



Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

ACIDO TRANEXAMICO

2. VIA DE ADMINISTRACION

ORAL, INTRAVENOSA

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Antihemorrágicos, antifibrinolíticos.
Código ATC: B02AA02.

3.1. Farmacodinamia

El ácido tranexámico ejerce una actividad antihemorrágica mediante la inhibición de las propiedades fibrinolíticas de la plasmina. Se constituye un complejo con el ácido tranexámico y el plasminógeno; el ácido tranexámico se une al plasminógeno cuando se transforma en plasmina.

La actividad del complejo ácido tranexámico-plasmina sobre la actividad de la fibrina es menor que la actividad de la plasmina libre por sí sola. Los estudios in vitro han mostrado que las dosis altas de ácido tranexámico reducen la actividad del complemento.

3.2. Farmacocinética

Absorción

Las concentraciones plasmáticas máximas de ácido tranexámico se obtienen rápidamente después de una infusión intravenosa corta, después de lo cual las concentraciones plasmáticas disminuyen de forma multiexponencial hasta la 6.^a hora. La semivida de eliminación es de 3 horas, aproximadamente.

Distribución

El ácido tranexámico administrado por vía parenteral se distribuye según un modelo bicompartimental. La unión a proteínas plasmáticas del ácido tranexámico es aproximadamente del 3% a los niveles plasmáticos terapéuticos y parece que se explica totalmente por su unión con el plasminógeno. El ácido tranexámico no se une a la albúmina sérica. El volumen inicial de distribución es de aproximadamente 9 a 12 litros. El ácido tranexámico atraviesa la placenta.

El ácido tranexámico difunde rápidamente al líquido articular y a la membrana sinovial. La concentración de ácido tranexámico en otros tejidos es una fracción de la observada en la sangre (en la leche materna, una centésima parte; en el líquido cefalorraquídeo, una décima parte; en el humor acuoso, una décima parte). El ácido





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gov.ve>

tranexámico se ha detectado en el semen, donde inhibe la actividad fibrinolítica, pero no influye en la migración del esperma.

Eliminación

La principal vía de eliminación es la excreción urinaria a través de filtración glomerular. El aclaramiento renal es igual al aclaramiento plasmático (110 a 116 mL /min). La excreción de ácido tranexámico es aproximadamente del 90% en las primeras 24 horas tras la administración intravenosa de 10 mg/kg de peso corporal, Se excreta principalmente en orina como fármaco inalterado. La vida media de eliminación del ácido tranexámico es de aproximadamente 3 horas

Insuficiencia renal

Las concentraciones plasmáticas aumentan en los pacientes con insuficiencia renal.

Edad pediátrica (≤ 18 años)

No se ha realizado ningún estudio farmacocinético específico en niños.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Los datos pre-clínicos no revelan ningún riesgo especial para los seres humanos de acuerdo con estudios convencionales de farmacología de seguridad, toxicidad de dosis repetidas, genotoxicidad, potencial carcinógeno y toxicidad para la reproducción.

Se ha observado actividad epileptogénica en animales con el uso de ácido tranexámico por vía intratecal.

4. INDICACIONES

Prevención y tratamiento de las hemorragias por hiperfibrinolisis o hiperfibrinogenólisis.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos

Vía IV: De 25 a 50 mg/kg/día, administrar en una proporción de 1 mL (100 mg) por minuto.

Vía oral: De 2 a 3 tabletas (1 - 1,5 g), cada 8 o 12 horas.

5.2. Dosis máxima

La dosis recomendada. El uso en exceso o más frecuente no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

En la insuficiencia renal que conduce a un riesgo de acumulación, el uso de ácido tranexámico está contraindicado en los pacientes con insuficiencia renal grave.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gov.ve>

En los pacientes con insuficiencia renal leve a moderada, las dosis de ácido tranexámico deben reducirse de acuerdo con el nivel de creatinina sérica:

Creatinina sérica		Dosis Intravenosa	Administración
$\mu\text{mol/l}$	mg/10 ml		
120 - 249	1,35 – 2,82	10 mg/kg de peso	Cada 12 horas
250 - 500	2,82 – 5,65	10 mg/kg de peso	Cada 24 horas
> 500	> 5,65	5 mg/kg de peso	Cada 24 horas

Insuficiencia hepática

En los pacientes con insuficiencia hepática no es necesario un ajuste de la dosis.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No es necesario reducir la dosis a menos que haya evidencia de insuficiencia renal.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

La forma inyectable se puede mezclar con la mayoría de las soluciones para infusión. La mezcla se debe preparar el mismo día en que se va a administrar.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

- Muy frecuentes ($\geq 1/10$)
- Frecuentes ($\geq 1/100$, $< 1/10$)
- Poco frecuentes ($\geq 1/1000$, $< 1/100$)
- Raras ($\geq 1/10.000$, $< 1/1.000$)
- Muy raras ($< 1/10.000$)
- Frecuencia no conocida (notificadas durante uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos del sistema inmunológico

Frecuencia no conocida: Reacciones de hipersensibilidad incluyendo anafilaxia.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuencia no conocida: Convulsiones, especialmente en caso de uso incorrecto.

Trastornos oculares

Frecuencia no conocida: Trastornos visuales, incluyendo alteración de la visión del color.

Trastornos vasculares

Frecuencia no conocida: Malestar general con hipotensión, con o sin pérdida de conciencia (por lo general después de una inyección intravenosa demasiado rápida,





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

excepcionalmente tras la administración oral). Embolismo arterial o venoso en cualquier lugar.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Diarrea, vómitos, náuseas.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Dermatitis alérgica.

"Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita los profesionales de la salud y a la comunidad en general a notificar cualquier sospecha de reacción adversa asociada a su uso al Centro Nacional de Vigilancia Farmacológica (CENAVIF) del Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel", a través de la página web: <http://www.inhrr.gob.ve/ram1.php>".

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

No se han realizado estudios de interacción. El tratamiento simultáneo con anticoagulantes debe llevarse a cabo bajo la estricta supervisión de un médico con experiencia en este campo. Los medicamentos que actúan sobre la hemostasia deben administrarse con precaución en los pacientes tratados con ácido tranexámico. Existe un riesgo teórico de aumento del potencial de formación de trombos, como con los estrógenos. De forma alternativa, la acción antifibrinolítica del medicamento puede ser antagonizada con fármacos trombolíticos.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Deberán seguirse estrictamente las indicaciones y forma de administración indicados: La inyección intravenosa se debe administrar muy lentamente, no se debe administrar por vía intramuscular.

Se han notificado casos de convulsiones en asociación con el tratamiento con ácido tranexámico, en la cirugía de injerto de derivación arterial coronaria (IDAC), la mayoría de estos casos se notificaron después de la administración intravenosa (IV) de dosis altas. Con el uso de las dosis inferiores recomendadas de ácido tranexámico, la incidencia de convulsiones postoperatorias fue la misma que en los pacientes no tratados.

Se debe prestar atención a posibles alteraciones visuales, que incluyen insuficiencia visual, visión borrosa y alteración de la visión del color y si es necesario debe interrumpirse el tratamiento.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

En caso de hematuria procedente del tracto urinario superior, existe un riesgo de obstrucción uretral.

Antes del uso del ácido tranexámico, se deben considerar los factores de riesgo de enfermedad tromboembólica. En pacientes con antecedentes de enfermedades tromboembólicas o en aquellos con mayor incidencia de acontecimientos tromboembólicos en sus antecedentes familiares (pacientes con un alto riesgo de trombofilia), la solución inyectable de ácido tranexámico se debe administrar solamente si hay una clara indicación médica después de consultar a un médico con experiencia en hemostasia y bajo estricta supervisión médica.

Los pacientes con coagulación intravascular diseminada (CID) no deben, en la mayoría de los casos, tratarse con ácido tranexámico. Si se administra ácido tranexámico, se debe limitar a aquellos casos en los que haya una activación predominante del sistema fibrinolítico con hemorragia aguda grave. En estos casos agudos, una dosis única de 1 g de ácido tranexámico generalmente es suficiente para controlar el sangrado. En caso de CID, sólo se debe considerar la administración de ácido tranexámico cuando se disponga de las instalaciones de laboratorio de hematología y la experiencia necesaria.

Se debe prestar atención a posibles alteraciones visuales, que incluyen insuficiencia visual, visión borrosa y alteración de la visión del color y si es necesario debe interrumpirse el tratamiento. Si la solución inyectable de ácido tranexámico se utiliza de forma continua a largo plazo, deben realizarse exploraciones oftalmológicas regulares (exámenes oculares, incluyendo agudeza visual, visión del color, fondo de ojo, campo visual, etc.). En caso de cambios oftalmológicos patológicos, en particular enfermedades de la retina, el médico debe decidir en cada caso individual, previa consulta a un especialista, la necesidad del uso a largo plazo de la solución inyectable de ácido tranexámico.

El ácido tranexámico se debe administrar con precaución en pacientes que reciben anticonceptivos orales, debido al riesgo aumentado de trombosis.

8.2. Embarazo

No se recomienda el uso de ácido tranexámico durante el primer trimestre del embarazo. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia a menos que a criterio médico el balance riesgo-beneficio sea favorable.

8.3. Lactancia

El ácido tranexámico se excreta en la leche materna humana. En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No se han realizado estudios de los efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas.





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad al ácido tranexámico o a alguno de los excipientes de la formulación.
Trombosis aguda arterial o venosa, embolia pulmonar, trombosis cerebral.
Enfermedad fibrinolítica después de coagulopatía de consumo, excepto en aquellos con activación predominante del sistema fibrinolítico con hemorragia aguda grave.
Insuficiencia renal grave.
Defectos de la visión.
Antecedentes de convulsiones.
Hemorragia subaracnoidea.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

No se ha informado de ningún caso de sobredosis. Los signos y síntomas pueden incluir náuseas, diarrea, mareos, cefalea, hipotensión y convulsiones. Se ha observado que las convulsiones tienden a aparecer con mayor frecuencia con las dosis crecientes.

10.2. Tratamiento

Si se justifica aplicar medidas de descontaminación.
El tratamiento de la sobredosis se basa en la aplicación de medidas de apoyo.
Mantener la diuresis adecuada.

11. TEXTO DE EMPAQUE Y ETIQUETA

VIA DE ADMINISTRACION: Oral.

INDICACIONES Y POSOLOGIA: A juicio del facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica. No se administre durante el embarazo o cuando se sospeche su existencia, a menos que el médico lo indique. En caso de ser imprescindible su uso por no existir otra alternativa terapéutica, suspéndase la lactancia mientras dure el tratamiento.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

No exceda la dosis prescrita

Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES:

Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA





Instituto Nacional de Higiene "Rafael Rangel"

Ciudad Universitaria UCV - Los Chaguaramos
Caracas - República Bolivariana de Venezuela - C.P. 1041
Teléfono: (0058 212) 219 1622
<http://www.inhrr.gob.ve>

USO HOSPITALARIO

VIA DE ADMINISTRACION: Intravenosa.

INDICACION Y POSOLOGIA: A juicio del Facultativo.

ADVERTENCIAS:

Producto de uso delicado que debe ser administrado bajo estricta vigilancia médica.
Antes de administrar este producto, leer el prospecto interno.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Octubre de 2022



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

