

- Conservar a temperatura no mayor de 30°C. Preservar de la luz y la humedad.
- Mantener alejado del alcance de los niños.

Dirección Técnica: Dr. Luis M. Radici – Farmacéutico.
MEDICAMENTO AUTORIZADO POR EL MINISTERIO DE SALUD.
Certificado N° 55.072
Laboratorios CASASCO S.A.I.C.
Boyacá 237 - Buenos Aires

URALOS® CR



COMPRIMIDOS RECUBIERTOS
DE LIBERACIÓN PROLONGADA

TAMSULOSINA

Industria Argentina
Venta Bajo Receta

Fórmula

Cada comprimido recubierto de liberación prolongada contiene: tamsulosina clorhidrato 0,40 mg. Excipientes: hidroxipropilmetilcelulosa K-4 26 mg; óxido de polietileno 90 mg; almidón pregelatinizado 40,873 mg; butilhidroxitolueno 0,200 mg; fosfato tricálcico 40,873 mg; dióxido de silicio coloidal 0,800 mg; estearato de magnesio 0,800 mg; óxido de hierro amarillo 0,204 mg; hidroxipropilmetilcelulosa E-15 1,670 mg; polietilenglicol 6000 0,705 mg; bióxido de titanio 1,575 mg; talco 1,600 mg; povidona K-30 0,300 mg.

Acción Terapéutica: bloqueante de los receptores alfa-1, subtipo alfa-1a.

Indicaciones: tratamiento de los síntomas urinarios asociados a la hiperplasia benigna de próstata (HBP).

Acción Farmacológica: la tamsulosina se une en forma selectiva y competitiva a los receptores alfa 1, postsinápticos, especialmente a los del subtipo alfa 1a, produciendo relajación del músculo liso de la próstata y la uretra.

Efectos farmacodinámicos: URALOS CR aumenta la tasa máxima de flujo urinario al reducir la tensión del músculo liso en la próstata y la uretra y aliviar por lo tanto la obstrucción. Además mejora el complejo de síntomas irritativos y obstructivos en el cual la inestabilidad de la vejiga y la tensión de los músculos lisos del tracto urinario inferior desempeñan un rol importante. Los bloqueantes alfa pueden reducir la presión arterial al disminuir la resistencia periférica. Durante los estudios clínicos con tamsulosina CR no se observó ninguna reducción en la presión arterial de significancia clínica.

Farmacocinética

Absorción: la tamsulosina es absorbida por el intestino y es biodisponible casi en su totalidad. La absorción de tamsulosina se reduce con una comida reciente. Se puede mejorar la uniformidad de absorción si el paciente toma siempre URALOS CR después del desayuno habitual. La tamsulosina muestra una cinética lineal. Después de una sola dosis los niveles de tamsulosina en el plasma alcanzan su pico alrededor de las 6 horas y, en estado estable, el cual se alcanza al quinto día de dosis múltiples, la C_{max} en pacientes es casi dos tercios más elevada que la alcanzada después de una sola dosis. Si bien esto se observó en pacientes ancianos, sería de esperar el mismo resultado en jóvenes.

Hay una considerable variación de un paciente a otro en los niveles en plasma tanto después de una dosis como de dosis múltiples.

Distribución: en el hombre, la tamsulosina está unida en casi un 99% a las proteínas del plasma y el volumen de distribución es pequeño (alrededor de 0,21/kg).

Biotransformación: la tamsulosina tiene un escaso efecto temprano ya que, se metaboliza lentamente. La mayor parte de la tamsulosina está presente en el plasma en forma de droga inalterada. Es metabolizada en el hígado. En ratas apenas si se observó alguna inducción de enzimas microsomales de hígado causada por la tamsulosina. No se justifica ningún ajuste de la dosis en la insuficiencia hepática. Ninguno de los metabolitos son más

E-1520-03 / D1808 / Acr.: 09/2012

 CASASCO

4

1

activos que el compuesto original.

Eliminación: la tamsulosina y sus metabolitos son principalmente excretados en la orina, en la que está presente alrededor del 9% de una dosis en forma de droga inalterada. Después de una dosis única en pacientes en período post-prandial, y en el estado estable, se han medido vidas medias de eliminación de alrededor de 10 y 13 horas respectivamente.

La insuficiencia renal no justifica la disminución de la dosis.

Datos preclínicos de seguridad

Se realizaron estudios de toxicidad con tamsulosina con dosis única y dosis repetidas en ratones, ratas y perros. Sumando a ello se estudió la toxicidad reproductora en ratas, la carcinogenicidad en ratones y ratas y la genotoxicidad in vivo e in vitro. El perfil general de toxicidad, según se observó con altas dosis de tamsulosina, coincide con las acciones farmacológicas conocidas de los agentes bloqueadores alfa-adrenérgicos.

Con niveles de dosis muy altos se alteró el ECG en perros. Esta respuesta no se considera de relevancia clínica. La tamsulosina no mostró propiedades genotóxicas relevantes.

Se ha informado una mayor incidencia de cambios proliferativos en glándulas mamarias de ratas y ratones hembras. Estos resultados, que probablemente estén mediados por hiperprolactinemia y sólo se presentaron con niveles de dosis elevados, se consideraron irrelevantes.

Posología y Modo de administración

URALOS CR: un comprimido por día. Se puede ingerir independientemente de las comidas.

Deben ingerirse enteros, con aproximadamente 150 ml de líquido, sin romper ni masticar, ya que esto altera la liberación del principio activo.

Contraindicaciones: hipersensibilidad al principio activo o a otros componentes del producto. Antecedentes de hipotensión ortostática. Insuficiencia hepática severa.

Advertencias: al igual que con otros bloqueantes alfa, se puede presentar una reducción en la presión arterial en casos individuales durante el tratamiento con URALOS CR, lo que en casos muy raros puede llevar al desvanecimiento. A los primeros signos de hipotensión ortostática (mareo, vértigo, sensación de inestabilidad) es conveniente que el paciente se siente o se acueste hasta que los síntomas hayan desaparecido.

Precauciones: antes de iniciar el tratamiento con URALOS CR se debe examinar al paciente para excluir la presencia de otras condiciones que causan los mismos síntomas que la hiperplasia prostática benigna. Se debe realizar un tacto rectal y, en caso necesario, la determinación del antígeno prostático específico (PSA) antes del tratamiento y a intervalos regulares durante el mismo. Se debe encarar con precaución este tratamiento en pacientes con deterioro renal severo (clearance de creatinina < 10 ml/min) ya que estos pacientes no han sido estudiados.

Interacciones medicamentosas: no se han observado interacciones en casos de administración en forma concomitante con atenolol, enalapril o nifedipina. La cimetidina causa una elevación en los niveles de tamsulosina en el plasma, y la furosemida un descenso, pero mientras los niveles permanezcan dentro de las variaciones normales no es necesario cambiar la posología. In vitro, ni diazepam ni propanolol, triclometiazida, clormadinoma, amitriptilina, diclofenac, glibenclamida, simvastatin ni warfarina varían las fracciones libres de tamsulosina en el plasma humano. Tampoco la tamsulosina varía las fracciones libres de diazepam, propanolol, triclometiazida y clormadinoma.

No se han observado interacciones a nivel de metabolismo hepático durante estudios in vitro con fracciones microsomales de hígado (representativas del sistema enzimático metabolizante de drogas vinculadas al citocromo P450) con respecto a la amitriptilina, el salbutamol, la glibenclamida y el finasteride. No obstante el diclofenac y la warfarina pueden incrementar la tasa de eliminación de la tamsulosina. La administración concomi-

tante de otros antagonistas de receptores adrenérgicos alfa, podría llevar a efectos hipotensores.

Gravidez y Lactancia: URALOS CR está destinado a pacientes masculinos únicamente.

Efectos sobre la capacidad para conducir y utilizar maquinarias: no se disponen de datos respecto a si URALOS CR afecta de manera adversa la capacidad para conducir u operar maquinarias. Sin embargo, en este aspecto, los pacientes deben estar concientes de que pueden sufrir mareos.

Reacciones adversas

	Frecuentes (>1%, <10%)	Poco frecuentes (>0,1%, <1%)	Raros (>0,01%, <0,1%)	Muy raros (<0,01%)
Trastornos cardíacos		Palpitaciones		
Trastornos gastrointestinales		Estreñimiento, diarrea, náuseas, vómitos		
Trastornos generales y alteraciones en el lugar de administración		Astenia		
Trastornos del sistema Nervioso	Mareo (1,3%)	Cefalea	Síncope	
Trastornos del aparato reproductor y de la mama		Alteraciones de la eyaculación		Priapismo
Trastornos respiratorios, torácicos y mediastínicos.		Rinitis		
Trastornos de la piel y del tejido subcutáneo		Exantema, prurito, urticaria	Angioedema	
Trastornos vasculares		Hipotensión postural		

Sobredosificación: no se han informado casos de sobredosis aguda. Sin embargo, teóricamente se podría presentar hipotensión después de una sobredosis, en cuyo caso se debe brindar apoyo cardiovascular. Se acostará al paciente para tratar de normalizar la presión arterial y el ritmo cardíaco. Si esto no ayuda entonces se pueden emplear expansores y, en caso necesario, vasopresores. Es necesario monitorear la función renal y aplicar medidas generales de apoyo. No es probable que la diálisis sirva de ayuda ya que la tamsulosina está sumamente unida a las proteínas del plasma.

Se pueden tomar medidas tales como emesis, para detener la absorción. Cuando se trata de cantidades abundantes, se puede aplicar lavaje gástrico y carbón activado y se puede administrar un laxativo osmótico, como el sulfato de sodio.

Ante la eventualidad de una sobredosificación, concurrir al Hospital más cercano o comunicarse con los Centros de Toxicología:

Hospital A. Posadas: (011) 4654-6648/4658-7777.

Hospital de Pediatría Ricardo Gutiérrez: (011) 4962-6666/2247.

Optativamente otros Centros de Intoxicaciones.

Presentación: envases con 30 comprimidos recubiertos de liberación prolongada.

Fecha de última revisión: julio de 2009

Forma de conservación

2

3