

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	DIAZEPAM-5
Forma farmacéutica:	Tableta
Fortaleza:	5,0 mg
Presentación:	Estuche por 1, 2, ó 3 blísteres de PVC ámbar /AL con 10 o 20 tabletas cada uno. Estuche por 3 blísteres de PVC blanco opaco/AL con 10 o 20 tabletas cada uno. Blíster de PVC ámbar/AL con 20 tabletas. Blíster de PVC blanco opaco/AL
Titular del Registro Sanitario, ciudad, país:	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba.
Fabricante (es) del producto, ciudad (es), país (es):	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba. UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) SOLMED, Planta 1 y Planta 2.
Número de Registro Sanitario:	M-15-002-N05
Fecha de Inscripción:	6 de enero de 2015.
Composición:	
Cada tableta contiene:	
Diazepam	5,0 mg
Lactosa monohidratada	77,180 mg
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Ansiedad. Insomnio. Tratamiento coadyuvante de la ansiedad asociada a depresión mental. Manejo en los trastornos de ansiedad.

Tratamiento del espasmo del músculo esquelético, síntomas neuromusculares del tétanos.

Abstinencia alcohólica.

Su uso en las crisis convulsivas es positivo pero no como tratamiento habitual de la epilepsia, sino como tratamiento coadyuvante a corto plazo.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida a las benzodiazepinas.

Glaucoma de ángulo cerrado o agudo. Pueden ser utilizados en pacientes con glaucoma de ángulo abierto que estén recibiendo tratamiento adecuado.

Menores de 6 meses: debido a la falta de experiencia clínica.

No debe utilizarse asociado a depresores del SNC.

Coma o shock.

Insuficiencia pulmonar aguda.

Insuficiencia hepática severa.

Contiene lactosa, no administrar en pacientes con intolerancia a la lactosa.

Precauciones:

Embarazo: atraviesa la barrera placentaria. Algunos estudios han sugerido un aumento del riesgo de malformaciones congénitas cuando se usan durante el primer trimestre de embarazo. Debe evitarse su uso durante el embarazo, ya que puede ocasionar síntomas de privación en el neonato. Categoría de riesgo para el embarazo: D. Uso durante el parto: cuando se administran dosis de diazepam mayores de 30 mg, i.m. ó i.v., a mujeres dentro de las 15 h anteriores al parto, el neonato puede desarrollar apnea, hipotonía, hipotermia, aversión hacia el alimento o alteración de la respuesta metabólica al estrés por frío.

Lactancia materna: se excreta en la leche materna. Los niños son más sensibles a los efectos del diazepam sobre el SNC. En el neonato puede producirse una depresión prolongada del SNC, debido a la incapacidad para biotransformar las BZD en metabolitos inactivos.

Los ancianos normalmente son más sensibles a los efectos sobre el SNC.

El uso parenteral puede ocasionar apnea, hipotensión, bradicardia o paro cardíaco, especialmente en pacientes geriátricos o severamente enfermos y en pacientes con reserva pulmonar limitada o situación cardiovascular inestable, o si la administración intravenosa del medicamento es muy rápida.

Se recomienda usar con precaución en pacientes con insuficiencia renal y/o hepática.

En casos de insuficiencia respiratoria y EPOC puede agravar la hipoventilación.

La supresión brusca de este fármaco en pacientes con antecedentes de epilepsia o crisis convulsivas puede aumentar la frecuencia y severidad de las crisis.

Pacientes con diabetes mellitus.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

El uso prolongado puede causar hábito.

Evitar la ingesta de bebidas alcohólicas.

Este medicamento puede provocar somnolencia y los pacientes bajo tratamiento no deberán conducir vehículos u operar maquinarias donde la disminución de la atención pueda originar accidentes

Efectos indeseables:

Las más comunes incluyen, somnolencia, mareos, fatiga y ataxia, y generalmente se asocian con las dosis elevadas.

Ocasionalmente pueden producirse náuseas, obnubilación, diplopía, hipotensión, cefalalgia, disminución de la memoria, lenguaje entrecortado, rash, incontinencia, constipación, confusión, trastornos digestivos, arritmias, aumento o disminución de la libido, temblor y retención urinaria.

El diazepam puede producir reacciones paradójicas, tales como excitación, depresión, estimulación, alucinaciones, ira, psicosis, agresividad, ideas delirantes, trastornos del sueño y alucinaciones, conducta inadecuada, las cuales suelen desaparecer rápidamente cuando el fármaco es discontinuado.

Raras: Íctero, trastornos hematológicos, reacciones de hipersensibilidad.

Farmacodependencia: es común después del uso de las BZD aún a dosis y auditivos, alteraciones del gusto, náuseas, vómitos, palpitaciones, hipertensión arterial leve, taquicardia, hipotensión ortostática, más raras son: el estado confusional o psicosis paranoide, convulsiones y delirium tremens.

Posología y modo de administración:

Para evitar riesgo de dependencia se recomienda emplear cursos cortos de tratamiento (no mayores de 4 semanas) y deberá ser retirado progresivamente.

Adultos:

Ansiedad: 2 a 10 mg vía oral, 2 o 3 v/d (dosis máxima 30 mg/d). Las benzodiazepinas tienen un papel limitado en el insomnio, se recomiendan en la ansiedad con insomnio asociado, dosis de 5 a 15 mg al acostarse en la noche.

Medicación preanestésica, procedimientos endoscópicos: 5 a 20 mg, vía oral.

Para la vía i.v. la dosis usual es de 100 a 200 mg/kg de peso.

Convulsiones: 5 a 10 mg i.v., repetir cada 5 a 15 min, hasta un máximo de 60 mg. Es preferible la vía de administración intravenosa; sin embargo, si esta es imposible, puede utilizarse la vía rectal (solución con una dosis de 500 mg/kg de peso en adultos y niños de más de 10 kg de peso).

Relajante del músculo esquelético: espasmos musculares: 2 a 15 mg vía oral, cada 6 a 8 h. Por vía i.m. ó i.v. lento, dosis de 10 mg, repetir si fuese necesario a las 4 h. En casos de espasticidad severa se podrá recomendar hasta 60 mg/d, en adultos y hasta 40 mg/d en niños.

En el tétanos en adultos y niños se emplean dosis de 100 a 300 mg/kg cada 1 a 4 h, vía i.v... Alternativamente se podrá administrar de 3 a 10 mg/kg de peso, en infusión i.v. continua, durante 24 horas.

Abstinencia alcohólica: de 5 a 20 mg, vía oral, continuar cada 6 a 8 h, si es necesario, de acuerdo con la severidad de los síntomas. Si se requiere la vía parenteral (delirium tremens) la dosis es de 10 mg i.m. ó i.v...

Niños:

Convulsiones (crisis convulsivas, recurrentes y severas): lactantes mayores de 30 días y niños menores de 5 años: 0,2 a 0,5 mg (200 a 500 mg), vía i.v., cada 2 o 5 min, máximo de 5 mg. Si es preciso puede repetirse el tratamiento en un período de 2 a 4 h.

Niños de 5 años en adelante: 1 mg, vía i.m., cada 2 a 5 min, hasta un máximo de 10 mg. Si es necesario se puede repetir el tratamiento en 2 a 4 h. Es preferible la vía de administración i.v., sin embargo, si la administración intravenosa es imposible, puede utilizarse una dosis de 0,1 a 0,2 mg/kg, por vía rectal.

Relajante del músculo esquelético: tétano: lactantes mayores de 30 días y niños menores de 5 años: vía i.m. ó i.v., de 1 a 2 mg; c/3 a 4 h, según necesidad.

Niños de 5 años en adelante: de 5 a 10 mg vía i.m. ó i.v., c/3 a 4 h, según necesidad. Cuando se usa la vía i.v. en lactantes y niños, se recomienda administrar lentamente el medicamento, durante un período de 3 min, en una dosificación tal que no sobrepase los 0,25 mg/kg. Puede repetirse la dosificación después de un intervalo de 15 a 30 min.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

El alcohol o depresores del SNC: se incrementan los efectos depresores del SNC. La premedicación con diazepam puede disminuir la dosis necesaria del fentanilo para inducir

anestesia y disminuir el tiempo de pérdida de conciencia con la dosis de inducción, se debe reducir un tercio de la dosis del fentanilo.

Los antihipertensivos potencian los efectos hipotensores del diazepam. La asociación con carbamazepina disminuye las concentraciones séricas de ambos fármacos.

Prolongan los efectos del diazepam: cimetidina, anticonceptivos, eritromicina, isoniazida, omeprazol. La rifampicina puede potenciar la eliminación de diazepam, produciendo una disminución de las concentraciones plasmáticas, se debe ajustar la dosis.

Su uso concomitante con levodopa disminuye el efecto antiparkinsoniano. Su asociación con zidovudina incrementa la toxicidad del antiviral.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: atraviesa la barrera placentaria. Algunos estudios han sugerido un aumento del riesgo de malformaciones congénitas cuando se usan durante el primer trimestre de embarazo. Debe evitarse su uso durante el embarazo, ya que puede ocasionar síntomas de privación en el neonato. Categoría de riesgo para el embarazo: D. Uso durante el parto: cuando se administran dosis de diazepam mayores de 30 mg, i.m. ó i.v., a mujeres dentro de las 15 h anteriores al parto, el neonato puede desarrollar apnea, hipotonía, hipotermia, aversión hacia el alimento o alteración de la respuesta metabólica al estrés por frío.

Lactancia materna: se excreta en la leche materna. Los niños son más sensibles a los efectos del diazepam sobre el SNC. En el neonato puede producirse una depresión prolongada del SNC, debido a la incapacidad para biotransformar las BZD en metabolitos inactivos.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

Este medicamento puede provocar somnolencia y los pacientes bajo tratamiento no deberán conducir vehículos u operar maquinarias donde la disminución de la atención pueda originar accidentes.

Sobredosis:

En caso de sobre dosis se presentará intensificación de los efectos terapéuticos (sedación), relajación muscular, sueño profundo), fatiga, ataxia, amnesia y depresión respiratoria. Puesto que no existe un antídoto específico para la intoxicación del Diazepam, el tratamiento consiste en una terapia general de apoyo e incluye lo siguiente:

Si el paciente está consciente debe inducirse la émesis mecánicamente o con eméticos, además se pueden administrar por vía oral carbón adsorbente para aumentar el aclaramiento.

Además si el paciente está inconsciente puede realizarse lavado gástrico.

Pueden administrarse líquidos intravenosos para promover la diuresis.

La diálisis tiene un valor limitado en el tratamiento de la sobre dosis.

Propiedades farmacodinámicas:

Código ATC: N05BA01

Grupo farmacoterapéutico: Sistema nervioso, Psicodélicos, Ansiolíticos, Derivados de la benzodiazepina.

El diazepam es un derivado benzodiazepínico que actúa sobre el sistema límbico, el tálamo y el hipotálamo. No produce una acción de bloqueo autonómico periférico ni efectos secundarios extrapiramidales. En el hombre presenta efectos ansiolíticos, sedantes, relajantes musculares, anticonvulsivos y amnésicos.

Mecanismo de acción: El diazepam es un depresor del sistema nervioso central (SNC) y produce todos los niveles de depresión del mismo, desde una leve sedación hasta hipnosis o coma dependiendo de la dosis.

No están totalmente establecidos los lugares y mecanismos de acción precisa. Aunque se han propuesto varios mecanismos de acción, se cree que el diazepam, después de interactuar con un receptor neural de membrana específico, potencia o facilita la acción inhibitoria del neurotransmisor ácido gamma-aminobutírico (GABA), mediador de la inhibición tanto a nivel presináptico en las regiones del SNC.

Ansiolítico; Sedante-hipnótico: Se cree que estimula los receptores del GABA en el sistema reticular activador ascendente. Puesto que el GABA es inhibidor, la estimulación de los receptores aumenta la inhibición y bloquea la excitación cortical y límbica después de estimular la formación reticular del tallo cerebral.

Anticonvulsivo: Parece actuar, al menos parcialmente, por potenciación de la inhibición presináptica. Suprimen la extensión de la actividad convulsiva producida por focos epileptógenos en la corteza, tálamo y estructuras límbicas, pero no eliminan la descarga anormal del foco.

Relajante del músculo esquelético: No está totalmente establecido el mecanismo exacto del diazepam, pero parece que produce la relajación del músculo esquelético principalmente por inhibición de las vías espinales aferentes polisinápticas; sin embargo, también puede inhibir las vías aferentes monosinápticas. El diazepam puede inhibir los reflejos mono y polisinápticos actuando como un inhibidor de la transmisión neural o bloqueando la transmisión sináptica excitatoria. También, puede deprimir directamente los nervios motores y la función muscular.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: Se absorbe rápida y completamente en el tracto gastrointestinal. Picos plasmáticos de concentración entre 0.5 y 2 horas después de la administración oral.

Unión a proteínas plasmáticas: El diazepam y sus metabolitos activos se unen en un 99 %.

Distribución: La distribución del diazepam es rápida.

Volumen aparente de distribución: Elevado. Altamente liposoluble y atraviesa BHE.

El diazepam atraviesa la barrera placentaria y se excreta en la leche materna.

Metabolismo: El diazepam degrada en el sistema enzimático microsomal hepático.

El principal metabolito del diazepam, el derivado N-desmetílico, es biológicamente activo; otros metabolitos activos son un derivado hidroxilado en el anillo y el oxazepam desmetilado e hidroxilado.

Eliminación: El diazepam se excreta casi totalmente en la orina en un 70 a 90 % en forma de metabolitos oxidados y conjugados y el resto en las heces a través de la bilis.

La eliminación es algo lenta ya que los metabolitos activos pueden permanecer en la sangre durante varios días, produciendo posiblemente efectos persistentes.

Vida media plasmática: Es de 20 a 70 horas. Sin embargo, la vida media para el recién nacido prematuro y pacientes geriátricos es 3 a 4 veces más prolongada que el adulto joven. Además la hepatopatía severa puede duplicar y hasta quintuplicar la vida media del diazepam.

Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 31 de marzo de 2023.

