

FOLLETO DE INFORMACION MEDICA
TIBOLONA
COMPRIMIDOS 2,5 mg

INSTITUTO DE SALUD PUBLICA
DEPARTAMENTO DE CONTROL NACIONAL
REGISTRO Nº F-1838/99

Tibolona es un agente esteroideal sintético que posee actividades estrogénica y progestágenas y una débil actividad androgénica. Esta combinación de propiedades hormonales, le permite ser de gran utilidad en el tratamiento de síntomas menopáusicos y postmenopáusicos.

El mecanismo de acción de la tibolona en el alivio de los síntomas post menopáusicos puede estar relacionado con el aumento de las secreciones plasmáticas de β -endorfina y β - lipoproteína. Los niveles de ambos péptidos son normalmente más bajos en la postmenopausia, al contrario de lo que ocurre en mujeres fértiles, y el aumento en sus concentraciones plasmáticas inducidas por la tibolona tiene correlación con la disminución de los bochornos térmicos y otros síntomas menopáusicos. La Tibolona parece ser al menos tan efectiva como los estrógenos conjugados en restablecer los niveles circulantes de β - endorfina y β -lipoproteína en mujeres menopáusicas.

Farmacocinética:

La tibolona es rápida y extensamente absorbida, apareciendo en la sangre 30 minutos con posterioridad a su administración oral y alcanzando niveles plasmáticos máximos entre 1,5 y 4 horas. Es metabolizada en el hígado y sus metabolitos son excretados principalmente en las heces y, en menor magnitud, en la orina . Algunos de los metabolitos pueden contribuir a sus efectos biológicos. La vida media de eliminación de la tibolona y sus metabolitos activos es de poco menos de 2 días.

Indicaciones:

Tratamiento de las molestias asociadas a la menopausia natural o quirúrgica.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO

Posología:

La dosis usual es un comprimido de 2,5 mg una vez al día. Por lo general la mejoría de los síntomas se produce en pocas semanas, pero los óptimos resultados se obtienen cuando la terapia se continua durante por lo menos tres meses.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO

2

Contraindicaciones:

- Hipersensibilidad a la Tibolona.
- Cáncer de mamas (conocido o sospechado).
- Neoplasmas hormono dependientes.
- Enfermedades cerebrovasculares.
- Antecedentes de ataque apoplético.
- Enfermedad arterial coronaria.
- Desórdenes tromboembólicos.
- Antecedentes de ictericia colestásica.
- Transtornos hepáticos severos.
- Sangramientos vaginales anormales.
- Embarazo

Reacciones adversas.

Las siguientes reacciones adversas han sido observadas con el uso de tibolona :

- Cefalea y migraña; Mareos; Edema; Cambios de peso corporal; Prurito; Molestias gastrointestinales; Manchas o sangramiento vaginal; alteraciones visuales; aumento del crecimiento del vello facial; alteraciones de la función hepática.

Precauciones y Advertencias

- Tibolona no está prescrito para ser usado como anticonceptivo
- El uso de tibolona debería ser evitado hasta 12 meses después del último sangramiento menstrual natural. Si se hace uso de tibolona antes de este período, la frecuencia de aparición de sangramiento irregular puede aumentar.
- Durante la terapia con tibolona puede presentarse sangramiento vaginal por una aparente estimulación del endometrio debido a producción de estrógenos. Normalmente tal sangramiento es de corta duración . Si éste aparece luego de unos meses de comenzado el tratamiento y es de larga duración o recurrente, debe ser investigado.
- En mujeres que cambian de otra forma de terapia de sustitución hormonal a terapia con tibolona, es aconsejable inducir la hemorragia por supresión con un progestágeno antes de iniciarse el tratamiento con tibolona.
- Si se presentan síntomas de procesos tromboembólicos o si los ensayos de laboratorio de la función hepática son anormales o si aparece ictericia colestásica , el tratamiento debería ser discontinuado.
- Tibolona no debe ser usado en mujeres premenopáusicas debido a que en estudios en animales ha mostrado ser teratogénico

Además, Tibolona deberá administrarse con precaución a pacientes que presentan las siguientes condiciones:

- Hiperlipidemia (especialmente aquellas con colesterol-HDL alto) debido a que Tibolona produce cambios en el perfil lipídico.
- Insuficiencia renal, epilepsia o migraña, debido a que estas condiciones pueden exacerbarse por retención de líquido.
- Diabetes mellitus o alteración el metabolismo de los glúcidos, ya que Tibolona disminuye la tolerancia a la glucosa por lo que puede aumentar la cantidad necesaria de insulina o hipoglicemiantes orales para la mantención de la glucosa dentro de niveles normales.

Interacciones

- Compuestos inductores enzimáticos tales como barbituratos, carbamazepina, hidantoínas, y rifampicina pueden acelerar el metabolismo de la tibolona y disminuir su efecto terapéutico.
- Puede potenciar el efecto de los anticoagulantes debido a una aumentada actividad fibrinolítica sanguínea

Sobredosis:

En caso de sobredosis aguda pueden presentarse síntomas gastrointestinales tales como náuseas y vómitos y hemorragia vaginal. De ser necesario se puede realizar tratamiento sintomático.

Presentación:

Envase de 14 - 28 ó 30 comprimidos

Almacenamiento

Almacenar en lugar fresco, seco, al abrigo de la luz, y fuera del alcance de los niños.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO

BIBLIOGRAFIA

1. Martindale. The Extra Pharmacopoeia 31th Ed. Royal Pharmaceutical Society, London U.K. 1996, pg. 1509.
2. Ellerington MC, Whitcroft SIJ, Whitehead MI: HRT: developments in therapy. Br. Med. Bull 1992, 48: 401 - 425.
3. Genazzani AR, Petraglia F, Facchinetti F et al: Effects of Org OD14 on pituitary and peripheral beta-endorphin in castrate rats and post-menopausal women. Maturitas 1987, Suppl. 1: 35 - 48.
4. Genazzani AR, Petraglia F, Facchinetti F et al: Steroid replacement treatment decreases beta-endorphin and beta-lipotropin plasma levels in postmenopausal women. Gynecol Obstet Invest 1988; 26:153-159.
5. Tax L, Goorissen EM, Kicovic PM: Clinical profile of Org OD 14. Maturitas 1987; Suppl. 1: 3-13
6. Tibolone (Livial) A new steroid for the menopause. Drug and Therapeutics Bulletin. Vol.29 N°20: 77-78, 1991.
7. Markiewicz L, Gurside E: In vitro evaluation of estrogenic, estrogen antagonistic and progestagenic effects of a steroidal drug (Org. OD-14) and its metabolites on human endometrium. J. Steroid Biochem; 35, N°5: 535 - 541, 1990.

FOLLETO PARA INFORMACION MEDICA
EXCLUSIVAMENTE NO INCLUIRLO EN
EL ENVASE DE VENTA AL PUBLICO