



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

TAMSULOSINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

VIA ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Drogas usadas en la hipertrofia prostática benigna

Código ATC: G04CA.02

3.1. Farmacodinamia

La tamsulosina es un derivado sulfamoiil-fenetilamida con actividad bloqueante selectiva y competitiva de los receptores adrenérgicos del sub-tipo alfa-1A, cuya distribución en el organismo es particularmente abundante en la próstata y el trigono vesical. Como el tono de la musculatura lisa en ambos está mediado por la estimulación nerviosa simpática del estos receptores, en pacientes con hipertrofia prostática benigna (HPB) y obstrucción urinaria asociada la interrupción de dicha influencia por bloqueo del receptor alfa-1A provoca la relajación de la fibra prostática y uretral, dando lugar con ello a una mejora significativa del flujo urinario y al consecuente alivio sintomático de la condición.

La experiencia clínica demuestra que su uso en pacientes con HPB reduce o retrasa considerablemente la necesidad de cirugía o cateterización.

3.2. Farmacocinética

Tras su administración por vía oral en ayunas la tamsulosina se absorbe casi completamente en el tracto gastrointestinal y genera concentraciones séricas pico en 4-5 horas que alcanzan el estado estable a los 5 días con la dosificación continua. Los alimentos enlentecen su absorción y reducen su biodisponibilidad.

Se une a proteínas plasmáticas en un 94-99% y exhibe un volumen de distribución aparente de 16 L.

Se metaboliza extensamente en el hígado vía citocromo P-450 (por las isoenzimas CYP3A4 y CYP2D6, principalmente) y posterior conjugación con ácido glucurónico y sulfato, dando lugar a productos parcialmente inactivos que se excretan, junto a menos de un 10% de tamsulosina inalterada, en un 76% por la orina y 21% con las heces. Su vida media de eliminación en sujetos sanos es de 9-13 horas y de 14-15 horas en pacientes con HPB.

En pacientes con insuficiencia renal, incluso grave, o con disfunción hepática leve a moderada los parámetros farmacocinéticos de la tamsulosina no se





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>

alteran en forma sustancial. No se ha estudiado pacientes con insuficiencia hepática severa.

Aunque en los estudios clínicos los ancianos muestran niveles plasmáticos y valores de vida media de tamsulosina superiores a los observados en sujetos jóvenes, no se reportan diferencias de eficacia o seguridad entre ambos grupos.

3.3. Información pre-clínica sobre seguridad

Los ensayos de carcinogenicidad con tamsulosina mostraron una incidencia elevada de neoplasias mamarias (fibroadenomas y adenocarcinomas) en ratas y ratones hembras con niveles de exposición sistémica equivalentes a 3 y 8 veces, respectivamente, los generados por la dosis terapéutica máxima recomendada en humanos (DMRH). Dichos hallazgos fueron atribuidos a un efecto hiperprolactinéxico de la tamsulosina en roedores cuya relevancia como factor de riesgo en humanos es desconocido.

En las pruebas de genotoxicidad realizadas con tamsulosina (ensayos in vivo de micronúcleos de ratón y de intercambio de cromátidas hermanas y ensayos in vitro de mutación bacteriana de Ames, de aberración cromosómica en células ováricas de hámster chino o linfocitos humanos, de reparación y síntesis no programada de ADN y de timidina-quinasa en células de linfoma de ratón) los resultados fueron negativos.

Los estudios de reproducción en conejos y ratas preñadas expuestas a dosis de tamsulosina equivalentes a 8 y 50 veces, respectivamente, la DMRH no reveló teratogenicidad.

Los estudios de fertilidad en ratas con niveles de exposición a tamsulosina equivalentes a 50 veces la DMRH reportaron una disminución de la capacidad reproductiva en los machos que se consideró resultante de un efecto del fármaco en la formación de un tapón vaginal posiblemente debido a cambios en el contenido espermático o por trastornos eyaculatorios. Se evidenció también una reducción de la fertilidad en las hembras, aparentemente asociada a alteraciones de la fertilización.

4. INDICACIONES

Tratamiento de la hiperplasia prostática benigna en casos en los que la cirugía no está indicada.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos: 0.4 mg una vez al día.

5.2. Dosis máxima diaria

Adultos: 0.4 mg una vez al día.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





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>

5.3. Dosis en pacientes especiales

Insuficiencia renal: No se requieren ajustes de dosificación.

Insuficiencia hepática: En pacientes con disfunción leve a moderada, no se requieren ajustes de dosificación. En presencia de insuficiencia grave su uso está contraindicado.

Ancianos: No se requieren ajustes de dosificación.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Cápsulas o comprimidos de liberación modificada:

Administrar por vía oral con agua, fuera de las comidas (1 hora antes ó 2 horas después) y a la misma hora del día durante todo el tratamiento. La unidad posológica debe tragarse entera, sin masticar, triturar o fraccionar.

6. REACCIONES ADVERSAS

Las reacciones adversas se han clasificado por su frecuencia en:

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

Trastornos gastrointestinales

Poco frecuentes: Náuseas, vómito, diarrea, estreñimiento.

Frecuencia no conocida: Boca seca.

Trastornos cardiovasculares

Poco frecuentes: Palpitaciones, hipotensión postural.

Frecuencia no conocida: Fibrilación atrial, arritmia, taquicardia, dolor de pecho.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Mareo.

Poco frecuentes: Cefalea.

Raras: Síncope.

Frecuencia no conocida: Somnolencia, insomnio, disminución de la libido.

Trastornos respiratorios

Poco frecuentes: Rinitis.

Frecuencia no conocida: Epistaxis, disnea, sinusitis, incremento de la tos.





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>

Trastornos músculo-esqueléticos

Frecuencia no conocida: Dolor de espalda.

Trastornos oculares

Frecuencia no conocida: Trastornos visuales, visión borrosa, síndrome de iris flácido intraoperatorio (durante cirugía de catarata y glaucoma).

Trastornos del aparato reproductor y de la mama

Muy frecuentes: Trastornos eyaculatorios, eyaculación retrógrada, eyaculación fallida.

Muy raras: Priapismo.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Erupción, prurito, urticaria.

Muy raras: Síndrome de Stevens-Johnson.

Frecuencia no conocida: Eritema multiforme, dermatitis exfoliativa.

Trastornos del sistema inmunológico

Raras: Angioedema.

Trastornos generales

Poco frecuentes: Astenia.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Algunos inhibidores de CYP3A4 (como ketoconazol y cimetidina) pueden reducir el metabolismo de la tamsulosina y, como resultado, incrementar sus niveles séricos.

El uso concomitante de tamsulosina y otros bloqueantes alfa-adrenérgicos (como prazosina o terazosina) puede dar lugar a hipotensión sintomática por efectos aditivo.

Su uso en combinación con fármacos inhibidores de fosfodiesterasa-5 (como sildenafil y similares) puede aumentar el riesgo de hipotensión.

Resultados de estudios in vitro sugieren que la warfarina y el diclofenaco podrían incrementar la eliminación de la tamsulosina.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.





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>

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Antes de iniciar un tratamiento con tamsulosina y periódicamente durante el mismo se debe examinar al paciente y descartar la posibilidad de cáncer de próstata u otras condiciones urológicas que pudiesen causar síntomas similares o parecidos a los de la hipertrofia prostática benigna.

Dado que con el uso de tamsulosina se han descrito casos de hipotensión ortostática, mareos y (en raras ocasiones) síncope, los pacientes deben ser informados de su posibilidad y advertidos sobre la inconveniencia de conducir vehículos u operar maquinarias durante el tratamiento, o realizar actividades que pudiesen provocar algún accidente si se presentan dichas reacciones.

Se debe advertir a los pacientes la importancia de procurar atención médica si se presenta una erección dolorosa y con duración superior a 4 horas (priapismo), dado que si no es tratada inmediatamente podría mantenerse y ocasionar daño tisular del pene y pérdida permanente de la potencia sexual.

Durante cirugías de catarata o glaucoma en pacientes que están siendo o han sido tratados con tamsulosina se ha observado síndrome de iris flácido intraoperatorio (SIFI), una variante del síndrome de pupila pequeña. Dado que no se conoce el tiempo que debe transcurrir entre la cirugía y la suspensión previa del medicamento para evitar su ocurrencia, se recomienda no iniciar un tratamiento con tamsulosina en pacientes que tengan previsto en el corto o mediano plazo someterse a una cirugía de cataratas o glaucoma. De ser necesaria la intervención en pacientes que para el momento reciben o recibieron anteriormente tamsulosina, el cirujano oftalmólogo deberá estar en conocimiento de ello a objeto de tomar las medidas pertinentes (como el uso de ganchos de iris, anillos dilatadores del iris o sustancias viscoelásticas) para minimizar las complicaciones del SIFI si llegare a presentarse.

No se ha estudiado la eficacia y seguridad de la tamsulosina en niños y adolescentes.

8.2. Embarazo

El producto no está indicado para uso en mujeres.

8.3. Lactancia

El producto no está indicado para uso en mujeres.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a la tamsulosina o a los excipientes de la fórmula.

Insuficiencia hepática severa.



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"





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>

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis de tamsulosina puede ocasionar hipotensión cuya severidad dependerá de la cantidad ingerida.

10.2. Tratamiento

Tratamiento sintomático y de soporte. En caso de hipotensión severa practicar medidas de estabilización (posición Trendelenburg, administración de fluidos IV o uso de agentes vasopresores, según la circunstancia). Debido a la elevada unión a proteínas del fármaco, la diálisis resulta inefectiva.

11. TEXTOS DE ESTUCHES Y ETIQUETAS

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 exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

Contraindicaciones: Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA



Gobierno Bolivariano
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la Salud

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

