

## Pohlavní hormony a jejich deriváty, HAK, HRT, Uterotonika, tokolytika.

### Pohlavní hormony a jejich deriváty, HAK, HRT

#### Ovariální hormony

##### Estrogeny a látky, které je ovlivňují

estradiol, estron, estriol

estery estradiolu: estradiol dipropionát, estradiol benzoát pro i.m. podání  
estradiol valerát pro p.o. podání

Parciální agonisté: tamoxifen – inhibuje růst hormonálně dependentních buněk karcinomu prsu  
raloxifen

Antiestrogeny: klomifen – blokuje estrogenové receptory v hypotalamu a hypofýze

Inhibitory biosyntézy estrogenů: anastrozol – sel.blokátor aromatázy  
aminoglutetimid – nes.inhibitor steroidogeneze v kůře nadledvin

##### Gestageny (progesterony, progestiny)

progesteron

Syntetické progestiny, deriváty 17-hydroxyprogesteronacetátu: hydroxyprogesteron kaproát pro i.m.  
megestrolacetát pro p.o.

medroxyprogesteronacetát pro p.o.

Syntetické progestiny, deriváty 19-nortestosteronu: noretisteron, lynestrenol, levonorgestrel, gestoden,  
desogestrel

Atypické progestiny: tibolon, drospirenon

#### Hormonální antikoncepce

**Perorální hormonální antikoncepce:** vychází z účinku nízkých a středních dávek etinylestradiolu kombinovaných s progestiny-noretisteronem a lynestrenolem nebo s gonany: levonorgestrel, desogestrel, gestodenum nebo cyproteron acetátem.

Kombinovaná antikoncepce: estrogeny+progestiny

Antikoncepce založená pouze na progestinech (minipilulky)- noretisteron, lynestrenol

Postkoitální antikoncepce- levonorgestrel, etinylestradiol

**Parenterální antikoncepce:** medroxyprogesteron pro i.m.podání, levonorgestrel intrauterinně nebo s.c. jako implantované tyčinky

**NÚ:** tromboembolické příhody, riziko infarktu myokardu a cévní mozkové příhody, kancerogenita, bolesti hlavy vaskulárního typu, nauzea, snížení libida, napětí prsů

#### Mužské pohlavní hormony – androgeny

testosteron

estery testosteronu: testosteron propionát, testosteron fenylpropionát, izokaproát, testosteron undekanoát

Syntetické androgeny: mesterolon

Antagonisté androgenních receptorů: finasterid, flutamid, cyproteron

## UTEROTONIKA A TOKOLYTIKA - látky ovlivňující hladké svaly děložní

• UTEROTONIKA – vyvolávají nebo zesilují kontrakce myometria těhotné dělohy v období porodu (↑ tonus dělohy, podporují relaxaci děložního hrdla)

- **oxytocin** - působí kontrakce myometria gravidní dělohy při porodu (↑ f a amplitudu), ejekce mléka při kojení, i.v. podání → vazodilatace a ↓ TK

**MÚ:** vazba na oxytocinové receptory → vzestup intracelulární koncentrace  $Ca^{2+}$ , tvorba PG)

**ind.:** indukce porodu, zesílení slabých kontrakcí, k involuci dělohy po porodu, profylaxe/léčba děložního krvácení z hypotonie dělohy, podpora ejekce mléka

- dobré vstřebání z podkoží, svalů, nosní sliznicí (NE p.o.)

**KI:** tetanická kontrakce dělohy (asfyxie plodu), retence vody s hyponatrémií, otoky, hypotenze matky, bradykardie plodu

- **karbetocin** - syntetický derivát oxytocinu, delší úč.

- **prostanoidy** a deriváty:

**dinoproston** – syntetický PG, působí kontrakce děložního těla, relaxace děložního hrdla, působí v celém období gravidity (x oxytocin)

**MÚ:** stimulace receptorů spřažených s G-proteinem (uterotonika ↓ cAMP)

**ind.:** po lokálním podání **užití ke zrání děložního hrdla a indukci porodu, abortivum, zástava krvácení z děložní atonie**

**NÚ:** nauzea, zvracení, průjem, třesavka, ↓ TK, bronchokonstrikce (při i.v.)

**alprostadi** – abortivum, indukuje porod, **karboprost** – derivát PG, stimuluje motilitu GIT

– **námelové alkaloidy: metylergometrin** – působící kontrakce dělohy, zvýšení motility GIT

**MÚ:** stimulace  $\alpha_1$  rec. a blokáda 5-HT<sub>1D</sub> rec. **myometria**, úč. za 5-10 min (trvá 2-6 hod)

**ind.:** použití jako uterotonikum (ergotamin se nepoužívá, mnoho NÚ), profylaxe nebo léčba děložního krvácení po porodu (i.v., III. doba porodní) při hypotonii dělohy

**NÚ:** bolesti břicha, nauzea, tinnitus, ↑TK, spasmus koronárních cév (stenokardie)

**KI:** v první a druhé době porodní

• **TOKOLYTIKA** – snižují motilitu a tonus těhotné dělohy

**ritodrin, terbutalin, fenoterol**

**MÚ:** stimulace  $\beta_2$ -adrenergických rec ( $\beta_2$ -sympatomimetika)

**ind.:** **zklidnění předčasných kontrakcí při hrozím předčasném porodu po 20. týdnu těhotenství, asthma bronchiale, prevence hypoxie plodu nadměrnými kontrakcemi, hrozící RDS syndrom**

**NÚ:** tachykardie, arytmie, hyperglykémie, hypokalémie, edém plic, retinopatie novorozenců, periferní vazodilatace, třes,

**KI:** eklampsie, DM, hyperthyreóza, poruchy srdečního rytmu, CAVE! průnik placentou (70-90% first pass efekt), vyluč. ledvinami, tachyfylaxe

**blokátory Ca<sup>2+</sup> kanálů (nifedipin, nitrendipin)** – prodloužení gestace s nízkou incidencí NÚ

**atosiban** – polypeptid, kompetitivní antagonist oxytocinu, úč. do 10 min, trvání 12h

**ind.:** **oddálení předčasného porodu**

**NÚ:** nauzea, zvracení, děložní hypotonie (↑ ztráta krve), méně než předchozí!

**magnesium sulfát** (sporný tokolytický účinek)