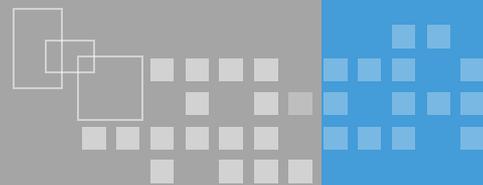


# 肾上腺皮质激素



## 肾上腺皮质激素

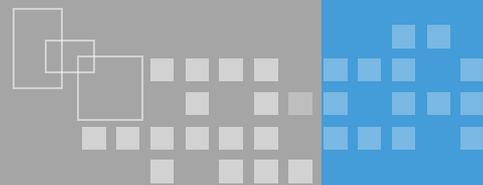
肾上腺皮质所分泌的激素的总称，属甾体类化合物

糖皮质激素

盐皮质激素

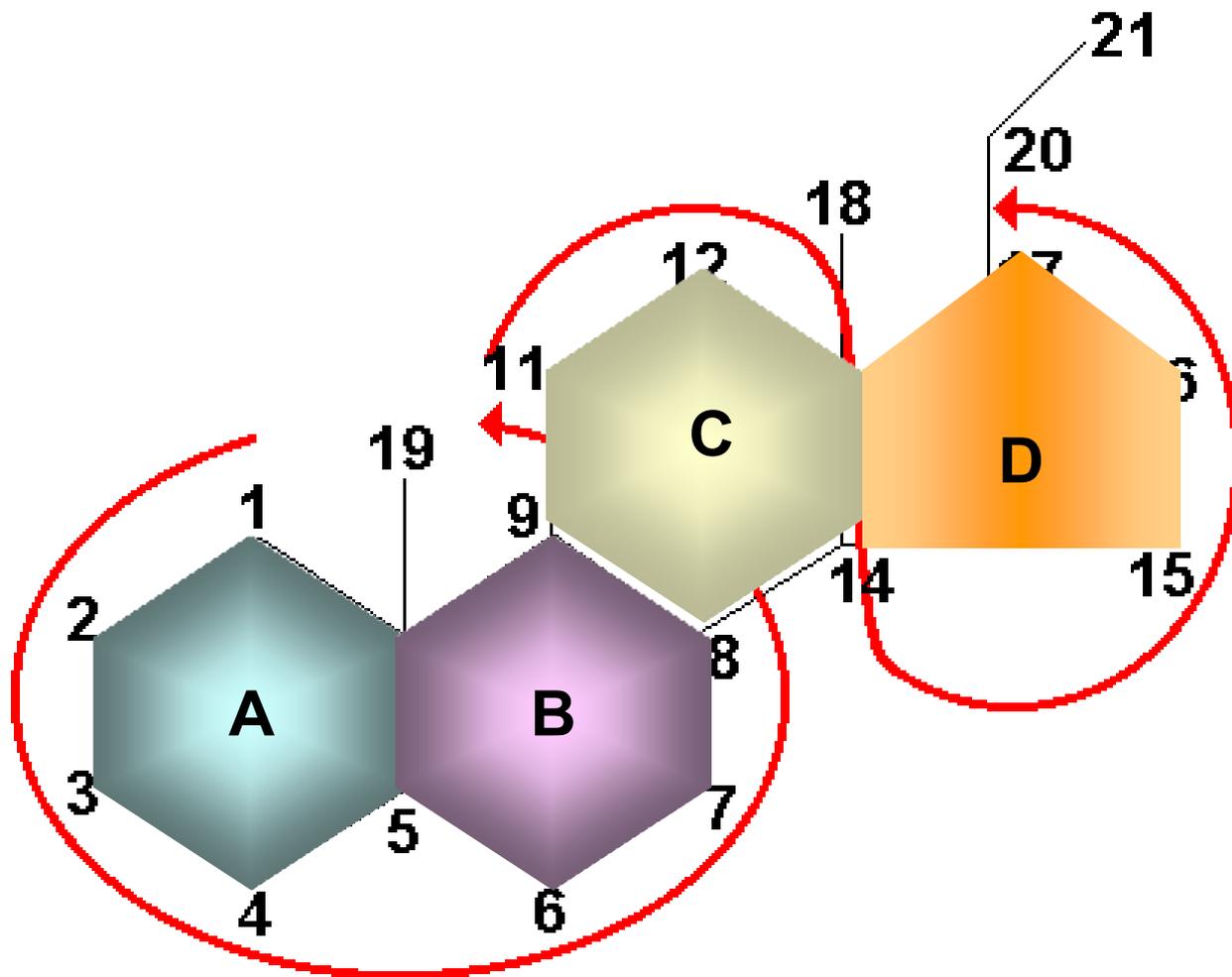
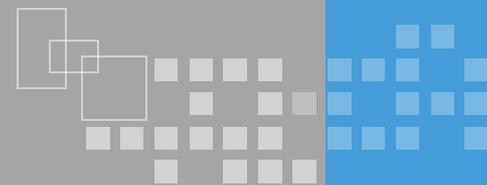
性激素

# 背景

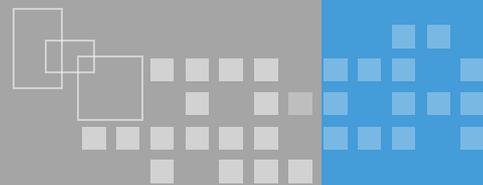


- 1855年以来人们一直在研究肾上腺皮质激素的生理作用和临床应用
- 1927年Rogoff和stewart通过动物实验证明了肾上腺皮质激素的存在
- 1935年 E. Kendall取得小牛Glucocorticoids结晶(GCs)
- 1942年 人工合成糖皮质激素目的：
  - 扩大糖皮质激素正常的代谢功能
  - 抑制糖皮质激素中盐皮质激素类活性的副作用
- 1946年，美国默克研究实验室L. H. Sarett首次合成Cortisone
- 1950年，Kendall获诺贝尔奖
- 1956年，合成糖皮质激素7000种之多。

# 糖皮质激素的基本结构



# 糖皮质激素的药理作用



1 对物质代谢的影响

2 允许作用

3 抗炎作用

4 免疫抑制、抗过敏作用

5 抗休克

6 其他

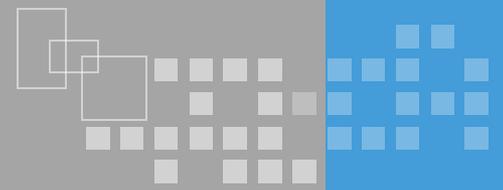


# 糖皮质激素对物质代谢的影响

- 糖代谢
- 蛋白质代谢
- 脂肪代谢
- 核酸代谢
- 水和电解质代谢



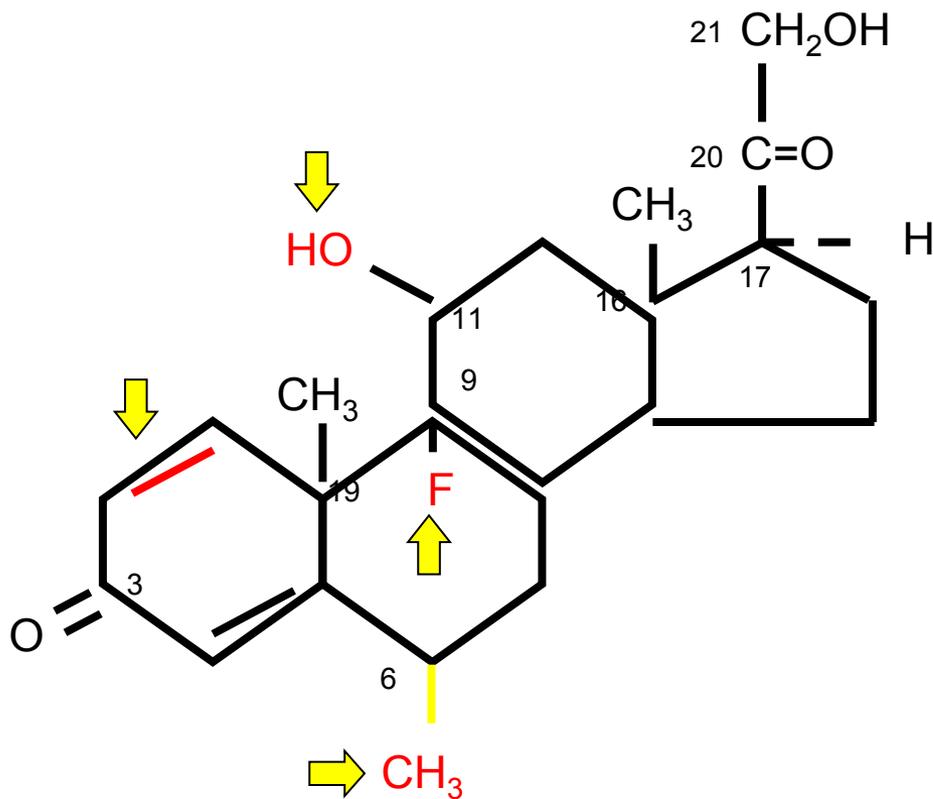
# 其他



- 退热作用
- 血液和造血系统
- 中枢神经系统
- 骨骼
- 心血管系统



# 糖皮质激素的基本结构及变异



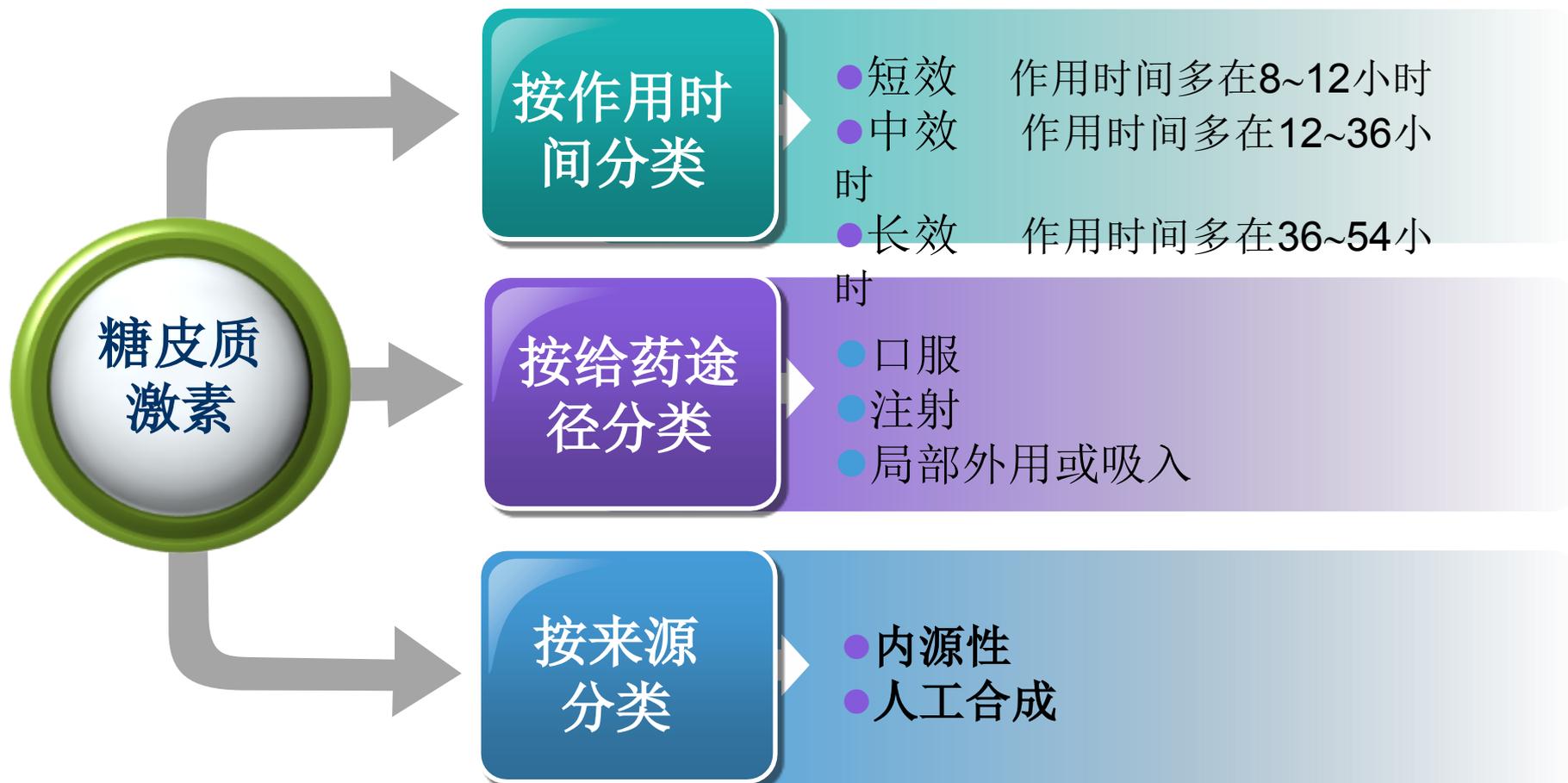
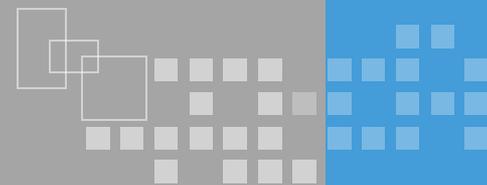
**C1=C2双键** — 增加抗炎活性  
盐皮质激素活性减弱

**C6 $\alpha$ 甲基化** — 亲脂性 $\uparrow$ , 组织渗透 $\uparrow$ ,  
快速到达靶位, 抗炎性 $\uparrow$

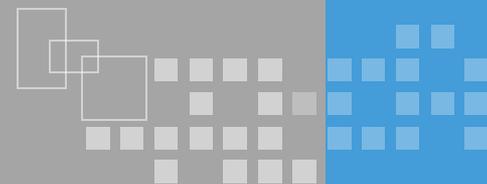
**C9 $\alpha$ 氟化** — HPA轴抑制 $\uparrow$  肌肉毒性  
 $\uparrow$   
抗炎 $\uparrow$

**C11羟基化** — 使其无需肝脏转化,  
减轻肝脏负担

# 糖皮质激素的分类



# 常用糖皮质激素



类别	药物	对糖皮质激素受体的亲和力	水盐代谢(比值)	糖代谢(比值)	抗炎作用(比值)	等效剂量(mg)	血浆半衰期(min)	作用持续时间(h)
短效	氢化可的松	1.00	1.0	1.0	1.0	20.00	90	8~12
	可的松	0.01	0.8	0.8	0.8	25.00	30	8~12
中效	泼尼松	0.05	0.8	4.0	3.5	5.00	60	12~36
	泼尼松龙	2.20	0.8	4.0	4.0	5.00	200	12~36
	甲泼尼龙	11.90	0.5	5.0	5.0	4.00	180	12~36
	曲安西龙	1.90	0	5.0	5.0	4.00	>200	12~36
长效	地塞米松	7.10	0	20.0~ 30.0	30.0	0.75	100~ 300	36~54
	倍他米松	5.40	0	20.0~ 30.0	25.0~ 35.0	0.60	100~ 300	36~54

# 全身用糖皮质激素常用药物

## 内源性糖皮质激素

可的松 Cortisone

氢化可的松 Hydrocortisone

## 外源性糖皮质激素

泼尼松 Prednisone

泼尼松龙 Prednisolone

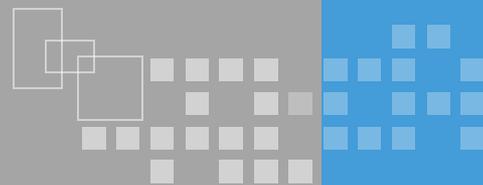
甲泼尼龙

Methylprednisolone

倍他米松 Betamethasone

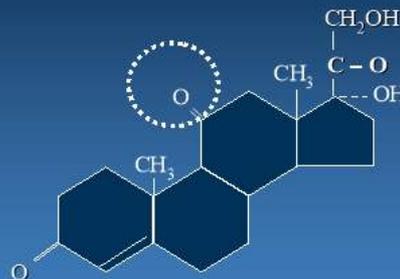
地塞米松 Dexamethasone

# 内源性糖皮质激素



内源性糖皮质激素

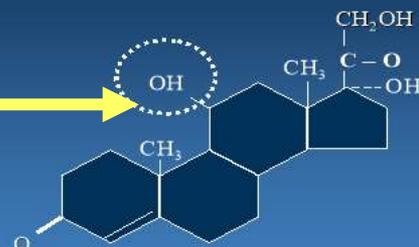
可的松



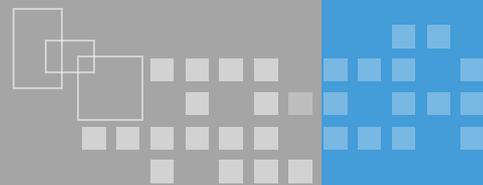
可的松C11位羟化

糖皮质激素活性

氢化可的松

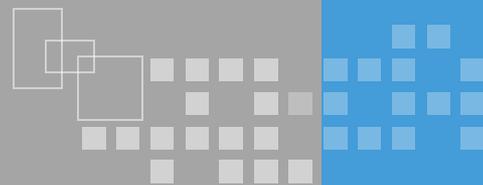


# 内源性糖皮质激素

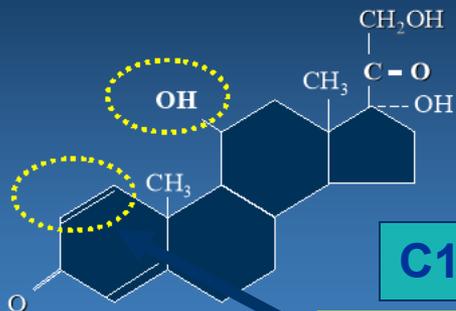


	可的松	氢化可的松
作用特点	是无活性代谢物氢化可的松与可的松在肝脏代谢中互相转换	具有生理活性
药动学	生物利用度低于氢化可的松	氢化可的松适用于肝功能障碍患者 急性或严重应激状态下使用氢化可的松
药效学	生理性替代治疗	生理性替代治疗

# 外源性糖皮质激素



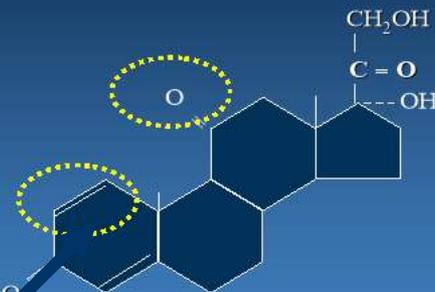
## 泼尼松龙 (强的松龙)



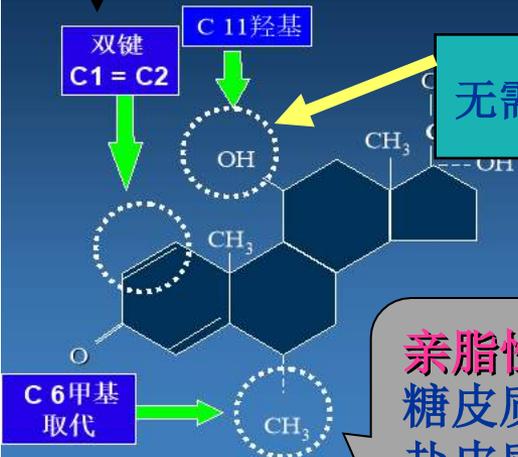
C1=C2双键结构

糖皮质激素活性×4  
盐皮质激素活性×0.8

## 泼尼松 (强的松)



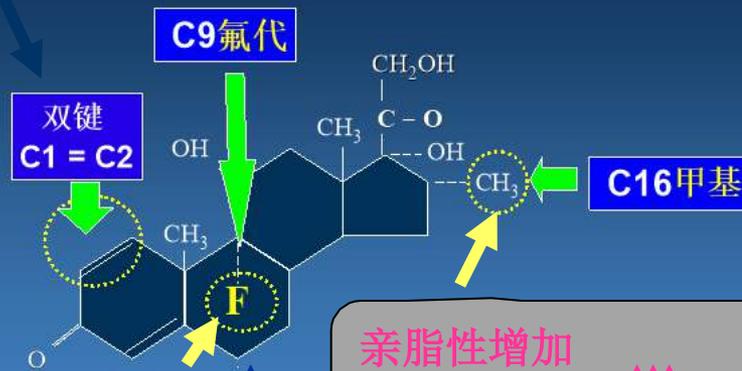
## 甲泼尼龙 (甲强龙)



无需肝脏代谢活化

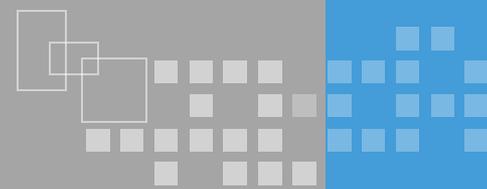
亲脂性增加  
糖皮质激素活性↑5  
盐皮质激素活性↓0.5

## 地塞米松 or 倍他米松



糖皮质激素活性↑↑↑  
盐皮质激素活性↓↓↓

亲脂性增加  
糖皮质激素活性↑↑↑ 20  
盐皮质激素活性↓↓↓ 0



## 有效性

具有较强的抗炎活性

药效平稳

起效快

## 安全性

具有较短的生物半衰期

对HPA轴抑制作用小

没有盐皮质激素作用

肝功能不全是否适用

# 泼尼松龙(强的松龙)、泼尼松(强的松)

## 有效性

>> 氢化可的松 x 4倍

## 安全性

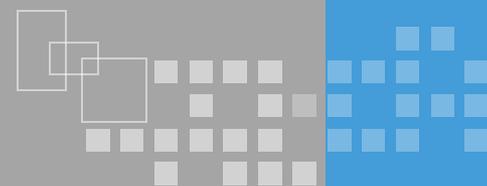
中效激素，生物半衰期较短

对HPA轴抑制作用较弱

水钠潴留作用是可的松 0.8倍

肝功能不全是否适用

# 甲泼尼龙(甲强龙)



## 有效性

>> 氢化可的松 x 5倍

> 泼尼松龙 x 1.25倍

## 安全性

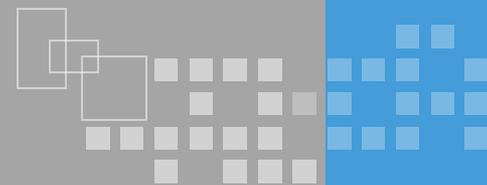
中效激素，生物半衰期较短

对HPA轴抑制作用较弱

水钠潴留作用小于氢化可的松和泼尼松龙

肝功能不全可安全使用

# 地塞米松和倍他米松



## 有效性

>>> 氢化可的松 x 20-30倍

>> 泼尼松龙 x 5-6倍

>> 甲泼尼龙 x 4-5倍

## 安全性

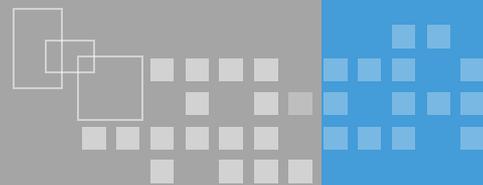
长效激素，生物半衰期大于36小时

对HPA轴抑制作用显著增加，

水钠潴留作用明显降低几乎为 0

肝功能不全可安全使用

# 糖皮质激素的适用范围



1

内分泌系统疾病

2

风湿性疾病和自身免

3

呼吸系统疾病

4

血液系统疾病

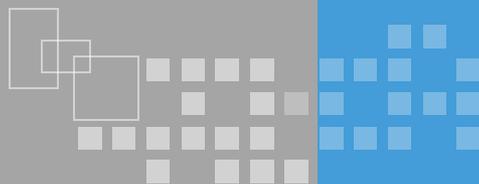
5

肾脏系统疾病

6

严重感染或炎性反应

# 糖皮质激素的适用范围



7

重症患者（休克）

8

异体器官移植

9

过敏性疾病

10

神经系统损伤或病变

11

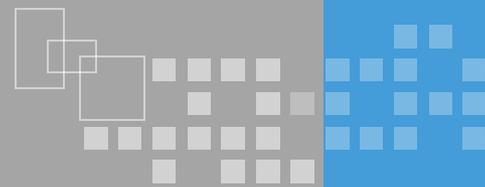
严重感染或炎症反应

12

预防治疗炎症反应后遗症



# 呼吸系统疾病



- 哮喘
- 特发性间质性肺炎
- 变态反应性支气管肺曲菌病
- 结节病
- 慢性阻塞性肺疾病
- 变应性鼻炎
- 嗜酸性粒细胞性支气管炎



以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：<https://d.book118.com/308022106043007000>