#### HORMONAS SEXUALES

ANDRÓGENOS, ESTRÓGENOS, PROGESTÁGENOS, CONTRACEPTIVOS HORMONALES

#### **SUMARIO**

ANDRÓGENOS, ESTROGENOS, PROGESTÁGENOS, CONTRACEPTIVOS HORMONALES:

Acciones farmacológicas. Usos terapéuticos. Efectos Indeseables. Vías de Administración. Ejemplos de los mas empleados.

(1889)

Brown-Séquard, preparó un extracto tisular y se lo administró a si mismo, comprobando que había ganado en vigor y capacidad de trabajo.

Principio activo: TESTOSTERONA

SÍNTESIS:

**Testículo** 

Ovario

Corteza Suprarrenal

#### **CLASIFICACIÓN:**

- 1- Esteres de la testosterona: Propionato, Enantato, Cipionato
- 2- Derivados de 17-alquiltestosterona: Metiltestosterona, Fluoximesterona, Oximetazolona
- 3- Esteroides anabólicos: Metandienona, Nandrolona

#### Acciones farmacológicas:

- 1- Responsables de los cambios de la pubertad que transforman al niño en hombre.
- 2- Hombre con hipogonadismo: corrigen los trastornos de la insuficiencia testicular
- 3- Inhiben la espermatogénesis (dism. Secrec. Hipofisaria de gonadotropinas)

#### Acciones farmacológicas:

- 4- Virilización (en la mujer) (dosis altas o mantenidas)
- 5- En la vida fetal, interviene en la diferenciación del aparato reproductor
- 6- Efecto anabólico (estimulan el anabolismo proteico)

#### Mecanismo de acción:

Es convertida por una 5 alfa reductasa en dihidrotestosterona, que es más activa. Esta se une a una proteína receptora citoplásmica y pasa al núcleo, con el resultado de mayor actividad de RNA polimerasa y síntesis de RNA y proteínas

#### Toxicidades:

- 1. En mujeres: Masculinización (acné, crecimiento del vello facial, voz grave). Masculinización de fetos hembras.
- 2. En hombres : Priapismo
- 3. En niños : trastornos del crecimiento y del desarrollo sexual y òseo
- 4. Impotencia, azospermia, edema, aumento de peso, carcinoma hepático

#### Indicaciones:

- 1. Hipogonadismo (en el hombre)
- 2. Mejorar forma atlética (ilegal)
- 3. Anemias refractarias
- 4. Cáncer de mama
- 5. Acelerar crec. en niños (discutido)

#### CONTRAINDICACIONES

- 1- Embarazo
- 2- Cáncer de pròstata
- 3- Hepatocarcinoma
- 4- Enfermedad renal o cardiovascular

PREPARADOS: TESTOSTERONA (Ampula 25mg/ml, (Ampula 100 mg/ml) TESTOSTERONA ENANTATO (200 mg/ml PROPIONATO (25 y 200 mg/ml, s.c.) METILTESTOSTERONA (TAB. 5 mg) FLUOXIMESTERONA (TAB. 2 y 5 mg)

#### ANTIANDROGENOS

#### CIPROTERONA

Usos clínicos:

- 1- Cáncer de próstata
- 2- Pubertad precoz en hombres
- 3- Acné e Hirsutismo en mujeres
- 4- Hipersexualidad en hombres
- 5- Contraceptivo hormonal y Acné (asociado a Estrógenos)

#### ANTIANDROGENOS

#### CIPROTERONA EFECTOS INDESEABLES

- 1- Disminución de la líbido
- 2- Modificación del peso corporal
- 3- Inhibición de la espermatogénesis e infertilidad
- 4- Ginecomastia
- 5- Cambios en la tensión arterial

#### ANTIANDROGENOS

FLUTAMIDA
BICALUTAMIDA
NILUTAMIDA
FINASTERIDA (ùtil en la
Hiperplasia Prostática Benigna)

(CARACTERISTICAS FARMACOLÓGICAS SIMILARES A LA CIPROTERONA)

(1926)

Leewe y Lango, descubrieron una hormona sexual femenina en orina de mujeres menstruantes y que su concentración variaba según la fase del ciclo menstrual.

SÍNTESIS: Ovario

Placenta

**Testículos** 

Glándulas suprarrenales

**ESTROGENOS NATURALES:** 

Estrona, Estriol, Estradiol

#### **ESTROGENOS SINTETICOS:**

1- Agentes Esteroideos: Etinilestradiol

Mestranol

2- Agentes no Esteroideos: Dietilestilbestrol
Dinestrol

 Responsables del desarrollo y mantenimiento de los caracteres sexuales femeninos secundarios.

 Controlan los cambios cíclicos a los cuales el útero y la vagina están sometidos durante el ciclo menstrual

#### **ACCIONES FARMACOLÓGICAS:**

- 1- Cambios de las niñas en la pubertad.
- 2- INHIBEN LA OVULACIÓN POR INHIBICIÓN DE LA LH
- Acciones metabólicas: Aumentan glicemia, disminuyen colesterol, retienen Na y H2O

#### **ACCIONES FARMACOLOGICAS:**

- 4. Acción carcinógena (desarrollo de tumores) NO a embarazadas
- 5. Pueden inducir el flujo menstrual cuando los ovarios no son funcionales
- 6. Ciclo menstrual

MECANISMO DE ACCION:

ESTROGENO

RECEPTOR

(nucleo)

Secuencia específica de nucleótidos

Aumento o Disminución en la transcripción de genes regulados por hormonas

#### Toxicidades:

- 1. Náuseas (el mas frecuente)
- 2. Vómitos, diarreas, anorexia (dosis altas)
- Edemas, aumento de tamaño de las mamas, cefalea, depresión,
- 4. Aumento riesgo de tromboembolismo
- La adm. de pequeñas dosis en ttos, prolongados: sangramientos uterinos y nódulos de mama

#### **USOS CLINICOS:**

- 1- Contracepción hormonal
- 2- Terapia hormonal posmenopáusica
- 3- Trastornos del desarrollo ovárico
- 4- Cáncer de próstata
- 5- Hemorragia uterina disfuncional
- 6- Dismenorrea
- 7- Cáncer de mama

#### **PREPARADOS**

- DIETILESTILBESTROL DIPROPIONATO (Tab 1 y 5 mg)
- ESTRADIOL DEPÓSITO (Amp. 10 mg/ml)
- ESTRADIOL (Tab. 0.5, 1 y 2 mg)
- ESTRÓGENOS CONJUGADOS (tab. 0.625 mg y crema vaginal 25 g)
- ETINILESTRADIOL (Tab. 0,02, 0,05 mg)

#### **ANTIESTRÓGENOS**

**TAMOXIFENO:** 

(Para cáncer mamario)

**CLOMIFENO:** 

Infertilidad causada por anovulación

#### SÍNTESIS DE PROGESTERONA:

**Placenta** 

Cuerpo amarillo

Glándulas suprarrenales

Agentes que semejan la acción de la progesterona

Debe existir acción estrogénica previa

#### ACCIÓN PROGESTACIONAL:

Producir en el endometrio los cambios necesarios para la implantación del huevo fecundado

#### PROGESTAGENOS SINTETICOS:

- 1- AGENTES SIMILARES A LA PROGESTERONA: Progesterona, Caproato de Hidroxiprogesterona, Acetato de Medroxiprogesterona
- 2- AGENTES SIMILARES A LA 19-NORTESTOSTERONA: Noretindrona, Noretinodrel, Norgestrel, Desogestrel, Norgestimato

#### Acciones Farmacológicas:

- Conduce al desarrollo de un endometrio secretorio
- 2- Proliferación de los acinos de la glándula mamaria
- 3- IMPIDEN LA OVULACIÓN AL FRENAR LA LH
- 4- Suprime contracción uterina

#### MECANISMO DE ACCIÓN

Similar a los Estrógenos

Debe existir acción estrogénica previa lo que garantiza un adecuado número de receptores para la Progesterona

#### Toxicidades:

- 1- A bajas dosis en indicaciones ginecológicas: POCAS toxicidades
- 2- A dosis altas en indicaciones oncológicas: náuseas, vómitos, retención de agua, fiebre, diarreas, cólicos, acné, ginecomastia, edemas, alteraciones de la líbido

#### Usos terapéuticos:

- 1- Contracepción hormonal (solos o combinados con Estrógenos)
- 2- Terapia hormonal posmenopáusica
- 3- Hemorragia uterina disfuncional
- 4- Dismenorrea
- 5- Aborto
- 6- Carcinoma de endometrio

LOS MAS USADOS:

- MEGESTROL
- MEDROXIPROGESTERONA

#### PREPARADOS:

- PROGESTERONA (AMP. 25 o 50 mg/ml)
- CAPROATO DE HIDROXIPROGESTERONA (AMP. 125 O 250 mg/2ml)
- ACETOXIPROGESTERONA (TAB. 5mg)
- EDROXIPROGESTERONA (TAB. 5 mg)
- NORETISTERONA (TAB. 0,35 mg)

Preparado combinado:

ESTRÓGENO + PROGESTÁGENO

(Inhibe la ovulación porque inhibe la LH)

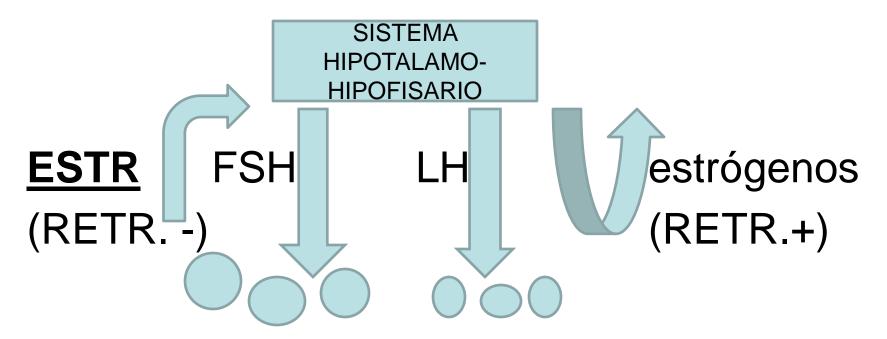
CLASIFICACION

1- CONTRACEPTIVOS ORALES COMBINADOS: (Estrógenos y Progestágenos)

2- PROGESTAGENOS SOLOS

MECANISMO DE ACCION

La combinación ESTROGENO-PROGESTAGENO inhibe la ovulación de forma sinérgica.



#### **Toxicidades:**

- 1- Tratornos Gastrointestinales: <u>NAUSEAS</u>, vomitos, dolor abdominal
- 2- Trastornos Cardiovasculares: tromboflebitis, tromboembolia, aceleración de la coagulación sanguínea, aumento TA

- 3. Cáncer: (vaginales, uterinos, mamarios)
- 4. Cefalea, mareos, aumento de peso, molestias en mamas, depresión, fatiga, dism. act. sexual., edemas,

#### USOS CLINICOS

- 1. Prevención del embarazo
- 2. Endometriosis
- 3. Dismenorreas
- 4. Hemorragia uterina disfuncional
- 5. Hirsutismo

#### Preparados:

#### Monofásicos:

- Etinilestradiol (35g) + Noretindrona (1mg)
- Etinilestradiol (30 g)+ Levonorgestrel (0,15 mg)
- Mestranol (0,05 mg + Noretisterona (1 mg)

#### Bifásicos:

Etinilestradiol (35 g) + Noretindrona (0,5 mg) (días 1-10)

Etinilestradiol (35 g) + Noretindrona (1 mg) (días 11-21)

```
Trifásicos:
```

```
Etinilestradiol (35 g)+Norgestimato(0,18 mg) (días 1-7)
```

Etinilestradiol(35 g)+Norgestimato(0,215mg) (días 8-14)

Etinilestradiol(35g)+Norgestimato(0,25mg) (días 15-21)

# PARCHES ANTICONCEPTIVOS TRANSDERMICOS

Se colocan en el abdomen y se reemplaza cada 7 días durante las tres primeras semanas de cada ciclo.

VENTAJA: Duración del efecto por 7 días