

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	FENOBARBITAL-100
Forma farmacéutica:	Tableta
Fortaleza:	100 mg Estuche por 1 ,2 ó 3 blísteres de PVC/AL con 10 ó 20 tabletas cada uno.
Presentación:	Estuche por 1 ,2 ó 3 blísteres de PVC ámbar /AL con 10 ó 20 tabletas cada uno. Blíster de PVC ámbar /AL con 10 tabletas. (Temporal).
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba. EMPRESA LABORATORIOS MEDSOL, La Habana, Cuba.
Fabricante, país:	UNIDAD EMPRESARIAL DE BASE (UEB) SOLMED. Planta 1 y Planta 2.
Número de Registro Sanitario:	M-15-137-N03
Fecha de Inscripción:	22 de octubre de 2015
Composición:	
Cada tableta contiene:	
Fenobarbital	100,0 mg
Lactosa monohidratada	18,11 mg
Plazo de validez:	36 meses
Condiciones de almacenamiento:	Almacenar por debajo de 30 °C. Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Convulsiones (todas las formas), crisis convulsivas generalizadas (tónicas, clónicas, tonicoclónicas y mioclónicas).

Profilaxis y tratamiento de las convulsiones febriles.

Hiperbilirrubinemia y kernícterus en el recién nacido.

Contraindicaciones:

Hipersensibilidad conocida al fenobarbital o a otros barbitúricos.

Porfiria intermitente aguda o porfiria variegata.

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

Precauciones:

Embarazo: Atraviesa la barrera placentaria; riesgo de teratogenicidad, dependencia y síndrome de abstinencia en el neonato (en el 3er trimestre). Su uso con fines anticonvulsivos durante el embarazo va asociado a un defecto de la coagulación en el neonato que puede producir hemorragia durante el período neonatal temprano (primeras 24

h del nacimiento). Se debe administrar vitamina K a la madre, de forma profiláctica 1 mes antes y durante el parto e inmediatamente después del nacimiento al lactante por vía i.v. Categoría de riesgo para el embarazo: D.

Lactancia materna: se excreta por la leche materna; puede causar depresión del SNC en el lactante.

Uso en niños: excitación paradójica y compromiso de la función cognitiva.

Adulto mayor: Debe ser utilizado con cuidado en pacientes con edad avanzada, ya que estos pueden reaccionar a las dosis usuales con excitación, confusión o depresión mental.

Disfunción hepática: Requiere disminución de la dosis por metabolismo hepático reducido.

Disfunción renal: Puede ser necesario ajustar la dosis.

Antecedentes de abuso o dependencia de drogas.

Insuficiencia respiratoria y asma severa: puede producir depresión de la ventilación. Hipertiroidismo: Puede exacerbarse. Su uso prolongado puede producir farmacodependencia.

Debe valorarse la relación riesgo-beneficio en casos de anemia severa, historia de asma, diabetes mellitus, historia de abuso o dependencia de drogas, coma hepático, disfunción hepática, disfunción renal, hiperquinesia, hipoadrenalismo limítrofe, depresión mental y tendencias suicidas.

Pacientes con diabetes mellitus.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

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

Evitar la ingesta de bebidas alcohólicas, no tomar con otros depresores del SNC.

El uso prolongado puede crear hábito, no debe suprimirse bruscamente el tratamiento porque pueden incrementarse la frecuencia e intensidad de las crisis.

Monitoreo periódico de concentraciones plasmáticas para detectar efecto y reacciones adversas.

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:

Oral:

Adultos:

Anticonvulsivo: De 50 a 250 mg (base) al día, como dosis única o divididas en varias tomas.

Antihiperbilirrubinémico: De 25 a 50 mg (base) /8 h.

Los pacientes geriátricos y debilitados pueden reaccionar a las dosis usuales con excitación,

confusión o depresión mental. En estos pacientes pueden ser necesarias dosis menores.

Niños:

Anticonvulsivo: De 1 a 6 mg (base) por kg de peso corporal al día, como dosis única o dividida en varias tomas.

Antihiperbilirrubinémico:

Neonatos: Oral de 5 a 10 mg (base) por kg de peso corporal al día, durante los primeros días después del nacimiento.

Niños menores de 12 años: Oral, de 1 a 4 mg (base) por kg de peso corporal/8 h.

Interacción 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.

Por inducción de enzimas microsomales hepáticas puede disminuir los efectos de los siguientes medicamentos:

Corticoides, ciclosporina, levotiroxina, quinidina, anticoagulantes, antidepresivos tricíclicos, paracetamol, doxiciclina, dacarbazina, glucósidos digitálicos, metronidazol, anticonceptivos (riesgo de embarazo), estrógenos, nifedipino, diltiazem y verapamilo. Disminuyen el efecto del fenobarbital:

El haloperidol y otros antipsicóticos (por reducción del umbral convulsivo), griseofulvina (por reducción de su absorción).

Con otros anticonvulsivos: puede disminuir concentraciones séricas de la carbamazepina y aumentar las del ácido valproico y la fenitoína.

No deberá usarse simultáneamente con ácido ascórbico, bloqueantes de los canales del calcio, ciclofosfamida, griseofulvina, Vitamina D y xantinas.

Isoniazida, metilfenidato y los inhibidores de la MAO pueden aumentar los efectos depresivos sobre el SNC cuando se emplean concomitantemente con el fenobarbital.

Paracetamol: puede disminuir sus efectos cuando se utiliza en pacientes con tratamiento prolongado con fenobarbital.

Anticonvulsivantes del Grupo de las Hidantoínas, ya que su uso simultáneo con el fenobarbital puede producir efectos variables e imprevisibles en su metabolismo por lo que deben controlarse estrechamente sus concentraciones plasmáticas.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: Atraviesa la barrera placentaria; riesgo de teratogenicidad, dependencia y síndrome de abstinencia en el neonato (en el 3er trimestre). Su uso con fines anticonvulsivos durante el embarazo va asociado a un defecto de la coagulación en el neonato que puede producir hemorragia durante el período neonatal temprano (primeras 24 h del nacimiento). Se debe administrar vitamina K a la madre, de forma profiláctica 1 mes antes y durante el parto e inmediatamente después del nacimiento al lactante por vía i.v. Categoría de riesgo para el embarazo: D.

Lactancia materna: se excreta por la leche materna; puede causar depresión del SNC en el lactante. Uso en niños: excitación paradójica y compromiso de la función cognitiva.

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:

La sobredosificación puede producir depresión respiratoria, hipertensión, colapso vascular periférico, disminución de la temperatura corporal y coma. En tratamientos prolongados pueden aparecer desorientación, confusión mental, ataxia, vértigos, depresión y rash cutáneo.

La intoxicación moderada se parece a la ebriedad alcohólica.

En la intoxicación severa el paciente está comatoso y el nivel de actividad refleja corresponde en general a la intensidad de la depresión central. Las pupilas pueden estar contraídas y reaccionar a la luz, pero pueden llegar a presentar dilatación paralítica hipóxica. La respiración se afecta pronto y puede ser lenta o rápida y superficial. El paciente puede caer en shock.

Las complicaciones pulmonares y la insuficiencia renal son posibles complicaciones fatales del envenenamiento severo con barbitúricos.

El tratamiento se basa en medidas generales de apoyo y en casos graves el uso de diálisis o hemoperfusión. Si han transcurrido menos de 24 horas de la ingestión es útil el lavado gástrico. Es necesario prestar atención constante al mantenimiento de una vía aérea despejada y la prevención de la neumonía hipostática. La dosis potencialmente fatal de fenobarbital es de 6 a 10 g.

Propiedades farmacodinámicas:

ATC: N03AA02

Grupo farmacoterapéutico: N - Sistema nervioso, N03 - Antiepilépticos, N03A Antiepilépticos, N03AA – Barbitúricos y derivados

El fenobarbital es un barbitúrico que posee actividad hipno-sedante y anticonvulsiva.

Mecanismo de acción:

El mecanismo de acción por el cual el fenobarbital inhibe las convulsiones incluye, posiblemente, potenciación de la inhibición sináptica por una acción en el receptor GABA_A. Es agonista de receptores GABA incrementando la acción inhibitoria de estos en el SNC. Reduce efectos excitatorios mediados por el glutamato. Eleva el umbral convulsivo y limita la propagación de la crisis.

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. 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.

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.

Antihiperbilirrubinémico: Disminuye las concentraciones séricas de bilirrubina probablemente por inducción de la gluconil transferasa, enzima que conjuga la bilirrubina.

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

Absorción: Cuando la administración es oral, se disuelve y se dispersa en el contenido gastrointestinal, es absorbido en forma moderadamente rápida, siendo el intestino su principal sitio de absorción. La presencia de alimento en el estómago disminuye la velocidad de absorción pero no su biodisponibilidad.

Distribución: Se distribuye menos rápidamente que otros barbitúricos debido a su menor solubilidad en lípidos.

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

Unión a proteínas plasmáticas (%): 40-60. Es titulable en plasma entre las 2-3 horas posteriores a su administración.

Vida media (h): Intervalo: 53-118 (la vida media en niños es de 40-70 horas). Se prolonga en neonatos.

Media: 79 h.

Comienzo de la acción:

Oral: Varía de 20 a 60 minutos.

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

Eliminación/ % excretado inalterado: Renal/ 20-30 %, y su velocidad de eliminación puede aumentar alcalinizando la orina. El resto es inactivado por las enzimas microsomales hepáticas y se excreta en forma de glucurónidos y sulfatos.

La concentración sanguínea óptima de fenobarbital debe determinarse por la respuesta en el control de la crisis convulsiva y la aparición de efectos tóxicos.

Para conseguir concentraciones sanguíneas consideradas como terapéuticas en niños, generalmente se requiere una mayor dosificación de fenobarbital.

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

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 30 de septiembre de 2020.