de su administración.

Tras la administración de 25 mg por vía oral, la C_{max} viene a ser de 425 $\mu g/ml$ una hora después.

La vida media del bentazepam es corta, aproximadamente 3,3 horas, siendo su tiempo de acción de unas 7 horas.

La biodisponibilidad es del 86,4 %.

En cuanto a la distribución, la máxima concentración del bentazepam se produce en los siguientes órganos por orden decreciente: hígado, riñón, tejido adiposo, bazo, cerebro.

El bentazepam atraviesa la barrera hematoencefálica.

La metabolización del preparado se produce a nivel hepático dando lugar a un metabolito hidroxilado y eliminándose fundamentalmente a través de orina en una proporción metabolito/principio activo de 3/1. Existe también una pequeña eliminación a nivel de heces³.

No está aún establecida de manera clara la cinética del metabolito principal ni su contribución a la actividad del fármaco.

Indicaciones

El bentazepam está indicado en todas aquellas circunstancias en que una ansiólisis puede mejorar la situación de los pacientes y de una forma más concreta en las neurosis de ansiedad en sus diversas formas clínicas. También está indicado en el tratamiento de los trastornos psicossomáticos y ansiosos que tienen un fondo depresivo, aunque no debe ser catalogado como un antidepresivo.

Dadas sus características ofrece la ventaja sobre otros ansiolíticos de poseer una vida media corta y de producir una menor repercusión sobre el rendimiento del paciente.

En distintos ensayos clínicos se ha mostrado una marcada acción ansiolítica en cuadros psicóticos⁴ y una mejoría en síntomas de: ansiedad, tensión, fobias, síntomas somáticos generales y síntomas vegetativos^{5, 6}.

Igualmente ha sido utilizado con eficacia en el tratamiento de la ansiedad infantil⁷.

* Servicio de Farmacología Clínica. Clínica Universitaria. Facultad de Medicina. Universidad de Navarra. Pamplona.

Reacciones adversas y contraindicaciones

Las reacciones adversas se presentan en un escaso porcentaje de pacientes, siendo las más frecuentes: sensación de sequedad de boca y alteraciones digestivas (náuseas, pirosis, molestias epigástricas) que disminuyen si se administra el preparado con las comidas. Es posible también la presentación de somnolencia.

Aunque las reacciones adversas detectadas hasta ahora son escasas y poco frecuentes, conviene esperar a que haya sido utilizado por una población más amplia para poder establecer de manera precisa su incidencia.

La utilización del bentazepam está contraindicada en estados de hipotonía muscular en caso de que sea necesario realizar un trabajo peligroso o que exija mucha precisión mientras no se compruebe que en ese caso concreto no se produce somnolencia o deficiencia en la coordinación motora.

Aunque estas contraindicaciones son genéricas, quizás el bentazepam sea el ansiolítico menos peligroso que se puede utilizar en estas situaciones cuando sea imprescindible el tratamiento de la ansiedad.

Interacciones y situaciones especiales

El bentazepam no debe administrarse conjuntamente con alcohol y barbitúricos, ya que potencia la acción de estas sustancias.

En general la asociación con psicofármacos debe realizarse bajo estricto control, ya que existe la posibilidad de que se produzcan interacciones.

El bentazepam no debe ser utilizado durante el embarazo, puesto que aún no ha sido suficientemente establecida su inocuidad teratogénica.

En los ancianos es preciso llevar a cabo una reducción de dosis ya que no se conoce bien hasta qué punto una insuficiencia renal puede influir en el perfil farmacocinético del producto.

Posología y presentación

La dosis normalmente utilizada es de 25 mg, 3 veces al día, aunque puede oscilar entre un mínimo de 25 mg al día y un máximo de 50 mg 3 veces día.

En los ancianos conviene realizar una reducción de dosis de aproximadamente 50 %.

En España la presentación comercial ha sido realizada por los Laboratorios Knoll-Made bajo el nombre de Tiadipona.

Los envases son de 30 grageas de 25 mg y tiene un precio de 737 ptas.

Conclusiones

El bentazepam es un ansiolítico que ofrece la ventaja con respecto a otros fármacos de su grupo de presentar un mayor poder ansiolítico en relación con sus efectos miorelajantes e hipnóticos.

La repercusión del bentazepam sobre la actividad intelectual y motora de los pacientes parece ser escasa.

Aunque hasta ahora, las reacciones adversas presentadas han sido de poca entidad y baja frecuencia, la conclusión de la fase IV de estudio del fármaco, actualmente en avanzado desarrollo, permitirá llegar a conclusiones más precisas en este sentido.

Bibliografía

1. Otsen RW. *Drug interactions at the GABA receptor-ionophore complex*. Ann Rev Pharmacol 22: 245-277, 1982.
2. Braestrup C y Nielsen M. *Multiple benzodiazepine receptors*. Trends Neurosci 301-303, 1980.
3. Idoipe E, Martínez M, Alsasua A, González E y García Jalón P. *Cinética de eliminación de la Tiadipona*. Arch de Farmacol y Toxicol II: 123-132, 1976.
4. Escudero J, Moreno J, Conde V y Ballesteros M. *Clinical psychotropic spectrum of a new drug (QM-6008) in clinical psychiatry*. 1st World Congress of Biological Psychiatry. Buenos Aires.
5. Ruiz M, Fernández L y Peña J. *Ensayo clínico con Tiadipona en el tratamiento sintomático de las neurosis*. Progresos en psicofarmacología. Barcelona 1979, vol. I.
6. Ballesteros M, Conde V, Escudero J y Moreno J. *Experiencia clínica con un nuevo psicofármaco (QM-6008)*. Cuad Mad Psiquiat V: 26, 74, Madrid 1974.
7. Ruiz M, Buil R, Lafuente M, Herrera D, Samada P, Enriquez A y Zeledon F. *Tratamiento de la ansiedad infantil con Tiadipona*. Psiquis 2: 61-63, 1981.