



1. NOMBRE DEL PRINCIPIO ACTIVO

ALFUZOSINA

2. VIA DE ADMINISTRACION

ORAL

3. PROPIEDADES FARMACOLOGICAS

Grupo farmacoterapéutico: Fármacos usados en la hipertrofia prostática benigna. Antagonistas de los receptores alfa-adrenérgicos.
Código ATC: G04CA01.

3.1. Farmacodinamia

La alfuzosina es un derivado quinazolina con actividad bloqueante selectiva de los receptores adrenérgicos alfa-1 postsinápticos. Como el tono de la musculatura lisa a nivel de la próstata, cuello vesical y uretra prostática está mediado por la estimulación nerviosa simpática de estos adreno-receptores, en pacientes con hipertrofia prostática benigna y obstrucción infravesical asociada la interrupción de dicha influencia por bloqueo del receptor alfa-1 provoca la relajación de la fibra, dando lugar con ello a una mejora significativa del flujo urinario y al consecuente alivio sintomático de la condición.

3.2. Farmacocinética

Absorción / Distribución

Tras su administración por vía oral como tableta de liberación prolongada la alfuzosina se absorbe en el tracto gastrointestinal en un 49% y genera concentraciones séricas pico en 8 horas. Su administración en ayunas reduce la biodisponibilidad en un 50%. Se une a proteínas plasmáticas en aproximadamente un 82 - 90% y exhibe un volumen de distribución aparente de 3,2 L/kg.

Biotransformación / Eliminación

Se metaboliza extensamente en el hígado vía citocromo P-450 (isoenzima CYP3A4, principalmente) dando lugar a productos inactivos que se excretan en un 69% con las heces y 24% por la orina (junto a un 11% de alfuzosina intacta). Su vida media de eliminación es de 10 horas.

Insuficiencia renal

Las variaciones farmacocinéticas en pacientes con insuficiencia renal leve a moderada no son de importancia clínica. No se ha estudiado en pacientes con insuficiencia renal severa.





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>

Insuficiencia hepática

En pacientes con insuficiencia hepática moderada a severa el aclaramiento de alfuzosina se reduce y sus concentraciones séricas se incrementan de 3 a 4 veces en comparación a lo observado en individuos sanos. No se ha estudiado en pacientes con insuficiencia leve.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se han descrito variaciones farmacocinéticas de relevancia clínica.

3.3. Información preclínica sobre seguridad

Los estudios a largo plazo en animales para evaluar el potencial carcinogénico de la alfuzosina mostraron resultados negativos, al igual que las pruebas de mutagenicidad realizadas. En los ensayos de reproducción no se evidenciaron daños fetales, ni alteraciones o trastornos de la fertilidad.

4. INDICACIONES

Tratamiento de la hiperplasia prostática benigna.

5. POSOLOGIA

5.1. Dosis

Adultos

Tabletas o comprimidos de liberación prolongada de 5 mg
una (1) tableta o comprimido (5mg) cada 12 horas.

Tabletas o comprimidos de liberación prolongada de 10 mg
una (1) tableta o comprimido (10 mg) una vez al día.

5.2. Dosis máxima

Las dosis señaladas. El uso de dosis superiores no genera beneficios terapéuticos adicionales y, por el contrario, podría ocasionar efectos adversos.

5.3. Dosis en poblaciones especiales

Insuficiencia renal

En enfermos con insuficiencia renal leve a moderada, como precaución, se recomienda que la posología comience con 5 mg por la noche, que se incrementará a 5 mg dos veces al día, en función de la respuesta clínica, sin exceder de 10 mg/día. No debe administrarse a pacientes con insuficiencia renal severa (aclaramiento de creatinina < 30 mL/min) debido a que no hay datos sobre seguridad clínica disponibles para este grupo de pacientes.





Insuficiencia hepática

No se han descrito pautas especiales de dosificación para pacientes con insuficiencia hepática leve. En pacientes con insuficiencia moderada a severa el uso está contraindicado.

Edad avanzada (≥ 65 años)

No se han descrito pautas especiales de dosificación para estos pacientes. Como precaución habitual cuando se prescribe alfuzosina a pacientes de edad avanzada (mayores de 65 años) o a enfermos hipertensos en tratamiento, se recomienda iniciar con una dosis de 1 comprimido por la noche, que se incrementará a 1 comprimido dos veces al día de acuerdo con la respuesta clínica, sin exceder de 10 mg/día.

Edad pediátrica (≤ 18 años)

No se ha demostrado la eficacia de alfuzosina en menores de 18 años. Alfuzosina no está indicada para utilizarse en población pediátrica.

5.4. Modo de empleo o forma de administración

Tabletas o comprimidos de liberación prolongada

Administrar por vía oral con agua, con las comidas 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 ($\geq 1/10$)
- 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 el uso post-comercialización y en datos de laboratorio)

Trastornos de la sangre y del sistema linfático

Frecuencia no conocida: Neutropenia, trombocitopenia.

Trastornos psiquiátricos

Poco frecuentes: Somnolencia.

Trastornos del sistema nervioso

Frecuentes: Mareo/desmayo, cefalea.

Poco frecuentes: Síncope.





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 oculares

Poco frecuentes: Visión anómala.

Frecuencia no conocida: Síndrome de iris flácido intraoperatorio.

Trastornos del oído y del laberinto

Poco frecuentes: Vértigo.

Trastornos cardíacos

Poco frecuentes: Taquicardia, palpitaciones.

Muy raras: Aparición, agravamiento o recurrencia de angina de pecho en pacientes con enfermedad coronaria preexistente.

Frecuencia no conocida: Fibrilación auricular.

Trastornos vasculares

Poco frecuentes: Hipotensión postural, rubor.

Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos

Frecuentes: Infección del tracto respiratorio alto, sinusitis, faringitis, bronquitis.

Poco frecuentes: Rinitis.

Trastornos gastrointestinales

Frecuentes: Náuseas, dolor abdominal, dispepsia, constipación.

Poco frecuentes: Diarrea, boca seca, vómitos.

Trastornos hepatobiliares

Frecuencia no conocida: Lesión hepatocelular, enfermedad hepática colestática.

Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo

Poco frecuentes: Erupción, prurito.

Muy raras: Urticaria, angioedema.

Trastornos del aparato reproductor y de la mama

Frecuentes: Impotencia.

Frecuencia no conocida: Priapismo.

Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración

Frecuentes: Astenia.

Poco frecuentes: Malestar general, edema, dolor de pecho.





“Dada la importancia de mantener una supervisión continua de la relación beneficio/riesgo del medicamento, se invita a 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://inhrr.gob.ve/?page_id=4493”.

7. INTERACCIONES

7.1. Con medicamentos, alimentos y bebidas

Los inhibidores potentes de la isoenzima CYP3A4 (como ketoconazol, itraconazol y ritonavir, entre otros) pueden reducir el metabolismo hepático de la alfuzosina y, como resultado, aumentar sus concentraciones séricas y el riesgo de reacciones adversas.

El uso concomitante de alfuzosina y otros bloqueantes alfa-adrenérgicos (como doxazosina, prazosina o terazosina), inhibidores de fosfodiesterasa-5 (como sildenafil y similares), antihipertensivos o nitratos puede dar lugar a hipotensión sintomática.

La coadministración de alfuzosina y medicamentos que prolongan el intervalo QT podría incrementar el riesgo de dicha reacción. Algunos fármacos con ese potencial incluyen: antiarrítmicos clase IA (como quinidina, disopiramida y procainamida) o clase III (como amiodarona y sotalol), antidepresivos (como citalopram, fluoxetina y los tricíclicos), antibióticos macrólidos (como eritromicina y claritromicina), fluoroquinolonas (como ciprofloxacino y moxifloxacino), antimicóticos imidazoles y triazoles (como ketoconazol y fluconazol), antipsicóticos (como haloperidol y clorpromazina), domperidona, litio y ondansetron, entre otros.

El uso de anestésicos generales en pacientes que reciben alfuzosina puede conducir a inestabilidad de la presión sanguínea durante la cirugía.

7.2. Interferencia con pruebas de laboratorio

No se han descrito.

8. ADVERTENCIAS Y PRECAUCIONES

8.1. Generales

Debido a que con el uso de alfuzosina puede ocurrir hipotensión ortostática, mareo y, en raras ocasiones, síncope, los pacientes deben ser informados de tal 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. El riesgo se incrementa con el uso simultáneo de





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>

agentes antihipertensivos o nitratos y en pacientes con hipotensión sintomática o con antecedentes de respuesta hipotensiva pronunciada asociada a medicamentos.

Antes de iniciar un tratamiento con alfuzosina 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.

Durante cirugías de catarata en pacientes que están siendo o han sido tratados con bloqueantes alfa-adrenérgicos se ha observado síndrome de iris flácido intraoperatorio (SIFI), una variante del síndrome de pupila pequeña. Como 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 alfuzosina en pacientes que tengan previsto en el corto o mediano plazo someterse a una cirugía de cataratas. De ser necesaria la intervención en pacientes que para el momento reciben o recibieron anteriormente alfuzosina, 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.

Dado que la alfuzosina ha demostrado potencial para prolongar el intervalo QT en el electrocardiograma, se debe usar con precaución en pacientes con prolongación congénita o adquirida del QT o tratados con medicamentos que producen dicho efecto. Se recomienda evaluar a los pacientes antes de iniciar el tratamiento y periódicamente durante el mismo.

Si durante el uso del producto aparecen síntomas de angina de pecho (o empeoran si ya existían) se debe suspender el tratamiento.

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

Como los pacientes de edad avanzada son más propensos a los efectos adversos de los medicamentos y, por lo general, tienen mayor probabilidad de presentar limitaciones funcionales y depurativas que podrían complicar el tratamiento e incrementar los riesgos, se deben extremar las precauciones al usar en ellos el producto.





8.2. Embarazo

El producto no está indicado para su uso en mujeres.

8.3. Lactancia

El producto no está indicado para su uso en mujeres.

8.4. Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar máquinas

No hay datos disponibles sobre el efecto en la conducción de vehículos.

Es posible que alfuzosina cause vértigo, mareo y/o astenia, sobre todo al principio del tratamiento. Se debe advertir a los pacientes que no conduzcan ni utilicen máquinas si presentan estos síntomas.

9. CONTRAINDICACIONES

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula.

Insuficiencia hepática moderada a severa.

Historia de hipotensión ortostática.

Asociación con otros bloqueantes alfa-adrenérgicos.

Administración conjunta con inhibidores potentes del CYP3A4.

10. SOBREDOSIS

10.1. Signos y síntomas

La sobredosis de alfuzosina 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 (82 - 90%), la diálisis resulta inefectiva.

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 exceda la dosis prescrita.

Manténgase fuera del alcance de los niños.





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>

Antes de administrar este producto, leer prospecto interno.

CONTRAINDICACIONES: Alergia a los componentes de la fórmula.

CON PRESCRIPCION FACULTATIVA

12. FECHA DE ACTUALIZACION DEL TEXTO

Diciembre de 2020



Gobierno **Bolivariano**
de Venezuela

Ministerio del Poder Popular
para la **Salud**

Instituto Nacional de Higiene
"Rafael Rangel"

