

# FENOBARBITAL KLONAL

## FENOBARBITAL

Inyectable - Comprimidos

Venta bajo receta archivada

Industria Argentina

K-81/G

### PRESENTACIONES FARMACÉUTICAS:

#### **Comprimidos:**

##### **Fenobarbital Klonal 15 mg:**

Fenobarbital ..... 15 mg

Excipientes autorizados: cellatosa, laca rojo punzó 4R, croscarmelosa sódica, dióxido de silicio coloidal, estearato de magnesio.

##### **Fenobarbital Klonal 100 mg:**

Fenobarbital .....100 mg

Excipientes autorizados: cellatosa, laca rojo punzó 4R, croscarmelosa sódica, dióxido de silicio coloidal, estearato de magnesio.

#### **Inyectable:**

##### **Fenobarbital Klonal 200 mg:**

Cada ampolla contiene:

Fenobarbital (como sal sódica).....200 mg

Excipientes: propilenglicol, agua destilada c.s.

#### **ACCIÓN TERAPÉUTICA:**

El Fenobarbital es un barbitúrico de acción anticonvulsivante, sedante e hipnótica.

#### **ACCIÓN FARMACOLÓGICA:**

Barbitúrico, depresor no selectivo de SNC, puede producir alteraciones de todo tipo en el SNC, desde excitación hasta sedación, hipnósís y coma profundo.

Su mecanismo de acción estaría relacionado con su capacidad de aumentar y/o mimetizar la acción inhibitoria sináptica del GABA

Aumenta el umbral de estimulación eléctrica de la corteza motora.

Se metaboliza en el hígado mediante el sistema de enzimas microsomas hepáticas.

#### **INDICACIONES:**

Indicado en el tratamiento de epilepsia con convulsiones generalizadas tónico clónicas y simples parciales.

Tratamiento y profilaxis de la crisis convulsiva.

Tratamiento del estado del mal epiléptico.

#### **USO PARENTERAL:**

El Fenobarbital es usado como medicación pre-anestésica para reducir la ansiedad del paciente y facilitar la inducción de la anestesia.

Su forma parenteral está indicada como tratamiento adjunto de emergencia en episodios convulsivos asociados a tétanos, meningitis, eclampsia, intoxicación por Estricnina.

#### **CONTRAINDICACIONES:**

Porfirias. Insuficiencia respiratoria severa. Antecedentes de hipersensibilidad a los barbitúricos.

#### **PRECAUCIONES:**

##### **EN PACIENTES CON INSUFICIENCIA RENAL O HEPÁTICA DISMINUIR LA POSOLOGÍA**

Está desaconsejada la ingestión de bebidas alcohólicas durante el tratamiento con esta medicación ya que puede existir una potenciación recíproca.

Pacientes sometidos a diálisis pueden necesitar dosis mayores del barbitúrico. No se recomienda el uso de barbitúricos como hipnóticos.

Debe tenerse precaución al conducir vehículos o manejar maquinarias, debido a los riesgos de somnolencia producidos por el fenobarbital.

##### **EVITAR LA SUSPENSIÓN ABRUPTA DE LA MEDICACIÓN, DISMINUIR PAULATINAMENTE.**

En ancianos se debe disminuir la posología, pueden reaccionar con excitación, confusión o depresión.

#### **PEDIATRÍA:**

En niños se han observado reacciones paradójales de excitación, irritabilidad e hiperexcitación, depresión mental o confusión.

En aquellos pacientes pediátricos que están sometidos a tratamientos prolongados con fenobarbital, deberá iniciarse un tratamiento profiláctico de raquitismo, administrando vitaminas D2 o 25-OH vitamina D3.

#### **ADMINISTRACIÓN PARENTERAL:**

Para la administración intravenosa se recomienda usar las venas mayores, para evitar reacciones locales de irritación y trombosis. Deben ser administradas lentamente y con monitoreo del paciente, deben controlarse presión sanguínea, respiración y función cardíaca, debe haber un equipo de resucitación disponible así como para ventilación del paciente.

La administración intramuscular debe ser profunda en los grandes músculos como el glúteo.

La inyección intramuscular superficial puede ser dolorosa y producir un absceso estéril.

El volumen no debe exceder los 5ml en un mismo lugar, independientemente de su concentración, para evitar irritación. La solución de Fenobarbital es altamente alcalina por lo cual debe evitarse la extravasación perivascular o inyección intraarterial. La extravasación puede causar dolor intenso, con daño local y posterior necrosis. La inyección intraarterial puede producir dolor intenso, espasmo y posible gangrena.

#### **ADVERTENCIAS: ABUSO Y DEPENDENCIA:**

Los barbitúricos pueden producir habituación. También pueden producir tolerancia, dependencia psicológica y dependencia psíquica, especialmente luego del uso prolongado de altas dosis. La administración de 400 mg de fenobarbital por aproximadamente 90 días puede producir algún grado de dependencia física. Una dosis de 600 a 800mg durante por lo menos 35 días es suficiente para producir convulsiones por supresión. El promedio de dosis para un paciente adicto a los barbitúricos es de aproximadamente, 1,5 g por día. Cuando se desarrolla tolerancia a los barbitúricos la cantidad necesaria para mantener el mismo nivel de intoxicación aumenta; sin embargo la tolerancia a la dosis fatal no aumenta mas de dos veces. Por lo tanto el margen entre dosis intoxicante y dosis fatal se hace pequeño.

Los síntomas de intoxicación con barbitúricos incluyen posturas inestables, lenguaje confuso, nistagmus sostenido. Los signos mentales de intoxicación crónica incluyen, confusión, juicio empobrecido, irritabilidad, insomnio, y quejas a nivel somático.

Los síntomas de dependencia a los barbitúricos son similares a aquellos del alcoholismo crónico. Si un individuo parece estar intoxicado con alcohol a un grado que es desproporcionado al grado de alcohol en su sangre, se debe sospechar el uso de barbitúricos.

La dosis letal de barbitúricos es menor si también se ingiere alcohol.

Los síntomas de supresión a barbitúricos pueden ser severos y pueden causar la muerte. Síntomas, menores de supresión pueden aparecer entre 8 a 12 horas después de la última dosis de barbitúricos ingeridos. Estos síntomas aparecen en el siguiente orden: ansiedad, contracturas musculares, temblor en las manos y en los dedos, debilidad progresiva, mareos, distorsión en la percepción visual, náuseas, vómitos, insomnio, e hipotensión ortostática. Los síntomas mayores de supresión (convulsiones, delirios) pueden ocurrir en 16 horas y durar hasta 5 días luego de la cesación abrupta de barbitúricos.

La intensidad de los síntomas de supresión declina gradualmente en un período de tiempo de aproximadamente 15 días. Individuos susceptibles al abuso y dependencias de barbitúricos incluyen alcohólicos y personas que abusan tanto de opioides como de otras sustancias sedativas-hipnóticas y anfetaminas. La característica de la dependencia de barbatúricos incluye:

- a) un fuerte deseo o necesidad a continuar tomando la droga
- b) una tendencia a aumentar la dosis
- c) dependencia psíquica relacionada a lo que subjetivamente piensa la persona de cual es el efecto de la droga.
- d) dependencia física sobre el efecto de droga, requiriendo su presencia para mantenimiento de la homeostasis y resultando en una característica definitiva y en un síndrome de abstinencia autolimitado cuando la droga es suprimida.

El tratamiento de la dependencia de barbitúricos consiste en una cautelosa y gradual supresión de la droga. Los pacientes con dependencia a los barbitúricos pueden ser tratados por el uso de un número de diferentes regímenes para evitar la brusca supresión. La supresión requiere en todos los casos un extendido período de tiempo.

Los lactantes que presentan dependencia física a los barbitúricos pueden ser tratados por una dosis fenobarbital de 3 a 10 mg/kg/día. Luego de los síntomas de supresión (hiperactividad, disturbios del sueño, temblores e hiperreflexia), la dosificación de fenobarbital deberá ser gradualmente disminuida y completamente suprimida en un período de 2 semanas.

**EMBARAZO:** Se ha determinado que en las mujeres epilépticas tratadas con medicación antiepiléptica, se observa un porcentaje mayor de niños nacidos con malformaciones, que el resto de la población (3% más). Las malformaciones mas comúnmente observadas se encuentran en los frentes labiales y del tipo cardiovascular.

Es raro que ocurran ataques epilépticos en la madre durante el embarazo o cuando ha habido un período anterior de algunos años sin presentar ataques, en esos casos es aconsejable interrumpir gradualmente la medicación antiepiléptica cuando está planeado encarar un embarazo. Si fuera necesario mantener la medicación antiepiléptica, deberá administrarse la menor dosis efectiva para el control de la enfermedad, dado que se producen importantes cambios en la farmacocinética de la droga durante el embarazo.

La interrupción del tratamiento bruscamente por parte de la madre, puede producir una agravación de la enfermedad perjudicando al feto.

**LACTANCIA:** Está desaconsejado porque puede originar sedación y dificultad en la succión del neonato. El Fenobarbital puede provocar un síndrome hemorrágico en las 24 primeras horas de vida del neonato. Como prevención se recomienda un tratamiento previo con vitaminas K1 (10 a 20mg/ 24hs) durante el mes previo al parto, y un aporte previo al parto de 1 a 10 mg por vía IV.

Raramente se observa en el recién nacido un síndrome de severidad moderada de movimientos anormales y succión ineficaz, así también como perturbación del metabolismo fosfo-cálcico y de la mineralización ósea.

#### **INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:**

**ASOCIACIONES DESACONSEJADAS:** El fenobarbital aumenta el catabolismo hepático de los estroprogestagenos y progestagenos utilizados como anticonceptivos, con la posible pérdida de eficacia de los mismos, por lo cual se recomienda el uso de otros métodos para el control de la natalidad.

El consumo de alcohol aumenta el efecto sedante de Fenobarbital, con el consecuente riesgo para la conducción de vehículos y el manejo de maquinarias.

**ASOCIACIONES QUE REQUIEREN EL CONTROL EN SU EMPLEO:** El Fenobarbital, por ser inductor enzimático, produce un aumento del catabolismo de las ciclosporinas. Se recomienda utilizar un ajuste en la dosis con la administración concurrente y también una reducción si se suspende la administración del inductor.

Puede producirse una pérdida de eficacia en los glucocorticoides y mineralocorticoides, por el aumento del catabolismo inducido por el Fenobarbital. Se recomienda un ajuste en la dosificación de los corticoides durante la administración concomitante, y también si se suspende la administración del inductor.

Al igual que otras drogas, la Doxiciclina puede sufrir un mayor catabolismo hepático en pacientes medicados con Fenobarbital. Se recomienda un ajuste en la dosificación de Doxiciclina en la administración concomitante con Fenobarbital.

El uso concomitante de Fenobarbital y Quinidina o Hidroxiquinidina resulta en menores concentraciones plasmáticas de los antiarrítmicos, con la consecuente pérdida de eficacia de estos, debido a un mayor catabolismo inducido por el Fenobarbital. Se recomienda monitorear las concentraciones plasmáticas de los antiarrítmicos y realizar un ajuste en la dosis. Debe tenerse precaución si se suspende la administración del inductor, ya que aumentaría la concentración plasmática del antiarrítmico.

La administración concurrente de Fenobarbital y Acido Valproico puede resultar en un aumento de la concentración plasmática del barbitúrico con las consecuentes manifestaciones de los efectos colaterales del mismo. Se recomienda un estricto control clínico y monitoreo de concentración plasmática de fenobarbital durante los primeros 15 días de tratamiento con ambas drogas.

La administración concurrente de Fenobarbital y anticoagulantes orales, puede resultar en una menor eficacia de estos últimos. Se recomienda el control del tiempo de Protombina y el ajuste de la posología de los anticoagulantes de ser necesario.

El uso de antidepresivos de la familia de la Imipramina, puede favorecer la aparición de crisis convulsivas generalizadas. Debe realizarse un estricto control del paciente y eventualmente aumentar la posología del agente antiepiléptico.

La administración concurrente de Fenobarbital y glucósidos cardiotónicos puede resultar en una disminución de la eficacia del agente cardiotónico, por lo cual se recomienda un estricto control clínico, monitoreo de las concentraciones del agente cardiotónico, ECG, y eventuales ajustes en la dosificación de ser necesario.

La administración concurrente de progabide puede resultar en un aumento de la concentración

plasmática de Fenobarbital, y una posible disminución de la concentración plasmática de progarbide. Se recomienda control clínico del paciente, y vigilar las concentraciones plasmáticas de fenobarbital y de ser necesario ajustar las posologías.

La suplementación del Acido fólico puede resultar en una disminución de los niveles plasmáticos de Fenobarbital. Se recomienda un control de los niveles séricos de Fenobarbital y un eventual ajuste en la dosis durante la suplementación y al suspenderla.

**OTRAS ASOCIACIONES DE IMPORTANCIA CLÍNICA:** La administración de Fenobarbital concurrente a la de Carbamazepina, puede resultar en una disminución progresiva de los niveles séricos de esta última, con la resultante pérdida de eficacia del tratamiento antiepiléptico. Se recomienda controlar las concentraciones séricas.

Fármacos con acción depresora sobre SNC como antidepresivos IMAO A, Anti H1, benzodiacepinas, Clonidina y relacionados, hipnóticos, derivados morfínicos, neurólépticos, tranquilizantes, pueden aumentar la depresión central propia del Fenobarbital por sumatoria de efectos, con consecuencias notables sobre la capacidad para conducir vehículos y manejar maquinaria riesgosa.

En la administración conjunta de Fenobarbital y Fenitoína, el resultado sobre las concentraciones plasmáticas de ambas drogas es imprevisible, siendo mas probable que los niveles de Fenitoína sean los disminuidos. Ambas drogas son inductoras enzimáticas, y es importante un estricto control clínico y monitoreo de las concentraciones plasmáticas de ambos fármacos.

La concentración plasmática de betabloqueantes como Propanolol, Alprenolol, Metaprolol, etc puede ser disminuida por su administración concomitante con Fenobarbital, por un aumento de su catabolismo hepático.

Es importante tener en cuenta que si se suspende la administración de Fenobarbital, la concentración plasmática de otros fármacos administrados concomitantemente con este, puede aumentar, por disminución o desaparición de la inducción de enzimas hepáticas, por lo cual puede requerirse una disminución en la dosis.

#### **REACCIONES ADVERSAS:**

El efecto adverso más frecuente con la administración de Fenobarbital es la sedación. Puede ocurrir depresión mental. La administración prolongada, puede producir deficiencia de folatos, hipocalcemia, raramente se reportó anemia megaloblástica y osteomalacia. También puede producirse dolor de huesos, pérdida de apetito, debilidad muscular, pérdida de peso inusual.

La administración intravenosa puede ser riesgosa y causar hipotensión, shock, broncoespasmo, laringoespasmo y apnea, especialmente si la administración se efectúa demasiado rápido.

**A nivel del SNC:** Sedación residual o "hangover", mareos, letargia, vértigo. Se pueden acentuar disturbios emocionales y fobias. En algunas personas, la administración repetida de Fenobarbital produce excitación más que depresión y el paciente puede parecer estar ebrio. En niños puede presentarse irritabilidad e hiperactividad. Como en otras drogas hipnóticas cuando se administran para el dolor, pueden causar desasosiego, excitación y delirio.

**Respiratorio/Circulatorio:** Depresión respiratoria, apnea, colapso circulatorio.

**Alérgicos:** Hipersensibilidad adquirida a los barbitúricos, que consisten en reacciones adversas especialmente en pacientes que tienen tendencia a padecer asma, urticaria o angiodema.

Entre las reacciones de hipersensibilidad se encuentran: edema de los párpados, de las mejillas, de los labios y dermatitis eritematosas.

Raramente puede causarse dermatitis exfoliativa que puede ser fatal como la del síndrome de Stevens-Johnson o la necrosis epidérmica tóxica.

La erupción de la piel puede ser asociada con fiebre, delirios y marcados cambios degenerativos en el hígado y otros órganos parenquimatosos.

**Otros:** Náuseas y vómitos, dolor de cabeza y osteomalacia. Se han reportado casos de hepatitis y alteraciones en la función hepática. Con el uso prolongado puede producirse daño hepático (que se manifiesta como piel y ojos amarillentos); osteopenia o raquitismo.

**Efectos adversos con una incidencia mayor de 1 en 100 pacientes:** El mas frecuente es la somnolencia que se presenta en 1 a 3 de cada 100 pacientes.

**Efectos adversos con una incidencia menor de 1 en 100 pacientes:**

SNC: agitación, confusión, hiperkinesia, ataxia, depresión del SNC, pesadillas, nerviosismo, alteraciones psiquiátricas, alucinaciones, insomnio, ansiedad, mareos, alteraciones en el pensamiento.

**Respiratorios:** hiperventilación, apnea.

**Cardiovasculares:** bradicardia, hipotensión, síncope.

**Digestivo:** náuseas, vómitos, constipación.

**Otras reacciones:** dolor de cabeza, reacciones en el sitio de inyección, hipersensibilidad, fiebre, daño hepático, anemia megaloblástica seguida al uso crónico de fenobarbital.

#### **POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN:**

##### **FENOBARBITAL COMPRIMIDOS:**

Adultos: como anticonvulsivante, de 60 a 250 mg diarios en una dosis única o dividida.

Pacientes geriátricos o debilitados pueden requerir dosis menores.

Dosis pediátricas usuales: como anticonvulsivante, 1 a 6 mg/kg/día, en una dosis única o dividida. Como medicación preoperatoria, 1 a 3 mg/kg.

**FENOBARBITAL INYECTABLE:** Adultos; como anticonvulsivante, intravenoso, 100 a 320 mg, repitiendo de ser necesario hasta un máximo de 600 mg en un período de 24 hs. Estado epiléptico, por administración intravenosa lenta, de 10 a 20 mg/kg. Repitiendo de ser necesario. Como medicación preoperatoria, vía intramuscular, 130 a 200 mg, de 60 a 90 minutos antes de la intervención quirúrgica. Pacientes geriátricos o debilitados pueden requerir dosis menores.

Dosis pediátricas usuales: Como anticonvulsitante, una dosis inicial de 10 a 20 mg/kg, la dosis de mantenimiento será de 1 a 6 mg/kg/día. Estado epiléptico, 15 a 20 mg/kg administrados vía intravenosa en un período de 10 a 15 minutos. Como sedante, en medicación preoperatoria 1 a 3 mg/kg, 60 a 90 minutos antes de la intervención.

#### **SOBREDOSIFICACIÓN:**

Signos y síntomas: El comienzo de síntomas luego de una dosis tóxica de fenobarbital puede presentarse hasta varias horas luego de la ingestión. Las manifestaciones incluyen: nistagmus, ataxia, depresión del SNC, depresión respiratoria, hipotermia e hipotensión. También pueden encontrarse: Reflejos deprimidos o ausentes y puntos hemorrágicos o eritematosos. Luego de la ingesta masiva de fenobarbital, se presenta edema, colapso circulatorio, pérdida de pulso, paro cardíaco y muerte.

#### **TRATAMIENTO:**

Mantener la vía aérea permeable. Monitorear meticulosamente los signos vitales, los gases en sangre y los electrolitos séricos. Disminuir la absorción de drogas desde el tracto gastrointestinal por la administración de carbón activado. En caso de ser necesario realizar diuresis forzada por alcalinización de la orina o diálisis, asistencia respiratoria, aporte de potasio.

**EN CASO DE INTOXICACIÓN PROVOCADA O ACCIDENTAL COMUNICARSE INMEDIATAMENTE CON EL CENTRO DE INTOXICACIONES DEL HOSPITAL DE NIÑOS DR. RICARDO GUTIERREZ (011) 4962-6666/2297. HOSPITAL POSADAS TEL. (011) 4658-7777 HOSPITAL FERNANDEZ TEL. (011) 4801-5555/7767. CENTRO NACIONAL DE INTOXICACIONES TEL.0800-333-0160**

#### **PRESENTACIONES:**

FENOBARBITAL KLONAL 15mg. Comprimidos: Envases con 30, 500 y 1000 comprimidos; las dos últimas presentaciones para uso hospitalario exclusivo.

FENOBARBITAL KLONAL 100 mg. Comprimidos: Envases con 40, 500 y 1000 comprimidos; las dos últimas presentaciones para uso hospitalario exclusivo.

FENOBARBITAL KLONAL Inyectable: Envases con 5 y 100 ampollas por 2 ml, siendo este último de uso hospitalario exclusivo.

#### **CONSERVACIÓN:**

Conservar a temperatura menor de 30°C, en lugar seco y al abrigo de la luz.

**"ESTE MEDICAMENTO DEBE SER USADO BAJO PRESCRIPCIÓN Y VIGILANCIA MÉDICA Y NO PUEDE REPETIRSE SIN NUEVA RECETA MÉDICA"**

Especialidad medicinal autorizada por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 47.066

Director Técnico: Leonardo Iannello  
Farmacéutico

Fecha de última revisión: 06/1998



Planta: Lamadrid 802 - Quilmes - Pcia. de Bs. As., Argentina.  
C.P. (B1878CZV) Tel. Fax: (54) (11) 4251-5954/5955