



algestona acetofenida + enantato de estradiol

Medicamento genérico Lei nº 9.787, de 1.999

Solução injetável
150 mg + 10 mg/ampola

FORMA FARMACÉUTICA E APRESENTAÇÕES

Solução injetável. Embalagem contendo 1 ampola de 1 mL.

USO ADULTO

Via intraglútea

Composição:

algestona acetofenida	150 mg
enantato de estradiol	10 mg
excipientes q.s.p.	1 mL

Excipientes: álcool benzílico, benzoato de benzila e óleo de gergelim.

INFORMAÇÕES AO PACIENTE

Ação esperada do medicamento

Algestona acetofenida + enantato de estradiol é um contraceptivo hormonal injetável para uso em dose única mensal, devendo ser utilizado somente sob orientação médica.

Cuidados de Conservação

Conservar em temperatura ambiente (15° C e 30° C). Proteger da luz.

Prazo de Validade

O prazo de validade do produto é de 24 meses, desde que observadas as condições de armazenamento. Não tome medicamento com prazo de validade vencido.

Gravidez e lactação

O produto não deve ser usado durante a gravidez e o período de lactação.



Informe ao seu médico a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informe ao seu médico se está amamentando.

ESTE MEDICAMENTO PODE INTERROMPER A MENSTRUÇÃO POR PERÍODO PROLONGADO E/OU CAUSAR SANGRAMENTOS INTERMENSTRUAIS SEVEROS.

Cuidados de administração

"Não use algestona acetofenida + enantato de estradiol sem receita médica, nem durante prazo de tempo superior ao recomendado pelo seu médico".

Algestona acetofenida + enantato de estradiol deve ser aplicado por via intraglútea profunda, entre o 7° e o 10° dia de referência no 8º dia, a contar do 1º dia da menstruação. O local da aplicação não deve ser massageado. Se estas recomendações não forem observadas, a eficácia do produto fica comprometida. Apesar de Algestona acetofenida + enantato de estradiol ser altamente eficaz, a prática e os estudos têm mostrado que podem ocorrer casos de gravidez, uma vez que, como todos os demais métodos de contracepção, também este não protege 100% das mulheres. A ocorrência destes casos de gravidez resulta de falhas do próprio método contraceptivo e/ou de outros fatores não relacionados ao medicamento. Estes estudos mostram que podem ocorrer gestações na proporção de 3 a 17 casos para cada 10.000 mulheres que utilizarem o produto durante 1 ano. Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre a indicação posológica e a duração do tratamento.

Interrupção do tratamento

Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.

Reações adversas

Como, efeitos adversos podem ocorrer principalmente dor no local da injeção, dor de cabeça, náuseas, vômito, tontura, dores nos seios, fadiga, reações na pele tais como acne ou coceira, tosse, humor deprimido e alteração do desejo sexual, alteração da menstruação e sangramento fora da menstruação. E com um ocorrer um encurtamento do ciclo menstrual (antecipação das regras), de 3 a 6 dias. Se ocorrerem reações desagradáveis graves (sobretudo cefaléias intensas, distúrbios visuais agudos, inflamação das veias ou varizes), procurar o médico. Informar ao médico o aparecimento de reações desagradáveis.

TUDO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

Contra-indicações e precauções

As principais contra-indicações para o uso do produto são doenças da coração e do aparelho circulatório, antecedentes de fibrilha, trombose, trombose embolia, sangramento genital de causa desconhecida, antecedentes de intolerância associada ao uso de outros contraceptivos hormonais (comumente chamados "pílulas"), gravidez e suspeitas de gravidez. Durante o uso de contraceptivos hormonais, o hábito de fumar, pode favorecer o desenvolvimento de complicações vasculares.

Não se recomenda o uso de anovulatórios hormonais por mulheres fumantes.

Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando antes do início ou durante o tratamento. O produto não deve ser usado durante a gravidez e o período de lactação. **Este medicamento causa mal formação ao bebê durante a gravidez.**

NÃO TOMO REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO, PODE SER PERIGOSO PARA A SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS AOS PROFISSIONAIS DE SAÚDE

CARACTERÍSTICAS

Algestona acetofenida + enantato de estradiol é um anticoncepcional injetável que se aplica por via intramuscular, somente uma vez por mês, trata-se da associação de dois princípios ativos: um gestágeno (acetofenida de didroprogesterona, DHPA) e um estrogênio (enantato de estradiol, EZEN).

Algestona acetofenida + enantato de estradiol provém de um estrogênio natural (estradiol), ao contrário dos estrogênios sintéticos utilizados em contraceptivos orais combinados (COCOs). Por isso, o risco de trombose venosa e outros eventos tromboembólicos é menor, pois os estrogênios sintéticos (COCOs) são mais potentes que os estrogênios naturais. Algestona acetofenida + enantato de estradiol podem ser diferentes daqueles em usuárias de COCs.

Estudos comparativos mostraram que DHPA+EZEN têm pouco ou nenhum efeito sobre pressão arterial, hemostase e coagulação, metabolismo de lípidos e carboidratos, e função hepática, ao contrário dos COCs. Além disso, a administração parenteral de algestona acetofenida + enantato de estradiol elimina o efeito da primeira passagem dos hormônios pelo fígado.

A dose do gestágeno (DHPA 150 mg) confere ao algestona acetofenida + enantato de estradiol o seu principal mecanismo de ação anticoncepcional: o efeito anovulatório por supressão da secreção de gonadotrofinas hipofisárias. Os efeitos gestágenos acessórios (modificação do muco cervical, alterações endométriais e da motilidade tubária desfavoráveis à fecundação e a capacidade do espermatócito de sobreviver a fecundação e a capacitação de desenvolvimento embrionário) são de menor importância em relação ao efeito anticoncepcional de algestona acetofenida + enantato de estradiol. Os efeitos estrogênicos são semelhantes aos de uma mulher em fase de maturação sexual normal. A presença de um estrogênio no produto previne a ocorrência de sintomas vasculares e hipertensão, correspondendo às tendências mais modernas em anticonceção injetável, tendo acatado significativamente maior que os preparados que contém exclusivamente gestágenos.

A proporção posológica entre DHPA e EZEN (150 mg:10 mg) foi selecionada em estudos comparativos por seu adequado balanço entre eficácia e tolerabilidade. Ao comparar esta posologia com a dos anticoncepcionais orais, deve-se ter em mente que os componentes de algestona acetofenida + enantato de estradiol não são derivados sintéticos tão potentes como os utilizados por via oral em microgramas, mas sim derivados diretos dos hormônios naturais do organismo, para produzir efeitos similares, são aplicados por via parenteral, em miligramas.

Para se avaliar a eficácia de um anticoncepcional, adota-se um índice denominado Índice de Pearl. Pela observação de estudos realizados em diversos países e com base no uso do produto por vários anos, o valor desse índice para o algestona acetofenida + enantato de estradiol pode variar de 0,03 como resultado de falhas do método (Índice de Pearl teórico) até 0,15/0,17 como resultado de falhas do método e/ou da usuária (Índice de Pearl real). Isto significa que, apesar da alta eficácia do produto, que é igual ou superior à dos anticoncepcionais orais, podem ocorrer gestações na proporção de 3 a 17 casos para cada grupo de 10.000 mulheres que utilizarem o produto durante 1 ano. Tolerabilidade: Estudos de algestona acetofenida + enantato de estradiol comparados com contraceptivos orais combinados anticoncepcionais orais combinados atualmente em uso. Algestona acetofenida + enantato de estradiol é uma solução oleosa administrada por via intramuscular. É distribuída no tecido adiposo, onde ocorre lenta liberação, assegurando seu efeito por todo o mês. O local da aplicação não deve ser massageado, pois pode-se acelerar sua absorção, com consequente diminuição da eficácia. O pico sérico de estradiol ocorre depois de 3 dias da aplicação e tem uma meia-vida

de 5,37 dias. Os metabólitos: ácido glucurônico e conjugados metabólicos de ácido sulfúrico, são eliminados primariamente na urina. A meia-vida da didroprogesterona e dos seus metabólitos é de 24 dias.

Após a administração, o efeito hormonal persiste durante todo o ciclo menstrual. A exceção se dá basicamente pelas fezes. Não consta que a aplicação repetida de algestona acetofenida + enantato de estradiol se compare com alterações nas características farmacocinéticas do produto, nem com sinais de acúmulo no organismo. Estudos de toxicidade em diferentes espécies de animais, falharam ao demonstrar a DL50 por via intramuscular, devido à ausência de óbitos, mesmo usando-se a dose máxima provável em cada espécie. Soluções oleosas de DHPA e EZEN foram aplicadas via i.m. na proporção de 15:1.

Os valores de DL50 obtidos foram:

- > 150 mg+10 mg / 1 mL/kg em ratos,
- > 375 mg+25 mg / 2,5 mL/kg em camundongos,
- > 750 mg+50 mg / 5 mL/kg em coelhos.

O único sinal tóxico foi uma discreta secação ocorrida logo após a administração e que desapareceu em 1-2 dias. Nenhuma intolerância local foi descrita. Depois de 14 dias podem-se observar hipotrofia ovariana e testicular, bem como dilatação e congestão uterina. Estes são considerados efeitos farmacológicos e não toxicológicos do produto. Estudos de toxicidade repetidos mostraram que o ciclo menstrual é abolido nas fêmeas e a espermatogênese nos machos. Em ratos, doses maiores que DHPA 30 mg + EZEN 2 mg por kg de peso corpóreo, i.m., correlacionam-se com atrofia ovariana e dilatação severa e, às vezes, com infecção uterina. Nos machos, há hipotrofia dos testículos e das glândulas sexuais acessórias, e em ambos os sexos hiperplasia da glândula pituitária e diminuição do peso corpóreo. Em cães, essa preparação causou hiperplasia pituitária e tumores na mama. Todos esses efeitos são reversíveis e desaparecem após a interrupção da administração, mesmo a progressiva, quando aplicados nas doses anuais em altas doses e por um longo período. É por isso que estudos da OMS têm desqualificado o modelo de cães como padrão quando avaliar a toxicidade do modelo de cães como padrão usados em mulheres. Por outro lado, estudos epidemiológicos mostraram que mulheres tratadas com a combinação de DHPA-EZEN falharam em demonstrar alguma correlação entre essa

formulação e carcinoma cervical.





Deve-se evitar o uso do produto em adolescentes que ainda não apresentem ciclos menstruais em ritmo regular. A gestação acetofenida + enantato de estradiol inibe a ovulação de maneira transitória e não é causa de esterilidade a posteriori. No entanto, deve-se ter em conta que, como ocorre com outros anticoncepcionais hormonais, o ciclo ovulatório natural pode ser interrompido por 2 a 3 meses após a suspensão do tratamento. Nos seguintes casos, o risco de uso de gestação acetofenida + enantato de estradiol geralmente supera os benefícios: fumante ativa (> 20 cigarros por dia) com mais de 35 anos de idade; amamentação (6 semanas a 6 meses pós-parto); < 21 dias pós-paro e não amamentando; antecedentes de câncer de mama; sangramento vaginal de origem desconhecida; uso de certos antibióticos e anticonvulsivantes (vide interações medicamentosas); cirrose grave (descompensada); tumores malignos de fígado. Nestes casos, o uso da droga requer cuidadoso julgamento clínico, levando-se em conta a gravidade do caso e a disponibilidade, praticidade e aceitabilidade de métodos alternativos de contracepção, bem como rigoroso acompanhamento médico.

CONTRA-INDICAÇÕES

Constituem contra-indicações absolutas: complicações sérias associadas ao uso de contraceptivos hormonais no passado; gravidez ou suspeita de gravidez; amamentação (menos de 6 semanas pós-paro); hipertensão; cardiopatia; diabetes mellitus ou outras doenças vasculares ou diabete com mais de 20 anos de duração; glaucoma; antecedentes de processos fibilíticos, tromboembólicos ou tromboembólicos; varizes importantes; sangramento genital de causa desconhecida; tumor ginecológico ou de mama; neoplasias benignas hormônio-dependentes; neoplasias malignas; hepatopatia em atividade; tumores malignos no fígado; anemia falciforme; epilepsia; colagenose com lesão visceral ou vascular, pré e pós-operatório, mulheres passíveis de imobilização (p. ex., após acidentes); história de icterícia, prurido grave, coréia ou herpes em gestação anterior. Constituem contra-indicações relativas: galactorréia; obesidade; hiperlipidemias; tabagismo; irregularidades menstruais frequentes; colestípticas; cefaléias severas (recorrentes, incluindo enxaqueca) com sintoma neurológico focal. A gestação acetofenida + enantato de estradiol não deve ser usado na presença de conhecida hipersensibilidade às substâncias ou a qualquer um dos componentes da fórmula.

POSOLOGIA

Uma ampola por via intragástrica profunda entre o 7º e 10º dia, de preferência no 8º dia, a partir do início de cada menstruação. Contar o primeiro dia de sangramento menstrual como dia número um. Não massagear o local da aplicação. Se estas recomendações não forem observadas, a eficácia do produto fica comprometida.

PRECAUÇÕES E ADVERTÊNCIAS

Antes de iniciar o emprego de gestação acetofenida + enantato de estradiol (ou qualquer outro contraceptivo hormonal), assim como periodicamente durante o seu uso, recomenda-se um exame geral completo, com minuciosa investigação ginecológica. Deve-se dedicar atenção especial à pressão arterial, mamas, abdome e órgãos pélvicos, incluindo esfregaço de Papanicolaou

esses testes estiverem anormais em uma paciente, o uso do produto deve ser descontinuado e os testes repetidos 2 meses após a suspensão. As pacientes usuárias do medicamento podem apresentar distúrbios do metabolismo do triptolano, o que pode resultar em relativa deficiência de piridoxina; não obstante, o significado clínico deste evento ainda não foi determinado. Os níveis séricos de folatos podem ser deprimidos pelo uso do medicamento. Mulheres que engravidarem pouco depois de começar o uso de contraceptivos hormonais têm maior probabilidade de desenvolverem defeitos congênitos.

Complicações a eles atribuídas. Pacientes com antecedentes de depressão psíquica devem ser cuidadosamente observadas e o uso do medicamento ser descontinuado se a depressão reaparecer em grau importante. As associações de estrógeno com gestágeno podem apresentar efeitos sobre o metabolismo dos hidratos de carbono e dos lipídios (diminuição da tolerância à glicose; alteração dos níveis séricos de triglicérides, de fosfolípidios, de diversas frações de colesterol, etc). Por este motivo, a administração de gestação acetofenida + enantato de estradiol ou de outros anticoncepcionais hormonais a mulheres portadoras de diabetes, pré-diabete ou distúrbios requer controle e vigilância contínua. Está bem estabelecido um aumento do risco de doenças tromboembólicas e tromboembólicas associado ao uso de anovulatórios em geral.

O médico deve estar alerta às manifestações precoces destes distúrbios (p.ex. tromboflebitas, embolia pulmonar, occlusão coronariana, etc). Em casos de suspeita de alguma dessas manifestações, o uso do medicamento deve ser interrompido imediatamente e o paciente encaminhado ao médico. Estes riscos cardiovasculares são maiores em mulheres fumantes, em mulheres com a idade e o fumo intenso (15 ou mais cigarros por dia) e mais acentuado em mulheres acima de 35 anos de idade. Recomenda-se que as mulheres tratadas com contraceptivos hormonais de qualquer tipo não fumem.

Foi relatado um aumento da pressão arterial em pacientes tomando anovulatórios, podendo em algumas mulheres ocorrer hipertensão pouco meses após o início do uso de tais produtos. Também aumenta o risco de doenças da vesícula biliar em usuárias de anovulatórios ou de estrógenos. Relata-se um risco de complicações tromboembólicas pós-cirúrgicas 4 a 6 vezes maior em usuárias de anovulatórios. Por este motivo, sempre que possível, o uso do medicamento deve ser descontinuado pelo menos 1 mês antes de uma cirurgia associada a risco aumentado de tromboembolismo.

Gravidez e lactação

Contra-indicado na gravidez. Pouco se sabe sobre efeitos ao usar gestação acetofenida + enantato de estradiol durante a gravidez. Pouco se sabe sobre efeitos ao usar gestação acetofenida + enantato de estradiol durante a lactação. Não se sabe se a gestação acetofenida + enantato de estradiol é excretado no leite materno. Não se sabe se a gestação acetofenida + enantato de estradiol causa mal formação ao bebê durante a gravidez.

feto se forem usados contraceptivos injetáveis combinados durante a gravidez. A administração de anovulatórios no período pós-parto pode interferir com a lactação, pode ocorrer uma diminuição na quantidade e na qualidade do leite materno. Além disso, identificou-se uma pequena fração dos componentes hormonais dos anovulatórios no leite das mães que os utilizaram; entretanto, um efeito sobre a criança amamentada, se existente, não foi constatado.

Em aproximadamente 3 semanas após o parto, a coagulação sanguínea e a fibrinólise normalizam-se essencialmente e o acetofenida + enantato de estradiol pode novamente ser usado a partir daí em mulheres que não estejam amamentando. Este medicamento causa mal formação ao bebê durante a gravidez.

ESTE MEDICAMENTO PODE INTERROMPER A MENSTRUÇÃO POR PERÍODO PROLONGADO E/OU CAUSAR SANGRAMENTOS INTERMENSTRUAIS SEVEROS.

Tal como sucede com os anticoncepcionais hormonais em geral, o uso concomitante de gestação acetofenida + enantato de estradiol com rifampicina, hidantoínas, barbitúros, antibióticos penicilínicos, cloranfenicol, griseofulvina, fenitoina, carbamazepina, primidona, isoniazida, nitrofurantoina, sulfonamidas e tetraciclina pode reduzir a eficácia contraceptiva do produto ou provocar irregularidades menstruais. Da mesma forma, os anticoncepcionais hormonais podem alterar a eficácia de anticonvulsivantes, anti-hipertensivos, hipotéticos, hipocímicos, anticoagulantes e antidepressivos.

REAÇÕES ADVERSAS

É possível que algumas mulheres notem mudanças no ciclo menstrual típico (ciclos menores, hemorragia intermenstrual, sangramento irregular), dismenorria, amenorria transitória, prurido vaginal, dores de estômago, náuseas, vômitos, cefaléias e alterações emocionais nos testes de excreção do fígado e alterações emocionais e da libido, alterações do peso corpóreo e fenômenos de fotossensibilização (ciclasma). Tontura, nervosismo, depressão, fadiga, acné, hipersensibilidade (prurido, tosse), distúrbios visuais e auditivos são prováveis, uma vez que eles podem ocorrer com qualquer

hormônio sexual, mas raramente foram relatados com gestação acetofenida + enantato de estradiol. Geralmente podem ocorrer no tratamento com contraceptivos hormonais outras reações adversas tais como tromboflebite, trombose arterial ou venosa, eventos tromboembólicos, derrame cerebral, cefaléias intensas (enxaqueca), hipertensão, neurralgia ou que poderia levar à suspensão do tratamento, embora não tenham sido associadas ao uso de gestação acetofenida + enantato de estradiol.

SUPERDOSE

Descobrem-se casos de superdosagem e reações adversas graves correlatas. Entretanto, em tais casos podem-se esperar náusea, vômito, mastodinia, cefaléias, retenção hídrica, alteração do sangramento endometrial e amenorria. Como não existem antídotos específicos, recomenda-se manter a pessoa afetada em observação, sob controle médico estrito e tratamento sintomático.

ARMAZENAGEM

Conservar em temperatura ambiente (temperatura entre 15° e 30° C). Proteger da luz.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

INFORMAÇÃO IMPORTANTE

Algestona acetofenida + enantato de estradiol deve ser aplicado entre o 7º e 10º dia, de preferência no 8º dia, contados a partir do dia do início da menstruação. Deve ser aplicado com agulha 30x7 ou 30x8 no região glútea, profundamente.

O local da injeção não deve ser massageado após a aplicação de gestação acetofenida + enantato de estradiol. Se estas recomendações não forem observadas, a eficácia do tratamento fica comprometida.

MS - 1.0043.0986

Farm. Resp. Dra. Sônia Albano Badaró - CRF-SP 19.258



Eurofarma

EUROFARMA LABORATÓRIOS LTDA.

Av. Ver. José Diniz, 3.465 - São Paulo - SP

CNPJ 1.61.130.096/0001-92

Indústria Brasileira



Eurofarma

0800-704-3876

www.eurofarma.com.br