

常用糖皮质激素类药物 制剂及特点

医院药剂科



糖皮质激素给药途径

- 全身给药
 - 口服给药
 - 静脉给药
 - 肌肉给药

- 局部给药
 - 吸入给药
 - 经口吸入
 - 鼻腔喷雾
 - 关节内给药
 - 眼内局部给药
 - 滴眼剂
 - 眼部注射
 - 滴耳给药
 - 皮肤外用给药
 - 皮损内注射给药
 - 硬膜外给药
 - 直肠给药



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



全身用糖皮质激素常用药物

- 内源性
 - 可的松 **Cortisone**
 - 氢化可的松
Hydrocortisone
- 外源性
 - 泼尼松 **Prednisone**
 - 泼尼松龙 **Prednisolone**
 - 甲泼尼龙
Methylprednisolone
 - 倍他米松 **Betamethasone**
 - 地塞米松 **Dexamethasone**



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变

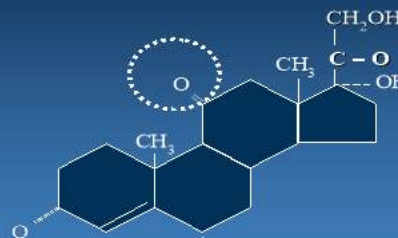


内源性 糖皮质激素

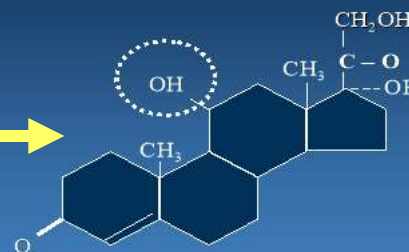
可的松C11位羟化

糖皮质激素活性

可的松



氢化可的松



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



氢化可的松 vs 可的松

关联与差异

氢化可的松
可的松

- 内源性糖皮质激素(与内源性糖皮质激素具有等效作用的药物)有哪些?
- 其中具有生理活性的是? **氢化可的松**
- 其中没有生理活性, 是无活性代谢物的是? **可的松**
- 两者之间的关系是什么? **在代谢中相互转化**
- 发生代谢转换的部位是? **肝脏**



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



氢化可的松 vs 可的松

关联与差异

- 药代动力学
 - 吸收差异
 - 生物利用度-氢化可的松96%，高于可的松，因此同等疗效，用量小于可的松，
 - 代谢差异：氢化可的松适用于肝功能障碍患者
 - 肝功能障碍患者，可的松不能有效代谢成为活性产物氢化可的松，应直接使用无需代谢的活性成分
 - 急性或严重应激状态下：
 - 使用无需代谢的活性成分-氢化可的松，直接发挥作用
- 药效学
 - 与内源性皮质激素功能相同，同时具有糖和盐皮质激素活性，因此适用于生理性替代治疗。
 - 用于药理作用抗炎治疗时，水钠潴留副作用明显，并具有HPA轴抑制作用



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



1929年

发现可的松在治疗类风湿关节炎的治疗作用

1948年, 1951年

可的松和氢化可的松用于治疗类风湿关节炎

内源性糖皮质激素

糖皮质激素活性

抑制类风关
所需剂量

盐皮质激素活性

正作用

正常代谢功能
扩大

副作用

人工合成糖皮质激素



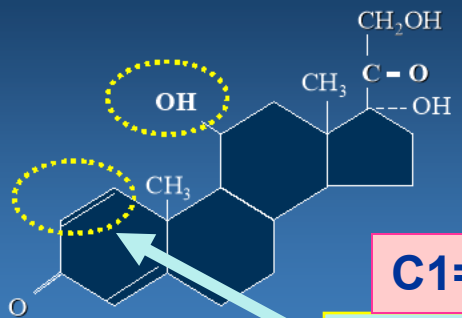
中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



外源性糖皮质激素

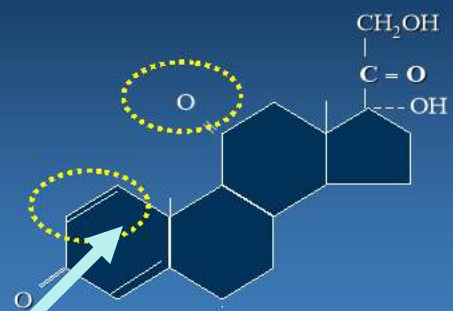
泼尼松龙 (强的松龙)



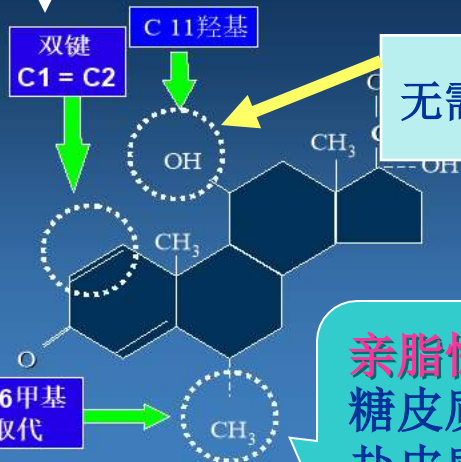
C1=C2双键结构

糖皮质激素活性×4
盐皮质激素活性×0.8

泼尼松 (强的松)



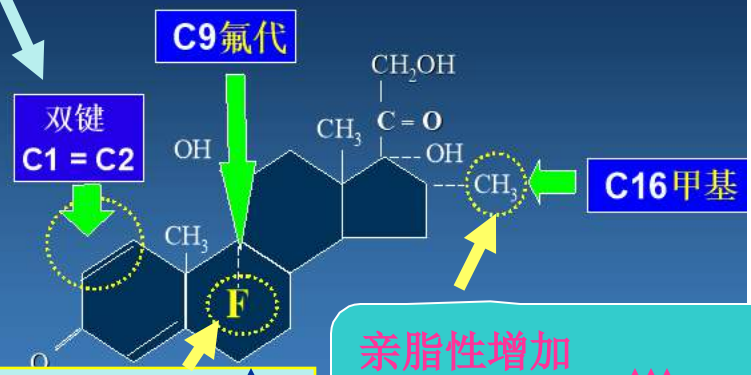
甲泼尼龙 (甲强龙)



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





药理学作用改变

与糖皮质激素受体亲和作用

盐皮质激素作用没有增强
略有下降

抗炎作用

生物半衰期

水钠潴留

化学结构变化

泼尼松龙
泼尼松

C1, 2位不饱和双键
环A几何形态改变

抗炎作用强弱和
作用时间长短的
药物化学基础

药代动力学特征改变

蛋白结合降低
游离增加

抗炎作用增强

代谢降低

血浆半衰期延长

作用时间延长



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



泼尼松龙 (强的松龙) vs 泼尼松 (强的松)

关联与差异

泼尼松龙 (强的松龙)

- 其中具有生理活性的是？
- 其中没有生理活性，是无活性代谢物的是？
- 两者之间的关系？
- 发生代谢转换的部位是？

泼尼松 (强的松)

在代谢中相互转化

肝脏

- 药代动力学：

- 代谢差异：肝功能障碍患者适于直接使用活性成分泼尼松龙 (强的松龙)，泼尼松不能有效代谢成为活性产物。

- 药效学：

- 作用完全相同，可等剂量交换使用



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



药理学作用改变

与糖皮质激素受体亲和作用

盐皮质激素作用
更大幅度继续下降

抗炎作用

组织分布
生物半衰期

水钠潴留

化学结构变化

甲泼尼龙
(甲强龙)

C6位-甲基取代
C1, 2位不饱和双键

脂溶性增加

代谢降低

蛋白结合降低游离增加

分布体积更大

抗炎作用增强

组织穿透性
更好

生物半衰期
延长

作用时间延长



中国糖皮质激素
临床使用教育活动





药理学作用改变

与糖皮质激素受体亲和作用



抗炎作用

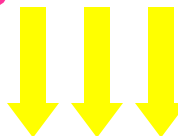


组织分布
生物半衰期



盐皮质激素作用明显下降

水钠潴留



化学结构变化

C9位-氟代基团
C16位-甲基取代
C1, 2位双键

地塞米松

脂溶性
增加

抗炎活性
增加

受体亲和力
增加

药代动力学特征改变

代谢降低

蛋白结合降低游离增加

分布体积变大

抗炎作用增强



组织穿透性
加强

生物半衰期
延长

作用时间延长



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



糖皮质激素糖盐代谢作用

药物名称	抗炎强度	水钠潴留强度	等效剂量(mg)
短效糖皮质激素($t_{1/2} < 12h$)			
可的松	0.8	0.8	25
氢化可的松	1	1	20
中效糖皮质激素($t_{1/2}=12-36h$)			
泼尼松	4	0.8	5
泼尼松龙	4	0.8	5
甲泼尼龙	5	0.5	4
长效糖皮质激素($t_{1/2} > 36h$)			
地塞米松	20-30	0	0.75
倍他米松	25-30	0	0.6



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



糖皮质激素半衰期(血浆和生物)

	激素名称	血浆半衰期(h)	生物半衰期(h)	HPA 轴抑制时间(天)
短效	可的松	0.5	8 - 12	1.25 - 1.50
	氢化可的松	1.6	8 - 12	1.25 - 1.50
中效	泼尼松	2.6 - 3	18 - 36	1.25 - 1.50
	泼尼松龙	2 - 4	18 - 36	1.25 - 1.50
	甲泼尼龙	2 - 3	18 - 36	1.25 - 1.50
长效	地塞米松	3 - 6	36 - 54	2.75
	倍他米松	3 - 6	36 - 54	3.25



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



糖皮质激素蛋白结合作用

皮质激素	激素结合蛋白	白蛋白
可的松	90（激素结合蛋白饱和后，与白蛋白结合）	
氢化可的松	90（激素结合蛋白饱和后，与白蛋白结合）	
泼尼松	70	
泼尼松龙	70-90（与激素结合蛋白结合力强，可与内源性激素竞争结合，饱和后与白蛋白结合）	
甲泼尼龙	< 1	74
倍他米松	< 1	64
地塞米松	< 1	77



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



生理作用

氢化可的松和可的松与内源性糖皮质激素具有等效糖盐代谢作用

疾病特点

原发性、继发性(垂体性)
肾上腺皮质功能减退症
肾上腺酶系缺乏所致的
肾上腺增生

急性肾上腺皮质功能减退
慢性患者发生严重应激状况

中枢神经系统抑制
肝功能不全

用药特点

长期或终生服用
生理替代剂

危象时，静脉给药
迅速发挥作用

静脉滴注氢化可的松

无需肝药酶活化，
直接发挥药理作用

口服：氢化可的松
静脉：氢化可的松琥珀酸钠

不能使用氢化可的松注射液含
50%乙醇



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



药理作用

服用等效剂量
糖皮质激素



相同的抗炎作用



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



药物治疗相关影响因素

有效性

具有较强的抗炎活性

治疗指数高

起效快

药效平稳

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



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



泼尼松龙(强的松龙)vs.和泼尼松(强的松)

有效性

>>氢化可的松 x 4倍

可用于抗炎治疗
用量小于氢化可的松
5mg : 20mg

可长期使用

泼尼松龙 ✓
泼尼松 ✗

安全性

中效激素，生物半衰期较短

对HPA轴抑制作用较弱

水钠潴留作用略小于氢化可的松
0.8倍

肝功能不全是否适用



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



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

可用于抗炎治疗
用量小于泼尼松龙
4mg : 5mg

可长期使用

可安全使用

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



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



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

抗炎治疗指数高
等效剂量小
0.6mg, 0.75mg

不能长期使用

可安全使用

安全性

长效激素，生物半衰期最长
大于36小时

对HPA轴抑制作用显著增加，最强

水钠潴留作用明显降低
几乎为0

肝功能不全



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



总 结

- 中效激素
 - 用于抗炎治疗，HPA轴抑制作用相对较弱
 - 甲泼尼龙：糖/盐作用比较好，长期服用疗效稳定，适用于肝功能不全患者。注射剂可用于静脉，做冲击治疗。
 - 泼尼松(龙)：糖/盐作用比次之，可长期服用，泼尼松龙适用于肝功能不全患者，不宜使用泼尼松。
- 长效激素
 - 生物半衰期长，HPA轴抑制作用长而强，不宜长期使用
 - 抗炎治疗指数高，用药剂量小
 - 适合短期使用
 - 可用于其他糖皮质激素反应不佳或无效的场所



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



全身用糖皮质激素 常用药物、制剂及特点



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



药品名称		剂型	剂型	性状	
醋酸可的松	醋酸酯	片剂	注射液	乳白色微细颗粒混悬液	灭菌混悬液
醋酸氢化可的松	醋酸酯	片剂	注射液	乳白色微细颗粒混悬液	灭菌混悬液
氢化可的松		片剂	注射液	无色澄清液体,	灭菌稀乙醇溶液
氢化可的松琥珀酸钠	琥珀酸钠		注射用	白色疏松块状物	无菌冻干品
醋酸泼尼松	醋酸酯	片剂			
泼尼松龙		片剂			
醋酸泼尼松龙	醋酸酯	片剂	注射液	乳白色微细颗粒混悬液	灭菌混悬液
甲基泼尼松龙	琥珀酸钠		注射液	白色疏松块状物	无菌冻干品
甲泼尼龙		片剂			
倍他米松		片剂			
倍他米松磷酸钠	磷酸钠		注射液	无色澄清液体	灭菌水溶液
地塞米松		片剂			
地塞米松磷酸钠	磷酸钠		注射液	无色澄清液体	灭菌水溶液
醋酸地塞米松	醋酸酯	片剂	注射液	乳白色微细颗粒混悬液	灭菌混悬液



糖皮质激素类药物注射剂的分类

- **溶液型注射剂**
 - 无色澄清液体，可静脉或肌肉注射
 - 起效迅速
- **混悬型注射剂**
 - 适于水难溶性药物及注射后要求延长药效的药物，如醋酸可的松。
 - 乳白色微细颗粒混悬液，一般仅供肌肉注射，严禁静脉注射。
 - 注射后吸收缓慢，药物作用时间延长。
- **注射用无菌粉末**
 - 白色疏松块状物，溶解后用法及疗效特点同溶液型注射剂。



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



糖皮质激素类药物注射剂给药途径

- **静脉注射(intravenous injection)**
 - 药效最快，常作急救、补充体液和供营养之用，适用于抢救危重病人
 - 混悬液或乳浊液能引起毛细血管栓塞，故不能做静脉注射
- **肌肉注射(intramuscular injection)**
 - 肌肉注射溶液型注射剂吸收特点同静脉注射
 - 肌肉注射混悬液的特点是，延长作用时间和给药间隔，减少给药次数，但不能代替口服治疗
- **关节内注射(intra-articular injection)**
 - 不作预防或慢性病维持用药，只作为急症或恶化情况下的短期用药

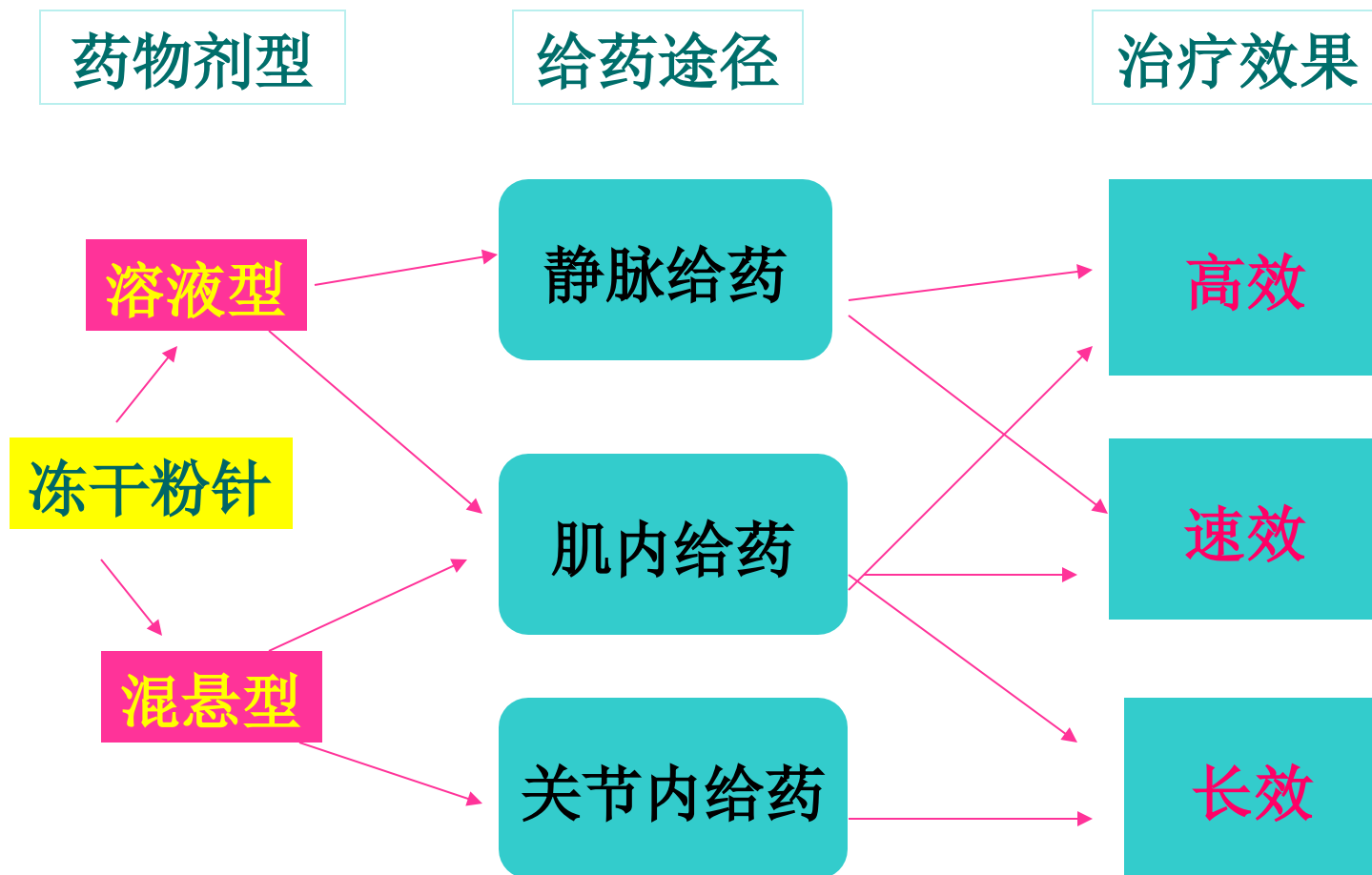


中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



药物剂型、给药途径、治疗效果



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变



注射剂相关其它问题：溶媒和附加剂

● 溶媒的选择

- 药物的性质(溶解度, 稳定性)
- 临床要求(速效, 长效, 减轻刺激, 安全)
- 乙醇做注射用溶媒时浓度可高达50%, 但乙醇浓度超过10%时, 肌注有疼痛感, 静注时应防止溶血的发生(乙醇易透过人红细胞膜)。体外试验表明, 当乙醇浓度达60%时, 红细胞立即凝聚生成深红色束状沉淀, 所以采用乙醇作为注射用溶媒浓度不易过高, 使用前应充分稀释。可静点, 不能静注。

氢化可的松注射液含乙醇50%, 使用前必须充分稀释, 加25倍生理盐水或5%葡萄糖注射液500毫升稀释。只能静脉滴注



中国糖皮质激素
临床使用教育活动

聚势而变

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/855311314322011310>