

COMPOSICIÓN:	Pregabalina 75mg Cápsulas	Pregabalina 150mg Cápsulas	Pregabalina 300mg Cápsulas
Pregabalina	75 mg	150 mg	300 mg
Excipientes, c.s.p.	1 cápsula	1 cápsula	1 cápsula

DESCRIPCIÓN:

Gabafar® contiene pregabalina, un fármaco antiepiléptico y analgésico usado en el dolor neuropático periférico, y como terapia añadida en las crisis parciales convulsivas con o sin generalización en adultos.

INDICACIONES:

- Manejo del dolor neuropático asociado con neuropatía diabética periférica.
- Tratamiento de la neuralgia postherpética.
- En epilepsia está indicado como terapia adjunta en adultos con crisis parciales con o sin generalización secundaria.
- Tratamiento de la fibromialgia.
- Manejo del dolor neuropático asociado con lesión de la médula espinal.
- Trastorno de ansiedad generalizada.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

La pregabalina se absorbe con rapidez tras su administración por vía oral y las concentraciones plasmáticas máximas se alcanzan al cabo de 1.5 horas. La biodisponibilidad oral es del 90% aproximadamente. Si se administra con alimentos se reduce la velocidad, pero no el grado de absorción, aunque este hecho no es clínicamente significativo. El estado de equilibrio estacionario se alcanza en 1-2 días. La pregabalina no se metaboliza de manera apreciable y su unión a las proteínas plasmáticas es nula. Alrededor del 98% de la dosis se excreta por la orina como fármaco inalterado. La semivida de eliminación es de 6.3 horas. La pregabalina se elimina mediante hemodiálisis.

La pregabalina se fija a una subunidad auxiliar (proteína $\alpha 2\text{-}\delta$) de los canales de calcio dependientes de voltaje en el sistema nervioso central, provocando una reducción de las corrientes de calcio neuronales. Datos limitados sugieren agonismo de la pregabalina en los canales de potasio dependientes de ATP. La pregabalina puede desplazar a la gabapentina de su sitio de unión. La unión de pregabalina a la subunidad alfa 2 delta de los canales de calcio dependientes de voltaje, aparece también implicado en el mecanismo de acción del fármaco en los estados de ansiedad. Este mecanismo también ha sido propuesto para los efectos analgésicos de gabapentina. La evidencia en modelos animales con lesión en nervio ha demostrado que la pregabalina reduce la liberación de calcio dependiente de neurotransmisores pronocéptivos en la médula espinal, posiblemente al interrumpir el tráfico de calcio y/o reducción en las corrientes de calcio.

REACCIONES ADVERSAS:

Las reacciones adversas comunicadas con más frecuencia han sido mareos y somnolencia. Generalmente, las reacciones adversas fueron de intensidad de leve a moderada. En todos los estudios controlados, la tasa de abandono a causa de reacciones adversas fue del 13% para pacientes que estaban recibiendo pregabalina y del 7% para pacientes que recibieron placebo. Las reacciones adversas que con más frecuencia dieron lugar a una interrupción del tratamiento en los grupos tratados con pregabalina fueron mareos y somnolencia.

Otras reacciones adversas son:

Trastornos de la sangre y del sistema linfático: neutropenia (<1/1,000).

Trastornos del metabolismo y de la nutrición: aumento del apetito (>1/10); Anorexia (<1/100); hipoglucemia (1/1,000).

Trastornos psiquiátricos: euforia, confusión, disminución de la libido, irritabilidad (1/10); pérdida de la personalidad, anorgasmia, inquietud, depresión, agitación, balanceos, exacerbación del insomnio, estado de ánimo depresivo, dificultad para encontrar palabras, alucinaciones, sueños extraños, aumento de la libido, ataques de pánico, apatía (1/100); desinhibición, estado de ánimo elevado (1/100).

Trastornos del sistema nervioso: mareos, somnolencia (1/10); ataxia, alteraciones en la concentración, coordinación anormal, deterioro de la memoria, temblor, distartria, parestesia (1/100); trastorno cognitivo, hipoestesia, defecto del campo visual, nistagmo, trastornos del habla, mioclonía, hiporreflexia, discinesia, hiperactividad psicomotora, mareo postural, hiperestesia, ageusia, sensación de ardor, temblor intencional, estupor, síncope (1/1,000); Hipocinesia, parosmia, disgrafía (< 1/1,000).

Trastornos oculares: visión borrosa, diplopía (1/10); trastornos visuales, sequedad de ojos, hinchazón de ojos, disminución de la agudeza visual, dolor de ojos, astenopia, aumento de la lacrimación (1/100); fotopsia, irritación de los ojos, midriasis, oscilopsia, percepción de la profundidad visual alterada, pérdida de la visión periférica, estrabismo, brillo visual (1/1,000).

Trastornos del oído y del laberinto: vértigo (1/10); Hiperacusia (< 1/1,000).

Trastornos cardíacos: taquicardia (1/100); bloqueo auriculoventricular de primer grado, taquicardia sinusal, arritmia sinusal, bradicardia sinusal (< 1/1,000).

Trastornos vasculares: rubor, sofocos (1/100); hipotensión, frío periférico, hipertensión (<1/1,000)

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos: disnea, sequedad nasal (1/100); nasofaringitis, tos, congestión nasal, epistaxis, rinitis, ronquidos, opresión en la garganta (<1/1,000).

Trastornos gastrointestinales: sequedad de boca, estreñimiento, vómitos, flatulencia (1/10); distensión abdominal, hipersecreción salivar, enfermedad de reflujo gastroesofágico, hipoestesia oral (1/100); ascitis, disfagia, pancreatitis (<1/1,000).

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo: sudoración erupción papular (1/100); sudor frío, urticaria (1/1,000).

Trastornos musculoesqueléticos y del tejido conjuntivo: espasmo muscular, hinchazón de las articulaciones, calambres musculares, mialgia, artralgia, dolor de espalda, dolor en las extremidades, rigidez muscular (1/100); espasmo cervical, dolor de cuello, rabdomiólisis (< 1/1,000).

Trastornos renales y urinarios: disuria, incontinencia urinaria (1/100); oliguria, insuficiencia renal (<1/1,000).

Trastornos del aparato reproductor y de la mama: disfunción eréctil (1/10); retraso en la eyaculación, disfunción sexual (1/100); amenorrea, dolor de mamas, secreción mamaria, dismenorrea, hipertrofia mamaria (< 1/1,000).

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración: fatiga, edema periférico, sensación de embriaguez, edema, marcha anormal (1/10); astenia, caídas, sed, opresión en el pecho (1/100); dolor exacerbado, anasarca, pirexia, escalofríos (< 1/1,000).

Otros: aumento de peso (1/100); aumento de la alanina aminotransferasa, aumento de la creatinina fosfoquinasa plasmática, aumento de la aspartato aminotransferasa, disminución del número de plaquetas (1/100); Aumento de la glucemia, aumento de la creatinina plasmática, reducción de la potasemia, reducción del peso, reducción del número de leucocitos.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Pacientes con problemas hereditarios de intolerancia a la galactosa, lactasa o síndrome de mala absorción de glucosa/galactosa, no deben tomar este medicamento.

Algunos pacientes diabéticos que ganan peso en el tratamiento con pregabalina pueden necesitar ajustar sus medicamentos hipoglucemiantes.

La pregabalina puede provocar mareo y somnolencia. Por lo tanto, a los pacientes se les aconseja no

manejar, operar maquinaria compleja ni comprometerse en otras actividades potencialmente peligrosas hasta que se sepa si este medicamento afecta su capacidad para realizar estas actividades.

En algunos pacientes se han observado síntomas de supresión tras la interrupción del tratamiento con pregabalina tanto a corto como a largo plazo. Se han mencionado los siguientes acontecimientos: insomnio, dolor de cabeza, náuseas, diarrea, síndrome gripal, nerviosismo, depresión, dolor, sudación y mareos.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad al principio activo o a alguno de los excipientes.
Insuficiencia cardiaca estudios III y IV.

INTERACCIONES:

Dado que la pregabalina se excreta principalmente sin cambios en la orina, experimenta un metabolismo insignificante en humanos (<2% de una dosis se recupera en la orina en forma de metabolitos), no inhibe el metabolismo del fármaco in vitro, y no se une a las proteínas plasmáticas, pregabalina tiene poca probabilidad de producir, o someterse a, interacciones farmacocinéticas.

Por consiguiente, en estudios in vivo no se observaron interacciones farmacocinéticas clínicamente relevantes entre pregabalina y fenitoína, carbamazepina, ácido valproico, lamotrigina, gabapentina, lorazepam, oxycodona o etanol. El análisis de la farmacocinética poblacional indica que los antidiabéticos orales, diuréticos, insulina, fenobarbital, tiagabina y topiramato no produjeron efecto clínicamente significativo sobre la depuración de pregabalina.

La administración concomitante de pregabalina con los anticonceptivos orales noretisterona y/o etinil estradiol no influye en la farmacocinética en estado estable de cualquiera de las sustancias. La pregabalina puede potenciar los efectos del etanol y lorazepam. En estudios clínicos controlados, las dosis orales múltiples de pregabalina coadministradas con oxycodona, lorazepam, o etanol no resultaron en efectos clínicamente importantes en relación a la respiración. La pregabalina parece tener un efecto aditivo en la alteración de la función cognitiva y motora causada por oxycodona.

En la experiencia post-comercialización, existen reportes de insuficiencia respiratoria, coma y muerte en pacientes que toman pregabalina y otros medicamentos depresivos del SNC (Sistema Nervioso Central), incluyendo a los pacientes que son farmacodependientes. Existen reportes post-comercialización de eventos relacionados con una disminución en la función del tracto gastrointestinal inferior (ejemplo: obstrucción intestinal, íleo paralítico, constipación) cuando pregabalina fue administrada concomitantemente con medicamentos que tienen el potencial de producir estreñimiento, como los analgésicos opioides.

No se realizaron estudios específicos de interacción farmacodinámica en voluntarios adultos mayores.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

No existen datos suficientes sobre la utilización de pregabalina en mujeres embarazadas. Los estudios en animales han mostrado toxicidad reproductiva. Se desconoce el posible riesgo en seres humanos. Por tanto, la pregabalina no debería utilizarse durante el embarazo a menos que el beneficio para la madre supere el riesgo potencial para el feto. Las mujeres en edad fértil deben utilizar un método anticonceptivo eficaz.

Se desconoce si pregabalina se excreta en la leche materna humana; sin embargo, está presente en la leche de las ratas. Por lo tanto, no se recomienda la lactancia materna durante el tratamiento con pregabalina.

SOBREDOSIFICACIÓN Y TRATAMIENTO:

En sobredosis de hasta 15 g, no se reportaron reacciones adversas inesperadas. El tratamiento de la sobredosis de pregabalina debe incluir medidas generales de apoyo y puede incluir la hemodiálisis si es necesario.

DOSIFICACIÓN Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN:

Vía de administración: oral.

El rango de dosis es de 150 a 600 mg por día, dividiendo su administración en dos o tres tomas.

Pregabalina se administra por vía oral con o sin alimentos.

Dolor neuropático: el tratamiento con pregabalina puede comenzarse a una dosis de 150 mg por día. Basándonos en la respuesta individual de los pacientes y la tolerabilidad, la dosificación puede incrementarse a 300 mg por día tras un intervalo de 3 a 7 días, y en caso necesario, a una dosis máxima de 600 mg por día después de un intervalo adicional de 7 días.

Fibromialgia: el rango de dosis usual para la mayoría de los pacientes es de 300 a 450 mg al día administrados en dos dosis divididas. Algunos pacientes pueden recibir un beneficio adicional con la dosis de 600 mg al día. La administración debe iniciarse con 75 mg dos veces al día (150 mg/día) y puede incrementarse a 150 mg dos veces al día (300 mg/día) en el lapso de 1 semana con base en la eficacia y la tolerabilidad. A los pacientes que no experimentan un beneficio suficiente con 300 mg/día se les puede incrementar la dosis a 225 mg dos veces al día (450 mg/día). Si fuera necesario, en algunos pacientes, con base en la respuesta y tolerabilidad individuales, la dosis puede aumentarse a un máximo de 600 mg/día después de una semana adicional.

Epilepsia: el tratamiento con pregabalina puede iniciarse con una dosis de 150 mg por día. Basándonos en la respuesta individual de los pacientes y la tolerabilidad, la dosificación puede incrementarse a 300 mg por día tras 1 semana. La dosificación máxima de 600 mg por día puede alcanzarse después de una semana adicional.

Trastorno de Ansiedad Generalizada: el rango de dosis es de 150 a 600 mg al día, dividiendo su administración en dos o tres tomas. Se debe reevaluar de forma periódica la necesidad del tratamiento.

El tratamiento con pregabalina se puede iniciar con una dosis de 150 mg al día. En función de la respuesta y tolerabilidad individual de cada paciente, la dosis se puede incrementar a 300 mg al día después de una semana. Tras una semana adicional, la dosis se puede incrementar a 450 mg al día. La dosis máxima que se puede alcanzar, después de una semana adicional, es de 600 mg al día.

Descontinuación de pregabalina: si debemos descontinuar la administración de pregabalina, se recomienda hacerlo gradualmente durante un mínimo de una semana.

PRESENTACIONES:

Caja conteniendo 3 blísteres de 10 cápsulas.

Caja conteniendo 10 blísteres de 10 cápsulas.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN:

Venta por receta médica.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Consérvese en un lugar fresco y seco entre 25 – 30 °C.



Fabricante y Titular:

LABORATORIO LAPROFAR, S.R.L.
C/2da. Av. Los Restauradores No.1,
Sabana Perdida, Santo Domingo Norte.