

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	GABAPENTINA
Forma farmacéutica:	Tableta
Fortaleza:	300,0 mg
Presentación:	Estuche por 3 blísteres de PVC/AL con 10 tabletas cada uno.
Titular del Registro Sanitario, ciudad, país:	EUROTRADE WORLD COMMERCE.S.L, La Habana, Cuba.
Fabricante (s) del producto, ciudad (es), país (es):	UNIZA LIFECARE PRIVATE LIMITED, Gujarat, India. Producto Terminado.
Número de Registro Sanitario:	M-25-010-N03
Fecha de Inscripción:	17 de abril de 2025.
Composición:	
Cada tableta contiene:	
Gabapentina	300,0 mg
Lactosa monohidratada	100,0 mg
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz y la humedad.

Indicaciones terapéuticas:

Gabapentina Se indica como terapia combinada en el tratamiento de crisis parciales con o sin generalización secundaria en adultos y en niños a partir de los 6 años.

Como monoterapia en el tratamiento de crisis parciales con o sin generalización secundaria en adultos y en adolescentes a partir de los 12 años.

Tratamiento del dolor neuropático periférico

Tratamiento del dolor neuropático periférico, por ejemplo, la neuropatía diabética dolorosa y la neuralgia post-herpética, en adultos.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes

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

Los pacientes con intolerancia hereditaria a galactosa, deficiencia total de lactasa o problemas de absorción de glucosa o galactosa no deben tomar este medicamento.

Precauciones:

Pacientes con diabetes mellitus.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Se ha reportado Erupción medicamentosa con eosinofilia y síntomas sistémicos (DRESS) en pacientes tomando antiepilépticos, incluyendo Gabapentina.

Es importante percatarse de manifestaciones de hipersensibilidad tempranamente, como fiebre o linfadenopatía, que pueden presentarse incluso si el rash no es evidente.

Si aparecen signos y síntomas que sugieran estas reacciones, debe evaluarse al paciente inmediatamente. Debe suspenderse el tratamiento con gabapentina si no puede establecerse una etiología alternativa para los signos o síntomas.

Anafilaxia:

La gabapentina puede producir anafilaxia. Los signos y síntomas en los casos notificados incluyen dificultad para respirar, hinchazón de los labios, la garganta y la lengua, e hipotensión que requieren un tratamiento de emergencia. Se debe advertir a los pacientes que interrumpan el tratamiento con gabapentina y busquen asistencia médica inmediata si experimentan signos o síntomas de anafilaxia.

Pensamientos y comportamientos suicidas:

Se han notificado casos de pensamiento y comportamientos suicidas en pacientes tratados con medicamentos antiepilépticos en diversas indicaciones. Un meta-análisis de ensayos aleatorizados controlados con placebo, también ha mostrado un pequeño aumento del riesgo de pensamientos y comportamientos suicidas. Se desconoce el mecanismo por el que se produce este riesgo. Se han observado en estudios post-comercialización casos de pensamientos y comportamientos suicidas en pacientes tratados con gabapentina. Se debe aconsejar a los pacientes (y sus cuidadores) que consulten a su médico si aparecen pensamientos o comportamientos suicidas. Los pacientes deben ser monitorizados para detectarlos y debe considerarse el tratamiento adecuado. Debe considerarse la interrupción del tratamiento en caso de pensamientos y comportamientos suicidas.

Pancreatitis aguda:

Si un paciente tratado con gabapentina desarrolla pancreatitis aguda, debe considerarse la interrupción de gabapentina.

Convulsiones:

Aunque no existe evidencia de crisis de rebote con gabapentina, una retirada brusca de los medicamentos anticonvulsivantes en pacientes epilépticos puede precipitar un estatus epiléptico.

Algunos pacientes tratados con gabapentina pueden experimentar un aumento en la frecuencia de las crisis o la aparición de nuevos tipos de crisis, al igual que con otros anticonvulsivos.

Como con otros antiepilépticos, los intentos de retirar los medicamentos anticonvulsivos concomitantes a pacientes refractarios en tratamiento con más de un antiepiléptico para conseguir la monoterapia con gabapentina, tiene un índice de éxito bajo.

Gabapentina no se considera eficaz en el tratamiento de crisis generalizadas primarias, tales como las ausencias, pudiendo agravar este tipo de crisis en algunos pacientes. Por lo tanto, gabapentina debe usarse con precaución en pacientes con crisis mixtas incluyendo ausencias.

El tratamiento con gabapentina se ha asociado a mareo y somnolencia, que podrían aumentar la incidencia de lesiones accidentales (caídas). También se han comunicado casos de confusión, pérdida de conciencia y daño mental progresivo tras la comercialización. Por lo tanto, debe aconsejarse a los pacientes que actúen con prudencia hasta estar familiarizados con el efecto del tratamiento.

Uso concomitante con opioides y otros depresores del SNC:

Los pacientes que requieran un tratamiento concomitante con opioides deberán ser cuidadosamente observados para ver si presentan signos de depresión del sistema nervioso central (SNC), como somnolencia, sedación y depresión respiratoria. Los pacientes que tomen un tratamiento concomitante con gabapentina y morfina pueden sufrir un aumento de

las concentraciones de gabapentina. Deberá reducirse adecuadamente la dosis de gabapentina o de opioide.

Debe advertirse precaución cuando se prescribe concomitantemente gabapentina y opioides debido al riesgo de la depresión del SNC. Basada en la observación de estudio de casos y controles anidado en una población de usuarios de opioides, la prescripción de opioides y gabapentina se asoció con el aumento de riesgo de muerte relacionadas con opioide, comparado con la prescripción de la gabapentina sola (razón de probabilidades ajustada [aOR], 1,49 [95 % CI, de 1,18 a 1,88, $p < 0,001$]).

Depresión respiratoria:

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

Edad avanzada (mayores de 65 años):

No se han realizado estudios sistemáticos con gabapentina en pacientes de 65 años de edad en adelante. En un estudio doble ciego en pacientes con dolor neuropático, apareció somnolencia, edema periférico y astenia en un porcentaje algo más alto en pacientes a partir de 65 años de edad o más, que en pacientes más jóvenes. Aparte de estos hallazgos, las investigaciones clínicas en este grupo de edad no indican que haya un perfil de reacciones adversas diferente del observado en los pacientes más jóvenes.

Población pediátrica:

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

Abuso y dependencia:

Se han notificado casos de abuso y uso incorrecto postcomercialización.

Antes de prescribir gabapentina, se debe evaluar exhaustivamente el riesgo que tiene el paciente por una historia de abuso y observarlo por los posibles signos de abuso de la gabapentina, como el desarrollo de tolerancia, el aumento de la dosis y la búsqueda compulsiva del fármaco.

Pruebas de laboratorio:

Se pueden obtener lecturas de falsos positivos en la determinación semi-cuantitativa de las proteínas totales en orina con los análisis de tiras reactivas. Por lo tanto, se recomienda verificar el resultado positivo de estas tiras mediante métodos basados en un principio analítico diferente, tales como el método Biuret, turbidimétrico o los métodos de fijación de colorantes, o bien utilizar estos métodos alternativos desde el inicio.

Excipientes con efectos conocidos:

Las tabletas de Gabapentina contienen lactosa. Los pacientes con problemas hereditarios raros de intolerancia a la galactosa, deficiencia completa a la lactosa o malabsorción galactosa-glucosa no deben usar este medicamento.

Efectos indeseables:

Las reacciones adversas observadas durante los estudios clínicos llevados a cabo en epilepsia (en combinación y en monoterapia) y en dolor neuropático se adjuntan en la lista siguiente ordenadas por sistema y frecuencia [muy frecuentes ($\geq 1/10$), frecuentes ($\geq 1/100$ a $< 1/10$), poco frecuentes ($\geq 1/1000$ a $< 1/100$), raras ($\geq 1/10000$ a $< 1/1000$), muy raras ($< 1/10000$). En los estudios clínicos, cuando una reacción adversa se observó a frecuencias distintas, se le asignó la frecuencia más alta.

Reacciones adicionales notificadas durante la experiencia post-comercialización se incluyen en la lista inferior con frecuencia no conocida (no puede estimarse a partir de los datos disponibles).

Las reacciones adversas se enumeran en orden decreciente de gravedad dentro de cada intervalo de frecuencia.

Clasificación por Sistema de órganos	Reacciones adversas
Infecciones e infestaciones	
Muy frecuentes:	Infección viral.
Frecuentes:	Neumonía, infección respiratoria, infección del tracto urinario, infección y otitis media.
Trastornos de la sangre y del sistema linfático	
Frecuentes:	Leucopenia.
Frecuencia no conocida:	Trombocitopenia.
Trastornos del sistema inmunológico	
Frecuentes:	Reacciones alérgicas (urticaria).
Frecuencia no conocida:	Síndrome de hipersensibilidad, reacción sistémica de presentación variable que puede incluir fiebre, erupción, hepatitis, linfadenopatía, eosinofilia, y a veces otros signos y síntomas, anafilaxia.
Trastornos del metabolismo y la nutrición	
Frecuentes:	Anorexia y aumento del apetito.
Poco frecuentes:	Hiper glucemia (observada con mayor frecuencia en pacientes con diabetes).
Raras:	Hipoglucemia (observada con mayor frecuencia en pacientes con diabetes).
Frecuencia no conocida:	Hiponatremia.
Trastornos psiquiátricos	
Frecuentes:	Hostilidad, confusión e inestabilidad emocional, depresión, ansiedad, nerviosismo y pensamiento anormal.
Poco frecuentes:	Agitación.
Frecuencia no conocida:	Alucinaciones, pensamientos suicidas y dependencia del fármaco.
Trastornos del sistema nervioso	
Muy frecuentes:	Somnolencia, mareos y ataxia.
Frecuentes:	Convulsiones, hipercinesia, disartria, amnesia, temblor, insomnio, cefalea, sensaciones como parestesia, hipoestesia, coordinación anormal, nistagmo, aumento, descenso o ausencia de reflejos.

Poco frecuentes:	Hipocinesia y daño mental progresivo.
Raras:	Pérdida de conciencia.
Frecuencia no conocida:	Otros trastornos del movimiento (por ejemplo, coreoatetosis, discinesia, distonía).
Trastornos oculares	
Frecuentes:	Alteraciones visuales tales como ambliopía. Diplopia.
Trastornos del oído y del laberinto	
Frecuentes:	Vértigo.
Frecuencia no conocida:	Tinnitus
Trastornos cardíacos	
Poco frecuentes:	Palpitaciones
Trastornos vasculares	
Frecuentes:	Hipertensión y vasodilatación
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos	
Frecuentes:	Disnea, bronquitis, faringitis, tos y rinitis
Raros:	Depresión respiratoria
Trastornos gastrointestinales	
Frecuentes:	Vómitos, náuseas, anomalías dentales, gingivitis, diarrea, dolor abdominal, dispepsia, estreñimiento, sequedad de boca o de garganta, y flatulencia
Poco frecuentes:	Disfagia
Frecuencia no conocida:	Pancreatitis
Trastornos hepatobiliares	
Frecuencia no conocida:	Hepatitis e ictericia
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo	
Frecuentes:	Edema facial, púrpura descrita más a menudo como contusiones resultantes de un traumatismo físico, erupción, 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 conjuntivo	
Frecuentes:	Artralgia, mialgia, dolor de espalda y espasmos.

Frecuencia no conocida:	Rabdomiolisis y mioclono.
Trastornos renales y urinarios	
Frecuencia no conocida:	Insuficiencia renal aguda y incontinencia
Trastornos del aparato reproductor y de la mama	
Frecuentes:	Impotencia
Frecuencia no conocida:	Hipertrofia mamaria, ginecomastia y disfunción sexual (como 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 y síndrome gripal.
Poco frecuentes:	Edema generalizado.
Frecuencia no conocida:	Reacciones por síndrome de retirada*, dolor de pecho. Se han notificado muertes inesperadas, en las que no se ha establecido una relación causal con el tratamiento con gabapentina.
Investigaciones	
Frecuentes:	Disminución del recuento leucocitario, aumento de peso.
Poco frecuentes:	Aumento en los valores de los análisis de función hepática SGOT (AST), SGPT (ALT) y bilirrubina.
Frecuencia no conocida:	Creatinfosfoquinasa en sangre elevada.
Lesiones traumáticas, intoxicaciones y complicaciones de procedimientos terapéuticos	
Frecuentes:	Lesiones accidentales, fractura y abrasión.
Poco frecuentes:	Caída.

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

En pacientes en hemodiálisis por insuficiencia renal en fase terminal, se ha notificado miopatía con elevados niveles de creatina quinasa.

Infecciones del tracto respiratorio, otitis media, convulsiones y bronquitis sólo se han notificado en ensayos clínicos en niños. Además, en los ensayos clínicos en niños se han notificado frecuentemente comportamientos agresivos e hipercinesia.

Posología y modo de administración:

En la Tabla 1, se adjunta un esquema de dosificación para el inicio del tratamiento en todas las indicaciones, que se recomienda para adultos y adolescentes a partir de los 12 años. Las pautas de dosificación para niños menores de 12 años se encuentran recogidas bajo un epígrafe diferenciado más adelante en esta sección.

Tabla 1		
DIAGRAMA DE DOSIS-DOSIFICACIÓN INICIAL		
Día 1	Día 2	Día 3
300 mg una vez al día	300 mg dos veces al día	300 mg tres veces al día

Interrupción del tratamiento con gabapentina:

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

Epilepsia

La epilepsia normalmente requiere un tratamiento a largo plazo. El médico determinará la dosis en función de la tolerancia y eficacia individual.

Adultos y adolescentes:

En los ensayos clínicos, el rango de dosis eficaz fue de 900 a 3 600 mg/día. El tratamiento debe iniciarse titulando la dosis tal y como se describe en la Tabla 1 o mediante la administración de 300 mg/día, tres veces al día (TVD) en el Día 1. Por lo tanto, basándose en la respuesta y tolerabilidad individual del paciente, la dosis se puede incrementar posteriormente en 300 mg/día cada 2 a 3 días hasta alcanzar una dosis máxima de 3 600 mg/día. En ciertos pacientes puede resultar adecuado realizar una titulación más lenta de la dosis de gabapentina. El tiempo mínimo para alcanzar una dosis de 1 800 mg/día es de una semana, para alcanzar 2 400 mg/día es de 2 semanas y para alcanzar los 3 600 mg/día es de un total de 3 semanas. Dosis por encima de los 4 800 mg/día han sido bien toleradas en estudios clínicos abiertos a largo plazo. La dosis diaria total se debe dividir en 3 dosis unitarias, no debiendo exceder de 12 horas el intervalo máximo de tiempo entre dosis para prevenir las convulsiones.

Niños a partir de los 6 años:

La dosis inicial debe ser de 10 a 15 mg/kg/día y la dosis efectiva se alcanza mediante el incremento de la titulación a lo largo de un periodo aproximado de 3 días. La dosis efectiva de gabapentina en niños a partir de los 6 años es de 25 a 35 mg/kg/día. Dosis por encima de 50 mg/kg/día han sido bien toleradas en un estudio clínico a largo plazo. La dosis diaria total se debe dividir en tres dosis unitarias, no debiendo exceder de 12 horas el intervalo máximo de tiempo entre dosis.

No es necesario monitorizar las concentraciones plasmáticas de gabapentina para optimizar la terapia con la misma. Además, gabapentina puede ser usada en combinación con otros antiepilépticos sin que se produzcan alteraciones de las concentraciones plasmáticas de gabapentina o de las concentraciones séricas de otros antiepilépticos.

Dolor neuropático periférico:

Adultos:

La terapia se puede iniciar mediante ajuste de la dosis tal y como muestra la Tabla 1. De forma alternativa, la dosis inicial es de 900 mg/día repartido en tres tomas iguales. Por lo tanto, basándose en la respuesta y tolerabilidad individual del paciente, la dosis se puede ir incrementando posteriormente en 300 mg/día cada 2 o 3 días hasta alcanzar una dosis máxima de 3 600 mg/día. En algunos pacientes puede resultar adecuado realizar un ajuste más lento de la dosis de gabapentina. El tiempo mínimo para alcanzar una dosis de 1 800 mg/día es de una semana, para alcanzar 2 400 mg/día es de 2 semanas y para alcanzar los 3 600 mg/día es de un total de 3 semanas.

No se ha estudiado la eficacia y la seguridad del tratamiento del dolor neuropático periférico, por ejemplo, en la neuropatía diabética y en la neuralgia post-herpética, en ensayos clínicos por más de 5 meses de duración. En caso de que el paciente necesite tratamiento del dolor neuropático periférico durante más de 5 meses, el médico debe evaluar la situación clínica del paciente y determinar la necesidad de una terapia adicional.

Instrucciones para todas las indicaciones:

En pacientes con un estado general de salud débil, por ejemplo, con bajo peso corporal, tras un trasplante de órgano, etc., la dosis se ha de ajustar más lentamente, incluso mediante el empleo de dosis menores o de mayores intervalos entre los incrementos de dosis.

Edad avanzada (mayores de 65 años):

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

Insuficiencia renal

Se recomienda utilizar un ajuste de la dosis en pacientes con la función renal deteriorada tal y como se describe en la Tabla 2 y/o en aquellos pacientes sometidos a hemodiálisis. Gabapentina tabletas puede usarse siguiendo las recomendaciones de dosis indicadas en pacientes con insuficiencia renal.

Tabla 2	
DOSIS DE GABAPENTINA 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 repartida en tres tomas al día. Las dosis reducidas son para pacientes con alteración renal (aclaramiento de creatinina < 79 ml/min).

b La dosis diaria de 150 mg se debe administrar como 300 mg en días alternos.

c En pacientes con un aclaramiento de creatinina <15 ml/min, se ha de reducir la dosis diaria en proporción al aclaramiento de creatinina (por ejemplo, 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 15 ml/min).

Uso en pacientes sometidos a hemodiálisis:

Para los pacientes con anuria sometidos a hemodiálisis que nunca han sido tratados con gabapentina, se recomienda una dosis de carga de 300 a 400 mg, seguida posteriormente de una dosis de 200 a 300 mg después de cada 4 horas de hemodiálisis. En los días en que no se dializa, no se debe tratar con gabapentina.

Para los pacientes con insuficiencia renal sometidos a hemodiálisis, la dosis de mantenimiento de gabapentina debe basarse en las recomendaciones de dosis dadas en la Tabla 2. Adicionalmente a la dosis de mantenimiento, se recomienda una dosis de 200 a 300 mg después de cada 4 horas de hemodiálisis.

Forma de administración:

Vía oral.

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

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Hay notificaciones espontáneas y casos publicados de depresión respiratoria y/o sedación y muerte asociadas al uso de opioides y gabapentina. En alguna de estas notificaciones, los

autores consideraron que se trataba de un problema específico relativo a la combinación de gabapentina y opioides, especialmente en pacientes de edad avanzada y en pacientes con enfermedades respiratorias serias de base, con polifármacos y en aquellos con trastornos de abuso de sustancias.

En un estudio con voluntarios sanos (N=12), se administró una cápsula de morfina de 60 mg de liberación controlada 2 horas antes de administrar una cápsula de 600 mg de gabapentina, observándose un aumento de un 44 % en la media del AUC de gabapentina comparado con la de gabapentina administrada sin morfina. Por tanto, los pacientes que requieran tratamiento concomitante con opioides deben ser cuidadosamente controlados para detectar signos de depresión del SNC, como somnolencia sedación y depresión respiratoria, debiendo reducirse adecuadamente la dosis de gabapentina o de opioide.

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

La farmacocinética de gabapentina en estado estacionario es similar en sujetos sanos a la observada en pacientes con epilepsia que reciben medicamentos antiepilépticos.

La coadministración de gabapentina con anticonceptivos orales que contengan oretindrona y/o etinil estradiol no influye en la farmacocinética en estado estacionario de ambos componentes.

La administración concomitante de gabapentina con antiácidos, que contengan aluminio o magnesio, reduce la biodisponibilidad de gabapentina hasta un 24 %. Se recomienda tomar gabapentina dos horas después de la administración de antiácidos.

La excreción renal de gabapentina no se altera con la administración de probenecid.

Se ha observado una ligera reducción de la excreción renal de gabapentina cuando se coadministra junto con cimetidina, hecho del que no se espera que tenga relevancia clínica

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo:

Riesgo asociado a la epilepsia y a los medicamentos antiepilépticos en general:

El riesgo de padecer defectos en el nacimiento se ve aumentado de 2 a 3 veces en los niños de madres tratadas con un medicamento antiepiléptico. Los que más frecuentemente aparecen son labio leporino, malformaciones cardiovasculares y anomalías del tubo neural.

Un tratamiento múltiple con medicamentos antiepilépticos puede asociarse a un mayor riesgo de malformaciones congénitas que la monoterapia, por tanto, es importante que se trate con monoterapia siempre que sea posible.

Se ha de dar consejo específico a las mujeres que quieran quedarse embarazadas o estén en edad fértil, y revisar la necesidad del tratamiento antiepiléptico cuando una mujer planea quedarse embarazada. No se debe interrumpir repentinamente el tratamiento antiepiléptico ya que esto puede llevar a una crisis importante que puede tener graves consecuencias tanto para la madre como para el feto. Raramente se ha observado retraso en el desarrollo en niños de madres con epilepsia. No es posible diferenciar si el retraso en el desarrollo puede estar causado por factores genéticos, sociales, por la epilepsia materna o el tratamiento antiepiléptico.

Riesgo asociado a gabapentina:

Gabapentina atraviesa la placenta humana.

No existen datos suficientes o estos son limitados sobre la utilización de gabapentina en mujeres embarazadas.

Los estudios en animales han mostrado toxicidad reproductiva. Se desconoce el riesgo en seres humanos. Gabapentina no debe usarse durante el embarazo, a menos que el beneficio para la madre sea claramente superior al riesgo potencial para el feto.

No puede concluirse si gabapentina está casualmente asociada con un aumento del riesgo de malformaciones congénitas cuando se administra durante el embarazo, debido a la epilepsia en sí misma y a la presencia de medicamentos antiepilépticos concomitantes en los embarazos que se notificaron.

Lactancia:

Gabapentina se excreta en la leche materna. Al desconocer el posible efecto sobre los lactantes, se debe prestar atención cuando se administre gabapentina a madres que amamantan. Gabapentina solo se utilizará en madres lactantes, si los beneficios superan claramente los riesgos.

Fertilidad:

No hay efectos sobre la fertilidad en los estudios en animales.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

La influencia de gabapentina sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas puede ser reducida o moderada. Gabapentina actúa sobre el sistema nervioso central y puede causar somnolencia, mareo u otros síntomas relacionados. Aun siendo leves o moderadas, estas reacciones adversas pueden ser potencialmente peligrosas en los pacientes que conduzcan o utilicen máquinas. Esto ocurre especialmente al comienzo del tratamiento y después de aumentar la dosis.

Sobredosis:

Con sobredosis de gabapentina de hasta 49 g no se ha observado una toxicidad aguda que pudiera poner en peligro la vida. Los síntomas de sobredosis incluyen mareo, visión doble, dificultad para hablar, somnolencia, pérdida de conciencia, letargia y diarrea leve. Todos los pacientes se recuperaron totalmente mediante tratamiento de soporte. La reducida absorción de gabapentina a dosis más alta puede limitar la absorción del medicamento en caso de sobredosis y, por tanto, minimizar la toxicidad por sobredosis.

La sobredosis de gabapentina, en particular en combinación con otros medicamentos depresores del SNC, puede derivar en coma.

Aunque gabapentina se puede eliminar por hemodiálisis, de acuerdo a la experiencia previa, esto no es normalmente necesario. No obstante, puede indicarse la hemodiálisis en pacientes con alteración grave de la función renal.

No se ha identificado una dosis oral letal de gabapentina en ratones y ratas que recibieron dosis de hasta 8 000 mg/kg. Los signos de toxicidad aguda en animales incluyen ataxia, dificultad al 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 al cerebro y previene las convulsiones en un número de modelos de animales de epilepsia. No posee afinidad ni con ninguno de los receptores GABAA o GABAB, ni tampoco altera el metabolismo de GABA. No se une a otros receptores de los neurotransmisores cerebrales y no interactúa con los canales de sodio. Se une con gran afinidad a la subunidad $\alpha 2\delta$ (alfa2-delta) de los canales de calcio dependientes de voltaje y se supone que la unión a la subunidad $\alpha 2\delta$ pueda involucrarse a los efectos anticonvulsivantes de gabapentina en animales. No sugiere proyección de panel amplio en cualquier otro medicamento dirigido a otros objetivos que no sean $\alpha 2\delta$.

La evidencia de varios modelos preclínicos informa que la actividad farmacológica de la Gabapentina puede estar mediada por la unión a $\alpha 2\delta$ a través de una reducción en la liberación de neurotransmisores excitatorios en regiones del sistema nervioso central. Dicha actividad puede ser la base de la actividad anticonvulsiva de la gabapentina. La relevancia de estas acciones de este medicamento sobre los efectos anticonvulsivantes en humanos queda por establecerse.

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

Absorción

Tras la administración oral, las concentraciones plasmáticas máximas de gabapentina se observaron en las 2 a 3 horas. La biodisponibilidad (fracción de dosis absorbida) de gabapentina tiende a disminuir cuando se incrementa la dosis. La biodisponibilidad absoluta de las cápsulas de 300 mg es de aproximadamente el 60 %. Los alimentos, incluyendo un régimen alto de grasas, no presentan un efecto clínicamente significativo en la farmacocinética de gabapentina.

La farmacocinética de gabapentina no se ve afectada por la administración repetida. Aunque las concentraciones plasmáticas de gabapentina estuvieron generalmente entre 2 y 20 µg/ml en los estudios clínicos, estas concentraciones no son predictivas de la seguridad o eficacia.

Distribución

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

Biotransformación

No hay evidencia de metabolismo de gabapentina en el hombre. Gabapentina no induce las enzimas hepáticas oxidativas de función mixta responsables del metabolismo de los medicamentos.

Eliminación

Gabapentina se elimina inalterada únicamente por excreción renal. La semivida de eliminación de gabapentina es independiente de la dosis y se mueve en un rango de 5 a 7 horas.

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.