

# PRICISTIN®

## GABAPENTINA

ANTINEURITICO - ANTICONVULSIVANTE  
CÁPSULAS  
VÍA DE ADMINISTRACIÓN: ORAL

#### FORMULA:

PRICISTIN 100: Cada cápsula contiene:

Gabapentina..... 100 mg  
Excipientes..... c.s.

PRICISTIN 300: Cada cápsula contiene:

Gabapentina..... 300 mg  
Excipientes..... c.s.

PRICISTIN 400: Cada cápsula contiene:

Gabapentina..... 400 mg  
Excipientes..... c.s.

#### MECANISMO DE ACCIÓN

Antiepiléptico, relacionado estructuralmente con el GABA. Su efecto parece producirse como resultado de una acción farmacológica retardada o indirecta, hasta ahora desconocida. Se ha sugerido un efecto sobre un sistema de transporte neuronal de L-aminoácidos. La identificación en ratas de un nuevo lugar de unión de péptidos en neocórtex y en el hipocampo, indica que éstos pueden estar relacionados con la actividad anticonvulsivante de la gabapentina. Carece de efectos sobre receptores de GABA, benzodiazepinas o ureídicos, tampoco afecta a la recaptación presináptica, contenido en las terminaciones nerviosas o metabolismo de GABA. Tampoco tiene ningún efecto sobre receptores aminoacídúrgicos como NMDA (glutámico), o sobre canales iónicos de sodio o calcio.

#### FARMACOCINÉTICA

Después de la administración oral, las concentraciones plasmáticas máximas de la gabapentina se observan dentro de las siguientes 2 a 3 horas. La biodisponibilidad absoluta de las cápsulas de 300 mg es, aproximadamente de 59%. La presencia de alimentos no afecta la farmacocinética de la gabapentina. La biodisponibilidad de la gabapentina no es proporcional a la dosis, ya que cuando se incrementa ésta, la biodisponibilidad disminuye. La biodisponibilidad de una dosis de 400 mg es proporcionalmente 25% menor que la biodisponibilidad de una dosis de 100 mg. La vida media de eliminación es independiente de la dosis y en promedio es de 5 a 7 horas. La gabapentina no se liga a las proteínas plasmáticas y en enfermos epilépticos sus concentraciones en el líquido cefalorraquídeo y en el tejido cerebral son respectivamente de 20% y 80% de aquellas encontradas en el plasma. Ya que la gabapentina no se une a las proteínas y no induce mayor actividad en las enzimas hepáticas, no se producen interacciones con los agentes antiepilépticos convencionales (fenitoína, valproato de sodio, carbamazepina y fenobarbital). Este hecho facilita enormemente la terapia adicional de la gabapentina a los regímenes antiepilépticos existentes. La gabapentina se elimina por vía renal y en el caso de insuficiencia renal se deben modificar las dosis Vía oral: Su biodisponibilidad es del 55-65%, alcanzando la concentración sérica máxima al cabo de 2 horas. Los alimentos no reducen ni retrasan la absorción oral. Aunque en los estudios clínicos las concentraciones plasmáticas de gabapentina estuvieron generalmente entre 2 mcg/ml y 20 mcg/ml, éstas no son predictivas de seguridad o eficacia. El grado de unión a proteínas plasmáticas es del 0%. Es eliminado mayoritariamente con la orina, 100% en forma inalterada. Su semivida de eliminación es de 5-7 h (en insuficiencia renal hasta 45 h). La fracción de la dosis eliminable mediante hemodiálisis o diálisis peritoneal es del 90-100%

#### INDICACIONES:

Dolor neuropático: La gabapentina está indicada para el tratamiento del dolor neuropático en pacientes mayores de 18 años de edad.  
Epilepsia: La gabapentina está indicada como tratamiento único de crisis convulsivas parciales, con o sin generalización secundaria, en adultos y en niños mayores de 12 años de edad.

#### CONTRAINDICACIONES:

La gabapentina está contraindicada en pacientes que hayan demostrado hipersensibilidad al fármaco.

## REACCIONES ADVERSAS / EFECTOS COLATERALES:

Se han hecho evaluaciones de seguridad de gabapentina en aproximadamente 2.000 sujetos y pacientes bajo tratamiento concomitante y fue bien tolerado. De estos, 543 pacientes participaron en estudios clínicos controlados. Como gabapentina con mayor frecuencia se administró en combinación con otros agentes antiepilépticos, no fue posible determinar cual o cuáles agentes, en el caso, estuvo o estuvieron asociados con eventos adversos. Los eventos adversos reportados, fueron de grado leve a moderado.

## PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Aunque no existe evidencia de convulsiones de rebote con gabapentina, la interrupción súbita en la administración de medicamentos anticonvulsivantes en pacientes epilépticos, puede ocasionar *status epilepticus*.

Cuando a juicio del médico sea necesario disminuir la dosis, interrumpir su administración o utilizar algún medicamento anticonvulsivante alternativo, estos cambios deben efectuarse gradualmente durante un período mínimo de una semana.

En general, no se considera que gabapentina sea de utilidad para el tratamiento de las crisis de ausencia.

Uso pediátrico: Epilepsia: No se han establecido la seguridad y eficacia de gabapentina como tratamiento coadyuvante en niños menores de 3 años de edad. Como tratamiento único, no se han establecido la seguridad ni la eficacia en pacientes menores de 12 años.

Dolor neuropático: La seguridad y efectividad en pacientes menores de 18 años de edad no han sido establecidas.

Uso geriátrico: Cincuenta y nueve pacientes (3 %) mayores de 65 años de edad recibieron gabapentina en estudios antes de su comercialización. Las reacciones secundarias reportadas en estos pacientes, no fueron diferentes a las que se han informado en pacientes más jóvenes. En pacientes con función renal comprometida, la dosis debe ser ajustada.

Este medicamento contiene Almidón, por lo que debe tenerse en cuenta en el tratamiento de los pacientes celíacos. Los pacientes con alergia al almidón no deben tomar este medicamento.

## INTERACCIONES:

No se han observado interacciones entre la gabapentina y fenobarbital, fenitoína, ácido valproico o carbamazepina. La farmacocinética de la gabapentina en estado estable es semejante en los sujetos sanos y en los pacientes con epilepsia que reciben estos medicamentos antiepilépticos.

La administración concomitante de gabapentina y anticonceptivos orales que contienen noretindrona y/o etinilestradiol, no afecta la farmacocinética en estado estable de cualquiera de los fármacos.

La administración concomitante de gabapentina con antiácidos que contienen aluminio y magnesio, reduce aproximadamente 20 % su biodisponibilidad. Se recomienda que gabapentina se tome aproximadamente 2 horas después del antiácido. La excreción renal de gabapentina no es alterada por el probenecid. Se espera que la leve disminución de la excreción renal de gabapentina observada cuando se administra simultáneamente con cimetidina no sea clínicamente importante.

## POSOLÓGIA:

Vía oral, con o sin alimentos.

Epilepsia: Adultos y pacientes mayores de 12 años: En estudios clínicos controlados, el intervalo de las dosis eficaces fue de 900 a 3.600 mg/día. El tratamiento se puede iniciar con la administración de 300 mg tres veces al día el primer día de tratamiento, o ajustando la dosis como se describe más adelante. A continuación, la dosis se puede incrementar en 3 dosis fraccionadas iguales hasta un máximo de 3.600 mg. Dosis hasta de 4.800 mg/día han sido bien toleradas en estudios clínicos abiertos, por un tiempo prolongado. El tiempo máximo entre la administración de una y otra dosis en esquema de tres veces al día, no debe ser mayor de 12 horas.

Dosis en pacientes pediátricos desde los 12 años: La dosis efectiva de gabapentina es de 25 a 35 mg/kg/día en dosis fraccionadas (3 veces al día). El ajuste de la dosis efectiva puede requerir más de 3 días mediante la administración de 10 mg/kg/día el día uno, 20 mg/kg/día el día dos y 30 mg/kg/día el día tres. En estudios clínicos de larga duración, dosis hasta de 40 a 50 mg/kg/día han sido bien toleradas.

No es necesario medir las concentraciones de gabapentina en el plasma para optimizar su dosis. Además, la gabapentina se puede administrar en combinación con otros medicamentos antiepilépticos sin preocupación sobre alteración de las concentraciones plasmáticas de la gabapentina o las concentraciones plasmáticas de los otros medicamentos antiepilépticos.

Si se interrumpe la administración de gabapentina y/o se agrega algún otro medicamento anticonvulsivante al tratamiento, estos cambios deben efectuarse gradualmente durante un período mínimo de una semana.

Dolor neuropático: En pacientes adultos: La dosis inicial es de 900 mg/día en tres dosis divididas, ajustarse si es necesario, con base en la respuesta obtenida, hasta una dosis máxima de 3.600 mg/día.

Ajustes de la dosis en pacientes con insuficiencia renal y dolor neuropático o epilepsia. Se recomienda ajustar la dosis en los pacientes con función renal comprometida o que estén bajo tratamiento por hemodiálisis. En pacientes que se encuentran en hemodiálisis y que han recibido gabapentina, se recomienda una dosis de inicio de 300 a 400 mg, a continuación 200 a 300 mg, 4 horas después de la hemodiálisis.

## RECOMENDACIÓN:

En caso de sobredosis recurrir al Centro Nacional de Toxicología en el Centro de Emergencias Médicas - Av. Gral. Santos y Teodoro S. Mongelós - Tel. 204 800

## PRESENTACIÓN:

PRICISTIN 100: Caja x 30 cápsulas.

PRICISTIN 300: Caja x 30 cápsulas.

PRICISTIN 400: Caja x 30 cápsulas.

## Venta Bajo Receta

Mantener a temperatura ambiente (15 °C a 30 °C). Conservar en lugar seco.

Elaborado por

Laboratorios Catedral de Scavone Hnos. S. A. – Acceso Norte

Planta Industrial: Vía Férrea esq. Cándido Vasconellos - Asunción – Paraguay

Director Técnico: Farm. Jaime Cristófol - Reg. Prof. N° 2.719

SCAVONE HNOS. S.A.

Santa Ana N° 431 c/ Avda. España - Asunción – Paraguay

Director Técnico: Q.F. Amílcar Sena - Reg. Prof. N° 4.885

Todo medicamento debe ser mantenido fuera del alcance de los niños.