



Paraclim[®] 1.25 Tibolona

Comprimidos

Industria Uruguaya

Venta Bajo Receta

COMPOSICIÓN

Cada comprimido contiene:
Tibolona 1,25 mg. Excipientes: lactosa anhidra CD 22,15 mg; celulosa microcristalina PH 200 16,10 mg; almidón pregelatinizado 10,00 mg; estearato de magnesio 0,50 mg.

ACCIÓN TERAPÉUTICA

Después de la administración oral de tibolona, ésta se transforma rápidamente en tres metabolitos diferentes que contribuyen al efecto farmacológico de la misma. Dos de los metabolitos ejercen un efecto esencialmente estrogénico, y el tercero al igual que la molécula sin transformar, tiene las mismas propiedades progestágenas. Los efectos de la tibolona son análogos a los de los estrógenos, actuando sobre los sofocos y otros síntomas de la menopausia. La tibolona ejerce también efectos estrogénicos sobre vagina y huesos. Por su efecto progestágeno, la tibolona no estimula el endometrio. Las posibles hemorragias provienen del endometrio atrófico. La tibolona actúa sobre diversos parámetros metabólicos y hematológicos provocando una disminución de las tasas plasmáticas de HDL colesterol, de triglicéridos y de lipoproteína (a) y un aumento de la actividad fibrinolítica de la sangre.

CARACTERÍSTICAS FARMACOLÓGICAS

Farmacocinética y Metabolismo.

- Absorción

La tibolona es rápida y totalmente absorbida por vía oral. Se transforma rápidamente en el metabolito 3 alfa-hidroxi (OH), en el metabolito 3 beta-hidroxi (OH) y en el isómero delta 4. Las concentraciones plasmáticas de tibolona son muy bajas al igual que las del isómero delta 4. Es por ello que es imposible calcular los parámetros farmacocinéticos de estas sustancias. Los dosajes de los metabolitos 3 alfa-hidroxi (OH) y del metabolito 3 beta-hidroxi (OH) mostraron una cinética lineal y se establece que las concentraciones plasmáticas máximas están entre 15 y 5 µg por ml respectivamente al cabo de 1 a 2 horas. La vida media es de alrededor de 6 horas. La tibolona no se acumula. El porcentaje de unión a proteínas plasmáticas es del 96% y tal unión se produce esencialmente con proteínas pequeñas.

- Eliminación

La tibolona es excretada principalmente bajo la forma de metabolitos polares. La tibolona es excretada en baja proporción por la orina y en mayor parte por la bilis y las heces.

INDICACIONES

Tratamiento del síndrome climatérico luego de transcurrido 1 año de una menopausia natural o inmediatamente luego de una menopausia quirúrgica. Prevención de la osteoporosis en mujeres con riesgo de fracturas.

POSOLOGÍA Y FORMA DE ADMINISTRACIÓN

Tomar 1 comprimido por día siempre a la misma hora todos los días durante el tratamiento. Los comprimidos se pueden tomar con un poco de agua u otro líquido. En general los síntomas disminuyen después de unas semanas de tratamiento. Los resultados son óptimos si el tratamiento se sigue durante 3 meses a las dosis recomendadas. La tibolona deberá administrarse por el mínimo periodo de tiempo que la sintomatología lo permita.

En caso de olvido de la toma de un comprimido es necesario tomar-

lo lo antes posible, salvo si el retardo en la toma sobrepasa las 12 hs; en ese caso se omite la toma del comprimido y se sigue con el horario habitual de posología.

CONTRAINDICACIONES

Embarazo y lactancia

Tumores hormonodependientes diagnosticados o sospechados. Enfermedades cardiovasculares o cerebrovasculares, por ejemplo tromboflebitis, accidentes tromboembólicos y antecedentes de este tipo. Hemorragias vaginales de origen indeterminado. Perturbaciones graves de la función hepática. Endometriosis. Hipersensibilidad a la droga o a cualquiera de sus componentes.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS

No se puede usar tibolona como anticonceptivo. Es necesario evaluar el riesgo/beneficio en las situaciones patológicas siguientes: Enfermedades hepáticas. Hipercolesterolemia. El tratamiento con tibolona debe ser comenzado un año después de las últimas reglas naturales. Un empleo más precoz de tibolona puede aumentar la frecuencia de las hemorragias irregulares. Antes de reemplazar otro producto hormonoterápico por tibolona es recomendable inducir una hemorragia por privación utilizando un progestágeno. El desencadenamiento de las hemorragias vaginales (y sangrados eventuales) después del inicio del tratamiento con tibolona pueden explicarse por la presencia de un resto de estrógenos endógenos o exógenos. Si las hemorragias se presentan después de tres meses de tratamiento, se repiten o permanecen es necesario investigar la causa. Como regla general se recomienda efectuar exámenes de control todos los años. Mientras se utilicen esteroides con actividad hormonal, es necesario vigilar particularmente a los pacientes que presenten las siguientes patologías: Trastornos de la función renal, epilepsia, migraña y antecedentes de las mismas, ya que las hormonas esteroideas pueden provocar retención de líquido. Se ha observado aumento en la concentración plasmática del colesterol y modificación de los lípidos sanguíneos durante el tratamiento con tibolona. Se han señalado perturbaciones en el metabolismo glucídico y de la tolerancia a la glucosa durante el tratamiento con tibolona, lo que puede aumentar la necesidad de insulina u otros antihiperbólicos. Miomas uterinos. Si se presentan procesos tromboembólicos o ictericia o si los tests de funcionalidad hepática presentan resultados anormales, es necesario suspender el tratamiento. Debido a que pueden presentarse vértigos durante el tratamiento con tibolona, se debe tener precaución al manejar automóviles o máquinas que requieran concentración.

Embarazo y lactancia.

El uso de tibolona está contraindicado durante el embarazo y la lactancia.

Interacciones

Si bien no se han reportado interacciones entre tibolona y otros productos es necesario tener en cuenta las interacciones teóricamente posibles: Fármacos que producen inducción enzimática como los barbitúricos, carbamazepina, hidantoínas y rifampicina, pueden aumentar la transformación metabólica de la tibolona y alterar su efecto terapéutico. Como la tibolona puede aumentar la actividad fibrinolítica de la sangre (disminución de la concentración de fibrinógeno, aumento de la concentración de Antitrombina III, del plasminógeno y aumento de la actividad fibrinolítica) puede aumentar el efecto de los anticoagulantes.

REACCIONES ADVERSAS

Se pueden presentar hemorragias vaginales sobre todo durante los primeros meses de tratamiento. Se reportaron casos esporádicos con síntomas de dolor de cabeza, migraña, edema, obnubilación, prurito, aumento de peso, náuseas, dolores abdominales, erupciones, depresión, broncoespasmo, y perturbación de la función hepática.

SOBREDOSIFICACIÓN

La toxicidad de la tibolona es muy baja en animales. En casos de una sobredosis accidental se pueden presentar náuseas, vómitos y hemorragias por deprivación en las mujeres. No existen antidotos específicos. Se debe instalar inmediatamente un tratamiento sintomático. Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Htal. de Pediatría "Dr. Ricardo Gutiérrez": (011) 4962-6666/2247

Htal. "A. Posadas": (011) 4654-6648/4858-7777

Centro Nacional de Intoxicaciones: 0800-3330160

MANTENER ÉSTE Y TODOS LOS MEDICAMENTOS FUERA DEL ALCANCE DE LOS NIÑOS.

PRESENTACIÓN

Envase conteniendo 30 comprimidos.

CONSERVACIÓN

Conservar a temperatura no mayor de 30 °C y proteger de la luz.

Esp. Med. aut. por el Ministerio de Salud.

Certificado N° 48.251

Laboratorio Elea S.A.C.I.F. y A. - Sanabria 2353, CABA.

Director Técnico: Isaac J. Nisenbaum, Farmacéutico.

Elaborado en Av. Italia 2599 - C.P. (11600) Montevideo, Uruguay.

Fecha de la última revisión: diciembre / 2005

53823-00 1-pm-w

LI-6160-01

The logo for ELEA, featuring the word "ELEA" in a bold, stylized, italicized sans-serif font. The letters are dark blue with a slight gradient and shadow effect.