

性激素与避孕药



第三十二章

性激素与避孕药

01 第一节 雌激素类药及抗雌激素类药

02 第二节 孕激素类药及抗孕激素类药

03 第三节 雄激素类药及抗雄激素类药

04 第四节 避孕药

性激素类药与避孕药

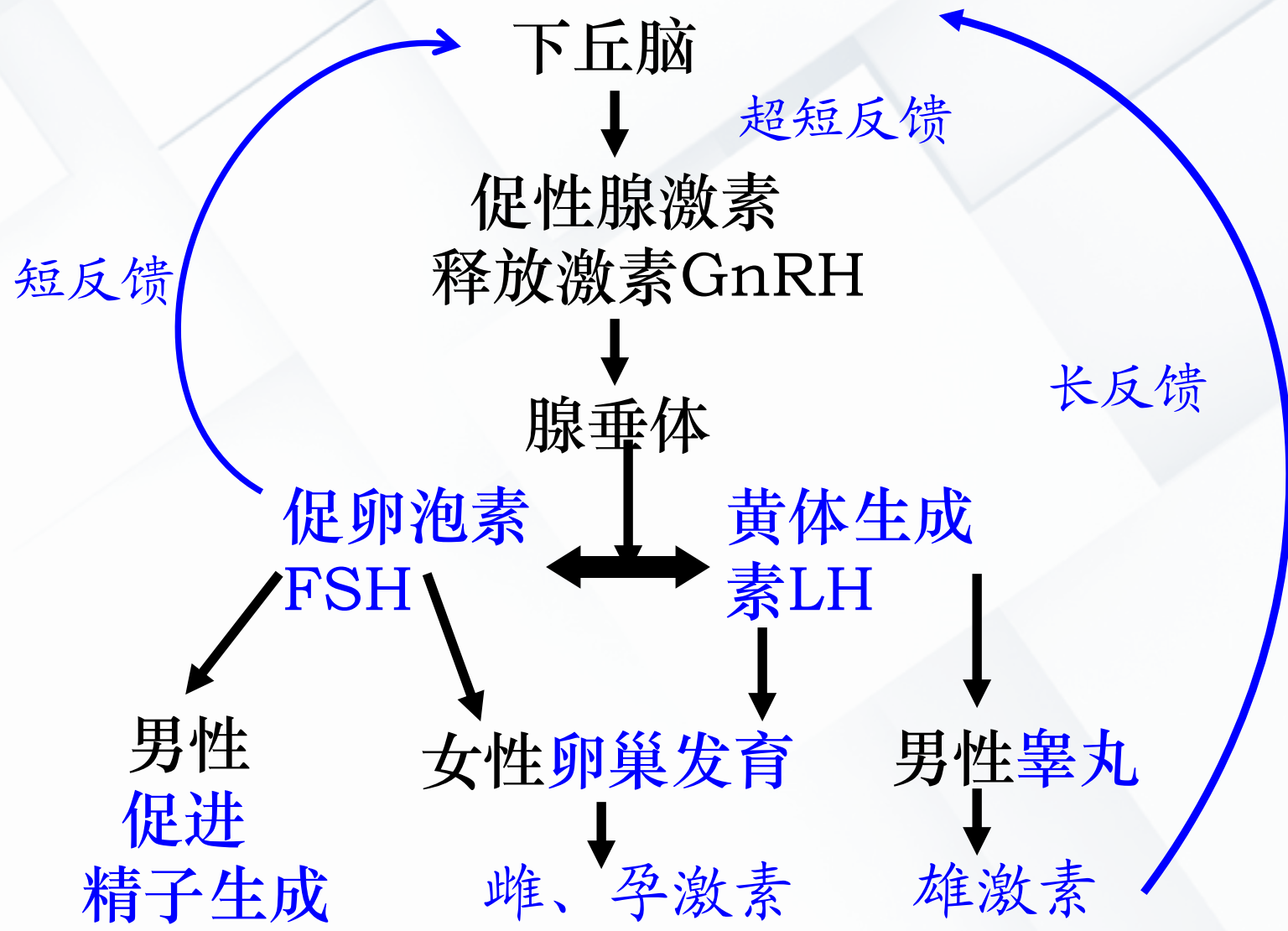
1.性激素主要由性腺分泌，属甾体化合物，临床用人工合成品和其衍生物。

雌激素：卵巢卵泡膜细胞分泌

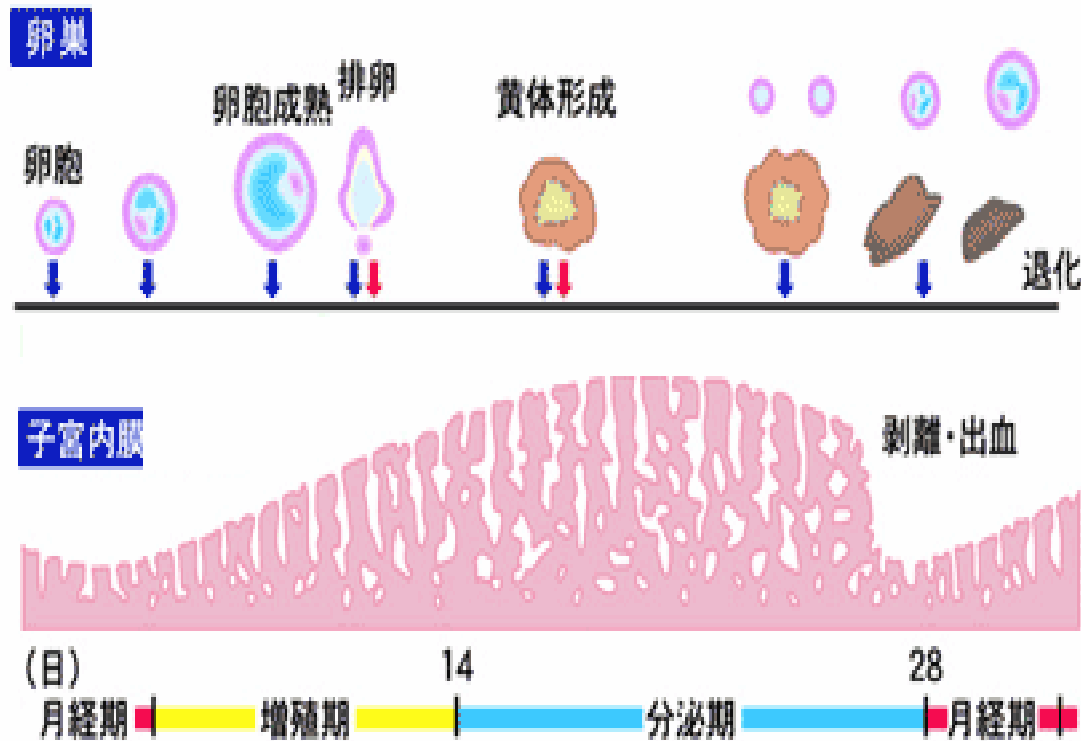
孕激素：黄体、妊娠后胎盘分泌

雄激素：主要由睾丸间质细胞分泌。

性激素类药与避孕药



女性激素与性周期



- 卵巢:女性生殖腺，产生卵子并分泌女性性激素（雌、孕激素）。
- 从青春期开始，每隔28天左右会有一次子宫内膜剥脱出血，称为月经周期 (menstrual cycle)。MC的出现，标志着卵巢开始排卵，同时伴有雌、孕激素的分泌。
- 月经周期持续30-40年，随后，卵巢老化，月经周期停止，进入绝经期。

第一节 雌激素类药及抗雌激素类药

一、雌激素类药

天然激素作用弱，常用衍生物；油剂吸收缓慢，作用持续时间长。

常用药物

- ❖ **雌二醇**：天然激素，作用弱，注射给药。
- ❖ **炔雌醇**：雌二醇衍生物，作用强，口服。
- ❖ **炔雌醚**：长效，储存于脂肪，口服1次，持续7-10天
- ❖ **己烯雌酚**（非甾体类药物）：人工合成，作用弱。



生理、药理作用

1.促进女性第二性征和性器官发育成熟：未成熟女性

2.参与形成月经周期：成熟女性，保持第二性征，

3.抗排卵作用

①小剂量促性腺激素分泌，促使排卵

②较大量通过负反馈抑制排卵

较大量抗催乳素，抑制乳汁分泌

③抗雄激素作用

4.影响代谢：轻度水钠潴留，升高血压；促钙沉积



临床应用

1. 绝经期综合征：卵巢功能↓雌激素↓促性腺激素↑
3. 卵巢功能不全、闭经：补雌激素，替代疗法
3. 功能性子宫出血：促内膜增生，修复创面止血
4. 乳房胀痛和产后退乳：抗催乳素，减少乳汁分泌
5. 晚期乳腺癌：晚期癌，绝经>5年，绝经前禁用
6. 前列腺癌：抑制雄激素分泌兼抗雄激素作用
7. 避孕，骨质疏松，痤疮等

不良反应：1.长期大剂量可致内膜过度增殖而出血
2.水钠潴留，引起水肿，加重心衰



二、抗雌激素药

雌激素受体调节剂，对抗雌激素生殖系统作用；对骨骼、心血管拟似雌激素作用。

氯米酚

部分激动药，雌激素作用弱。

- 1. 作用：**阻断下丘脑雌激素受体，抑制负反馈调节——垂体前叶促性腺激素分泌 $\uparrow$ ，促排卵。
- 2. 应用：**无排卵型、缺精子型不孕症、闭经、乳房纤维囊性病、晚期乳癌等。
- 3. 不良反应：**长期致卵巢肥大，卵巢囊肿禁用。



第二节 孕激素类药

常用药物：

孕酮（黄体酮，**progesterone**）作用弱，注射给药

孕酮衍生物：**甲地孕酮、甲羟孕酮**

妊娠素衍生物：**炔诺酮、炔诺孕酮**



生理和药理作用

1.生殖系统

- ①促进子宫内膜增生，使内膜由增殖期转为分泌期，利于孕卵着床、发育。
- ②抑制子宫收缩，降低对缩宫素敏感性，保胎
- ③较大剂量抑制排卵，促子宫颈口闭合，避孕
- ④与雌激素一起促进乳腺发育，为哺乳作准备。

2.对抗醛固酮、利尿。

3.轻度升温，在月经周期黄体相基础体温高。



临床应用

- 1.功能性子宫出血：促内膜发育成熟完全脱落完全
 - 2.痛经：抑制排卵，减轻子宫过度收缩
 - 3.子宫内膜异位症：使异位的子宫内膜退化
 - 4.流产：降低子宫对缩宫素敏感性，有安胎作用
 - ①对先兆流产早期效果好，对习惯性流产效差
 - ②炔诺酮使女胎男性化，禁用；
 - ③黄体酮偶使生殖器畸形。
 - 5.子宫内膜腺癌，前列腺肥大和前列腺癌
 - 6.避孕，与雌激素合用
- 不良反应：长期应用子宫内膜萎缩等

第三节 雄激素类药和同化激素类药

一、雄激素类药

睾酮 (testosterone) 天然激素。

甲睾酮(methyltestosterone) 可口服、舌下给药。

丙酸睾酮 油剂注射，作用时间长 (2-4d) 。



生理和药理作用

1.生殖系统

- ①促男性性器官和第二性征发育成熟
- ②抑制雌激素分泌，抗雌激素作用

2.刺激骨髓造血：红细胞生成素↑；直接兴奋骨髓

3.同化作用：促蛋白质合成，抑制分解—促进肌肉生长，体重增加



临床应用

1. **睾丸功能不全**：用于类无睾症、男子性功能低下
2. **功能性子宫出血**：收缩子宫及血管；内膜萎缩
3. **用于晚期乳腺癌和卵巢癌**：抗雌激素、抗催乳素对乳腺的刺激。
4. **用于再生障碍性贫血**
5. **虚弱**：消耗性疾病、骨质疏松、生长延缓等

不良反应

1. 女性患者男性化现象，多毛，痤疮等
2. 干扰肝内毛细胆管排泄，引起**胆汁淤积性黄疸**



二、同化激素 (anabolic hormone) 类药

常用药物：“苯丙酸诺酮（南诺龙）、美雄酮（去氢甲基睾丸素、司坦唑醇（康力龙）

药理作用：同化作用强，雄激素样作用弱。

临床应用：慢性消耗性疾病、严重烧伤、恶液质、手术后康复、恶性肿瘤晚期、老年骨质疏松等。

不良反应：长期应用可出现水钠潴留、女性男性化等。

第四节 避孕药

1.定义：能阻止受孕，中断妊娠的药物。

2.分类：

①主要抑制排卵的避孕药

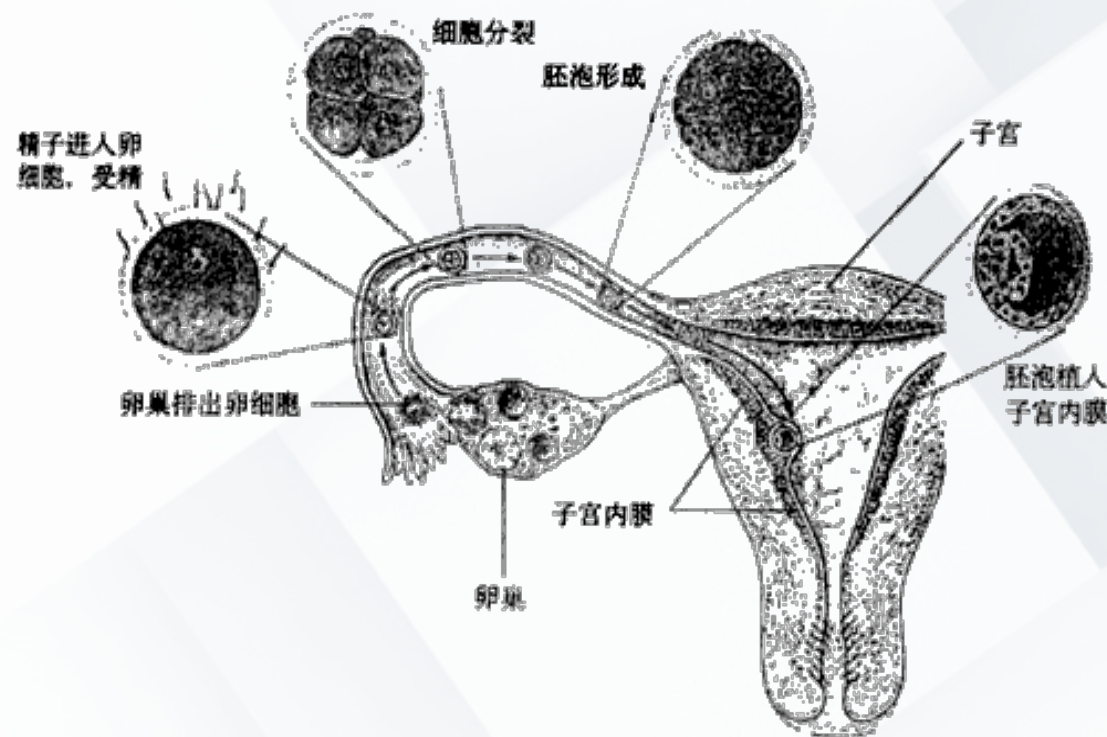
雌激素+ 孕激素

最常用的女用避孕药

②抗着床避孕药

③抗早孕药

④男用避孕药



排卵、受精和开始怀孕的示意图



一.抑制排卵药

药理作用

1.抑制排卵，停药后可恢复

雌激素负反馈抑制FSH分泌，抑制卵泡成熟；

孕激素负反馈抑制LH分泌，抑制排卵。

2.抗着床：抑制子宫内膜增殖，使其萎缩

3.孕激素可使子宫颈口闭合，宫颈粘液粘稠度高 不利于精子进入



分类及用法

1. 短效口服避孕药

炔雌醇+炔诺酮（或甲地孕酮、炔诺孕酮）

月经第5天始连续22天不间断，成功率近100%

2. 长效口服避孕药

炔雌醚+炔诺酮（氯地孕酮、甲氯地孕酮）

周期第5天服1片，隔20天再服1片，以后1片/月

成功率98.3%。

3. 长效注射避孕药

雌激素+孕激素：开始2支/月，后1支/月。

4. 埋植剂、多相片剂



二、抗着床避孕药（探亲避孕药）

- 1.由甲地孕酮、炔诺孕酮等高效孕激素组成
- 2.可使子宫内膜发生形态和功能的变化，导致受精卵难以着床，最终实现避孕的目的
- 3.可临时服用，事后每晚1片，超过14天，接服短效口服避孕药。

三、抗早期及中期妊娠药

米非司酮 + 米索前列醇

1. 阻断孕酮对子宫平滑肌的抑制作用，或增强前列腺素对子宫平滑肌的兴奋作用
2. 妊娠期的前12周内，完全流产终止妊娠的药物
3. 完全流产率高，对母体无明显不良反应

四、男性避孕药

棉酚：减少精子生成，过量可绝育