



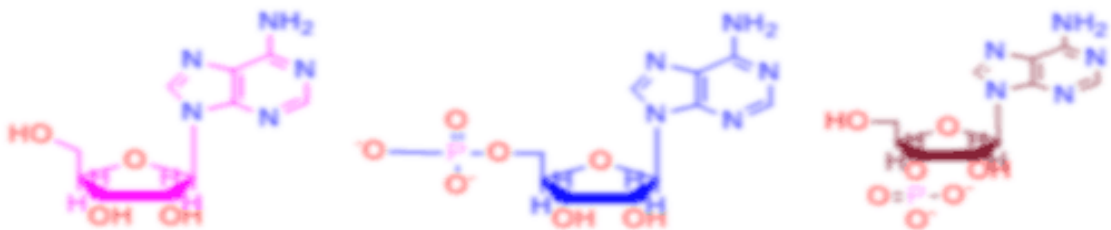
安徽中醫藥高等專科學校

2019 安徽省《藥物化學》精品線下開放課程

安徽中醫藥高等專科學校 | 藥學系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

藥物化學與藥物分析教研室 | 戴 勝





第十章 激素类药物

一、甾体激素



01 | 雌激素及抗雌激素

02 | 雄激素及蛋白同化激素

03 | 孕激素及抗孕激素

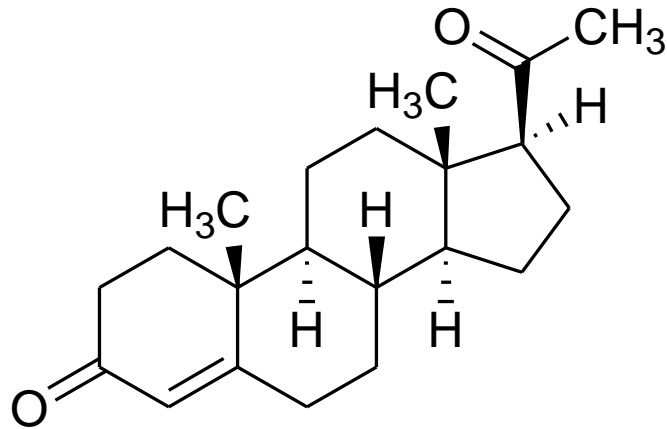


三、孕激素及抗孕激素

□孕激素

➤ 又称“女性激素”。

孕甾烷类，（4-烯-3酮，17位有甲基酮或17位OH）



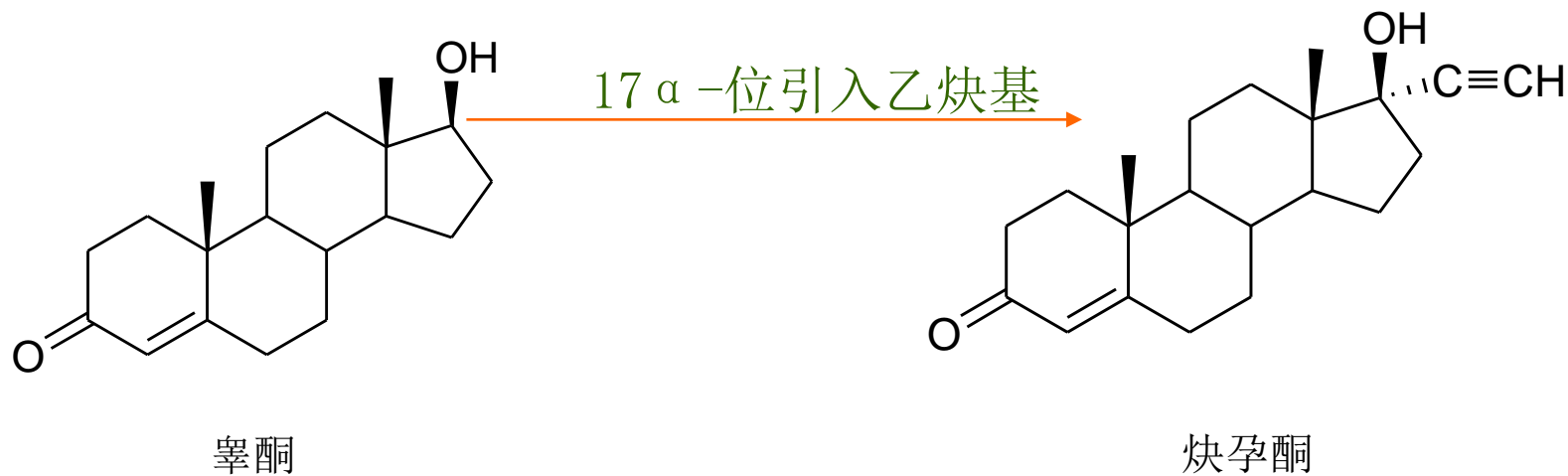


□孕激素的结构修饰

- 黄体酮口服易代谢失活，仅能注射给药
- 结构改造的主要目的：获得可口服的长效孕激素
- 根据结构改造的母体可以分为：孕酮类

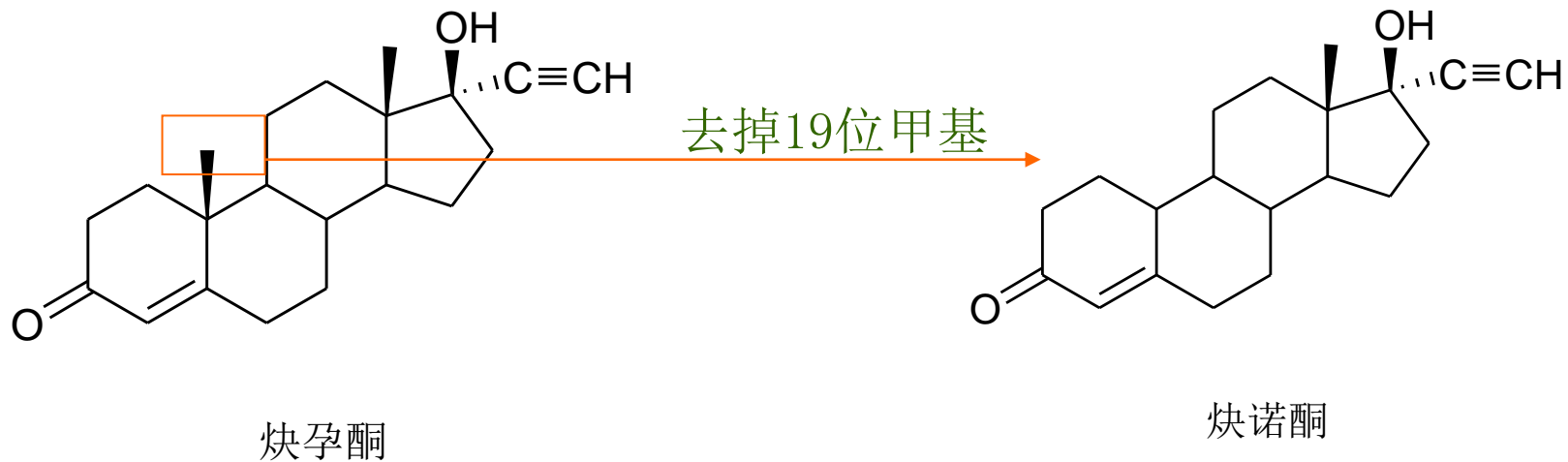
甾酮类

□ 甾酮类



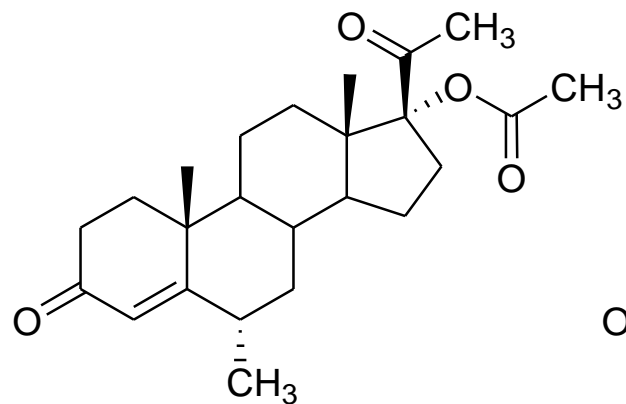
炔孕酮：雄性激素活性减弱，而口服后孕激素活性比黄体酮强15倍。

□ 甾酮类

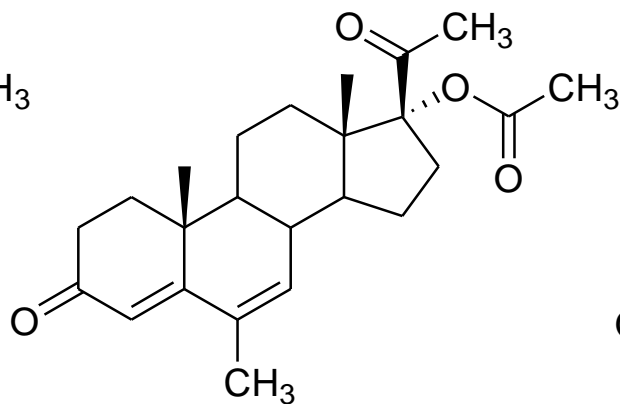


炔诺酮：活性比炔孕酮更高

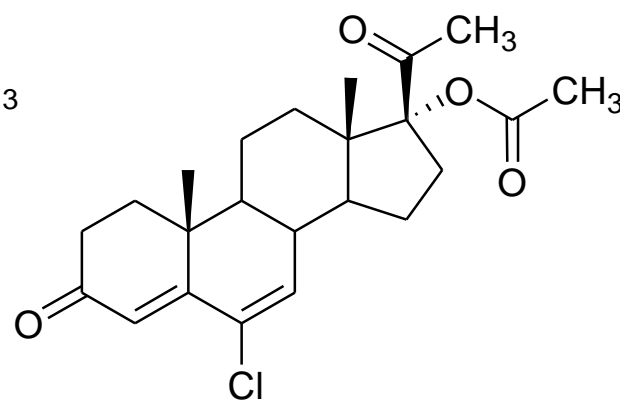
孕酮类



醋酸甲羟孕酮



醋酸甲地孕酮



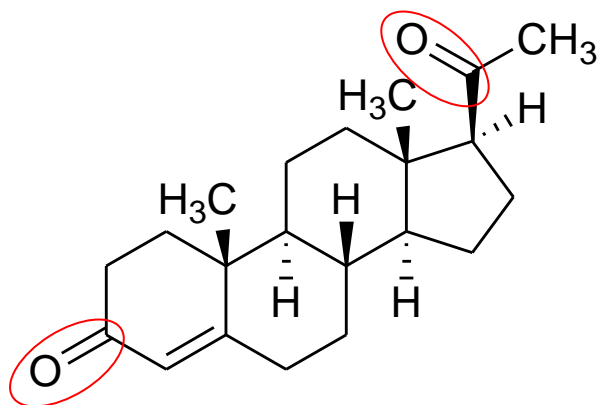
醋酸氯地孕酮

黄体酮 C_6 位用甲基取代，得到 6α -甲基衍生物醋酸甲羟孕酮，活性是黄体酮的20倍。进一步修饰，还可得到醋酸甲地孕酮和醋酸氯地孕酮，活性分别是黄体酮的12倍和50倍。

典型药物

黄体酮 Progesterone

孕甾-4-烯-3, 20-二酮。又名孕酮。



C_{17} 位具甲酮基，有亚硝基铁氰化钠反

应，显蓝紫色。为黄体酮特有专属的鉴别反应。

具酮基，与异烟肼缩合生成黄色的

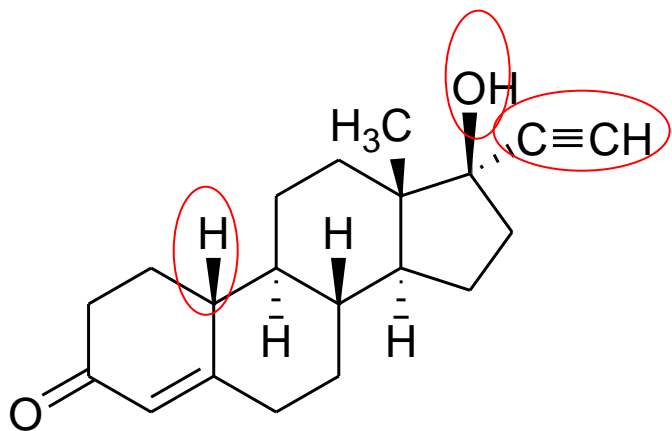
异烟腙。

习 具有保胎作用，常用于先兆流产，

习惯性流产、子宫功能性出血、月经失调及痛经，与雌激素类药物合用可作避孕药。

典型药物

炔诺酮 Norethindrone



17 β -羟基-19-去甲-17 α -孕甾-4-烯-

20-炔-3-酮。

具炔基，其乙醇溶液遇硝酸银试液，

产生白色炔诺酮银盐沉淀。

临床常用于治疗功能性子宫出血、妇女不育症、子宫内膜异位等，并与炔雌醇合用作为短效口服避孕药。

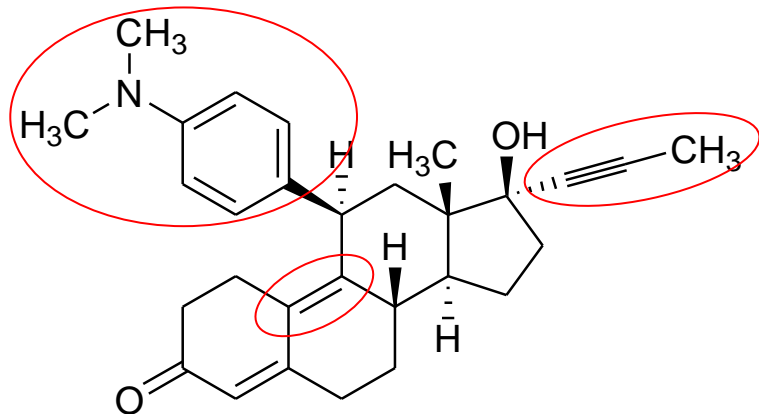


□ 抗孕激素

- 与孕激素竞争受体并拮抗其活性。
- 是终止早孕的重要药物。
- 1982年，报道了第一个抗孕激素米非司酮。能干扰早孕并终止妊娠，但有抗糖皮质激素活性。
- 抗孕激素奥那司酮 (Onapristone) 抗糖皮质激素活性较低。

典型药物

米非司酮 Mifepristone



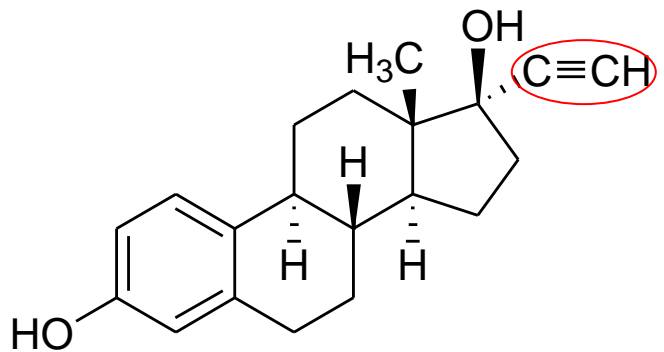
11 β - (4-二甲氨基苯基) -17 β -羟基-17-(1-丙炔基) -雌甾-4,9-二烯-3-酮。

主要用于**抗早孕**，也可用于**紧急避孕**。

典型药物

炔雌醇 Ethinylestradiol

3-羟基-19-去甲-17 α -孕甾-1,3,5
(10)-三烯-20-炔-17-醇。



和硫酸作用显橙红色，在反射光线下出现黄绿色荧光，将此溶液倾入水中，产生玫瑰红色絮状沉淀。

具炔基，其乙醇溶液遇硝酸银试液产生白色炔雌醇银盐沉淀。

为口服、高效、长效雌激素，雌激素活性为雌二醇的7~8倍，为己烯雌酚的20倍。

主用于月经紊乱、子宫发育不全、前列腺癌等。和孕激素配伍组成各种复方制剂，用作口服避孕药。



小结

- ◆ 孕激素的结构修饰方法（孕酮/睾酮）
- ◆ 孕激素的代表药物黄体酮以及抗孕激素的代表药物米非司酮和炔雌醇



2019 安徽省《药物化学》精品线下开放课程

安徽中医药高等专科学校 | 药学系

Anhui College of Traditional Chinese Medicine | Department of Pharmacy

药物化学与药物分析教研室 | 戴 胜