



**EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS  
VECOL S.A.**

**1. NOMBRE DEL PRODUCTO**

**GESTAVEC® 25**

**2. REGISTRO I.C.A.**

**No. 1802 DB**

**3. FORMA FARMACEUTICA**

- Solución Inyectable - PROGESTÁGENO

**4. FORMULA CUALI Y CUANTITATIVA DE PRINCIPIOS ACTIVOS Y  
COMPONENTES DEL EXCIPIENTE:**

**COMPOSICIÓN:**

Cada ml contiene:

**Principio Activo:**

|                    |       |
|--------------------|-------|
| Progesterona       | 25 mg |
| Excipientes c.s.p. | 1 ml  |

**5. ACCION FARMACOLÓGICA Y MECANISMOS DE ACCIÓN**

**➤ FARMACOCINETICA**

Los Progestágenos de manera característica son bastantes lipófilos, y se difunden con libertad hacia las células, donde se unen al receptor de progesterona. Al igual que otros miembros de la superfamilia de receptores de esteroides/tiroides, el receptor de progesterona es un factor de transcripción nuclear activado por ligado

## EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.

que interactúa con un elemento de reacción de progesterona en genes, precondicionados para regular su expresión.

El receptor de progesterona se expresa en vías reproductoras femeninas, glándulas mamarias, sistema nervioso central (incluso, la región del generador de impulsos del hipotálamo) e hipófisis, pero por lo general tiene una distribución más limitada en los tejidos que los receptores de estrógenos u otras hormonas esteroides. En muchas células, los estrógenos inducen la expresión de los receptores de progesterona, cuya presencia es de un marcador frecuente de efectos de estrógenos en situaciones tanto de investigación como clínicas.

Hay un gran único que codifica para receptores de progesterona, pero en algunos tejidos se observan dos formas del receptor, las llamadas formas A y B. Esas surgen a partir de la utilización de dos codones de inicio de la traducción. El receptor A es la forma más pequeña y constituye una forma truncada del receptor B. Ambas modalidades de receptores se unen a la hormona y son activos como factores de transcripción, pero se desconoce la importancia fisiológica y farmacológica de las dos formas.

En muchos sistemas biológicos, los progestágenos aumentan la diferenciación y se oponen a las acciones de los estrógenos para estimular la proliferación de células. Este efecto de los progestágenos puede incluir decrementos de las concentraciones de receptores de estrógenos, aumentos del metabolismo local de estrógenos hacia metabolitos menos activos, o la inducción de productos de genes que disminuyen las respuestas celulares a compuestos estrogénicos.

### ABSORCIÓN, DESTINO Y ELIMINACIÓN

La progesterona no tiene actividad apreciable por vía oral, debido al extenso metabolismo hepático de primer paso. Esta hormona está disponible en una solución oleosa para administración por vía intramuscular, pero la preparación puede causar irritación local importante cuando se proporciona por esta vía. Se dispone de ésteres como *caproato de hidroxiprogesterona* y *acetato de medroxiprogesterona* para administración intramuscular, y el MPA y el *acetato de megestrol* pueden usarse por vía oral porque su metabolismo hepático está reducido de modo sustancial en comparación con la hormona original. Los esteroides 19-nor poseen actividad adecuada por vía oral debido a que el sustitutivo etinil en C17 hace muy lento el metabolismo en hígado. Se dispone de progestágenos sintéticos, para la liberación durante periodos muy prolongados.

## EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.

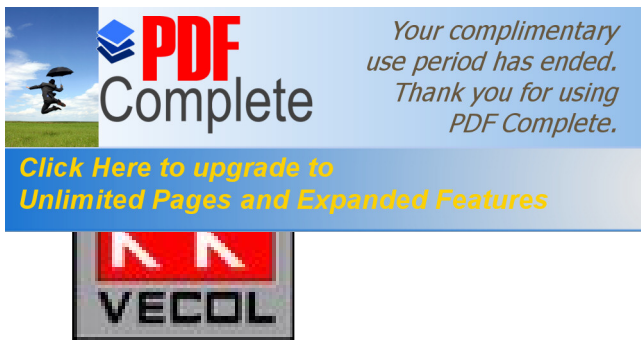
En plasma, la progesterona está unida a albúmina y globulina de unión a corticoides (CBG, o transcortina), pero ni muestra unión apreciable a la globulina de unión a esteroides sexuales (SSBG). Los compuestos 19-nor, como noretindrona, norgestrel y desogestrel. Se unen a la globulina de unión a esteroides sexuales y albúmina, y los ésteres, como el MPA, se unen principalmente a la albúmina. La unión total de todos esos compuestos sintéticos a las proteínas plasmáticas es extensa, de 90% o más, aunque la distribución de la unión a las diferentes proteínas es específica para el compuesto.

La vida media de la progesterona es de alrededor de cinco minutos, y la hormona se metaboliza principalmente en hígado hasta generar metabolitos hidroxilados y sus conjugados, sulfato y glucurónido, que se eliminan en la orina. Un metabolito urinario importantes específico para el metabolismo de la progesterona es el pregnano-3 $\alpha$ , 20 $\alpha$ -diol; su medición en orina y plasma se utiliza como un índice de la secreción de progesterona endógena. Los progestágenos sintéticos tienen vida media mucho más prolongadas, por ejemplo, de unas siete horas para la noretindrona, 16 para el norgestrel, 12 para el gestodeno, y 24 para el MPA. En tanto se carece de detalles completos con respecto a las progestinas sintéticas, se cree que se metabolizan principalmente en hígado, y la eliminación por lo general se efectúa *por medio* de la orina, como conjugados y diversos metabolitos polares.

### ➤ FARMACODINAMIA

Al contrario del receptor de estrógenos, que requiere un anillo fenólico A para unión de alta afinidad, el receptor de progesterona favorece una estructura de anillo  $\Delta^4$ -3-ona A en una conformación 1 $\beta$ -, 2 $\alpha$ -invertida. Otros receptores de hormonas esteroides también se unen a esta estructura de anillo o fenólico A, aunque la conformación óptima difiere de aquella para el receptor de progesterona. De este modo, algunos progestágenos sintéticos ( en especial, los compuestos 19 nor) muestran unión limitada a receptores de glucocorticoides, andrógenos y mineralocorticoides propiedad que tal vez explica algunas de sus actividades no progestacionales. La gama de actividades de esos compuestos depende mucho de grupos sustitutivos específicos ( en especial, la naturaleza del sustituto C 17 en el anillo D) de la presencia de un grupo metil C 19, y de un grupo etil en la posición C 13.

Una clase importante de compuestos es similar a al progesterona y su metabolito 17 $\alpha$ -hidroxiprogesterona. Esta última en sí es inactiva, pero algunos de sus



## EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.

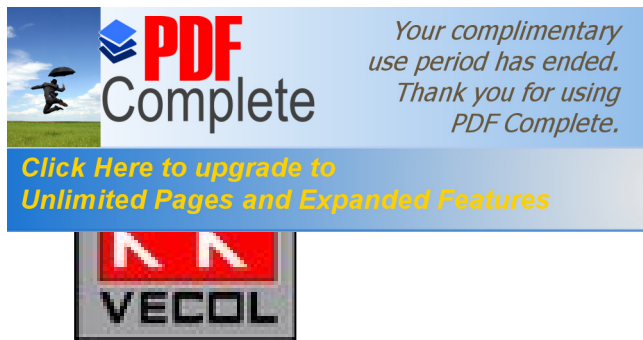
derivados éster tienen actividad progestacional.. Los compuestos como el caproato de hidroxiprogesterona poseen actividad progestacional, pero deben usarse por vía parenteral debido a metabolismo hepático de primer paso. Empero, las sustituciones de esos 17-ésteres en la posición 6 del anillo B proporcionan compuestos activos por vía oral como el acetato de clormadinona ( $6\alpha$ -cloro- $\Delta^6$ -17 $\alpha$ -acetoxiprogesterona). Los compuestos de esta clase química muestran actividad progestacional relativamente selectiva.

La segunda clase importante de compuestos es el grupo 19-nor. LA 1-nor progesterona (similar a la progesterona salvo porque el grupo metil C 19 queda reemplazado por un átomo de hidrógeno) tiene potente actividad progestacional, y los derivados de la 19-nor testosterona muestran principalmente acción progestacional más que androgénica. Un sustituto etinil en C 17 disminuye el metabolismo hepático y proporciona análogos de la 19-nor testosterona como noretindrona, noretinodrel y diacetato de etinodiol, que tienen actividad por vía oral. La adición de un grupo 13-etil a la noretindrona genera el gonano norgestrel, que es más potente que el compuesto original. Esos medicamentos son menos selectivos que los ésteres de progesterona mencionados y tienen grados variables de actividades andrógenicas, estrogénicas y antiestrogénicas.

### SINTESIS Y SECRECIÓN

La progesterona es secretada por los ovarios, principalmente a partir del cuerpo amarillo, durante la segunda mitad del ciclo menstrual. La secreción en realidad empieza justo antes de la ovulación, a partir del folículo que está destinado a liberar un óvulo. La formación de progesterona a partir de precursores esteroides, ocurre en ovarios, testículos, corteza suprarrenal y placenta. El efecto estimulante de la hormona luteinizante sobre la síntesis y secreción de progesterona por el cuerpo amarillo, está mediado por un receptor unido a membrana enlazado a una vía de transducción de señales acoplada a proteína G que incrementa la síntesis de cAMP mediante estimulación de la adenililciclase.

Si el óvulo queda fecundado, la o implantación tiene lugar unos siete días más tarde, y casi al mismo tiempo el trofoblasto en desarrollo empieza a secretar gonadotropina coriónica humana (CG) hacia la circulación materna, lo cual sostiene la vida funcional del cuerpo amarillo. La gonadotropina coriónica humana, detectable en la orina varios días antes del momento esperado del siguiente periodo



## EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.

menstrual, se excreta en cantidades progresivamente mayores durante alrededor de las cinco semanas que siguen, y en cantidades reducidas a partir de entonces durante todo el embarazo. En el transcurso del segundo a tercer mes de la gestación, la placenta en desarrollo empieza a secretar estrógenos y progesterona en colaboración con las suprarrenales del feto y, a partir de ese momento, el cuerpo amarillo no es esencial para la continuación del embarazo. La placenta sigue secretando estrógenos y progesterona en grandes cantidades hasta el momento del parto.

Las mediciones de la tasa de secreción de progesterona sugieren que, a partir de algunos miligramos al día secretados durante la fase folicular el ciclo, la tasa aumenta a 10 a 20 mg en el transcurso de la fase luteínica, y a varios cientos de miligramos durante la última parte de la gestación. Se han medido tasa de 1 a 5 mg/día en varones, y son comparables con las cifras en mujeres durante la fase folicular del ciclo.

### 6. PRESENTACIONES

- Frascos por 10 y 20 ml

### 7. INDICACIONES DE USO, DOSIFICACIÓN Y VÍAS DE ADMINISTRACIÓN

#### ♦ ESPECIES DE DESTINO

- Bovinos, Equinos, Porcino, Ovinos, Caninos y Gatos

#### ♦ USO

Se recomienda para mantener la preñez en caso de amenaza de aborto habitual por deficiencias de la hormona llamada Progesterona.

#### ♦ DOSIFICACIÓN

- ✓ Bovinos, Equinos de 2 a 4 ml
- ✓ Porcinos: de 0,6 a 1 ml
- ✓ Caninos y Gatos de 0.1 a 0.2 ml



## **EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.**

La frecuencia del tratamiento depende del Médico Veterinario.

### **♦ VÍA DE ADMINISTRACIÓN O APLICACIÓN**

- Se aplica únicamente por **Vía Intramuscular**

### **8. ADVERTENCIAS O ESPECIFICACIONES ESPECIALES DE USO**

#### **a. TIEMPO QUE DEBE TRANSCURRIR ENTRE EL ÚLTIMO DÍA DEL TRATAMIENTO Y EL SACRIFICIO DEL ANIMAL PARA CONSUMO HUMANO (PERÍODO DE RETIRO):**

- No aplica
- **TIEMPO QUE DEBE TRANSCURRIR ENTRE EL ÚLTIMO DÍA DEL TRATAMIENTO Y EL DESTINO DE LA LECHE, HUEVOS Y SUBPRODUCTOS PARA CONSUMO HUMANO**
- No aplica

### **9. PRECAUCIONES**

Ninguna en especial.

### **10. FORMA ADECUADA DE CONSERVACIÓN, TRANSPORTE Y DESTRUCCIÓN DEL PRODUCTO, MÉTODO DE ELIMINACIÓN DE LOS ENVASES**

- **Almacenamiento :**
  - Manténgase en lugar fresco y seco.
  - Almacenar entre 15° C y 25° C
  - Evite las temperaturas bajas
- **Transporte**
  - Tener cuidado de no romperlos durante su transporte el envase, manejarlos con cuidado.



## **EMPRESA COLOMBIANA DE PRODUCTOS VETERINARIOS VECOL S.A.**

- No transportar con alimentos
- **Manejo de los residuos:**
  - Quemar los envases y producto sin consumir
  - Recicle los insertos y el cartón del empaque

### **11. PERÍODO DE VALIDEZ**

- El período de validez es Cinco (5) años.