

# JOURNAL FÜR MENOPAUSE

WENZL R

*Zellulärer Wirkmechanismus und Pharmakokinetik einer pulsatilen Östrogengabe*

*Journal für Menopause 2001; 8 (Sonderheft 2) (Ausgabe für Österreich), 4*

**Homepage:**

**[www.kup.at/menopause](http://www.kup.at/menopause)**

**Online-Datenbank mit  
Autoren- und Stichwortsuche**

ZEITSCHRIFT FÜR DIAGNOSTISCHE, THERAPEUTISCHE UND PROPHYLAKTISCHE ASPEKTE IM KLIMAKTERIUM

**Erschaffen Sie sich Ihre  
ertragreiche grüne Oase in  
Ihrem Zuhause oder in Ihrer  
Praxis**

**Mehr als nur eine Dekoration:**

- Sie wollen das Besondere?
- Sie möchten Ihre eigenen Salate,  
Kräuter und auch Ihr Gemüse  
ernten?
- Frisch, reif, ungespritzt und voller  
Geschmack?
- Ohne Vorkenntnisse und ganz  
ohne grünen Daumen?

**Dann sind Sie hier richtig**



# ZELLULÄRER WIRKMECHANISMUS UND PHARMAKOKINETIK EINER PULSATILEN ÖSTROGENGABE

Neben der oralen, transdermalen und intramuskulären Applikation ist das Spektrum der Hormonersatztherapie zur Behandlung von postmenopausalen Symptomen um eine neue Darreichungsform erweitert worden: die nasale Applikation.

Um die Löslichkeit von  $17\beta$ -Östradiol im wässrigen Milieu zu erhöhen, wird die Substanz RAMEB (randomized methylated  $\beta$ -cyclodextrin) verwendet (1000fache Erhöhung der Löslichkeit von  $17\beta$ -Östradiol). Es genügen daher 2 Hübe des Aerosols, um eine suffiziente Östrogenwirkung zu erzielen. Nach Verwendung des Aerosols intranasal (Aerodiol) wird  $17\beta$ -Östradiol über die Nasenschleimhaut resorbiert. Bei einer täglichen Dosis von 300  $\mu\text{g}$  intranasal werden kurz nach der Applikation Östradiolwerte von bis zu 1200  $\text{pg/ml}$  erreicht, die aber nach ca. 4 Stunden wieder auf postmenopausale Werte abfallen. Das bedeutet, daß ein hohes, aber nur kurz anhaltendes Angebot an Östrogen für die Rezeptoren zur Verfügung steht.

Das freie Östradiol wird an den Rezeptor gebunden und in den Zellkern eingeschleust. Die Wirkung des Östrogens über die in Folge erzeugten Proteine hält aber über Stunden bis zur nächsten Applikation an (Abb. 1, 2).

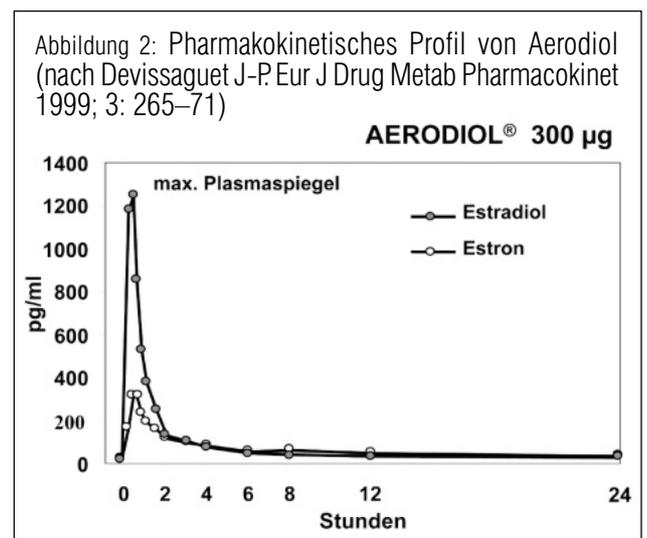
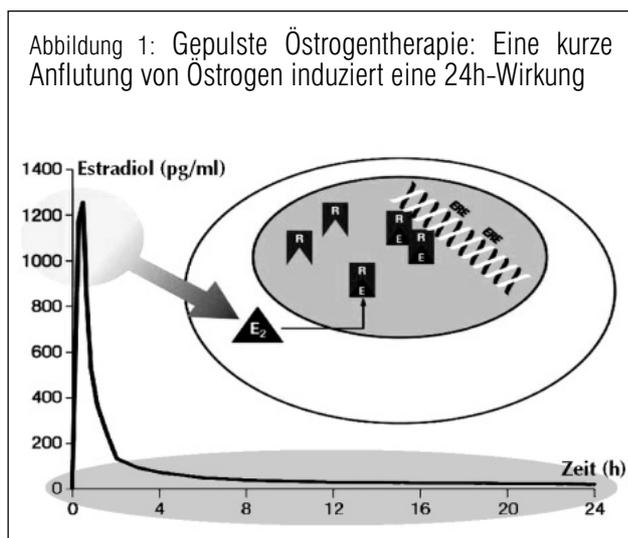
Bei oraler Applikation wird ein Großteil des Östrogens in der Leber einem metabolischen first pass unterzogen (hohe Östronwerte im Verhältnis zu Östradiol). Bei transnasaler Applikation ist die Relation von Östron zu Östradiol (ca. 1) ähnlich wie bei transdermaler Verabreichung, was eine Umgehung des First-pass-Effektes in der Leber unterstreicht.

Eine doppelblinde, kontrollierte Studie zeigte, daß die Effektivität von 300  $\mu\text{g}$  intranasal nicht unterschiedlich gegenüber 2 mg Östradiolvalerat oral in bezug auf den Kupperman-Index, Hitzewallungen und Östrogenisierung des Gewebes war. Bei transdermaler oder oraler Applikation schwanken die meßbaren Plasma-

spiegel von Patientin zu Patientin deutlich. Ebenso ist aber auch eine Schwankungsbreite der Wirkspiegel bei der einzelnen Frau an unterschiedlichen Tagen zu beobachten. Die Wirkspiegel der transnasalen Applikation sind aber im Vergleich zu oraler oder transdermaler Verabreichung konstant. Zusätzlich kommt es durch die kurze Verfügbarkeit bzw. Halbwertszeit zu keiner Akkumulation des Wirkstoffes bei längerer Anwendung.

Offensichtlich ist ein intensives, aber kurz dauerndes Östrogenangebot im Serum ausreichend, um postmenopausale Symptome effektiv zu behandeln.

**Korrespondenzadresse:**  
Univ.-Prof. Dr. René Wenzl  
Universitätsklinik für Frauenheilkunde  
1090 Wien, Währinger Gürtel 18–20



# Mitteilungen aus der Redaktion

Besuchen Sie unsere Rubrik

## [Medizintechnik-Produkte](#)



Neues CRTD Implantat  
Intica 7 HF-T QP von Biotronik



Artis pheno  
Siemens Healthcare Diagnostics GmbH



Philips Azurion:  
Innovative Bildgebungslösung

Aspirator 3  
Labotect GmbH



InControl 1050  
Labotect GmbH

## e-Journal-Abo

Beziehen Sie die elektronischen Ausgaben dieser Zeitschrift hier.

Die Lieferung umfasst 4–5 Ausgaben pro Jahr zzgl. allfälliger Sonderhefte.

Unsere e-Journale stehen als PDF-Datei zur Verfügung und sind auf den meisten der marktüblichen e-Book-Readern, Tablets sowie auf iPad funktionsfähig.

## [Bestellung e-Journal-Abo](#)

### Haftungsausschluss

Die in unseren Webseiten publizierten Informationen richten sich **ausschließlich an geprüfte und autorisierte medizinische Berufsgruppen** und entbinden nicht von der ärztlichen Sorgfaltspflicht sowie von einer ausführlichen Patientenaufklärung über therapeutische Optionen und deren Wirkungen bzw. Nebenwirkungen. Die entsprechenden Angaben werden von den Autoren mit der größten Sorgfalt recherchiert und zusammengestellt. Die angegebenen Dosierungen sind im Einzelfall anhand der Fachinformationen zu überprüfen. Weder die Autoren, noch die tragenden Gesellschaften noch der Verlag übernehmen irgendwelche Haftungsansprüche.

Bitte beachten Sie auch diese Seiten:

[Impressum](#)

[Disclaimers & Copyright](#)

[Datenschutzerklärung](#)