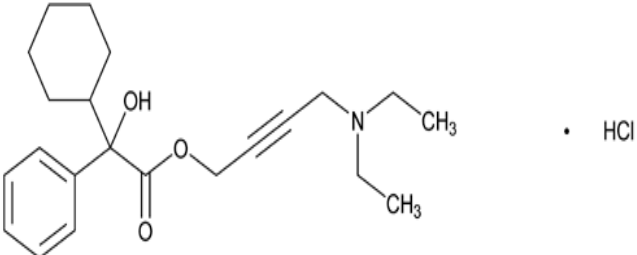


	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)		CODIGO: R-VE-74
			VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión: 2014-06-14	Página 1 de 8

1. Denominación	
Nombre:	URO-KONTROL®
Principio Activo:	CLORHIDRATO DE OXIBUTININA
Forma Farmacéutica:	TABLETA
Presentaciones:	Caja conteniendo 30 tabletas

2. Presentación:	
Cada tableta contiene:	
Clorhidrato de oxibutinina	5 mg
Excipiente c.b.p	1 Tableta

3. Fórmulas:	
Fórmula de Oxibutinina HCl	$C_{22}H_{31}NO_3 \cdot HCl$
Nombre Químico de Oxibutinina HCl	4-(Diethylamino)-2-butynyl (±)--phenylcyclohexaneglycolate hydrochloride
Estructura Química	
P.M. de Oxibutinina HCl	393.95
Número CAS:	1508-65-2

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 2 de 8	Firma de aprobación: 

4. Aspectos Químicos:

Polvo cristalino blanco o casi blanco. Libremente soluble en agua, alcohol y acetona, ligeramente soluble en ciclohexano.

5. Categoría:

Grupo fármaco terapéutico: Sistema genitourinario. Urológicos. Drogas para frecuencia urinaria e incontinencia.
ATC: G04BD04

6. Indicaciones:

Uro-Kontrol® (oxibutinina) está indicado para el tratamiento de la vejiga hiperactiva con síntomas de urgencia, frecuencia e incontinencia urinaria de esfuerzo.

7. Farmacología:

La Incontinencia Urinaria de Esfuerzo es una pérdida involuntaria de orina que ocurre durante una actividad física como toser, estornudar, reír o realizar ejercicio.

Causas, incidencia y factores de riesgo

La incontinencia urinaria de esfuerzo es un problema de almacenamiento de la vejiga en el cual se reduce la fuerza de los músculos (esfínter uretral) y éste no es capaz de evitar el flujo de orina cuando aumenta la presión abdominal.

La incontinencia urinaria de esfuerzo puede presentarse como resultado del debilitamiento de los músculos pélvicos que soportan la vejiga y la uretra o debido al mal funcionamiento del esfínter uretral. El debilitamiento puede ser causado por un trauma previo de la zona uretral. Lo más común son los partos vaginales difíciles o traumáticos, o que no han sido atendidos adecuadamente en un hospital o por una lesión neurológica, algunos medicamentos, o después de una cirugía del área pélvica.

La incontinencia urinaria de esfuerzo es el tipo más común de incontinencia urinaria en las mujeres. Los estudios han documentado que alrededor del 50% de todas las mujeres

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 3 de 8	Firma de aprobación: 

presentan incontinencia urinaria ocasional y hasta el 10% presentan incontinencia frecuente. Esta pérdida involuntaria de orina ocasiona problemas sociales, de indiscreción e incomodidad. Además, origina pena por parte de la paciente y situaciones antihigiénicas.

La incontinencia Urinaria es fácilmente diagnosticada por el Médico y muy sensible por parte de las pacientes.

Estas estadísticas aumentan considerablemente en los países Latinoamericanos por la alta frecuencia de los partos extra-hospitalarios. Casi el 20% de las mujeres mayores de 75 años experimentan incontinencia urinaria diaria.

Este tipo de incontinencia se ve a menudo en mujeres que han tenido múltiples embarazos y partos vaginales o que tienen prolapso de la vejiga urinaria, uretra o pared rectal dentro del espacio vaginal (prolapso pélvico).

Los factores de riesgo para la incontinencia urinaria de esfuerzo comprenden:

- Sexo femenino
- Edad avanzada
- Historia de Parto(s) Vaginal (es);
- Tabaquismo
- Obesidad
- Tos crónica (como bronquitis crónica y asma)

Síntomas

La pérdida involuntaria de orina es el principal síntoma y puede ocurrir:

- Al toser
- Al estornudar
- Al estar de pie
- Al realizar ejercicio (caminar rápido, correr, saltar, etcétera)
- Durante otra actividad (realizar esfuerzos: Levantar objetos pesados, agacharse e incorporarse nuevamente, etcétera)

La Incontinencia Urinaria produce trastornos diversos en la calidad de vida de las pacientes (problemas sociales, psicológicos, domésticos, físicos). Esto hace además, que las mujeres

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 4 de 8	Firma de aprobación: 

eviten las actividades físicas, que ingieran menos cantidades de líquidos, que usen pañales, ropa oscura, etc. Las pacientes no acuden al médico por pena, vergüenza o por ignorancia; ya que creen que su mal no tiene cura, por fracasos de cirugías previas o por consejos de otras pacientes a quienes no les fue bien.

Anatomía

La uretra proximal y el cuello vesical son soportados por un fuerte arco tendinoso de fascia pélvica, el cual es una condensación de la fascia superior del diafragma pélvico y la fascia obturadora interna; se extienden desde el borde inferior de la sínfisis púbica hasta la espina isquiática. Juntando bilateralmente a esta densa estructura fibrosa, la vagina, alrededor el tejido conectivo y hacia abajo los músculos elevadores del ano, se va a formar un soporte como una hamaca o cincha abrazadora.

Uro-Kontrol® contienen como principio activo oxibutinina, el cual es un fármaco de doble función. Simultáneamente brinda una acción antiespasmódica que ejerce un efecto anticolinérgico sobre el músculo liso vesical de un modo selectivo, utilizándose en el tratamiento de la vejiga neurogénica. La otra acción terapéutica que logra **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) es en los pacientes con condiciones caracterizadas por contracciones involuntarias de la vejiga. Los estudios cistométricos han demostrado que la oxibutinina reduce la frecuencia de las contracciones del músculo detrusor, aumentando la capacidad de la vejiga y retrasando el deseo inicial del vaciado. La oxibutinina contenida en **Uro-Kontrol®** muestra también efectos analgésicos y anestésicos locales.

Mecanismo de acción:

La acción anticolinérgica de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) se debe a una inhibición del efecto muscarínico de la acetilcolina sobre el músculo liso. Aunque la oxibutinina sólo es 4 ó 5 veces menos potente que la atropina en el músculo detrusor, es 4 veces más potente como antiespasmódico. La actividad antimuscarínica de la oxibutinina reside en su isómero R.

El fármaco no tiene ninguna actividad bloqueadora a nivel de las uniones neuro-musculares esqueléticas ni tiene actividad sobre los receptores nicotínicos de los ganglios autonómicos.

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	<i>Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.</i>	<i>Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14</i>	<i>Página 5 de 8</i>	<i>Firma de aprobación: </i>

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

Después de la administración de una dosis oral de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina), las máximas concentraciones en plasma se alcanzan a las 4-6 horas. La administración de dosis repetidas retrasa a 10-12 horas la aparición de las concentraciones máximas, después de las cuales, las concentraciones plasmáticas se mantienen durante 24 horas con mínimas fluctuaciones. Las concentraciones de los isómeros de la oxibutinina son muy similares, así como las semi-vidas y la biodisponibilidad, que es algo mayor para cada uno de los isómeros individuales que para el racémico. Después de dosis repetidas, las condiciones de equilibrio se alcanzan a los tres días, momento en el que las T_{max} son de 11-12 horas y las T_{1/2} de 12 a 13 horas.

Una vez en la sangre la oxibutinina se distribuye ampliamente por todos los órganos y tejidos del organismo después de su administración. La oxibutinina se metaboliza por los sistemas enzimáticos del citocromo P450 del hígado y de la pared intestinal. El principal metabolito, la desetil-oxibutinina, es tan activo desde el punto de vista farmacológico como el producto de partida. Menos del 0.1% de la dosis se elimina sin metabolizar en la orina.

Los pacientes geriátricos muestran un perfil farmacocinético de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) idéntico al de los sujetos de menor edad. Tampoco se observan diferencias entre sexos, ni entre razas.

No se ha evaluado la farmacocinética de la oxibutinina en la insuficiencia renal o hepática.

8. Posología:

Las dosis recomendadas son de 5 mg una vez al día por vía oral. Estas dosis pueden ser aumentadas, con incrementos de 5 mg, hasta un máximo de 30 mg/día. Por regla general, los incrementos de la dosis hasta conseguir una respuesta adecuada, se deben realizar a intervalos de una semana. Sin embargo, la gran mayoría de pacientes logra estabilizarse y conseguir resultados extraordinarios con 5 mg al día.

Por supuesto, es aconsejable que la paciente practique los ejercicios vesicales orientados por el médico tratante.

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 6 de 8	Firma de aprobación: 

9. Efectos Adversos:

Los efectos adversos más frecuentes comunicados en los pacientes tratados con dosis de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) entre 5 y 30 mg son los que eran de esperar de una medicación anti-colinérgica: Sequedad de boca (1.2%), y náusea (1.9%).

Otros efectos adversos, que se observan en el 2-5% de los pacientes son:

- a) Reacciones adversas de tipo general: dolor abdominal, sequedad nasal y de las membranas de los senos nasales, dolor de espalda y síntomas similares de los de un resfriado.
- b) Reacciones adversas cardiovasculares: Hipertensión, palpitaciones, vasodilatación, taquicardia.
- c) Reacciones adversas digestivas: Flatulencia, reflujo gastroesofágico
- d) Reacciones adversas músculo-esqueléticas: Artritis
- e) Reacciones adversas sobre el SNC: Insomnio, nerviosismo, confusión, alucinaciones, ciclopejía, midriasis
- f) Reacciones adversas sobre el tracto respiratorio: Infecciones del tracto respiratorio superior, tos, faringitis, sinusitis y bronquitis
- g) Reacciones adversas sobre la piel: Sequedad de piel, rash
- h) Reacciones adversas urogenitales: Vacilación al orinar, aumento del volumen post-vaciado, retención urinaria, impotencia.

10. Precauciones y Advertencias:

Uro-Kontrol® (oxibutinina) se debe utilizar con precaución en los pacientes que presenten insuficiencia renal o hepática.

En los pacientes que muestren algún tipo de obstrucción de la vejiga, la **oxibutinina** se debe administrar con precaución debido al riesgo de producir retención urinaria. De igual forma, los pacientes con enfermedades gastrointestinales obstructivas presentan un riesgo mayor de retención gástrica. Al igual que otros fármacos anticolinérgicos, **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) reduce la motilidad gastrointestinal por lo que su administración a pacientes con colitis ulcerosa, atonía intestinal y miastenia grave se debe llevar a cabo bajo una cuidadosa vigilancia. La **oxibutinina** puede producir reflujo gastroesofágico y complicar el riesgo de

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)			CODIGO: R-VE-74
				VERSION: 01
	Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 7 de 8	Firma de aprobación: 

esofagitis producida por otros fármacos, como los Bisfosfonatos.

Debido a sus efectos anticolinérgicos, **Uro-Kontrol** (oxibutinina) puede ocasionar somnolencia y visión borrosa. Los pacientes deberán ser advertidos sobre estos efectos, en particular si deben conducir o manejar maquinaria pesada. El alcohol puede aumentar la somnolencia inducida por el fármaco.

Uso en Embarzo y Período de Lactancia.

Aunque los estudios en animales de laboratorio han puesto de manifiesto que la **oxibutinina** no tiene ningún efecto adverso sobre la reproducción, no se han realizado estudios clínicos controlados en el humano. Por ello, no se aconseja la administración de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) durante el embarazo, a menos que los beneficios para la madre superen, a juicio del médico, el posible riesgo para el feto.

Se desconoce si la **oxibutinina** se excreta en la leche materna, por lo que no se aconseja su utilización durante el período de lactancia.

No se han establecido la seguridad y la eficacia de la **oxibutinina** en pediatría.

11. Contraindicaciones:

Uro-Kontrol® (oxibutinina) está contraindicado en pacientes que hayan mostrado una hipersensibilidad al fármaco. También está contraindicada en pacientes con retención urinaria, retención gástrica, o glaucoma de ángulo estrecho no controlado y en los pacientes que presenten algún riesgo de padecer estas enfermedades.

12. INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS:

El uso concomitante de **Uro-Kontrol®** (oxibutinina) con otros fármacos anticolinérgicos puede aumentar la frecuencia y gravedad de la somnolencia, constipación y sequedad de boca asociados a estos fármacos. Otros fármacos como los antihistamínicos de primera generación, sedantes o antidepresivos pueden incrementar la somnolencia inducida por **Uro-Kontrol®**.

Como todos los agentes anticolinérgicos que afectan la motilidad gastrointestinal, la **oxibutinina** puede afectar la absorción de otros fármacos que se administren al mismo tiempo, factor que debe tomarse en cuenta si hay otras medicaciones por parte de la paciente.

	INFORMACION FARMACOLOGICA (MONOGRAFIA)		CODIGO: R-VE-74
			VERSION: 01
Creado por: Dr. Eric Guillermo Serrano S.	Fecha de creación: 2011-03-14 Fecha de última versión 2014-06-14	Página 8 de 8	Firma de aprobación: 

Aunque la **oxibutinina** puede interferir con los fármacos que inhiben el sistema enzimático del citocromo P450, tales como los antifúngicos imidazólicos (ketoconazol, itraconazol, etc.) o los antibióticos macrólidos (eritromicina o claritromicina), no han realizado estudios clínicos que cuantifiquen el alcance de esta interacción.

13. RECOMENDACIONES EN CASO DE SOBREDOSIFICACIÓN.

La sobredosis de oxibutinina ha sido asociada a efectos anticolinérgicos, incluyendo excitación del sistema nervioso central (temblores, irritabilidad, convulsiones, delirio y alucinaciones) sofocos, fiebre, deshidratación. También pueden presentarse arritmias cardíacas, vómitos y retención de orina. Otros síntomas incluyen hipotensión o hipertensión, fallo respiratorio, parálisis y coma.

El tratamiento debe ser sintomático y de soporte. Puede administrarse como catártico carbón activado.

14. Bibliografía:

- **USP 38 NF 33**
- **http://www.whocc.no/atc_ddd_index/?code=G04BD04**
- **MANUAL WASHINGTON DE TERAPÉUTICA HUMANA. 34ª Edición.**
- **GOODMAN & GILMAN. LAS BASES FARMACOLÓGICAS DE LA TERAPÉUTICA. A 12ª EDICIÓN.**
- **VELÁSQUEZ. FARMACOLOGÍA BÁSICA Y CLÍNICA. 18ª EDICIÓN.**
- **HARRISON PRINCIPIOS DE MEDICINA INTERNA. 17ª EDICIÓN**

Fecha de Revisión de la Monografía: 31-Octubre 2016.