

**Тема лекции:**  
**Препараты половых  
гормонов и их  
антагонисты**

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

Это лекарственные средства, которые применяют для коррекции нарушений репродуктивной системы.

**Классификация  
препаратов  
половых гормонов**

# Препараты женских половых гормонов

## 1. Эстрогены

Эстрадиола дипропионат

Этинилэстрадиол

Синэстрол

Диэтилстильбестрол

## 2. Гестагены

Прогестерон

Оксипрогестерона капронат

Норэтистерон

# АНТАГОНИСТЫ ЖЕНСКИХ ПОЛОВЫХ ГОРМОНОВ

## 1. Антиэстрогены

Кломифен

Тамоксифен

## 2. Антигестагены

Мефепристон

# Препараты мужских половых гормонов

## Андрогены

Тестостерона пропионат

Тестенат

Метилтестостерон

# **Антагонисты рецепторов андрогенов**

Флутамид

# Анаболические стероиды

Нандролона деканоат  
(ретаболил)



# Эстрогены

Название этой группы женских половых гормонов происходит от латинского слова «oestrus» — течка у кастрированных животных (мыши, крысы), которым с целью биологической стандартизации вводят гормон.

# Эстрогенные гормоны

стимулируют развитие матки, фаллопиевых труб, влагалища и обеспечивают появление вторичных половых признаков: развитие молочных желез, распределение и рост волос, строение фигуры, отложение жира, организацию психики по женскому типу.

В зрелом возрасте эстрогены вызывают пролиферацию эндометрия, усиливают кровообращение в матке, повышают чувствительность матки к окситоцину, увеличивают ритм и сокращения матки во время родов.

# Другие эффекты эстрогенов

1. Способствуют отложению  $\text{Ca}^{++}$  в костях, препятствуют развитию остеопороза.
2. Усиливают образование в печени ЛПВП и снижают синтез ЛПНП, препятствуют развитию атеросклероза.

3. Активируют образование в печени факторов свертывания крови (II, VII, IX и X). Снижают образование антитромбина III.

4. Активируют гемопоэз в костном мозге.

5. Усиливают рост эстроген зависимых типов злокачественных опухолей.

По химическому строению

выделяют

препараты

эстрогенов

стероидного

строения

(эстрадиол,

этинилэстрадиол)

и

нестероидного

строения

(синэстрол,

лигнандол, брестрол)

**Механизм  
действия  
эстрогенов**

Эстрогены проникают в ядро клеток-мишеней, где они связываются со специфическими белками-рецепторами. Образовавшийся комплекс рецептор-гормон взаимодействует с ДНК и регулирует синтез специфических структурных белков и ферментов, которые необходимы для роста и функционирования органов репродуктивной системы.



# Применение эстрогенов

- При гипофункции яичников.
- Для подавления лактации.
- В комплексной терапии больных раком предстательной железы.
- При раке молочных желез после 60 лет.
- При заместительной терапии при климаксе.
- Как противозачаточные средства в комбинации с прогестинами.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

*Estradiol dipropionate*

Ампулы, р-р в масле

0,1 %-1 мл, в/м 1 раз в 3 дня

# *Aethinylestradiol*

Таблетки 10 и 50 мкг .

Внутрь 1 р/с

# *Synestrol*

Ампулы , р-р в масле

0,1% -1 мл , в/м 1 раз в сутки

0,2% -1 мл

# *Diethylstilbestrol*

Ампулы, р-р в масле

3% -1 мл. в/м 1 раз в сутки

# Гестагены

Название происходит от латинского слова «gesto» - нести (способствовать развитию беременности).

# Прогестерон

Стероидный гормон.

Аналогичен природному прогестерону, который образуется в желтом теле и подготавливает матку к беременности.



# Механизм действия

Связывается с внутриклеточными рецепторами, образуя гестаген-рецепторный комплекс, который реагирует с ДНК и активирует синтез белков и ферментов, необходимых для имплантации зиготы и нормального течения беременности.

# Основные эффекты

- Активирует в матке фазу секреции
- Снижает возбудимость миометрия
- Способствует пролиферации ткани молочных желез

Применяется для коррекции нарушений менструального цикла, при бесплодии, для сохранения беременности при угрозе выкидыша.

Вводят в/м 1 раз в день.

# Оксипрогестерона капронат

Синтетический гестаген  
длительного действия.

По механизму действия,  
эффектам и применению  
сходен с прогестероном.

Вводят в/м 1 раз в 7 дней.

# Норэтистерон

Гестагенный синтетический препарат, активный при введении внутрь.

Входит в состав комбинированных гормональных противозачаточных средств.

Вводят внутрь 1 раз в день.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

*Progesterone*

Ампулы, р-р в масле

1% -1 мл, в/м 1 раз в день

# *Oxuprogesteroni caproas*

Ампулы, р-р в масле

12,5%-1 мл, в/м 1 раз в

7 дней

# *Norethisterone*

Таблетки 5 мг, ВНУТРЬ  
1 раз в сутки



# Антиэстрогенные препараты

Эти препараты являются  
антагонистами  
рецепторов эстрогенов.

# Кломифена цитрат

Синтетическое соединение.

Вводят внутрь.

Блокирует рецепторы эстрогенов в гипоталамусе и гипофизе.

Увеличивает выделение ФСГ и ЛГ.

Активирует созревание яйцеклеток в фолликулах и сперматогенез.

Применяется при бесплодии.

# Тамоксифена цитрат

Сходен с кломифеном.

Антагонист рецепторов  
эстрогенов.

Применяется при раке  
молочной железы.

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

*Clomifeni citras*

Таблетки 50 мг,

внутрирь 1 раз в сутки

# *Tamoxifeni citras*

Таблетки 10 и 20 мг

внутри 2 раза в день

# Антигестагенные средства

К ним относят  
антагонисты и  
модуляторы рецепторов  
прогестерона.

# Мефепристон

Блокирует рецепторы прогестерона матки.

Применяется совместно с простагландинами для прерывания беременности на ранних сроках.

Вводят внутрь по 600 мг.

# Форма выпуска

*Mefepristone*

Синонимы: *Mifegyne*

*Ренсрофтон*

Таблетки 200 мг.



# Андрогены

Это лекарственные средства, с активностью гормонов мужских половых желез.

Название происходит от греческого «andros» - мужчина, «genos» - род.

Основным гормоном мужских половых желез является тестостерон, который в органах превращается в более активный дигидротестостерон.

Андрогенные гормоны  
необходимы для развития  
половых органов и  
вторичных половых  
признаков мужчины.

Они оказывают анаболическое действие, способствуют синтезу белка, усиливают развитие мышц, способствуют отложению кальция и фосфора в костях, усиливают эритропоэз.

# Механизм действия андрогенов

Тестостерон и дигидротестостерон взаимодействуют с одним и тем же рецептором, который обозначается NR3A и относится к рецепторам стероидных гормонов.

Рецептор андрогенов  
имеет 3 участка:

1. Амино-терминальный
2. ДНК-связывающий
3. Лиганд-связывающий

Андрогены присоединяются к лиганд-связывающему участку и транспортируются в ядро клетки-мишени, где связываются с ДНК и активируют экспрессию генов.

В отдельных тканях тестостерон превращается в эстрадиол, который действует через рецепторы эстрогенов. Так регулируется рост костей и половое влечение у мужчин.

Применяют при половом недоразвитии и климактерических нарушениях у мужчин.

При избыточном выделении эстрогенов и метастазах рака молочной железы у женщин.



# ФОРМЫ ВЫПУСКА

*Testosteroni propionas*

Ампулы, р-р в масле

5%-1 мл

в/м 1 раз в сутки

# *Testenatum*

Смесь эфиров тестостерона  
длительного действия

Ампулы, р-р в масле

в/м 1 раз в 7 дней

# *Methyltestosterone*

Таблетки 5 и 10 мг

внутри и под язык 1 раз в  
сутки

# Антиандрогенные средства

## Классификация

1. Подавляющие секрецию андрогенов.

*Buserelin* — рилизинг гормон гипоталамуса.

2. Подавляющие синтез андрогенов.

*Ketocanazol* — противогрибковое средство.

3. Подавляющие активирование  
тестостерона с образованием  
дигидротестостерона.

*Finastride* — ингибитор 5- $\gamma$ -  
редуктазы.

4. Антагонисты рецепторов  
тестостерона

*Ципротерон*

*Флютамид*

# ФОРМЫ ВЫПУСКА

*Sупротероне асетате*

Синоним: *Андросир*

Таблетки 10 и 50 мг

Раствор в масле 10%-3 мл

Применяют при раке  
предстательной железы

# *Flutamide*

Таблетки 250 мг

Внутрирь 3 раза в сутки

Применяют при раке  
предстательной железы

# Анаболические стероиды

К ним относят стероидные вещества, которые по фармакологическому действию похожи на тестостерон, но являются слабыми андрогенами и сильными анаболиками.



# Основные эффекты

- Увеличение аппетита
- Усиление синтеза белка
- Увеличение массы скелетных мышц и внутренних органов
- Задержка в организме азота, фосфора и кальция

Применяют анаболические  
стероиды при кахексии,  
после лучевой терапии,  
при остеопорозе, для  
усиления регенерации  
тканей.

# Форма выпуска

*Retabolilum*

Ампулы, р-р в масле

5 % - 1 мл, в/м 1 раз в  
14 дней

Благодарю за  
внимание!