

Anticoncepción hormonal

– conceptos clínicos actuales –



Dr. Alberto Estrella
Médico Ginecólogo

Anticonceptivos hormonales

Los anticonceptivos hormonales son, sin duda, los preparados farmacéuticos más estudiados en la historia de la medicina.

En el presente artículo intentamos transmitir los conceptos básicos de la anticoncepción hormonal, brindando algunos de los detalles que a menudo se relegan (por ejemplo, la farmacología) y que consideramos importantes, dado que su adecuado manejo puede aportar beneficios en la aplicación clínica diaria.

Conceptos farmacológicos de estrógenos y progestágenos

Estrógenos

El 17 beta estradiol no ha podido ser empleado en anticoncepción oral, pero ésteres o microcristales de estradiol son útiles en preparados de administración parenteral.

En anticoncepción oral los estrógenos más utilizados son los sintéticos dada su administración oral en dosis diarias.

El etinilestradiol fue descrito en 1938 y es hoy en día considerado el gold standard de los estrógenos en anticoncepción oral. Es la forma activa de todos los estrógenos sintéticos empleados en anticoncepción oral.

El etinilestradiol es un estrógeno muy potente y activo por vía oral; es 200 veces más potente que el estradiol micronizado por vía oral; 5 mcg de EE2 por vía oral equivalen a 1000 mcg de estradiol micronizado. Es a su vez 10 veces más potente que el estradiol.

Los estrógenos administrados por vía oral determinan modificaciones en el metabolismo hepático debido a las altas concentraciones que estos

presentan en el sistema porta-hepático. Los más relevantes son:

- Inducción de la síntesis y liberación de angiotensinógeno, lo cual produce una activación del sistema renina-angiotensina-aldosterona.
- A nivel del metabolismo hepático inducen la glucronoconjugación e inhiben de forma competitiva la hidroxilación y la actividad de la isoenzima 3A4 del citocromo P450.
- Inducción de síntesis de proteínas plasmáticas, en especial transcortina (Corteroid Binding Globulin -CBG-), que se incrementa 2.5 veces su valor pretratamiento; Steroid Hormone Binding Globulin (SHBG) incrementa 3-4 veces su concentración inicial; Tiroglobulina o Thyroid Binding Globulin (TBG), tiroplasmina, transferrina y ceruloplasmina, que se estabilizan hacia el tercer mes de tratamiento.
- Modifican la fibrinólisis e incrementan levemente los factores de la coagulación VII y XII y disminuyen los factores (proteínas) con acción anticoagulantes C y S y la antitrombina III.

-Farmacocinética y Farmacodinamia

La absorción se inicia en el estómago, en las vellosidades del intestino delgado, el 30% de la dosis administrada se conjuga con sulfato y permanece en la luz intestinal como sulfato de etinilestradiol y no se absorbe. El restante 70% se absorbe y presenta un importante efecto de metabolización hepática inicial (efecto de primer paso hepático) por lo que pasa a la circulación sistémica (biodisponibilidad) sólo un 38-48% de la dosis total administrada. Parte de los metabolitos se eliminan por vía biliar como glucuronato o sulfato de etinilestradiol y en la luz colónica las bacterias (especialmente Clostridium) los hidrolizan liberando el etinilestradiol, el cual se vuelve a absorber conformando así un circuito enterohepático, que permite mantener los niveles plasmáticos estables y dentro de rango terapéutico, a pesar de las bajas dosis administradas una sola vez al día.

Progestágenos

Los nuevos gestágenos se orientan a una mayor selectividad del receptor, buscando la similitud con la progesterona natural.