



RESUMEN DE CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	GABAPENTIN EIPICO
Forma farmacéutica:	Cápsula
Fortaleza:	300 mg
Presentación:	Estuche por 3 blísteres de PVC/AL con 10 cápsulas cada uno.
Titular del Registro Sanitario, ciudad, país:	EGYPTIAN INTERNATIONAL PHARMACEUTICAL INDUSTRIES CO (EIPICO), Ramadan, Egipto.
Fabricante (s) del producto, ciudad (es), país (es):	EGYPTIAN INTERNATIONAL PHARMACEUTICAL INDUSTRIES CO (EIPICO), Ramadan, Egipto. Producto terminado
Número de Registro Sanitario:	M-25-009-N03
Fecha de Inscripción:	17 de abril de 2025
Composición:	
Cada cápsula contiene:	
Gabapentina	300,0 mg
Lactosa anhidra	57,825mg
Plazo de validez:	24 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 25 °C. Protéjase de la humedad.

Indicaciones terapéuticas:

Epilepsia:

Gabapentina Eipico está indicado como terapia adyuvante en el tratamiento de convulsiones parciales con y sin generalización secundaria en adultos y niños de 6 años o más.

Gabapentina Eipico está indicado como monoterapia en el tratamiento de crisis parciales con y sin generalización secundaria en adultos y adolescentes de 12 años o más.

Tratamiento del dolor neuropático periférico:

Gabapentina Eipico está indicado para el tratamiento del dolor neuropático periférico como la neuropatía diabética dolorosa y la neuralgia postherpética en adultos.

Contraindicaciones

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes.

Precauciones

Convulsiones:

Aunque no hay evidencia de convulsiones de rebote con gabapentina, la retirada abrupta de anticonvulsivos en pacientes epilépticos puede precipitar el estado epiléptico.

Al igual que con otros medicamentos antiepilépticos, algunos pacientes pueden experimentar un aumento en la frecuencia de las convulsiones o la aparición de nuevos tipos de convulsiones con Gabapentina Eipico.

Al igual que con otros antiepilépticos, los intentos de retirar los antiepilépticos concomitantes en pacientes refractarios al tratamiento que reciben más de un antiepiléptico, con el fin de alcanzar la monoterapia con gabapentina, tienen una tasa de éxito baja.

Gabapentina Eipico No se considera eficaz contra las convulsiones generalizadas primarias, como las ausencias, y puede agravarlas en algunos pacientes. Por lo tanto, Gabapentina Eipico debe usarse con precaución en pacientes con convulsiones mixtas, incluidas las ausencias.

El tratamiento con gabapentina se ha asociado con mareos y somnolencia, lo que podría aumentar la incidencia de lesiones accidentales (caídas). También se han notificado casos posteriores a la comercialización de confusión, pérdida de consciencia y deterioro mental.

Por lo tanto, se debe aconsejar a los pacientes que tengan precaución hasta que estén familiarizados con los posibles efectos del medicamento.

Advertencias especiales y precauciones de uso.

Pensamiento y comportamiento suicida

Se han reportado ideas y comportamientos suicidas en pacientes tratados con antiepilépticos en diversas indicaciones. Un metaanálisis de ensayos clínicos aleatorizados y controlados con placebo sobre antiepilépticos también ha mostrado un pequeño aumento del riesgo de ideas y comportamientos suicidas. Se desconoce el mecanismo de este riesgo y los datos disponibles no descartan la posibilidad de un aumento del riesgo con gabapentina.

Por lo tanto, se debe vigilar a los pacientes para detectar signos de ideación y comportamiento suicida, y se debe considerar el tratamiento adecuado. Se debe aconsejar a los pacientes (y a sus cuidadores) que consulten a un médico si aparecen signos de ideación o comportamiento suicida.

Anafilaxia:

Gabapentina Eipico puede causar anafilaxia. Los signos y síntomas en los casos notificados incluyen dificultad para respirar, hinchazón de labios, garganta y lengua, e hipotensión, que requiere tratamiento de emergencia. Se debe indicar a los pacientes que suspendan el tratamiento con Gabapentina Eipico y busquen atención médica inmediata si experimentan signos o síntomas de anafilaxia.

Pancreatitis aguda:

Si un paciente desarrolla pancreatitis aguda durante el tratamiento con Gabapentina Eipico, se debe considerar la interrupción del tratamiento con Gabapentina Eipico.

Uso concomitante con opioides:

Los pacientes que requieren tratamiento concomitante con opioides deben ser observados cuidadosamente para detectar signos de depresión del sistema nervioso central (SNC), como somnolencia, sedación y depresión respiratoria. Los pacientes que usan Gabapentina Eipico y morfina concomitantemente pueden experimentar aumentos en las concentraciones de Gabapentina Eipico. La dosis de Gabapentina Eipico o de opioides debe reducirse según corresponda.

Depresión respiratoria:

La gabapentina se ha asociado con depresión respiratoria grave. Los pacientes con función respiratoria comprometida, enfermedad respiratoria o neurológica, insuficiencia renal, uso concomitante de depresores del SNC y los ancianos podrían tener un mayor riesgo de experimentar esta reacción adversa grave. Podría ser necesario ajustar la dosis en estos pacientes.

Personas mayores (mayores de 65 años):

No se han realizado estudios sistemáticos con gabapentina en pacientes de 65 años o más. En un estudio doble ciego con dolor neuropático, se observó una proporción ligeramente mayor de somnolencia, edema periférico y astenia en pacientes de 65 años o más que en pacientes más jóvenes. Aparte de estos hallazgos, las investigaciones clínicas en este grupo de edad no indican un perfil de efectos adversos diferente al observado en pacientes más jóvenes.

Población pediátrica:

Los efectos del tratamiento a largo plazo (más de 36 semanas) con gabapentina sobre el aprendizaje, la inteligencia y el desarrollo en niños y adolescentes no se han estudiado adecuadamente. Por lo tanto, es necesario sopesar los beneficios de un tratamiento prolongado frente a sus posibles riesgos.

Abuso y dependencia:

Se han notificado casos de abuso y dependencia en la base de datos pos-comercialización. Evalúe cuidadosamente a los pacientes para detectar antecedentes de abuso de fármacos y obsérvelos para detectar posibles signos de abuso de Gabapentina Eipico, como búsqueda indiscriminada de fármacos, aumento de la dosis y desarrollo de tolerancia.

Erupción medicamentosa con eosinofilia y síntomas sistémicos (DRESS):

Se han notificado reacciones de hipersensibilidades sistémicas graves y potencialmente mortales, como erupción medicamentosa con eosinofilia y síntomas sistémicos (DRESS), en pacientes que toman medicamentos antiepilépticos, incluida la gabapentina.

Es importante tener en cuenta que las primeras manifestaciones de hipersensibilidad, como fiebre o linfadenopatía, pueden presentarse incluso sin exantema evidente. Si se presentan estos signos o síntomas, se debe evaluar al paciente de inmediato.

Gabapentina Eipico debe suspenderse si no se puede establecer una etiología alternativa para los signos o síntomas.

Lactosa: Gabapentina Eipico: Contiene lactosa monohidrato. Los pacientes con intolerancia hereditaria a la galactosa, deficiencia de lactasa de Lapp o malabsorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

Pruebas de laboratorio:

Pueden obtenerse lecturas falsas positivas en la determinación semicuantitativa de proteínas totales en orina mediante tiras reactivas. Por lo tanto, se recomienda verificar dicho resultado positivo mediante métodos basados en un principio analítico diferente, como el método de biuret, el turbidimétrico o el de fijación de colorantes, o utilizar estos métodos alternativos desde el principio.

Efectos indeseables

Las reacciones adversas observadas durante los estudios clínicos realizados en epilepsia (como tratamiento adyuvante y en monoterapia) y dolor neuropático se presentan en una lista única a continuación, ordenadas por clase y frecuencia: Muy frecuentes ($\geq 1/10$); Frecuentes ($\geq 1/100$ a $< 1/10$); Poco frecuentes ($\geq 1/1000$ a $< 1/100$); Raras ($\geq 1/10\ 000$ a $< 1/1000$); Muy raras ($< 1/10\ 000$). Cuando una reacción adversa se observó con diferente frecuencia en los estudios clínicos, se asignó a la frecuencia más alta notificada.

Las reacciones adicionales notificadas a partir de la experiencia posterior a la comercialización se incluyen con una frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles) en cursiva en la lista siguiente.

Dentro de cada grupo de frecuencia, los efectos indeseables se presentan en orden decreciente de gravedad.

Infecciones e infestaciones:

Muy común: Infección viral.

Frecuentes: Neumonía, infección respiratoria, infección del tracto urinario, infección, otitis media.

Trastornos del sistema sanguíneo y linfático:

Común: Leucopenia.

Frecuencia no conocida: Trombocitopenia.

Trastornos del sistema inmunológico:

Poco frecuentes: Reacciones alérgicas (p. ej. urticaria).

Frecuencia no conocida: síndrome de hipersensibilidad (una reacción sistémica con una presentación variable que puede incluir: fiebre, erupción cutánea, hepatitis, linfadenopatía, eosinofilia y, a veces, otros signos y síntomas), anafilaxia.

Trastornos del metabolismo y la nutrición:

Frecuentes: Anorexia, aumento del apetito.

Poco frecuentes: Hiperglucemia (observada con mayor frecuencia en pacientes con diabetes).

Raras: Hipoglucemia (observada con mayor frecuencia en pacientes con diabetes).

Frecuencia no conocida: Hiponatremia.

Trastornos psiquiátricos:

Común: Hostilidad, confusión y labilidad emocional, depresión, ansiedad, nerviosismo, pensamiento anormal.

Poco común: Agitación.

No conocido: Alucinaciones.

Trastornos del sistema nervioso:

Muy frecuentes: Somnolencia, mareos, ataxia.

Frecuentes: Convulsiones, hipercinesia, disartria, amnesia, temblor, insomnio, dolor de cabeza, sensaciones como parestesia, hipoestesia, coordinación anormal, nistagmo, aumento, disminución o ausencia de reflejos.

Poco frecuentes: Hipocinesia, deterioro mental.

Raras: Pérdida de conciencia.

Frecuencia no conocida: Otros trastornos del movimiento (p. ej. coreoatetosis, discinesia, distonía).

Trastornos oculares:

Frecuentes: Alteraciones visuales como ambliopía, diplopía.

Trastornos del oído y del laberinto:

Común: Vértigo.

No conocido: Tinnitus.

Trastornos cardíacos:

Poco frecuentes: Palpitaciones.

Trastornos vasculares:

Frecuentes: Hipertensión, vasodilatación.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos:

Frecuentes: Disnea, bronquitis, faringitis, tos, rinitis.

Raras: depresión respiratoria.

Trastornos gastrointestinales:

Frecuentes: Vómitos, náuseas, anomalías dentales, gingivitis, diarrea, dolor abdominal, dispepsia, estreñimiento, sequedad de boca o garganta, flatulencia.

Poco frecuentes: disfagia.

Frecuencia no conocida: Pancreatitis.

Trastornos hepatobiliares:

Frecuencia no conocida: hepatitis, ictericia.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo:

Frecuentes: edema facial, púrpura (descrita con mayor frecuencia como hematomas resultantes de traumatismos físicos), erupción cutánea, prurito y acné.

Frecuencia no conocida: síndrome de Stevens-Johnson, angioedema, eritema multiforme, alopecia, erupción medicamentosa con eosinofilia y síntomas sistémicos.

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conectivo:

Frecuentes: Artralgia, mialgia, dolor de espalda, espasmos.

Frecuencia no conocida: rabdomiólisis, mioclonías.

Trastorno renal y urinario:

Frecuencia no conocida: Insuficiencia renal aguda, incontinencia.

Trastornos del sistema reproductor y de la mama:

Común: Impotencia.

Frecuencia no conocida: hipertrofia mamaria, ginecomastia, disfunción sexual (incluyendo cambios en la libido, trastornos de la eyaculación y anorgasmia).

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración:

Muy frecuentes: Fatiga, fiebre.

Frecuentes: Edema periférico, marcha anormal, astenia, dolor, malestar, síndrome gripal.

Poco frecuentes: Edema generalizado.

Frecuencia no conocida: Reacciones de abstinencia (principalmente ansiedad, insomnio, náuseas, dolor, sudoración), dolor torácico. Se han notificado muertes súbitas inexplicables en las que no se ha establecido una relación causal con el tratamiento con gabapentina.

Investigaciones:

Frecuentes: Disminución del recuento de glóbulos blancos (WBC), aumento de peso.

Poco frecuentes: Pruebas de función hepática elevadas SGOT (AST), SGPT (ALT) y bilirrubina.

Frecuencia no conocida: Aumento de la creatinfosfoquinasa sanguínea.

Intoxicación por lesiones y complicaciones de procedimientos:

Común: Lesión accidental, fractura, abrasión.

Se han notificado casos de pancreatitis aguda durante el tratamiento con gabapentina. La relación causal con la gabapentina no está clara.

En pacientes en hemodiálisis debido a insuficiencia renal terminal, se ha descrito miopatía con niveles elevados de creatina quinasa.

Sólo en estudios clínicos en niños se informaron infecciones del tracto respiratorio, otitis media, convulsiones y bronquitis.

Además, en estudios clínicos realizados en niños, se informó con frecuencia de comportamiento agresivo e hipercinesia.

Posología y modo de administración

Para todas las indicaciones, en la Tabla 1 se describe un esquema de titulación para el inicio del tratamiento, recomendado para adultos y adolescentes mayores de 12 años. Las instrucciones de dosificación para niños menores de 12 años se incluyen en un apartado aparte más adelante en esta sección.

Tabla 1: Tabla de dosificación - Titulación inicial:

Día Uno	Día Dos	Día Tres
300 mg una vez al día	300 mg dos veces al día	300 mg tres veces al día

Interrupción de Gabapentina Eipico:

De acuerdo con la práctica clínica actual, si se debe suspender el tratamiento con Gabapentina Eipico, se recomienda hacerlo de forma gradual durante un mínimo de 1 semana, independientemente de la indicación.

Epilepsia:

La epilepsia suele requerir terapia a largo plazo. La dosis la determina el médico tratante según la tolerancia y eficacia individual.

Adultos y adolescentes:

En ensayos clínicos, el rango de dosificación eficaz fue de 900 a 3600 mg/día. La terapia puede iniciarse titulando la dosis como se describe en la Tabla 1 o administrando 300 mg tres veces al día (TID) el Día 1. Posteriormente, según la respuesta y la tolerabilidad de cada paciente, la dosis puede incrementarse en incrementos de 300 mg/día cada 2-3 días hasta una dosis máxima de 3600 mg/día. Una titulación más lenta de la dosis de gabapentina puede ser apropiada para pacientes individuales. El tiempo mínimo para alcanzar una dosis de 1800 mg/día es de una semana, para alcanzar 2400 mg/día es de un total de 2 semanas y para alcanzar 3600 mg/día es de un total de 3 semanas. Dosis de hasta 4800 mg/día han sido bien toleradas en estudios clínicos abiertos a largo plazo. La dosis diaria total debe dividirse en tres dosis únicas, el intervalo máximo de tiempo entre las dosis no debe exceder las 12 horas para prevenir convulsiones irruptivas.

Niños de 6 años o más:

La dosis inicial debe oscilar entre 10 y 15 mg/kg/día y la dosis efectiva se alcanza mediante titulación ascendente durante un período de aproximadamente tres días. La dosis efectiva de Gabapentina Eipico en niños de 6 años o más es: 25 a 35 mg/kg/día. Dosis de hasta 50 mg/kg/día han sido bien toleradas en un estudio clínico a largo plazo. La dosis diaria total debe dividirse en tres dosis únicas, el intervalo máximo de tiempo entre dosis no debe exceder las 12 horas. No es necesario monitorear las concentraciones plasmáticas de Gabapentina Eipico para optimizar la terapia con Gabapentina Eipico. Además, Gabapentina Eipico puede usarse en combinación con otros medicamentos antiepilépticos sin preocupación por la alteración de las concentraciones plasmáticas de Gabapentina Eipico o las concentraciones séricas de otros medicamentos antiepilépticos.

Dolor neuropático periférico:

Adultos:

El tratamiento puede iniciarse ajustando la dosis según se describe en la Tabla 1. Como alternativa, la dosis inicial es de 900 mg/día, administrados en tres dosis iguales. Posteriormente, según la respuesta y la tolerabilidad del paciente, la dosis puede incrementarse en incrementos de 300 mg/día cada 2-3 días hasta una dosis máxima de

3600 mg/día. Un ajuste más lento de la dosis de Gabapentina Eipico puede ser adecuado para cada paciente. El tiempo mínimo para alcanzar una dosis de 1800 mg/día es de una semana, para alcanzar 2400 mg/día es de un total de 2 semanas y para alcanzar 3600 mg/día es de un total de 3 semanas.

En el tratamiento del dolor neuropático periférico, como la neuropatía diabética dolorosa y la neuralgia posherpética, no se ha evaluado la eficacia ni la seguridad en estudios clínicos con tratamientos superiores a 5 meses. Si un paciente requiere una dosis superior a 5 meses para el tratamiento del dolor neuropático periférico, el médico tratante debe evaluar su estado clínico y determinar la necesidad de terapia adicional.

Instrucciones para todas las áreas de indicación:

En pacientes con mala salud general, es decir, bajo peso corporal, después de un trasplante de órganos, etc., la dosis debe ajustarse más lentamente, ya sea utilizando dosis más pequeñas o intervalos más largos entre aumentos de dosis.

Personas mayores (mayores de 65 años):

Los pacientes de edad avanzada pueden requerir un ajuste de la dosis debido al deterioro de la función renal con la edad (véase la Tabla 2). La somnolencia, el edema periférico y la astenia pueden ser más frecuentes en estos pacientes.

Insuficiencia renal:

Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con función renal alterada, como se describe en la Tabla 2, o en hemodiálisis. Las cápsulas de Gabapentina Eipico 100 mg pueden utilizarse para seguir las recomendaciones posológicas en pacientes con insuficiencia renal.

Tabla 2: Dosis de Gabapentina Eipico en adultos según la función renal:

Aclaramiento de creatinina (mL/min)	Dosis diaria total (mg/día)
≥ 80	900-3600
50-79	600-1800
30-49	300-900
15-29	150b -600
< 15c	150b -300

A) La dosis diaria total debe administrarse en tres tomas. Se recomiendan dosis reducidas para pacientes con insuficiencia renal (aclaramiento de creatinina <79 ml/min).

B) La dosis diaria de 150 mg debe administrarse en 300 mg en días alternos.

C) Para los pacientes con un aclaramiento de creatinina < 15 ml/min, la dosis diaria debe reducirse en proporción al aclaramiento de creatinina (por ejemplo, los pacientes con un aclaramiento de creatinina de 7,5 ml/min deben recibir la mitad

de la dosis diaria que reciben los pacientes con un aclaramiento de creatinina de 15 ml/min).

Uso en pacientes sometidos a hemodiálisis:

Para pacientes anúricos en hemodiálisis que nunca han recibido gabapentina, se recomienda una dosis de carga de 300 a 400 mg, seguida de 200 a 300 mg de Gabapentina Eipico cada 4 horas de hemodiálisis. En los días sin diálisis, no se debe administrar Gabapentina Eipico.

Para pacientes con insuficiencia renal sometidos a hemodiálisis, la dosis de mantenimiento de Gabapentina Eipico debe basarse en las recomendaciones de dosificación que se encuentran en la Tabla 2. Además de la dosis de mantenimiento, se recomienda una dosis adicional de 200 a 300 mg después de cada tratamiento de hemodiálisis de 4 horas.

Administración:

Para uso oral.

Gabapentina Eipico Se puede administrar con o sin alimentos y debe tragarse entero con una ingesta suficiente de líquido (por ejemplo, un vaso de agua).

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Existen informes de casos espontáneos y publicados en la literatura sobre depresión respiratoria y/o sedaciones asociadas con el uso de gabapentina y opioides. En algunos de estos informes, los autores consideraron que esto representa una preocupación particular con la combinación de gabapentina y opioides, especialmente en pacientes de edad avanzada.

Los pacientes que requieren tratamiento concomitante con opioides deben ser observados cuidadosamente para detectar signos de depresión del SNC, como somnolencia, sedación y depresión respiratoria y la dosis de Gabapentina Eipico o el opioide debe reducirse adecuadamente.

No se ha observado interacción entre gabapentina y fenobarbital, fenitoína, ácido valproico o carbamazepina.

La farmacocinética en estado estable de gabapentina es similar en sujetos sanos y pacientes con epilepsia que reciben estos agentes antiepilépticos.

La coadministración de Gabapentina Eipico con anticonceptivos orales que contienen noretindrona y/o etinilestradiol no influye en la farmacocinética en estado estacionario de ninguno de los componentes.

La administración concomitante de Gabapentina Eipico con antiácidos que contienen aluminio y magnesio reduce su biodisponibilidad hasta en un 24 %. Se recomienda tomar Gabapentina Eipico como mínimo dos horas después de la administración del antiácido.

La excreción renal de Gabapentina Eipico no se altera con probenecid.

No se espera que una ligera disminución en la excreción renal de gabapentina que se observa cuando se administra conjuntamente con cimetidina tenga importancia clínica.

Uso en embarazo y lactancia

Embarazo:

Riesgos relacionados con la epilepsia y los medicamentos antiepilépticos en general:

El riesgo de defectos congénitos se duplica o triplica en los hijos de madres tratadas con un medicamento antiepiléptico. Los más frecuentes son labio hendido, malformaciones cardiovasculares y defectos del tubo neural.

La terapia con múltiples fármacos antiepilépticos puede estar asociada con un mayor riesgo de malformaciones congénitas que la monoterapia, por lo tanto, es importante que se practique la monoterapia siempre que sea posible.

Se debe brindar asesoramiento especializado a las mujeres que probablemente queden embarazadas o que estén en edad fértil y se debe revisar la necesidad de tratamiento antiepiléptico cuando una mujer esté planeando quedar embarazada.

No se debe interrumpir bruscamente el tratamiento antiepiléptico, ya que esto puede provocar convulsiones que podrían tener graves consecuencias tanto para la madre como para el niño.

El retraso del desarrollo en hijos de madres con epilepsia se ha observado en raras ocasiones. No es posible diferenciar si este retraso se debe a factores genéticos, sociales, a la epilepsia materna o al tratamiento antiepiléptico.

Riesgos relacionados con la Gabapentina:

La gabapentina atraviesa la placenta humana.

No existen datos o estos son limitados sobre el uso de gabapentina en mujeres embarazadas.

Estudios en animales han mostrado toxicidad reproductiva. Se desconoce el riesgo potencial para los humanos.

Gabapentina Eipico no debe utilizarse durante el embarazo a menos que el beneficio potencial para la madre supere claramente el riesgo potencial para el feto.

No se puede llegar a una conclusión definitiva sobre si la gabapentina está causalmente asociada con un mayor riesgo de malformaciones congénitas cuando se toma durante el embarazo, debido a la epilepsia en sí y a la presencia de medicamentos antiepilépticos concomitantes durante cada embarazo informado.

Lactancia:

La gabapentina se excreta en la leche materna. Dado que se desconoce su efecto en el lactante, se debe tener precaución al administrar Gabapentina Eipico a una madre lactante. Gabapentina Eipico solo debe administrarse a madres lactantes si los beneficios superan claramente los riesgos

Fertilidad:

No hay efectos sobre la fertilidad en estudios con animales.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

Gabapentina Eipico Puede tener una influencia leve o moderada sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas. Gabapentina Eipico actúa sobre el sistema nervioso central y puede causar somnolencia, mareos u otros síntomas relacionados.

Incluso aunque fuesen de grado leve o moderado, estos efectos indeseables podrían ser potencialmente peligrosos en pacientes que conducen o manejan maquinaria.

Esto es especialmente cierto al comienzo del tratamiento y después del aumento de la dosis.

Sobredosis

No se ha observado toxicidad aguda potencialmente mortal con sobredosis de gabapentina de hasta 49 g. Los síntomas de sobredosis incluyeron mareos, visión doble, dificultad para hablar, somnolencia, pérdida de consciencia, letargo y diarrea leve. Todos los pacientes se recuperaron completamente con tratamiento de soporte.

La absorción reducida de gabapentina en dosis más altas puede limitar la absorción del fármaco en el momento de la sobredosis y, por tanto, minimizar la toxicidad de las sobredosis.

Las sobredosis de gabapentina, particularmente en combinación con otros medicamentos depresores del SNC, pueden provocar coma.

Aunque la gabapentina puede eliminarse mediante hemodiálisis, según la experiencia previa, no suele ser necesaria. Sin embargo, en pacientes con insuficiencia renal grave, la hemodiálisis puede estar indicada.

Los signos de toxicidad aguda en animales incluyeron: ataxia, dificultad para respirar, ptosis, hipoactividad o excitación.

Propiedades farmacodinámicas

Código ATC: N03AX12

Grupo farmacoterapéutico: N: Sistema Nervioso, N03: Antiepilépticos, N03A: Antiepilépticos, N03AX: Otros antiepilépticos.

Mecanismo de acción:

La gabapentina penetra fácilmente en el cerebro y previene las convulsiones en diversos modelos animales de epilepsia. No posee afinidad por los receptores GABAA ni GABAB, ni altera el metabolismo del GABA. No se une a otros receptores de neurotransmisores del cerebro ni interactúa con los canales de sodio.

La gabapentina se une con alta afinidad a la subunidad $\alpha 2\delta$ (alfa-2-delta) de los canales de calcio dependientes de voltaje, y se propone que la unión a esta subunidad podría estar implicada en sus efectos anticonvulsivos en animales. Un panel amplio de cribado no sugiere ninguna otra diana farmacológica aparte de la $\alpha 2\delta$.

La evidencia de varios modelos preclínicos informa que la actividad farmacológica de la gabapentina puede estar mediada a través de la unión a $\alpha 2\delta$ mediante una reducción en la liberación de neurotransmisores excitatorios en regiones del sistema nervioso central.

Esta actividad podría ser la base de la actividad anticonvulsiva de la gabapentina. La relevancia de estas acciones de la gabapentina para los efectos anticonvulsivos en humanos aún está por determinar.

La gabapentina también ha demostrado eficacia en varios modelos preclínicos de dolor animal. Se ha propuesto que su unión específica a la subunidad $\alpha 2\delta$ produce diversas acciones que podrían ser responsables de la actividad analgésica en modelos animales.

Las actividades analgésicas de la gabapentina pueden manifestarse tanto en la médula espinal como en los centros cerebrales superiores mediante interacciones con las vías inhibitorias descendentes del dolor. Se desconoce la relevancia de estas propiedades preclínicas para su acción clínica en humanos.

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

Absorción:

Tras la administración oral, las concentraciones plasmáticas máximas de gabapentina se observan en un plazo de 2 a 3 horas. La biodisponibilidad de gabapentina (fracción de la dosis absorbida) tiende a disminuir con el aumento de la dosis. La biodisponibilidad absoluta de una cápsula de 300 mg es de aproximadamente el 60 %. Los alimentos, incluida una dieta rica en grasas, no tienen un efecto clínicamente significativo sobre la farmacocinética de la gabapentina.

La farmacocinética de la gabapentina no se ve afectada por la administración repetida. Si bien las concentraciones plasmáticas de gabapentina se situaron generalmente entre 2 µg/ml y 20 µg/ml en estudios clínicos, dichas concentraciones no fueron predictivas de seguridad ni eficacia. Los parámetros farmacocinéticos se presentan en la Tabla 3.

Tabla 3: Resumen de Gabapentina. Parámetros farmacocinéticos medios (%CV) en estado estacionario tras la administración cada ocho horas:

Parámetro farmacocinético	300 mg (N = 7)		400 mg (N = 14)		800 mg (N=14)	
	Promedio	%CV	Promedio	%CV	Promedio	%CV
C _{máx} (µg/mL)	4.02	(24)	5.74	(38)	8.71	(29)
t _{máx} (hora)	2.7	(18)	2.1	54)	1.6	76)
T _{1/2} (hora)	5.2	(12)	10.8	89)	10.6	(41)
AUC (0-8) (µg•h/mL)	24.8	(24)	34.5	34)	51.4	(27)
Ae % (%)	N / A	N / A	47.2	25)	34.4	(37)

C_{máx} =Concentración plasmática máxima en estado estacionario.

t_{máx} =Hora de C_{max}.

T_{1/2} =Vida media de eliminación.

AUC (0-8) =Área bajo la curva de concentración plasmática en estado estacionario-tiempo desde el momento 0 hasta las 8 horas posteriores a la dosis.

Ae% =Porcentaje de dosis excretada sin cambios en la orina desde las 0 a las 8 horas posteriores a la dosis.

NA =No disponible.

Distribución:

La gabapentina no se une a las proteínas plasmáticas y tiene un volumen de distribución de 57,7 litros. En pacientes con epilepsia, las concentraciones de gabapentina en el líquido cefalorraquídeo (LCR) son aproximadamente el 20 % de las concentraciones plasmáticas mínimas en estado estacionario. La gabapentina está presente en la leche materna de las mujeres lactantes.

Biotransformación:

No existe evidencia del metabolismo de la gabapentina en humanos. La gabapentina no induce las enzimas oxidasas hepáticas de función mixta responsables del metabolismo de fármacos.

Eliminación:

La gabapentina se elimina inalterada únicamente por excreción renal. Su semivida de eliminación es independiente de la dosis y su promedio es de 5 a 7 horas.

En pacientes de edad avanzada y con insuficiencia renal, el aclaramiento plasmático de gabapentina está reducido. La constante de eliminación de gabapentina, el aclaramiento plasmático y el aclaramiento renal son directamente proporcionales al aclaramiento de creatinina.

La gabapentina se elimina del plasma mediante hemodiálisis. Se recomienda ajustar la dosis en pacientes con función renal alterada o en hemodiálisis.

Se determinó la farmacocinética de gabapentina en niños de 50 sujetos sanos de entre 1 mes y 12 años. En general, las concentraciones plasmáticas de gabapentina en niños mayores de 5 años son similares a las de los adultos cuando se administra en mg/kg.

En un estudio farmacocinético en 24 sujetos pediátricos sanos de edades comprendidas entre 1 y 48 meses, se observó una exposición aproximadamente un 30 % menor (AUC), una C_{max} menor y un aclaramiento mayor por peso corporal en comparación con los datos notificados disponibles en niños mayores de 5 años.

Linealidad/No linealidad:

La biodisponibilidad de gabapentina (fracción de la dosis absorbida) disminuye al aumentar la dosis, lo que confiere no linealidad a los parámetros farmacocinéticos, como el parámetro de biodisponibilidad (F), p. ej., Ae%, CL/F, Vd/F. La farmacocinética de eliminación (parámetros farmacocinéticos que no incluyen F, como CL_r y T_{1/2}) se describe mejor mediante farmacocinética lineal. Las concentraciones plasmáticas de gabapentina en estado estacionario son predecibles a partir de datos de dosis única.

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

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 17 de abril de 2025.