

TANSULOSINA HCl

BLOQUEADOR ALFA-ADRENÉRGICO PARA TRATAMENTO DA HPB

Propriedades

A **Tansulosina HCl** é um bloqueador dos receptores alfa-adrenérgicos (prazosina, alfuzosina, terazosina, doxazosina), que se caracteriza por sua ação específica e seletiva sobre os chamados α -1-A que estão presentes em número elevado na uretra proximal, estroma e cápsula prostática. Na próstata humana constatou-se que os receptores α -1-A predominam, tanto do ponto de vista numérico (70% do total de receptores α 1) como funcional. Esse agente derivado, benzenosulfonamida metoxibenzeno, bloqueia a ação simpática (contração da musculatura lisa uretroprostática com as conseqüentes alterações da urodinamia) sobre a uretra, colo vesical, músculo liso prostático, e melhora rapidamente toda a fenomenologia clínica (polaquiúria, disúria, urina residual, astenúria). Em nível vascular, como todo bloqueador alfa-adrenérgico, provoca vasodilatação periférica. Sua absorção digestiva após sua administração oral é gradual e completa, apresenta uma elevada biodisponibilidade (100%) e atinge níveis plasmáticos estáveis no quinto dia. Possui uma elevada ligação às proteínas plasmáticas (99%); fixa-se principalmente à glicoproteína ácida α -1 que é um componente das globulinas plasmáticas e cuja concentração aumenta com a idade. Sua biotransformação metabólica é lenta e gradual em nível hepático e sua meia-vida é prolongada (10-13 horas), o que permite uma dose de uma única tomada diária. A **Tansulosina HCl** e seus metabólitos são excretados principalmente na urina (76%), encontrando-se 10% como fármaco inalterado.

Indicações

Hipertrofia prostática benigna (HPB).

Posologia

Aconselha-se 0,4mg administrado pela manhã em uma única tomada diária. Não requer ajuste posológico em pacientes com insuficiência hepática ou renal.

Manipulação

As formas de liberação modificada passíveis de serem manipuladas, pelas farmácias magistrais, com segurança, são as cápsulas com revestimento entérico (liberação retardada) e as de liberação lenta ou slow release (conceito mais amplo e menos restrito do que liberação controlada ou sustentada), estas últimas, obtidas com a utilização de excipientes formadores de matrizes coloidais. Uma liberação lenta do fármaco (não controlada) pode ser obtida em cápsulas com o emprego de polímeros formadores de matriz hidrofílica, tal como o HPMC.

A concentração do polímero utilizado afetará a velocidade de liberação do fármaco.

Para se obter um efeito de liberação lenta em cápsulas deve-se empregar no mínimo 40% do volume da cápsula com o HPMC. Por exemplo, 40% do volume da cápsula 1 corresponde a cerca de 100 mg de HPMC, da cápsula 0 corresponde a cerca 140 mg HPMC, da cápsula 00 corresponde a cerca de 200 mg. O restante do excipiente poderá ser lactose ou celulose microcristalina.

É recomendado que no preparo de cápsulas de liberação lenta, a mistura do pó contendo o ativo, o HPMC e o excipiente sejam tamisados em um tamis de malha fino para se obter um pó muito fino (ex. tamis 80 mesh).

Mas atenção a forma de liberação lenta não é equivalente farmacêutico da especialidade industrializada, não devendo ser comercializada com este apelo. O termo liberação lenta significa que o fármaco é liberado mais lentamente do que a forma convencional de pronta liberação, porém não significa que será liberado na mesma velocidade que de uma determinada especialidade farmacêutica.

De acordo com a United States Pharmacopeia 24 ed. (2000), o termo liberação controlada é sinônimo de liberação sustentada, liberação prolongada ou ação prolongada. Tais termos são empregados para descrever formulações que não liberam o fármaco prontamente após administração, como os denominados medicamentos de liberação convencional e, que apresentam redução na frequência de doses administradas. Formas de liberação controlada são ainda definidas, como aquelas nas quais há redução de pelo menos duas vezes na frequência de dosagem, com aumento na aquiescência do paciente ao esquema terapêutico que possui eficácia melhorada, quando comparado aos sistemas convencionais.



Por outro lado, designa-se como formas de liberação retardada, aquelas que liberam o fármaco em tempo diferente do sistema convencional e em local bem determinado, sendo depois, a liberação praticamente imediata, o que acontece com as formas de liberação entérica (Costa, Lobo, 1999; United States Pharmacopeia 24 ed., 2000).

Ambos sistemas - liberação controlada e liberação retardada - são definidos pelo termo liberação modificada que possui sentido mais amplo: são sistemas cuja característica de liberação do fármaco, em relação ao tempo e/ou local são determinados de acordo com objetivos ou conveniências não oferecidas por sistemas convencionais de liberação do fármaco; como soluções, pomadas e demais formas de pronta dissolução (United States Pharmacopeia 24 ed., 2000).

OBS: Não é necessário corrigir em relação a equivalência, pois para o medicamento de referência é utilizado o **Cloridrato de Tansulosina**.

Superdosagem

Não foram comunicados casos de superdose aguda. Em caso de superdose indicam-se eméticos, lavagem gástrica, laxantes osmóticos.

Reações adversas

Em raras ocasiões podem ocorrer queda da pressão arterial, tontura, debilidade ou síncope. Nos primeiros sinais de hipotensão ortostática o paciente deverá sentar-se ou se deitar até que os sintomas tenham desaparecido.

Interações

A administração simultânea de cimetidina produz uma elevação dos níveis séricos da **Tansulosina HCl** e uma queda da furosemida. O emprego de outros antagonistas adrenérgicos α -1 pode produzir efeitos hipotensores. O diclofenaco e a varfarina podem incrementar a taxa de eliminação de **Tansulosina HCl**.

Contra-indicações

Hipersensibilidade ao fármaco. História de hipotensão ortostática. Insuficiência hepática severa.

Referências Bibliográficas

P.R. Vade-mécum 2003/2004.

Martindale; The complete drug reference; 34 ed.

Andrejus korolkobas, Dicionário Terapêutico, Guanabara, Francisco Faustino de A.

Carneiro de França, Edição 2004/2005.

FERREIRA, Anderson de Oliveira. Guia Prático da Farmácia Magistral. 2ª Ed. Juiz de Fora: 2002.

Última atualização: 09/07/2012 MJD