

**Тема лекции:**  
**Эндокринные**  
**средства**  
**(гормоны и их антагонисты)**

Доцент кафедры общей и клинической  
фармакологии с курсом ФПК и ПК  
*Владимир Михайлович Концевой*

# Определение фармакологической группы

Эндокринные средства — это лекарственные препараты, которые применяют для коррекции функций организма при эндокринных заболеваниях

# КЛАССИФИКАЦИЯ

К группе эндокринных средств  
относят:

1. Гормональные препараты
2. Антигормональные препараты

Гормональные препараты содержат гормоны или их синтетические аналоги.

Они являются агонистами гормональных рецепторов и воспроизводят в организме действие инкретов желез внутренней секреции.

Основное применение гормональных препаратов — заместительная терапия при недостаточности соответствующих эндогенных гормонов.

# **К антигормональным препаратам относят:**

1. Антагонисты гормонов.
2. Средства, блокирующие образование и (или) выделение гормонов.

## **Область применения:**

1. Устранение эффекта гормона.
2. Снижение функции эндокринной железы

# Источники получения гормональных препаратов

1. Выделение из тканей животных и мочи человека.
2. Химический синтез.
3. Генная инженерия.

# Биологическая стандартизация

Это методы оценки активности гормонов пептидного строения на биологических тест-объектах в сравнении с активностью препарата стандартного гормона.

Дозу гормона в этих случаях выражают в единицах действия.

Препараты химически чистых гормонов дозируют в весовых единицах

# Классификация гормонов по химическому строению

## 1. Пептидные

Гормоны гипофиза, гипоталамуса и поджелудочной железы

## 2. Производные тирозина

Гормоны щитовидной железы и мозгового вещества надпочечников

## 3. Стероидные

Гормоны коркового вещества надпочечников и половых желез

# Препараты гормонов передней доли гипофиза

1. Соматропин
2. Тетракозактид
3. Хорионический гонадотропин
4. Менопаузный гонадотропин

# Соматотропин

Генно-инженерный СТГ человека.

Полипептид.

Индукцирует образование в печени соматомединов, которые усиливают рост скелета и внутренних органов.

Применяется при задержке роста у детей, связанной с недостаточным выделением гормона роста передней доли гипофиза.

# Форма выпуска

Соматропин *Somatropin*

Синоним: *Genotropin*

Флаконы: 4 МЕ и 16 МЕ

Вводят п/к, в/м

# Тетракозактид

Синтетический аналог кортикотропного гормона передней доли гипофиза. Полипептид.

Стимулирует синтез и выделение глюкокортикоидных гормонов коры надпочечников.

Применяют для диагностики характера недостаточности надпочечников.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

Тетракозактид

*Tetracosactide*

Синоним: *Synacthen*

Ампулы: 0,25 мг

Вводят в/м, в/в

# Хорионический гонадотропин

Получают из мочи беременных.

Содержит лютеинизирующий гормон плаценты.

Стимулирует выделение половых гормонов.

Вызывает овуляцию и образование желтого тела.

Применяют при гипогонадизме, связанным с недостаточным выделением гонадотропных гормонов передней доли гипофиза и при бесплодии у женщин.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

Хорионический гонадотропин

*Human chorionic gonadotropin*

Синоним: *Chorigon*

Ампулы: 2500 и 5000 МЕ

Вводят в/м

# Менопаузный гонадотропин

Получают из мочи женщин в период менопаузы.

Содержит ФСГ и ЛГ.

Стимулирует развитие фолликулов в яичниках и синтез эстрогенов.

Стимулирует развитие семенников и сперматогенез.

Применяется при бесплодии у мужчин и женщин.

# Формы выпуска

Менопаузный гонадотропин

*Human menopausal gonadotropin*

Синоним: *Pergonal*

Ампулы 75 МЕ (ФСГ) и 75 МЕ (ЛГ)

Вводят в/м

# Препараты гормонов задней доли гипофиза

1. Окситоцин

2. Десмопрессин

# ОКСИТОЦИН

Синтетический гормон, аналогичен природному окситоцину.

Стимулирует окситоциновые рецепторы ГМК матки во время родов, повышает содержание ионов  $\text{Ca}^{++}$  в ГМК, стимулирует сокращения матки, способствует течению родов.

Применяется для усиления ритмических сокращений матки при ослабленных родах.

# Форма выпуска

ОКСИТОЦИН *Oxytocin*

Ампулы: 5 ЕД

Вводят в/м и в/в

# Десмопрессин

Синтетический аналог вазопрессина (АДГ).

Стимулирует рецепторы в эпителии собирательных трубочек нефрона.

Увеличивает реабсорбцию воды, снижает диурез.

Увеличивает содержание в плазме VIII фактора свертывания крови.

Применяется при несахарном диабете и гемофилии А.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

Десмопрессин *Desmopressin*

Синоним: *Minirin*

Таблетки: 0,1 и 0,2 мг

Вводят внутрь при несахарном  
диабете

*Emosint* 40 мг – 1 мл

Вводят в/в при гемофилии А

# Препараты гормонов гипоталамуса

1. Серморелин
2. Соматостатин
3. Октреотид
4. Гонадорелин

# Серморелин

Синтетический полипептидный гормон гипоталамуса.

Стимулирует выделение гормона роста.

Применяется для диагностики характера выделения гормона роста.

# Формы выпуска

Серморелин *Sermorelin*

Синонимы: *Groliberin*

Флаконы: 100мкг

Вводят в/в

# Соматостатин

Синтетический полипептидный гормон гипоталамуса короткого действия.

Подавляет выделение гормона роста и гормонов, регулирующих функции ЖКТ (гастрин, секретин, мотилин и др.)

Применяют для диагностики, когда необходимо прекратить выделение гормона роста и гормонов ЖКТ.

# Форма выпуска

Соматостатин *Somatostatin*

Синонимы: *Stilamin*

Ампулы: 250 и 3000 мкг

Вводят в/в

# Октреотид

Синтетический аналог соматостатина длительного действия (около 12 часов).

Подавляет выделение в кровь гормона роста и гормонов ЖКТ (секретин, гастрин, мотилин, глюкагон, вип и др).

Применение:

1. Акромегалия
2. Опухоли, выделяющие гормоны
3. Панкреатит
4. Кровотечение из ЖКТ

# Форма выпуска

Октреотид *Octreotide*

Синоним: *Sandostatin*

Ампулы: 50, 100 и 500 мкг

Вводят п/к

# Гонадорелин

Синтетический полипептидный гормон гипоталамуса.

При введении в пульсирующем режиме стимулирует, а при постоянном введении подавляет выделение ФСГ и ЛГ гипофизом.

Применение:

1. При половом недоразвитии
2. Для стимуляции процесса овуляции
3. При раке предстательной железы (подавление секреции ФСГ и ЛГ).

# Форма выпуска

Гонадорелин *Gonadorelin*

Ампулы: 100 мкг

Аналог: *Goserelin*

Ампулы 3,6 мг п/к

1 раз в 4 недели

# Препараты гормонов щитовидной железы

## Тиреоидные:

1. Левотириксин
2. Лиотиронин

## Влияющие на обмен $\text{Ca}^{++}$

1. Кальцитонин
2. Дигидротахистерол (заменитель гормона околощитовидных желез)

# Левотироксин

Синтетический гормон щитовидной железы ( $T_4$ ). Содержит 4 атома йода.

Всасывается в тонком кишечнике. В крови на 99% связывается с белками.

Эффект  $T_4$  развивается медленно в течение 3-5 суток. В тканях  $T_4$  теряет один атом йода и превращается в  $T_3$ .

1. Активирует специфические рецепторы клеточной мембраны, митохондрий и ядер клеток.
2. Усиливает транспорт аминокислот, глюкозы и солей внутрь клеток.
3. Усиливает окислительное фосфорилирование в митохондриях, увеличивает образование АТФ и потребление кислорода.

4. Индуцирует синтез белков, необходимых для нормального роста и развития организма.
5. По механизму отрицательной обратной связи уменьшает выделение тиреотропин-либерины и тиреотропного гормона.

# Применение

1. Заместительная терапия при гипотиреозе
2. Супрессивная терапия при простом (нетоксическом) зобе
3. Рак щитовидной железы (подавление секреции ТТГ)

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

Левотироксин

*Levothyroxine sodium*

Синоним: *L-Thyroxin*

Таблетки: 50 и 100 мкг

Вводят внутрь

# Лиотиронин

Синтетический  $T_3$ .

Отличие от  $T_4$ :

1. Меньше связывается с белками крови.
2. Активнее  $T_4$  в 5 раз
3. Эффект развивается через 4-8 часов

Применяют при гипотиреозе  
для быстрого достижения  
лечебного эффекта.

# Форма выпуска

Лиотиронин

*Liothyronine*

Синоним: *Triiodthyronine*

Таблетки: 50 мкг

Вводят внутрь

# Антитиреоидные средства

Это лекарственные препараты, которые применяют при гипертиреозе для снижения секреции  $T_3$  и  $T_4$ .

# К ним относят:

1. Тиамазол
2. Пропилтиоурацил
3. Калия йодид

# Тиамазол

Производное тиоимидазола.

Хорошо всасывается в ЖКТ.

Метаболизируется в печени.

Ингибирует пероксидазу тиреоцитов, снижает окисление йодидов и ( $I^- \rightarrow I^0 \rightarrow I^+$ ) включение йода в тиреоглобулин.

Снижение содержания  $T_3$  и  $T_4$  в крови происходит через неделю, когда истощаются запасы йодированного тиреоглобулина в коллоиде фолликулов железы.

# Применение

Для устранения  
гипертиреоза при  
подготовке к резекции  
щитовидной железы.

# Форма выпуска

Тиамазол

*Thiamazole*

Синоним: *Mercazolilum*

Таблетки: 5 мг

Вводят внутрь

# Пропилтиоурацил

Производное тиоурацила.

По механизму действия  
сходен с тиамазолом.

# Отличие от тиамазола

1. Уменьшает превращение  $T_4$  в  $T_3$  в тканях
2. Не проникает через ГЭБ и плаценту
3. Не влияет на функции системы иммунитета

# Применение

При тиреотоксическом кризе  
для угнетения образования  
активной формы  
тиреоидного гормона ( $T_3$ ).

# Форма выпуска

Пропилтиоурацил

*Propylthiouracil*

Синоним: *Propilthiouracil*

Таблетки: 50 мг

Вводят внутрь

# Калия йодид

Для быстрого снижения содержания  $T_3$  и  $T_4$  в крови при тиреотоксическом кризе препарат вводят внутрь в сравнительно больших дозах 100-200 мг в сутки.

Хорошо всасывается в ЖКТ.

Активно накапливается в ткани щитовидной железы в больших концентрациях.

Антитиреоидный эффект развивается в течение суток и длится около 2-3 недель.

Высокие концентрации иодидов в щитовидной железе угнетают протеолиз тиреоглобулина и высвобождение  $T_3$  и  $T_4$  в кровь.

При длительном приеме развивается толерантность и гипертиреоз возвращается

# Применение

При тиреотоксическом кризе  
для подготовки больного к  
резекции щитовидной  
железы.

# Форма выпуска

Калия иодид

*Kalii jodidum*

Синоним: *Pot. Iodide*

Порошок

Вводят внутрь

# Гормональные препараты, регулирующие минеральный обмен в костной ткани

К ним относят:

1. Дигидротахистерол  
(заменитель гормона  
паращитовидных желез)
2. Кальцитонин

# Дигидротахистерол

Препарат с активностью  
витамина Д.

Вводят внутрь. Хорошо  
всасывается в ЖКТ.

Активируется в печени путем  
гидроксилирования.

Выделяется с мочой.

Повышает содержание  $\text{Ca}^{++}$  в крови, усиливая его всасывание в кишечнике и высвобождение из костей.

Усиливает высвобождение фосфора из костей и выведение его с мочой.

В отличии от кальцитриола (Vit D<sub>3</sub>) почти не оказывает антирахитического действия (1% активности).

Действие развивается медленно в течение 2 недель.

Применяется для стабилизации содержания  $\text{Ca}^{++}$  в крови при гипопаратиреозе как заменитель паратгормона, который снят с производства.

# Формы выпуска

Дигидротахистерол

*Dihydrotachysterol*

Синоним: *A.T.10, Roxane, ДНТ*

Раствор в масле 0,1% - 15 мл

Внутрь индивидуально

0,8-2,4 мг/сут

# Кальцитонин

Полипептидный гормон  
С-клеток щитовидной  
железы.

Снижает содержание  $\text{Ca}^{++}$  и фосфатов в крови, уменьшая их выделение из костей (подавляет резорбцию костной ткани, остеокластами).

Обладает анальгезирующим действием.

Получают из ткани  
паращитовидных желез  
лосося (миакальцик) и  
свиней (кальцитрин).

# Применение

При болезни Педжета для  
снижения резорбции  
костной ткани.

# Форма выпуска

Кальцитонин

*Calcitonin*

Синоним: *Calcitrin*

Флаконы: 10-15 ЕД

Вводят п/к и в/м

Благодарю за  
внимание!