

USO: Interno

CAS: 82640-04-8

Fator de Correção: Não se aplica

FM: C28H27NO4S.HCl

Fator de Equivalência: Não se aplica

PM: 510,05

DCB: 07622

RALOXIFENO HCL **ANTIOSTEOPORÓTICO**

Propriedades

Quimicamente é um derivado do benzotiofeno, que atua como um agonista e modulador seletivo do receptor estrogênico do tecido ósseo e sobre os receptores relacionados com a regulação dos lipídeos sanguíneos, ao passo que se comporta como antagonista para os efeitos estrogênicos sobre o útero e a glândula mamária.

Após administração oral, o **Raloxifeno** é rapidamente absorvido, sua biodisponibilidade absoluta é de 2% em função de uma intensa metabolização de primeira passagem (glicuronidação) o nível plasmático é mantido pela circulação êntero-hepática, sendo sua meia-vida de 27,7 horas. É eliminado principalmente por via fecal.

Indicações

Osteoporose pós-menopáusia (tratamento preventivo).

Demais: possível redução dos riscos de doenças cárdio-vasculares, proteção contra o câncer de mama, proteção contra o câncer de endométrio, possível prevenção da doença de Alzheimer.

Posologia

60mg uma vez ao dia, por via oral. Em mulheres com dieta insuficiente de cálcio e Vitamina C, indica-se a complementação dos mesmos.

Excipientes

Pode ser utilizado, lactose monohidratada, lauril Sulfato de Sódio (1,5%), polissorbato 80, estearato de Mg e dióxido de titânio, polietilenoglicol.

Superdosagem

Não se conhecem os efeitos. Em caso de superdose, instaurar tratamento sintomático e de suporte.

Reações adversas

Doença tromboembólica (menos de 1%), rubor, calor (24%), câibras (5,5%), edema periférico (3,1%).

Precauções

Não se realizaram estudos que garantam a segurança de sua administração juntamente com um tratamento de reposição estrogênica sistêmica. Na ausência de estudos clínicos, desconhece-se a influência da enfermidade hepática sobre a administração de **Raloxifeno**; apesar disto, recomenda-se precaução devido a sua ampla metabolização no fígado. A presença de sangramento uterino ou vaginal não deve ser creditada ao **Raloxifeno**, devendo sua causa ser investigada. Em estudos com animais, verificou-se que o **Raloxifeno**, em doses 400 vezes superiores àquelas recomendadas em humanos, aumenta a incidência de tumores ovarianos. Devido ao risco de episódios tromboembólicos, sua administração deve ser interrompida se o paciente adquire uma enfermidade ou condição que o obrigue a manter imobilidade por períodos prolongados.



Interações

Varfarina e cumarinas: não há variação dos níveis plasmáticos de ambos os fármacos; não obstante observaram-se discretas reduções do tempo de protrombina; assim, este parâmetro deve ser monitorado.

Não se registrou interação com digoxina, carbonato de cálcio, antiácidos contendo hidróxido de alumínio e magnésio, fenitoína, tamoxifeno, paracetamol, AINE (ácido acetilsalicílico, ibuprofeno, naproxeno), antagonistas H₁, antagonistas H₂, benzodiazepínicos. Colestiramina: não administrar conjuntamente, pois inibe a absorção do fármaco e interfere com a circulação êntero-hepática.

Ampicilina: reduz a velocidade de absorção do **Raloxifeno**, porém não modifica sua biodisponibilidade.

Contra-indicações

Hipersensibilidade ao fármaco. Mulheres grávidas, pré-menopáusicas ou que possam vir a engravidar. Pacientes com antecedentes ou condições que favoreçam patologias tromboembólicas.

Associações

- Ampicilina interagindo com **Raloxifeno** promove redução da velocidade de absorção, aumento do tempo para atingir o pico plasmático do **Raloxifeno**, porém sua biodisponibilidade não é alterada.
- Colestiramina não administrar com **Raloxifeno** de forma conjunta. A colestiramina inibe a absorção do **Raloxifeno** e interfere com a circulação êntero-hepática reduzindo o efeito do mesmo.

Eficácia

Em estudos clínicos com esquemas de tratamento de 2 anos de duração em mulheres pós-menopausadas, o **Raloxifeno** administrado juntamente com um suplemento dietário de cálcio, produziu aumento da densidade óssea em geral, especialmente em quadril e coluna. O colesterol LDL é reduzido significativamente nos pacientes que recebem **Raloxifeno** sem que outras frações lipídicas sejam afetadas, exceto o colesterol da HDL 2, o qual sofre aumento.

De acordo com estudo publicado na última semana no JAMA - *Journal of the American Medical Association*, mostra que o medicamento **Raloxifeno** aumenta a densidade óssea na coluna vertebral e no colo do fêmur, e reduz o risco de fraturas das vértebras em mulheres após a menopausa.

Referencias

1. http://www.ucg.br/ucg/institutos/nepss/monografia/monografia_12.pdf
2. http://www.scielo.br/scielo.php?script=sci_arttext&pid=S0004-27301999000600008 Consultado em 02.04.12
3. SWEETMAN, S.C; et al; MARTINDALE – Guia Completo de Consulta farmacoterapeutica. Barcelona. 2ª Ed. 2005.
4. DEF- Dicionário de Especialidades Médicas, 2009/10. Editora de Publicações Científicas LTDA.
5. ANFARMAG; MANUAL DE EQUIVALÊNCIA. São Paulo/SP, 3ª Ed. 2010.
6. GOODMAN & GILMAN. As bases Farmacológicas da Terapêutica, Editora mac graw hill. 11ª Edição, 2006.

Ultima alteração: 17.07.2012 DP