



# ПРОГЕСТИНЫ

ПОДГОТОВИЛА: ТОХТАБАЕВА И. Ш.

# ПРОГЕСТИНЫ

- **ПРОГЕСТИНЫ** - ЭТО ИСКУССТВЕННО СИНТЕЗИРОВАННЫЕ (ЭКЗОГЕННЫЕ) АНАЛОГИ ГЕСТАГЕНОВ, КОТОРЫЕ ИСПОЛЬЗУЮТСЯ В КАЧЕСТВЕ КОНТРАЦЕПТИВНЫХ ИЛИ ЛЕЧЕБНЫХ СРЕДСТВ.
- К ГЕСТАГЕНАМ ОТНОСЯТ ГРУППУ ПРИРОДНЫХ ГОРМОНОВ И ИХ СИНТЕТИЧЕСКИХ АНАЛОГОВ, ОБЛАДАЮЩИХ БИОЛОГИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТЬЮ ПРОГЕСТЕРОНА.

Таблица 1. Классификация прогестинов по поколениям [3]

Поколение	Препарат
I	Прогестерон Норэтинодрел Производные нортестостерона Норэтистерон
II	Производные 17-гидроксипрогестерона (прегнаны) Производные тестостерона (гонаны): норгестрел левоноргестрел
III	Производные левоноргестрела: дезогестрел этоногестрел гестоден норгестимат норэлгестромин
«Новые» прогестины	Дроспиренон Диеногест Тримегестон Несторон Номегестрола ацетат

Прогестины

Прогестерон

Прегнаны

Ацетилированные

Неацетилированные

Медрокси  
прогестерон  
а ацетат  
Хлормадино  
на ацетат  
Ципротерон  
а ацетат  
Мегестрола  
ацетат

19-Норпрегнаны

Ацетилированные

Неацетилированные

Несторон  
Номегестрол  
а ацетат

Демегестон  
Промегестон  
Тримегестон

Тестостерон

Эстраны

Гонаны

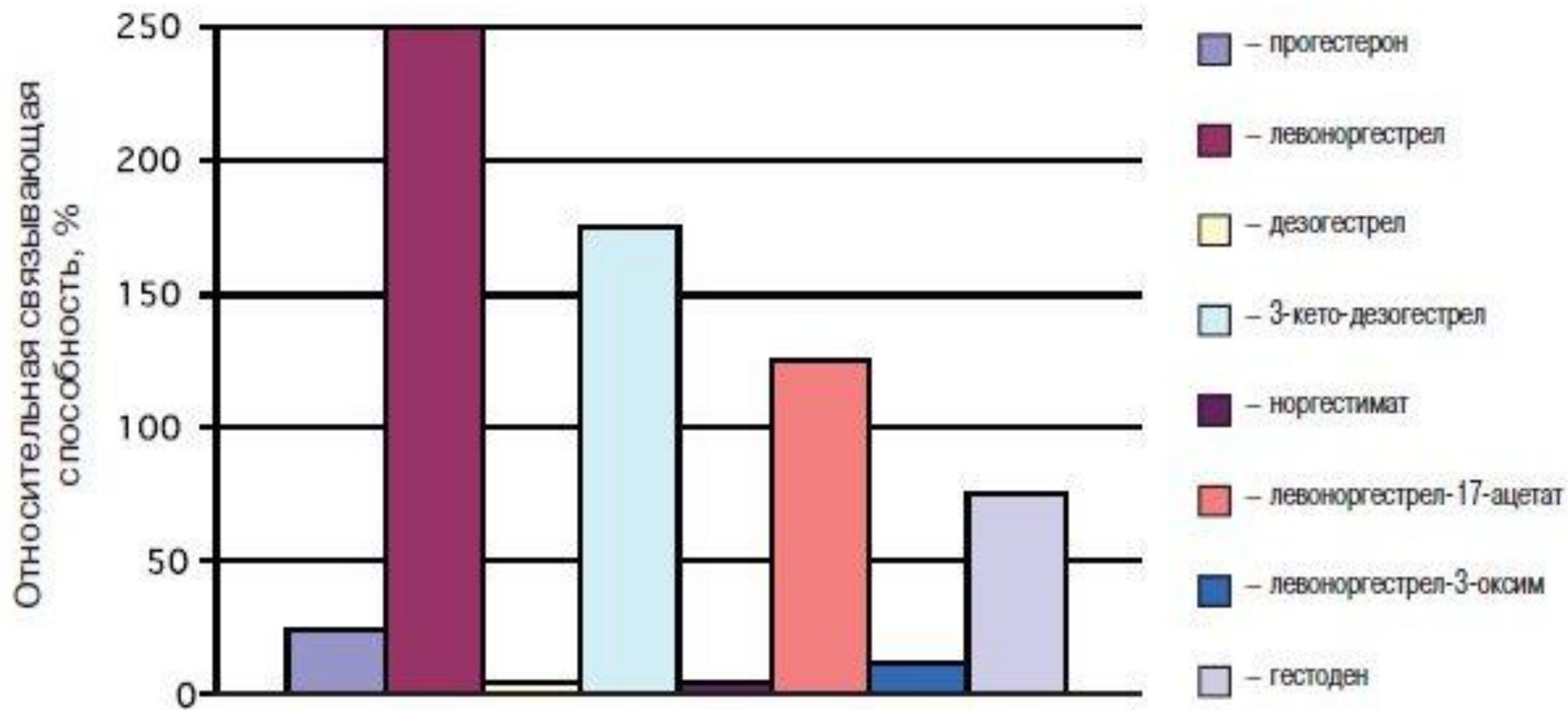
Норэтиндрон  
(Норэтистерон)  
Норэтиндрона  
ацетат  
Норэтинодреп  
Этинодиола  
диацетат  
Тиболон  
Линестренол

Левоноргестрел  
Норгестрел  
Диеногест  
Дезогестрел  
Этоногестрел  
Гестоден  
Норгестимат

Спиронолактон

Дроспиренон

# Относительная связывающая способность некоторых прогестинов с рецепторами прогестерона в матке.



Название прогестина	Прогестероно- вые свойства	Эстро- генные свойства	Противо- эстро- генные свойства	Андро- генные свойства	Противо- андро- генные свойства	Глюко- кортико- идные свойства	Анти- минерало- кортико- идные свойства	Анти- гонадо- тропные свойства	Суточная доза для подавления овуляции (мг)
Прогестерон	+	-	+	-	±	+	+	+	300
Прегнаны									
Дидрогестерон	+	-	+	-	±	-	±	-	30-35
Медрогестерон	+	-	+	-	+	-	-	+	10
Хлормадинона ацетат	+	-	+	-	+	+	-	+	1.5-2
Ципротерона ацетат	+	-	+	-	+	+	-	+	1
Мегестрола ацетат	+	-	+	±	+	+	-	+	10
Медроксипрогестерона ацетат	+	-	+	±	-	+	-	+	10
19-Норпрегнаны									
Номегестрола ацетат	+	-	+	-	±	-	-	+	5
Промегестон	+	-	+	-	-	-	-	+	0.5
Тримегестон	+	-	+	-	±	-	±	+	0.5
Эстраны									
Норэтистерон	+	+	+	+	-	-	-	+	0.5
Линестренол	+	+	+	+	-	-	-	+	2
Норэтинодрел	±	+	±	±	-	-	-	+	5
Гонаны									
Левоноргестрел	+	-	+	+	-	-	-	+	0.05
Дезогестрел	+	-	+	+	-	-	-	+	0.06
Норгестимат	+	-	+	+	-	-	-	+	0.2
Гестоден	+	-	+	+	-	+	+	+	0.03
Диеногест	+	±	±	-	+	-	-	+	1
Дроспиренон	+	-	+	-	+	-	+	+	2

# ФАРМАКОКИНЕТИКА

Таблица 3. Связывание гестагенов с белками плазмы крови (в %)

Гестаген	Связь с ГСПГ	Связь с глобулинами	Свободная фракция
Левоноргестрел	47,5	50	2,5
Норэтиндрон	35,5	60,8	3,7
3-кето-дезогестрел	31,6	65,9	2,5
Гестоден	75,3	24,1	0,6
Диеногест	0	91	9
Дроспиренон	0	95–97	3–5

# ПЕРВИЧНЫЙ МЕТАБОЛИЗМ В ПЕЧЕНИ И БИОДОСТУПНОСТЬ СИНТЕТИЧЕСКИХ ГЕСТАГЕНОВ

**ГЕСТАГЕН**

**АКТИВНЫЕ  
МЕТАБОЛИТЫ**

**БИОДОСТУПНОСТЬ**

**ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ**

**ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ**

**ОК. 100%**

**ДЕЗОГЕСТРЕЛ**

**3-КЕТОДЕЗОГЕСТРЕЛ**

**40-100%**

МАРВЕЛОН, МЕРСИЛОН,  
РЕГУЛОН, НОВИНЕТ

**ГЕСТОДЕН**

**ГЕСТОДЕН**

**ОК. 100%**

ЛОГЕСТ, ФЕМОДЕН

**НОРГЕСТИМАТ**

20% ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ

17% 3-КЕТОНОРГЕСТИМАТ

10% 17-ДЕАЦЕТИЛНОРГЕСТИМАТ

ОК. 50% НЕАКТИВНЫЕ МЕТАБОЛИТЫ

**50-60%**

СИЛЕСТ

