

**Гормональні препарати, їх синтетичні  
замінники та антагоністи.**

# План.

1. Препарати гормонів гіпофіза та гіпоталамічні гормони, що гальмують ріст.
2. Препарати, які застосовують при порушенні функції щитоподібної та прищитоподібної залоз.
3. Протидіабетичні засоби.
4. Препарати гормонів кіркової речовини надниркових залоз та їх синтетичні аналоги.
5. Препарати жіночих статевих гормонів. Контрацептивні (протизаплідні) засоби.
6. Препарати чоловічих статевих гормонів (андрогени). Анаболічні стероїди.

## **Гормональні препарати, їх синтетичні замінники та антагоністи.**

**Гормони** - білково-пептидні або стероїдні сполуки, що секретуються ендокринними залозами і виділяються безпосередньо в кров. Гормони - важлива складова нейроендокринного комплексу, який виконує: функції гомеостазу, взаємодії різних систем людського організму, збереження виду, адаптації до навколишнього середовища. Недостатня секреція гормонів (**гіпофункція залоз**) призводить до розвитку різних ендокринних захворювань- гіпотиреозу, цукрового діабету, безплідності тощо. Надлишкова секреція гормонів (**гіперфункція залоз**) також проявляється ендокринною патологією - гігантизмом, акромегалією, тиреотоксикозом тощо.

Гормональну терапію проводять з метою заміщення недостатності утворення гормонів у ендокринних залозах і лікування гіпофункції, а також при неендокринних хворобах для підвищення резистентності організму, при порушенні обміну речовин, під час інфекційних та алергічних хвороб тощо.

Слід завжди пам'ятати, що тривале лікування гормонами знижує секреторну активність відповідної залози і навіть може зумовити її атрофію. При цьому раптове переривання гормонотерапії може спричинити розвиток синдрому відміни - гормональну недостатність. Для попередження такого ускладнення завжди наприкінці лікування дозу знижують поступово і застосовують певні методи стимуляції відповідної залози.

### **Препарати гормонів гіпофіза та гіпоталамічні гормони**

#### **Препарати гормонів аденогіпофіза (передньої частки) та їх синтетичні аналоги**

Кортикотропін регулює функцію кіркової речовини надниркових залоз, виявляє протиалергічну і протизапальну дію. Призначають для лікування пацієнтів з алергічними і запальними захворюваннями, ревматизмом, поліартритом, а також застосовують з метою запобігання розвитку синдрому відміни під час лікування кортикостероїдами.

**Тиротропін** регулює функцію щитоподібної залози, призначають хворим з гіпофункцією щитоподібної залози та з діагностичною метою - при гострому її запаленні.

**Соматотропін (соматропін, хуматроп)** - біосинтетичний гормон росту людини, стимулює лінійне збільшення кісток. Застосовують для лікування

дітей з порушенням росту, синдрому Тернера, гіпофізарного нанізму (карликовості). Його не можна призначати хворим, коли ріст кісток уже завершився.

**Лактив** регулює виділення молока в післяпологовий період. Застосовують при гіпо- чи агалакції (недостатності виділення або відсутності молока).

**Гонадотропні гормони** регулюють функцію статевих залоз. Застосовують при порушенні функції статевих залоз, безплідності.

### **Препарати гормонів нейрогіпофіза (задньої частки)**

**Окситоцин** - синтетичний гормон нейрогіпофіза. Основне застосування препарату - стимуляція пологової діяльності, зупинка гіпотонічної маткової кровотечі.

**Пітуїтрин** - препарат, що містить 2 гормони: окситоцин та вазопресин. Вміст окситоцину дає можливість застосування його в акушерсько-гінекологічній практиці. Вміст вазопресину забезпечує підвищення реабсорбції води в нирках, затримку рідини та йонів в організмі, підвищення АТ. Застосовують пітуїтрин також для лікування хворих на нецукровий діабет, пацієнтів з нічним нетриманням сечі (енурезом).

**Адіурекрин** - сухий пітуїтрин. Застосовують інтраназально (вдихання через ніс) для лікування нецукрового діабету, енурезу. Тривалість дії - 6-8 год.

**Адіуретин** - рідина, що містить вазопресин. Призначають всередину в краплях пацієнтам з нецукровим діабетом та при енурезі.

### **Гіпоталамічні гормони, що гальмують ріст**

До них належать препарати соматостатин (модустатин) та октреотид (сандостатин).

**Октреотид (сандостатин)** - синтетичне похідне природного гормону соматостатину, але має більш тривалу дію. Він пригнічує підвищену секрецію гормону росту, а також пептидів і серотоніну, через що змінює клінічні прояви деяких пухлинних та інших хвороб травного каналу і підшлункової залози.

**Показання до застосування:** акромегалія, ендокринні пухлини травного каналу та підшлункової залози, зупинка кровотеч із варикозно розширених вен стравоходу, діарея у хворих на СНІД та ін.

## **Препарати, які застосовують при порушенні функції щитоподібної та прищитоподібноі залоз**

Функція щитоподібної залози залежить від кількості йоду і його сполук, які потрапляють в організм. Характерно, що надлишок йоду не впливає на функцію здорової залози. Під дією ферментів йод з тирозином утворює кілька сполук (дийодтирозин, тетраїодтиронін, трийодтиронін), потім у кров потрапляє тироксин, який утворюється з цих речовин у процесі біотрансформації.

Тироксин впливає на всі види обміну речовин в організмі, що забезпечує його ріст і розвиток.

**При гіпофункції** щитоподібної залози в дітей відзначається затримка росту, розумового та статевого розвитку з уповільненням обміну речовин (кретинізм).

У дорослих набута гіпофункція (мікседема, гіпотиреоз) проявляється зниженням обміну речовин (збільшенням маси тіла), розвитком зобу, облісінням, сухістю шкіри, набряками обличчя і кінцівок, анемією, серцевою недостатністю.

**При гіперфункції** щитоподібної залози підвищується обмін речовин, зменшується маса тіла, виникають тахікардія, пітливість, безсоння (базедова хвороба, гіпертиреоз, тиреотоксичний зоб).

**Засоби, які застосовують при гіпофункції щитоподібноі залози** (тиротропні засоби, стимулятори фуикції щитоподібноі залози, тиреоїдні засоби)

**Тиреоїдин** - тиреоїдний засіб, що отримують із щитоподібних залоз тварин, який містить тироксин та трийодтиронін; прискорює основний обмін. Дія препарату розвивається через 2-3 дні, максимум дії відзначається через 6-10 днів, триває 50-70 днів.

**Показання до застосування:** лікування хворих з усіма формами гіпотиреозу (мікседеми, кретинізму, ендемічного зобу), раком щитоподібної залози.

**Левотироксин (L-тироксин, еутирокс, елтроксин, тиворал)** - тиреотропний засіб, синтетичний гормон щитоподібної залози. Стимулює процеси росту і розвитку, обмін білків, жирів і вуглеводів, збільшує потребу тканин у кисні.

**Показання до застосування:** замісна терапія при гіпотиреозі та після струмектомії (часткове видалення щитоподібної залози), лікування і профілактика дифузного еутиреоїдного зобу, автоімунний тиреоїдит, рак щитоподібної залози.

### **Засоби, які застосовують при гіперфункції щитоподібної залози**

**Мерказоліл (тіамазол, метизол, тирозол)** - антитиреоїдний засіб, що зменшує синтез гормонів у щитоподібній залозі, виводить йодиди із залози, знижує активність окислювальних ферментів та основний обмін речовин.

**Показання до застосування:** для лікування різних форм токсичного зобу (базедова хвороба, тиреотоксикоз, дифузний токсичний зоб).

**Препарати йоду** - у низьких дозах виявляють антитиреоїдну дію, гальмують синтез гормонів щитоподібної залози, порушують зворотний зв'язок у системі аденогіпофіз - щитоподібна залоза (пригнічують утворення тиротропного гормону гіпофіза). Дія препаратів проявляється через 12-24 год.

### **Засоби, які застосовують при порушенні функції прищитоподібної залози**

Гормон прищитоподібної залози **паратиреоїдин (паратгормон)** посилює всмоктування кальцію у кишечнику, його реабсорцію у ниркових каналцях, сприяє розсмоктуванню кісток та видаленню з них кальцію; препарат також гальмує ниркову реабсорбцію фосфатів.

**При гіпофункції прищитоподібної залози** знижується вміст кальцію у крові і розвивається алкалоз. Це призводить до підвищення збудливості нервової системи і тетанії (підвищення тону м'язів обличчя і діафрагми, виникнення судом, ларингоспазму, порушення дихання - спазмофілія).

**При гіперфункції прищитоподібної залози** у крові підвищується рівень кальцію і це проявляється порушенням остеоутворення (розсмоктування кісткової тканини, деформація опорно-рухового апарату і переломи кісток), розвитком хвороби Педжета (деформічний остит), злоякісним остеолізом тощо.

**Паратиреоїдин (паратиреокрин, паратгормон)** - гормон прищитоподібної залози тварин. Регулює кальцієвий обмін. Початок дії спостерігається через 12-24 год.

**Показання до застосування:** тетанія, спазмофілія, бронхіальна астма та інші алергійні захворювання.

## Протидіабетичні засоби

У клітинах острівців підшлункової залози (Лангерганса) синтезується інсулін. Основна фізіологічна роль інсуліну в організмі - звиження вмісту глюкози в крові. Це відбувається за рахунок транспорту глюкози всередину клітин, посилення засвоєння її тканинами, підвищення глікогенезу (синтез глікогену з глюкози в клітинах печінки).

За відсутності або недостатності інсуліну розвивається **цукровий діабет**.

Розрізняють 2 типи цього захворювання (за класифікацією ВОЗ):

- інсулінозалежна форма (цукровий діабет I типу, цукровий діабет юнацький);
- інсулінонезалежна форма (цукровий діабет II типу, цукровий діабет дорослих).

У хворих на цукровий діабет з'являються сильна спрага, підвищується споживання рідини, зменшується маса тіла, знижується імунітет, сповільнюється загоєння ран, виникають ускладнення з боку судин. Лабораторно - гіперглікемія (рівень глюкози в крові більше ніж 6,6 ммоль/л), глюкозурія (цукор у сечі), ацидоз.

Залежио від типу хвороби застосовують 2 групи протидіабетичних препаратів:

### **Гормональні препарати - інсуліни**

Гормональні препарати для лікування цукрового діабету - інсуліни

Хумулін

Монодард

Монодар Б

Ультратард

Монодар ультралонг

Інсуліни - це гормональні препарати або їхні аналоги, які застосовують для лікування хворих з I типом цукрового діабету (інсулінозалежного).

**Гіпоглікемія** може розвинути внаслідок передозування інсуліну або фізичного навантаження. На початку цього стану хворому дають цукор або

солодкий чай, у тяжкому стані вводять внутрішньовенно струминно 20-50 мл 40 % розчину глюкози. За відсутності ефекту вводять 5 % розчин глюкози внутрішньовенно краплинно. Для стимуляції глікогенезу і корекції АТ вводять 0,5 мл 0,1 % розчину адреналіну гідрохлориду.

**Гіперглікемія (діабетична кома)** розвивається внаслідок несвоєчасного введення інсуліну. Для лікування застосовують лише інсуліни короткої дії, які вводять внутрішньовенно. Існують різні схеми лікування гіперглікемічної коми. Найоптимальніший метод - внутрішньовенне краплинне введення інсуліну протягом перших 2 год зі швидкістю 8 ОД/год з розрахунку 0,1 ОД/кг. Для цього 1 мл інсуліну (40 ОД) розчиняють у 500 мл ізотонічного розчину натрію хлориду, вводять внутрішньовенно краплинно зі швидкістю 30-35 крапель за 1 хв.

### **Пероральні гіпоглікемічні препарати**

**Пероральні гіпоглікемічні препарати** - це синтетичні препарати для вживання всередину при 2 типі цукрового діабету (інсуліннезалежного).

**Похідні сульфонілсечовини (букарбан, бутамід тощо)** стимулюють утворення ендogenousного інсуліну в підшлунковій залозі.

**Глібенкламід** - синтетичний гіпоглікемічний препарат, який посилює утворення ендogenousного інсуліну, підвищує чутливість тканин до інсуліну та ступінь його зв'язування з клітинами-мішенями.

Бігуаніди та препарати різної будови (метформін, буформін тощо) підвищують споживання глюкози тканинами, зменшують всмоктування глюкози в травному каналі. Призначають хворим на інсуліннезалежний цукровий діабет з ожирінням на фоні цукрового діабету 1 типу, у складі комбінованої терапії хворих на цукровий діабет.

**Метформін (сіофор)** - пероральний протидіабетичний засіб, який затримує всмоктування глюкози з травного каналу, підвищує зв'язування інсуліну з рецепторами, гальмує синтез глюкози в печінці, знижує синтез ендogenousного інсуліну.

### **Препарати гормонів кіркової речовини надниркових залоз та їх синтетичні аналоги**

Глюкокортикоїди або глюкокортикостероїди (ГКС) - гормони кіркової речовини надниркових залоз, що впливають на всі види обміну речовин.



Фармакологічна дія ГКС:

- протизапальна;
- протиалергійна;
- протишокова;
- імунодепресивна (пригнічення утворення антитіл, імуногенезу);  
антитоксична;
- пригнічення синтезу лімфоїдної та сполучної тканини.

Преднізолон - синтетичний ГКС, активніший за гідрокортизон у 4 рази, виявляє виражену протизапальну, протиалергійну, імунодепресивну дію.

**Показання до застосування:** для лікування пацієнтів з ревматизмом, колагенозом (захворювання сполучної тканини - системний червоний вовчак, склеродермія), бронхіальною астмою, тяжкими алергійними реакціями, шоком, колапсом різного типу (травматичний, алергійний, геморагічний, септичний, кардіогенний шок), при трансплантації органів тощо.

**Метилпреднізолон** проявляє таку саму активність, як і преднізолон, але не впливає на обмін мінералів, не зумовлює виникнення набряків і краще переноситься хворими.

Синтетичні ГКС, що містять фтор (**дексаметазон та тріамцинолон**) - більш активні, ніж преднізолон (у 7 і 5 разів відповідно). Застосовують так само, як і всі ГКС. Але треба пам'ятати, що вони справляють особливий побічний ефект: м'язову слабкість і навіть параліч (особливо тріамцинолон), тоді як побічна дія їх на травний канал та набряки - менш виражена та виникає рідше.

ГКС інгаляційні призначають хворим при нападах бронхіальної астми та бронхоспазмі.

**Флунісолід (інгакорт)** - ГКС у формі аерозолю для інгаляцій та назального аерозолю, виявляє виражену і швидку протиалергійну та протизапальну дію, оскільки, на відміну від беклометаону і дексаметазону, в момент введення перебуває у біологічно активній формі і повністю діє на орган-мішень. Покращує дихання, зменшує клінічні прояви бронхіальної астми та потребу в частому застосуванні бронхолітиків.

ГКС для зовнішнього застосування використовують у формі мазі при алергійному дерматиті, екземі, псоріазі, нейродерміті, інфекційно-запальних хворобах шкіри; у формі мазі для очей і крапель - при алергійному кон'юнктивіті тощо.

Дермовейт - ГКС для місцевого застосування IV покоління (найвищої активності), виявляє сильну протиалергійну та протизапальну дії. Усуває набряк, гіперемію, свербіж.

**Показання до застосування:** псоріаз, екзема, червоний плоский лишай (СЧВ) та інші стійкі до лікування менш активними ГКС шкірні хвороби.

### **Препарати жіночих статевих гормонів**

Естрогени виробляються в яєчниках. Вони стимулюють розвиток жіночих статевих органів, вторинних статевих ознак, спричинюють проліферацію ендометрія (зміни в ендотелії, що призводять до його видалення і відновлення менструації).

Естрогенну терапію широко застосовують при всіх проявах недостатності внутрішньосекреторної функції яєчників - гіпоплазії матки (інфантилізм - недорозвинутість статевих органів), розладах менструального циклу, безплідності, після операцій з приводу видалення яєчників і матки, при патологічному перебігу клімаксу тощо.

**Естрон (фолікулін)** - природий фолікулярний гормон у формі олійного розчину, отримують із сечі вагітних або плаценти. Бере участь у формуванні вторинних статевих ознак, стимулює розвиток матки, необхідний для нормального менструального циклу та репродуктивної функції. Як препарат, він приблизно в 5 разів менш активний, ніж естрадіол.

**Естрадіол** виявляє сильну, уповільнену та тривалу естрогенну дію.

**Етинілестрадіол** - синтетичне похідне естрадіолу, один із найбільш активних естрогенів.

**Синестрол** - синтетичний аналог естрадіолу (сильніший за естрон у 5 разів).

### **Гестагенні гормони (прогестини)**

Виробляються жовтим тілом яєчників. Назва гормонів походить від латинського pro gestatio - для вагітності. Звідси зрозуміла і їхня фізіологічна роль - сприяння збереженню вагітності в I триместрі.

**Прогестерон (утрожестан)** - гормон жовтого тіла яєчників. Сприяє утворенню нормального секреторного ендометрія, діє спазмолітично на м'язи матки,

зменшує збудливість і скоротливу активність м'язів матки і маткових труб; готує слизову оболонку матки до імплантації заплідненої яйцеклітини та підтримує нормальний розвиток вагітності.

Показання до застосування: невиношування плода (для його збереження), безплідність, дисменорея, гіперпластичні процеси в міометрії (маткові кровотечі), ендометріоз, патологічний перебіг клімаксу.

**Дуфастон (дидрогестерон)** - синтетичний прогестоген, дія якого та застосування подібні до таких прогестерону. Препарат не спричинює маскулінізуючу та вірилізуючу дію, добре переноситься.

**Аллілестренол (туринал)** - пероральний синтетичний гестаген, що застосовують для збереження вагітності при звичних та загрожуючих абортах, загрозі передчасних пологів.

### **Контрацептивні (протизаплідні) засоби**

**Контрацептивні (протизаплідні) засоби** - це гормональні препарати, які застосовують для запобігання небажаній вагітності.

### **Класифікація протизаплідних препаратів**

1. Комбіновані естроген-гестагенні протизаплідні засоби
  - монофазні - овідон, ригевідон, мівізістон, діане-35, марвелон, мікрогінон-28, силест
  - двофазні - антеовін
  - трифазні - трирегол, тризістон, триквілар, триновум
2. Мікродози гестагенів
  - норгестрел (оврет), мікролют
3. Посткоїтальні препарати
  - постииор
4. Пролонговані гестагенвмісні
  - ін'єкційні - медроксипрогестерону ацетат (депо-провера)
  - підшкірні імплантати - півоногестрел (норплант)

## 5. Вагінальні контрацептиви (сперміциди)

- фарматекс (бензалконій-хпорид).

Контрацептивні комбіновані естроген-гестагенні препарати пригнічують гіпоталамо-гіпофізарну систему, овуляцію, змінюють склад слизу в шийці матки і перешкоджають проникненню сперматозоїдів.

Моно-, дво- і трифазні препарати різняться за складом, дозою естрогенів і гестагенів. Трифазні контрацептиви повністю відповідають фізіологічному циклу, забезпечують найменше гормональне навантаження на організм жінки.

### **Препарати чоловічих статевих гормонів (андрогени)**

Андрогени виробляються чоловічими статевими органами, сприяють розвитку статевих органів, формуванню вторинних статевих ознак, скелетних м'язів за чоловічим типом, фіксують кальцій у кістках. До андрогенних препаратів належать тестостерону пропіонат, тестенат, тетрастерон (сустанон-250, омнадрен), метилтестостерон, тестобромлецит.

**Тестостерону пропіонат** - синтетичний аналог андрогенів, має біологічні і лікувальні властивості натурального гормону; повільніше всмоктується і більш стійкий, ніж природний гормон. З усіх препаратів чоловічих статевих гормонів має найбільш сильну андрогенну дію.

**Показання до застосування:** статеве недорозвинення (інфантилізм), порушення статевої функції, у високих дозах - для лікування злоякісних пухлин матки та молочних залоз у жінок віком до 60 років тощо.

**Метилтестостерон** у 3-4 рази слабший за тестостерон.

### **Анаболічні стероїди**

**Анаболічні стероїди** - група препаратів, які за будовою подібні до андрогенів, але не мають гормональної активності.

Анаболічні препарати - **метандростенолон, ретаболіл.**

**Ретаболіл (нандролон)** - синтетичний анаболічний стероїд, що виявляє сильну і тривалу анаболічну дію. Анаболічна дія - це стимуляція синтезу білка, утилізація азоту, кальцію, натрію, калію, хлоридів і фосфатів, що зумовлює збільшення м'язової тканини і прискорення росту кісток (остеогенез), репарації тканин. Ефект розвивається за 3 дні і триває протягом 3 тиж і більше.

**Показання до застосування:** всі стани з абсолютним чи відносним дефіцитом білків - при кахексії (виснаженні), дистрофії, хронічних інфекціях, травмах, опіках, інфаркті міокарда; хвороби опорно-рухового апарату - остеопороз, переломи, незакінчений остеогенез, псевдоартроз тощо.