

抗雄激素

药物 词条

misaka4e21 御坂0x4e21 limelight sysadmin

Sep '18

抗雄激素 (antiandrogen)，或称为雄激素拮抗剂 (androgen antagonist)。于1960年代时被发现，藉由阻断特定的受体而抑制雄激素的作用。可以竞争细胞表面的接受器或是影响雄激素的产生。

类型

雄激素受体拮抗剂 (AR antagonist)

雄激素受体拮抗剂直接与雄激素受体结合以阻止雄激素生效。此类物质包括雄激素受体部分激动剂及沉默拮抗剂。

雄激素受体部分激动剂 (Partial agonist)

类固醇抗雄激素为部分激动剂，如[[螺内酯]]与[[安得卡|色普龙]]，它们并不完全表现出纯拮抗作用，而是有部分内在活性。

雄激素受体沉默拮抗剂 (Silent antagonist)

非类固醇抗雄激素为沉默拮抗剂，如氟他胺、尼鲁他胺和比卡鲁胺，它们没有任何内在活性。

雄激素合成抑制剂 (Androgen synthesis inhibitors)

雄激素合成抑制剂通过阻断酶的催化反应以抑制雄激素的生物合成。此类物质包括5 α -还原酶抑制剂，以及螺内酯、酮康唑等抑制类固醇合成的药物。

5 α -还原酶抑制剂 (5 α -reductase inhibitors)

5 α -还原酶抑制剂抗雄激素抑制由5 α -还原酶导致的睾酮向双氢睾酮的转化。

抗促性腺激素释放激素药物 (GnRH analogue)

抗促性腺激素释放激素药物可降低促性腺激素的分泌，进而抑制性腺内性激素的生成。此类物质包括促性腺激素释放激素的类似物（激动剂和拮抗剂），以及任何的外源性激素。

促性腺激素释放激素激动剂 (antigonadotropic drugs)

促性腺激素释放激素激动剂在使用初期可刺激促性腺激素的分泌，但一段时间的持续刺激会使脑下垂体钝化。最终，促性腺激素分泌反而会减少，性激素水平也会随之下降。

促性腺激素释放激素拮抗剂 (GnRH antagonist)

促性腺激素释放激素拮抗剂可直接阻断促性腺激素释放激素受体，使促性腺激素分泌减少，从而导致性激素水平的下降。

外源性激素 (exogenous sex hormone)

人体内的激素水平由一个负反馈回路控制。在正常情况下，血浆内的性激素会降低垂体的 GnRH 产量，从而抑制促性腺激素产生，借此维持激素水平稳定。外来的性激素同样会抑制 GnRH 生成，最终抑制体内性激素产生。

在开发出其他抗雄激素之前，通过高剂量雌激素达到“阉割”级别的雄激素水平是治疗前列腺癌的常见手段。现在使用的醋酸环丙孕酮也是借助这种方式降低睾酮水平。

相关药品

对于类型空白的行，往下数第一个类型即为此药的类型

商品名	有效成分	类型
安体舒通、使尔通、Aldactone 等	螺内酯 (Spironolactone)	雄激素受体部分激动剂；合成抑制剂
安得卡 (Androcur)、华典、Sitertone 等	醋酸环丙孕酮 (Cyproterone acetate)	雄激素受体部分激动剂；外源孕激素
福至尔 (Fugerel)、Eulexin、Cytomid、Cebatrol 等	氟他胺 (Flutamide)	
Nilandron、Anandron	尼鲁他胺 (Nilutamide)	
康士得 (Casodex)、Cosudex、Calutide、Kalumid	比卡鲁胺 (Bicalutamide)	
Xtandi	恩杂鲁胺 (Enzalutamide)	雄激素受体拮抗剂 (沉默拮抗剂)
保列治 (Proscar)、保法止 (Propecia)、再安列、卡波 等	非那雄胺 (Finasteride)	
安福达 (Avodart)、适尿通	度他雄胺 (Dutasteride)	5α-还原酶抑制剂
诺雷得 (Zoladex)	戈舍瑞林 (Goserelin)	
抑那通 (Enantone)、Lupron、Eligard 等	亮丙瑞林 (Leuprorelin)	
达必佳 (Decapeptyl)、达菲林 (Diphereline)	曲普瑞林 (Triptorelin)	
注射用醋酸丙氨瑞林	丙氨瑞林 (Alarelin)	
Vantas、Supprelin LA 等	组氨瑞林 (Histrelin)	
Suprefact、Supercur、CinnaFact 等	布舍瑞林 (Buserelin)	
Synarel	那法瑞林 (Nafarelin)	GnRH 激动剂
思则凯 (Cetrotide)	西曲瑞克 (Cetrorelix)	
Antagon	加尼瑞克 (Ganirelix)	
Plenaxis	阿巴瑞克 (Abarelix)	
Firmagon	地加瑞克 (Degarelix)	GnRH 拮抗剂

🔗 螺内酯

🔗 Androcur/Procur (醋酸环丙孕酮片)

夏依玛尔科瑞塔 夏依玛尔·科瑞塔 Jul '18

安德卡就是常说的色

Narrow_0x2f 寻夜矢 Aug '20

misaka4e21:

包括5α-还原酶抑制剂，以及螺内酯

Spironolactone and/or its metabolites have been found [in vitro](#) to weakly [inhibit](#) a broad array of steroidogenic enzymes including [cholesterol side-chain cleavage enzyme](#) , [17α-hydroxylase](#), [17,20-lyase](#), [5α-reductase](#), [3β-hydroxysteroid dehydrogenase](#), [11β-hydroxylase](#), [21-hydroxylase](#), and [aldosterone synthase](#) (18-hydroxylase).[\[137\]](#)[\[187\]](#)[\[188\]](#)[\[189\]](#)

-from wiki

(有权限了 先占个坑)

Sep 2017

1 / 3

Sep 2017

Aug 2020