

Thông tin thuốc

Tháng 01 - 02/2010

Tổ Thông tin thuốc – P. Dược Lâm Sàng – BV Từ Dũ

Nội dung :

- Phân loại các progestin
- Hoạt tính sinh học của progesterone tự nhiên và progestin tổng hợp
- Hoạt tính progesterone trên nội mạc tử cung và tác dụng kháng gonadotropin (liều ức chế rụng trứng) của các loại progestin
- Liều progesterone (đường uống) làm biến đổi nội mạc tử cung tùy theo điều trị liên tục hoặc theo chu kỳ
- Một số chế phẩm chứa progesterone

1. Phân loại các progestin

Progestin	Ví dụ
Progesterone	Progesterone tự nhiên
Retroprogesterone	Dydrogesterone
Dẫn xuất Progesterone	Medrogestone
Dẫn xuất 17 α -Hydroxyprogesterone (pregnanes)	Medroxyprogesterone acetate, megestrol acetate, chlormadinone acetate, cyproterone acetate
Dẫn xuất 17 α -Hydroxynorprogesterone (norpregnanes)	Gestonorone caproate, nomegestrol acetate
Dẫn xuất 19-Norprogesterone (norpregnanes)	Demegestone, promegestone, nesterone, trimegestone
Dẫn xuất 19-Nortestosterone (estrans)	Norethisterone = norethindrone, norethisterone acetate, lynestrenol, ethynodiol acetate, norethinodrel
Dẫn xuất 19-Nortestosterone (gonanes)	Norgestrel, levonorgestrel, desogestrel, etenogestrel, gestodene, norgestimate, dienogest.
Dẫn xuất Spirolactone	Drospirenone

2. Hoạt tính sinh học của progesterone tự nhiên và progestin tổng hợp

Progestin	Hoạt tính progesterone	Kháng gonadotropin	Kháng estrogen	Hoạt tính estrogen	Hoạt tính androgen	Kháng androgen	Hoạt tính gluco-corticoid	Kháng mineralo-corticoid
Progesterone	+	+	+	—	—	±	+	+
Dydrogesterone	+	—	+	—	—	±	—	±
Medrogestone	+	+	+	—	—	±	—	—
Dẫn xuất 17 α -Hydroxy Chlormadinone acetate	+	+	+	—	—	+	+	—
Cyproterone acetate	+	+	+	—	—	++	+	—
Megestrol acetate	+	+	+	—	±	+	+	—
Medroxy-progesterone-acetate	+	+	+	—	±	—	+	—
Dẫn xuất 19-Nor-progesterone Nomegestrol acetate	+	+	+	—	—	±	—	—
Promegestone	+	+	+	—	—	—	—	—
Trimegestone	+	+	+	—	—	±	—	±
Dẫn xuất spirolactone Drospirenone	+	+	+	—	—	+	—	+
Dẫn xuất 19-Nortestosterone Norethisterone	+	+	+	+	+	—	—	—
Lynestrenol	+	+	+	+	+	—	—	—
Norethinodrel	±	+	±	+	±	—	—	—
Levonorgestrel	+	+	+	—	+	—	—	—
Norgestimate	+	+	+	—	+	—	—	—
3-Keto-desogestrel	+	+	+	—	+	—	—	—
Gestodene	+	+	+	—	+	—	+	+

Dienogest + + ± ± - + - -

(+) Tác dụng mạnh/trung bình; (±) tác dụng yếu; (-) không tác dụng

3. Hoạt tính progesterone trên nội mạc tử cung và tác dụng kháng gonadotropin (liều ức chế rụng trứng) của các loại progestin

Progestin	Liều ức chế rụng trứng mg/ngày (uống)	Liều biến đổi nội mạc tử cung mg/chu kỳ	Liều biến đổi nội mạc tử cung mg/ngày (uống)
Progesterone	300	4200	200–300
Dydrogesterone	>30	140	10–20
Medrogestone	10	60	10
Medroxyprogesterone acetate	10	80	5–10
Chlormadinone acetate	1.5–2.0	20–30	10
Cyproterone acetate	1	20	1.0
Norethisterone	0.5	100–150	/
Norethisterone acetate	0.5	30–60	/
Lynestrenol	2.0	70.0	/
Ethinodiol	2.0	15.0	/
Levonorgestrel	0.05	6.0	0.15
Desogestrel	0.06	2.0	0.15
Gestodene	0.03	3.0	/
Norgestimate	0.2	7.0	/
Dienogest	1.0	6.0	/
Drospirenone	2.0	50	/
Promegestone	0.5	10	0.5
Nomegestrol acetate	5.0	100	5.0
Trimegestone	0.5	/	0.25–0.5

/ không có dữ liệu

4. Liều progesterone (đường uống) làm biến đổi nội mạc tử cung tùy theo điều trị liên tục hoặc theo chu kỳ

Progestin	Liều mỗi ngày	
	Chu kỳ	Liên tục
Progesterone micronized	200–300	100
Dydrogesterone	10–20	5–10
Medrogestone	10	/
Chlormadinone acetate	10	/
Cyproterone acetate	1	/
Medroxyprogesterone acetate	5–10	2.5
Nomegestrol acetate	5	2.5
Promegestone	0.5	0.25
Trimegestone	0.25–0.5	/
Norethisterone	1	0.5

5. Một số chế phẩm chứa progesterone

Hoạt chất	Biệt dược	Dạng bào chế - Hàm lượng	Ghi chú
Progesterone tự nhiên	Vageston®	Viên nang mềm 100; 200mg	Bổ sung giai đoạn hoàng thể trong vô sinh; Đọa sảy thai; H/c tiền kinh nguyệt; H/c

	Crinone®	Ống bơm dùng đường âm đạo, gel 8%	quanh mãn kinh... Điều trị hiếm muộn do giai đoạn hoàng thể không đầy đủ
Dydrogesterone	Duphaston®	Viên 10mg	Liệu pháp thay thế hormone; Thống kinh; Lạc nội mạc tử cung; Xuất huyết tử cung bất thường; Vô kinh thứ phát; H/c tiền kinh nguyệt; Dọa sảy thai; Sảy thai liên tiếp
Cyproterone acetate	Diane-35	Viên 2mg	Các bệnh phụ thuộc androgen ở phụ nữ (mụn trứng cá, các dạng có kèm tăng tiết bã nhờn...)
Medroxy-progesterone acetate	Provera®	Viên 2.5; 5; 10mg	Liệu pháp thay thế hormone; Vô kinh; Xuất huyết tử cung do rối loạn chức năng
	Cycrin®	Viên 2.5mg; 5mg; 10mg	-nt-
	Depo-provera®	Thuốc tiêm; 150 mg/mL	Tránh thai
Nomegestrol acetate	Lutenyl®	Viên 5mg	Rối loạn do thiếu progesterone; Rối loạn tiền mãn kinh/mãn kinh
Norethisterone acetate	Aygestin®	Viên 5mg	Liệu pháp thay thế hormone; Vô kinh thứ phát
Norethisterone	Micronor®	Viên 0.35mg	Viên thuốc chỉ có progestin
	Nor-Q-D®	Viên 0.35mg	-nt-
	Primolut-N®	Viên 5mg	Xuất huyết do rối loạn chức năng; Vô kinh nguyên phát hoặc thứ phát; H/c tiền kinh nguyệt; Lạc nội mạc tử cung
Lynestrenol	Orgametril®	Viên 5mg	Đa kinh; Rong kinh & rong huyết; Vô kinh, thiếu kinh nguyên phát, thứ phát; H/c tiền kinh nguyệt; Lạc nội mạc tử cung...
Norgestrel	Ovrette®	Viên 0.075mg	Viên thuốc chỉ có progestin
Levonorgestrel	Escapelle®	Viên 1.5mg	Thuốc ngừa thai khẩn cấp
	Mirena®	Dụng cụ tử cung	Tránh thai; Rong kinh vô căn; Bảo vệ đối với sự tăng sinh lớp NMTC trong thời gian điều trị estrogen thay thế
	Postinor-2®	Viên 0.75mg	Thuốc ngừa thai khẩn cấp
	Tri-Regol®	Viên 0.05/0.075/0.125mg	Thuốc tránh thai phối hợp đường uống
Desogestrel	Marvelon 21®	Viên 0.15mg	Thuốc tránh thai phối hợp đường uống
	Regulon®	Viên 0.15mg	-nt-
Gestodene	Lindynette 20®	Viên 0.075mg	Thuốc tránh thai phối hợp đường uống
	Gynera®	Viên 0.075mg	-nt-
Norgestimate	Cilest®	Viên 0.25mg	Thuốc tránh thai phối hợp đường uống
Drospirenone	Drosperin®	Viên 3mg	Thuốc tránh thai phối hợp đường uống