CECMED
CENTRO PARA EL CONTROL ESTATAL DE MEDICAMENTOS, EQUIPOS Y DISPOSITIVOS MÉDICOS
Ministerio de Salud Pública de Cuba

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	FENOBARBITAL SODICO
Forma farmacéutica:	Inyección IM, IV
Fortaleza:	200 mg/mL
Presentación:	Caja por 25 ó 100 ampolletas de vidrio incoloro con 1 mL cada una.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, La Habana, Cuba.
Número de Registro Sanitario:	M-11-107-N03
Fecha de Inscripción:	22 de junio de 2011
Composición:	
Cada ampolleta contiene:	
Fenobarbital sódico	200,0 mg
EDTA sódico	
agua para inyección	
propilenglicol c.s.p.	
Plazo de validez:	48 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C.

Indicaciones Terapéuticas:

Convulsiones (todas las formas) de epilepsia menos las crisis de ausencia.

Estado epiléptico, control de convulsiones agudas.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida a otros barbitúricos.

Porfiria intermitente aguda.

Insuficiencia respiratoria severa.

Precauciones:

Embarazo: Categoría de riesgo B, atraviesa fácilmente la placenta. Después de la administración parenteral la concentración sanguínea en el feto se acerca a la de la madre. Se distribuye en los tejidos del feto, las mayores concentraciones estarán en la placenta, el hígado fetal y el cerebro fetal. Aumentando la incidencia de anomalías fetales.

Tercer trimestre: Durante el último trimestre puede producir dependencia física, dando lugar a síntomas de abstinencia en el neonato que puede producirse en el momento del nacimiento o demorarse 14 días.

Se ha descrito la asociación a un defecto en la coagulación (con el empleo prolongado de barbitúricos) dependiente de la vitamina K, se debe administrar de forma profiláctica a la madre un mes antes, durante el parto e inmediatamente después del nacimiento al lactante, vitamina K, por vía intravenosa.

Parto y alumbramiento: A dosis anestésica parecen inhibir la fuerza y presencia de las contracciones uterinas. Puede producir depresión respiratoria en el neonato. Se recomienda tener un equipo de resucitación a disposición inmediata.

Lactancia materna: compatible, vigilar efectos adversos en el lactante (somnolencia, succión débil y pobre ganancia de peso).

Los hijos de madres epilépticas tratadas con anticonvulsivantes, tienen cerca del doble de probabilidades de adquirir una malformación congénita, no obstante, en casos graves, se recomienda no descontinuar la administración de fármacos antiepilépticos, ya que los riesgos asociados al tratamiento suelen ser menores que los derivados de precipitarse el status epiléptico (hipoxia y trauma asociado, pudiendo llegar a muerte fetal). Se deberá considerar la interrupción del tratamiento solo en aquellos casos que la naturaleza, frecuencia y severidad de las convulsiones no conlleve un riesgo serio.

Pediatría: más susceptibles a sus efectos adversos. Algunos niños pueden reaccionar con excitación paradójica. Puede producir irritabilidad, excitabilidad y agresión en niños, así como estados hiperquinéticos que son atribuidos principalmente a una sensibilidad específica al fármaco.

Geriatría: más susceptibles a sus efectos adversos Los pacientes pueden reaccionar a las dosis usuales con excitación, confusión o depresión mental. Puede aumentar el riesgo de hipotermia inducida con dosis elevadas o sobredosis.

Pacientes debilitados, insuficiencia respiratoria ligera o moderada. Pacientes con antecedentes de abuso o dependencia de drogas.

Daño hepático: requiere disminución de la dosis por metabolismo hepático reducido.

Daño renal: puede ser necesario ajustar la dosis.

Hipertiroidismo: puede exacerbarse.

La administración IV puede producir hipotensión, shock laringoespasmo y apnea.

Cuidado con su administración con anticonceptivos orales por el riesgo de embarazo

Advertencias especiales y precauciones de uso:

Su uso prolongado puede producir fármacodependencia.

Puede producir somnolencia y los pacientes bajo tratamiento no deberán conducir vehículos u operar maquinarias donde una disminución de la atención pueda originar accidentes.

Si se administra en presencia de dolor, puede causar agitación, hiperexcitabilidad e incluso delirio.

Evítese la ingestión de bebidas alcohólicas ya que el uso concomitante puede causar severa depresión del SNC.

Producto de uso delicado que sólo debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.

No debe suprimirse bruscamente el tratamiento porque pueden incrementarse la frecuencia e intensidad de las crisis.

Contiene propilenglicol, puede producir síntomas parecidos a los del alcohol.

Efectos indeseables:

Frecuentes: Sedación, cambios en el estado de ánimo y deterioro en la memoria. En altas dosis puede provocar nistagmo, ataxia e insuficiencia respiratoria que puede ser severa.

Excitación paradójica (en ancianos), irritabilidad e hiperactividad (en niños).

Ocasionales: Depresión del SNC; deficiencia de folatos con la administración prolongada, que raramente conduce a una anemia megaloblástica. Otros efectos residuales pueden consistir en vértigo, náuseas, vómitos y constipación.

Raras: Agranulocitosis, trombocitopenia, reacciones de hipersensibilidad como edema localizado, especialmente en los párpados, mejillas y labios, así como dermatitis eritematosa y síndrome de Stevens– Johnson. Alucinaciones e hipotensión.

Posología y modo de administración:

Adulto:

Estatus epiléptico: 10 mg/kg i.v diluida 1 en 10, en agua para inyección administrada a una tasa que no exceda los 100 mg/min.

Control de convulsiones aguda. Adulto 200 mg i.m que se puede repetir c/6h si es necesario. Niños.15 mg/kg dosis única.

Modo de administración**:** Inyección Intramuscular, intravenosa.

Interacciones con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

Alcohol y otros depresores del SNC: incrementan los efectos depresores sobre el SNC. Anestésicos e hidrocarburos halogenados: el uso crónico de barbitúricos previo a la anestesia con halotano o metoxiflurano puede aumentar el riesgo de hepatotoxicidad. Dextropopoxifeno y cloranfenicol incrementan los niveles de fenobarbital.

Por inducción de enzimas enzimáticas microsomales hepáticas puede disminuir los efectos de los siguientes medicamentos: lamotrigina, carbamacepina, tiagabina, etosuximida corticoides, zonisamide, montelukast, nelfinavir, saquinavir, ciclosporina, levotiroxina, quinidina, anticoagulantes orales, haloperidol y aripiprazol, antidepresesivos tricíclicos, paracetamol, doxiciclina, metronidazol, anticonceptivos(riesgo de embarazo), estrógenos, ciclosporina, nifedipino, itraconazol, griseofulvina, digitoxina, diltiazem y verapamilo, interfiere en el metabolismo de doxiciclina, reduce la concentración de zonisamide, montelukast, nelfinavir, saquinavir, fenitoina, valproato de sodio, propagibe y oxcarbazepina incrementan las concentraciones del fenobarbital.

El haloperidol y otros antipsicóticos disminuyen el efecto del fenobarbital (reduce el umbral convulsivo).

Se incrementa el riesgo de osteomalacia cuando se administra conjuntamente con inhibidores de la anhidrasa carbónica.

Con otros anticonvulsivos: puede disminuir concentraciones séricas de de la carbamazepina y aumentar las del ácido valproico y la fenitoina, fenobarbital incrementa efecto sedativo de la primidona.

Uso en embarazo y lactancia:

Embarazo: Categoría de riesgo B, atraviesa fácilmente la placenta. Después de la administración parenteral la concentración sanguínea en el feto se acerca a la de la madre. Se distribuye en los tejidos del feto, las mayores concentraciones estarán en la placenta, el hígado fetal y el cerebro fetal. Aumentando la incidencia de anomalías fetales.

Tercer trimestre: Durante el último trimestre puede producir dependencia física, dando lugar a síntomas de abstinencia en el neonato que puede producirse en el momento del nacimiento o demorarse 14 días.

Se ha descrito la asociación a un defecto en la coagulación (con el empleo prolongado de barbitúricos) dependiente de la vitamina K, se debe administrar de forma profiláctica a la madre un mes antes, durante el parto e inmediatamente después del nacimiento al lactante, vitamina K, por vía intravenosa.

Parto y alumbramiento: A dosis anestésica parecen inhibir la fuerza y presencia de las contracciones uterinas. Puede producir depresión respiratoria en el neonato. Se recomienda tener un equipo de resucitación a disposición inmediata.

Lactancia materna: compatible, vigilar efectos adversos en el lactante (somnolencia, succión débil y pobre ganancia de peso).

Los hijos de madres epilépticas tratadas con anticonvulsivantes, tienen cerca del doble de probabilidades de adquirir una malformación congénita, no obstante, en casos graves, se recomienda no descontinuar la administración de fármacos antiepilépticos, ya que los riesgos asociados al tratamiento suelen ser menores que los derivados de precipitarse el status epiléptico (hipoxia y trauma asociado, pudiendo llegar a muerte fetal). Se deberá considerar la interrupción del tratamiento solo en aquellos casos que la naturaleza, frecuencia y severidad de las convulsiones no conlleve un riesgo serio.

Efectos sobre la conducción de vehículos/ maquinarias:

Puede producir somnolencia y los pacientes bajo tratamiento no deberán conducir vehículos u operar maquinarias donde una disminución de la atención pueda originar accidentes.

Sobredosis:

Medidas generales de apoyo y en casos graves el uso de diálisis o hemoperfusión. Si han transcurrido menos de 2 horas de la ingestión o el enfermo está inconsciente es útil el lavado gástrico con dosis repetidas de carbón activado con el propósito de evitar absorción e incrementar la eliminación. Es necesario prestar atención constante al mantenimiento de una vía aérea despejada y la prevención de la neumonía prostática.

La dosis potencialmente fatal de fenobarbital es de 6 a10 g.

Propiedades Farmacodinámicas:

ATC: N03AA02 Barbitúricos y derivados

El fenobarbital es un barbitúrico que posee actividad hipnosedante y anticonvulsiva.

El fenobarbital actúa como depresor no selectivo del sistema nervioso central (SNC), capaz de producir todos los niveles de alteración del estado anímico del SNC, desde excitación hasta sedación ligera, hipnosis y coma profundo. En dosis terapéuticas suficientemente elevadas, el fenobarbital induce anestesia.

Sedante-hipnótico: El fenobarbital deprime la corteza sensorial, disminuye la actividad motora, altera la función cerebral y produce somnolencia, sedación e hipnosis.

Anticonvulsivo: Se cree que actúa deprimiendo la transmisión monosináptica y polisináptica en el SNC. También aumenta el umbral de estimulación eléctrica de la corteza motora.

Otras acciones: Los barbitúricos tienen poca acción analgésica a dosis subanestésicas y pueden aumentar la reacción a los estímulos dolorosos; son depresores respiratorios (en dependencia de la dosis y el grado de depresión); disminuyen la fase del sueño del movimiento rápido de los ojos (REM); disminuyen las etapas III y IV del sueño (sueño de onda lenta); inducen las enzimas microsomales hepáticas, aumentando y alterando el metabolismo de otros barbitúricos, medicamentos o compuestos.

Mecanismo de acción:

Estudios recientes han sugerido que los efectos sedante-hipnóticos y anticonvulsivos del fenobarbital pueden estar relacionados con su capacidad para potenciar y/o mimetizar la acción sináptica inhibitoria del ácido gamma-aminobutírico (GABA). Aunque el mecanismo de acción no está completamente establecido, el fenobarbital parece tener un efecto particular a nivel del tálamo, donde inhibe la conducción ascendente en la formación reticular, interfiriendo así con la transmisión de los impulsos hacia la corteza.

Propiedades Farmacocinéticas (absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: Las sales sódicas de los barbitúricos se absorben más rápidamente debido a su rápida disolución.

Unión a proteínas: 20-45 %

Distribución: Rápidamente a todos los tejidos y líquidos corporales, consiguiéndose concentraciones elevadas en el cerebro, hígado y riñones. Pasa a leche materna y su concentración es aproximadamente el 45 % de la del plasma. La solubilidad en los lípidos es el factor que determina su distribución corporal.

Metabolismo: Hepático, principalmente mediante el sistema de enzimas microsomales hepáticas.

Vida media (h): Intervalo:

Adultos: 53-118.

Niños: 40-70.

Media: 79.

El tiempo de vida media de los recién nacidos es mayor que el de los adultos, igualmente se ve aumentada en pacientes con insuficiencia renal o hepática.

Comienzo de la acción:

Intramuscular: Ligeramente más rápida que por vía oral o rectal (20 a 60 minutos).

Intravenosa: 5 minutos.

Tiempo hasta el efecto máximo: La máxima depresión del SNC puede no producirse hasta 15 minutos o más después de la administración intravenosa.

Tiempo máximo im: 2 horas.

Concentración sérica terapéutica: Anticonvulsivo: de 10 a 40 mcg por mL.

Eliminación: Principalmente por la orina, 25 % en forma inalterada y 75 % metabolizada, conjugado con ácido glucurónico y sulfatos. La alcalinización de la orina aumenta la excreción del fenobarbital en forma inalterada.

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

Deseche el sobrante

Fecha de aprobación / revisión del texto: 31 de enero de 2018.