

Ficha técnica de producto

ESTRADIOL 17 BETA HEMIHIDRATO

Descripción del producto:

Fórmula Molecular	C ₁₈ H ₂₄ O ₂ ·0,5H ₂ O
Peso molecular	281,38
Número CAS	35380-71-3
Sinónimos	Estradiol hemihidrato; β-Estradiol hemihydrate

Datos Físico-Químicos:

Polvo cristalino, blanco o casi blanco o cristales incoloros e higroscópicos. Prácticamente insoluble en agua, soluble en acetona, bastante soluble en etanol al 96%, y poco soluble en cloruro de metileno. Punto de fusión: 173 – 179 °C. Rotación óptica: (+76°) – (+83°) (dioxano). Absorción UV máx.: 225, 280 nm.

Aprox. 1,03 g de estradiol 17-beta hemihidrato equivalen a 1 g de estradiol 17- beta anhidro.

Aprox. 1 mg de estradiol contiene 10.000 UI.

Composición y/o INCI:

sustancia pura.

Propiedades:

Origen	Semi-sintético
Calidad	Cumple Farmacopea Europea
Uso	Farmacéutico

Indicaciones:

Los estrógenos son las hormonas responsables del crecimiento y desarrollo de los caracteres sexuales femeninos: maduración de la vagina y útero, desarrollo de los senos, y mantenimiento de la estructura orgánica y capacidad funcional del aparato genital femenino. El estradiol en concreto se acepta que es la hormona ovárica natural, siendo las demás hormonas derivadas de éste.

Se utiliza en la terapia hormonal sustitutiva para prevenir la sintomatología y cambios metabólicos asociados con la pérdida de la función ovárica debida a la menopausia, y en casos de deficiencias de estrógenos como vaginitis atrófica, distrofia atrófica menopáusica de la vulva, síntomas vasomotores de la menopausia, y prevención de la osteoporosis.

También se utiliza en manifestaciones carenciales después de ovariectomía o castración actínica por enfermedades no neoplásicas, y en casos de metástasis de carcinoma prostático y cáncer de pecho en hombres y mujeres postmenopáusicas.

Por vía tópica se usa en solución hidroalcohólica en la terapéutica de la alopecia en mujeres con ovario poliúístico, en forma de geles transdérmicos para fines sistémicos, y en cremas vaginales (dichas cremas han de tener un pH de 3,5 – 6,5 según recomienda la USP).

La terapia prolongada con estrógenos aumenta la incidencia de hiperplasia y carcinoma de endometrio. Para paliar este riesgo se aconseja la administración adicional de progesterona en los últimos 12 días del ciclo.

Dosificación:

Vía oral, a la dosis de 1 – 2 mg/día.

Vía tópica, al 0,01 – 0,2 %.

Efectos secundarios:

Los estrógenos pueden producir náuseas, vómitos, retención de sodio y edema, dolor abdominal, aumento de peso, ginecomastia y mastalgia, cambios en la lívido, hemorragias vaginales, alteraciones de la función hepática, ictericia colestática, dolor de cabeza, mareos, depresión mental, cloasma y erupciones cutáneas. También se origina hipercalcemia, especialmente si se emplea en casos de metástasis malignas.

A dosis elevadas se ha observado cierre de las epífisis óseas. Estas dosis en carcinoma prostático en hombre o para suprimir la lactancia en mujeres, se han asociado con un incremento del riesgo de eventuales tromboembolias, aunque esta posibilidad es inexistente cuando se usa para la sintomatología postmenopáusica. Raramente se han dado casos de intolerancia a las lentillas de contacto, hirsutismo, alopecia, urticaria, eritema multiforme, hiperplasia endometrial, hipertrigliceridemia o hipertensión con dosis altas.

La administración transdérmica puede provocar eritema y prurito en la zona de aplicación, que generalmente desaparece a los 3 - 4 días de cambiar el parche. Con menor frecuencia se ha observado tumefacción, pápulas o vesículas, y descamación.

El tratamiento debe suspenderse inmediatamente en caso de experimentar algún episodio de hipercalcemia o tromboembolismo.

Contraindicaciones:

Pacientes con antecedentes familiares o historial de carcinoma o neoplasias estrógeno-dependientes de mama o del tracto genital, hiperplasia endometrial, trastornos tromboembólicos, trombosis pulmonar, enfermedad cardiovascular grave, tromboflebitis, insuficiencia hepática, historial de herpes gravídico y hemorragia vaginal no diagnosticada.

Precauciones:

Evitar el contacto de la sustancia con la piel, así como su inhalación, por lo que se recomienda el empleo de guantes de látex y mascarilla durante su manejo.

Debe evaluarse su uso y controlar a la persona en caso de asma, epilepsia, migraña, enfermedad cardíaca o renal, hipertensión, hiperprolactinemia, hipercalcemia, depresión, esclerosis múltiple, lupus eritematoso sistémico y otosclerosis. Pueden precipitar la aparición de porfiria en individuos susceptibles y exacerbar la diabetes mellitus. Se aconseja no utilizarlos durante el embarazo y la lactancia.

Debe emplearse con precaución en niños debido al cierre prematuro de la epífisis, con la consecuente inhibición del crecimiento lineal, estatura pequeña y/o desarrollo sexual precoz.

Antes de comenzar la terapia y durante la misma, deben realizarse exploraciones ginecológicas exhaustivas.

El tratamiento prolongado con estrógenos aumenta la incidencia de hiperplasia y carcinoma de endometrio; para paliar este riesgo se recomienda el uso adicional de un progestágeno.

Interacciones e Incompatibilidades:

Los estrógenos son inhibidores enzimáticos, pudiendo incrementar los niveles plasmáticos de antidepresivos tricíclicos, beta-bloqueantes y benzodiazepinas metabolizadas en el hígado, teofilina y ciclosporina.

Pueden reducir la acción de los antihipertensivos y antidiabéticos, y modificar el efecto de anticoagulantes orales.

La administración de inductores hepáticos tales como rifampicina, griseofulvina, barbitúricos, carbamazepina o fenitoína tienden a disminuir la actividad de éstos.

Condiciones de conservación:

En envases bien cerrados. PROTEGER DE LA LUZ.

Ejemplos de formulación:

Formulaciones más habituales:

Crema vaginal de 17 β -estradiol

Estradiol 17-beta	0,01 %
Brij 35	1 %
Alcohol cetílico	14 %
Vaselina líquida	5 %
Ácido láctico c.s.p. pH = 4,5 – 5	
Agua purificada c.s.p.	100 g

Gel de 17 β -estradiol

Estradiol 17-beta 0,06 %

Gel de Carbopol c.s.p. 100 ml

Modus operandi:

Pulverizar el estradiol y humectarlo con un poco de propilenglicol. Añadir el gel y homogeneizar.

Solución de 17 β -estradiol y betametasona

Estradiol 17-beta 0,01 %

Betametasona dipropionato 0,05 %

Alcohol etílico 90o c.s.p. 30 ml

Información complementaria:

Fabricante abala que el producto es libre de alérgenos, dado que el proceso de fabricación no se utilizan sustancias con contenido alérgico.

Bibliografía:

- *Martindale, Guía completa de consulta farmacoterapéutica, 1ª ed. (2003).*
- *The Merck Index, 13ª ed. (2001).*
- *Monografías de la SEFH.*
- *Trissel's Stability of Compounded Formulations (5th edition). Lawrence A.Trissel.*
- *International Journal of Pharmaceutical Compounding, INC. (2024).*
- *Documentación técnica proveedores.*

Última actualización: 08/2024