CRISTERONA® “FP”

ESTRADIOL - PROGESTERONA

Inyectable

COMPOSICION:

Cada mL contiene:

Estradiol...................................................................2 mg.

Progesterona.........................................................10 mg.

Vehículo...................................................................c.s.p.

ACCION TERAPEUTICA:

Asociación estro-progestacional.

INDICACIONES TERAPEUTICAS:

Atraso en la aparición de la menstruación - Amenorrea - Hipomenorrea - Irregularidades del ciclo menstrual.

MECANISMO DE ACCION:

Cristerona es una asociación fisiológica de las dos hormonas secretadas por el ovario, Estradiol y Progesterona, que inducen un estado similar al de la fase lútea del ciclo menstrual y por ello, dentro de los 8 - 10 días posteriores a su administración, se produce en condiciones normales flujo menstrual de 4 a 5 días de duración.

Estradiol: A nivel celular, aumenta la síntesis de ADN, ARN y varias proteínas en el órgano blanco. Reduce la liberación en el hipotálamo de la LHRH, llevando así a una disminución en la hipófisis de la FSH y la LH.

Con la pequeña dosis de estrógeno que se emplean en Cristerona FP no se inhibe la función hipofisaria.

Progesterona: Ingresa por difusión pasiva y se une a receptores citosólicos que están cercanos al límite nuclear.

El complejo receptor esteroide inicia la transcripción resultando en un aumento de la síntesis proteica.

Puede afectar las concentraciones de otras hormonas en particular de estrógenos. Efectos estrogénicos se modifican por los progestágenos, ya sea reduciendo la disponibilidad o estabilidad del complejo receptor-hormona o desactivando genes por interacción directa con el receptor progestínico en el núcleo.

La Progesterona produce cambios histológicos en el epitelio vaginal e induce modificaciones secretorias en el endometrio en la segunda mitad del ciclo menstrual. Cuando lo niveles de progestágenos caen se produce la aparición del sangrado uterino.

ABSORCION:

Estradiol: La absorción del Estradiol seguida de la administración intramuscular es prolongada.

Progesterona: Se absorbe rápidamente vía intramuscular.

DISTRIBUCION:

Estradiol: Cristerona es una suspensión acuosa de microcristales por vía intramuscular que logra prolongar la acción de las hormonas esteroideas. El Estradiol se distribuye a la mayoría de los tejidos teniendo gran afinidad por el tejido adiposo. Se une de un 50 a 80 % a albúmina y globulina ligadora de hormonas sexuales.

Progesterona: Circula unida altamente (en un 90 % o más) a proteínas plasmáticas en un 17,7 % a globulina ligadora de Cortisol y 79,3 % a albúmina.

BIOTRANSFORMACION:

Estradiol: Principalmente se realiza a nivel hepático, aunque también algún metabolismo se produce en músculo, riñón y las gónadas.

Progesterona: Hepática, en un 12 % se metaboliza a pregnanediol.

EXCRECION:

Estradiol: Se excreta principalmente por orina en forma de numerosos metabolitos y una pequeña parte como Estradiol intacto. Parte se excreta por las heces. Sufre recirculación enterohepática.

Progesterona: En un 50 - 60 % la eliminación es renal como glucurónido. Sólo un 10 % se excreta por las heces.

BIODISPONIBILIDAD:

Estradiol: Sufre extensa metabolización en el hígado siendo algunos de los metabolitos estrógenos menos activos tales como Estriol y Estrona, por lo que la biodisponibilidad disminuye.

Progesterona: Medianamente alta.

POSOLOGIA:

1 a 6 mL por vía intramuscular.

Atraso en la aparición de la menstruación (inducción retardada): 2 mL por vía intramuscular. El advenimiento de una metrorragia dentro de los 10 días de la administración significa que el retraso de la menstruación no es atribuible a un embarazo.

Amenorrea: 2 a 6 mL por vía intramuscular, según la duración de la amenorrea. La metrorragia se presenta dentro de los 8 a 10 días de la inyección, excepto que la amenorrea esté causada por embarazo, disfunción del eje hipotálamo-hipofisogonadal, insuficiencia ovárica, o que se trate de una amenorrea uterina.

Si se considera necesario, repetir la misma dosis todos los meses en la misma fecha.

En caso de ausencia de respuesta, la dosis puede ser repetida cada 10 días de acuerdo al criterio médico.

Hipomenorrea: 1 mL por vía intramuscular en el vigésimo día del ciclo menstrual. Repetir la misma dosis, con igual esquema, en los meses subsiguientes, si se considera necesario.

Irregularidades del ciclo menstrual (inducción precoz): en mujeres con ciclos menstruales irregulares, si se desea obtener la metrorragia en la fecha precisa, en ausencia de embarazo, pueden ser administrados 2 mL de Cristerona en el día 22 del ciclo.

CONTRAINDICACIONES:

Antecedentes de herpes gravídico. Tumores hormonodependientes comprobados o sospechados. Trastornos tromboembólicos en evolución. Sangrado vaginal anormal.

PRECAUCIONES Y ADVERTENCIAS:

Administrar con precaución a personas con insuficiencia cardíaca, asma o epilepsia. Si como respuesta a la administración de Cristerona, se produce una metrorragia profusa, el médico tratante debe descartar la existencia de otra patología concomitante.

Agitar el frasco antes de extraer el contenido.

Aplicar por vía intramuscular profunda utilizando jeringa y aguja (de calibre 8) esterilizadas, desechables.

REACCIONES ADVERSAS Y EFECTOS COLATERALES:

Cuando se administra en una única dosis y a la posología indicada, carece de los efectos secundarios que pudieran observarse en la administración prolongada de sus principios activos.

INTERACCION CON MEDICAMENTOS Y ALIMENTOS:

Farmacocinéticas

Estradiol: El uso concurrente de estrógenos y glucocorticoides puede alterar el metabolismo y la unión a proteínas disminuyendo el clearance y aumentando el tiempo de vida media de eliminación de los glucocorticoides.

Se han reportado casos en que los estrógenos inhibieron el metabolismo de la Ciclosporina, aumentándose las concentraciones plasmáticas de esta última y su nefrotoxicidad.

Progesterona: Drogas inductoras de enzimas hepáticas como la Carbamazepina, Fenobarbital, Fenitoína, Rifabutina o Rifampicina puede disminuir la eficacia de algunos progestágenos. Se ha sugerido que esto se debe al metabolismo aumentado de los progestágenos.

Farmacodinámicas

El uso concomitante de estrógenos con Tamoxifeno puede interferir en el efecto terapéutico de este último.

SOBREDOSIFICACION:

En dosis recomendada no se han descrito. Si ocurriese tratar con tratamiento de sostén. En caso de sobredosis o ingestión accidental, consultar al Servicio de Toxicología del Hospital de EMERGENCIAS MEDICAS Tel.: 220-418 o el 204-800 (int. 011).

RESTRICCIONES DE USO:

No debe administrarse durante los meses de gestación.

PRESENTACION:

Caja x 1 Frasco Ampolla de 6 mL.

Almacenar a temperatura entre 15° y 30 °C.

Mantener Fuera del Alcance de los Niños.