

HRT 国际常规用量分术前和术后 (TS 必看)

HRT (荷尔蒙替代疗法) 作为 TS 术前治疗的一部分, 其真正目的是:

- 1、减缓当事人因体内雄激素造成的焦虑痛苦等情况, 并阻止身体继续男性化。
- 2、作为判断当事人是否适合手术的重要依据之一。

(注: 抗雄是正规的术前 HRT 里最重要的, 也是达到以上目的的关键, 不用抗雄则根本不算 HRT)

雌激素类药物的种类

1. 天然雌激素类:

基本上是体内分泌的天然雌激素制剂, 包括雌二醇 (E2)、雌酮 (E0)、雌三醇 (E3)。它们与体内代谢过程及第二性征的发育与维持有密切关系。

2. 半合成雌激素类:

是在甾体激素的基本结构上经过人工方法去丢某些基团或增加某些基团而合成的具有雌激素活性的药物, 如炔雌醇、尼尔雌醇等。

3. 合成雌激素类:

也称为非甾体雌激素。此类药物的基本结构并非甾体的框架结构, 但它们具有雌激素活性, 如己烯雌酚、己烷雌酚、氯三芳乙烯等。

以上三种对人体器官影响及伤害大小分别为:

【最小】 天然雌激素 < 半合成雌激素 < 合成雌激素 【最大】

孕激素类药物种类和制剂

1. 黄体酮(progesterone) 或称孕酮, 为天然孕激素。现均由人工合成。目前黄体酮仍为常用的孕激素之一。

(1) 针剂: 口服无效。肌肉注射后作用快, 消失亦快, 故需每日或隔日注射。针剂有 10mg / 支、20mg / 支。复方黄体酮针剂每支 1ml 内含苯甲酸雌二醇 2mg 及黄体酮 20mg。

(2) 胶囊: 黄体酮类。近几年研制出的口服有效的天然孕激素, 无合成孕激素的毒副作用, 成分与人体黄体酮相同。口服片剂为 100mg / 片, 栓剂相同。

2. 孕酮衍生物

孕酮的代谢物 17 α -羟基孕酮并无生物效应, 但其 17 α 位上的羟基酯化后, 其孕激素作用不但恢复且有所加强, 常用制剂有:

(1) 甲孕酮(medroxyprogesterone acetate, provera, DMPA): 商品名安宫黄体酮。口服或肌肉注射均有效。口服片剂为每片 2mg, 针剂有 50mg / 支、75mg / 支、100mg / 支等。目前已有 100mg / 片、200mg / 片、500mg / 片大剂量的口服片。

(2) 甲地孕酮(megestrolacetate): 商品名为妇宁片。化学名为 6-氯-甲 Δ 6-17 α 乙酰氧基孕酮。口服片剂为 1mg / 片、4mg / 片。

(3) 氯地孕酮(chlormadinone acetate): 化学名为 6-氯-甲 Δ 6-17 α 乙酰氧基孕酮。口服片剂有 2mg / 片、6mg / 片、12mg / 片等。

(4) 己酸孕酮(hydroxyprogesterone caproate): 化学名为 17 α 羟基孕酮己酸酯, 为长效孕激素, 其孕激素活性为孕酮的 7 倍, 并可维持 1-2 周以上。针剂有 125mg / 支、250mg / 支, 供肌肉注射。

3. 19-去甲基孕酮衍生物

睾酮在 19 位上去甲基后具有强孕激素作用。国内常用制剂有：

(1) 炔诺酮(norethisterone, norethindrone): 化学名为 17 α 乙炔基 19-去甲睾酮, 商品名为 妇康片。除孕酮作用外, 具有轻微雄激素作用。口服片有 0.625mg / 片、2.5mg / 片、3mg / 片及 5mg / 片等。

(2) 甲炔诺酮(norgestrel): 或称 18-甲基炔诺酮。炔诺酮的 18 位甲基改为乙基而成, 是炔诺酮族中孕激素作用最强者, 并有雄激素作用。口服片剂有 0.3mg / 片、3mg / 片等。

(3) 异炔诺酮(norethynodrel): 与炔诺酮化学结构相似, 区别在于炔诺酮双链在第 4~5 位, 而异炔诺酮在第 5~10 位。孕激素作用较弱, 无雄激素作用。口服片剂有 2.5mg / 片及 5mg / 片。

口服复方避孕药类药物

无论长短效都非常不推荐使用, 副作用太大。例如: 妈富隆, 悦可婷等。

抗雄药物介绍

一、强抗雄药物

以下列出的 2 种为 HRT 的首选抗雄药物, 其抗雄原理为直接与雄激素受体结合来阻断雄激素合成, 从而降低雄激素水平。

1: Spironolactone / 螺内酯 (安体舒通)

螺内酯, 既螺旋内酯固醇。该药具保钾利尿功能, 它使肾脏在运作中将多余的水分和钠排出体外, 同时减少体内钾的代谢。其最初是用于治疗低钾引起的高血压、低钾血以及康式症候群。

在 HRT 应用中该药起抗雄作用, 参与竞争雄激素受体, 抑制雄激素的生物合成, 并加强睾酮的代谢廓清率。

该药同时抑制细胞色素 P450 和 17 α -羟化酶的活性, 肾上腺皮质中的 17 α -羟化酶部分受抑制, 这些酶受抑制后雄激素的生物合成减少。

因没有环丙孕酮的药品许可, 故该药为欧洲 HRT 的抗雄首选。

主肝/副肾代谢药物。

抗雄效果:

a: 来自 susan 论坛的用户反馈, 半年左右的常规用量可以将体内雄激素水平减少到普通女性程度 (T 参数 2.5 以内), 1 年后可能趋于低值极限 (0.5)。

b: [观察对象共 50 人, 均为确诊的术前 MtF, 开始观察前 27 人有常规高剂量雌激素治疗, 23 人无; 开始之后 50 个对象均开始使用安体舒通+小剂量雌激素。

观察初期 27 人组尽管之前有超过 2 年的高剂量雌激素治疗, 但雄激素水平依然大大高于女性范围。

在应用了 12 个月的安体舒通 (剂量 200-600mg/day) 之后, 2 个组的对象的雄激素水平均达到女性标准。

27 人组尽管减少了雌激素剂量并停止了注射途径的补充, 雄激素水平依然达到了女性标准; 而 23 人组的变化更明显, 体内游离睾酮含量平均减少了近 95%。]

(注: 上面的安体剂量比较高, 应该是为了进行观察对比而特地安排的不同剂量, 实际 HRT 中不需要吃那么多的, 请勿随意模仿)

重要注意事项:

由于该药有保钾作用,可能会造成高钾血症,平时注意不要大量吃高钾食物(常见食物中有海藻类、豆类、花生、土豆、香菇、菠菜、香蕉等,各类果汁也是),但也不用太紧张,保持正常用餐量就行。

同时应多喝水预防高钾(很重要)。

其他注意:

- a. 避免喝酒;
- b. 避免同时服用会引起头晕的药物(如感冒药、止痛药、肌肉松弛剂、以及治疗癫痫、忧郁的药物);
- c. 不要使用盐代替物或低钠奶制品,因为其中含有钾;
- d. 避免高盐摄入,因为会导致体内水分难以排出从而降低药效;同时也不要太低盐,血钠过低会造成肾脏排钾功能减弱;
- e. 该药可能导致思维和反应降低,因此在驾驶或进行其他需要清醒的活动时小心使用;
- f. 避免在运动时身体过热、脱水以及呆在高温环境中。

2: Cyproterone acetate / 醋酸环丙孕酮(色普龙)

醋酸环丙孕酮,即醋酸环丙氯地孕酮,是目前最强的抗雄药物,它通过减少睾酮和双氢睾酮在组织细胞中的活性,并与雄激素受体结合抑制促黄体激素来降低体内雄激素水平。

在过去其主要用于治疗前列腺癌、良性前列腺增生、持续勃起症以及性欲亢进。因该药为肝脏代谢,故长期使用的情况下可能会产生肝毒性,如有此症状发生应立即停药。(皮肤起红斑)该药会引起血糖偏高,糖尿病患者或其他相关禁忌症患者慎用。

该药在服用过程中不得突然中止用药,一些生产厂商也会注明每次减少量不得大于 50mg,且需间隔数周。主要原因是醋酸环丙孕酮会影响肾上腺。因为其具有肾上腺皮质激素活性,高水平的醋酸环丙孕酮摄入会减少体内的促肾上腺皮质激素分泌,如果突然停止用药会导致肾上腺机能不全。此外,尽管醋酸环丙孕酮能降低性腺中的雄激素合成,但却会增加肾上腺的雄激素合成,故在某些情况下会造成雄激素水平整体的短期上升,因此突然停药会造成不必要的雄化效果。

该药并非在全球都有药品许可(如美国就没有),但在欧洲应用广泛,是欧洲 HRT 中首选的抗雄药物。

重要注意事项:

环丙孕酮与高剂量雌激素联用的致血栓风险较高,使用时:

- 1、需避免与高血栓率雌激素(如炔雌醇和共轭雌激素)搭配,尽量与低血栓率雌激素(如雌二醇)搭配;
- 2、雌激素用量尽量用最小值(视情况用更小值)以降低血栓风险。

二、弱抗雄药物

以下列出的抗雄药物很少用于 HRT,因为其抗雄效果较弱。它们并不降低雄激素水平,而是阻止睾酮和双氢睾酮与雄激素受体结合来降低雄激素产生,且因为它们对脑垂体的作用较弱,所以并不会降低性欲或减少勃起,更多的情况下这些药物是用于治疗前列腺癌的。

以下均为非甾类药物。

1. Flutamide / 氟他胺(福至尔)

该药被用于治疗前列腺癌，它在前列腺中会与睾酮及双氢睾酮竞争雄激素受体，以此阻止雄激素对癌细胞的刺激。氟他胺现在已被一种更有效且副作用更小的药物比卡鲁胺所代替。肝代谢药物。

2. Nilutamide / 尼鲁米特（安得乐）

该药被用于治疗晚期前列腺癌。原理为阻断雄激素受体以阻止其与睾酮结合，是抗雄激素受体类药物。肝代谢药物。

3. Bicalutamide / 比卡鲁胺（康士得）

抗雄效果最初于 1995 年于晚期前列腺癌的去势治疗中被发现，随后被应用于早期前列腺癌的单一疗法中。由于其效果好副作用低而逐渐成为常用的前列腺癌治疗药物。肝代谢药物。

三、其他雄激素抑制剂（不推荐）

以下化学化合物的抗雄效果非常弱，但它们对双氢睾酮的抑制作用可以起到有效的生发效果。这些药物均属于 5α 还原酶抑制剂，用以阻断 5α 还原酶以阻止其将睾酮转换为双氢睾酮。（注：双氢睾酮与雄激素受体的结合活性是睾酮的 2.5 倍）

1. Finasteride / 非那雄胺（保列治）

该药作用为抑制 5α 还原酶 II 型，可阻断 40%~80% 的 5α 还原酶反应，阻止其将睾酮转化为双氢睾酮。

使用本药后双氢睾酮水平下降，前列腺体积缩小，但不影响促黄体激素和睾酮浓度，基本对性欲和性功能无影响（影响概率 5%）。

低剂量的该药常用于治疗良性前列腺增生，高剂量的该药用于治疗前列腺癌。该药也在很多国家中用于男性型脱发的治疗。

2. Dutasteride / 度他雄胺（度他雄胺胶囊）

该药被用于治疗双氢睾酮引起的病症，如良性前列腺增生。同时阻断 5α 还原酶 I 型和 II 型，也被用于治疗脱发。

1. transsexualism——变性欲症、易性症、易性病、易性“癖”症

-ism 后缀用在医学领域时表示“病、病状、症”等，so 在做病名使用时至少把该加上的加上吧

看不懂我也没话说了

2. 关于激素：非 TS 不要用、避孕药不推荐、己烯等合成类不推荐、不要乱吃、不要过量，发帖前先看版规

注意：

- 1、以下绿色文字内容的用量部分仅供参考，写出来是为了防止乱用药、过量用药。个人用量可以比下面写的少，但无论如何不要超过。超量用药不仅伤身而且效果差。
- 2、MtF 的 HRT 标准内容为：雌激素+抗雄药物。孕激素可选用，并非必需。
- 3、一旦开始使用如下正规药物组合，则应停止服用一切避孕药类药物，防止激素过量、药物相互作用以及各种因个体差异引发的副作用。

补充：术前口服药物中有亚洲用量的就不要选前面的国际用量以免超量（注射和其他类别不详）

HRT 国际常规用量（术前，每种激素只可选其一）

1. 雌激素：

口服：共轭雌激素（conjugated equine estrogens）-倍美力（Premarin）：5-10mg/day（亚洲地区：2.5-5mg/day）

口服：雌二醇（estradiol）-诺坤复（Estrofem）：4-8mg/day（亚洲地区：4-6mg/day）

口服：戊酸雌二醇（estradiol valerate）-补佳乐（Progynova）：（亚洲地区：2-4mg/day）

注射：戊酸雌二醇（estradiol valerate）-戊酸雌二醇注射液，5-10mg/2weeks

注射：环戊丙酸雌二醇（estradiol cypionate）-环戊丙酸雌二醇注射液，2-5mg/month

贴片：雌二醇（estradiol）-雌二醇贴片，0.2mg/day

补充一个不推荐的：

注射：苯甲酸雌二醇（Estradiol Benzoate）-苯甲酸雌二醇，25mg/week，分 2-3 次，即 10mg/3day（该药用量大频率高，而且是注射，所以不推荐）

2. 孕激素：

口服：醋酸甲羟孕酮（medroxyprogesterone acetate, Provera）-安宫黄体酮：5-10mg/day（亚洲地区不变）

口服：微粉黄体酮（progesterone micronised）-Prometrium（中文名不详）：100mg/day（替代药物：琪宁黄体酮胶丸，100mg/day）（亚洲地区不变）

注射：醋酸甲羟孕酮（medroxyprogesterone）-醋酸甲羟孕酮注射液（Depo Provera）：50mg/2weeks，100mg/month（亚洲地区不变）

注射：油状黄体酮（progesterone in oil, PIO）-50mg/2weeks

3. 抗雄药物：

口服：螺内酯（spironolactone）-安体舒通（Aldactone）：100-200mg/day（亚洲地区：100mg/day）

口服：醋酸环丙孕酮（cyproterone acetate）-色普龙（安得卡錠，Androcur）：50-100mg/day（亚洲地区：25-50mg/day）

HRT 国际常规用量（术后，每种激素只可选其一）

1. 雌激素：

口服：共轭雌激素（conjugated equine estrogens）-倍美力（Premarin）：0.625-1.25mg/day（亚洲地区不变）

口服：雌二醇（estradiol）-诺坤复（Estrofem）：1-2mg/day（亚洲地区不变）

口服：戊酸雌二醇（estradiol valerate）-补佳乐（Progynova）：1-2mg/day（亚洲地区不变）

2. 孕激素：

停止

3. 抗雄药物：

停止

=====华丽的分割线=====

以下为我个人在当前时间点上对 HRT 的药物选择的建议，不代表论坛的意见，仅供参考，不得作为个人用药依据

1. 雌激素：

可能的话用注射效果更好些，也减少一次内脏代谢从而降低肝肾负担，不过在国内通常不太可行，so 口服还是主要选项。

主要是共轭雌激素和雌二醇，也就是倍美力 or 补佳乐。从成分上看，前者是雌酮 E0，后者是雌二醇 E2，活性应是后者大，但实际效果却也因人而异，要选择适合自己的。至于两者共同使用的方式，国际上通常都是 2 者选一，共用的反馈信息基本没有，so 同时使用效果更好或更坏不得而知。安全起见，暂不建议共用。

各国的用药倾向：北美-倍美力；欧洲-补佳乐为主倍美力为辅；日本-正规用药为注射，民间用药为倍美力。

（顺便提一下己烯雌酚，这个国际上是不用在 HRT 上的，而且已经禁止在妇科及畜牧业等地方使用。国内通常只作为前列腺癌晚期的症状缓解药使用，但偶尔也会有不负责的医生把这个当人工周期药开给病人。此药个人不推荐，除非实在没钱买天然激素）

2. 孕激素：

国际上 MtF 的 HRT 是否需要孕激素意见不一，用或者不用都有。不过，通常孕激素能降低因雌激素过多而带来的致癌（对 TS 来说主要是乳腺癌）概率，安全性上可能较有保证。对胸部发育的影响么？的确是有，不过效果有限。

而如果用的话也分 2 种用法，即保持不间断用药和模拟女性周期的每月用 10 天 or 7 天的周期用法。2 种用法也不是说那种更好，而同样是根据个人情况来的，有人适合连续用，有人适合周期用，不能一概而论。总体而言，激素的各人差异性太大，他人用量只能用于参考。种类方面，国际常用的就 2 种，安宫黄体酮和天然微粉黄体酮。安宫价格便宜，微粉天然无副作用。在国外通常一致推荐微粉黄体酮 Prometrium，因为它完全和女性体内正常分泌的黄体酮成分相同，所以也没有了安宫的雄化作用、忧郁症作用以及其他副作用，纯天然的激素。国内该药也常用在妇科上，只不过找不到其中文名。。。国内的同类产品有各种黄体酮胶丸，常见的是琪宁黄体酮胶丸。

3. 抗雄药物

这个是 HRT 必备药物，可以没有孕激素，但必须要吃抗雄药。只吃雌激素不仅效果很差，而且会引起体内雌雄激素过度对抗而造成各种身体不适的副作用。常用的强抗雄药就 2 种，安体舒通和色普龙。安体舒通价格便宜，副作用轻到中（同样看人），色普龙价格超贵，但没什么副作用（不是完全没有）。弱抗雄药物可以不用考虑，效果差价格还高（大部分比色普龙还贵），具体上面已提。

选择方面，资金充足就用色普龙（注意雌激素搭配），资金不足就安体（前提是服用后没有比较强烈的副作用）。

关于术后抗雄药是否要继续使用的问题，其实这个是根据体内雄激素水平来决定的，如果残留雄激素水平高于普通女性水平，则通常医生会继续开抗雄药物吃一段时间，如果已经在女性的正常范围内，那就不需要了。

4. 维生素

激素会加速体内维生素代谢，所以适当补充维生素还是有必要的，像 VB 复合片、VC 等，或者那种各种都包括的复合片。按正常剂量就行，通常不用加量。

5. 关于组合配方

目前市面上的泰国配方，是通过多年亚洲人士试验得到的最佳配方，个人也推荐的（省得麻烦），例如：泰国激素 650、680 等。

6. 关于服用方法

纯激素不适用舌下含服，会直接从舌下静脉丛进入血管从而对心脏造成负担。同样也不要嚼碎服，那样可能使碎片残留在牙齿里，有溶于唾液从舌下进入血管的可能。先弄碎再冲服倒是没什么问题。

缓释片虽然不推荐但还是说一下好了，这个不能弄碎吃，会破坏药片结构失去缓释效果。

更多激素请加群主 QQ: 232753604.

梦芭莎变装整理，转载请著名出处。