

RESUMEN DE LAS CARACTERÍSTICAS DEL PRODUCTO

Nombre del producto:	TRAMADOL
Forma farmacéutica:	Inyección IM, IV, SC, Infusión IV
Fortaleza:	100 mg / 2 mL
Presentación:	Estuche por 3 ó 5 ampolletas de vidrio incoloro con 2 mL cada una. Estuche por 25 ó 100 ampolletas de vidrio incoloro con 2 mL cada una.
Titular del Registro Sanitario, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, LA HABANA, CUBA.
Fabricante, país:	EMPRESA LABORATORIOS AICA, LA HABANA, CUBA.
Número de Registro Sanitario:	M-06-127-N02
Fecha de Inscripción:	21 de agosto de 2006
Composición:	
Cada ampolleta contiene:	
Clorhidrato de tramadol	100,0 mg
Acetato de sodio trihidratado	
Agua para inyección	
Plazo de validez:	60 meses
Condiciones de almacenamiento:	Protéjase de la luz.

Indicaciones terapéuticas:

Tratamiento de dolores moderados a severos, de origen agudo o crónico (fracturas, luxaciones, infarto agudo del miocardio, cáncer, etc.).

También puede utilizarse como analgésico preoperatorio, como complemento de anestesia quirúrgica, en el postoperatorio y procedimientos de exploración diagnósticas dolorosas

Contraindicaciones:

No debe administrarse en caso de conocida hipersensibilidad al tramadol o a los componentes de la fórmula.

En intoxicación con alcohol, somníferos, analgésicos y psicofármacos.

Precauciones:

Embarazo: se ha demostrado teratogenicidad en animales, se carecen de estudios adecuados en humanos. Categoría de riesgo: C. Con el uso prolongado, se produce dependencia materna y síndrome de abstinencia neonatal (irritabilidad, llanto excesivo, bostezos, estornudos, aumento de la frecuencia respiratoria, temblores, hiperreflexia, fiebre, vómitos, incremento de las heces y diarrea). El uso de este medicamento durante el embarazo solo se acepta en caso de ausencia de alternativas

terapéuticas más seguras y cuando los beneficios superen los riesgos potenciales para el feto.

Trabajo de parto y parto: no se debe administrar a menos que beneficios superen los riesgos. El uso crónico determina la dependencia física y síntomas de retirada posparto en el recién nacido.

Lactancia materna: el tramadol y su metabolito farmacológicamente activo se excretan con la leche materna. Su seguridad en niños y neonatos no ha sido evaluada, el fármaco no se recomienda para la medicación preoperatoria obstétrica o para analgesia posparto en madres lactantes.

Niño: Los estudios actualmente disponibles avalan que la forma inyectable puede utilizarse en niños (dosis única). No obstante, este fármaco debe administrarse en niños en casos excepcionales y utilizando dosis cuidadosamente calculadas según su masa corporal.

Adulto mayor (todas las vías): en mayores de 75 años puede requerirse ajuste de la dosificación o del intervalo de la dosis, al estar aumentada su vida media de eliminación y sus concentraciones séricas.

Insuficiencia hepática: posee metabolismo hepático; requiere ajuste de la dosis. Insuficiencia renal: eliminación renal; requiere ajuste de la dosis.

Tras la administración repetida durante períodos prolongados y con dosis elevadas, puede ocasionar dependencia. Existe dependencia cruzada entre opiáceos que actúen en los mismos receptores del dolor.

La interrupción brusca de un tratamiento, en pacientes con dependencia física puede precipitar un síndrome de abstinencia. También pueden presentarse síntomas de abstinencia después de la administración de un antagonista opiáceo (naloxona, naltrexona) o de agonista/antagonista (pentazocina) en pacientes con dependencia a opiáceos.

Adenoma de próstata: puede producir retención urinaria.

Asma o EPOC: puede deprimir la función respiratoria y aumentar la resistencia de las vías respiratorias en estos pacientes.

Epilepsia: puede inducir o exacerbar la aparición de episodios convulsivos. Alcoholismo o drogodependientes a opiáceos: debido a la predisposición del paciente a la drogadicción.

Hipotiroidismo: aumento del riesgo de depresión respiratoria y de depresión prolongada del SNC.

Presión intracraneal elevada o lesión cerebral: elevan aún más la presión del LCR; también pueden producir sedación y cambios en las pupilas que pueden enmascarar la evolución clínica de la lesión craneal.

No manejar maquinarias de precisión, no conducir vehículos durante primeros días del tratamiento por riesgo de somnolencia, visión borrosa.

Evitar la ingestión de bebidas alcohólicas.

Advertencias especiales y precauciones de uso:

El tramadol podría alterar las reacciones de los conductores de vehículos y de operadores de máquinas peligrosas o de precisión.

La administración repetida durante períodos prolongados y con dosis elevadas, puede ocasionar dependencia.

No se debe administrar a menores de 12 años.

Efectos indeseables:

Frecuentes: náuseas, vómitos, somnolencia, vértigo, estreñimiento, desorientación, sudoración, euforia.

Ocasionales: cefalea, sequedad de la boca, confusión, mareo.

Raras: especialmente en la administración i.v. y en pacientes estresados físicamente palpitaciones, taquicardia, hipotensión postural o colapso cardiovascular; irritación gastrointestinal (pesadez, sensación de plenitud, hinchazón); reacciones cutáneas (prurito, exantema, urticaria); convulsiones epileptiformes (generalmente tras dosis elevadas o tras administración concomitante de fármacos capaces de reducir el umbral convulsivo); debilidad motora, alteraciones en el apetito; desórdenes en la micción; efectos psíquicos (euforia, disforia, cambios en la actividad, dificultad en la toma de decisiones, perturbación de la percepción); reacciones alérgicas (disnea, broncoespasmo, sibilancias, edema angioneurótico, anafilaxia); elevación de la presión arterial; bradicardia; empeoramiento del asma; depresión respiratoria.

Puede originarse dependencia y síntomas propios del síndrome de abstinencia, similares a los que aparecen con la privación de opiáceos: ansiedad, agitación, nerviosismo, insomnio, hiperquinesia, temblor y síntomas gastrointestinales.

Posología y método de administración:

Vía parenteral (s.c, i.m, i.v, o por infusión: adultos y niños mayores de 12 años: en dolores severos, 100 mg inicialmente, pudiendo administrar durante la hora posterior 50 mg cada 10-20 min., sin sobrepasar una dosis diaria total de 250 mg. Posteriormente, 50 - 100 mg /6-8 horas sin sobrepasar una dosis total de 400 mg.

En dolores moderados, 50-100 mg durante la primera hora. Niños: 1-1,5 mg/kg/d.

Modo de administración: Inyección intramuscular, intravenosa, subcutánea y por infusión i.v.

Modo de preparación:

Es compatible con las siguientes infusiones administradas en frascos de plástico, mezclándolo inmediatamente antes de su uso: cloruro sódico al 0,9%, cloruro sódico al 0,18% y glucosa al 4%, solución de Hartmann, glucosa al 5%.

Velocidad de administración: velocidad de 12 a 24 mg/h después de una inyección inicial i.v. o i.m. de 100 mg.

Interacción con otros productos medicinales y otras formas de interacción:

No administrar concomitantemente con medicamentos antidepresivos (tricíclicos, serotoninérgicos).

Al usarse simultáneamente con otros medicamentos de acción central (tranquilizantes, somníferos), es posible un incremento del efecto depresor o de la toxicidad de inhibidores de MAO.

Carbamazepina: disminución (50 %) de los niveles plasmáticos y la vida media del tramadol, con posible inhibición de su efecto. Digoxina: incremento de la toxicidad a la digoxina.

Quinidina, fluoxetina, paroxetina, amitriptilina: incrementan la concentración del tramadol y reducen la de su metabolito, al ser inhibidores de su metabolito.

Depresores del SNC (alcohol, opioides, anestésicos, fenotiazidas, sedantes, hipnóticos): se incrementa la depresión respiratoria, requiere ajuste de la dosis.

Warfarina: alteración de su efecto, prolongación del tiempo de protrombina.

Uso en Embarazo y lactancia:

Embarazo: se ha demostrado teratogenicidad en animales, se carecen de estudios adecuados en humanos. Categoría de riesgo: C. Con el uso prolongado, se produce dependencia materna y síndrome de abstinencia neonatal (irritabilidad, llanto excesivo, bostezos, estornudos, aumento de la frecuencia respiratoria, temblores, hiperreflexia, fiebre, vómitos, incremento de las heces y diarrea). El uso de este medicamento durante el embarazo solo se acepta en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras y cuando los beneficios superen los riesgos potenciales para el feto.

Trabajo de parto y parto: no se debe administrar a menos que beneficios superen los riesgos. El uso crónico determina la dependencia física y síntomas de retirada posparto en el recién nacido.

Lactancia materna: el tramadol y su metabolito farmacológicamente activo se excretan con la leche materna. Su seguridad en niños y neonatos no ha sido evaluada, el fármaco no se recomienda para la medicación preoperatoria obstétrica o para analgesia posparto en madres lactantes.

Efectos sobre la conducción de vehículos/maquinarias:

No manejar maquinarias de precisión, no conducir vehículos durante primeros días del tratamiento por riesgo de somnolencia, visión borrosa.

Evitar la ingestión de bebidas alcohólicas.

Sobredosis:

Se procederá a la evacuación gástrica mediante el vómito o al lavado gástrico

Se puede revertir la depresión respiratoria con naloxona y las crisis pueden ser controladas con diazepam.

Propiedades farmacodinámicas:

El tramadol es un potente analgésico de acción central, considerado dentro del grupo de los agonistas opiáceos. Tiene una afinidad fundamentalmente para el receptor μ . Adicionalmente, el tramadol activa sistemas descendentes inhibitorios del dolor, ya que inhibe la reutilización de noradrenalina y serotonina. El tramadol tiene un efecto antitusivo.

La potencia del tramadol es reportada por ser de 1/10 a 1/6 de la morfina.

La relación entre las concentraciones séricas y el efecto analgésico es dosis-dependiente, pero varía considerablemente en casos aislados. La concentración sérica efectiva usualmente es 100-300 ng/ml.

La administración oral es igual de eficaz que la aplicación parenteral. Esto lo diferencia positivamente de los demás analgésicos de acción central, cuya administración oral va unida a una considerable pérdida del efecto. Los efectos sobre la circulación mayor, menor y sobre el corazón son escasos y clínicamente poco relevantes, por lo que no existe limitación para su empleo en las enfermedades coronarias acompañadas de dolor. A dosis terapéuticas no causa alteraciones en el aparato respiratorio y la motilidad gastrointestinal no es afectada.

Propiedades farmacocinéticas (Absorción, distribución, biotransformación, eliminación):

Absorción: Más del 90% es absorbido después de la administración oral independientemente de la ingestión concomitante de alimentos ($T_{max}=1.9$ h). La diferencia

entre tramadol absorbido y el no metabolizado disponible es probablemente causado por el bajo efecto del primer paso.

Metabolismo: El tramadol es metabolizado en el hígado, tiene alta afinidad al tejido ($V = 203 \pm 40 \text{ L}$), es principalmente metabolizado por vías de N- y O-desmetilación y conjugación de los productos de la O-desmetilación con ácido glucurónico. La unión a proteínas es de alrededor del 20%.

Vida media: La vida media $t_{1/2}$ es de 6.0 horas ± 1.5 horas. La vida media de los metabolitos es similar a la sustancia intacta. En pacientes geriátricos puede estar prolongada en un factor de 1.4.

Excreción: El tramadol y sus metabolitos son casi completamente excretados por vía renal. En casos de insuficiencia renal y hepática, la vida media podría estar ligeramente prolongada. En pacientes con cirrosis hepática, la vida media de eliminación ha sido determinada de 13.3 ± 4.9 horas (tramadol) y 18.5 ± 9.4 horas (O-desmetiltramadol). En pacientes con insuficiencia renal (depuración de creatinina $< 5 \text{ ml/min}$) los valores son de 11

± 3.2 horas y 16.9 ± 3 horas. En casos extremos 19.5 horas y 43.2 horas, respectivamente.

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

No procede.

Fecha de aprobación/ revisión del texto: 28 de febrero de 2017.