

INFORMACIÓN PARA PRESCRIBIR AMPLIA (IPP-A)



FORMA FARMACÉUTICA Y FORMULACIÓN:

SOLUCIÓN INYECTABLE

Cada ampolleta de 2 mL contiene:

Progesterona	50 mg
Vehículo cbp	2 mL

INDICACIONES TERAPÉUTICAS:

Medicación progestacional, tratamiento de los trastornos del ciclo menstrual (amenorrea de origen ovárico), hemorragia uterina disfuncional, amenaza de aborto y soporte de fase lútea en reproducción asistida.

FARMACOCINÉTICA Y FARMACODINAMIA:

La progesterona es una hormona natural que se une a receptores específicos para inducir efectos progestacionales específicos. Como resultado de esta unión la progesterona es capaz de interferir con los sitios de unión de otros esteroides. Por lo tanto, la progesterona presenta actividad antiestrogénica, antiandrogénica y también antimineralocorticoide.

Farmacodinamia

El mecanismo de acción de progesterona es similar al de todos los esteroides a nivel celular. Para transporte por vía sanguínea se une a una globulina transportadora (SHBG) en receptores específicos de la célula blanco como órganos reproductores femeninos, glándulas mamarias, sistema nervioso central (incluso, la región del generador de impulsos en el hipotálamo) e hipófisis. Se han descrito dos tipos de receptores: alfa y beta y la progesterona se acopla al receptor desencadenando un estímulo en el mecanismo de cascada de la fosforilación formando un complejo hormona-receptor (HR). Este HR activa los receptores nucleares de la adenilciclase nuclear, produciendo una defosforilación y traslocación a nivel nuclear, modificando las proteínas del ADN con activación de la ARN polimerasa, lo cual inicia el fenómeno de transcripción. El ADN activado por metilación desencadena la orden para que el ARN mensajero viaje hacia los ribosomas y produzca la respuesta deseada.

Farmacocinética

La absorción de la progesterona es mucho más eficaz, cuando se aplica por vía intramuscular que cuando se administra por vía oral. La absorción de la progesterona es rápida, por lo que su vida media es de unos cuantos minutos.

Absorción: después de la administración intramuscular de 10 mg de progesterona en aceite, concentraciones máximas en plasma (media geométrica de 7 ng/mL) se alcanzaron aproximadamente en 8 horas después de la inyección y las concentraciones plasmáticas se mantuvieron por encima de la línea de base durante aproximadamente 24 horas después de la inyección. La inyección de 10, 25 y 50 mg resultó en valores medios geométricos de la concentración máxima en plasma (Cmax) de 7, 28 y 50 ng/mL, respectivamente.

Distribución: La progesterona se une ampliamente a las proteínas plasmáticas, principalmente a la albúmina (50-54%) y el cortisol proteína de unión (43-48%).

Metabolismo: La progesterona se metaboliza principalmente en el hígado mediante la reducción de pregnandiol, pregnanetriol, y pregnanolona. Subsecuentemente como resultado formación de metabolitos conjugados glucurónido y sulfato. La tasa de depuración metabólica promedio en plasma en las mujeres es 2.510 +135 (sem) L/día.

Excreción: Los metabolitos conjugados glucurónido y sulfato de pregnandiol y pregnanolona se excretan en la orina y bilis. Los metabolitos de progesterona que se excretan en la bilis pueden someterse a la recirculación enterohepática o puede ser excretada en heces.

Una pequeña cantidad de progesterona se almacena a nivel de tejido graso y es liberado cuando los niveles plasmáticos disminuyen. Aunque se elimina con rapidez si se le administra a intervalos diarios, alcanza efectividad terapéutica. Los efectos de la progesterona en el organismo continúan varios días después de haber suspendido la medicación.

Los efectos farmacológicos de la progesterona a dosis terapéuticas mayores, incluyen la supresión de la ovulación, conservación del embarazo por la inhibición de la contractilidad del útero, transformación de endometrio proliferativo a endometrio secretor.

Poblaciones especiales:

Insuficiencia renal: La seguridad y eficacia en pacientes con insuficiencia renal no ha sido establecido. Los metabolitos de progesterona se excretan principalmente por vía renal, la progesterona debe ser administrada con precaución y monitoreo cuidadoso en esta población de pacientes.

Insuficiencia hepática: La seguridad y eficacia en pacientes con insuficiencia hepática no ha sido establecido. Dado que la progesterona es metabolizada por el hígado, el uso en pacientes con disfunción hepática o enfermedad está

contraindicada.

CONTRAINDICACIONES:

Hipersensibilidad a los componentes de la fórmula. Hemorragia vaginal o del tracto urinario no diagnosticada. Antecedentes de tromboflebitis o trastornos tromboembólicos, o accidentes vasculares cerebrales. Tumoraciones malignas de mama o genitales no diagnosticada, conocida o con sospecha de malignidad, trastornos cardiovasculares y enfermedad hepática.

Está contraindicado el uso de progesterona en pacientes con manifestaciones de aborto incompleto, aborto inevitable, aborto retenido, aborto diferido, aborto séptico, aborto en evolución y aborto completo.

PRECAUCIONES GENERALES:

Previo a iniciar la terapia con progesterona, deberá realizarse en todas las mujeres un examen físico con atención especial a las mamas y órganos pélvicos, así como frotis de papanicolaou.

El médico prescriptor debe estar alerta a cualquier manifestación de trastornos trombóticos (tromboflebitis, trastornos cardiovasculares, embolia pulmonar, y trombosis retinal). Si ocurren algunos de estos eventos o sospecha deberá suspender inmediatamente.

El tratamiento deberá suspenderse si se presenta de manera súbita pérdida de la visión parcial o completamente y si existe inicio de proptosis, diplopía o migraña. Si en la exploración física revela papiledema o lesiones vasculares retinales, el tratamiento deberá suspenderse.

Debe usarse con precaución en pacientes cuya condición puede ser agravada por la retención de líquidos (por ej. hipertensión, enfermedad cardíaca o renal, epilepsia) y en aquellas con historia de depresión, diabetes, disfunción hepática o migraña.

En los casos de sangrado, al igual que en todos los casos de sangrado irregular vaginal se deben tener en cuenta causas no funcionales, y adecuadas medidas diagnosticadas llevadas a cabo. Existen posibles riesgos que pueden estar asociados con el uso de tratamiento con progestinas, incluyendo efectos adversos en hidratos de carbono y metabolismo de los lípidos. Una disminución de la tolerancia a la glucosa se ha observado en un pequeño porcentaje de pacientes en tratamiento combinado de estrógeno-progestina. El mecanismo de esta disminución es desconocido. Por esta razón, los pacientes diabéticos deben ser observados cuidadosamente durante la recepción

de dicha terapia.

RESTRICCIONES DE USO DURANTE EL EMBARAZO Y LA LACTANCIA:

El uso de este medicamento no está contraindicado durante el embarazo, aún durante las primeras semanas. La decisión de emplear Cuerpo Amarillo Fuerte® durante el embarazo, es responsabilidad del médico tratante, quien en caso de prescribirlo mantendrá a la paciente en estrecha vigilancia. En periodo de lactancia no se recomienda su uso.

REACCIONES SECUNDARIAS Y ADVERSAS:

Pueden presentarse náuseas, mareo, vómito, vértigo, cefalea, aumento o disminución de peso, sangrado intermenstrual, manchado, cambio en el flujo menstrual, edema, cambios en las secreciones cervicales y ocasionalmente puede haber depresión o fatiga, ictericia colestásica, hipersensibilidad mamaria, galactorrea, dolor irritación y/o enrojecimiento del área de la inyección; reacciones de sensibilidad de la piel que consiste en urticaria, prurito, edema y erupción cutánea generalizada; acné, alopecia e hirsutismo, exantema (alérgica) con y sin prurito; reacciones anafilácticas, depresión; pirexia, insomnio, náusea y somnolencia.

INTERACCIONES MEDICAMENTOSAS Y DE OTRO GÉNERO:

Se ha demostrado que la fenitoina, el fenobarbital y el ácido valpróico, pueden reducir la eficacia de la progesterona. De igual forma, se ha reportado que la progesterona disminuye el efecto de la rifampicina cuando se administran concomitantemente.

ALTERACIONES EN LOS RESULTADOS DE PRUEBAS DE LABORATORIO:

En algunas ocasiones puede llegar a modificar los resultados de algunas pruebas de laboratorio como: pruebas de función tiroidea (por aumento de la transcortina); prueba de la proteína fijadora de tiroxina (tiroxinasa); curva de tolerancia a la glucosa y determinación del nitrógeno ureico en sangre.

PRECAUCIONES EN RELACIÓN CON EFECTOS DE CARCINOGENESIS, MUTAGÉNESIS, TERATOGÉNESIS Y SOBRE LA FERTILIDAD:

En animales de experimentación, a dosis elevadas se ha observado la aparición de nódulos mamarios. No obstante, en el humano no se han reportado dichos hallazgos. La progesterona no es teratogénica, esto ha sido demostrado hasta la actualidad en una gran cantidad de nacimientos en niños cuyo período embriogénico ha tenido lugar en un ambiente terapéuticamente enriquecido con esta hormona.

DOSIS Y VÍA DE ADMINISTRACIÓN: Intramuscular.

Soporte de fase lútea en reproducción asistida: De una a dos ampollas al día 50 – 100 mg al día vía intramuscular profunda.

Amenaza de aborto: administrar 100 mg al día (dos ampollas) por vía intramuscular profunda.

Tratamiento de los trastornos del ciclo menstrual (amenorrea de origen ovárico): De una a dos ampollas 50-100 mg al día vía intramuscular profunda.

Hemorragia uterina disfuncional: 50 a 100 mg al día (una a dos ampollas) vía intramuscular profunda.

MANIFESTACIONES Y MANEJO DE LA SOBREDOSIFICACIÓN O INGESTA ACCIDENTAL:

La toxicidad reportada por la progesterona es baja, pero puede presentarse: somnolencia, sensación de vértigo, cefalea intensa, sangrado intermitente. Tratamiento: Reducción de la dosis hasta suspender la medicación y manejo sintomático.

PRESENTACIÓN: Caja con 6 ampollas de 2 mL.

RECOMENDACIONES SOBRE ALMACENAMIENTO:

Consérvese la caja bien cerrada a no más de 30°C. Protéjase de la luz.

LEYENDAS DE PROTECCIÓN:

Literatura exclusiva para médicos.

No se deje al alcance de los niños.

Su venta requiere receta médica.

Protéjase de la luz.

Reporte las sospechas de reacción adversa a los

correos: farmacovigilancia@cofepris.gob.mx y

ucfarmacovigilancia@sanfer.com.mx

Hecho en México por:

Grimann, S.A. de C.V.

Circuito Nemesio Diez Riega No. 11,

Parque Industrial El Cerrillo II,

C.P. 52000, Lerma, México, México.

y/o

Laboratorios Química Son's, S.A. de C.V.

23 Poniente 2302-A,

Col. Volcanes, C.P. 72410,

Puebla, Puebla, México.

Para:

Grimann, S.A. de C.V.

Circuito Nemesio Diez Riega No. 11,

Parque Industrial El Cerrillo II,

C.P. 52000, Lerma, México, México.

Distribuido por:

Laboratorios Sanfer S.A. de C.V.

Bicentenario no. 101,

Parque Industrial Lerma, C.P. 52000,

Lerma, México, México.

sanfer®

® Marcas Registradas.

Reg. No. 13571 SSA IV