



El valerato de estradiol, cuyo principio activo es el 17 $\beta$ -estradiol, es idéntico química y biológicamente al estradiol endógeno humano. Se absorbe rápida y completamente desde el tracto gastrointestinal. Se une en un 50% a proteínas plasmáticas y se metaboliza en el hígado a estriol y estrona. El etinilestradiol es un potente estrógeno sintético, con escaso metabolismo hepático, no disponible en España de forma aislada. Se une en gran medida, pero no específicamente a la albúmina plasmática de SHBG. Sufre una conjugación presistémica en la mucosa del intestino delgado y del hígado.

## **USO CLÍNICO**

Fase inicial de estrogenización, similar a lo que ocurre de forma natural en el inicio de la pubertad, y suele oscilar entre 24-36 meses (estradiol) en adolescentes mayores de 12 años (**E:** *off-label*).

Terapia hormonal sustitutiva (en adultos): asociado a progestágenos (a gestodeno, desogestrel, drospirenona, entre otros) (**A**).

## **DOSIS Y PAUTAS DE ADMINISTRACIÓN**

Se puede emplear mediante:

- Administración continua: fase inicial de estrogenización.
- Administración secuencial continua: se añade el progestágeno durante 10-14 días/ mes / ciclo de 28 días.

### **Administración:**

Para la inducción de la pubertad se comenzará con dosis iniciales de estrógenos muy bajas; ya que, los estrógenos son un potente inductor de la fusión epifisaria. Los regímenes más habitualmente empleados incluyen la administración oral de 17  $\beta$ -estradiol (5  $\mu$ g/kg/día) o etinil-estradiol (2,5-5  $\mu$ g/día). Esta dosis inicial se incrementará lentamente, cada 6-12 meses, durante un periodo no inferior a 2-3 años, hasta alcanzar la dosis diaria de sustitución estrogénica de una mujer adulta, que correspondería a 10-20  $\mu$ g de etinil-estradiol o 1-2 mg/día de 17  $\beta$ -estradiol. Si se produce sangrado menstrual o pequeños manchados debe añadirse un progestágeno cíclico (12-14 días de cada mes) para la protección uterina y establecer ciclos menstruales regulares mensuales.

## **CONTRAINDICACIONES**

- Enfermedad tromboembólica arterial activa o reciente.
- Trastornos trombofílicos conocidos (deficiencia de la proteína C o antitrombina).
- Tromboembolismo venoso actual o idiopático previo.
- Hiperplasia endometrial no tratada.
- Sangrado genital no diagnosticado.
- Hipersensibilidad conocida al principio activo o algunos de los excipientes.
- Enfermedad hepática aguda o antecedente de enfermedad hepática si las pruebas de función hepática continúan alteradas.

- Tumores estrógeno dependientes malignos o sospecha de los mismos (carcinoma de endometrio).
- Hipertrigliceridemia grave.

## **PRECAUCIONES**

Antes de iniciar o reinstaurar el tratamiento hormonal, debe realizarse una historia clínica completa personal y familiar.

Vigilar estrechamente al paciente si presentara:

- Ictericia o deterioro de la función hepática.
- Aumento de la tensión arterial.
- Embarazo.
- Migraña o cefalea grave.
- Epilepsia.
- Asma.
- Factores de riesgo para trastornos tromboembólicos.
- Factores de riesgo para tumores estrógeno dependientes (carcinoma de mama en familiares de primer grado).
- Colelitiasis.

## **EFECTOS SECUNDARIOS**

- Tensión mamaria. En un 20-35% de pacientes.
- Reacciones locales. En un 10-25%, principalmente, moderado con o sin prurito.
- Leucopenia.
- Irritabilidad y dolor de cabeza.
- Retención de líquidos, sensación de pesadez en las piernas.
- Disminución de la tolerancia a la glucosa.
- Náuseas, cefalea, mareos, vértigo, síntomas depresivos.

## **INTERACCIONES FARMACOLÓGICAS**

El metabolismo de los estrógenos puede aumentar debido al uso concomitante de sustancias inductoras de las enzimas que metabolizan fármacos, específicamente las enzimas del citocromo P450, tales como anticonvulsivantes (fenobarbital, fenitoína, carbamazepina) y antiinfecciosos (rifampicina, rifabutina, nevirapina, efavirenz).

No deben tomarse preparaciones a base de plantas medicinales con hierba de San Juan (*Hypericum perforatum*).

## **DATOS FARMACÉUTICOS**

**Presentaciones comerciales:** las presentaciones disponibles en España pueden consultarse en línea en el Centro de Información de Medicamentos de la AEMPS (CIMA), <http://www.aemps.gob.es/cima>, y en <https://www.aeped.es/comite-medicamentos/pediamecum> en el enlace "Presentaciones" correspondiente a cada ficha.

---

## **BIBLIOGRAFÍA**

- Fichas técnicas del Centro de Información *online* de Medicamentos de la AEMPS-CIMA [base de datos en Internet]. Madrid, España: Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS) [consultado en noviembre de 2020]. Disponible en: <https://cima.aemps.es/cima>
- Guía de Prescripción Terapéutica [base de datos en Internet]. Madrid, España: Agencia Española de Medicamentos y Productos Sanitarios (AEMPS) [consultado el 3/03/2013]. Disponible en: [www.imedicinas.com/GPTage/](http://www.imedicinas.com/GPTage/)
- Micromedex Healthcare® Series [base de datos en Internet]. Greenwood Village, Colorado: Thomson Micromedex Drugdex® System. 1974-2012. Disponible en: [www.thomsonhc.com/home/dispatch](http://www.thomsonhc.com/home/dispatch)
- Sociedad Española de Contracepción. Anticonceptivos hormonales orales comercializados en España. Disponible en: <http://sec.es/>
- Villa LF (ed.). Medimecum, guía de terapia farmacológica. 16.ª edición. España: Adis; 2011.

**Fecha de actualización:** noviembre de 2020.

**La información disponible en cada una de las fichas del Pediamécum ha sido revisada por el Comité de Medicamentos de la Asociación Española de Pediatría y se sustenta en la bibliografía citada. Estas fichas no deben sustituir en ningún caso a las aprobadas para cada medicamento por la Agencia Española del Medicamento y Productos Sanitarios (AEMPS) o la Agencia Europea del Medicamento (EMA).**