



GOSERELIN

Versión: 0

Fecha: 12/10/20

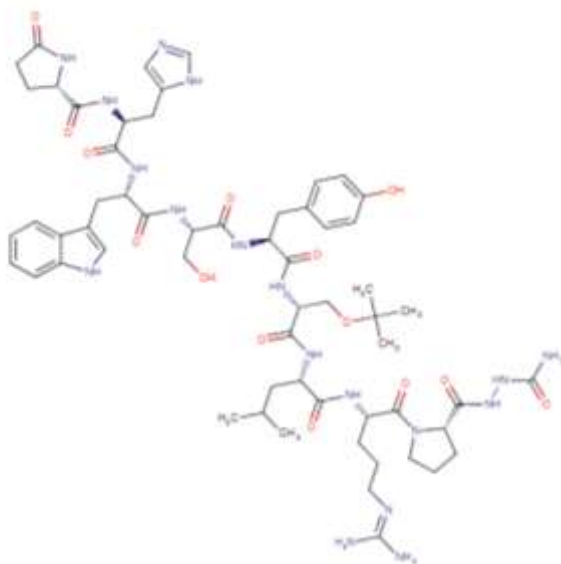
GENERALIDADES

Denominación común internacional: Acetato de goserelin

Sinonimias: No tiene

Nomenclatura IUPAC: (2S)-1-[[[(2S)-2-[[[(2S)-2-[[[(2R)-3-(tert-butoxy)-2-[[[(2S)-2-[[[(2S)-3-hydroxy-2-[[[(2S)-2-[[[(2S)-3-(1H-imidazol-5-yl)-2-[[[(2S)-5-oxopyrrolidin-2-yl] formamido]propanamido]-3-(1H-indol-3-yl) propanamido] propanamido]-3-(4-hydroxyphenyl) propanamido] propanamido]-4-methylpentanamido]-5-[[[diaminomethylidene]amino]pentanoyl]-N-(carbamoylamino)pyrrolidine-2-carboxamide (2S)-1-[[[(2S)-2-[[[(2S)-2-[[[(2R)-3-(tert-butoxy)-2-[[[(2S)-2-[[[(2S)-3-hydroxy-2-[[[(2S)-2-[[[(2S)-3-(1H-imidazol-5-yl)-2-[[[(2S)-5-oxopyrrolidin-2-yl] formamido] propanamido]-3-(1H-indol-3-yl) propanamido]propanamido]-3-(4-hydroxyphenyl) propanamido]propanamido]-4-methylpentanamido]-5-[[[diaminomethylidene] amino] pentanoyl]-N-(carbamoylamino)pyrrolidine-2-carboxamide.

Estructura química:



Familia: Análogos de LHRH (hormona liberadora de gonadotropina)

MECANISMO DE ACCIÓN:

El acetato de goserelin cuando se administra por primera vez aumenta de forma transitoria los niveles plasmáticos de la hormona luteinizante (LH) y la hormona folículo estimulante (FSH). La administración crónica produce una supresión sostenida de las gonadotropinas hipofisarias. La testosterona sérica cae a niveles comparables a la castración quirúrgica. El mecanismo exacto de este efecto es desconocido, pero puede estar relacionado con cambios en el control de la LH o la regulación negativa de los receptores de la LH.

En varones, la supresión de testosterona alcanza niveles de castración dentro de 2 a 4 semanas después del inicio.

En mujeres, la supresión del estradiol alcanza los niveles posmenopáusicos dentro de las 3 semanas y la FSH y la LH se suprimen a los niveles de la fase folicular dentro de las 4 semanas posteriores al inicio.

FARMACOCINÉTICA:

Absorción: Después de la administración subcutánea es bien absorbida. Puede ser detectado en suero a los 30 a 60 min. En los hombres, las máximas concentraciones plasmáticas se alcanzan de 12 a 15 días, y en las mujeres de 8 a 22 días.

Distribución: Volumen de distribución en hombres es de 44,1 L y en mujeres 20.3 L. Mínima Unión a proteínas plasmáticas menor al 30%.

Metabolismo: Durante su metabolismo hepático se somete a un proceso de hidrólisis de los aminoácidos C-terminales.

Eliminación: Renal (>90%), 20% como fármaco sin cambios.

Presentación: Implante en jeringa prellenada de 28 días de 3,6 mg

Implante en jeringa prellenada de 12 semanas de 10.8 mg.

Clasificación NIOSH: Grupo 1.

ADMINISTRACIÓN

Vías de administración: SC

El implante se administra insertando la aguja en un ángulo de 30 a 45 grados en la pared abdominal anterior debajo de la línea del ombligo, debido a la proximidad de la arteria epigástrica inferior subyacente y sus ramas. No se debe purgar.

Clasificación para Algoritmo de Extravasaciones: N/A

Premedicación /medicación concomitante recomendada: Ninguna

POSOLOGIA Y USOS FRECUENTES

CANCER DE MAMA AVANZADO

Implante de 3.6 mg cada 28 días.

CANCER DE PROSTATA AVANZADO

Implante de 3.6 mg cada 28 días o 10 mg cada 12 semanas.

ENDOMETRIOSIS

Implante de 3.6 mg cada 28 días durante 6 meses máximo.

CANCER DE PROSTATA, estadio B2 a C: en combinación con un antiandrógeno y radioterapia; comienza 8 semanas antes de la radioterapia: Implante combinado de 28 días / 12 semanas: implante de 3,6 mg, seguido en 28 días por implante de 10,8 mg.

Implante de 28 días (dosis alternativa): 3,6 mg; Repetir cada 28 días para un total de 4 dosis.

TOXICIDAD

No requiere ajuste de dosis.

EFFECTOS ADVERSOS

Órgano o sistema	Frecuencia	Hombre	Mujer
Cardiovascular	> 10%	No indica incidencia	Vasodilatación (57%), edema periférico (21%)
		Prolongación del intervalo QT	
	1-10%	Edema (7%), hipertensión (1-6%), insuficiencia cardíaca (5%), arritmia cardíaca (1-5%), ACV (1-5%), enfermedad vascular periférica (1-5%), vrices, dolor torácico (1-5%), infarto de miocardio (1-5%)	Edema (5%), hipertensión (1-6%), dolor torácico (1-5%), palpitaciones, taquicardia
	<1%	Trombosis venosa profunda, ataque isquémico transitorio, hipotensión	
SNC	> 10%	Dolor de cabeza (1-5%), depresión (1-5%), dolor (8-7%), insomnio (5-11%)	Dolor de cabeza (32-75%), labilidad emocional (60%), depresión (54%), dolor (8-17%), dispareunia (14%), insomnio (5-11%)
	1-10%	Mareos (5%), escalofríos (1-5%), ansiedad (1-5%)	Letargo (\leq 8%), migraña (1-7%), mareos (6%), nerviosismo (3-5%), ansiedad (1-5%), trastorno de la voz (3%), anomalías del pensamiento, somnolencia, parestesis

SNC	<1%	Reacción psicótica, apoplejía pituitaria	
Dermatológico	> 10%	Diaforesis (6%) erupción cutánea (6-8%)	Diaforesis (16-45%), acné vulgar (42%) al mes de comenzar, seborrea (26%), enfermedad del cabello (4%), prurito (2%)
		Alopecia, decoloración de la piel, xeroderma	
	<1%	Reacción en el lugar de aplicación	
Endocrino y metabólico	> 10%	Sofoco (64%)	Sofoco (57-96%), disminución de la libido (48-61%) Aumento de la libido (12%)
	1-10%	Ginecomastia (8%), gota (1-5%), hiperglucemia (1-5%)	
		Aumento de peso 1-5%, hirsutismo 7%	
	<1%	Disminución de la tolerancia a la glucosa, disminución del colesterol HDL, diabetes Mellitus, hipercalcemia, hipercolesterolemia, Hiperlipidemia, aumento del colesterol HDL, aumento del colesterol LDL, aumento de la ALT sérica, aumento de la AST sérica, aumento de los triglicéridos séricos, osteoporosis, síndrome de hiperestimulación ovárica.	
Gastrointestinal	> 10%	Náuseas (5-11%)	Náuseas (5-11%) dolor abdominal (7-11%)
	1-10%	Úlcera gástrica 1-5%	Aumento del apetito 2%
		Anorexia (1-5%), estreñimiento (1-5%), diarrea (1-5%), vómito (1-5%), dispepsia, flatulencia, xerostomía, insuficiencia renal (1-5%)	

Genitourinario	> 10%	Trastorno sexual (21%), disminución de la frecuencia eréctil (18%)	Vaginitis (75%), atrofia mamaria (33%), hipertrofia mamaria (18%), síntomas pélvicos (18%)
	1-10%	Dolor pélvico (6%), hinchazón de las mamas (1-5%), obstrucción del tracto urinario (1-5%)	Dolor pélvico (9%), hemorragia uterina (6%), vulvovaginitis (5%), mastalgia (1-7%), hemorragia vaginal
	<1%	Quiste ovárico	
Hematológico y oncológico	> 10%	Bengala tumoral	Bengala tumoral (23%)
	1-10%	Anemia 1-5%	
		Moretones, hemorragia	
	<1%	Neoplasia hipofisaria, incluyendo adenoma	
Neuromuscular y esquelético	> 10%	Disminución de la densidad ósea	Disminución de la densidad ósea 23% (4% de disminución desde el inicio 6 meses), debilidad (11%)
	1-10%	Mialgia, calambres de piernas, hipertonía	Mialgia (3%), calambres de piernas (2%), hipertonía (1%)
		Artralgia, artropatía	
	<1%	Fractura ósea	
Infección	> 10%	No se informa incidencia	Incidencia 13%
	1-10%	Sepsis 1-5%	No se informa incidencia
	<1%	Anafilaxis	

Respiratorio	1-10%	Infección superior (7%), EPOC (5%), síntomas de gripe, sinusitis	Síntomas de gripe 5%, faringitis (5%), sinusitis (1%)
		Bronquitis, tos, epistaxis, rinitis	
	<1%	Embolia pulmonar	
Otros	1-10%	Reacciones de hipersensibilidad, reacción en el sitio de aplicación, ambliopía, síndrome de ojo seco, fiebre	
	<1%	Reacción en el lugar de la inyección (incluyendo lesión vascular, dolor, hematoma, hemorragia, shock hemorrágico)	

BIBLIOGRAFIA

1. Drugbank. Disponible en <https://www.drugbank.ca/drugs/DB00014>. Último acceso 12/10/20
2. Prospecto Zoladex® Disponible en:
<https://medicines.astrazeneca.co.uk/home/oncology/zoladex/prescribing-information.html> .
Último acceso 09/04/2019
3. UpToDate. Disponible en <https://www.uptodate.com>. Último acceso 09/04/2019
4. Micromedex. Disponible en <https://www.micromedexsolutions.com/> Último acceso 12/10/2020.

Revisión	Fecha	Descripción	Responsables
0	12/10/2020	Versión original	Coord: Farm. Andrea Massa Farm. Maria Elisabet Fuentes Farm. Larrarte Yanina Farm. Villalba Cecilia