

## **Tramadol, tabletas revestidas**

### **Tramadol, coated tablets**

---

Grupo Empresarial Químico-Farmacéutico QUIMEFA

Empresa Laboratorio Farmacéutico "Reinaldo Gutiérrez"

CATEGORÍA FARMACOLÓGICA: analgésico de acción central

VENTA POR RECETA MÉDICA

DENOMINACIÓN COMÚN INTERNACIONAL (DCI): clorhidrato de tramadol

NOMBRE QUÍMICO: ( $\pm$ ) cis - 2- [(dimetilamino) metil ]-1-(3-metoxifenil) ciclohexanol clorhidrato.

SIMILARES COMERCIALES: Tramal, Ultram, Wintradol, Tradol.

COMPOSICIÓN: cada tableta revestida contiene tramadol 50,0 mg, lactosa monohidratada 92,0 mg; excipiente cs.

#### **FARMACOLOGÍA:**

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

La potencia de 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 por vía oral es igual de eficaz que la aplicación por vía parenteral. Esto lo diferencia positivamente de los demás analgésicos de acción central, cuya administración por vía 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.

#### FARMACOCINÉTICA:

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 el 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 ( $V = 203 \pm 40$  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  $6,0 \pm 1,5$  h. 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  $13,3 \pm 4,9$  h (tramadol) y  $18,5 \pm 9,4$  h (O-desmetiltramadol). En pacientes con insuficiencia renal (depuración de creatinina  $< 5$  mL/min) los valores son de  $11 \pm 3,2$  y  $16,9 \pm 3$  h. En casos extremos 19,5 y 43,2 h, respectivamente.

#### INDICACIONES:

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 posoperatorio y procedimientos de exploración diagnósticos dolorosos.

#### 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. Los pacientes con antecedentes de estados convulsivos, deberán ser seguidos de cerca durante el tratamiento.

#### PRECAUCIONES:

No administrar en pacientes con antecedentes de alergia, dependencia o adicción a opioides.

Debe usarse con cuidado en pacientes con depresión respiratoria, enfermedad respiratoria obstructiva crónica, presión intracraneal aumentada, lesión cerebral, asma crónica, hipotensión, hipotiroidismo, taquicardia supraventricular, hipertrofia prostática o estenosis uretral, enfermedad inflamatoria intestinal grave.

Embarazo: categoría de riesgo C. El uso durante el embarazo solamente será bajo la responsabilidad del médico en caso de ausencia de alternativas terapéuticas más seguras. Si el tratamiento del dolor con opioides está indicado durante el embarazo,

debe ser restringido a la administración de dosis únicas. La administración a largo plazo debe ser evitada, ya que esto podría llevar a síntomas de abstinencia en el neonato. El tramadol, administrado antes o durante el nacimiento, no afecta la contractilidad uterina. En los neonatos podría inducir cambios en la frecuencia respiratoria, los cuales no son relevantes clínicamente.

Lactancia: el tramadol y su metabolito principal se excretan en la leche materna. Después de la administración única de tramadol no es necesario interrumpir la lactancia.

Administrar con precaución a pacientes geriátricos. Se debe administrar con precaución en pacientes con insuficiencia renal y/o hepática severa, previo clearance de creatinina, para saber el grado de daño renal y previo parámetro que dé cuenta de la función hepática.

#### ADVERTENCIAS:

Este producto contiene lactosa, que está contraindicado en pacientes con galactosemia congénita, síndrome de mala absorción a la glucosa y a la galactosa o déficit de lactosa.

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 de edad.

#### INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

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 la MAO.

Carbamazepina: disminución (50 %) de los niveles plasmáticos y la vida media de tramadol, con posible inhibición de su efecto.

Digoxina: incremento de la toxicidad a la digoxina.

Quinidina, fluoxetina, paroxetina, amitriptilina: incrementan la concentración del tramadol.

Depresores del sistema nervioso central (alcohol, opioides, anestésicos, fenotiazidas, sedantes, hipnóticos): se incrementa la depresión respiratoria.

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

#### REACCIONES ADVERSAS:

Frecuentes: náuseas, vómitos, somnolencia, vértigo, estreñimiento, desorientación, sudoración, euforia. Ocasionales: cefalea, sequedad de la boca, confusión, mareo.

Raras: 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); debilidad motora; desordenes en la micción; efectos síquicos (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:

La dosificación debe adaptarse a la intensidad del dolor y a la respuesta individual del paciente.

Adultos y niños mayores de 12 años:

De 50-100 mg cada 6 u 8 h. Si la analgesia requerida es inadecuada después de media hora de la administración de una tableta, se puede dar una segunda dosis o más, sin sobrepasar la dosis total de 250 mg. No administrar una cantidad mayor a 400 mg en el día.

En pacientes con disfunción renal y/o hepática, pacientes debilitados, debe considerarse que la duración del efecto es mayor y que puede deberse a la eliminación mas lenta del fármaco, por lo que los intervalos de dosificación deberán extenderse de acuerdo con los requerimientos del paciente.

El uso prolongado puede desarrollar adicción, por lo que el médico debe decidir la duración del tratamiento y eventualmente la introducción de pausas en este.

#### Sobredosificación:

Se deben observar las normas generales para casos de emergencia consistentes en mantener despejadas las vías respiratorias (aspiración), mantener la respiración y circulación según el cuadro sintomatológico.

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.

#### PRESENTACIÓN:

Estuche con 1 frasco plástico por 60 tabletas revestidas.

Estuche con 2 blísters por 10 tabletas revestidas.

Estuche con 3 blísters por 30 tabletas revestidas.