

Для кого тиболон?

Тиболон — синтетический стероид, тканеселективный регулятор эстрогенной активности. В организме человека он метаболизируется в три изомера: 3 альфа-гидрокситиболон, 3 бета-гидрокситиболон и 4 дельта-метаболит.

Изменение демографической структуры общества в последние десятилетия привело к увеличению в популяции доли женщин старшей возрастной группы. В настоящее время развитые страны мира стоят перед серьезной социальной и медицинской проблемой — инверсией возрастной «пирамиды», что связано с увеличением продолжительности жизни. Более трети своей жизни современная женщина проводит в состоянии дефицита женских половых гормонов. По данным ВОЗ с каждым годом возрастает число женщин, вступающих в период постменопаузы (к 2030 г. их количество достигнет 1,2 млрд человек). Менопауза, не являясь заболеванием, приводит к нарушению эндокринного равновесия в организме женщины, вызывая приливы, раздражительность, бессонницу, а в последующем — возможные урогенитальные расстройства, повышение риска развития остеопороза и сердечно-сосудистых заболеваний. Все эти данные свидетельствуют о необходимости разработки целого ряда медицинских и социальных мер по защите здоровья, сохранению работоспособности и достойного качества жизни женщин пери- и постменопаузального периода.

Новым этапом в развитии менопаузальной гормональной терапии (МГТ) стали данные о возможности эффективного использования особых групп препаратов как альтернативы традиционной эстрадиолсодержащей заместительной гормональной терапии (ЗГТ) [1]. Одним из таких препаратов является тиболон, относящийся к категории G3H — другие половые гормоны и препараты, применяющиеся для лечения менопаузальных нарушений. Тиболон — синтетический стероид, тканеселективный регулятор эстрогенной активности. В организме человека он метаболизируется в три изомера: 3 альфа-гидрокситиболон, 3 бета-гидрокситиболон и 4 дельта-метаболит, обладающие тканеселективным сродством к эстрогенным рецепторам. Гидроксиметаболиты циркулируют в плазме крови в связанном неактивном состоянии в виде сульфатированных форм. Попадая в ткани-мишени (кости, центральная нервная система, мочеполовые органы, сердечно-сосудистая система), метаболиты тиболонa реактивируются под воздействием сульфатазы, что обеспечивает их эстрогеноподобный эффект. В молочной железе и эндометрии 4 дельта-изомер блокирует сульфатазу, препятствуя формированию активных метаболитов, способных взаимодействовать с эстрогенными рецепторами. Этот изомер обладает также гестагенными и слабыми андрогенными свойствами. В результате достигаются благоприятные эстрогенные эффекты в центральной нервной системе, костях и мочеполовом тракте при отсутствии нежелательных влияний в эндометрии и молочных железах.

Тиболон появился на фармацевтическом рынке с 1988 г. Зарегистрирован в 89 странах для лечения климактерического синдрома, в 45 странах — для профилактики остеопороза. В Украине зарегистрирован препарат Эспа-тибол — тиболон 2,5 мг, который применяется один раз в сутки, желательно в одно и то же время. Показания к применению: лечение симптомов эстрогенной недостаточности у

женщин спустя 1 год после последней естественной менструации; профилактика остеопороза у женщин в постменопаузе, имеющих высокий риск возникновения переломов, и при непереносимости других препаратов, применяемых для профилактики остеопороза. Начало лечения: естественная менопауза — лечение можно начать через 12 месяцев после последней естественной менструации; хирургическая менопауза — лечение начинают немедленно. Пропуск приема таблетки: менее 12 часов — принять немедленно; более 12 часов — пропустить прием таблетки, следующую таблетку принять в обычное время. Общая переносимость: Ледибон хорошо переносится, нет существенного влияния на массу тела.

В рандомизированных плацебо-контролируемых исследованиях было показано, что тиболон позволяет контролировать приливы жара, потливость и другие типичные симптомы, такие как бессонница, головная боль и утомляемость. В плане облегчения климактерических симптомов он оказался настолько же эффективным, как и многочисленные схемы эстроген-прогестагенной комбинированной и только эстрогенной терапии (ЭПТ/ЭТ) [8–10], хотя, возможно, он и характеризуется несколько более медленным началом действия, но может также использоваться в качестве «терапии прикрытия» для облегчения симптомов дефицита эстрогенов у женщин, получающих лечение агонистами гонадотропин-рилизинг-гормона (аГнРГ) по поводу миомы матки и эндометриоза [11, 12].

Показано, что тиболон способствует обратному развитию атрофии влагалища (увеличивает кариопикнотический индекс и индекс созревания клеток) и улучшает качество цервикальной слизи [13]. Женщины, получающие лечение тиболоном, отмечают значительное уменьшение сухости во влагалище, выраженности диспареунии и мочевого симптомов.

Эффекты тиболона в отношении циркулирующих андрогенов отличаются от действия стандартных пероральных схем МГТ (ЭПТ/ЭТ). При использовании тиболона уровень глобулина, связывающего половые стероиды (ГСПС), снижается, а не увеличивается, в связи с этим концентрация свободного тестостерона повышается, в то время как при стандартной МГТ (ЭПТ/ЭТ) наблюдается ее снижение. Показано, что увеличивается также концентрация дегидро-эпиандростеронсульфата (ДЭАС) [14]. Кроме этого, 4 дельта-изомер тиболона также оказывает некоторое андрогенное действие. Эти свойства тиболона способствуют его благоприятному влиянию на сексуальное благополучие, которое заключается в повышении сексуального влечения, возбуждения, стимуляции сексуальных фантазий и повышении увлажненности влагалища [15–17]. В сравнении со стандартными схемами ЭПТ, тиболон в значительно большей степени способствует увеличению частоты коитусов, повышает степень наслаждения и удовлетворенности половым актом [18]. Что касается частоты оргазма и сексуальной чувствительности, то при применении тиболона или комбинации эстрогенов и андрогенов наблюдается более выраженный эффект, нежели при использовании ЭТ или в контрольной группе [19].

Подготовили Тихомиров А.Л., Манухин И.Б., Манухина Е.И., Казенашев В.В.

Опубликовано в журнале «Лечащий врач» №9'2016