

## RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

<b>Nombre del producto:</b>	ÁCIDO TRANEXÁMICO (ÁCIDO TRANEXÁMICO)
<b>Forma farmacéutica:</b>	Inyección IV
<b>Fortaleza:</b>	100 mg/mL
<b>Presentación:</b>	Estuche por 5 ampolletas de vidrio ámbar con 5 mL cada una.
<b>Titular del Registro Sanitario, país:</b>	SGPHARMA PVT.LTD., MUMBAI, INDIA.
<b>Fabricante, país:</b>	SGPHARMA PVT.LTD., MUMBAI, INDIA.
<b>Número de Registro Sanitario:</b>	M-11-147-B02
<b>Fecha de Inscripción:</b>	29 de agosto de 2011
<b>Composición:</b>	
Cada ampolleta contiene:	
Ácido tranexámico	500 mg*
Se adiciona un 3% de exceso	
Agua para inyección c.s.p.	
<b>Plazo de validez:</b>	24 meses
<b>Condiciones de almacenamiento:</b>	Almacenar por debajo de 30 °C. No refrigerar.

### Indicaciones Terapéuticas:

Fibrinólisis local

Por un término corto de uso en la profiláctica y tratamiento en pacientes al riesgo alto de hemorragia pre y postoperatorio en:

Prostatectomía

Conización del cuello uterino

Procedimientos quirúrgicos y extracciones dentales en hemofílicos

Fibrinólisis general

Complicaciones hemorrágicas en asociación con terapia trombolítica.

Hemorragia asociada con la coagulación intravascular diseminada con la activación predominante del sistema fibrinolítico.

### Contraindicaciones:

El ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. se contraindica:

En pacientes con proceso de coagulación intravascular activa (fibrinólisis primaria debe ser diferenciada de la coagulación intravascular diseminada).

En pacientes con defecto adquirido de trastornos visuales (usado como un indicador de toxicidad).

En pacientes con hemorragia subaracnoidea (la ocurrencia potencial de complicaciones isquémicas cerebrales).

Hipersensibilidad al Ácido tranexámico.

Insuficiencia renal severa.

### **Precauciones:**

La dosis de ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. debe reducirse en los pacientes con insuficiencia renal debido al riesgo de acumulación.

Se ha reportado la obstrucción uretral debido a la formación de coágulo en los pacientes con sangramiento del tracto urinario superior en pacientes tratados con ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P.

Trombosis venosa y arterial o tromboembolismo se ha reportado en pacientes tratados con ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. Además, los casos de obstrucción de la arteria central de la retina y de la vena central de la retina se han reportado.

Los pacientes con una historia previa de enfermedad tromboembólica pueden estar en el riesgo aumentado para la trombosis venosa o arterial.

El ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. no debe administrarse concomitantemente con concentrados de Complejo de Factor IX o concentrados de Anti-inhibidor Coagulante, pues el riesgo de trombosis puede aumentarse.

Los pacientes con la coagulación intravascular diseminada (CID), quienes requiere el tratamiento con el ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P., debe estar bajo la vigilancia estricta de un médico experimentado tratando este desorden.

Uso pediátrico:

La droga ha tenido limitado el uso en los pacientes pediátrico, principalmente en relación con la extracción del diente. Los datos limitados sugieren que las instrucciones de dosificación para niños puedan usarse para pacientes pediátricos que necesitan terapia de Ácido tranexámico.

Geriátricos:

Estudios apropiados realizados no han demostrado problemas geriátricos-específicos que limitarían la utilidad de Ácido tranexámico en el anciano.

### **Advertencias especiales y precauciones de uso:**

Las áreas focales de degeneración de la retina han desarrollado en gatos, perros y ratas seguida las dosis oral o intravenosa de Ácido tranexámico a las dosis entre 250 a 1600 mg/kg/día (6 a 40 veces la dosis humana usual recomendada) desde 6 días a 1 año. La incidencia de tales lesiones ha variado de 25 % a 100 % de los animales tratados y ha estado relacionada con la dosis. A dosis más baja algunas lesiones han parecido ser reversibles.

Los datos limitados en los gatos y conejos mostraron los cambios de la retina en algunos animales con las dosis tan bajo como 126 mg/kg/día (sólo aproximadamente 3 veces la dosis humana recomendada) administrada durante varios días a dos semanas.

En ensayos clínicos ningún cambio de la retina se ha reportado o se ha notado en los exámenes del ojo en pacientes tratados con Ácido tranexámico durante semanas a meses.

Sin embargo, las anomalías visuales, a menudo pobremente caracterizada, representa la reacción adversa el reporte postcomercialización más frecuentemente reportado en Suecia. Para pacientes que serán tratados continuamente por más de varios días, un examen oftalmológico como agudeza visual, fondo de ojo, entre otros se aconseja, antes de comenzar y a intervalos regulares durante el curso de tratamiento. El Ácido tranexámico debe discontinuarse si se encuentran cambios en los resultados del examen.

### **Efectos indeseables:**

Las perturbaciones gastrointestinales (náusea, vómitos, diarrea) pueden ocurrir pero desaparece cuando la dosificación es reducida. Se han reportado desvanecimiento e hipotensión de vez en cuando. La hipotensión se ha observado cuando la inyección IV es demasiado rápida. Para evitar esta respuesta, la solución no debe inyectarse más rápidamente que 1 mL por minuto.

### **Posología y modo de administración:**

Administración:

Por inyección intravenosa lenta.

Instrucciones para el uso de la ampolla:

La ampolla usada en este producto está equipada con un sistema de apertura U.P.C (Un punto de corte). Ningún filo de ampolla es necesario para abrir la ampolla. El cuello de la ampolla es grabado con un punto de constricción. Un punto coloreado en la cabeza de la ampolla ayuda a orientar la ampolla. Tomar la ampolla y colocarla por el punto coloreado. Permita que la solución fluya a la cabeza abajo por agitación o golpe ligero. La ampolla se abre fácilmente por colocación del pulgar en el punto coloreado y presionar ligeramente hacia abajo como se muestra.

Dosis:

La administración intravenosa solo es necesaria si es difícil dar las dosis adecuadas por la vía oral.

La dosis estándar recomendada es de 2-3 tabletas de 0.5 g. Para la vía intravenosa la dosis normal recomendada es de 5-10 ml por la inyección intravenosa lenta a una velocidad de 1 ml/minuto, dos a tres veces al día. Para las indicaciones listadas debajo las dosis siguientes se recomiendan.

Prostatectomía:

De 5-10 ml por inyección intravenosa lenta cada ocho horas (la primera inyección es dada durante la operación) durante los primeros tres días después de la cirugía; Después 1 - 1.5 g por vía oral tres o cuatro veces al día hasta que la hematuria macroscópica no está presente.

Menorragia:

1-1.5 g por vía oral tres o cuatro veces al día por tres o cuatro días. La terapia de ácido tranexámico es iniciada cuando el sangramiento es abundante.

Epistaxis:

1.5 g oral tres veces al día por 4 a 10 días. El ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. puede aplicarse tópicamente en la mucosa nasal de pacientes que padecen epistaxis. Esto puede hacerse empapando una tira de gasa en la solución, y condensando la cavidad nasal.

Hematuria:

1-1.5 g por vía oral 2 - 3 veces al día hasta que la hematuria macroscópica no está presente.

Conisación del cuello del útero:

1.5 g por vía oral 3 veces al día por 12 a 14 días post-operatorio.

Cirugía dental en los pacientes con coagulopatías:

Inmediatamente antes de la cirugía, 10 mg por kg de peso debe darse intravenosamente. Después de la cirugía, 25 mg por kg de peso corporal es dado oralmente tres o cuatro veces al día por seis a 8 días. Podría ser necesario administrar el concentrado de factor de la coagulación.

Fibrinólisis general:

1.0 g (10 ml) por inyección intravenosa lenta tres a cuatro veces al día. Con fibrinólisis en conjunción con el diagnóstico, la coagulación del intravascular aumentada es decir el síndrome del desfibrilación, un anticoagulante como la heparina puede darse con precaución.

Edema angioneurotico hereditario:

De 1-1.5 g por vía oral dos o tres veces al día como tratamiento intermitente o continuo dependiendo de si el paciente tiene presencia o no de los síntomas.

Insuficiencia renal:

Para los pacientes con la función renal dañada, las dosificaciones siguientes se recomiendan:

<b>Creatinina Sérica (micromol/L)</b>	<b>Dosis IV</b>	<b>Dosis Oral</b>	<b>Dosis frecuente</b>
120-249	10 mg/kg	15 mg/kg	Dos veces al día
250-500	10 mg/kg	15 mg/kg	Dos veces al día
>500	5 mg/kg	7.5 mg/kg	Dos veces al día

Niños:

La experiencia clínica con el ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. en los niños con hemorragia menores 15 años de edad no está disponible.

**Interacciones con otros productos medicinales y otras formas de interacción:**

Debido a que están disponibles los datos limitados en la co-administración de productos complejos protrombina altamente activado y agentes antifibrinolítico, el complejo anti-inhibidor coagulante no será usado concomitantemente con el Ácido tranexámico. El Ácido tranexámico puede mezclarse con la mayoría de las soluciones como electrólito, carbohidrato, aminoácido, y soluciones del dextrano. Es compatible con heparina. La droga no debe mezclarse con transfusión de sangre o con soluciones de infusión que contienen penicilina.

La terapia concomitante de clorpromazina y Ácido tranexámico en la hemorragia subaracnoidea se ha reportado para producir vasoespasmo cerebral e isquemia cerebral, y posiblemente una reducción en el flujo de sangre cerebral. Las propiedades simpaticomimética de ambas drogas pueden haber contribuido al desarrollo de vasoespasmo e isquemia cerebral en estos pacientes. Es mejor evitar la combinación durante el tratamiento de hemorragia subaracnoidea.

**Uso en embarazo y lactancia:**

Embarazo: Categoría B

No hay estudios adecuados y bien controlados en mujeres embarazadas. Sin embargo, el ácido tranexámico se conoce que atraviesa la placenta. Aparece en sangre del cordón a las concentraciones aproximadamente igual a la concentración materna. Debido a los estudios de reproducción en animales no siempre son predictivos de la respuesta humana, esta droga sólo debe usarse durante el embarazo si se necesita claramente.

Madres lactantes:

El Ácido tranexámico está presente en la leche materna a una concentración alrededor de una centésima de los correspondientes niveles de suero. La precaución debe ejercerse cuando el ÁCIDO TRANEXÁMICO INYECCIÓN B.P. se administra a una mujer lactante.

### **Efectos sobre la conducción de vehículos/ maquinarias:**

No procede

### **Sobredosis:**

Envenenamiento, síntomas, tratamiento de emergencia y antídotos:

No se ha reportado ningún caso de sobredosis. Los síntomas pueden ser náusea, mientras vómitos, síntomas ortostáticos y/o hipotensión. Mantenga una toma alta de fluido para promover la excreción renal.

### **Propiedades Farmacodinámicas:**

El Ácido tranexámico es un inhibidor competitivo de activación del plasminógeno y a muy altas concentraciones un inhibidor no competitivo de plasmina, implicando así que el Ácido tranexámico interfiera con el proceso fibrinolítico en la misma manera como el Ácido aminocaproico. El Ácido tranexámico es aproximadamente 10 veces más potente "in Vitro" que el Ácido aminocaproico.

El Ácido tranexámico se enlaza considerablemente más fuertemente que el Ácido aminocaproico a ambos sitios fuertes y débiles de la molécula del plasminógeno en una proporción que corresponde a la diferencia en la potencia entre los compuestos.

El Ácido tranexámico en una concentración de 1 mg/ml no agrega las plaquetas "in vitro". El Ácido tranexámico en concentraciones de hasta 10 mg/ml en sangre no tiene influencia sobre el conteo de plaqueta, el tiempo de coagulación o varios factores de coagulación en sangre entera o sangre citrada en sujetos normales. Por otro lado el Ácido tranexámico en concentraciones de 10 mg/ml y 1 mg/ml en sangre prolonga el tiempo del trombina.

El Ácido de tranexámico no se enlaza a la albúmina de suero. El enlaza a proteína plasmática es aproximadamente 3% a niveles plasmáticos terapéuticos y parece ser considerado totalmente por su enlace al plasminógeno.

### **Propiedades Farmacocinéticas (absorción, distribución, biotransformación, eliminación):**

Tres horas después de una sola dosis oral de 25 mg/kg, el nivel pico en suero fue 15.4 g/l y el nivel de humor acuoso fue de 1.6 g/l.

La cantidad total de metabolitos excretada en la orina durante 72 horas es menos de 5 %. Las posibles rutas de biotransformación son acetilación o desaminación seguidos por oxidación o reducción. Después de la administración oral aproximadamente son excretados el 50 % del compuesto relacionado, el 2 % del Ácido dicarboxílico desaminado y 0.5 % del producto acetilado.

El Ácido tranexámico se elimina por la filtración glomerular, la excreción es de aproximadamente 90 % en 24 horas después de la administración intravenosa de 10 mg/kg de peso corporal. Después de la administración oral de 10 a 15 mg/kg de peso corporal de excreción urinaria en 24 horas es 39 % y en 48 horas es 41 %.

El nivel de pico plasmático después de 1 g oralmente es 8 mg/l y después de 2 g, 15 mg/l, ambos obtenidos tres horas después de la dosificación.

Una toma paralela de alimentos no tiene influencia sobre la biodisponibilidad de la droga.

Cuando se administró 36 a 48 horas antes de la cirugía en 4 dosis de 10 a 20 mg/kg, una concentración activa antifibrinolíticamente (10 µg/ml) de Ácido tranexámico permanece en diferentes tejidos por aproximadamente 17 horas y en el suero por siete u ocho horas.

El Ácido tranexámico pasa a través de la placenta. La concentración en sangre del cordón después de una inyección intravenosa de 10 mg/kg a las mujeres podría ser suficientemente alta, aproximadamente 30 µg/ml en suero fetal.

La concentración en la leche materna es aproximadamente una centésima concentración de pico en suero obtenido.

El Ácido tranexámico pasa al semen e inhibe su actividad fibrinolítica pero no influye en la migración de esperma.

El Ácido tranexámico atraviesa la barrera hematoencefálica.

La droga pasa en el humor acuoso, la concentración es aproximadamente uno décimo de la concentración plasmática.

El Ácido tranexámico difunde rápidamente al fluido de la articulación y en la membrana sinovial, y la misma concentración en el fluido articular es obtenida como en el suero. La vida media biológica en el fluido de la articulación es aproximadamente tres horas.

**Instrucciones de uso, manipulación y destrucción del remanente no utilizable del producto:**

Desechar cualquier remanente no utilizado.

**Fecha de aprobación/ revisión del texto:** 31 de enero de 2016.