



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 Производные 17-гидроксипрогестерона (прегнаны)
II	Производные тестостерона (гонаны): норгестрел левоноргестрел
III	Производные левоноргестрела: дезогестрел этногестрел гестоден норгестимат норэлгестромин
«Новые» прогестины	Дроспиренон Диеногест Тримегестон Несторон Номегестрола ацетат

Прогестины

Прогестерон

Прегнаны

Ацетилированные

Неацетилированные

Медрокси прогестерон ацетат
Хлормадинона ацетат
Ципротерон ацетат
Мегестрола ацетат

Дидрогестерон
Медрогестерон

19-Норпрегнаны

Ацетилированные

Неацетилированные

Несторон
Номегестрола ацетат

Демегестон
Промегестон
Тримегестон

Тестостерон

Эстроны

Норэтиндрон (Норэтистерон)
Норэтиндрона ацетат
Норэтинодреп
Этинодиола диацетат
Тиболон
Линестренол

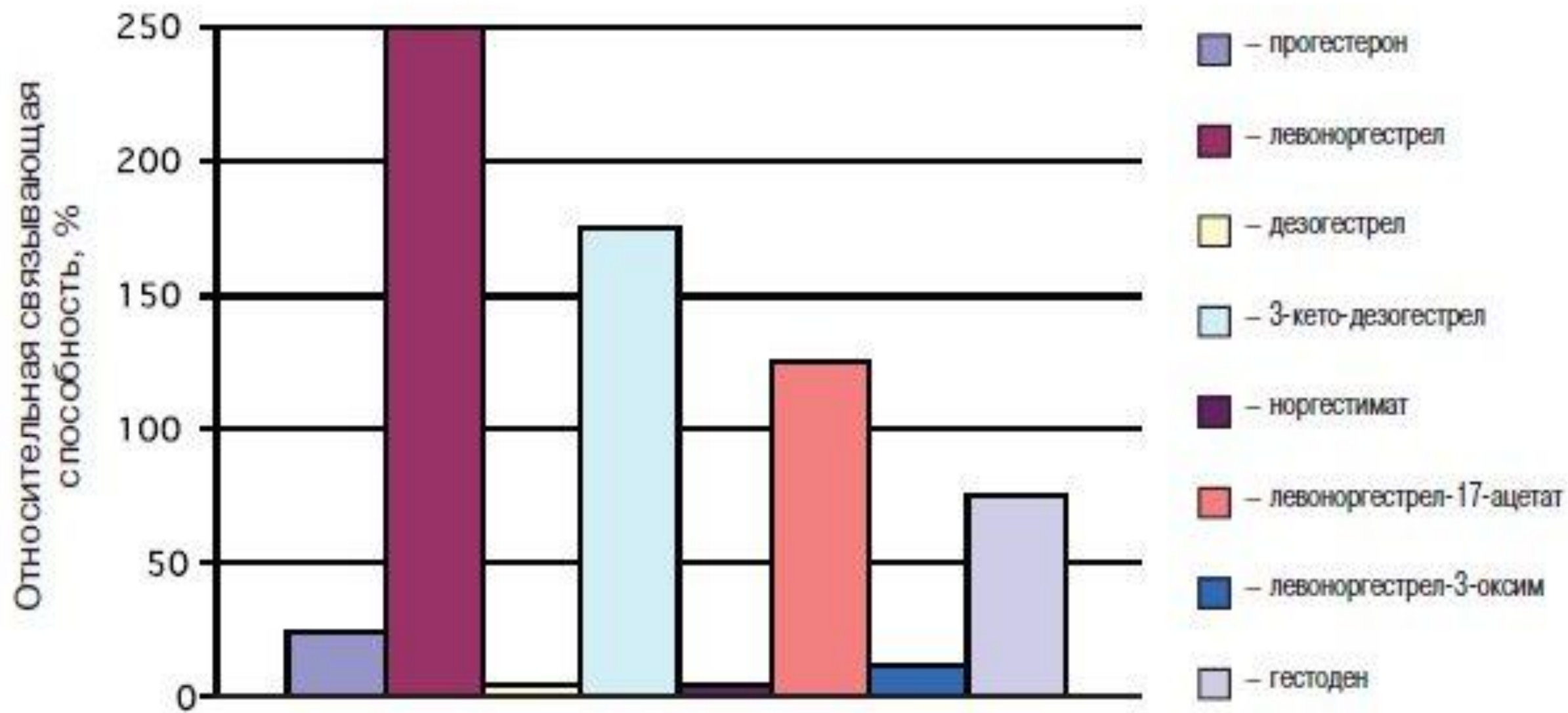
Гонаны

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

