

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к 1стр. из 164	
Лекционный комплекс		

Министерство здравоохранения Республики Казахстан
Медицинский колледж при АО
«Южно-Казахстанская медицинская академия»

ЛЕКЦИОННЫЙ КОМПЛЕКС

Дисциплины: Фармакология, фармакотерапия

Специальность: 0301000 «Лечебное дело»

Квалификация: 0301013 «Акушер»

Курс: 2

Семестр: 3

Форма контроля: экзамен

Общая трудоемкость всего часов/кредитов КЗ - 120час/4 кредит

СРО – 40 час.

СРОП – 10 час.

Аудиторные - 30час.

Симуляция - 40час.

Шымкент 2020г.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	2стр. из 164

Лекционный комплекс дисциплины Фармакология, фармакотерапия составлен: преподаватель Кенесова К.Ж.

На основании силлабуса по специальности: 0301000 «Лечебное дело»

Протокол № 15 «02» 06 2020 г.

Заведующая кафедрой, к.м.н., доцент  Ахмадиева К.Е.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	Зстр. из 164	

1. Тема: Общая рецептура.

2. Цель: При изучении данной темы следует обратить особое внимание на следующее.

1. Характерные особенности каждой лекарственной формы и их разновидности.
2. Пути введения и особенности применения этих лекарственных форм.
3. Таблица окончаний именительного и родительного падежей латинских склонений.
4. Образцы и примеры выписывания лекарственных форм в рецептах.
5. Возможные варианты и особенности их выписывания.
6. Алгоритм выписывания рецепта, необходимый при выполнении заданий.

3. Тезисы лекции.

Понятие о лекарственном веществе и лекарственной форме. Общая рецептура.

Правила выписывания лекарственных форм.

Рецептура – раздел курса фармакологии, в котором излагаются правила выписывания рецептов на разнообразные лекарства, способы их изготовления в аптечных условиях, хранения и отпуска потребителю.

Лекарственное вещество – это химическое соединение установленной структуры, которое в определенных количествах (дозах) обладает лечебным или профилактическим действием при том или ином заболевании. Некоторые лекарственные вещества используются и в диагностических целях.

Лекарственное средство – лекарственные вещества или их комбинации, вступающие в контакт с организмом человека или животного, проникающее в органы и ткани организма человека или животного, применяемые для профилактики, диагностики, лечения заболеваний и полученные из крови, органов и тканей организма человека, животного, растений, минералов, методами синтеза или с применением биотехнологий.

Лекарственная форма – состояние лекарственного препарата, соответствующее способам его применения и введения и обеспечивающее достижение необходимого эффекта.

Лекарственный препарат – лекарственное средство в виде лекарственной формы, применяемое для профилактики, диагностики, лечения заболевания.

В зависимости от консистенции лекарственные формы делятся на:

1. Твердые формы – порошки, гранулы, таблетки, драже, капсулы, спансулы, сборы, пилюли.
2. Жидкие формы – растворы, суспензии, настойки, капли, настои, отвары, слизи, экстракты, эмульсии, микстуры, аэрозоли.
3. Мягкие формы – мази, пасты, линименты, суппозитории, пластыри, пленки.

Рецепт – это письменное обращение врача, фельдшера, акушерки, зубного врача в аптеку об отпуске готового или изготовлении в самой аптеке лекарственного средства в определенной лекарственной форме и дозировке и отпуске его с указанием способа применения.

Рецепт содержит 9 основных частей:

Наименование лечебного учреждения (штамп).

1. Дата прописывания рецепта.
2. ФИО больного.
3. Возраст больного.
4. ФИО врача
5. Обозначение лекарственных веществ и их количества (пропись).
6. Название лекарственной формы и указания фармацевту.
7. Способ применения лекарства.
8. Подпись и личная печать врача.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	Лекционный комплекс	044/41-19к 4стр. из 164

Твердые лекарственные формы

Порошки (им. п., ед.ч. Pulvis, род.п. ед.ч. – Pulveris, им.п.мн.ч. – Pulveres)

Порошки – это твердая лекарственная форма для внутреннего и наружного применения, обладающая свойствами сыпучести.

По степени измельченности различают мельчайшие, мелкие и крупные порошки. По составу порошки бывают простые – состоят из одного вещества и сложные – состоят из нескольких веществ.

Примеры рецептов:

Rp: Norsulfasoli subtilissimi 50,0

D.S. Присыпать рану 2 раза в день утром и вечером после промывания раствором марганцовки и обсыхания. На 20 присыпок равными долями.

Rp: Anaesthesini 5,0

Zinci oxidi 20,0

Talci 25,0

M.f. pulv.

D.S. Присыпать мокнущие участки кожи после их просушивания ватой 2-3 раза в день, обязательно на ночь. На 10 присыпок.

Порошки разделенные предназначены для внутреннего применения, каждый порошок на один прием. Могут простыми и сложными. Вес одного порошка не меньше 0,1. В них могут выписываться сильнодействующие и ядовитые компоненты. Если вес одного или нескольких лекарственных веществ, входящих в порошок менее 0,1, то для формирования порошка добавляют индифферентные наполнители – сахар, глюкозу, и др.

Примеры рецептов:

Rp: Ferri lactates 1,0

D.t.d. № 20

S. По 1 порошку 3 раза в день после еды.

Rp: Pulv. Rad. Rhei 0,5

D.t.d. № 10

S. По 1 порошку на ночь Запить ½ стакана теплой воды

(слово «порошок» обычно не пишут в начале рецепта, за исключением порошков из растительного сырья)

Rp: Paracetamoli

Ac. acetylsalicylici aa 0,25

Coffeini natrii-benzoatis 0,1

M.f.pulv.

D.t.d. № 10

S. По 1 порошку при головной боли. Запить молоком.

Гранулы (Granulum, Granula, Granulorum)

Гранулы – это порошкообразная крупнозернистая лекарственная форма заводского изготовления. Состоит из однородных частиц (крупинки) размером от 0,2 до 3 мм. Состав обычно сложный. В качестве вспомогательных веществ используют сахар, глюкозу, крахмал, тальк и т.д. Отпускается общим количеством в заводской упаковке. Дозировается в соответствии с сигнатурой самим больным чайными ложками или прилагаемыми мерными ложками, растворяя перед приемом в 0,5 – 1 ст. воды или заливая водой. Так как точность дозирования весьма относительно, ядовитые и сильнодействующие вещества в гранулах не выпускаются.

Примеры рецептов:

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	Стр. из 164	

Rp: Granulorum Orasi 100,0

D.S. По 1 ч.ложке гранул 3 раза в день во время или после еды.

Таблетки (Tabuletta, Tabuletae)

Таблетки – твердая дозированная лекарственная форма, получаемая прессованием медикаментов при помощи специальных таблетующих машин только на фармзаводах. Аптека лишь отпускает их, как правило, в заводской упаковке с вложенной инструкцией по применению.

Состав вспомогательных компонентов в рецепте не указывается, дозировки действующих веществ строго фиксированы и произвольно меняться не могут.

Большинство таблеток, содержащих в своем составе несколько лекарственных веществ, имеют коммерческое (запатентованное фирмой) название. Это название в рецепте часто заключается в кавычки и не склоняется.

Примеры рецептов:

Rp : Tab. Anaprilini 0,01 № 20

D.S. По 1 таб. 3 раза в день

Rp : Tab. «Papazolium» №20

D.S. По 1 таб. 2 раза в день

Драже (Dragee, Dragees)

Драже – это твердая дозированная лекарственная форма для внутреннего применения, получаемая путем многократного наслаивания (дражирования) лекарственных и вспомогательных веществ на сахарную крупку (гранулу). Драже изготавливают только на заводах в специальных машинах. В форме драже лекарственные вещества хорошо защищены, поэтому в этой форме выпускают витамины, ферменты. Масса 1 драже не более 1,0. Так же как и таблетки, имеют коммерческие названия, в рецепте в кавычках и склоняется.

Примеры рецептов:

Rp: Dragees Diprazini 0,025 № 20

D.S. По 1 драже 2 раза в день после еды.

Rp: Dragees «Festal» № 50

D.S. По 2 драже 3 раза в день во время или сразу после еды.

Капсулы (Capsula, Capsulae)

Капсулы – дозированная твердая лекарственная форма, представляющая собой лекарственное вещество, заключенное в оболочку – капсулу. Под капсулой понимается желатиновая или полимерная оболочка для порошкообразных, пастообразных веществ и жидких масел. Желатиновые капсулы вмещают от 0,1 до 1,5 лекарственного вещества, полимерные – 0,1 – 0,5.. Многие имеют коммерческие названия.

Примеры рецептов:

Rp: Caps. Nitroglycerini 0,0005 № 40

D.S. По 1 капсуле под язык при приступах стенокардии (капсулу раздавить зубами)

Rp: Caps. «Essentiale» № 50

D.S. По 2 капсулы 3 раза в день через час после еды.

Спансулы (Spansulae)

Относительно новая твердая дозированная лекарственная форма заводского изготовления. Это усовершенствованный вариант многослойных таблеток, позволяющих осуществить регулируемое высвобождение лекарственных веществ в различных отделах пищеварительного тракта и через необходимые интервалы времени. Являются разновидностью капсул, которые заполняют не порошком или масляным раствором, а

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	бстр. из 164	

микросферами (микрокапсулами) или пластинками из полимеров или природных материалов. Могут включать одно или несколько веществ.

Жидкие лекарственные формы

РАСТВОРЫ - SOLUTIONES

(Solutio, Solutionis)

Раствор - жидкая лекарственная форма, получаемая путем растворения твердого лекарственного вещества или жидкости в растворителе.

В качестве растворителя используют Aqua destillata, Spiritus aethylicus 70%, 90%, 95%, Glycerinum, жидкие масла: Oleum Vaselini, Oleum Olivarum, Oleum Persicorum.

Соответственно выделяют водные, спиртовые, глицериновые и масляные растворы.

Выделяют также истинные и коллоидные растворы; истинные должны быть всегда прозрачны, не должны содержать взвесей и осадка.

Применение: наружное и внутреннее, инъекции.

Rp.: Solutionis Camphorae oleosae 10% - 100 ml

D. S. Для растирания области сустава.

Rp.: Anaesthesini 5,0

Olei Vaselini ad 50 ml

M. D. S. Наносить на раневую поверхность.

(официальный раствор)

Rp.: Solutionis Hydrogenii peroxydi dilutae 100 ml

D. S. Развести 1 столовую ложку в стакане воды. Для полоскания.

NB!!! Для расчета разведения: 1 ч.л. содержит 5 мл водного раствора, 1 десертная ложка - 7,5 мл, 1 ст.л. - 15 мл. В 1 мл водного раствора содержится 20 капель.

NB!!! Капли перед употреблением разводят небольшим количеством воды или молока (масляные).

СЛИЗИ - MUCILAGINES

(Mucilago, Mucilaginis)

Слизь - вязкие, клейкие жидкости, представляющие собой раствор ВМС, получаемый при растворении камедей, извлечения методом настаивания, а также из крахмала при обработке горячей водой.

Чаще всего применяют Mucilago Gummi Armeniacae (слизь камеди абрикосовой), Mucilago Gummi arabici, Mucilago radices Althaeae, Mucilago Amyli.

Все слизи официальные, так что концентрация в рецептах не пишется.

Применение: обволакивающие средства, совместно с раздражающими лекарствами; в составе микстур с нерастворимыми веществами. Нельзя назначать одновременно спиртовые препараты, кислоты и щелочи.

Rp.: Chlorali hydrati 1,5

Mucilaginis Amyli

Aquae destillatae aa 25 ml

M. D. S. Для одной клизмы.

СУСПЕНЗИИ - SUSPENSIONES

(Suspensio, Suspensiones)

Суспензии - жидкие лекарственные формы, в которых твердые мелкоизмельченные

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казakhstanская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	7стр. из 164

нерастворимые лекарственные вещества находятся во взвешенном состоянии в какой-либо жидкости.

От коллоидных растворов суспензии отличает больший размер взвешенных частиц. По этому критерию различают тонкие и грубые суспензии.

Применение: наружное и внутреннее, некоторые - парентерально. Надо иметь в виду, что суспензии можно вводить в/м или в полости тела.

(водные, официальные суспензии - без концентрации)

Rp.: Suspensionis Hydrocortisoni acetatis 0,5% - 10 ml

D. S. По 2 капли в глаз 4 раза в день, перед употреблением взбалтывать.

(магистральные суспензии)

Rp.: Trichomonacidi 0,25

Olei Vaselini ad 50 ml

M. f. suspensio

Sterilisetur!

D. S. Вводить в мочевого пузырь по 10 мл. Перед употреблением взбалтывать.

ЭМУЛЬСИИ ДЛЯ ВНУТРЕННЕГО ПРИМЕНЕНИЯ - EMULSA AD USUM INTERNUM

(Emulsum, Emulsi)

Эмульсия - жидкая лекарственная форма, в которой нерастворимые в воде жидкости находятся в водной среде во взвешенном состоянии в виде мельчайших капель.

По способу приготовления выделяют масляные и семенные эмульсии. Используются Oleum Ricini, Oleum Amygdalarum, Oleum jecoris Aselli (рыбий жир тресковый).

Для хорошего эмульгирования берут 2 части масла, 1 часть эмульгатора и 17 частей воды.

Если количество масла в рецепте не обозначено, то из 10 частей масла делают 100 частей эмульсии: 20 мл масла + 10,0 желатозы + 170 мл воды = 200 мл эмульсии. Для семенных эмульсий эмульгаторы не нужны, отношение количества семян к общему количеству эмульсии - 1:10.

Rp.: Olei jecoris Aselli 30 ml

Gelatosae 15,0

Aquae destillatae ad 200 ml

M. f. emulsum

D. S. На два приема.

Rp.: Emulsi olei Amygdalarum 200 ml

Codeini phosphatis 0,2

M. D. S. По 1 ст. л. 3 раза в день.

НАСТОИ И ОТВАРЫ - INFUSA ET DECOCTA

(Infusum, Infusi; Decoctum, Decocti)

Настои и отвары - жидкие лекарственные формы, представляющие собой водные извлечения из лекарственного сырья.

Применение: внутреннее и наружное. Они быстро разлагаются, поэтому их выписывают на 3-4 дня и рекомендуют хранить в прохладном месте.

Rp.: Infusi herbae Thermopsidis 0,6 - 180 ml

D. S. По 1 ст. л. 3 раза в день.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	8стр. из 164	

СБОРЫ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ - SPECIES

(Species, Specierum)

Сборы лекарственных - смеси нескольких видов измельченного, реже цельного растительного лекарственного сырья.

Применение: внутреннее, сжигание и вдыхание дыма, наружное.

Rp.: Herbae Adonidis vernalis 2,0

Rhizomatis cum radicibus Valerianae 1,5

M. f. species

D. t. d. N 10

S. Дозу сбора заваривать стаканом кипятка и настаивать в течение 30 минут. Принимать по 1 ст. л. 3 раза в день.

Rp.: Specierum antiasthmaticarum 100,0

D. S. По 1/2 ч. л. сжигать и вдыхать дым.

НАСТОЙКИ - TINCTURAE

(Tinctura, Tincturae)

Настойки - жидкие, прозрачные, более или менее окрашенные спиртовые извлечения из растительного сырья, получаемые без нагревания и удаления экстрагента.

ВНИМАНИЕ!!! Все настойки официнальны и, в отличие от настоев и отваров, являются стойкой лекарственной формой.

Rp.: Tincturae Stophanthi 5 ml

Tincturae Valerianae 15 ml

M. D. S. По 20 капель на прием, 3 раза в день.

ЭКСТРАКТЫ - EXTRACTA

(Extractum, Extracti)

Экстракт - концентрированная вытяжка из лекарственного растительного сырья.

В зависимости от консистенции различают Extracti fluidi, Extracti spissi, Extracti sicci.

Rp.: Extracti Frangulae fluidi 20 ml

D. S. По 20 капель на прием, 3 раза в день.

МИКСТУРЫ - MIXTURAE

(Mixtura, Mixturae)

Микстуры - жидкие лекарственные формы, которые получают при растворении или смешивании в различных жидких основах нескольких твердых веществ или при смешивании нескольких жидкостей.

Применение: чаще внутреннее.

Микстуры с осадками, которые следует взбалтывать - Mixturae agitandae.

Слово "Mixtura" в рецепте не употребляется.

Rp.: Codeini phosphatis 0,18

Kalii bromidi 6,0

Aquae destillatae ad 180 ml

M. D. S. По 1 ст. л. 3 раза в день.

ЛИНИМЕНТЫ - LINIMENTI

(Linimentum, Linimenti)

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	Лекционный комплекс	044/41-19к 9стр. из 164

Линименты - лекарственная форма для наружного применения.

Они могут быть эмульсиями, суспензиями, эмульсиями-суспензиями, микстурами, оподельдоками (т. н. мыльные линименты; студнеобразная масса, размягчающаяся при температуре тела).

Rp.: Chloroformii 20 ml
Olei Hyoscyami 40 ml

M. f. linimentum

D. S. Для растирания области пораженного сустава.

Мягкие лекарственные формы

МАЗИ - UNGUENTA

(Unguentum, Unguenti)

Мази - мягкие лекарственные формы, имеющие вязкую консистенцию и назначаемые для наружного применения.

Мази получают смешиванием basis'a с constituens'ом. В качестве constituens по умолчанию используется вазелин, а если это глазные мази, то ланолин и вазелин для глазных мазей в соотношении 10:90.

Различают простые (2 компонента) и сложные мази.

Глазные мази принято выписывать в количестве 5,0-10,0; остальные - 20,0 - 100,0.

(официальные мази)

Rp.: Unguenti Zinci 20,0

D. S. Наносить на пораженные участки кожи.

Rp.: Unguenti Neomycini sulfatis 1% - 50,0

D. S. Смазывать пораженные участки кожи.

(развернутый вариант глазных мазей)

Rp.: Sulfacyli-natrii 1,0

Lanolini 0,4

Vaselini ad 5,0

M. f. unguentum

D. S. Под веко 3 раза в день.

ПАСТЫ - PASTAE

(Pasta, Pastae)

Пасты - разновидности мазей с содержанием порошкообразных веществ не менее 25% (близкие по консистенции к тесту - pasta по-латыни) и не более 60-65%.

NB!!! Если количество порошкообразных веществ в пасте меньше 25%, то добавляют индифферентные порошки - Amylum, Talcum, Zinci oxydum, Bolus alba (глина белая).

Rp.: Iodoformii 10,0

Amyli

Zinci oxydi aa 5,0

Vaselini ad 50,0

M. f. pasta

D. S. Наносить на пораженные участки кожи.

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	10стр. из 164	

СУППОЗИТОРИИ - SUPPOSITORIA

(Suppositorium, вин. п. - Suppositorium, Suppositoria)

Суппозитории - дозированные лекарственные формы, твердые при комнатной температуре и расплавляющиеся или растворяющиеся при температуре тела.

Различают suppositoria rectalia, suppositoria vaginalia и bacilli (палочки).

В качестве constituens чаще всего используют масло какао, жир коричника японского, а также желатиново-глицериновые и мыльно-глицериновые основы.

Ректальные суппозитории - конус или цилиндр с заостренным концом, масса - 1,1-4,0 г, в педиатрической практике - 0,5-1,5 г. Максимальный диаметр - 1,5 см. По умолчанию изготавливают массой 3,0 г.

Среди **вагинальных суппозиториях** можно выделить globuli (сферической формы), ovuli (яйцевидной формы), pessaria (плоские с закругленным концом). Масса - 1,5-6,0 г, по умолчанию изготавливают массой 4,0 г.

Палочки используются сейчас редко, они предназначены для введения в мочеиспускательный канал, шейку матки, свищевые ходы etc. Они имеют форму цилиндров с заостренным концом. При их выписывании обязательно указываются размеры.

(официальные суппозитории)

Rp.: Suppositorium cum Ichtyolo 0,2

D. t. d. N 10

S. По 1 суппозиторию ректально утром и на ночь.

Rp.: Suppositoria "Bethiolum" N 10

D. S. По 1 суппозиторию 2 раза в день.

(магистральные суппозитории)

Rp.: Promedoli 0,02

Olei Casao 3,0

M. f. suppositorium rectale

D. t. d. N 6

S. По 1 суппозиторию при болях.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Какие бывают порошки?
2. Что значит характеристика «сложный порошок»?
3. Что такое «сложный, разделенный на дозы порошок»?
4. Для какого применения предназначены порошки?
5. Как выписать в рецепте порошок простой, не разделенный на дозы?
6. Какая особенность существует при выписывании в рецептах порошков из частей растений?
7. Где изготавливают таблетки и драже?
8. Как в рецепте можно выписать простые таблетки?
9. Что служит основой для мазей?
10. Укажите основной вариант выписывания в рецептах драже.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	11стр. из 164	

11. Из каких составных частей состоят мази?

12. Чем пасты отличаются от мазей?

1. Тема. Общая фармакология. Фармакокинетика лекарственных средств.

2. Цель. Данный раздел создает базу для изучения вопросов темы «Частная фармакология», где подробно рассматриваются характеристики отдельных фармакологических групп лекарственных веществ, поэтому при его изучении необходимо обратить внимание на следующее.

1. Многообразие путей введения лекарственных веществ.

2. Распределение и биотрансформация лекарственных веществ в организме.

3. Тезисы лекции.

ПУТИ ВВЕДЕНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ В ОРГАНИЗМ

Лекарственные вещества в организм могут быть введены различными путями. Их множество, но все они разделены на две большие группы: 1) энтеральные пути введения, при которых лекарственные вещества в организм попадают через желудочно-кишечный тракт; 2) парентеральные пути введения, когда лекарство вводится, минуя желудочно-кишечный тракт.

К способам введения лекарств в организм относятся:

- энтеральные (внутрь (через рот), сублингвальный (под язык), ректальный (в прямую кишку), в желудок и кишечник (с помощью зонда);

- парентеральные (инъекционные (под кожу, в мышцу, в вену, в спинномозговой канал и т.д.), на кожу и слизистые оболочки, ингаляции (путем вдыхания)). Все эти способы имеют положительные и отрицательные стороны, однако от правильно избранного пути введения лекарственного вещества в организм больного зависит скорость наступления фармакологического эффекта, его сила и продолжительность.

ЭНТЕРАЛЬНЫЕ ПУТИ ВВЕДЕНИЯ

Через рот (per os), или внутрь, — наиболее удобный и простой путь введения. Он не требует стерилизации лекарственных веществ и удобен для приема большинства лекарственных форм. Лекарственные вещества, принятые через рот, проходят пищевод, желудок, двенадцатиперстную кишку, всасываются в тонком кишечнике, попадают в воротную вену, затем в печень и далее в общий кровоток. Действие лекарственных веществ, или, как принято говорить, «фармакологический эффект», при их введении через рот начинается через 15—30 минут. Однако этот путь введения не всегда может быть использован. Некоторые лекарственные вещества (адреналин, инсулин) легко разрушаются под влиянием ферментов и кислот желудка, другие сильно раздражают слизистую, третьи не всасываются из желудочно-кишечного тракта и не могут оказывать действие на весь организм, и, наконец, лекарственные вещества, например тетрациклин, могут частично или полностью связываться с элементами пищи и терять свое действие. Кроме того, печень, выполняя защитную функцию, частично обезвреживает (инактивирует) лекарственные вещества, когда они проходят через нее. Медленное наступление фармакологического эффекта после приема лекарственного вещества через рот также не позволяет в большинстве случаев использовать этот путь введения в неотложной помощи.

Ректальный путь введения, или в прямую кишку (per rectum), используют для введения лекарственных клизм (растворы, слизи и т.д.) и суппозиториев. При этом всасывание лекарственных веществ происходит быстрее, чем при приеме через рот. Лекарственные вещества после введения попадают сначала в геморроидальные вены, затем в нижнюю

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	12стр. из 164	

полую вену и, минуя печень, в общий кровоток. Этот путь введения используют при невозможности ввести препарат через рот, при заболеваниях нижнего отдела кишечника и органов таза, а также если хотят избежать нежелательного влияния препарата на печень. Дозы лекарственных веществ при введении их в прямую кишку должны быть несколько меньше, чем при приеме их через рот. Следует помнить, что если лекарственное вещество обладает раздражающим действием, то его вводят в прямую кишку с обволакивающими средствами, например слизью крахмала. Сублингвальный (sub — под, lingua — язык) путь введения используют для препаратов, которые легко всасываются через слизистую оболочку полости рта, при этом они быстро попадают в кровь, минуя печень и почти не подвергаясь воздействию пищеварительных ферментов. Однако всасывающая поверхность подъязычной области ограничена, что позволяет вводить таким путем только высокоактивные вещества, например нитроглицерин при приступах стенокардии. Иногда таким образом советуют применять корвалол, кордиамин и другие препараты. В желудок и кишечник лекарственные вещества вводят с помощью специальных резиновых трубок-зондов. Эти пути введения используют в основном в лабораторной практике при исследовании желудочного сока или желчи.

ПАРЕНТЕРАЛЬНЫЕ ПУТИ ВВЕДЕНИЯ

Инъекционные пути введения считаются одними из наиболее рациональных и эффективных. При сравнительно меньших дозах, чем при приеме через рот, в этих случаях удается получить хороший фармакологический эффект значительно быстрее и нередко — на более продолжительный период. Напомним, что для инъекций используют стерильные водные и масляные растворы, суспензии и порошки, которые перед введением растворяют в специальных растворителях (вода для инъекций, растворы новокаина, изотонический раствор натрия хлорида и т.д.). Каждый инъекционный путь имеет свои особенности, которые необходимо учитывать при введении лекарственных веществ в организм больного. Подкожным путем введения стерильные лекарственные вещества доставляют с помощью шприца, специальной системы (капельницы) или безыгольным инъектором. Чаще вводят водные, реже — масляные растворы. Последние во избежание инфильтратов рекомендуется подогревать до температуры тела, а место инъекции после введения препарата массировать. Под кожу не рекомендуется вводить суспензии (возможны инфильтраты), а раздражающие и гипертонические растворы вводить запрещено из-за возможного развития некроза (отмирания) тканей. Всасывание препаратов в кровь при подкожном введении идет сравнительно медленно, и поэтому фармакологический эффект развивается через 5—15 минут. Для подкожного введения чаще всего используют область плеча и лопатки, а для капельного введения — область бедра и живота. Одномоментно под кожу вводят 1—2 мл раствора, а капельно — до 500 мл.

Внутримышечный путь введения используют для водных, масляных растворов и суспензий. Первые в этом случае всасываются быстрее, чем при их введении под кожу. Суспензии же образуют своеобразный запас (депо) лекарственного вещества, из которого они постепенно всасываются и значительно увеличивают время его действия. При введении в мышцу масляных растворов и суспензий необходимо следить за тем, чтобы игла не попала в кровеносный сосуд, так как в этом случае возможна закупорка кровеносных сосудов (эмболия), а это может вызвать нарушение жизненно важных функций организма. Лекарственные вещества в мышцу вводят в основном одномоментно от 1 до 10 мл, используя при этом крупные мышцы, например бедра, ягодицы. Если используют ягодичную мышцу, то ее условно делят на четыре части и лекарство вводят в верхний наружный левый или верхний наружный правый квадрант.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	13стр. из 164

При внутривенном пути введения в отличие от подкожного и внутримышечного, при котором лекарственное вещество частично задерживается и разрушается в тканях, все количество вводимого вещества сразу попадает в кровь. Этим объясняется почти немедленное развитие фармакологического эффекта. В вену вводят преимущественно водные растворы, а также гипертонические растворы и раздражающие вещества, которые нельзя вводить под кожу и в мышцу. Правда, раздражающие вещества в ряде случаев перед введением следует разводить для ослабления неприятного действия. Лекарственные вещества в вену вводят медленно, иногда несколько минут, а капельно — несколько часов. Одномоментно в вену вводят от 1 до 20 мл, а капельно — от 50 мл до 1 л и более. Для внутривенного введения чаще всего используют локтевые вены, другие вены (височная, подколенная) используются реже. Недостатком внутривенного пути введения является возможность образования тромбов, особенно при длительном введении лекарств.

Кроме указанных инъекционных путей введения существуют еще внутрикожный и внутриартериальный пути введения, путь введения в спинномозговой канал, а также в различные полости, например брюшную, плевральную и т.д. Накожный путь введения пригоден для мазей, паст, линиментов, растворов, настоев, отваров и т.д. Этот путь введения рассчитан в основном на местное действие и реже на общее, потому что всасывание лекарственных веществ через кожу проходит лишь в том случае, если они хорошо растворяются в жирах (липидах) кожи. Считают, что мази, пасты, приготовленные на вазелине, оказывают только поверхностное местное действие и через кожу не всасываются. Эти же лекарственные формы, но приготовленные на ланолине, хорошо всасываются и могут оказывать не только местное, но и общее действие. Кроме того, в зависимости от фармакологических свойств используемых лекарственных веществ они могут оказывать местное раздражающее, обезболивающее, подсушивающее или какое-то другое действие. При накожном способе введения всасывание лекарственных веществ происходит сравнительно медленно. Ускорению процесса всасывания способствуют втирания, теплые ванны, компрессы, а также создание на данном участке гиперемии (покраснение). С этой целью используют соответствующим образом преобразованный электрический ток в кабинетах физиотерапии. Хорошему всасыванию лекарственных веществ способствует нарушение целостности кожи, поэтому введение препарата в рану или нанесение его вокруг нее дает различный фармакологический эффект. Ингаляционный путь введения используется чаще всего при заболеваниях органов дыхания. Площадь легких велика, почти 100 м², и поэтому лекарственные вещества легко могут проникать в кровь и оказывать общее действие. Ингаляционно, т.е. путем вдыхания, вводят газообразные вещества (кислород), пары жидких, легколетучих веществ (эфир для наркоза), а также аэрозоли, например при приступах бронхиальной астмы. Фармакологический эффект со стороны органов дыхания при таком способе введения достигается быстрее, чем, например, при внутримышечном введении.

РАСПРЕДЕЛЕНИЕ, БИОТРАНСФОРМАЦИЯ И ВЫВЕДЕНИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ ИЗ ОРГАНИЗМА

Распределение лекарственных веществ в организме может быть равномерным и неравномерным. Это зависит от ряда факторов, например от способности лекарственных веществ всасываться, связываться с белками, накапливаться в тканях, создавая их своеобразный запас (депо), или проникать через различные биологические барьеры. К последним относятся гематоэнцефалический (препятствует проникновению лекарственных веществ из крови в ЦНС), плацентарный (препятствует переходу лекарств из организма матери в организм плода) и другие барьеры. При соединении лекарственных веществ с

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	14стр. из 164	

белками крови их активность резко падает. Подобные соединения в большинстве случаев нестойки, и освобождающиеся от белков вещества снова становятся активными, проявляют фармакологическое действие, увеличивая таким образом время его действия. То же самое происходит, если лекарственное вещество временно накапливается в тканях и, высвобождаясь из этого депо, оказывает активное влияние на организм. Под биотрансформацией понимают изменения, происходящие с лекарственными веществами в процессе их прохождения по организму. Большой частью биотрансформация лекарственных веществ осуществляется в печени с помощью специальных микросомальных ферментов. От последних зависит скорость биотрансформации, в результате чего одни лекарственные вещества усиливают, а другие ослабляют свое действие. Элиминация — совокупность процессов, охватывающих биотрансформацию и выведение лекарственных веществ из организма. Она приводит к снижению концентрации действующих веществ в жидкостях и тканях организма. Пути выведения лекарственных веществ различны. Одни выводятся через почки с мочой, другие в составе желчи или пищеварительных соков через желудочно-кишечный тракт, третьи — через потовые, слюнные или бронхиальные железы, четвертые, особенно летучие, через легкие с выдыхаемым воздухом. Особое внимание следует обратить на то, что у кормящих матерей лекарственные вещества нередко выделяются с молоком и могут оказывать свое положительное или отрицательное действие на ребенка. Например, эргокальциферол (витамин Д₂), попадающий в организм ребенка с молоком матери, оказывает благоприятный профилактический эффект. Сугубо обратное отрицательное действие в этом случае оказывают алкоголь, наркотические или подобные вещества, а также никотин.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Укажите энтеральные пути введения.
2. Какие лекарственные формы можно вводить внутривенно?
3. В каком виде и куда можно вводить масляные растворы?
4. Какие лекарственные формы можно вводить в мышцу?
5. Что дает внутримышечное введение суспензий по сравнению с аналогичным введением растворов?
6. Что такое ингаляционный путь введения лекарственных веществ?

1. Тема. Фармакодинамика лекарственных средств.

2. Цель. Данный раздел создает базу для изучения вопросов темы «Частная фармакология», где подробно рассматриваются характеристики отдельных фармакологических групп лекарственных веществ, поэтому при его изучении необходимо обратить внимание на следующее.

1. Понятия «фармакологический эффект» и «механизм действия».
2. Различные виды действия лекарственных веществ.
3. Зависимость фармакологического эффекта от свойств лекарственного вещества и организма человека.
4. Расчет доз лекарственных веществ в зависимости от массы тела и возраста.

2. Тезисы лекции.

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЙ ЭФФЕКТ И МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979- MEDICAL ACADEMY	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	15стр. из 164	

Фармакологическим эффектом называют наблюдаемые изменения, вызванные лекарственными веществами в деятельности отдельных органов или систем организма. Например, одни усиливают работу сердца, другие снимают спазм бронхов, третьи снижают артериальное давление и т.д. Для каждого лекарственного вещества характерны свои фармакологические эффекты, причем чаще используются те, что выражены наиболее сильно. Они носят название «основные фармакологические эффекты», остальные называют побочными.

Способы, которыми лекарственные вещества вызывают различные фармакологические эффекты, называют механизмом действия. Например, снижения артериального давления можно добиться за счет угнетения ЦНС, блокады ганглиев симпатической и парасимпатической нервной системы, непосредственного (миотропного) влияния препаратов на мышцы кровеносных сосудов и т.д.

Знание механизмов действия лекарственных веществ необходимо для более правильного и своевременного их назначения. Например, знание механизма действия адреналина гидрохлорида на кровеносные сосуды и его своевременное введение помогают быстро вывести больного из состояния шока.

ВИДЫ ДЕЙСТВИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ НА ОРГАНИЗМ

Характер действия лекарственных веществ на организм может быть различен, что зависит от многих факторов, в том числе и от свойства самого лекарственного вещества. Виды действия лекарственных веществ на организм и их краткие характеристики представлены в табл. 1.

Виды действия лекарственных веществ

Вид действия	Краткая характеристика	Пример
Местное	Действие лекарственного вещества на месте введения до всасывания в кровь	Анастезирующее или вяжущее вещество
Общее или резорбтивное	Действие лекарственного вещества на весь организм после всасывания в кровь	Снотворные средства, средства для наркоза
Рефлекторное	Действие лекарственного вещества осуществляется на одном конце рефлекторной дуги (рецептор), а фармакологический эффект развивается на другом	Горчичники, раствор аммиака при возбуждении дыхания
Главное или основное	Наиболее выраженное и часто используемое действие лекарственного вещества	У морфина — обезболивающее, хотя он оказывает противорвотное и другие действия
Побочное	Нежелательное действие лекарственного вещества,	Резерпин хорошо снижает артериальное давление, но

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии		044/41-19к
Лекционный комплекс		16стр. из 164

	которое может быть причиной осложнений	усиливает образование кислого желудочного сока, что нежелательно при язвенной болезни желудка
Прямое или первичное	Действие лекарственного вещества на какой-либо орган или систему	Сердечные гликозиды регулируют работу сердца
Косвенное или вторичное	Эффект лекарственного вещества, возникающий как следствие прямого действия	Сердечные гликозиды вызывают мочегонный эффект, хотя на почки они влияния не оказывают

Если одновременно используются два и более лекарственных вещества, то принято считать, что они оказывают комбинированное действие. При этом общий характер действия лекарственных веществ может изменяться в сторону либо увеличения, либо ослабления эффекта. Если лекарственные вещества усиливают действие друг друга, то такой эффект называют синергизмом. Он может быть суммарным (простое сложение эффектов) и потенцированным, когда совместный эффект лекарственных веществ возрастает в несколько раз. Примером синергизма служат препараты «Цитрамон» и «Пенталгин», состоящие из нескольких ингредиентов и действующие по принципу синергизма. Если же лекарственные вещества, применяемые одновременно, ослабляют действие друг друга, то это явление называют антагонизмом. Например, антагонистами являются вяжущие и слабительные вещества, средства, снижающие артериальное давление и повышающие его.

ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

Побочное действие лекарственных веществ чаще всего проявляется в виде двух форм: аллергической и неаллергической (табл. 2).

Побочное действие лекарственных веществ

Неаллергическое	Аллергическое
Характерно для каждого лекарственного вещества	Сходно для большинства лекарственных веществ
Усиливается при увеличении доз	Не зависит от дозы
Устраняется специфическими антагонистами	Устраняется специальными противоаллергическими средствами
Формы проявления: тошнота, рвота, повышение температуры, чувство тяжести, дискомфорта, сонливость, боли в желудке, головные боли и т.д.	Формы проявления: зуд, сыпь, крапивница, рожистое воспаление, отек Квинке, бронхиальная астма, анафилактический шок

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс		17стр. из 164

ТОКСИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

Токсическое действие лекарственных веществ проявляется после применения их в токсических дозах, которые вызывают отравление и изменения со стороны организма или отдельных органов больного. Чаще всего токсическое действие проявляется в нарушении функций печени, почек, желудочно-кишечного тракта, кроветворных органов, центральной нервной системы. Эти изменения могут носить обратимый и необратимый характер, и поэтому от их глубины зависит судьба больного. Токсическое действие лекарственных веществ, если их принимать во время беременности, может переноситься на плод и вызывать врожденные уродства. Такое действие лекарственных веществ называется тератогенным (teras — урод, genesis — рождение). Неблагоприятное действие лекарственных веществ на эмбрион, не вызывающее уродств, но снижающее функциональное состояние (рост, вес) организма, носит название эмбриотоксического. Такое действие оказывают алкоголь, никотин, особенно если женщина злоупотребляет ими в период беременности.

ВИДЫ ДОЗ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

Известно, что действие лекарственных веществ на организм зависит от их химической структуры, физико-химических свойств и дозы. Дозы по своей характеристике, назначению и эффекту могут быть различны. Наименьшая доза лекарственного вещества, после приема которой наблюдается минимальный терапевтический эффект, называется пороговой или минимальной терапевтической дозой. Однако в медицинской практике для лечения больных используется так называемая средняя терапевтическая (лечебная) доза, после приема которой у большинства больных наблюдается устойчивый терапевтический эффект. В ряде случаев и эта доза дает недостаточный лечебный эффект, и тогда приходится прибегать к более высоким дозам, что небезопасно для организма. В связи с этим для большинства лекарственных веществ установлены предельно допустимые дозы на один прием и прием в течение суток. Их называют соответственно высшая разовая доза (ВРД) и высшая суточная доза (ВСД). Высшая разовая доза лекарственного вещества — это предельно допустимая доза, разрешенная (соответствующими руководствами) на один прием. После ее применения наблюдается наибольший лечебный эффект. Высшая суточная доза — это предельно допустимая доза лекарственного вещества, разрешенная на прием в течение суток. Обычно высшие разовые и суточные дозы устанавливаются Государственной фармакопеей РФ для препаратов списка А (ядовитые и наркотические вещества) и препаратов списка Б (сильнодействующие вещества). Диапазон доз лекарственных веществ от минимальной терапевтической до высшей разовой называется шириной терапевтического действия данного вещества. Чем больше ширина терапевтического действия препарата, тем он менее токсичен, и наоборот. Кроме гою, известны другие дозы лекарственных веществ. Токсическая доза — это доза лекарственного вещества, вызывающая отравление без смертельного исхода. Смертельная, или летальная, доза вызывает смерть после ее употребления. Курсовая доза — это доза лекарственного вещества, предназначенная на курс лечения. Обычно в таблетках, порошках, суппозиториях она обозначается D.t.d. № 20, а в настоях, настойках и других растворах — как общий объем (10 мл, 200 мл) выписываемого препарата. Нередко врачи, фельдшеры назначают поддерживающую дозу — это доза лекарственного вещества, которая поддерживает функциональное состояние отдельных органов или систем организма на определенном уровне. Такие дозы применяют, например, для профилактики приступов эпилепсии, шизофрении, для предупреждения гипертонических кризов.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	18стр. из 164	

ПРИНЦИПЫ ДОЗИРОВАНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ В ЗАВИСИМОСТИ ОТ ВОЗРАСТА И МАССЫ ТЕЛА

Действие лекарственных веществ на организм в зависимости от возраста различно. Известно, что дети и люди старше 60 лет более чувствительны к действию лекарств, поэтому при определении доз лекарственных веществ возраст больных обязательно принимают во внимание. Высшие разовые и высшие суточные дозы на ядовитые и сильнодействующие вещества приведены в соответствующих таблицах Государственной фармакопеи. Они даны как для взрослых, так и для детей различного возраста. На остальные лекарственные вещества дозы рассчитываются исходя из дозы взрослого (старше 25 лет), которая принимается за единицу.

Для лиц старше 60 лет доза лекарственного вещества уменьшается до $2/3$ или $1/2$ дозы взрослого, кроме антибиотиков, витаминов и сульфаниламидных средств. Например, если средняя терапевтическая доза анальгина для взрослого составляет 0,5 г, то ребенку 7 лет следует назначить $1/3$ этой дозы, т.е. $1/3$ таблетки; или если лечебная доза 25% раствора магния сульфата для инъекций составляет 10 мл, то для ребенка 6 лет она будет равна $1/4$ части этого объема, т.е. 2,5 мл. Однако масса тела людей одного возраста может быть различна, а от этого в определенной степени зависит действие лекарственных веществ. В связи с этим понятно, что чем больше масса тела больного, тем выше должна быть доза лекарственного вещества. В таких случаях дозы лекарственных веществ назначают из расчета на 1 кг массы тела больного. Подобное дозирование считается более точным, и его нередко используют, например, при дозировании антибиотиков и других лекарственных веществ в детской практике.

ИЗМЕНЕНИЯ В ДЕЙСТВИИ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ ПРИ ИХ ПОВТОРНОМ ПРИМЕНЕНИИ

При повторном применении лекарственного вещества характер его действия может значительно изменяться и быть непохожим на первоначальный эффект. Это зависит от химической структуры вещества, его физико-химических свойств и частоты употребления. Так, при повторном применении лекарственных веществ может развиваться следующее (табл. 12). Таблица 12

Эффект лекарственных веществ при их повторном применении

Эффект	Определение	Пример
Привыкание	Ослабление действия лекарственного вещества при повторном применении в одной и той же дозе	Длительное применение нурофена постепенно ослабляет его обезболивающее действие
Кумуляция	Накапливание лекарственных веществ в организме вследствие его медленного выделения. Кумуляция может привести к отравлению	Такое действие оказывают препараты наперстянки, фенобарбитал, препараты брома
Лекарственная зависимость или пристрастие (наркомания)	Болезненное, трудно преодолимое влечение организма к повторному	Подобное действие при повторном применении вызывают наркотические

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	19стр. из 164	

	применению лекарственного вещества	вещества омнопон)	(морфин,
--	---------------------------------------	----------------------	----------

ЗАВИСИМОСТЬ ДЕЙСТВИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ ОТ ИНДИВИДУАЛЬНОЙ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТИ И СОСТОЯНИЯ ОРГАНИЗМА

В ряде случаев одинаковые дозы лекарственных веществ оказывают различное действие на больных: на одних — более слабое, а на других — очень сильное по сравнению с обычным их действием на большинство больных. Эти изменения в действии лекарственного вещества зависят от индивидуальной чувствительности организма к нему. Такая измененная необычная реакция организма в ответ на введение лекарственного вещества носит название идиосинкразии (*idios* — своеобразный, *synkresis* — смешение). Чаще всего эти явления связаны с нарушением ряда генетических факторов организма, например с недостатком ряда ферментов. Кроме того, действие лекарственных веществ зависит от функционального и патологического состояния организма. Известно, что вещества, угнетающие центральную нервную систему, сильнее и ярче проявляют свое действие на возбуждение и наоборот. Большинство лекарственных веществ почти не оказывают действия на здоровый организм, а при наличии заболевания или его симптомов их действие проявляется отчетливо. Так, кислота ацетилсалициловая проявляет жаропонижающее действие только в случае высокой температуры, а местноанестезирующие средства (новокаин) снижают свою активность в условиях воспалительного процесса, поэтому их так часто вводят выше места воспаления.

4. Иллюстративный материал. Презентация

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Что означает термин «прямое действие» лекарственного вещества?
2. Как вы понимаете термин «фармакологический эффект» лекарственного вещества?
3. Что означает термин «механизм действия» лекарственных веществ?
4. Какие дозы лекарственных веществ чаще всего используют для лечения больных?
5. Что положено в основу принципа расчета доз лекарственных веществ для больных?
6. Что такое кумуляция и чем она опасна?
7. Что такое синергизм?
8. Почему во время беременности применение лекарственных веществ следует проводить с большой осторожностью?
9. Укажите основные особенности организма, от которых зависит действие лекарственных веществ.

1. Тема. Основные виды лекарственной терапии. Основные и побочные действие. Аллергические реакции. Идиосинкразия. Токсические эффекты.

2. Цель. Данный раздел создает базу для изучения вопросов темы «Частная фармакология», где подробно рассматриваются характеристики отдельных фармакологических групп лекарственных веществ, поэтому при его изучении необходимо обратить внимание на следующее.

1. Зависимость фармакологического эффекта от свойств лекарственного вещества и организма человека.
2. Расчет доз лекарственных веществ в зависимости от массы тела и возраста.
3. Изменения, возникающие при повторном применении лекарственных веществ.
4. Побочное и токсическое действие лекарств.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	20стр. из 164	

3. Тезисы лекции.

ОСНОВНЫЕ ВИДЫ ЛЕКАРСТВЕННОЙ ТЕРАПИИ

Профилактическое применение лекарственных средств имеет в виду предупреждение определенных заболеваний. С этой целью используют дезинфицирующие, химиотерапевтические вещества и др.

Этиотропная (каузальная) терапия направлена на устранение причины заболевания (так, антибиотики действуют на бактерии, противомалярийные средства - на плазмодии малярии).

Главной задачей симптоматической терапии является устранение нежелательных симптомов (например, боли), что оказывает существенное влияние и на течение основного патологического процесса. В связи с этим во многих случаях симптоматическая терапия играет роль патогенетической.

Заместительная терапия используется при дефиците естественных биогенных веществ. Так, при недостаточности желез внутренней секреции (при сахарном диабете, микседеме) вводят соответствующие гормональные препараты. Длительность такой терапии измеряется месяцами и годами.

ОСНОВНОЕ И ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ. АЛЛЕРГИЧЕСКИЕ РЕАКЦИИ. ИДИОСИНКРАЗИЯ. ТОКСИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ

Лекарственные средства назначают для получения определенного фармакотерапевтического эффекта: для уменьшения боли, гипотензивные средства для снижения артериального давления и т.д. Все это - проявление основного действия препаратов, ради которого их применяют в практической медицине. Однако наряду с желательными эффектами практически все вещества оказывают неблагоприятное действие, к которому относятся отрицательное побочное действие неаллергической природы, аллергические реакции, токсические и другие эффекты.

К проявлениям побочного действия неаллергического происхождения относят только те эффекты, которые возникают при применении веществ в терапевтических дозах и составляют спектр их фармакологического действия. Так, фенобарбитал при использовании в качестве противоэпилептического средства может быть причиной сонливости. Обезболивающий препарат морфин в терапевтических дозах вызывает эйфорию, повышение тонуса сфинктеров желудочно-кишечного тракта.

Побочное действие может быть первичным и вторичным. Первичное действие возникает как прямое следствие влияния данного препарата на определенный субстрат (например, тошнота, рвота при раздражающем действии веществ на слизистую оболочку желудка). Вторичное побочное действие относится к косвенно возникающим неблагоприятным влияниям (например, гиповитаминоз при подавлении кишечной флоры антибиотиками).

Неблагоприятные эффекты веществ весьма разнообразны по характеру, бывают разной выраженности и продолжительности. Побочное действие может быть направлено на нервную систему, кровь и кроветворение, органы кровообращения, дыхания, пищеварения, почки, эндокринные железы и т.д. Одни побочные эффекты переносятся относительно легко (умеренная тошнота, головная боль и др.), другие могут быть тяжелыми и даже угрожающими жизни (поражение печени, лейкопения, апластическая анемия).

К отрицательным влияниям, оказываемым лекарственными веществами, относятся также аллергические реакции, частота которых довольно велика. Возникают они независимо от дозы вводимого вещества. Лекарственные средства в данном случае выступают в роли антигенов (аллергенов). Лекарственные аллергии обычно подразделяются на 4 типа.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	21стр. из 164	

Тип I (немедленная аллергия). Данный тип гиперчувствительности связан с вовлечением в реакцию IgE-антител. Проявляется это крапивницей, сосудистым отеком, ринитом, бронхоспазмом, анафилактическим шоком. Такие реакции возможны при применении пенициллинов, сульфаниламидов и др.

Тип II. При этом типе лекарственной аллергии IgG- и IgM-антитела, активируя систему комплемента, взаимодействуют с циркулирующими клетками крови и вызывают их лизис. Так, метилдофа может вызывать гемолитическую анемию, хинидин - тромбоцитопеническую пурпуру, ряд препаратов (например, анальгин) иногда являются причиной развития агранулоцитоза.

Тип III. Очевидно, в развитии данного типа лекарственной аллергии принимают участие IgG-, а также IgM- и IgE-антитела (+ комплемент). Комплекс «антиген-антитело-комплемент» взаимодействует с сосудистым эндотелием и повреждает его. Возникает так называемая сывороточная болезнь. Проявляется она крапивницей, артралгией, артритом, лимфаденопатией, лихорадкой. Сывороточную болезнь могут вызывать пенициллин, сульфаниламиды, йодиды и другие препараты.

Тип IV. В данном случае реакция опосредуется через клеточные механизмы иммунитета, включающие сенсибилизированные Т-лимфоциты и макрофаги. Возникает при местном нанесении вещества и проявляется контактным дерматитом.

Идиосинкразия (см. выше) также может быть одной из причин неблагоприятных реакций на вещества.

В дозах, превышающих терапевтические, вещества вызывают токсические эффекты. Последние обычно проявляются в виде тех или иных серьезных нарушений функций органов и систем (снижение слуха, вестибулярные расстройства, слепота в результате поражения зрительного нерва, выраженное нарушение проведения возбуждения по миокарду, поражение печени, кроветворения, угнетение жизненно важных центров продолговатого мозга).

Основной причиной токсических эффектов является передозировка - случайное или сознательное превышение максимально переносимых доз. Кроме того, возможно накопление токсических концентраций веществ в организме в результате нарушения их метаболизма (например, при патологии печени) или замедленного их выведения (при некоторых заболеваниях почек).

Лекарственные средства, назначаемые во время беременности, могут оказывать отрицательные влияния на эмбрион и плод. К таким влияниям относится тератогенное действие веществ, которое приводит к рождению детей с различными аномалиями.

Внимание к возможному тератогенному действию лекарственных средств привлекла трагедия, связанная с использованием в ряде стран талидомида. Этот препарат был введен в медицинскую практику в качестве успокаивающего и снотворного средства. Однако, как выяснилось, талидомид обладает выраженными тератогенными свойствами. В период его применения родились несколько тысяч детей с различными аномалиями (фокомелия, амелия, гемангиомы на лице, аномалии со стороны желудочно-кишечного тракта и др.). Эти события заставили особенно настороженно относиться не только к новым, но и к уже известным препаратам.

Для изучения тератогенного действия веществ была сделана попытка создать адекватную модель на животных, однако эти исследования не увенчались успехом. До настоящего времени нет достаточно доказательных экспериментальных методов для выяснения потенциальной тератогенности веществ при их внедрении в клиническую практику. Дело в том, что аномалии развития у животных вызывают многие вещества, в том числе и

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	22стр. из 164	

препараты, широко применяемые в медицине, которые, по имеющимся данным, не оказывают тератогенного действия на эмбрион человека. Таким образом, на достоверность могут претендовать только отрицательные результаты. Если вещество не вызывает аномалий развития у животных, есть основания считать, что их не будет и у человека. Если же соединение тератогенно для животных, это еще не значит, что действие проявится и в отношении человека. Тем не менее к таким препаратам следует относиться с учетом возможной тератогенности. Принимая во внимание подобную неопределенность прогнозов, женщинам в первые 2-3 мес беременности, когда у эмбриона формируются основные органы, рекомендуется воздерживаться от приема лекарственных средств без абсолютных к тому показаний. Наиболее опасным в отношении тератогенного действия считают I триместр беременности (особенно первые 3-8 нед), т.е. период органогенеза. В эти сроки повышен риск тяжелой аномалии развития эмбриона.

Вместе с тем следует учитывать, что лекарственные вещества могут оказывать на эмбрион и плод неблагоприятное воздействие, не связанное с нарушением органогенеза, что не относится к тератогенному действию. Его можно расценивать как побочное или токсическое действие лекарственных средств. Оно может проявляться на разных стадиях беременности. Если такие эффекты возникают до 12 нед беременности, их называют эмбриотоксическими, в более поздние сроки - фетотоксическими.

При назначении препаратов беременным следует учитывать, что в случае прохождения веществ через плаценту они могут оказывать неблагоприятное влияние на плод. Так, стрептомицин, назначаемый беременной, способен вызвать глухоту у плода (повреждается VIII пара черепных нервов). Тетрациклины отрицательно влияют на развитие костей у плода. У матери, страдающей морфинизмом, новорожденный также может обладать физической зависимостью к морфину. Если перед родами роженице дают антикоагулянты, возможно возникновение кровотечений у новорожденного. Таких примеров много. Они свидетельствуют о том, что через плаценту проходят различные химические соединения (липофильные). В связи с этим беременным следует проводить фармакотерапию только по строгим показаниям. При этом необходимо особенно тщательно выбирать наименее токсичные и заведомо хорошо апробированные лекарственные средства.

Кроме того, следует учитывать возможность попадания лекарственных веществ новорожденным с молоком матери, что может оказывать на них неблагоприятное влияние. Например, пенициллин может вызывать аллергические реакции, сульфаниламидные препараты - гемолитическую анемию, антикоагулянты - кровоточивость.

При создании новых лекарственных средств следует также иметь в виду потенциальную возможность таких серьезных отрицательных эффектов, как химическая мутагенность и канцерогенность. Мутагенность - это способность веществ вызывать стойкое повреждение зародышевой клетки и ее генетического аппарата, что проявляется в изменении генотипа потомства. Канцерогенность - это способность веществ вызывать развитие злокачественных опухолей.

Неблагоприятные эффекты веществ могут возникать также при их неудачном сочетании - при лекарственной несовместимости (см. выше).

ОБЩИЕ ПРИНЦИПЫ ЛЕЧЕНИЯ ОСТРЫХ ОТРАВЛЕНИЙ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ

Острые отравления химическими веществами, в том числе лекарственными средствами, встречаются довольно часто. Отравления могут быть случайными, преднамеренными (суицидальными) и связанными с особенностями профессии. Наиболее часто встречаются острые отравления этиловым спиртом, снотворными средствами, психотропными

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	23стр. из 164

препаратами, опиоидными и неопиоидными анальгетиками, фосфорорганическими инсектицидами и другими соединениями.

Для лечения отравлений химическими веществами созданы специальные токсикологические центры и отделения. Основная задача при лечении острых отравлений заключается в удалении из организма вещества, вызвавшего интоксикацию. При тяжелом состоянии пациентов этому должны предшествовать общетерапевтические и реанимационные мероприятия, направленные на обеспечение функционирования жизненно важных систем - дыхания и кровообращения.

Принципы детоксикации заключаются в следующем. Прежде всего необходимо задержать всасывание вещества на путях введения. Если вещество частично или полностью всосалось, следует ускорить его выведение из организма, а также воспользоваться антидотами для его обезвреживания и устранения неблагоприятных эффектов.

А) ЗАДЕРЖКА ВСАСЫВАНИЯ ТОКСИЧНОГО ВЕЩЕСТВА В КРОВЬ

Наиболее часто острые отравления вызваны приемом веществ внутрь. Поэтому одним из важных методов детоксикации является очищение желудка. Для этого вызывают рвоту или промывают желудок. Рвоту вызывают механическим путем (раздражением задней стенки глотки), приемом концентрированных растворов натрия хлорида или натрия сульфата, введением рвотного средства апоморфина. При отравлении веществами, повреждающими слизистые оболочки (кислоты и щелочи), рвоту не следует вызывать, так как произойдет дополнительное повреждение слизистой оболочки пищевода. Кроме того, возможны аспирация веществ и ожог дыхательных путей. Более эффективно и безопасно промывание желудка с помощью зонда. Сначала удаляют содержимое желудка, а затем желудок промывают теплой водой, изотоническим раствором натрия хлорида, раствором калия перманганата, в которые при необходимости добавляют активированный уголь и другие антидоты. Промывают желудок несколько раз (через 3-4 ч) до полного очищения его от вещества.

Для задержки всасывания веществ из кишечника дают адсорбирующие средства (активированный уголь) и слабительные (солевые слабительные, вазелиновое масло). Кроме того, проводят промывание кишечника.

Если вещество, вызвавшее интоксикацию, нанесено на кожу или слизистые оболочки, необходимо тщательно промыть их (лучше всего проточной водой).

При попадании токсичных веществ через легкие следует прекратить их ингаляцию (удалить пострадавшего из отравленной атмосферы или надеть на него противогаз).

При подкожном введении токсичного вещества всасывание его из места введения можно замедлить инъекциями раствора адреналина вокруг места введения вещества, а также охлаждением этой области (на кожную поверхность помещают пузырь со льдом). Если возможно, накладывают жгут, затрудняющий отток крови и создающий венозный застой в области введения вещества. Все эти мероприятия уменьшают системное токсическое действие вещества.

Б) УДАЛЕНИЕ ТОКСИЧНОГО ВЕЩЕСТВА ИЗ ОРГАНИЗМА

Если вещество всосалось и оказывает резорбтивное действие, основные усилия должны быть направлены на скорейшее выведение его из организма. С этой целью используют форсированный диурез, перитонеальный диализ, гемодиализ, гемосорбцию, замещение крови и др.

Метод форсированного диуреза заключается в сочетании водной нагрузки с применением активных мочегонных средств (фуросемид, маннит). В отдельных случаях ощелачивание или подкисление мочи (в зависимости от свойств вещества) способствует более быстрому

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	24стр. из 164	

выведению вещества (за счет уменьшения его реабсорбции в почечных канальцах). Методом форсированного диуреза удается выводить только свободные вещества, не связанные с белками и липидами крови. При использовании этого метода следует поддерживать электролитный баланс, который может быть нарушен вследствие выведения из организма значительного количества ионов. При острой сердечно-сосудистой недостаточности, выраженном нарушении функции почек и опасности развития отека мозга или легких форсированный диурез противопоказан.

Помимо форсированного диуреза, используют гемодиализ или перитонеальный диализ. При гемодиализе (искусственная почка) кровь проходит через диализатор с полупроницаемой мембраной и в значительной степени освобождается от не связанных с белками токсичных веществ (например, барбитуратов). Гемодиализ противопоказан при резком снижении артериального давления.

Перитонеальный диализ заключается в промывании полости брюшины раствором электролитов. В зависимости от характера отравления используют определенные диализирующие жидкости, способствующие наиболее быстрому выведению веществ в полость брюшины. Одновременно с диализирующим раствором для профилактики инфекции вводят антибиотики. Несмотря на высокую эффективность этих методов, они не универсальны, так как не все химические соединения хорошо диализируются (т.е. не проходят через полупроницаемую мембрану диализатора при гемодиализе или через брюшину при перитонеальном диализе).

Одним из методов детоксикации является гемосорбция. В данном случае токсичные вещества, находящиеся в крови, адсорбируются на специальных сорбентах (например, на гранулированном активированном угле с покрытием белками крови). Этот метод позволяет успешно проводить детоксикацию организма при отравлениях антипсихотическими средствами, анксиолитиками, фосфорорганическими соединениями и др. Важно, что метод эффективен и в тех случаях, когда препараты плохо диализируются (в том числе вещества, связанные с белками плазмы) и гемодиализ не дает положительного результата.

При лечении острых отравлений используется также замещение крови. В таких случаях кровопускание сочетается с переливанием донорской крови. Наиболее показано использование этого метода при отравлении веществами, действующими непосредственно на кровь, например вызывающими метгемоглобинообразование (так действуют нитриты, нитробензолы и др.). Кроме того, метод весьма эффективен при отравлении высокомолекулярными соединениями, прочно связывающимися с белками плазмы. Операция замещения крови противопоказана при резких нарушениях кровообращения, тромбофлебите.

За последние годы при лечении отравлений некоторыми веществами получил распространение плазмаферез, при котором производится удаление плазмы без потери форменных элементов крови с последующим замещением ее донорской плазмой или раствором электролитов с альбумином.

Иногда с целью детоксикации через грудной лимфатический проток удаляют лимфу (лимфорея). Возможны лимфодиализ, лимфосорбция. Большого значения эти методы при лечении острых отравлений лекарственными веществами не имеют.

Если отравление произошло веществами, выделяющимися легкими, то форсированное дыхание является одним из важных способов лечения такой интоксикации (например, средствами для ингаляционного наркоза). Гипервентиляцию можно вызвать стимулятором дыхания карбогеном, а также искусственным дыханием.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	25стр. из 164	

Усиление биотрансформации токсичных веществ в организме при лечении острых отравлений существенной роли не играет.

В) УСТРАНЕНИЕ ДЕЙСТВИЯ ВСОСАВШЕГОСЯ ТОКСИЧНОГО ВЕЩЕСТВА

Если установлено, каким веществом вызвано отравление, то прибегают к детоксикации организма с помощью антидотов².

Антидотами называют средства, применяемые для специфического лечения отравлений химическими веществами. К ним относятся вещества, которые инактивируют яды посредством химического или физического взаимодействия либо за счет фармакологического антагонизма (на уровне физиологических систем, рецепторов и т.д.)³. Так, при отравлении тяжелыми металлами применяют соединения, которые образуют с ними нетоксичные комплексы (например, унитиол, D-пеницилламин, CaNa₂ЭДТА). Известны антидоты, которые вступают в реакцию с веществом и высвобождают субстрат (например, оксимы - реактиваторы холинэстеразы; аналогичным образом действуют антидоты, применяемые при отравлении метгемоглобинообразующими веществами). Широко используют при острых отравлениях фармакологические антагонисты (атропин при отравлении антихолинэстеразными средствами, налоксон при отравлении морфином и т.д.). Обычно фармакологические антагонисты конкурентно взаимодействуют с теми же рецепторами, что и вещества, вызвавшие отравление. Перспективно создание специфических антител в отношении веществ, которые особенно часто являются причиной острых отравлений.

Чем раньше начато лечение острого отравления антидотами, тем оно эффективнее. При развившихся поражениях тканей, органов и систем организма и в терминальных стадиях отравления результативность терапии антидотами невелика.

Г) СИМПТОМАТИЧЕСКАЯ ТЕРАПИЯ ОСТРЫХ ОТРАВЛЕНИЙ

Важную роль в лечении острых отравлений играет симптоматическая терапия. Особенно большое значение она приобретает при отравлении веществами, которые не имеют специфических антидотов.

Прежде всего необходимо поддержать жизненно важные функции - кровообращение и дыхание. С этой целью применяют кардиотоники, вещества, регулирующие уровень артериального давления, средства, улучшающие микроциркуляцию в периферических тканях, часто используют оксигенотерапию, иногда - стимуляторы дыхания и т.д. При появлении нежелательных симптомов, которые отягощают состояние пациента, их устраняют с помощью соответствующих препаратов. Так, судороги можно купировать анксиолитиком диазепамом, который обладает выраженной противосудорожной активностью. При отеке мозга проводят дегидратационную терапию (с помощью маннита, глицерина). Боли устраняют анальгетиками (морфин и др.). Большое внимание следует уделять кислотно-основному состоянию и при возникающих нарушениях проводить необходимую его коррекцию. При лечении ацидоза применяют растворы натрия гидрокарбоната, трисамин, а при алкалозе - аммония хлорид. Столь же важно поддерживать водно-электролитный баланс.

Таким образом, лечение острых отравлений лекарственными средствами включает комплекс детоксикационных мероприятий в сочетании с симптоматической и, если возникает необходимость, реанимационной терапией.

Д) ПРОФИЛАКТИКА ОСТРЫХ ОТРАВЛЕНИЙ

Главная задача - предупреждение острых отравлений. Для этого необходимо обоснованно выписывать лекарственные средства и правильно хранить их в медицинских учреждениях и в домашних условиях. Так, не следует держать медикаменты в шкафах, холодильнике, где

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	26стр. из 164	

находится пища. Места хранения лекарственных средств должны быть недоступны для детей. Нецелесообразно сохранять дома препараты, в которых нет надобности. Нельзя применять лекарственные средства, срок годности которых истек. Используемые препараты обязательно должны иметь соответствующие этикетки с названиями. Естественно, что принимать большинство лекарственных средств следует только по рекомендации врача, строго соблюдая их дозировку. Это особенно важно для ядовитых и сильнодействующих препаратов. Самолечение, как правило, недопустимо, так как оно нередко бывает причиной острых отравлений и других неблагоприятных эффектов. Важное значение имеет соблюдение правил хранения химических веществ и работы с ними на химико-фармацевтических предприятиях и в лабораториях, занимающихся изготовлением лекарственных препаратов. Выполнение всех этих требований может значительно уменьшить частоту острых отравлений лекарственными средствами.

4. Иллюстративный материал. Презентация

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Каким термином обозначают необычные реакции на введение лекарственного средства?
2. Какие явления могут возникать при комбинированном применении веществ?
3. Нежелательные действие лекарственных веществ при их применении в терапевтических дозах.

1. Тема. Антисептики и дезинфицирующие средства

2. Цель. При изучении этой темы следует обратить особое внимание на следующее.

1. Понятия «антисептическое», «дезинфицирующее», «асептическое», «бактерицидное» и «бактериостатическое» действие лекарственных средств.
2. Классификация антисептических дезинфицирующих средств.
3. Механизм противомикробного действия препаратов хлора и йода. Практическое применение их в медицинской практике.
4. Фармакологические свойства окислителей.
5. Противомикробное действие спирта этилового и формальдегида.
6. Противомикробные свойства соединений ароматического ряда.
7. Противомикробное и противогрибковое действие красителей.
8. Механизм противомикробного действия препаратов, содержащих соли тяжелых металлов.
9. Общая характеристика и применение детергентов.
10. Возможность отравления солями тяжелых металлов и роль унитиола при оказании помощи в таких случаях.

3. Тезисы лекции.

Антисептические и дезинфицирующие средства на практике представлены большой группой препаратов, относящихся к различным классам химических соединений, имеющих различный механизм противомикробного действия и находящих применение во многих областях медицины.

Современная классификация антисептических и дезинфицирующих средств основана на химической структуре препаратов и включает в себя следующие группы: 1) галогены и галогенсодержащие соединения; 2) окислители; 3) кислоты и щелочи; 4) спирты и альдегиды; 5) фенолы, дегти, синтетические бальзамы; 6) красители; 7) детергенты и др.

1. Галогены и галогенсодержащие соединения

К этой группе антисептических средств относятся соединения хлора (хлорамин, пантоцид, хлоргексидин) и ряд соединений йода (раствор йода спиртовой, йодонат).

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	27стр. из 164	

Противомикробное действие хлора и йода связано со способностью свертывать белки протоплазмы микробов, что и вызывает их гибель. Но подобное действие оказывают лишь активные (свободные) галогены, входящие в состав препаратов, а эффективность их зависит от количества содержащихся в препаратах свободных хлора и йода. ХЛОРАМИН Б (Chloraminum B) — растворимый в воде белый порошок, содержащий 25—29% активного хлора, обладающий антисептическим, дезинфицирующим и дезодорирующим действием. Растворы хлорамина применяют для обработки рук — 0,25—0,5%, лечения и обработки ран — 1—3%, дезинфекции предметов ухода за больными, неметаллического инструментария, посуды, белья инфицированных больных. Их применяют для обеззараживания выделений больных брюшным тифом, паратифом, холерой и другими опасными кишечными заболеваниями — 1—3%. Для обработки выделений при капельных инфекциях (дифтерия, скарлатина) применяют 1—3% растворы, а при туберкулезной инфекции — 5% раствор хлорамина. Выпускают хлорамин Б в виде порошка в пакетах или хорошо укупоренных банках. ПАНТОЦИД (Pantocidum) — препарат хлора, содержащий не менее 50% его в активном состоянии. Препарат предназначен в основном для обеззараживания воды, но иногда его используют в виде растворов для обработки рук — 1 — 1,5%, ран и спринцеваний — 0,1—0,5%. Для обеззараживания 500—750 мл воды в нее помещают 1 таблетку препарата и выдерживают в течение 15 минут, после чего процеживают и используют по назначению. При такой обработке воды ее вкусовые качества не изменяются. Выпускают пантоцид в таблетках, содержащих кроме основного вещества безводный натрия карбонат и натрия хлорид, в упаковке по 20 штук. ХЛОРГЕКСИДИН (Chlorhexidinum) — активный антисептик, оказывающий сильное противомикробное действие на многие виды бактерий, возбудителей некоторых венерических и грибковых заболеваний. Используют растворы хлоргексидина для обработки рук, операционного поля, ран, ожогов, быстрой стерилизации хирургического инструментария, а также для промывания мочевого пузыря при цистите. Применяют хлоргексидин в виде 0,5% спиртового раствора, приготовляемого путем разведения стандартного 20% водного раствора в 70% этиловом спирте в соотношении 1: 40. Для промывания мочевого пузыря используют 0,02% стерильный водный раствор. Выпускают препарат в виде 20% водного раствора в баллонах по 5 л (для стационара) и 0,05% раствора во флаконах по 100 мл. ЙОД (Iodum) оказывает противомикробное действие, влияет на функции щитовидной железы и синтез ее гормонов (тироксин, трийодтиронин), жировой и белковый обмен. Наружно применяют 5% спиртовый раствор йода как антисептическое и раздражающее средство при обработке ран, операционного поля, лечения воспалительных заболеваний мышц и нервов (миозит, радикулит), а также как противогрибковое средство при кожных заболеваниях, вызванных патогенными грибами (лишай и т.д.). Для внутреннего применения йод используют в составе ряда лекарственных препаратов с целью лечения атеросклероза, эндемического зоба, гипертиреоза, воспалительных заболеваний дыхательных путей, при хроническом отравлении ртутью и свинцом. Спиртовый раствор йода может оказывать раздражающее действие на кожу и вызывать ожоги, частично всасываться и влиять на функции всего организма. У некоторых больных наблюдается повышенная чувствительность к йоду и его препаратам, часто выражающаяся в виде аллергических реакций (зуд, крапивница). Именно это качество йода служит противопоказанием к его применению. Выпускают 5% раствор йода спиртовой во флаконах по 10, 15 и 25 мл; в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 штук. ЙОДОНАТ (Iodonatum) — темно-коричневая жидкость, содержащая около 3% йода и представляющая собой водный раствор комплекса поверхностно-активного вещества и йода. Препарат обладает бактерицидным действием в

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	28стр. из 164	

отношении золотистого стафилококка, протей, синегнойной палочки и некоторых видов патогенных грибов. Используют йодонат только в стационаре в хирургической практике как заменитель раствора йода спиртового для обработки операционного поля в виде 1% раствора, для чего исходный препарат разводят стерильной или кипяченой дистиллированной водой в отношении 1:3. Этим раствором также обрабатывают края раны перед наложением швов, что препятствует развитию в них инфекций. Выпускают йодонат в бутылках оранжевого стекла объемом в 1 и 2 л. ЙОДИНОЛ (Iodinolum) — комплексный препарат йода пролонгированного действия. Кроме йода в него входят калия йодид, спирт поливиниловый и вода дистиллированная. Препарат предназначен для промывания небольших полостей и углублений при тонзиллите, для закапывания в ухо и промываний при гнойных отитах; при трофических и варикозных язвах, гнойных ранах, ожогах в виде повязок 1—2 раза в сутки. Выпускают йодиол во флаконах по 100 мл. Кроме указанных препаратов в качестве антисептических препаратов йода нередко используют йодоформ в виде присыпок и мазей для лечения инфицированных ран; раствор Люголя на глицерине для смазывания оболочек зева, глотки, гортани при их воспалении; йодпирон для обработки рук хирурга, операционного поля и лечения гнойных ран; йодовидон для лечения инфицированных ран и ожогов.

2. Окислители

Данную группу антисептиков представляют вещества, которые при контакте с тканями разлагаются с образованием атомарного или молекулярного кислорода. Выделяющийся кислород окисляет различные органические соединения, в том числе и белки протоплазмы микробных клеток, вызывая гибель микроорганизмов. Наиболее активное противомикробное действие оказывают вещества, при разложении которых образуется атомарный кислород. Основными представителями группы окислителей являются калия перманганат, перекись водорода, гидропирит и др. КАЛИЯ ПЕРМАНГНАТ (Kalii permanganas) — сильный окислитель, оказывает выраженное противомикробное действие, так как при разложении препарата выделяется атомарный кислород. Применяют калия перманганат как антисептическое и дезодорирующее средство. На кожу и слизистые оболочки препарат в зависимости от концентрации оказывает вяжущее, раздражающее или прижигающее действие. Как антисептическое средство калия перманганат используют наружно для ванночек, промывания ран в виде 0,1—0,5% водных растворов; для полоскания рта и горла, промывания уретры; для спринцевания в гинекологической практике применяют 0,01—0,1% растворы, а для обработки язвенных или ожоговых поверхностей употребляют 2—3% растворы препарата. В последнем случае калия перманганат оказывает не только антисептическое, но и вяжущее действие, способствуя образованию защитной пленки, предохраняющей поверхность ожога от раздражения, и снижению болевых ощущений. Нередко 0,02—0,1% растворы калия перманганата применяют для промывания желудка при острых отравлениях легкоокисляющимися алкалоидосодержащими препаратами (морфин, омнонон, кодеин), а также фосфором. Выпускают калия перманганат в порошке, который хранят в хорошо закрытой таре и в защищенном от света месте. РАСТВОР ПЕРЕКИСИ ВОДОРОДА (Solutio Hydrogeniiperoxydi diluta) оказывает более слабое противомикробное действие по сравнению с перманганатом калия. При контакте с тканями под влиянием содержащегося в них фермента каталазы перекись водорода разлагается с образованием молекулярного кислорода, уступающего по окисляющим свойствам атомарному кислороду. Интенсивное выделение молекулярного кислорода из раствора перекиси водорода при контакте его с тканями сопровождается образованием «пены», которая механически очищает раны от

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	29стр. из 164	

гноя, сгустков крови и вызывает свертывание крови при кровотечениях. Раствор перекиси водорода применяют в качестве антисептического средства при воспалительных заболеваниях слизистых оболочек полости рта, горла (стоматит, ангина), для остановки носовых кровотечений, для обработки и лечения гнойных и загрязненных ран. Выпускают препарат в виде раствора, содержащего около 3% перекиси водорода. Сохраняют раствор в защищенном от света месте. ГИДРОПЕРИТ (Hydroperitum) — таблетки, содержащие комплексное соединение перекиси водорода (35%) с мочевиной. Применяется наружно как дезинфицирующее и дезодорирующее средство в виде раствора при воспалительных заболеваниях слизистых оболочек, кожи, при некоторых гинекологических заболеваниях для спринцевания. Раствор готовят перед применением, для чего 1—2 таблетки разводят в половине стакана воды. Выпускают гидроперит в таблетках по 1,5 г в упаковке по 6 и 10 штук.

3. Кислоты и щелочи

Противомикробное действие кислот и щелочей связано с их способностью вызывать гидролиз белков и других органических соединений бактерий. Однако и в качестве антисептических средств могут быть использованы только те кислоты и щелочи, которые не вызывают раздражение и повреждение кожи. К числу таких препаратов относятся кислоты — салициловая, борная, бензойная и препараты, обладающие свойствами щелочей, — натрия тетраборат, натрия гидрокарбонат, раствор аммиака и др. КИСЛОТА САЛИЦИЛОВАЯ (Acidum salicylicum) применяется как антисептическое, раздражающее, отвлекающее и кератолитическое средство. Назначают кислоту салициловую в составе присыпок, 1—10% мазей, паст и спиртовых растворов для лечения различных поражений кожи. Кислота салициловая входит в состав мозольной жидкости, мозольного пластыря «Салипод», цинково-салициловой пасты, пасты Теймурова, пасты Лассара и др. Выпускают салициловую кислоту в порошке и в составе различных паст по 25, 50 и 100 г.

КИСЛОТА БОРНАЯ (Acidum boricum) — антисептическое и фунгицидное средство в виде водных и спиртовых растворов, присыпок, мазей и паст. Промывают глаза 2% водным раствором, а 3% раствором лечат мокнущие экземы и дерматиты. Довольно часто 0,5—3% спиртовые растворы борной кислоты применяют как капли в ухо при остром или хроническом отите. Борная кислота проникает через кожу, слизистые и оказывает побочные эффекты в виде тошноты, рвоты, головной боли, спутанности сознания и даже судорог. Применение борной кислоты противопоказано детям (!), а также беременным женщинам, кормящим матерям для обработки молочных желез и лицам с индивидуальной непереносимостью препарата. Выпускают борную кислоту в порошке, в виде 3% спиртового раствора во флаконах по 10 мл, а также в форме 5% мази. Список Б. РАСТВОР АММИАКА (Solutio Ammonii caustici) — прозрачная с характерным запахом жидкость, оказывающая выраженное антисептическое действие. Раствор аммиака обладает хорошими моющими свойствами и иногда применяется для мытья рук медицинского персонала по методу С.И. Спасокукоцкого и И.Г. Кочергина перед операциями. Его используют для мытья загрязненной посуды, стекол и как средство, возбуждающее дыхание при обмороках. Выпускают раствор аммиака 10% концентрации во флаконах по 10, 40 и 100 мл, а также в ампулах по 1 мл.

4. Альдегиды и спирты

Альдегиды оказывают противомикробное действие за счет их способности дегидратировать (обезвоживать) белок протоплазмы клетки, свертывать белок и вызывать гибель микроорганизмов. К числу препаратов этой группы относятся формальдегид, лизоформ, гексаметилентетрамин, циминаль, цимизоль, формидрон и др. ФОРМАЛИН

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	30стр. из 164	

(Formalinum) — 40% раствор формальдегида в воде, уничтожает бактерии, вирусы, грибки и их споры, применяется для лечения карбункулов сибирской язвы на коже. При действии на кожу и слизистые оболочки проявляет дубящий эффект, т.е. уплотняет их. Раствор формальдегида можно использовать как дезинфицирующее, антисептическое и дезодорирующее средство при обработке белья, посуды, инструментария, для мытья рук и протирания кожи ног при их потливости (0,5—1%). Он широко используется для консервации анатомических препаратов, входит в состав препаратов «Лизоформ», «Формидрон» и формалиновой мази. Сохраняют формалин в хорошо закупоренных склянках в защищенном от света месте. Медицинская практика в качестве антисептического средства использует чаще всего **ЭТИЛОВЫЙ СПИРТ** (Spiritus aethylicus). Другие, хотя и называются спиртами, например спирт камфорный, спирт салициловый и др., представляют собой растворы этих веществ в этиловом спирте. Спирт этиловый оказывает дегидратирующее действие на белки клеточной протоплазмы микроорганизмов, свертывает их (денатурация), вызывая гибель бактерий. Спирт этиловый 40% оказывает на микроорганизмы бактериостатическое действие, проявляя одновременно раздражающий и согревающий эффект, поэтому широко применяется для компрессов и растираний и профилактики пролежней. Спирт этиловый 70% используют для обработки рук хирурга, операционного поля, места для инъекции, приготовления большинства настоек и т.д. Спирт этиловый 95% служит средством для обработки рук хирурга и обеззараживания хирургического инструментария. Спирт этиловый и все лекарственные спиртосодержащие формы должны отпускаться из аптеки по рецепту врача.

5. Фенолы, дегти и синтетические бальзамы

К данной группе антисептических средств относятся фенол, трикрезол, резорцин, ваготил, деготь березовый, ихтиол, фенолсалицилат и др. **ФЕНОЛ** (Phenolum) обладает сильным бактерицидным действием в отношении вегетативных форм микроорганизмов. Сегодня для медицинских целей используют фенол, но применяют редко из-за возможных побочных эффектов. На кожу и слизистые он оказывает раздражающее и прижигающее действие, но для обработки тела почти не используется, так как легко всасывается и оказывает токсическое действие на весь организм, проявляющееся в виде головокружения, общей слабости, коллапса, расстройства дыхания, изменений в составе крови и т.д. При попадании концентрированных растворов фенола на кожу ее необходимо обработать спиртом.

РЕЗОРЦИН (Resorcium) применяют при кожных заболеваниях (экзема, себорея, зуд, поражения грибками) наружно в виде 2—5% водных или спиртовых растворов, а также в форме 5, 10 и 20% мази. **ДЕГОТЬ БЕРЕЗОВЫЙ** (Pix liquida Betulae) — продукт сухой перегонки коры березы. Представляет собой черную маслянистую жидкость с характерным запахом. В состав дегтя входят фенол, ксилол, толуол, смолы и другие вещества, обладающие дезинфицирующим, антисептическим, инсектицидным и местнораздражающим действием. При нанесении дегтя и его препаратов на кожу улучшается ее кровоснабжение, регенерация тканей, активизируется процесс их ороговения. Самостоятельно деготь почти не используется, но он входит в состав многих лекарственных препаратов, применяемых для лечения экзем, псориаза, чешуйчатого лишая, трихофитии, грибковых и других поражений кожи. Примером служит мазь Вилькинсона (Ungentum Wilkinsoni), применяемая для лечения грибковых поражений кожи и чесотки, и линимент бальзамический по А.В. Вишневскому (Linimentum balsamicum Vishnevsky) для лечения ран, язв, пролежней. При длительном применении дегтя и содержащих его препаратов возможно раздражение кожи. **ИХТИОЛ** (Ichthyolum) — черная сиропобразная жидкость с характерным запахом, обладающая противомикробным, противовоспалительным и

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	31стр. из 164

местнообезболивающим действием. Используют ихтиол в составе мазей, паст, водно-спиртовых и глицериновых растворов, а также в форме вагинальных и ректальных суппозиториях. Применяют ихтиол для лечения ожогов, рожистого воспаления, экземы, невралгий, артритов и других заболеваний, его растворы рекомендуют использовать в виде примочек и втираний. При воспалении органов малого таза назначают суппозитории с ихтиолом. Выпускают ихтиол в виде 10 и 20% мази и суппозиториях, содержащих 0,2 г препарата, в упаковке по 10 штук.

6. Красители

Эти препараты оказывают противомикробное действие в отношении грамположительных бактерий и кокков. Их невысокая токсичность позволяет принимать некоторые из них внутрь, но все же большей частью они используются наружно для лечения различных воспалительных и гнойных заболеваний кожи и слизистых оболочек.

БРИЛЛИАНТОВЫЙ ЗЕЛЕНЫЙ (Viride nitens) — наиболее активный ам неси гпк из числа красителей. Его водные и спиртовые растворы применяют! наружно для обработки ссадин, царапин, операционных шипи, ран, лечения гнойничковых поражений кожи (пиодермия), елн палых оболочек, блефарита (инфекционное поражение век) и т.д. Медицинская практика чаще всего использует 1 и 2% водные п спиртовые растворы. Единственным недостатком бриллиантового зеленого является его способность на длительное время окрашивать ткани, что объясняется более глубоким проникновением препарата через кожу по сравнению, например, со спиртовым раствором йода, поэтому раствор бриллиантового зеленого более предпочтителен при обработке послеоперационных швов. Выпускают бриллиантовый зеленый в порошке и в виде 1 и 2% спиртовых растворов (Solutio Viridis nitentis spirituosa) во флаконах по 10 мл. **МЕТИЛЕНОВЫЙ СИНИЙ (Methylenum coeruleum)** по противомикробной активности несколько уступает бриллиантовому зеленому. Применяют 1—3% спиртовые растворы в качестве антисептического средства при ожогах, пиодермии, фолликулитах и т.д. Водные 0,02% растворы используют для промывания полостей, для лечения цистита, уретрита и т.д. Метиленовый синий иногда назначают внутрь по 0,1 г до 4 раз в день при воспалительных заболеваниях мочевыводящих путей. При этом, выделяясь с мочой, препарат окрашивает ее в синий цвет, что используют иногда для исследования функций почек. Метиленовый синий представляет интерес и как антидот при отравлениях цианидами, нитритами, окисью углерода, сероводородом. В этих случаях препарат проявляет свои окислительно- восстановительные свойства, способствуя разрушению яда. При отравлениях 1 % растворы метиленового синего вводят внутривенно. Выпускают метиленовый синий в форме порошка, в виде 1% водного и спиртового растворов и ампул, содержащих по 20 и 50 мл 1% раствора метиленового синего в 25% растворе глюкозы. **ЭТАКРИДИНА ЛАКТАТ (Aethacridini lactas)** используют в виде свежеприготовленного раствора в соотношении 1 : 500 и 1 : 1000. Применяют препарат как наружное профилактическое и лечебное антисептическое средство в хирургической, гинекологической, урологической, офтальмологической, дерматологической практике. Его назначают для промывания плевральной, брюшной полостей, при гнойном артрите или цистите. При воспалительных заболеваниях слизистых оболочек рта, зева, носа назначают полоскания и обрабатывают их 0,1% раствором, а при поражениях кожи используют этакри- дина лактат в форме присыпок, мазей и паст. Выпускают этакридина лактат в порошке, таблетках, содержащих 0,01 г препарата и кислоты борной 0,09 г, в упаковке по 50 штук.

7. Детергенты

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	32стр. из 164	

Детергенты — это вещества, обладающие высокой поверхностной активностью, моющим, противомикробным и смягчительным действием. Противомикробное действие детергентов объясняется изменением под их влиянием проницаемости клеточных мембран бактерий и нарушением их нормальной жизнедеятельности. Изменение транспорта необходимых микроорганизмам веществ через клеточную оболочку приводит к их гибели. Если к детергенту добавить воду, поверхностное натяжение последней изменяется и вследствие этого кожа, поверхность предметов, инструментария очищается от жира, гноя, крови, инородных частиц. Таким образом проявляется моющее действие детергентов. После удаления с кожи защитной жировой пленки она сохнет, сморщивается и образует трещины. Чтобы этого не произошло, в детергенты добавляют смягчительные вещества (глицериды), позволяющие после обработки кожи предупредить ее высыхание и сохранить эластичность. Применяют детергенты для обработки рук медицинского персонала перед и после выполнения манипуляций, хирургических операций, для обработки раневых поверхностей, предметов ухода за больными и т.д. К детергентам относят препараты «Церигель», «Дегмицид», «Димексид», «Этоний», мыло «Зеленое» и др.

8. Соли тяжелых металлов

Соли тяжелых металлов как антисептические средства представлены препаратами ртути, серебра, меди, цинка, свинца и др. Противомикробное действие солей тяжелых металлов обусловлено способностью блокировать сульфгидрильные (-SH) группы белков и ферментов, необходимых для жизнедеятельности микроорганизмов.

Инактивация их происходит путем замещения иона водорода в сульфгидрильной группе на катион металла (-SH → -SAg), вследствие чего наступает гибель микробной клетки. На кожу и слизистые данные препараты оказывают выраженное местное действие, которое в зависимости от концентрации и еще ряда факторов может быть вяжущим, противомикробным или прижигающим. Механизм местного действия солей тяжелых металлов основан на их способности вступать в реакцию с белками тканей и денатурировать (свертывать) последние. При вяжущем действии солей тяжелых металлов реакция их с белками тканей обратима и затрагивает лишь поверхностные слои кожи и слизистых оболочек. После окончания действия препарата функции белка восстанавливаются полностью. В случае прижигающего действия реакция солей тяжелых металлов с белками тканей необратима и сопровождается их гибелью. В качестве антисептических средств препараты солей тяжелых металлов (в зависимости от их токсичности и других свойств) используются для обработки предметов ухода за больными, лечения эрозий, язв, ушибов, воспалительных заболеваний кожи и слизистых оболочек. Но их не используют для обеззараживания выделений инфекционных больных, так как наличие в выделениях большого количества белка (гной, кровь, мокрота) резко снижает противомикробный эффект солей тяжелых металлов.

8.1. Препараты серебра Противомикробное действие ионов серебра известно давно. Как антисептическое средство медицинская практика использует чаще всего серебра нитрат в различных концентрациях и лекарственных формах, протаргол, серебряную соль сульфазина и др. СЕРЕБРА НИТРАТ (Argentī nitras) в зависимости от концентрации обладает вяжущим, противовоспалительным и прижигающим действием. Используют растворы серебра для лечения ран, трещин, эрозий, конъюнктивита, трахомы, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Для лечения воспалительных заболеваний слизистых оболочек в качестве антисептического и вяжущего средства применяют 0,25—2% растворы серебра нитрата. В качестве прижигающего средства, например при трещинах сосков у кормящих матерей, используют 5—10% растворы, а для лечения язв, ран

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	33стр. из 164

применяют иногда 1—2% мазь. Для прижигания бородавок, трещин, ран иногда используют ляписный карандаш (*Stilius Lapidis*). Хранят серебра нитрат в хорошо закрытых склянках темного стекла в защищенном от света месте. Список А. ПРОТАРГОЛ (*Protargolum*) — коричневатый порошок слабогорького вкуса, легко растворимый в воде и обладающий антисептическим, вяжущим и противовоспалительным действием. Применяют растворы протаргола для смазывания слизистых оболочек верхних дыхательных путей — 1—5%, для промывания мочеиспускательного канала и мочевого пузыря — 1—3%, при гнойном хроническом уретрите. В глазной практике — 1—3% растворы протаргола используют в виде глазных капель для лечения конъюнктивита, блефарита, бленореи. Выпускают протаргол в виде порошка. СЕРЕБРЯНАЯ СОЛЬ СУЛЬФАЗИНА применяется в составе мази «Сульфаргин» для лечения гнойных и длительно незаживающих ран, ожогов, язв и пролежней.

8.2. Препараты цинка Цинк как микроэлемент содержится в различных органах и тканях и играет важную роль в ряде функций организма. Например, при его участии синтезируются некоторые ферменты, гормоны (инсулин, кортикотропин). При его недостатке возможно развитие заболеваний желудочно-кишечного тракта, почек, печени (цирроз), крови, кожи, ослабление иммунитета, нарушается рост волос и т.д. Препараты цинка широко используются для лечения заболеваний кожи, волос, а также в составе комбинированных поливитаминных препаратов. ЦИНКА СУЛЬФАТ (*Zinci sulfas*) используется как антисептическое и вяжущее средство в виде растворов при воспалительных заболеваниях глаз (конъюнктивит), гортани (ларингит) и мочеиспускательного канала (уретрит). С этой целью применяют 0,1—0,5% растворы цинка сульфата. Выпускают цинка сульфат в порошке, в виде глазных капель (0,25 и 0,5% растворов цинка сульфата и борной кислоты 2%) во флаконах по 10 мл и в тубиках-капельницах по 1,5 мл. ЦИНКА ОКИСЬ (*Zinci oxidum*) — порошок, практически нерастворим в воде. Применяют цинка окись в составе мазей, паст, линиментов, присыпок как вяжущее, подсушивающее, антисептическое и дезинфицирующее средство для лечения дерматитов, язв, опрелостей и других заболеваний. Цинка окись входит в состав цинковой мази, пасты цинковой, пасты цинково-салициловой, пасты цинково-ихтиоловой и других лекарственных препаратов, предназначенных для наружного применения. Выпускают цинка окись в порошке.

Отравление солями тяжелых металлов и помощь при отравлениях Соли тяжелых металлов относятся к числу довольно токсичных средств и поэтому нередко вызывают отравления. Хронические отравления возникают вследствие постепенного накопления их в организме, а острые — при попадании внутрь больших доз препаратов. Картина отравления солями тяжелых металлов в общих чертах сходна, однако наибольшую опасность и частоту отравлений представляют соли ртути (ртути дихлорид), которые легко диссоциируют и всасываются в желудочно-кишечном тракте. При отравлениях солями тяжелых металлов они оказывают как местное, так и резорбтивное действие на организм. Местное действие (раздражающее и прижигающее) проявляется в виде тошноты, рвоты, чувства жжения, обильного слюноотделения, острых болей с возможным развитием шока. Общее действие характеризуется изменениями со стороны центральной нервной системы и выражается вначале в виде возбуждения, возможного развития судорог, нарушения функций печени, почек и работы сердца. При отравлениях солями ртути поражаются слизистые оболочки и у пострадавшего развивается стоматит, язвенный колит, поражение почек, нарушается процесс мочеобразования и мочевыделения. Помощь при остром отравлении солями тяжелых металлов состоит из целого комплекса мероприятий. Сначала следует принять меры к удалению и предупреждению дальнейшего всасывания яда из желудочно-

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	34стр. из 164

кишечного тракта. Необходимо внутрь дать молоко, яичный белок (белки связывают яд), а затем осторожно промыть желудок водой с активированным углем. После этого внутрь назначить быстродействующее слабительное (магния сульфат). Для обезвреживания яда, находящегося в крови, и с целью предупреждения развития резорбтивного эффекта необходимо как можно быстрее осуществить парентеральное введение противоядий. Унитиол вводят по 5—10 мл внутримышечно или под кожу в виде 5% раствора несколько раз в день. Продолжительность введения Унитиола зависит от скорости выведения ядовитых веществ из организма. Кроме этих мероприятий при отравлениях солями тяжелых металлов используют симптоматическую терапию: для устранения боли вводят омнопон или промедол с целью предупреждения шока, повышают артериальное давление с помощью мезатона или эфедрина и улучшают деятельность желудочно-кишечного тракта.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Дайте фармакологическую характеристику указанным ниже препаратам: бриллиантовый зеленый, спиртовой раствор йода, ртуть двухлористая, гидроперит, кислота борная, формалин. После выполнения заданий сравните свои ответы с материалами темы, дайте им оценку и сделайте заключение о качестве усвоения изученной темы.

1. Тема. Антибиотики.

2. **Цель.** При изучении первого раздела химиотерапевтических средств следует обратить особое внимание на следующее.

1. Классификация химиотерапевтических средств.
2. Основные правила (принципы) химиотерапии.
3. Классификация антибиотиков.
4. Характеристика отдельных групп антибиотиков и спектр их действия.
5. Особенности действия и применения антибиотиков.
6. Побочные эффекты антибиотиков и возможные пути их устранения.
7. Особенности классификации и действия сульфаниламидных средств.
8. Особенности действия и применения производных нитрофурана.
9. Особенности действия и применения производных 8-оксихинолина.
10. Особенности действия и применения производных хинолона.

3. Тезисы лекции.

Сущность антибиота (anti — против, bios — жизнь), под которым понимают антагонизм между микроорганизмами, заключается в том, что одни из них уничтожают другие с помощью вырабатываемых и выделяемых ими специфических веществ, получивших название «антибиотики». Основными источниками получения антибиотиков являются микроорганизмы и низшие грибы, но современная медицинская промышленность получает также антибиотики синтетическим и полусинтетическим путем. Большой вклад в развитие учения об антибиозе внесли выдающиеся микробиологи Л. Пастер, И.И. Мечников и другие исследователи. Но широкое использование антибиотиков в медицинской практике стало возможным после открытия и получения пенициллина и его препаратов. Сегодня известно большое количество антибиотиков, которые принято классифицировать по сходной химической структуре, свойствам или по спектру противомикробного действия. В первом случае среди антибиотиков различают группы пенициллина, цефалоспоринов, аминогликозиды, тетрациклины, макролиды и др. По спектру противомикробного действия антибиотики делят: 1) на антибиотики, действующие преимущественно на грамположительные микроорганизмы. К этой группе относятся пенициллины, эритромицин,

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	35стр. из 164	

линкомицин и др.; 2) антибиотики широкого спектра действия, т.е. действующие на грамположительную и грамотрицательную микрофлору. Эту группу представляют тетрациклины, цефалоспорины, некоторые аминогликозиды и др.; 3) противогрибковые антибиотики: нистатин, леворин, гризеофульвин и др.

1.1. Препараты группы пенициллина Впервые пенициллин был открыт в 1928 г. А. Флемингом, а в чистом виде его получили Г. Флори и Э. Чейн в 1940 г. В нашей стране заслуга получения пенициллина, разработка его препаратов и внедрения их в медицинскую практику принадлежит З.В. Ермольевой и Т.И. Балезиной. Пенициллины относятся к группе бета-лактамовых антибиотиков и делятся на природные пенициллины и их полусинтетические и синтетические аналоги. Основными источниками получения природных пенициллинов являются различные виды зеленой плесени пенициллиума. Получаемые таким образом пенициллины отличаются друг от друга по своим свойствам и противомикробной активности. Наиболее широкое практическое применение из них получили бензилпенициллин и его соли. Последние обладают почти одинаковым спектром противомикробного действия и подавляют жизнедеятельность стафилококков, стрептококков, пневмококков, менингококков, гонококков, а также возбудителей особо опасных инфекций — сибирской язвы, дифтерии, газовой гангрены и сифилиса. Механизм противомикробного действия пенициллинов объясняют их способностью нарушать биосинтез клеточной стенки микроорганизмов, находящихся в фазе роста и деления. В качестве лекарственных средств природных пенициллинов используют соли бензилпенициллина, предназначенные для парентерального введения, потому что они при приеме внутрь разрушаются хлористоводородной кислотой желудка. Основными препаратами бензилпенициллина являются его натриевая и калиевая соли, новокаиновая соль и бициллины. Они отличаются неодинаковой способностью растворяться в воде и продолжительность действия. Натриевая и калиевая соли бензилпенициллина хорошо растворимы в воде, быстро всасываются, действуют, по эффект их продолжается 4—6 часов, поэтому их относят к препаратам короткого действия. Новокаиновая соль бензилпенициллина и бициллины плохо растворимы в воде, медленнее всасываются, но действие их после однократного введения продолжается от 8—12 часов до 7—14 и более суток, вследствие чего их относят к препаратам длительного действия.

Один из немногих пенициллинов в этой группе — феноксиметилпенициллин — является кислотоустойчивым и может применяться внутрь независимо от кислотности желудочного сока. Широкое применение в настоящее время получили полусинтетические пенициллины: ампициллин, оксациллин, карбенициллин и др. **БЕНЗИЛПЕНИЦИЛЛИНА НАТРИЕВАЯ СОЛЬ** (Benzylpenicillinum-natrium) — один из наиболее применяемых антибиотиков группы пенициллина. Его используют для лечения гнойных поражений кожи, слизистых оболочек, раневых инфекций, флегмон, абсцессов, плеврита, сепсиса, очаговой и крупозной пневмонии, бронхита, дифтерии, сифилиса, гонореи, рожистого воспаления и целого ряда других воспалительных и инфекционных заболеваний, вызванных чувствительными к бензилпенициллину микроорганизмами. Бензилпенициллина натриевую соль в виде раствора вводят в мышцу, приготовляя препарат непосредственно перед введением (ex tempore), а в качестве растворителя используют чаще всего воду для инъекций или 0,5% раствор новокаина. Раствор бензилпенициллина в новокаине иногда мутнеет уже в шприце вследствие образования новокаиновой соли препарата, которая плохо растворима в воде, но это обстоятельство не препятствует внутримышечному введению препарата и даже обеспечивает более продолжительное его действие — до 6 часов, поэтому в таком виде его вводят до 4 раз в сутки. В тяжелых случаях при плеврите,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	36стр. из 164

перитоните, артрите натриевую соль бензилпенициллина вводят в плевральную, брюшную и другие полости или в суставные сумки, а при заболеваниях органов дыхания ее порошок используют в форме аэрозоля. Среди побочных эффектов бензилпенициллина отмечают иногда вызываемые им аллергические реакции в виде крапивницы, озноба, головной боли, отека Квинке, затрудненное дыхание, а в редких случаях анафилактический шок. Выпускают бензилпенициллина натриевую соль во флаконах в виде стерильного порошка по 250.000 ЕД, 500.000 ЕД и 1.000.000 ЕД. **БЕНЗИЛПЕНИЦИЛЛИНА КАЛИЕВАЯ СОЛЬ** (Benzylpenicilium- kalium) по свойствам близка к натриевой соли, отличаясь лишь тем, что в вену ее не вводят, а применяют внутримышечно и наружно в виде мази, глазных капель или в форме аэрозоля. Возможные осложнения, противопоказания, формы выпуска аналогичны натриевой соли бензилпенициллина. **БЕНЗИЛПЕНИЦИЛЛИНА НОВОКАИНОВАЯ СОЛЬ** (Benzyl- penicillinum-novocainum) в отличие от других пенициллинов плохо растворима в воде, медленно всасывается, но при введении в мышцу оказывает более продолжительное действие, так как при разведении образует суспензию. **БИЦИЛЛИН-1** (Bicillinum) — препарат бензилпенициллина пролонгированного действия, с водой образует суспензию, а при введении в мышцу создает депо препарата в организме в течение длительного времени. Показаниями к применению препарата служат заболевания, вызванные чувствительными к бензилпенициллину микроорганизмами, а также лечение и профилактика гонореи, сифилиса и ревматизма. Вводят Бициллин-1 в мышцу в форме суспензии, приготовляемой непосредственно перед употреблением, по 300.000 ЕД и 600.000 ЕД 1 раз в неделю и по 1.200.000 ЕД 1 раз в 2 недели. Бициллин-1, как и другие пенициллины, может вызывать аллергические реакции у пациентов с повышенной индивидуальной чувствительностью к препаратам этой группы. Следует учитывать и тот факт, что после инъекции препарата некоторое время возможна болезненность в месте введения. Выпускают препарат во флаконах для инъекций по 300.000 ЕД, 600.000 ЕД и 1.200.000 ЕД. **БИЦИЛЛИН-5** (Bicillinum-5) содержит смесь Бициллина-1 и бензилпенициллина новокаиновой соли в соотношении 4:1. Препарат пролонгированного действия для введения в мышцу, основным показанием к применению которого является круглогодичная профилактика рецидивов ревматизма. В этом случае препарат вводят в мышцу по 1.500.000 ЕД 1 раз в месяц. Выпускают Бициллин-5 по 1.500.000 ЕД в комплексе с растворителем в ампулах по 5 мл. **Список Б. ФЕНОКСИМЕТИЛПЕНИЦИЛЛИН** (Phenoxymethylpenicillinum) по противомикробному действию аналогичен другим препаратам пенициллина. Он хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, малотоксичен и не кумулирует. Применяют препарат в таблетках по 0,1 и 0,25 г за 30—60 минут до еды 4—6 раз в день. Выпускают его в таблетках по 0,1 и 0,25 г в упаковке по 10 штук. Все природные пенициллины имеют один серьезный недостаток — они легко разрушаются ферментом пенициллиназой, поэтому неэффективны при заболеваниях, вызываемых пенициллиназообразующими формами микроорганизмов. Полусинтетические пенициллины в отличие от солей бензилпенициллина не разрушаются в кислой среде желудка, устойчивы к пенициллиназе, имеют более широкий спектр противомикробного действия, влияют не только на грамположительные, но и на грамотрицательные формы патогенных микробов. К полусинтетическим пенициллинам относятся ампициллин, оксациллин, карбенециллин, азлоциллин и др. **АМПИЦИЛЛИНА ТРИГИДРАТ** (Ampicillini trihydraz) — препарат широкого спектра действия, не разрушается хлористоводородной кислотой желудка и хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Его применяют для лечения воспалительных заболеваний органов дыхания, брюшной полости, вызванных палочкой брюшного тифа, сальмонеллами,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казakhstanская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	37стр. из 164

гонококками, протеем и др. В организме он накапливается в желчи, моче, поэтому его используют для лечения инфекционных заболеваний желче- и мочевыводящих путей. Выпускают препарат в таблетках и капсулах по 0,25 г в упаковке по 10 штук. АМПИЦИЛЛИНА НАТРИЕВАЯ СОЛЬ (Ampicillinum-natrium) подобна своему аналогу, но выпускается в виде стерильного порошка для внутримышечных инъекций. Препарат быстро всасывается в кровь, проникает в ткани, где оказывает противомикробное действие, не кумулирует и малотоксичен. Выпускают данную форму ампициллина во флаконах для инъекций по 0,25 и 0,5 г. Растворы ампициллина натриевой соли готовят непосредственно перед введением! ОКСАЦИЛЛИНА НАТРИЕВАЯ СОЛЬ (Oxacillinum-natrium) эффективна в отношении многих микроорганизмов, чувствительных к препаратам группы пенициллина, и даже к тем, которые устойчивы к феноксиметилпенициллину. Используют оксациллина натриевую соль так же, как и ампициллины. Выпускают препарат в таблетках по 0,25 г, в капсулах по 0,25 и 0,5 г и во флаконах для инъекций по 0,25 и 0,5 г, иногда в комплексе с растворителем. Комплексный препарат, содержащий натриевые соли ампициллина и оксациллина в соотношении 2:1, называется «Ампиокс». Его выпускают в капсулах по 0,25 г для приема внутрь и для инъекций во флаконах по 0,1; 0,2 и 0,5 г. АМОКСИЦИЛЛИН (Amoxicillinum) — новый полусинтетический кислотоустойчивый антибиотик группы пенициллина, обладающий широким противомикробным спектром действия. Препарат нарушает синтез белка клеточной стенки возбудителя в период его роста и развития. Действие его начинается через 15—30 минут после применения и продолжается до 8 часов. Амоксициллин используют для лечения инфекций дыхательных путей (пневмония, бронхит, тонзиллит), мочеполовой системы (цистит, гонорея, эндометрит), желудочно-кишечного тракта (дизентерия, холецистит, перитонит), при инфекциях кожи и мягких тканей (рожа, дерматозы), болезни Лайма, менингита, сепсиса и др. Назначают амоксициллин взрослым в таблетках по 0,5 г 3 раза в день, а при острых инфекциях дозы препарата увеличивают в 1,5—2 раза. Среди побочных эффектов при приеме препарата возможны аллергические реакции, дисбактериоз, тошнота, общее возбуждение, бессонница и др. Не следует использовать препарат при гиперчувствительности организма к нему: аллергическом диатезе, бронхиальной астме, недостаточной функции печени и во время грудного вскармливания. Выпускают амоксициллин в таблетках по 0,25 и 0,5 г № 10 и № 20. Список Б.

1.2. Препараты группы цефалоспорины К цефалоспорином относится группа природных антибиотиков и их полусинтетических аналогов, имеющих по химической структуре некоторое сходство с пенициллинами и относящихся также к группе бета-лактамовых антибиотиков. Но от пенициллинов их отличает более широкий спектр противомикробного действия и устойчивость к пенициллиназе. Цефалоспорины губительно действуют на грамположительные и грамотрицательные микроорганизмы, в том числе и на пенициллиназообразующие, устойчивые к бензилпенициллину. Подобно пенициллинам, цефалоспорины оказывают бактерицидное действие, связанное с их способностью снижать активность некоторых компонентов клеточной оболочки, нарушая ее структуру, что приводит к гибели возбудителей заболеваний, находящихся в стадии размножения. Применяют цефалоспорины для лечения острых и хронических заболеваний органов дыхания, различных инфекций мочевыводящих путей, половых органов, при заболеваниях, вызванных кишечной палочкой, протеем, диплококками и другими патогенными микроорганизмами. Сегодня используют четыре поколения цефалоспоринов. Все они отличаются высокой химиотерапевтической активностью, но неодинаковы по скорости всасывания в желудочно-кишечном тракте, путям введения, широте противомикробного

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	38стр. из 164	

действия, устойчивости к действию бета-лактамазы — ферменту, инактивирующему цефалоспорины. Представителями первого поколения цефалоспоринов являются цефалоридин, цефалексин; второго — цефуроксим, цефокситин; третьего — цефотаксим, цефоперазон; четвертого — цефепин, цефокситин, цефотетан и др. **ЦЕФАЛОРИДИН (Cefaloridinum)** — полусинтетический антибиотик первого поколения, активен в отношении всех видов кокков, возбудителей сибирской язвы, сифилиса, гонореи и других патогенных микроорганизмов, устойчивых к бензилпеницилину. Вводят цефалоридин в мышцу, а при тяжелых формах инфекционных заболеваний — внутривенно. Растворы его готовят непосредственно перед введением. Цефалоридин противопоказан лицам с повышенной чувствительностью к препаратам этой группы. Не рекомендуют применять цефалоридин в первые три месяца беременности. Выпускают цефалоридин во флаконах по 0,2; 0,5 и 1 г. Список Б. **ЦЕФАЛЕКСИН (Cefalexinum)** отличается от цефалоридина устойчивостью в кислой среде и предназначен для приема внутрь. Его применяют при гнойно-септических заболеваниях различной локализации, для лечения цистита, пиелонефрита, при инфекциях верхних дыхательных путей, остром и хроническом остеомиелите, гонорее и других заболеваниях. Назначают цефалексин внутрь по 0,25 г на прием независимо от приема пищи до 4 раз в сутки. Выпускают препарат в капсулах по 0,25 г и в таблетках по 0,5 г. Список Б. Цефалоспорины второго поколения отличаются от рассмотренных выше тем, что обладают более сильным действием на грамотрицательные микроорганизмы. Они лучше проникают через клеточную оболочку возбудителя заболевания, вызывают их гибель, а сами проявляют большую устойчивость к ферментам, разрушающим их. **ЦЕФУРОКСИМ (Cefuroxim)** оказывает бактерицидное действие вследствие нарушения синтеза клеточной оболочки микроорганизма, обладает широким спектром противомикробного действия, но особенно активен в отношении многих кокков и грамотрицательных бактерий (кишечная палочка, сальмонеллы, энтеробактерии и др.). Препарат устойчив к действию бета-лактамазы. Цефуроксим применяют при инфекционно-воспалительных заболеваниях дыхательных путей (пневмония, бронхит), уха, горла и носа (синусит, тонзиллит), инфекциях мочевыводящих путей (цистит, пиелонефрит), инфекциях мягких тканей (целлюлит, рожистое воспаление) и т.д. Вводят препарат взрослым по 0,75 г в мышцу или в вену 3—4 раза в сутки при наличии грамположительных возбудителей и по 1,5 г 3—4 раза в сутки при заболеваниях, вызванных грамотрицательными микроорганизмами. Препарат может вызывать аллергические реакции и другие побочные эффекты. Выпускают цефуроксим во флаконах для инъекций по 0,75 г. Список Б. Цефалоспорины третьего поколения отличаются от других препаратов более высокой активностью в отношении энтеробактерий, но слабее действуют на грамположительных возбудителей и особенно стафилококков. **ЦЕФОТАКСИМ (Cefotaxim)** по химической структуре близок к препаратам первого и второго поколения, обладает широким спектром действия и более продолжительным эффектом. Вводят препарат в мышцу и в вену, так как в желудочно-кишечном тракте он не всасывается. После однократного введения бактерицидная концентрация его сохраняется более 12 часов. Используют цефотаксим при инфекциях дыхательных и мочевыводящих путей, инфекциях уха, горла и носа, менингите, эндокардите, инфекциях костной ткани и брюшной полости. При введении цефотаксима возможны аллергические реакции, повышение температуры, лейкопения, а в месте инъекции — раздражение. Выпускают цефотаксим во флаконах по 0,5; 1 и 2 г для инъекций. **ЦЕФОБИД (Cefobid)** — полусинтетический антибиотик, представляющий собой натриевую соль цефоперазона, обладающего широким спектром противомикробного действия. Он применяется в тех же случаях, что и цефотаксим, а также при инфекциях

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	39стр. из 164	

кожных покровов, заболеваниях органов таза, при перитоните, холецистите и других заболеваниях. Выделяется преимущественно с желчью, поэтому рекомендован для лечения воспалительных заболеваний желчевыводящих путей. Вводят Цефобид в мышцу или в вену по 1—2 г, реже по 2—4 г, разделяя эти дозы на равные части, которые используют каждые 12 часов. Во время лечения Цефобидом возможны потливость, прилив крови к лицу, головная боль и аллергические реакции.

Выпускают Цефобид во флаконах, содержащих 1 г натриевой соли цефоперазона для инъекций. ЦЕФСАН (Cefspan) — полусинтетический антибиотик для перорального применения. Обладает широким спектром противомикробного действия, нарушает синтез некоторых компонентов клеточных оболочек возбудителей заболеваний. Применяют Цефспан при заболеваниях верхних дыхательных путей, отитах, неосложненных инфекциях мочевыводящих путей и шейки матки. Назначают препарат в капсулах по 0,4 г 1 раз в сутки или по 0,2 г 2 раза в сутки. Выпускают Цефспан в капсулах по 0,4 г № 6 и в виде порошка для приготовления суспензии по 1,2 г для приема внутрь. Представителями цефалоспоринов четвертого поколения являются Максипим, Цефпирон, Цефотитан и др. Они отличаются от других цефалоспоринов высокой противомикробной активностью в отношении бактериоидов (грамотрицательных, чаще неподвижных, анаэробных палочковидных бактерий), часто присутствующих в полости рта, зубном налете, в желудочно-кишечном тракте и мочеполовых путях. ЦЕФЕПИМ (Cefepim), синоним: Максипим, обладает широким спектром действия, в том числе оказывает губительный эффект на бактерии, устойчивые к другим цефалоспорином, антибиотикам-аминогликозидам и гноеродным микроорганизмам, находящимся в крови. Препарат применяют для лечения инфекций дыхательных, мочевыводящих и желчевыводящих путей, кожи и мягких тканей. Вводят Максипим в мышцу или в вену по 1 г с интервалом в 12 часов при курсе лечения 7—10 дней, но в тяжелых случаях курс лечения более продолжительный. Побочные эффекты при применении препарата проявляются в виде тошноты, боли в животе, диареи и головной боли. Выпускают препарат во флаконах, содержащих 0,5; 1 и 2 г цефепим гидрохлорида.

1.3. Препараты группы тетрациклина Группа антибиотиков тетрациклина оказывает противомикробное действие на возбудителей инфекционных заболеваний желудочно-кишечного тракта (дизентерия, холера, брюшной тиф), спирохеты, риккетсии и крупные вирусы. В отличие от пенициллинов тетрациклины обладают бактериостатическим действием, нарушая биосинтез белка микробной клетки. Это приводит к задержке роста, развития и размножения, а в конечном итоге к постепенной гибели микроорганизма. Тетрациклины назначают для лечения бруцеллеза, сыпного, возвратного и брюшного тифа, холеры, туляремии, менингита, сифилиса, пневмонии, трахомы и других заболеваний. Препараты тетрациклинов эффективны при гнойно-септических заболеваниях, пиодермии, плеврите, инфицированных ожогах и фурункулах. При приеме внутрь тетрациклины не разрушаются в желудочно-кишечном тракте и хорошо всасываются в кровь. Их действие после однократного применения продолжается от 6 до 24 часов, в связи с чем различают препараты короткого (6—8 часов) и длительного (12—24 часа) действия. К препаратам короткого действия относятся тетрациклин и окситетрациклин, а длительного действия — метациклин и доксициклин. ТЕТРАЦИКЛИНА ГИДРОХЛОРИД (Tetracyclini hydrochloridum) - основной препарат группы, используемый для приема внутрь, наружно и для инъекций. Внутрь препарат назначают больным пневмонией, бронхитом, гнойным плевритом, бактериальной и амебной дизентерией, холерой, бруцеллезом, скарлатиной и другими заболеваниями. Применяют тетрациклин внутрь в таблетках по 0,2—0,25 г 3—4

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	40стр. из 164	

раза в день. Курс лечения продолжается около 7 дней, а после исчезновения симптомов заболевания его продолжают принимать еще 2—3 дня. При инфекционных поражениях глаз (трахома, конъюнктивит, блефарит) используют 1% глазную мазь (Unguentum Tetracycliniophthalmicum), а для лечения кожных заболеваний (угревая сыпь, фурункулез, трофические язвы) применяют 3% тетрациклиновую мазь, которую наносят на очаги поражения 1—2 раза в сутки. Во время лечения тетрациклины иногда вызывают побочные эффекты в виде аллергий, тошноты, расстройства кишечника и снижения аппетита. Тетрациклины способны накапливаться в печени, костях, зубах, слизистой оболочке желудочно-кишечного тракта, что может привести к нарушению их функций. С солями кальция они образуют нерастворимые соединения, которые, откладываясь в костной ткани, эмали зубов и дентине, изменяют их структуру, поэтому тетрациклины не рекомендуют применять детям до 8 лет и беременным. При длительном применении тетрациклинов возможно грибковое поражение кишечника (кандидамикоз), при котором назначают противогрибковые средства и витамины.

Тетрациклина гидрохлорид используют для введения в мышцу или полости организма при тяжелых инфекционных заболеваниях, когда требуется быстрое создание в крови высокой концентрации препарата (сепсис, перитонит), а также в случаях, если прием внутрь затруднен. Выпускают тетрациклин в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,1 и 0,2 г, а тетрациклина гидрохлорид для инъекций — во флаконах по 0,1 г. Список Б. ОКСИТЕТРАЦИКЛИНА ДИГИДРАТ (Oxytetracyclini dihydraz) по противомикробному спектру близок к тетрациклину. Препарат хорошо всасывается при приеме внутрь и сохраняется в организме до 8 часов, поэтому его применяют 3—4 раза в сутки. Окситетрациклина дигидрат входит в состав мази «Оксизон», которая применяется для лечения экзем, инфицированных ран, эрозий, аллергических дерматитов. Выпускают препарат в таблетках по 0,25 г. Список Б. ОКСИТЕТРАЦИКЛИНА ГИДРОХЛОРИД {Oxytetracyclini hydrochloridum) входит в состав мази «Гиоксизон» и аэрозольных препаратов «Оксициклозоль» и «Оксикорт», используемых местно для лечения ожогов, инфицированных ран, занимающих большую площадь. Не допускается попадание аэрозоля в глаза, поэтому его наносят на пораженный участок с расстояния 20—30 см. МЕТАЦИКЛИНА ГИДРОХЛОРИД {Methacyclini hydrochloridum) - полусинтетический антибиотик группы тетрациклина, хорошо растворим в воде и всасывается из желудочно-кишечного тракта, сохраняется в организме до 12 и более часов. Он легко проникает в органы и ткани, в значительной степени накапливается в печени, почках и плевральной жидкости. Метациклина гидрохлорид имеет широкий спектр противомикробного действия, активен против стрепто- и стафилококков, сальмонелл, возбудителей трахомы, орнитоза, гонореи, некоторых простейших, при инфекциях желче- и мочевыводящих путей, гнойных инфекциях кожи и мягких тканей, гинекологических инфекционных заболеваниях и т.д. Назначают препарат внутрь по 0,15 и 0,3 г 2—3 раза в день, лучше после еды. Среди побочных явлений возможны аллергические реакции, дисбактериоз, кандидоз, раздражение слизистых оболочек полости рта. Выпускают метациклина гидрохлорид в капсулах по 0,15 и 0,3 г. ДОКСИЦИКЛИНА ГИДРОХЛОРИД {Doxycyclini hydrochloridum) - полусинтетический антибиотик, по противомикробной активности не уступает метациклину, оказывает губительное действие на энтеробактерии, риккетсии, возбудителей трахомы и некоторых простейших. Он легко всасывается и медленно выделяется из организма, и в зависимости от вводимой дозы его действие может продолжаться до 18—24 часов. Применяют доксициклина гидрохлорид внутрь и внутривенно при остром и хроническом бронхите, пневмонии, плеврите, инфекциях мочевыводящих путей и гонорее.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	41стр. из 164	

Назначают внутрь в капсулах по 0,2 г в сутки или по 0,1 г каждые 12 часов. Выпускают препарат в капсулах по 0,05 и 0,1 г. Список Б. Тетрациклины нередко комбинируют с другими антибиотиками с целью получения быстрого и эффективного лечения различных заболеваний. К ним относятся Олететрин и Эрициклин, выпускаемые в капсулах по 0,25 г, назначаемые в сутки 3—4 раза.

1.4. Левомецетины Левомецетины относятся к препаратам широкого противомикробного спектра действия, а по фармакологическому эффекту и применению близки к препаратам тетрациклина. Они несколько превосходят их при лечении брюшного тифа, паратифа, пищевых токсикоинфекций, инфекций, вызванных сальмонеллами, возбудителями бруцеллеза и туляремии. Механизм действия левомецетинов связан с нарушением синтеза белка микробной клетки, что и приводит к гибели возбудителя заболевания. Применяют левомецетин и его аналоги внутрь, наружно и парентерально, а также закапывают в глаза и вводят в прямую кишку. Левомецетины не рекомендуют применять беременным женщинам, новорожденным, больным псориазом и лицам, имеющим повышенную чувствительность к этой группе препаратов, их не советуют использовать вместе с препаратами, угнетающими кроветворение (цитостатики, бутадиион и др.). ЛЕВОМИЦЕТИН (Levomycetinum), хлорамфеникол — синтетический препарат, аналогичный природному антибиотику, обладающий широким спектром противомикробного действия. Он хорошо всасывается в кишечнике, легко проходит гематоэнцефалический барьер и плаценту, равномерно накапливается в жидкостях и тканях организма. Назначают Левомецетин при брюшном тифе, паратифе, генерализованных формах сальмонеллез, бруцеллезе, менингите и других заболеваниях.

После приема внутрь его максимальная концентрация в крови создается через 2—3 часа и сохраняется до 6—8 часов, что позволяет принимать препарат по 0,25—0,5 г 3—4 раза в день. Местно Левомецетин применяют в виде раствора для лечения инфекционных поражений глаз (конъюнктивит, блефарит), а в форме линимента — для лечения заболеваний слизистых и кожи (ожоги, трещины). Левомецетин входит в состав аэрозольного препарата Левовинизоль, мазей Левомеколь и Левосин. Побочные эффекты при применении Левомецетина возможны в виде расстройства кишечника, раздражения слизистых, кожной сыпи, дерматита. Большие дозы и длительное применение препарата способны вызывать изменения со стороны крови, поэтому лечение Левомецетином желательно проводить под контролем картины крови. Выпускают Левомецетин в таблетках по 0,25 и 0,5 г, в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,25 г, в капсулах по 0,1 и 0,5 г, в виде 0,25% раствора (глазные капли) во флаконах по 10 мл. Список Б. ЛЕВОМИЦЕТИНА СТЕАРАТ (Levomycetini steams) плохо растворим в воде, создает в кишечнике необходимую бактериостатическую концентрацию, что позволяет использовать его для лечения инфекционных заболеваний желудочно-кишечного тракта (дизентерия, брюшной тиф). Назначают препарат взрослым по 1 г на прием 3—4 раза в сутки. Продолжительность лечения обычно составляет 10 дней, а при заболеваниях, сопровождающихся рецидивами, — 2—3 недели. Выпускают левомецетина стеарат в таблетках по 0,25 г. ЛЕВОМИЦЕТИНА НАТРИЯ СУКЦИНАТ (Levomycetini natrii succinas) по антибактериальной активности не отличается от Левомецетина, но хорошо растворим в воде, что позволяет вводить его парентерально. Вводят препарат в мышцу, под кожу и в вену по 0,5 и 1 г 2—3 раза в день. Выпускают левомецетина сукцинат натрия во флаконах по 1 г с приложением 0,5% раствора новокаина в ампулах по 5 мл. Аналогом Левомецетина является антибиотик Синтомицин, применяемый наружно в виде 1, 5 и 10% линимента (Linimentum Syntomycini) для лечения гнойно-воспалительных заболеваний кожи и слизистых, инфицированных

O'NTÜSTİK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	42стр. из 164	

ожогов, гнойных ран и т.д. Синтомицин иногда используют в форме вагинальных суппозиториев по 0,25 г.

1.5. Макролиды (антибиотики группы эритромицина) К этой группе препаратов относятся эритромицин, олеандомицина фосфат, азитромицин, рулид и др. Их механизм действия связан с блокадой синтеза белков микробной клетки. К макролидам чувствительны микроорганизмы, которые устойчивы к препаратам пенициллина, тетрациклина и левомицетина. Они хорошо переносятся пациентами, но их недостатком считают то, что к ним быстро развивается устойчивость со стороны возбудителей заболеваний. ЭРИТРОМИЦИН (Erythromycinum) — антибиотик широкого спектра действия, активен против большой группы кокков, возбудителей дифтерии, сифилиса, гонореи, сепсиса, столбняка и др. Он хорошо всасывается в кровь, не кумулирует и малотоксичен. Назначают внутрь по 0,25—0,5 г 4—6 раз в день за час-полтора до еды, а наружно — в виде 1% мази. Лечение эритромицином может вызвать аллергические реакции и некоторые изменения в работе желудочно-кишечного тракта. Выпускают эритромицин в таблетках по 0,1 и 0,25 г в упаковке по 10 штук. Мазь эритромицина, содержащая в 1 г 10.000 ЕД препарата, выпускается в тубах по 7 и 15 г. ОЛЕАНДОМИЦИНА ФОСФАТ (Oleandomyciniphosphas) по противомикробному действию близок к эритромицину, оказывает губительное действие на большую группу кокков и другие микроорганизмы, хорошо всасывается в кровь, малотоксичен и не кумулирует. Применяют для лечения заболеваний верхних дыхательных путей (тонзиллит, дифтерия, ангина), гнойного холецистита, остеомиелита, флегмон и т.д. Назначают внутрь после еды по 0,25—0,5 г 4—6 раз в день при курсе лечения 7—10 дней. Выпускают препарат в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,125 г. Список Б. Олеандомицин входит в состав ряда комбинированных препаратов: Олететрин, выпускаемого в таблетках, и зарубежного препарата Тетра- олеан, предназначенного для парентерального введения. АЗИТРОМИЦИН (Asitromycinum) — представитель нового поколения макролидов, обладающий широким спектром действия, используется для лечения инфекционно-воспалительных заболеваний органов дыхания, заболеваний ЛОР-органов, скарлатины, инфекций кожи и мягких тканей и уретрита. Назначают азитромицин по 0,5 г 1 раз в день или по 0,25 г 2 раза в день. Доза на курс лечения составляет 1,5 г препарата, т.е. по 0,5 г в течение 3 дней. При заболеваниях органов дыхания в первый день назначают 0,5 г препарата, а в последующие 2—5 дней по 0,25 г. Выпускают азитромицин в таблетках по 0,125 и 0,5 г, в капсулах по 0,25 г. МАКРОПЕН (Macropen) — антибиотик группы макролидов, нарушает синтез белка микробной клетки, в малых дозах оказывает бактериостатическое, а в больших — бактерицидное действие. Применяют препарат при скарлатине, инфекциях полости рта, дифтерии, коклюше, рожистом воспалении и других заболеваниях. Курс лечения Макропеном составляет в среднем 7—10 дней при назначении его в таблетках по 0,4 г до 3 раз в день. Выпускают Макропен в таблетках по 0,4 г. Список Б.

1.6. Аминогликозиды Эта группа антибиотиков объединяет ряд препаратов, имеющих сходную химическую структуру и широкий спектр противомикробного действия. Они оказывают бактериостатическое и бактерицидное действие на грамположительные и грамотрицательные микроорганизмы. В данную группу входят препараты стрептомицин, гентамицин, неомицин, канамицин и др. Они отличаются друг от друга спектром противомикробного действия, его продолжительностью и токсическим влиянием на организм. Характерным для всех аминогликозидов является их побочный отрицательный эффект действия на почки (нефротоксичность), слуховой нерв и вестибулярный аппарат (ототоксичность), что делает невозможным их применение пациентами с заболеваниями

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	43стр. из 164	

почек и пониженным слухом. **СТРЕПТОМИЦИНА СУЛЬФАТ** (*Streptomycini sulfas*) — препарат широкого спектра действия, особенно активен в отношении многих грамотрицательных кислотоустойчивых бактерий, в том числе против микобактерий туберкулеза. Применяют препарат для лечения всех видов туберкулеза, менингита, заболеваний мочевыводящих путей, коклюша, чумы, туляремии, бруцеллеза и других заболеваний. Вводят стрептомицин в мышцу по 0,5—1 г (500.000—1.000.000 ЕД) в 2—5 мл воды для инъекций, изотонического раствора натрия хлорида или 0,5% раствора новокаина. При применении препарата возможны побочные эффекты в виде токсических и аллергических реакций, дерматита, гематурии, головокружения и др. При длительном применении стрептомицина в больших дозах поражаются черепно-мозговые нервы, с чем связывают нарушения в деятельности слухового нерва и вестибулярного аппарата. Выпускают стрептомицина сульфат во флаконах для инъекций по 0,25 и 0,5 г активного вещества. **СТРЕПТОМИЦИНА ХЛОРКАЛЬЦИЕВЫЙ КОМПЛЕКС** (*Streptomycini calcii chloridum*) — комплексный препарат, содержащий стрептомицина гидрохлорид и кальция гидрохлорид. Применяют препарат при туберкулезном менингите и менингите, вызванном чувствительными к стрептомицину бактериями. Во всех остальных случаях его используют как стрептомицина сульфат. Вводят препарат в мышцу и эндолюмбально по 0,05—0,1 г (50.000—100.000 ЕД). Растворы препарата готовят непосредственно перед употреблением (*ex tempore*), используя для этого воду для инъекций или изотонический раствор натрия хлорида. Выпускают препарат во флаконах по 0,2 г для инъекций. **НЕОМИЦИНА СУЛЬФАТ** (*Neomycini sulfas*) — к нему чувствительны стрепто- и стафилококки, палочка сибирской язвы, возбудители дизентерии, брюшного тифа и других бактерий. При приеме внутрь препарат почти не оказывает токсического действия, потому что не всасывается из кишечника, создает там высокую бактерицидную концентрацию и вызывает гибель патогенной микрофлоры. Его используют для лечения дизентерии, брюшного тифа, энтероколита и для санации кишечника перед операцией на желудочно-кишечном тракте. Внутрь неомицин назначают в таблетках по 0,1 или 0,25 г на прием 1—2 раза в день в течение 5—7 дней, а предоперационную подготовку ведут 1—2 дня. Местно неомицина сульфат используют для лечения экзем, инфицированных ран, пиодермии, конъюнктивита и других заболеваний. Не следует неомицина сульфат применять с другими препаратами, оказывающими нефро- и ототоксический эффект (стрептомицин, гентамицин и др.). Если в процессе лечения неомицином у пациента появляется шум в ушах, аллергические реакции и обнаруживается белок в моче, то применение препарата прекращают. Выпускают неомицина сульфат в таблетках по 0,1 и 0,25 г, в виде 2% мази в тубах по 15 и 30 г. **ГЕНТАМИЦИНА СУЛЬФАТ** (*Gentamycini sulfas*) оказывает бактериостатическое действие в отношении многих возбудителей заболеваний. После внутримышечной инъекции препарат быстро всасывается и сохраняет высокую концентрацию в крови в течение 8—12 часов. Выделяется он из организма почками в неизменном виде. Применяют гентамицина сульфат при пневмонии, плеврите, перитоните, сепсисе, раневой инфекции, инфекциях мочевыводящих путей, простатите и т.д. При воспалительных заболеваниях органов дыхания гентамицина сульфат в виде 1 % раствора вводят в виде аэрозоля и в мышцу в форме 4% раствора по 1—2 мл. При кожных инфекциях используют 0,1% гентамициновую мазь, а при инфекционно-воспалительных заболеваниях глаз используют 0,3% раствор препарата 3—4 раза в день. Выпускают гентамицина сульфат во флаконах по 0,08 г, 4% раствор — в ампулах по 1 и 2 мл, 0,1% мазь в тубах по 15 г, 0,3% раствор по 1,5 мл — в капельницах и в виде 2,5% линимента по 15 и 30 г. Список Б. Кроме

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	44стр. из 164	

неомицина, гентамицина к этой группе препаратов относятся мономицин, канамицин, бруламицин, сизомицин и полусинтетический антибиотик амикацин.

Особенности действия и применения антибиотиков Главным в применении антибиотиков является строгое выполнение основных принципов химиотерапии. Начинать лечение заболеваний следует как можно раньше основным антибиотиком, к которому возбудитель наиболее чувствителен. В случаях длительного использования антибиотиков возможно развитие устойчивости возбудителей к ним, и тогда приходится использовать резервные антибиотики. Последние применяют и в тех случаях, когда к ведущему антибиотику имеется повышенная чувствительность. Современная медицина рекомендует с целью получения более быстрого эффекта в лечении различных заболеваний использовать комбинированные препараты антибиотиков, например Ампиокс, Олететрин и др. Следует также помнить о том, что не все антибиотики совместимы. Так, нерационально одновременно назначать пенициллины вместе с тетрациклинами, поскольку эффективность антибиотиков при этом снижается. Большинство антибиотиков для организма малотоксичны, но в процессе их применения они способны оказывать нежелательное воздействие на организм больного. Например, антибиотики из группы аминогликозидов вызывают нарушение функций вестибулярного аппарата и почек, левомицетины способны угнетать кроветворение и почти все антибиотики при приеме внутрь могут вызывать диспептические расстройства. Аллергические проявления чаще всего бывают у лиц с повышенной чувствительностью организма к антибиотикам. Наиболее часто аллергию вызывают антибиотики групп пенициллина, тетрациклина, аминогликозидов и др. К сожалению, аллергические реакции (зуд, сыпь, отеки) при использовании антибиотиков нередко развиваются у медицинского персонала, непосредственно контактирующего с ними. Для профилактики подобных явлений обычно рекомендуют использовать антигистаминные средства. Среди побочных явлений, связанных с химиотерапевтическим действием антибиотиков, нередко отмечают дисбактериоз, снижение иммунитета, реакции обострения заболеваний и т.д. Для устранения этих эффектов советуют использовать симптоматическую терапию, назначая противовоспалительные, жаропонижающие средства, адаптогены, повышающие иммунитет вещества и препараты других фармакологических групп.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Что означает термин «химиотерапия»?
2. Как называют действие антибиотиков, вызывающих гибель микроорганизмов?
3. Какие вы знаете группы антибиотиков?
4. На какие группы микроорганизмов действуют антибиотики группы пенициллина?
5. Какие осложнения вызывают антибиотики-аминогликозиды?
6. Почему цефалоспорины предпочтительнее пенициллинов в лечении различных заболеваний?
7. Какие недостатки характерны для антибиотиков группы макролидов?
8. Какие побочные эффекты вызывают тетрациклины?
9. Почему необходимо соблюдать принципы химиотерапии?
10. В каких случаях показано применение левомицетина?

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	45стр. из 164	

1. Тема. Сульфаниламидные препараты. Синтетические антибактериальные средства разного химического строения.

2. Цель.

3. Тезисы лекции.

Все сульфаниламидные средства сходны в основе между собой по химической структуре и механизму противомикробного действия. Отличаются они друг от друга по фармакокинетическим параметрам: одни легко всасываются из желудочно-кишечного тракта, быстро накапливаются в крови, органах и тканях; другие — надолго задерживаются в кишечнике и создают в нем высокую концентрацию препаратов, достаточную для лечения заболеваний желудка и кишечника; третьи — в значительных количествах накапливаются в почках и мочевыводящих путях, выделяясь из организма в неизменном виде. На микроорганизмы сульфаниламидные средства оказывают бактериостатическое действие. Они подавляют жизнедеятельность большой группы кокков, дизентерийной и кишечной палочки, возбудителей сибирской язвы, холерного вибриона, бруцелл и других возбудителей заболеваний. Механизм действия сульфаниламидных средств основан на принципе антиметаболизма, когда происходит замена необходимого микроорганизму вещества на вещество, близкое по химической структуре, но противоположное по действию. Подобное действие носит название конкурентного антагонизма.

Парааминобензойная кислота принимает непосредственное участие в биотрансформации фолиевой кислоты, которая, преобразуясь в фолиниевую кислоту, участвует в синтезе нуклеиновых кислот (белка), что и лежит в основе роста, развития и размножения микроорганизма. Замена ПАБК на сульфонамид нарушает синтез белка, приводит к задержке роста и размножению возбудителей заболеваний. Но для получения такого эффекта концентрации сульфаниламидных средств должны во много раз превышать концентрацию ПАБК (второй принцип химиотерапии). Именно поэтому лечение сульфаниламидными средствами начинают с больших (ударных) доз препаратов, с тем чтобы как можно быстрее создать в организме высокую концентрацию конкурентного препарата. По времени действия сульфаниламидные средства делят на препараты короткого, среднего, длительного и сверхдлительного действия. К сульфаниламидам короткого действия относятся Стрептоцид, Норсульфазол, Сульфадимезин, Этазол и др.

СТРЕПТОЦИД (Streptocidum) — один из первых сульфаниламидных препаратов, используемых в медицинской практике. Его применяют для лечения ангины, пиелита, цистита, колита, рожистого воспаления, раневых инфекций и т.д. Лечение стрептоцидом начинают с ударной дозы 2 г, а затем внутрь по 0,5—1 г до 5 раз в день, постепенно снижая количество приемов к концу лечения. Наружно стрептоцид вводят в рану в виде стерильного порошка или используют его 5% линимент и 10% мазь. Среди побочных эффектов возможны аллергические реакции, лейкопения, агранулоцитоз, тахикардия и др. Стрептоцид противопоказан при заболеваниях системы кроветворения, нарушениях функций почек, тиреотоксикозе и повышенной чувствительности организма к сульфаниламидным средствам. Выпускают стрептоцид в порошке, таблетках по 0,3 и 0,5 г, в виде 5% линимента и 10% мази в упаковке по 25—30 г. **НОРСУЛЬФАЗОЛ (Norsulfazolum)** активен в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий, легко всасывается из желудочно-кишечного тракта и быстро выделяется из организма с мочой. Применяют Норсульфазол для лечения пневмонии, церебрального менингита, при стрептококковом и стафилококковом сепсисе, гонорее и других заболеваниях. Лечение начинают с назначения ударной дозы 2 г, а затем принимают по 1 г каждые 4—6 часов, а далее через 6—8 часов. Всего на курс лечения необходимо от 20 до 30 г препарата. При

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	46стр. из 164	

лечении Норсульфазолом рекомендуют увеличить потребление жидкости до 2—3 л в сутки с целью профилактики возможной кристаллурии. Советуют также после каждого приема препарата запивать его стаканом воды с добавлением небольшого количества питьевой соды. Среди побочных эффектов при использовании Норсульфазола — аллергические реакции, лейкопения, невриты и расстройство кишечника. Выпускают препарат в порошке, таблетках по 0,25 и 0,5 г. Список Б. ЭТАЗОЛ (Aethazolum) обладает антибактериальной активностью, которая распространяется на все виды кокков, кишечную палочку, возбудителей дифтерии и инфекций мочевыводящих путей. Применяют этазол для лечения пневмонии, рожистого воспаления, ангины, гнойных инфекций мочевыводящих путей, раневых инфекций и перитонита.

Назначают препарат внутрь по 1 г 4—6 раз в день в зависимости от характера заболевания. Этазол малотоксичен, не кумулирует и почти не вызывает кристаллурии. Побочные эффекты его такие же, как у остальных сульфаниламидных средств. Выпускают препарат в порошке и таблетках по 0,25 и 0,5 г. Натриевые соли вышеуказанных препаратов хорошо растворимы в воде и чаще используются для инъекций в случаях, когда пероральное применение бывает невозможно. Следует отметить и тот факт, что с появлением более эффективных химиотерапевтических средств применение сульфаниламидных препаратов значительно уменьшилось. Сульфаниламидные средства средней продолжительности действия представлены препаратом сульфазин и его серебряной солью. СУЛЬФАЗИН (Sulfazinum) отличается от других препаратов более продолжительным действием (до 8 часов). Показания к применению такие же, как и у Норсульфазола. Назначают сульфазин внутрь, первый прием — 2 г, затем в течение 1—2 дней по 1 г через 4 часа и далее по 1 г каждые 6—8 часов. Он редко вызывает побочные эффекты, а для предупреждения осложнений со стороны почек рекомендуют использовать щелочное питье. Выпускают сульфазин в порошке и таблетках по 0,5 г. Широкое применение в лечении инфекционных заболеваний нашли препараты длительного действия, применяемые в меньших дозах на курс лечения, почти не вызывающие кристаллурии и назначаемые 1—2 раза в сутки после приема ударной дозы. СУЛЬФАДИМЕТОКСИН (Sulfadimethoxinum) — препарат пролонгированного действия, медленно всасывается из желудочно-кишечного тракта, достигая максимальной концентрации через 8—12 часов. Антибактериальное действие препарата распространяется на все виды кокков, возбудителей дизентерии, трахомы и некоторые простейшие. Его используют для лечения острых респираторных заболеваний, пневмонии, бронхита, гайморита, отита, воспалительных заболеваний желчных и мочевыводящих путей, раневых инфекций и т.д. Назначают препарат внутрь начиная с 1—2 г в первый день и по 0,5—1 г в последующие дни. При применении сульфадиметоксина возможны кожные высыпания, лейкопения и редко — расстройство кишечника. Препарат противопоказан при его индивидуальной непереносимости. Выпускают сульфадиметоксин в таблетках по 0,5 г в упаковке по 10 штук.

СУЛЬФАПИРИДАЗИН (Sulfapyridazinum) в кишечнике всасывается быстрее, чем сульфадиметоксин, но выделяется из организма медленнее, чем и объясняется его длительное действие. Показания и противопоказания к применению сульфацидазина подобны сульфадиметоксину и другим сульфаниламидным средствам. С осторожностью его используют при заболеваниях кроветворной системы, при нарушении функций почек и декомпенсации сердечной деятельности. Выпускают сульфацидазин в таблетках по 0,5 г. Список Б. Хорошо растворимая натриевая соль сульфацидазина (Sulfapyridazinumnatrium) нередко используется для местного лечения гнойной инфекции, в виде глазных капель при трахоме и ингаляций при хронических гнойных процессах в

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	47стр. из 164	

бронхах и легких. Выпускают препарат в порошке для приготовления растворов и в виде глазных пленок в упаковке по 30 штук. СУЛЬФАМОНОМЕТОКСИН (Sulfamonomethoxinum) по показаниям и противопоказаниям к применению близок к препаратам длительного действия. Он легко растворим в воде, быстро всасывается, проникает через гематоэнцефалический барьер, относительно малотоксичен. Назначают его внутрь в таблетках в первый день по 1 г, а в последующие дни по 0,5 г в день. Суточную дозу дают 1 раз в день. Выпускают препарат в таблетках по 0,5 г. Сульфамонотоксин входит в состав препарата Сульфатон. Группу препаратов сверхдлительного действия представляет сульфален и его метилглюкаминная соль. СУЛЬФАЛЕН (Sulfalenum) по антибактериальному действию близок к сульфапиридазину и другим сульфаниламидам длительного действия, но обладает сверхдлительным действием, так как очень медленно выделяется из организма через почки (до 72 часов). При приеме внутрь он хорошо всасывается, легко проникает в жидкости и ткани, в больших концентрациях обнаруживается в печени и т.д. В отличие от других сульфаниламидных средств он почти не связывается с белками и находится в крови в свободном состоянии, что и обеспечивает его длительный терапевтический эффект. Сульфален применяют при инфекционных заболеваниях органов дыхания, желче- и мочевыводящих путей, гнойных инфекциях различной локализации (абсцессы, мастит), при остеомиелите, отите и др. Назначают сульфален внутрь в таблетках: в первый день 1 г препарата и в последующие — по 0,2 г в сутки за 30 минут до еды. Продолжительность лечения зависит от характера заболевания и составляет примерно 7—10 дней. Сульфален обычно хорошо переносится, но иногда при его применении развиваются аллергические реакции, тошнота, головная боль и лейкопения. Выпускают сульфален в таблетках по 0,2 г в упаковке по 10 штук. Растворимую соль сульфалена (Sulfalenum-megluminum) используют для парентерального введения при тяжелых формах гнойных инфекций в хирургии, терапии, урологии, при пневмонии и менингите. Вводят препарат в вену или внутримышечно. Список Б. Широкое применение в медицинской практике нашли комбинированные сульфаниламидные препараты Сульфатен и Бактрим (Бисептол). БАКТРИМ (Bactrim), синоним: Бисептол, — антибактериальный препарат широкого спектра действия. В его состав входят сульфаметоксазол и триметоприм. Бактерицидный эффект объясняется двойным блокирующим действием на метаболизм бактерий, которое связано с нарушением синтеза производных фолиевой кислоты. Бактрим применяют при инфекционных и воспалительных заболеваниях органов дыхания, мочевыводящих путей, желудочно-кишечных заболеваниях, заболеваниях кожи и мягких тканей. При приеме внутрь препарат быстро всасывается, достигает максимальной концентрации в крови через 1—4 часа и сохраняется до 7—8 часов. Назначают Бактрим внутрь по 2 таблетки утром и вечером после еды. Курс лечения занимает от 5 до 14 дней в зависимости от характера заболевания. Лечение желательно проводить под контролем картины крови. Среди побочных эффектов при приеме Бактрима возможны аллергические реакции, нефропатия, некоторые изменения со стороны крови, тошнота, рвота и др. Выпускают Бактрим (Бисептол) в таблетках по 480 мг для взрослых и по 120 мг для детей. В детской практике, начиная с 1,5 месяцев, применяют препарат в виде суспензии, которую выпускают во флаконах по 100 мл. СУЛЬФАТОН (Sulfatonum) содержит два действующих вещества: сульфамонотоксин и триметоприм, а по действию близок к Бактриму. Показаниями к применению препарата служат инфекции дыхательных путей, моче- и желчевыводящих путей, рожистое воспаление, сепсис, менингит, гнойная хирургическая инфекция и др.

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	48стр. из 164	

Назначают Сульфатон внутрь в первый день по 2 г утром и вечером (ударная доза), а в последующие дни по 1 таблетке 2 раза в день (поддерживающая доза). Курс лечения составляет 7—10 дней. Выпускают Сульфатон в таблетках по 0,35 г. Для местного применения сульфаниламидные средства используют в составе мазей «Сунорекс» и «Дермазин», комплексного препарата Ингалипт и в виде глазных капель сульфацил-натрия. СУЛЬФАЦИЛ-НАТРИЯ (Sulfacylum-natrium) — препарат широкого противомикробного действия, эффективен при кокковых и колибациллярных инфекциях, гнойных поражениях глаз, конъюнктивитах, язвах роговицы и при лечении инфицированных ран. Он хорошо растворим в воде, что позволяет применять его не только в виде глазных капель, но и для инъекций. Наиболее широкое применение раствор сульфацил-натрия нашел в офтальмологии, где его используют в 20 и 30% концентрации или в виде 10, 20 и 30% глазной мази. Для профилактики бленнореи новорожденным закапывают в глаза по 2 капли 30% раствора непосредственно после рождения и по 2 капли через 2 часа. При гнойных поражениях глаз раствор сульфацил-натрия закапывают по 2 капли до 6 раз в день. Внутрь при заболеваниях органов дыхания, мочеполовой системы препарат назначают по 0,5—1 г на прием 3—5 раз в сутки. В тяжелых случаях 30% раствор препарата вводят в вену. Выпускают сульфацил-натрия в порошке, в форме 20 и 30% растворов в тубиках-капельницах по 1,5 мл в упаковке по 2 штуки, 30% раствор во флаконах по 5 мл и 30% раствор в ампулах по 5 мл в упаковке по 10 штук. Список Б. Для лечения инфекционных заболеваний желудочно-кишечного тракта используют сульфаниламидные средства, которые плохо всасываются из него, создавая высокую противомикробную концентрацию, приводящую к гибели возбудителей заболеваний. К ним относятся Сульгин, фталазол, фтазин и др. СУЛЬГИН (Sulginum), синоним: сульфатуанидин, — препарат короткого действия, после приема внутрь основное количество его задерживается в кишечнике, где и проявляется его эффект. Применяют Сульгин для взрослых и детей при всех видах бактериальной дизентерии, колитах, энтероколитах и подготовке больных к операции на тонком и толстом кишечнике. При острых кишечных инфекциях препарат применяют по схеме: в первый день по 1—2 г 6 раз в день, во второй и третий — 5 раз, четвертый — 4 раза и пятый день 3 раза в сутки. Курс лечения составляет 5—7 дней, и после небольшого перерыва при необходимости его можно повторить. Во избежание побочных эффектов со стороны почек во время лечения рекомендуют поддерживать усиленный диурез путем приема 2—3 литров жидкости в сутки, а для профилактики авитаминозов советуют применять витамины группы В. Выпускают Сульгин в порошке и таблетках по 0,5 г в упаковке по 10 штук.

2.2. Производные нитрофурана Производные нитрофурана относятся к химиотерапевтическим средствам, обладающим бактерицидным и бактериостатическим действием в отношении большого числа патогенных микроорганизмов, некоторых крупных вирусов и простейших (трихомонады, лямблии). Их нередко используют в случаях снижения активности антибиотиков или имеющих к ним противопоказаний. Наиболее активными препаратами этой группы являются фурацилин, фуразолидон, Фурадо-нин, фурагин и др. ФУРАЦИЛИН (Furacilinum) — активное антисептическое средство, широко применяемое в медицинской практике. Его противомикробное действие проявляется в отношении стрепто- и стафилококков, кишечной и дизентерийной палочки, сальмонелл, возбудителей паратифа, газовой гангрены и т.п. Чаще всего растворы фурацилина используют наружно для лечения гнойных ран, ожогов, язв, фурункулов, пролежней. Растворы фурацилина используют для полоскания рта и горла (стоматит, ангина), промывания полостей, пазух и слухового прохода, для закапывания и промывания глаз при гнойных инфекциях. При местном применении растворы фурацилина не вызывают

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к 49стр. из 164	
Лекционный комплекс		

раздражения тканей, способствуют процессам грануляции и заживлению ран. Применяют фурацилин в виде 0,02% раствора (1 : 5000) и 0,2% мази. Для приготовления водного раствора 0,1 г фурацилина растворяют в 500 мл воды при кипячении и добавляют 0,5—1 чайную ложку хлорида натрия, который выполняет роль стабилизатора. Можно 0,1 г фурацилина растворить при кипячении в 500 мл 0,9% раствора натрия хлорида и после охлаждения использовать по назначению. Такой раствор можно хранить довольно долго. Иногда фурацилин в качестве химиотерапевтического средства назначают внутрь в таблетках для лечения бактериальной дизентерии, принимая при этом по 0,1 г в таблетках 4—5 раз в день в течение 5—7 суток. После небольшого перерыва курс лечения можно повторить. Фурацилин малотоксичен, но при приеме внутрь возможно снижение аппетита, тошнота и аллергические реакции. Выпускают фурацилин в таблетках по 0,1 г для приема внутрь и по 0,02 г для приготовления раствора наружного применения, а также в виде 0,2% мази. ФУРАЗОЛИДОН (Furazolidonum) несколько отличается от фурацилина по спектру противомикробного действия. Он активен в отношении возбудителей дизентерии, брюшного тифа, паратифа, а также простейших — трихомонад и лямблий. Для лечения дизентерии, паратифа, пищевых токсикоинфекций препарат назначают внутрь по 0,1—0,15 г до 4 раз в день в течение 4—5 дней. При лечении трихомоноза препарат назначают по 0,1 г 3—4 раза в сутки 3—4 дня подряд. С целью уменьшения побочных явлений (тошнота, аллергия) фу-разолидон при приеме внутрь рекомендуют запивать большим количеством воды. Выпускают фуразолидон в таблетках по 0,5 г и гранулах по 50 г в упаковке для детей. ФУРАДОНИН (Furadoninum) оказывает губительное действие на большую группу микроорганизмов, но чаще всего используется для лечения инфекционных заболеваний мочевыводящих путей (пиелит, уретрит, цистит). Его используют также как профилактическое средство при проведении урологических исследований и операций. Назначают Фурадонин внутрь в таблетках по 0,1—0,15 г 3—4 раза в день в течение 5—8 суток. При его применении возможны побочные эффекты в виде тошноты, изжоги и др. Выпускают Фурадонин в таблетках по 0,05 г и таблетках, растворимых в кишечнике, по 0,1 г.

2.3. Производные 8-оксихинолина, нафтидина и фторхинолона Эта группа химиотерапевтических средств различна по химической структуре. Они обладают широким спектром противомикробного и противопаразитарного действия, а некоторые из них активны в отношении грибов. Применяют их в основном для лечения инфекционных заболеваний желудочно-кишечного тракта, мочевыводящих путей, холецистита, воспаления среднего уха и т.д.

Представителями этих групп являются нитроксилин, интестопан, кислота налидиксовая, кислота пипемидиевая, офлоксацин и др. НИТРОКСОЛИН (Nitroxolinum) — представитель производных 8-оксихинолина, активен в отношении многих патогенных микроорганизмов и некоторых грибов. Нитроксилин хорошо всасывается из кишечника и выделяется из организма через почки в неизменном виде, создавая в мочевыводящих путях высокую терапевтическую концентрацию. Это качество препарата используется для лечения инфекционных заболеваний мочеполовых путей и для профилактики после операций на почках и мочевыводящих путях. Назначают нитроксилин внутрь по 0,1 г 4 раза в день при курсе лечения, зависящего от характера заболевания. Следует учитывать, что нитроксилин окрашивает мочу в желто-коричневый цвет, о чем желательно предупредить больного. Выпускают нитроксилин в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,05 г. Список Б. За рубежом препарат выпускают под названием «5-НОК». ХЛОРХИНАЛЬДОЛ (Chlorchinaldolum) подобен нитроксилину, обладает антибактериальным, противогрибковым и противопротозойным действием, активен в отношении большой группы кокков и

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	50стр. из 164	

некоторых грамотрицательных бактерий. Применяют чаще всего при кишечных инфекциях: дизентерии, сальмонеллезе, пищевой токсикоинфекции, инфекциях, вызванных стафилококком, и при дисбактериозе. Назначают препарат внутрь после еды по 0,2 г 3 раза в день, а при тяжелых инфекциях суточная доза может возрасти до 1,2 г. При лечении препаратом возможны побочные эффекты в форме кожной сыпи, боли в животе, тошноты, сердцебиения и т.д. Не рекомендуют применять его при повышенной чувствительности к производным 8-оксихинолина, тяжелых поражениях печени, зрительного нерва и периферической нервной системы. Выпускают хлорхинальдол в таблетках по 0,1 г № 50 для взрослых и по 0,03 г для детей. КИСЛОТА НАЛИДИКСОВАЯ (*Acidum nalidixicum*), синоним: неви-грамон, синтетическое химиотерапевтическое средство, производное нафтидина. Препарат эффективен в отношении многих грамотрицательных бактерий, кишечной, дизентерийной, брюшнотифозной палочки и др. Он хорошо всасывается из пищеварительного тракта и в больших количествах накапливается в мочевыводящих путях, где подобно ни-троксолину оказывает лечебный эффект. Кроме того, его применяют для лечения холецистита и энтероколита. Назначают внутрь в таблетках или капсулах по 0,5—1 г 4 раза в день около 7 дней подряд. Кислота налидиксовая хорошо переносится больными, но в ряде случаев возможны побочные эффекты в виде тошноты, головокружения и аллергических проявлений. Выпускают препарат в капсулах по 0,5 г. Список Б. КИСЛОТА ПИПЕМИДИЕВАЯ (*Acidum pipemidiesum*), синоним: палин, по характеру действия и применения близка к кислоте нали-диксовой, используется при острых и хронических заболеваниях мочевыводящих путей. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,4 г и капсулах по 0,2 г 2 раза в день. Курс лечения составляет 10 и более дней, что зависит от характера заболевания. Женщинам при инфекции мочеполовой сферы одновременно рекомендуют использовать вагинальные суппозитории по 0,2 г 1 раз в сутки. Выпускают кислоту пипемидиевую в капсулах по 0,1 и 0,2 г, таблетках по 0,4 г, вагинальных суппозиториях по 0,1 г. Список Б. ОФЛОКСАЦИН (*Ofloxacinum*), синоним: таривид, — производное фторхинолона, обладает широким спектром противомикробного действия, преимущественно на грамотрицательные бактерии. После приема внутрь быстро всасывается, создавая высокую концентрацию препарата в крови, органах и тканях. Используют офлоксацин для лечения инфекционных заболеваний дыхательных и мочевыводящих путей, уха, горла, мягких тканей, инфекций брюшной полости и гинекологических заболеваний. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,2 г 2 раза в день, а при инфекциях в области суставов и мочевых путей дозу на прием увеличивают до 0,3—0,4 г. Иногда препарат вызывает головную боль, отек лица, общее утомление и т.д. Нежелательно применять препарат и его аналоги при повышенной чувствительности к ним, эпилепсии, в период беременности и кормления ребенка. Выпускают офлоксацин в таблетках по 0,2 г в упаковке по 10 штук. ЦИПРОФЛОКСАЦИН (*Ciprofloxacinum*), синоним: ципролет, — противомикробное средство, производное фторхинолона. Препарат действует бактерицидно как на размножающиеся микроорганизмы, так и находящиеся в фазе покоя.

Он активен в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий. Его применяют при инфекционных и воспалительных заболеваниях органов дыхания, уха, горла и носа, почек, мочевыводящих путей, системы пищеварения, желчного пузыря и желчевыводящих путей, кожи, слизистых оболочек и мягких тканей, а также сепсиса и перитонита. Назначают ципрофлоксацин в таблетках по 0,25 г 2 раза в день, а в осложненных случаях по 0,5 г 2 раза в сутки после еды, запивая достаточным количеством воды. Курс лечения обычно составляет 7—10 дней. Побочные эффекты могут быть

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс		51стр. из 164

выражены в виде диареи, тошноты, нарушения зрения, изменений со стороны крови, аллергий и общей слабости. Принимающим ципролет пациентам, работа которых требует повышенной сосредоточенности и внимания, а также при вождении автомобиля, необходимо соблюдать осторожность. Выпускают ципрофлоксацин в таблетках по 0,25 и 0,5 г № 10.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Дайте характеристику каждому из предложенных препаратов, укажите их латинские названия, формы выпуска, принадлежность к соответствующей фармакологической группе и показания к применению: сульфацил-натрия, сульфален, фуразолидон, нитроксолин, кислота пипемидиевая, сульфапиридазин.

1. Тема. Противотуберкулезные, противовирусные, противогрибковые, противосифилитические средства

2. Цель. При изучении предложенных тем следует обратить внимание на следующее. 1. Классификация противотуберкулезных средств. 2. Фармакологические свойства и особенности применения препаратов гидразина изоникотиновой кислоты. 3. Особенности действия и применения производных парааминосалициловой кислоты (ПАСК). 4. Особенности действия и применения противотуберкулезных антибиотиков. 5. Побочные эффекты антибиотиков противотуберкулезного действия. 6. Комбинированное применение противотуберкулезных средств. 7. Современные противоспирохетозные (противосифилитические) средства. 8. Роль препаратов группы пенициллина в лечении сифилиса.

3. Тезисы лекции.

Противотуберкулезные средства Туберкулез — хроническое инфекционное заболевание, возбудителем которого является микобактерия туберкулеза, открытая в 1882 г. немецким ученым Робертом Кохом и названная в его честь палочкой или бациллой Коха. В первую очередь микобактерии туберкулеза поражают органы дыхания, а в дальнейшем через лимфатические и кровеносные сосуды заболевание распространяется на другие органы. Таким образом, развивается туберкулез легких, костей, почек, оболочек мозга, глаз, кожи ит.д. Высокая кислотоустойчивость микобактерии туберкулеза и плотная клеточная оболочка требуют достаточно длительного времени для проникновения лекарственных средств внутрь возбудителя, чтобы вызвать его гибель, что определяет хронический характер заболевания, который иногда продолжается несколько лет. Действие противотуберкулезных средств основано на их способности разрушать клеточную оболочку возбудителя, задерживать рост и развитие, что, в конце концов, приводит к его гибели. Кроме того, в процессе воздействия препаратов снижается вирулентность микобактерии туберкулеза. Современная классификация противотуберкулезных средств может быть представлена следующим образом: 1) антибиотики противотуберкулезного действия; 2) производные гидразина изоникотиновой кислоты (ГИНКа); 3) производные парааминосалициловой кислоты (ПАСКа); 4) препараты иной химической структуры. Кроме того, противотуберкулезные средства в зависимости от их влияния на возбудителя делят еще на две группы: 1) основные, или препараты первого ряда; 2) резервные, вспомогательные, или препараты второго ряда. Последние отличаются более слабым воздействием на микобактерию туберкулеза, чуть большей токсичностью, но они необходимы в ходе лечения в случаях выработки у возбудителя толерантности к

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	52стр. из 164	

препаратам первого ряда. В настоящее время для успешного лечения туберкулеза используют комбинированные препараты, что позволяет снизить возможность развития устойчивости со стороны микобактерий и сравнительно быстро получить лечебный эффект.

3.1. Антибиотики противотуберкулезного действия В эту группу лекарственных средств входят стрептомицина сульфат, стрептомицин хлоркальциевый комплекс (см. Антибиотики — аминогликозиды), Рифампицин, Канамицина Сульфат, флоримицин, циклосерин и др. **КАНАМИЦИНА СУЛЬФАТ** (Kanamycini sulfas) обладает широким спектром противомикробного действия, активен в отношении микобактерий туберкулеза, большинства грамположительных и грамотрицательных бактерий. Вводят препарат в мышцу, после чего он быстро всасывается в кровь и сохраняет терапевтическую концентрацию в течение 8 часов. Канамицин малотоксичен, не кумулирует и выводится через почки. Используют препарат для лечения различных форм туберкулеза и инфекционных заболеваний органов дыхания (пневмония, легочные нагноения), мочевых путей (пиелит, пиелонефрит), для профилактики гнойных осложнений при хирургических операциях. Назначают Канамицин для лечения туберкулеза по 1 г однократно или 2 раза в день в течение недели с последующим перерывом в 7 дней. При других инфекциях вводят по 0,5 г 2—3 раза в сутки 5—7 дней подряд. Длительное применение Канамицина сульфата может вызвать снижение слуха вследствие поражения слухового нерва (ототоксический эффект) и нарушение функций почек. Его не рекомендуют применять вместе с другими антибиотиками группы аминогликозидов (стрептомицин, гентамицин) и при заболеваниях почек. Выпускают канамицина сульфат во флаконах по 0,5—1 г с приложением растворителя; в ампулах по 10 мл 5% раствора и в виде глазных пленок, содержащих 0,001 г препарата № 30. Список Б. **РИФАМПИЦИН** (Rifampicinum) по противотуберкулезной активности превосходит стрептомицин и представляет собой антибиотик широкого спектра действия. Он вызывает гибель возбудителей туберкулеза, лепры, действует на стафилококки, менингококки и другие микроорганизмы. В отличие от стрептомицина Рифампицин более стоек и оказывает хороший эффект при приеме внутрь. Он хорошо всасывается из кишечника и легко проникает во все органы и ткани, что позволяет использовать его при всех формах туберкулеза. Применяют Рифампицин натощак за 30—60 минут до еды. Он имеет характерный коричнево-красный цвет, поэтому при его приеме внутрь моча, слюна, мокрота приобретают соответствующий оттенок, о чем следует предупреждать пациентов. Чтобы избежать быстрого привыкания к нему со стороны микобактерий туберкулеза, его часто комбинируют с другими противотуберкулезными средствами. Среди побочных эффектов иногда наблюдают расстройство кишечника, нарушение функций печени, поджелудочной железы и аллергические реакции. Выпускают Рифампицин в капсулах по 0,05 и 0,15 г или в ампулах по 0,15 г для инъекций. Список Б. **ФЛОРИМИЦИНА СУЛЬФАТ** {Florimycini sulfas) применяют при различных формах туберкулеза, особенно в случаях устойчивости микобактерий к противотуберкулезным средствам первого ряда. Вводят препарат в мышцу по 0,5 г 2 раза в день в течение недели, после чего делают перерыв на 7 дней. Флоримицин противопоказан при поражении VIII пары черепных нервов, нарушениях функций почек; его не следует применять вместе с другими антибиотиками из группы аминогликозидов. Выпускают флоримицина сульфат во флаконах по 0,5 и 1 г для инъекций. **ЦИКЛОСЕРИН** (Cycloserinum) — антибиотик второго ряда, его назначают при всех формах туберкулеза по 0,25 г 3 раза в сутки. Среди побочных явлений при его применении возможны головная боль, нарушение сна, ухудшение памяти. Выпускают препарат в таблетках и капсулах по 0,25 г № 50.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	53стр. из 164	

3.2. Производные гидразина изоникотиновой кислоты **ИЗОНИАЗИД (Isoniasidum)** — одно из активных противотуберкулезных средств, обладающее высоким бактериостатическим эффектом в отношении возбудителя этого заболевания. Используют изониазид при всех формах туберкулеза у взрослых и детей. Препарат особенно активен при свежих и острых формах заболевания. Его часто комбинируют с другими противотуберкулезными средствами, например с антибиотиками. Изониазид сравнительно устойчив, его действие после однократного приема длится от 6 до 24 часов. Назначают препарат внутрь преимущественно в форме порошка и таблеток, а растворы его вводят в мышцу и в вену при острых формах заболевания, реже внутрикавернозно и в форме ингаляций. Обычно на прием назначают по 0,3 г 2—3 раза в сутки. Среди побочных эффектов изониазида следует отметить возникающие иногда головные боли, нарушение сна, раздражительность, аллергические реакции, нарушение сердечного ритма. Его не рекомендуют применять при эпилепсии, нарушениях функций почек и печени, склонности к судорогам и выраженном атеросклерозе. Выпускают изониазид в таблетках по 0,1 и 0,3 г в упаковке по 100 штук и в ампулах по 5 мл 10% раствора для инъекций. Список Б. **ФТИВАЗИД (Phthivazidum)** — аналог изониазида с характерным запахом ванилина, плохо растворим в воде. Он медленнее всасывается из кишечника, но лучше, чем предыдущий препарат, переносится больными. Назначают фтивазид для лечения всех форм туберкулеза, как взрослым, так и детям, чаще всего в виде порошка или таблеток. Дозы препарата для пациентов подбираются индивидуально.

С целью предупреждения побочных эффектов одновременно с фтивазидом рекомендуют назначать витамины группы В, особенно тиамин и пиридоксин, а также глутаминовую кислоту. Выпускают фтивазид в порошке и таблетках по 0,1; 0,3 и 0,5 г. Кроме фтивазида аналогами изониазида являются метазид, салюзид, этионамид и протионамид. Последние два представляют препараты второго ряда. **САЛЮЗИД РАСТВОРИМЫЙ (Saluzidum solubile)** используют при различных формах и локализациях туберкулеза и в виде 5% раствора вводят под кожу, в мышцу и вену, спинномозговой канал и полости. Под кожу и в мышцу вводят за одну инъекцию по 0,5—1 г, а в вену — по 0,5 г. В форме аэрозоля используют интратрахеально или интра- бронхально по 2—3 мл на ингаляцию. Не рекомендуют применять препарат при органических изменениях в ЦНС, заболеваниях почек нетуберкулезного характера, сопровождающихся нарушением выделительной функции. Выпускают салюзид растворимый в порошке и ампулах по 1 и 2 мл 5% раствора. **МЕТАЗИД (Methazidum)** по противотуберкулезной активности близок к фтивазиду и используется при всех формах туберкулеза. Назначают препарат внутрь по 0,5 г 2 раза в день. Он хорошо переносится больными, и лишь в редких случаях проявляются его побочные эффекты. Выпускают метазид в таблетках по 0,1; 0,3 и 0,5 г в упаковке по 100 штук. **ЭТИОНАМИД (Ethionamidum)** — синтетический противотуберкулезный препарат второго ряда, активен в отношении возбудителей заболевания, в том числе штаммов, устойчивых к изониазиду и стрептомицину. Назначают этионамид внутрь в таблетках по 0,25 г после еды 3—4 раза в день. При его применении возможны побочные явления в виде тошноты, метеоризма, боли в животе, расстройства стула и снижения аппетита. Выпускают препарат в форме таблеток и драже по 0,25 г № 50. **ПРОТИОНАМИД (Protionamidum)** по химической структуре и действию сходен с этионамидом, но менее токсичен, и побочные эффекты его значительно слабее выражены. Используют препарат при различных формах туберкулеза как самостоятельно, так и в комбинациях с другими препаратами. Применяют внутрь в таблетках по 0,25 г после еды 3 раза в день. Выпускают протионамид в таблетках по 0,25 г № 50.

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	54стр. из 164	

Препараты этионамид, протионамид, этамбутол, тизамид, тиацетазон и др. в основном рассматривают как препараты второго ряда, используемые в перерывах между циклами лечения туберкулеза или при устойчивости возбудителя к препаратам первого ряда. Большинство из них представляют собой противотуберкулезные средства различных химических групп.

3.3. Производные парааминосалициловой кислоты К этой группе препаратов относится сама пара-аминосалициловая кислота (ПАСК), ее натриевая соль, Бепаск и др. НАТРИЯ ПАРА-АМИНОСАЛИЦИЛАТ (Natrii para-aminosalicylas) относится к основным противотуберкулезным средствам, обладающим бактериостатическим действием в отношении микобактерии туберкулеза. По силе воздействия на возбудителя туберкулеза она уступает антибиотикам и изониазиду, поэтому для получения хорошего эффекта их комбинируют с другими противотуберкулезными средствами. Подобное применение препаратов более эффективно, оно замедляет развитие лекарственной устойчивости у возбудителя и усиливает действие соответствующих препаратов. Механизм действия препаратов ПАСКа, как и сульфаниламидных средств, основан на конкурентном антагонизме между парааминобензойной кислотой (ПАБК) и парааминосалициловой кислотой (ПАСК), где ПАБК выступает в роли метаболита, а ПАСК — антиметаболита (рис. 5). Эта замена одного препарата на другой нарушает синтез белка возбудителя заболевания и постепенно приводит к его гибели. При замене атома водорода в гидроксильной группе на другие атомы или радикалы можно получить аналогичные препараты, имеющие меньшее количество побочных эффектов.

Назначают препарат по 3—4 г на прием внутрь 3 раза в день, а 3% раствор вводят в вену капельно до 6 раз в неделю при постоянном наблюдении врача. Лекарственные формы для внутреннего применения назначают через 30—60 минут после еды, запивают молоком или щелочной минеральной водой, а при ее отсутствии — водой с небольшим количеством натрия гидрокарбоната. Не следует применять натрия пара-аминосалицилат при гепатите, нефрите, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, микседеме, циррозе и т.д. Выпускают препарат в порошке, таблетках по 0,5 г № 150, таблетках, растворимых в кишечнике, по 0,5 г, покрытых оболочкой, № 100 и в гранулах в упаковке по 100 г. БЕПАСК (Bepasc) по действию и применению близок к натриевой соли парааминосалициловой кислоты. Применяют его в тех же случаях, что и ПАСК-натрия внутрь по 3 г 3—4 раза в день после еды, запивая молоком или щелочной водой. Иногда при применении Бепаска может наблюдаться нарушение функций кишечника, головокружение и аллергия. Выпускают препарат в порошке и таблетках по 0,5 г. ПАСОМИЦИН (Pasomycinum) — комбинированный препарат, состоящий из соли ПАСКа и дигидрострептомицина. Применяют его при различных формах туберкулеза, вводят в мышцу по 0,5—1 г, что обеспечивает достаточную терапевтическую концентрацию препарата в крови и тканях организма. Растворы его готовят непосредственно перед употреблением, используя для разведения препарата 0,5% раствор новокаина или воду для инъекций. При использовании Пасомицина возможны расстройства вестибулярного аппарата, снижение слуха, головокружение и аллергия. Его не следует применять вместе с канамицином и другими антибиотиками-аминогликозидами. Выпускают Пасомицин во флаконах по 0,5 г для инъекций в комплекте с 0,5% раствором новокаина в ампулах по 2 мл.

4. Противоспирохетозные (противосифилитические) средства Сифилис — венерическое заболевание, возбудителем которого является бледная спирохета (бледная трепонема). Заражение сифилисом происходит при непосредственном контакте с больным (половое сношение, поцелуи) или очень редко через предметы, загрязненные спирохетами (зубные

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	55стр. из 164	

щетки). Конечный итог заболевания — разрушение тканей, костей, хрящей, сосудов, внутренних органов, поражение ЦНС с последующим развитием параличей. Если на первой стадии заболевание сравнительно легко поддается лечению, то в третичном периоде лечение идет с большим трудом и полное выздоровление больного становится довольно проблематичным. Лечение больных сифилисом проводят по специальным схемам с применением антибиотиков и средств, повышающих иммунную функцию организма. Среди антибиотиков наиболее часто используют препараты группы пенициллина (соли бензил пенициллина), цефалоспорины (цефтриаксон, цефалоридин), макролидов (эритромицин), тетрациклина (доксциклин) и др. ЭКСТЕНЦИЛЛИН (Extencillinum), или бензатин бензилпенициллина, относится к группе бета-лактамов антибиотиков из числа пенициллинов пролонгированного действия. Оказывает бактерицидное действие на чувствительные к нему микроорганизмы за счет подавления синтеза муколипидов клеточной оболочки. Эффективен в отношении трепонем (спирохет), вызывающих сифилис и фрамбезию (тропическое инфекционное заболевание). Применяют препарат для профилактики обострений суставного ревматизма (сравни — Бициллин-1, -5), лечения сифилиса и других заболеваний, вызываемых трепонемами. Для лечения сифилиса препарат в виде суспензии вводят по 2.400.000 ЕД 1 раз в 8 дней. Растворы Экстенциллина готовят непосредственно перед применением путем разведения в 8 мл воды для инъекций и тщательно перемешивают, избегая образования пены. Суспензия препарата может храниться в холодильнике не более суток. Побочные эффекты и противопоказания такие же, что и для всех препаратов группы пенициллинов. Выпускают Экстенциллин в порошке для приготовления суспензии во флаконах по 5 мл, содержащих 600.000 МЕ или 1.200.000 МЕ, и по 15 мл, содержащих 2.400.000 МЕ препарата. Иногда для лечения сифилиса используют препараты висмута как самостоятельно, так и в комплексе с антибиотиками.

Противовирусные средства В данной теме рассматриваются лекарственные средства, используемые для лечения и профилактики многих вирусных заболеваний (грипп, герпес), которые нередко охватывают широкие массы людей и значительные территории, нанося огромный ущерб многим государствам мира.

Цель. При изучении темы особое внимание следует обратить на следующее.

1. Общую характеристику противовирусных средств.
2. Перечень заболеваний, вызываемых вирусами.
3. Особенности действия и схемы применения противовирусных средств для лечения и профилактики заболеваний.
4. Роль интерферона в лечении вирусных заболеваний.
5. Фармакологические особенности отдельных противовирусных средств.
6. Пути введения и подготовку к ним противовирусных лекарственных средств.

Вирусы являются основой многих инфекционных заболеваний человека. Среди них широко известны грипп, герпетические инфекции, корь, свинка, ветрянка, клещевой энцефалит, полиомиелит, бешенство, СПИД и др. Нередко вирусные инфекции сопровождаются тяжелыми осложнениями, требующими частого длительного лечения. Попадая в ткани организма, вирусы начинают размножаться, нарушают метаболические процессы в клетках и создают условия для построения вирусных РНК и ДНК. В ходе размножения они способны изменять свою структуру, варьировать и вызывать разнотипные заболевания, отличающиеся друг от друга лишь небольшим набором признаков, например гепатиты типа А, В, С, различные формы гриппа и др. Для предупреждения вирусных заболеваний широко

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	56стр. из 164	

используют различные вакцины, а для лечения — большую группу противовирусных средств, в числе которых препараты интерферон, Арбидол, Ремантадин, Ацикловир, Оксолин, Бонафтон и др. ИНТЕРФЕРОН (Interferonum) — особый белок, образующийся в организме человека в ответ на заражение его клеток вирусами и вызывающий их гибель. Получают лейкоцитарный человеческий интерферон из донорской крови, а методом генной инженерии синтезируют его аналог — реаферон. Интерферон используют для лечения и профилактики всех видов гриппа и острых респираторных вирусных инфекций (ОРВИ). С лечебной целью интерферон начинают применять с первых признаков заболевания, так как считают, что эффективность препарата тем выше, чем раньше начнется лечение.

Применяют интерферон в виде раствора, который приготавливают непосредственно перед употреблением, добавляя в ампулу с сухим препаратом 2 мл кипяченой воды комнатной температуры. Розовый раствор препарата закапывают в полости носа по 5 капель через 1—2 часа не менее 5 раз в день на протяжении 2—3 дней. Лучшим способом применения интерферона считают ингаляции, для чего содержимое трех ампул растворяют в 10 мл слегка подогретой воды и проводят ингаляции с помощью любого ингалятора 2 раза в сутки с интервалом не менее 2 часов. При вирусных поражениях глаз (вирусный конъюнктивит) раствор интерферона применяют в виде глазных капель несколько раз в день. Выпускают интерферон в форме порошка в ампулах по 2 мл. АРБИДОЛ (Arbidolum) — активный противовирусный и иммуномодулирующий препарат, подавляющий жизнедеятельность вирусов гриппа А и В. Одновременно он повышает устойчивость организма к другим вирусным инфекциям, снижает частоту обострений хронических заболеваний и сокращает продолжительность болезни. Используют Арбидол для лечения гриппа типа А и В, ОРВИ, в том числе осложненных бронхитом или пневмонией, а также рецидивирующей герпетической инфекции. Для лечения гриппа препарат назначают до еды по 0,2 г 4 раза в день в течение 3 суток. Детям в зависимости от возраста дозы снижают до 0,025—0,1 г, а продолжительность не сокращают. В случае контакта с больными для профилактики принимают по 0,2 г препарата в сутки в течение 10—14 дней, а в период эпидемии гриппа или сезонного роста заболеваемости ОРВИ — по 0,1 г 1 раз в день в течение 3 недель. Не рекомендуют применять Арбидол при сопутствующих заболеваниях сердечно-сосудистой системы, печени, почек и при индивидуальной непереносимости препарата. Выпускают Арбидол в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,05 и 0,1 г. Список Б. РЕМАНТАДИН (Remantadinum) — химиотерапевтический препарат, эффективный против вируса гриппа типа А и оказывающий антиоксидантное действие при гриппе, вызываемом вирусом В. Назначают ремантадин при ранних симптомах гриппа для лечения и профилактики его в период эпидемий. Применяют после еды по схеме: 1-й день — по 2 таблетки 3 раза в день, 2 и 3-й день — по 2 таблетки 2 раза в день и в 4-й день — по 2 таблетки 1 раз в день. Для профилактики препарат назначают по 1 таблетке 1 раз в сутки в течение 10—15 дней в зависимости от очага и характера заболевания пациента.

Иногда при использовании ремантадина у пациентов возникают боли в животе, его не рекомендуют применять при беременности, тиреотоксикозе, острых заболеваниях почек и печени. Выпускают ремантадин в таблетках по 0,05 г в упаковке по 20 штук. МАЗЬ ОКСОЛИНОВАЯ (Unguentum Oxolini) активна в отношении вируса гриппа и простого герпеса. Ее применяют при вирусных заболеваниях глаз, кожи, вирусных ринитах и т.д. С профилактической целью ее используют при пузырьковом и опоясывающем лишае, бородавках, чешуйчатом лишае и других заболеваниях. Для профилактики гриппа используют 0,25% мазь, которой при контакте с больным утром и вечером смазывают слизистую носа в течение 20 дней, т.е. в течение всего периода эпидемии. При

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	57стр. из 164	

опоясывающем лишае и других кожных заболеваниях используют оксолиновую мазь, которой 2—3 раза в день смазывают пораженные места в течение 2—8 недель. Во время применения оксолиновой мази иногда возникает быстро проходящее чувство жжения. Выпускают оксолиновую мазь 0,25% в тубах по 10 г и 3% мазь в упаковке по 30 г. АЦИКЛОВИР (Aciclovir), синоним: Зовиракс, взаимодействует с вирусными ферментами, что постепенно вызывает их гибель. При герпесе ацикловир предупреждает образование новых элементов сыпи, снижает вероятность осложнений, ослабляет боль в острой фазе опоясывающего лишая и оказывает иммуностимулирующее действие. Применяют ацикловир для лечения инфекций, вызванных простым герпесом, генитальным герпесом, герпесом энцефалита и др. Назначают раствор ацикловира для введения в вену (капельно), внутрь в таблетках по 0,2 г до 5 раз в день, для профилактики — по 1 таблетке 4 раза в день, а при опоясывающем лишае — по 4 таблетки 5 раз в день до исчезновения признаков заболевания, после чего продолжают лечение еще в течение 3 дней. Глазную мазь ацикловира применяют при герпетическом кератите, закладывая ее в конъюнктивальный мешок до 5 раз в день 10 дней подряд. Ацикловир хорошо переносится больными, но иногда вызывает побочные эффекты в виде тошноты, расстройства кишечника, увеличения содержания в организме мочевины и билирубина.

Выпускают ацикловир во флаконах по 0,25 г для инъекций, таблетках по 0,2 г № 20 и № 100 штук в упаковке, а также в виде 3% глазной мази в тубах по 5 г. ТЕБРОФЕН (Tebrofenum) — синтетический препарат, активный в отношении многих видов вирусов, оказывающий при этом вирусо-цидное действие. Используют препарат в виде 0,5% мази при вирусных поражениях глаз (кератоконъюнктивит), вызванных вирусом простого герпеса. Для лечения вирусных поражений кожи (опоясывающий герпес) применяют 2 и 5% мазь теброфена. Реже мазь используют для лечения простых и плоских бородавок у детей. В глазной практике 0,5% мазь закладывают за края век 3—4 раза в день 2—4 недели подряд, а при кожных заболеваниях 2 или 5% мазь наносят на пораженные участки 2—4 раза в день в течение недели. При применении мази иногда наблюдается легкое жжение, которое проходит довольно быстро. Выпускают теброфен в виде 0,5% глазной мази по 10 г в тубах, 2 и 5% мази по 30 г для применения в дерматологической практике. Кроме указанных выше препаратов для лечения вирусных заболеваний глаз используют мазь флореналевую, кожных поражений — мазь ридоксоловую и алпизариновую и др. Для лечения СПИДа назначают препараты Хивид и Криксаван, Инваридаза, а для лечения хронического активного инфекционного гепатита — препараты Вэлферон, Реоферон-А, Реальдирон и др.

6. Противогрибковые (противомикозные) средства Микозы — это заражение организма человека патогенными грибами. Различают кандидомикозы, дерматомикозы и глубокие (системные) микозы. Для лечения грибковых заболеваний используют лекарственные средства различной химической структуры, отличающиеся друг от друга спектром противомикозного действия и способами их применения. Среди них антибиотики (нистатин, леворин), производные имидазола (клотримазол, кетеконазол), комбинированные (ми-косептин, миконазол) и другие препараты. НИСТАТИН (Nistatinum) — высокоактивный антибиотик в отношении дрожжеподобных грибов рода *Candida*. Применяют нистатин в таблетках, мазях, суппозиториях для лечения и профилактики кандидомикозов слизистых оболочек, кожи, внутренних органов. Он плохо растворим в воде и почти не всасывается из кишечника, создавая в нем необходимую для лечения концентрацию препарата. Назначают нистатин по 250.000 и 500.000 ЕД 3—4 раза в день. Курс лечения зависит от характера заболевания и локализации очага поражения.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс		58стр. из 164

Нистатин редко вызывает побочные эффекты, которые могут проявляться в виде повышения температуры, тошноты, расстройства кишечника и др. Выпускают нистатин в таблетках, покрытых оболочкой, по 250.000 и 500.000 ЕД в упаковке по 20 штук, в виде 10% мази в тубах по 15 г, в форме ректальных суппозиториях по 500.000 ЕД и вагинальных суппозиториях по 250.000 ЕД по 10 штук в упаковке. ЛЕВОРИН (Levorinum) активен в отношении дрожжеподобных грибов и некоторых представителей простейших (трихомонады). Он малотоксичен и не обладает кумулятивными свойствами. Назначают Леворин при грибковых поражениях слизистых оболочек полости рта, желудочно-кишечного тракта, женских половых органов, кожи и с целью профилактики кандидомикозов. Применяют Леворин внутрь по 400.000 или 500.000 ЕД 2—3 раза в день в течение 10—12 дней, а местно используют 5% мазь. Для лечения кандидозов половых органов у женщин используют вагинальные суппозитории, содержащие 250.000 ЕД препарата. Выпускают Леворин в таблетках по 500.000 ЕД, в виде мази 5%, содержащей 500.000 ЕД в 1 г препарата, вагинальных суппозиториях по 250.000 ЕД в упаковке по 10 штук. АМФОТЕРИЦИН В (Amphotericinum B) активен в отношении не только дрожжеподобных грибов, но и многих возбудителей глубоких и системных микозов (спиотрихоз, гистоплазмоз). Он почти не всасывается из кишечника и поэтому малотоксичен. Препарат показан к применению в случаях грибковых заболеваний, не поддающихся воздействию других противогрибковых средств. Вводят препарат в вену капельно через день или 2 раза в неделю из расчета 250 ЕД на 1 кг веса больного. Продолжительность лечения составляет 4—8 недель, а раннее прекращение лечения может привести к рецидивам. При применении амфотерицина В иногда возникают побочные явления в виде головной боли, снижения аппетита и снижения артериального давления. Выпускают амфотерицин В во флаконах по 500.000 ЕД в комплекте с 5% раствором глюкозы по 450 мл. ДЕКАМИН (Decaminum) назначают местно при кандидозах кожи, ногтей, ногтевых валиков, эпидермофитии стоп, при воспалительных поражениях полости рта и при молочнице рта.

При грибковых поражениях кожи используют 0,5 и 1% мазь, а при воспалительных заболеваниях полости рта и молочнице употребляют карамель с декамином, которую по 1—2 штуки держат под языком до полного рассасывания каждые 3—5 часов подряд. Выпускают препарат в виде карамели по 0,00015 г № 100, мазь 0,5 и 1 % в упаковке по 30 г. КЛОТРИМАЗОЛ (Clotrimasol) — противогрибковый и противомикробный препарат широкого спектра действия. Применяют при микозах, вызванных дерматофитами, плесневыми и почкующимися грибами, а также при трихомонадном кольпите. В последнем случае таблетки по 0,1 г вводят во влагалище на ночь. При дерматомикозах препарат втирают или смазывают пораженные участки в течение 3—4 недель. Выпускают клотримазол в таблетках по 0,1 г, в виде 1 % крема по 20 г и 1 % раствора по 15 мл. МАЗЬ «МИКОЗОЛОН» (Uguentum Mucosolonum) — комбинированный препарат, в состав которого входят деперзолон и миконазол. В препарате объединено противовоспалительное и противоаллергическое действие кортикостероида деперзолон и противогрибковое действие миконазола, что значительно расширяет спектр действия препарата. Мазь применяют при инфекционных поражениях кожи и ногтей, вызванных дерматофитами или грибами, а также при микозах, сопровождающихся бактериальной инфекцией; наносят на пораженный участок 1—2 раза в день до полного излечения. Противопоказанием к применению мази служат туберкулез, герпес, ветряная оспа и другие заболевания. Выпускают мазь в тубах по 15 г. «МИКОСЕПТИН» (Mycoseptin) — комбинированный препарат, обладающий фунгистатическим и фунгицидным действием. Кроме того, он

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	59стр. из 164

оказывает антисептическое и подсушивающее действие. Используют «Микосептин» при грибковых поражениях кожи, например при эпидермофитии, дрожжеподобных дерматомикозах и т.д. Применяют наружно, смазывая пораженные участки 1—2 раза в день в течение 2—3 недель и далее 1—2 раза в неделю в течение месяца. Выпускают препарат в тубах по 30 г.

7. Противопротозойные и противоглистные средства В эту группу лекарственных средств входят соединения различной химической структуры, способные подавлять возбудителей инфекционных заболеваний, вызываемых простейшими (плазмодии, трихомонады, лямблии) и различными гельминтами. Именно то обстоятельство, что они вызывают большое число часто встречающихся инфекционных заболеваний, определяет необходимость изучения данного раздела.

Цель. При изучении тем данного раздела следует обратить особое внимание на следующее.

1. Понятие «протозойная инфекция» и виды ее возбудителей.
2. Особенности течения малярии и ее формы.
3. Особенности действия и применения противомаларийных средств.
4. Сравнительную характеристику противомаларийных средств.
5. Общую характеристику средств для лечения трихомоноза.
6. Общую характеристику средств для лечения амебиаза и лямблиоза.
7. Классификацию гельминтов и противогельминтных средств.
8. Требования, предъявляемые к противоглистным средствам.
9. Особенности действия и применения противонематодозных и противоцестодозных средств.
10. Средства, применяемые при внекишечных гельминтозах.

7.1. Противопротозойные средства Противомаларийные средства Малярия — инфекционное заболевание, возбудителем которого являются малярийные плазмодии, а переносчиком — малярийный комар. Заболевание проявляется в виде приступов лихорадки, повторяющихся с определенной периодичностью и сопровождающихся разрушением эритроцитов, тканей, их образующих, нарастанием анемии, поражением печени, селезенки и костного мозга. Различают малярию ежедневную, или тропическую, приступы ее повторяются каждые 24 часа; трехдневную — ее приступы возникают через 48 часов; и четырехдневную, когда лихорадка проявляется примерно через 72 часа.

Малярийные плазмодии в организме человека размножаются бесполом путем и могут существовать в преэритроцитарной, эритроцитарной, параэритроцитарной формах и в виде гамонтов (незрелые половые клетки). Каждая форма плазмодиев влияет на течение заболевания определенным образом. Приэритроцитарная форма характеризует инкубационный период, эритроцитарная — способствует клиническим проявлениям заболевания, развитию приступов лихорадки и малярийной комы, параэритроцитарная форма грозит развитием рецидивов, а гамонты участвуют в заражении комаров и дальнейшем распространении заболевания. В течении малярийного приступа различают две фазы: в первой наблюдается озноб, лихорадка, а во второй — резкое повышение температуры, обильное потоотделение и общее недомогание. У больных в результате разрушения эритроцитов наблюдаются анемия, лейкопения, увеличение печени, селезенки и общая слабость. В основе борьбы с данной инфекцией лежит следующее: 1) непосредственное лечение больных малярией; 2) профилактика рецидивов заболевания; 3) предупреждение распространения заболевания (общественная химиопрофилактика), имеющая цель не допустить заражение комаров и перенос ими малярии от больного человека здоровому. Противомаларийные средства оказывают неодинаковое действие на

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	60стр. из 164	

различные формы развития малярийного плазмодия, что следует учитывать при их применении. Лечение малярии предусматривает прежде всего прекращение или предупреждение приступов заболевания, а поскольку приступ развивается при участии эритроцитарных форм плазмодиев, живущих в эритроцитах и разрушающих их, то действие препаратов должно быть направлено на их уничтожение. Таким действием обладают препараты хингамин, хиноцид, бигумаль и др. С целью предупреждения рецидивов при трех- и четырехдневной малярии, виновниками которых являются параэритроцитарные (тканевые) формы плазмодиев, используют примахин, хиноцид и др. Для предупреждения распространения заболевания (общественная химиопрофилактика), уничтожения гамонтов, способствующих заражению комаров, применяют примахин, хлоридин и другие лекарственные средства. ХИНГАМИН (Chingaminum), синонимы: Делагил и Хлорохин,— один из наиболее активных противомаларийных препаратов. Он оказывает губительное действие на эритроцитарные формы всех видов плазмодиев и гамонты, предупреждая приступы малярии у больных и ее распространение на здоровых людей. Кроме того, хингамин оказывает противоаритмическое действие, влияет на иммунные процессы, используется для лечения ревматоидного артрита. Для прекращения приступов малярии бывает достаточно трехдневного курса лечения. В 1-й день после еды принимают 1 г (4 таблетки) препарата, а через 6—8 часов — еще 0,5 г (2 таблетки). На 2 и 3-й день назначают препарат по 0,5 г 1 раз в день. Побочные эффекты при использовании хингамина проявляются редко, в основном при длительном применении, и могут выражаться в виде головной боли, расстройства кишечника и некоторых нарушений со стороны зрения. Выпускают хингамин в таблетках по 0,25 г. Список Б. ПЛАКВЕНИЛ (Plaquenil) по химической структуре и типу действия близок к хингамину, но лучше переносится больными, обладает не только противомаларийным, но и иммунодепрессивным действием. Применяют препарат в тех же случаях, что и хингамин. При малярии его назначают по схеме: в 1-й день сразу дают 0,8 г плаквенила, а через 6—8 часов — еще 0,4 г препарата. Во 2 и 3-й день применяют по 0,4 г 1 раз. При ревматоидном артрите и коллагенозах его применяют по 0,4 г 2 раза в день. Выпускают Плаквенил в таблетках или драже по 0,2 г № 10. ХЛОРИДИН (Chloridinum) оказывает выраженное противопро- зойное действие в отношении малярийных плазмодиев, возбудителей токсоплазмоза и лешманиоза. Он подавляет развитие преэритроцитар- ных и эритроцитарных форм всех видов плазмодиев и гамонтов, чем препятствует заражению комаров и распространению заболевания. В связи с широким противомаларийным спектром действия препарат может использоваться для индивидуального лечения больных и общественной химиопрофилактики малярии. Назначают препарат в таблетках по 0,01 г 2—3 раза в день в течение 3 дней, а для индивидуальной профилактики — по 0,025 г 1 раз в неделю в течение всего малярийного сезона. Побочное действие хлоридина характеризуется головной болью, расстройством кишечника, болями в области сердца, анемией или лейкопенией. При заболеваниях кроветворных органов и почек применять хлоридин не рекомендуется. Выпускают хлоридин в таблетках по 0,01 г в упаковке по 10 штук. Список Б.

ПРИМАХИН (Primachinum) оказывает противопротозойное действие на параэритроцитарные и половые формы всех видов плазмодиев. Его применяют для профилактики отдаленных рецидивов трехдневной, четырехдневной и тропической малярии, в том числе и для индивидуальной профилактики вместе с хингамином, и общественной химиопрофилактики. Назначают примахин внутрь в таблетках по 0,009 г 3 раза в день в течение 2 недель. Детям дозы снижают в зависимости от возраста. Побочное действие препарата проявляется иногда в виде расстройства кишечника, болей в области

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к б1стр. из 164	
Лекционный комплекс		

сердца и изменений со стороны крови. Не следует применять примахин при заболеваниях крови и кроветворных органов, болезнях почек, стенокардии и др. Выпускают примахин в таблетках по 0,009 г. Список Б. ХИНОЦИД (Chinocidum) по действию и применению подобен при- махину и применяется для профилактики отдаленных рецидивов всех видов малярии. Назначают внутрь в таблетках по 0,01 г 2 раза в день или по 0,02 г однократно 10 дней подряд, а ослабленным больным — в течение 14 дней. Осложнения при его применении возможны в виде тошноты, цианоза губ, раздражения почек и мочевого пузыря. Выпускают хиноцид в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,01 г № 50. Список Б. Средства для лечения трихомоноза Трихомоноз — заболевание мочеполовой системы, возбудителями которого являются трихомонады. Они могут находиться на поверхности слизистой и в тканях мочеполовой системы, поэтому для лечения трихомонозов используют препараты, оказывающие действие при местном применении и при приеме внутрь. Препараты этой группы хорошо всасываются, накапливаются в моче, выделяются через почки, где оказывают противопрозоидное действие на трихомонады. Для лечения трихомоноза у женщин их назначают комбинированно, т.е. одновременно с приемом препаратов внутрь рекомендуется применять их интравагинально. Последнее объясняется тем, что при приеме внутрь препараты не действуют на трихомонады, находящиеся на слизистой оболочке влагалища. Для лечения трихомоноза используют метронидазол, тиридазол, трихомонацид, фуразолидон и другие препараты.

МЕТРОНИДАЗОЛ (Metronidazolium) используется для лечения трихомоноза, лямблиоза и амёбной дизентерии. Применяют при острой и хронической формах трихомоноза у мужчин и женщин. Его назначают внутрь по 0,25 г 2 раза в день в течение 10 дней, женщинам, кроме того, препарат назначают 1 раз в день ин- травагинально в форме суппозиторий или таблеток по 0,5 г. Противопоказанием к применению метронидазола служит беременность, кормление грудью, нарушение кроветворения, поэтому в ходе лечения желательно делать анализ крови. При использовании метронидазола должно быть исключено потребление алкоголя. Среди побочных эффектов возможны расстройство кишечника, сухость во рту, снижение аппетита, реж — лейкопения. Выпускают метронидазол в таблетках по 0,25 г № 20 и в виде вагинальных суппозиторий по 0,5 г. Список Б. За рубежом препарат выпускают под названием «Флагил» или «Трихопол». **ТРИХОМОНАЦИД (Trichomonacidum)** оказывает противопро- зойное действие на трихомонады. Применяют трихомонацид внутрь в таблетках по 0,1 г 3 раза в день в течение 3—5 дней. Женщинам одновременно рекомендуют использовать вагинальные суппозитории по 0,5 г ежедневно в течение 10 дней на ночь. Лечение обычно проводят в 3 цикла после окончания менструаций. Мужчинам одновременно с приемом препарата внутрь назначают 1% раствор по 10 мл для промывания уретры ежедневно 5—6 дней подряд, а повторить курс лечения можно через 10—20 дней. Выпускают препарат в порошке, таблетках по 0,05 г № 20 и в форме вагинальных суппозиторий по 0,05 г в упаковке по 10 штук. **ТИНИДАЗОЛ (Tinidazolium)** по химической структуре, действию и применению близок к метронидазолу. Используют препарат при трихомонозе у женщин и мужчин, а также для лечения лямблиоза и амёбной дизентерии. Назначают его внутрь по 2 г (4 таблетки) во время или после еды однократно или по 1 таблетке через каждые 15 минут в течение часа. Побочные эффекты у препарата подобны тем же, что и у метронидазола. Выпускают препарат в таблетках по 0,5 г № 40. **НИТАЗОЛ (Nitazolium)** оказывает губительное действие на трихомонады и лямблии, поэтому его часто используют при трихомонадных заражениях половой сферы у мужчин и женщин, а также для лечения лямблиоза.

O'NTÜSTİK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	62стр. из 164	

При трихомонадных заражениях у женщин Нитазол назначают местно и внутрь и лечение начинают сразу после окончания менструации. Сначала обрабатывают половые органы 1% раствором натрия гидрокарбоната, а затем 2,5% суспензией Нитазола, после чего вводят во влагалище суппозитории, содержащие 0,12 г препарата. Одновременно назначают внутрь таблетки по 0,1 г 3 раза в день. При лямблиозе Нитазол назначают внутрь по 0,1 г 3 раза в день во время всего периода лечения. Выпускают Нитазол в таблетках по 0,1 г № 30, в виде 2,5% суспензии по 100 мл и в форме вагинальных суппозиторий по 0,12 г. Список Б.

Средства для лечения лямблиоза Лямблиоз — заболевание, которое вызывают лямблии, жгутиковые паразиты из класса простейших. Они чаще всего паразитируют в кишечнике, желчных протоках и вызывают в них воспалительные процессы (энтерит, энтероколит, холецистит и др.). Для лечения лямблиоза используют большую группу препаратов, в том числе метронидазол, фуразолидон, тинидазол, аминохинол и др. Например, метронидазол в таких случаях принимают по 0,25 г 2—3 раза в день курсами по 5 дней, а тинидазол однократно по 2 г через 40—50 минут после еды или по 0,3 г в сутки в течение 7 дней. При необходимости лечение проводят повторно. АМИНОХИНОЛ (Aminochinolum) — препарат широкого спектра действия. Его применяют для лечения лямблиоза, кожного лейшманиоза, токсоплазмоза, неспецифического язвенного колита, красной волчанки и некоторых коллагенозов. При лямблиозе аминохинол взрослым назначают по 0,15 г 3 раза в день в 2—3 цикла по 5 дней с перерывами в 5—7 дней, а для лечения токсоплазмоза по 0,1—0,15 г 3 раза в день циклами по 7 дней с перерывами в 7—14 дней. Аминохинол обычно хорошо переносится больными и редко вызывает побочные эффекты в виде тошноты, слабости, головокружения, кожной сыпи и зуда. Выпускают аминохинол в таблетках по 0,025 и 0,05 г № 10. Средства для лечения амёбиоза Амёбиоз развивается в результате попадания в организм человека дизентерийной амёбы, относящейся к классу простейших. Заражение организма происходит через пищу или воду, загрязненную инфицированными каловыми массами. Заболевание характеризуется образованием язв в толстом кишечнике, расстройством пищеварения, резким снижением веса и анемией. Амёбы способны проникать в кровь, нарушать функции других органов (легкие, почки, мозг). Для лечения амёбной дизентерии используют метронидазол, антибиотики группы тетрациклина, эметина гидрохлорид и др. ЭМЕТИНА ГИДРОХЛОРИД (Emetini hydrochloridum) подавляет активность дизентерийной амёбы и некоторых видов трематод. Чаще используют для лечения амёбной дизентерии. Вводят препарат парентерально под кожу или в мышцу взрослым по 1,5 мл 1% раствора 2 раза в день ежедневно в течение 6—8 дней. В острых случаях заболевания лечение проводят в 2 цикла с интервалом в 7—10 дней. При применении препарата возможны побочные эффекты в виде болей в мышцах, тошноты, сердечной боли, полиневрита и др. Выпускают эметина гидрохлорид в виде 1% раствора в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 штук. Список Б.

7.2. Противоглистные (антигельминтные) средства Противоглистными называют лекарственные средства, которые используются для изгнания из организма человека глистов (гельминтов). Известно большое количество гельминтов, способных паразитировать в организме человека, наносить ему вред, особенно в детском возрасте. Глистные заболевания (гельминтозы или инвазии) сопровождаются интоксикацией организма, расстройством нервной системы, острой непроходимостью кишечника, состоянием дискомфорта, анемией и т.д. Большой вклад в развитие гельминтологии (наука о гельминтах) и успешную борьбу с глистными заболеваниями внесли академики К.И. Скрябин и Е.И. Павловский. Всех гельминтов принято делить на три класса: 1) нематодозы (круглые черви); 2) цестодозы (плоские черви); 3) трематоды (сосальщики). Заболевания,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	63стр. из 164	

которые они вызывают, называются соответственно нематодозы, цестодозы и трематодозы. Исходя из этого все противоглистные средства делят на три группы: противонематодозные, проти-воцестодозные и противотрематодозные. Учитывая, что гельминты могут паразитировать как в кишечнике, так и вне его, различают кишечные и внекишечные гельминтозы. Кроме того, гельминтозы принято обозначать по виду паразита, например заражение аскаридами называется аскаридоз, власоглавом — трихоце-фалез, острицами — энтеробиоз и т.д.

Противонематодозные средства Эту группу препаратов представляют пиперазина адипинат, мебен-дазол, Медамин, нафтомон, пирантел, левомизол (Декарис) и др. **ПИПЕРАЗИНА АДИПИНАТ** (Piperasini adipinas) оказывает противоглистное действие на различные виды нематод, особенно на аскариды и острицы. Он вызывает паралич мускулатуры гельминтов, обездвиживает их, а затем выводит из организма. Специальной подготовки больных к этой процедуре не требуется, как и слабительных средств. Эффективность лечения аскаридоза и энтеробиоза препаратом достигает 90—95%, а при повторном курсе — 100% результата. Для лечения аскаридоза пиперазина адипинат назначают по 1—2 г на прием за час до еды или через час после нее 2 раза в день в течение 2 дней, а при энтеробиозе — 5 дней подряд. Детям препарат лучше применять в виде 5% раствора. В терапевтических дозах пиперазина адипинат побочных эффектов почти не вызывает, и очень редко наблюдается тошнота, головная боль и мышечная слабость. Выпускают пиперазина адипинат в таблетках по 0,2 и 0,5 г, а также в виде 5% раствора во флаконах по 100 мл. **МЕБЕНДАЗОЛ** (Mebendazolium), синоним: вермокс, — противоглистное средство, используемое для лечения аскаридоза, энтеробиоза, анкилостомоза, трихоцефалеза. Препарат малотоксичен и при приеме внутрь очень медленно выделяется из организма через прямую кишку. При энтеробиозе мебендазол назначают одномоментно по 0,1 г, а при других глистных инвазиях — по 0,1 г в течение 3 дней. Не следует применять препарат при беременности, и недопустимо его использование вместе с алкоголем. Выпускают мебендазол в таблетках по 0,1 г № 6. **СПИСОК Б. ПИРАНТЕЛ** (Pyrantel) — активное противоглистное средство для борьбы с нематодами. Принимают пирантел 1 раз в день после завтрака в виде таблеток для жевания или сиропа. При энтеробиозе и аскаридозе назначают однократно из расчета 10 мг на 1 кг веса больного. Препарат хорошо переносится больными, и лишь иногда возникает головная боль, тошнота и расстройство кишечника. Противопоказан препарат при беременности. Выпускают пирантел в таблетках по 0,25 г № 3 и в виде суспензии во флаконах по 15 мл, содержащих по 0,05 г препарата в 1 мл.

МЕДАМИН (Medaminum) — высокоэффективное средство в отношении многих нематод, в том числе аскарид, остриц, власоглава, анкилостом и других гельминтов. Назначают препарат внутрь в таблетках сразу после еды до 3 раз в день, при этом таблетку разжевывают и запивают небольшим количеством воды. Эти процедуры выполняют в течение одного дня, повторить лечение можно лишь через 2—3 недели. Из побочных эффектов иногда отмечают тошноту и аллергические реакции. Выпускают Медамин в таблетках по 0,1 г в упаковке по 10 штук. **ДЕКАРИС** (Decaris), синоним: левамизол, — противоглистное средство широкого спектра действия. Он вызывает паралич мускулатуры паразитов и их гибель, используется для лечения аскаридоза, анкилостомоза, некатороза, трихоцефалеза и других инвазий. Назначают Декарис перед сном взрослым по 0,15 г, а детям из расчета 2,5 мг на 1 кг массы тела ребенка. Среди побочных явлений в отдельных случаях возможны тошнота, головная боль, расстройство кишечника и другие симптомы, как правило, не требующие дополнительного использования лекарственных средств.

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	64стр. из 164	

Выпускают Декарис в таблетках по 0,15 г в упаковке 1 штука и по 0,05 г в упаковке 2 штуки. Список Б. В России препарат выпускается под названием «Левамизол», который используется не только для борьбы с гельминтозами, но и как иммуномодулятор, повышающий иммунитет организма. С этой целью его рекомендуют применять при ревматоидном артрите и больным с хроническими неспецифическими заболеваниями легких. Противоцестодозные средства Возбудителями кишечных цестодозов являются ленточные черви, относящиеся к роду цепеней: вооруженный (свиной) цепень, невооруженный (бычий) цепень, карликовый цепень, широкий лентец и др. Лечение цестодозов (дифиллоботриоз, тениаринхоз, гименолепидоз) по ряду причин сложнее и почти всегда проводится в условиях стационара под наблюдением медицинского персонала. Для лечения кишечных цестодозов используют фенасал, аминоа-крихин, мекаприн, никлосамид, семена тыквы и другие средства. ФЕНАСАЛ (Phenasalum) — наиболее эффективное средство для борьбы с инвазиями, причинами которых являются заражения организма вышеназванными гельминтами, кроме инвазий, вызванных вооруженным цепнем из-за опасности развития цистицеркоза.

При тениаринхозе и дифиллоботриозе препарат принимают однократно утром натощак или вечером через 3—4 часа после легкого ужина. Перед приемом фенасала таблетки тщательно измельчают в теплой воде, а перед их применением больному дают 2 г натрия гидрокарбоната (питьевая сода). Через 2 часа после этого можно выпить стакан сладкого чая. Слабительное при этом не назначают. Фенасал малотоксичен и лишь в комбинации с другими антигельминтными средствами иногда вызывает расстройство кишечника. Выпускают фенасал в форме порошка и в таблетках по 0,25 г. Список Б. СЕМЕНА ТЫКВЫ (Semen Cucurbitae) содержат значительное количество жирного масла, фитостерин, витамины группы В, аскорбиновую кислоту и другие вещества. Для лечения цестодозов пригодны только свежие или высушенные семена. Вещества, оказывающие губительное действие на гельминтов, находятся в основном в зеленой оболочке, покрывающей семядоли. В качестве антигельминтного средства назначают по 300 г растертых в ступе семян (можно добавить мед) и полученную массу небольшими порциями принимают в течение 30 минут, а через три часа после этого принимают слабительное и еще через полчаса делают клизму. Выпускают семена тыквы в картонной упаковке по 100 и 150 г. Противотрематодозные средства (средства для лечения внекишечных гельминтозов) Среди трематодозов наиболее часто встречается описторхоз, кло-норхоз, фасциолез, шистосомоз и др. Чаще всего трематоды поражают печень, желчные протоки, кровеносные сосуды мочевого пузыря и кишечника. К счастью, заражения этими гельминтами по сравнению с кишечными встречаются значительно реже. Лечение трематодозов проводится в основном в стационаре медицинским персоналом, имеющим специальную подготовку. Для борьбы с трематодозами используют хлоксил, хлорохин, пра-зиквантел, ниридазол, стифен и другие препараты. ПРАЗИКВАНТЕЛ (Praziquantel) — противотрематодозное средство, вызывающее гибель различного вида шистосом, печеночной и легочной двуустки. Назначают препарат в течение 1—2 дней по 0,025 г на 1 кг массы тела больного 3 раза в сутки. При применении празиквантела иногда у больных возникают боли в животе, тошнота, крапивница и неприятные быстро проходящие после окончания лечения ощущения.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	65стр. из 164	

Задание 1. Укажите, к каким из изучаемых групп относятся следующие лекарственные средства: 1) Фтивазид; 2) Оксолин; 3) Арби- дол; 4) Экстенциллин; 5) Канамицин; 6) Ремантадин; 7) Ацикловир; 8) Изониазид, 9) Интерферон, 10) ПАСК-натрий.

Задание 2. Укажите из перечисленных препараты для лечения нема- тодозов, цестодозов и трематодозов: пиперазина адипинат, фенасал, мебендазол, празиквантел, пирантел, семена тыквы, хлосил, декарис, меркаприн, медамин.

1. Тема. Средства, влияющие на периферическую нервную систему.

2. Цель. При изучении данной темы следует обратить внимание на следующее.

1. Классификацию средств, влияющих на афферентную иннервацию.
2. Особенности влияния различных фармакологических групп на чувствительные нервные окончания.
3. Алгоритм характеристики лекарственного средства.
4. Области применения отдельных фармакологических групп лекарственных средств, влияющих на афферентную иннервацию.
5. Показания и противопоказания к применению отдельных лекарственных средств.
6. Формы выпуска и правила выписывания лекарственных средств этих групп в рецептах.
7. Выбор лекарственной формы, ее процентной концентрации или дозы в зависимости от конкретной ситуации, возраста пациента и избранного пути введения.
8. Правила хранения отдельных лекарственных средств в условиях стационара больницы, фельдшерского пункта и т.д.

3. Тезисы лекции.

Лекарственные средства данной группы в основном оказывают влияние на чувствительные нервные окончания (рецепторы), где зарождаются импульсы, несущие информацию по афферентным нервным волокнам в центральную нервную систему. Влияние различных фармакологических групп лекарственных средств на чувствительные нервные окончания неодинаково. Одни из них способны временно выключать рецепторы (анестезирующие средства), другие — блокировать, притуплять их активность, третьи — возбуждать (раздражать) их. На основании этого вещества, влияющие на афферентную иннервацию, можно рассматривать:

- 1) как вещества, угнетающие чувствительные нервные окончания или препятствующие их возбуждению; 2) вещества, возбуждающие (раздражающие) чувствительные нервные окончания.

К первой группе относятся анестезирующие, вяжущие, обволакивающие, адсорбирующие и другие вещества. Во вторую группу включают раздражающие, слабительные и рвотные средства. Последние две группы будут рассмотрены позже в соответствующих разделах.

Анестезирующие средства Анестезия (а, ап — отрицание, отсутствие и aesthesia — чувство, ощущение) — временная потеря болевой чувствительности на месте введения препарата с сохранением ее на остальных участках тела и с сохранением сознания. Поскольку обезболивание наступает на участке, куда введен препарат, анестезию принято называть местной. Обезболивание и потеря чувствительности происходят в данном случае не только за счет выключения чувствительных нервных окончаний, но и за счет блокады проведения возбуждения (импульсов) по чувствительным нервным волокнам. Последнее отличает анестезирующие вещества от всех остальных групп лекарственных средств, влияющих на афферентную иннервацию. Различают несколько видов местной анестезии (рис. 8). 1. Поверхностная (терминальная) анестезия проводится путем нанесения (в виде капель,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к 6бстр. из 164	
Лекционный комплекс		

смазывания) анестезирующих веществ на слизистые оболочки глаза, носоглотки, прямой кишки и др. Она используется в глазной практике при удалении инородных тел, при операциях, в терапии, хирургии, оториноларингологии, при интубации, введении бронхоскопов, гастроскопов, при трещинах слизистой прямой кишки ит.д.

Спинальный мозг волокно Нервные окончания

2. Проводниковая анестезия осуществляется с помощью шприца в виде инъекций. Лекарство при этом вводится в ткани по ходу рецепторов и нервных волокон. Блокада последних вызывает потерю чувствительности не только на месте инъекции, но и выше по ходу нерва. Этот вид анестезии используют в хирургии при травмах, операциях на конечностях, при вскрытии панарициев, удалении зубов и т.д. Разновидностью проводниковой анестезии является спинномозговая анестезия, при которой стерильные растворы анестезирующих веществ вводят в спинномозговой канал на уровне поясничного отдела спинного мозга. При этом происходит блокада всех чувствительных нервных волокон, входящих в пояснично-крестцовый отдел спинного мозга, развивается анестезия нижней половины туловища, внутренних органов и нижних конечностей. 3. Инфильтрационная анестезия — постепенное, послойное пропитывание толщи ткани анестезирующим веществом. Для ее проведения берут растворы малой концентрации 0,25—0,5%, но в достаточно больших объемах 200—500 мл. При этой анестезии теряют чувствительность не только чувствительные нервные окончания (рецепторы), но и нервные волокна, находящиеся в области введения препарата. Этот вид анестезии используют в хирургии при небольших операциях, травмах, ушибах, ушивании краев ран. Механизм действия анестезирующих средств довольно сложен. Они временно изменяют физико-химические свойства нервного волокна, в результате чего при раздражении чувствительные рецепторы не возбуждаются и оно не передается по нервным волокнам в центральную нервную систему. Современная медицинская практика для местной анестезии использует новокаин, лидокаин, тримекаин, ультракаин, пиромекаин, дикаин, анестезин и др. **НОВОКАИН (Novocainum)**, прокаина гидрохлорид, — активный анестетик, хорошо растворим в воде, используется для всех видов анестезии, кроме поверхностной. Последнее объясняется тем, что препарат в виде водного раствора почти не способен проникать через поврежденные ткани и слизистые в их толщу. Однако новокаин в виде таблеток, порошков и суппозиторий используют для поверхностной анестезии, но только в тех случаях, когда на поверхности слизистой или ткани имеются раны, язвы, трещины и т.д. Для инфильтрационной анестезии используют 0,25—0,5% растворы, для проводниковой — 1—2% растворы, а для спинномозговой — 5% раствор. Кроме того, слабые растворы новокаина используют для разведения антибиотиков, других препаратов, блокады по А. А. Вишневскому. Чтобы предупредить всасывание новокаина в кровь и увеличить время анестезии, к его растворам добавляют 0,1% раствор адреналина гидрохлорида из расчета 1 капля на 5—10 мл препарата. Новокаин иногда назначают внутрь в виде 0,25—0,5% раствора по 1—2 столовые ложки на прием и ректальных суппозиторий по 0,1 г, например при трещинах прямой кишки, геморрое и т.д.

ПОМНИТЕ! Новокаин у ряда больных вызывает аллергические реакции (!). В этих случаях он может быть заменен анестезирующим средством иной химической структуры, например лидокаином или тримекаином.

Выпускают новокаин в порошке; ампулах по 1, 2, 5 и 10 мл 0,25 и 0,5% растворов; ампулах по 1, 2, 5 и 10 мл 1 и 2% растворов; во флаконах, содержащих по 200 и 400 мл 0,25 и 0,5% стерильных растворов; в виде 5 и 10% мази и ректальных суппозиторий по 0,1 г. Новокаин входит в состав анестезирующей жидкости «Меновазин», используемой для растирания

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	67стр. из 164	

при миозите, радикулите, артрите и т.д. Список Б. ДИКАИН (Dicainum) — аналог новокаина, но отличается от него высокой токсичностью, поэтому применяется только для поверхностной анестезии. Во избежание всасывания препарата в кровь к нему обязательно добавляют сосудосуживающие средства. Используют растворы дикаина в глазной практике — 0,25—2%, в отоларингологии — 1—3%, для анестезии гортани, при бронхоскопии, эзофагоскопии — 1—3% раствор и т.д. Выпускают дикаин в порошке для приготовления растворов. Список А.

АНЕСТЕЗИН (Anaesthesinum) в отличие от новокаина почти нерастворим в воде, но хорошо растворяется в жирах и спирте. Применяют только для поверхностной анестезии при миозитах, зуде, трещинах прямой кишки и т.д. Его назначают в виде мази, пасты, суппозиториев по 0,1 г и в составе присыпок. Выпускают Анестезин в порошке, таблетках по 0,3 г, 5% мази и в виде ректальных суппозиториев по 0,1 г. Анестезин входит в состав комплексных препаратов «Белластезин», «Беллалгин», ректальных суппозиториев «Анестезол» и анестезирующей жидкости «Меновазин». Список Б. ЛИДОКАИН (Lidocainum) — по химической структуре отличается от новокаина и может служить его заменителем в случае аллергии у больного к последнему. Активный анестетик, действует быстро, сильно и продолжительно, хотя его токсичность чуть выше, чем у новокаина.

Можно использовать для всех видов анестезии. Для поверхностной анестезии применяют 1—2% растворы, для проводниковой — 0,5—2% растворы и для инфильтрационной — 0,25—0,5% растворы. Используют лидокаин еще как противоаритмическое средство в комплексной терапии инфаркта миокарда, тахикардии и др. Выпускают лидокаин в порошке, ампулах по 10 и 20 мл 1% раствора, по 2 и 10 мл 2% раствора. Список Б.

ТРИМЕКАИН (Trimescainum) подобен лидокаину, вызывает быструю и глубокую анестезию, менее токсичен, чем новокаин. Применяют для всех видов анестезии, но с обязательным добавлением к нему сосудосуживающих средств. Как и лидокаин, обладает противоаритмическим действием. Выпускают тримекаин в порошке, ампулах по 10 мл 0,25% раствора, по 2 и 10 мл 0,5 и 1% растворов, по 10 мл 2% раствора и по 1 и 2 мл 5% раствора. Список Б. АНИЛОКАИН (Anilocainum) — активный анестетик нового поколения, разработанный отечественными учеными. Препарат обладает хорошо выраженным анестезирующим действием, вызывает стойкую поверхностную анестезию, быстро наступающую глубокую инфильтрационную и проводниковую анестезию, но более продолжительную по времени, чем ранее известные анестетики. Анилокаин хорошо комбинируется с адреналином, который способствует усилению, удлинению и выраженности эффекта. Препарат может быть использован в хирургии, стоматологии, офтальмологии, урологии, акушерстве, гинекологии, при бронхо- и гастроскопии и др.

Для инфильтрационной анестезии рекомендуют использовать до 200 мл 1% раствора, а для проводниковой — 2% раствор объемом до 20—25 мл Анилокаина. Среди побочных эффектов при применении препарата возможны головная боль и снижение артериального давления. Выпускают Анилокаин в виде 1 и 2% растворов в ампулах по 5 мл. Список Б.

Вяжущие средства. Под вяжущим действием понимают обратимую реакцию препаратов этой группы с белками тканей и слизистых, в результате которой образуется временная плотная защитная пленка на их поверхности. Как при внутреннем, так и при наружном применении эта пленка (уплотнение) предохраняет пораженные (воспаленные) ткани от попадания в них микроорганизмов, ядов, способствует остановке кровотечений, заживлению ран, ожогов, трещин, ослабляет болевые ощущения и процессы воспаления и защищает рецепторы от раздражения. Вяжущие средства обычно делят на две группы: 1) вяжущие средства органической природы; 2) вяжущие средства неорганической природы.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	68стр. из 164	

К первой группе вяжущих средств относят препараты растений, например кору дуба, плоды черники, черемухи, корневище лапчатки, траву зверобоя и др. Действующими веществами этих растений являются содержащиеся в них особые химические вещества — танаглизиды. Именно они, вступая в реакцию с белками слизистых, вызывают их осаждение и образуют защитную пленку. И так, механизм действия вяжущих средств может быть представлен следующим образом:

Танаглизиды + Белок о Плотная защитная (временная) пленка.

Из этих растений готовят настои и отвары, которые применяют в виде полосканий при кровотечении из десен и при ангине; в виде примочек для заживления ран, язв, ожогов; внутрь при язвенной болезни, расстройствах кишечника, его воспалении (колит, энтероколит) и т.д. Во вторую группу вяжущих средств входят соли тяжелых металлов, например висмута, цинка, серебра и др., которые кроме вяжущего оказывают прижигающий и противомикробный эффект, но это зависит от концентрации препарата.

Вяжущие средства неорганической природы чаще используют в виде мазей, суппозиториев, присыпок как противомикробные, ранозаживляющие и кровоостанавливающие средства. Реже используют их растворы и в составе твердых лекарственных форм (таблетки) для лечения язв и воспалительных заболеваний желудочно-кишечного тракта. Препаратами этой группы являются висмута нитрат основной, ксероформ, дерматол, цинка окись, серебра нитрат и др. ТАНИН (Taninum) — светло-бурый порошок, хорошо растворимый в воде. Используют 1—2% водный раствор, 5—10% водно-глицериновый раствор для полоскания или смазывания при воспалительных заболеваниях полости рта, зева, гортани и глотки; 3, 5, 10% растворы и мази — для лечения ран, ожогов и трещин, а 0,5—2% растворы применяют для промывания желудка при отравлении солями тяжелых металлов и алкалоидами, с которыми препарат образует нерастворимое соединение и выпадает в осадок. Форма выпуска: порошок. КОРА ДУБА (Cortex Quercus) в виде отвара (1 : 10) используется для полоскания при гингивитах, стоматитах, кровоточивости десен и в виде 20% отвара для примочек при лечении ожогов. ПЛОДЫ ЧЕРНИКИ (Fructus Myrthilli) применяют в детской практике как вяжущее средство при расстройствах кишечника в виде настоя или киселя. ВИСМУТА НИТРАТ ОСНОВНОЙ (Bismuthi subnitras) как вяжущее и слабое антисептическое средство назначают внутрь при воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта (колит, энтерит), при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Назначают в порошках и таблетках по 0,25 и 0,5 г на прием до 3 раз в день; наружно в виде присыпки и 5 и 10% мази для лечения дерматита, экземы и т.д. Висмута нитрат основной входит в состав сложных таблеток «Викалин», используемых для лечения язвы желудка. Выпускают препарат в таблетках по 0,25 и 0,5 г и в виде мази 10%. Препаратами висмута являются Ксероформ, Дерматол и Де-Нол. КСЕРОФОРМ (Xeroformium) — желтый порошок с характерным запахом, содержит более 50% окиси висмута. Применяют как вяжущее, подсушивающее и антисептическое средство в виде присыпки, 3% глазной мази и 10% мази для лечения кожных поражений. Ксероформ входит в состав известного линимента по А.В. Вишневскому и целого ряда других препаратов. Форма выпуска: порошок. ДЕРМАТОЛ (Dermatolum) — аналог Ксероформа. Применяют в виде присыпки, 10% мази и в составе суппозиториев по 0,2 г. Выпускают в виде порошка, 10% мази и суппозиториев по 0,2 г. ДЕ-НОЛ (De-Nol) — коллоидный субцитрат висмута, оказывает вяжущее, обволакивающее, антацидное и цитопротекторное (защитное) действие по отношению к клеткам слизистой желудка и кишечника. При приеме внутрь образует коллоидную массу, которая, равномерно распределяясь по поверхности слизистой желудка, предохраняет ее от разрушения. Препарат показан при язвенной болезни желудка и

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	69стр. из 164

двенадцатиперстной кишки. Назначают Де-Нол по 1—2 таблетки 4 раза в день за 30—60 минут до еды. Выпускают препарат в таблетках по 0,12 г.

Обволакивающие средства Эти вещества за счет своих физико-химических свойств образуют слизь (Mucilago), которая, покрывая (обволакивая) ткани рыхлой пленкой, защищает их от раздражения, но не препятствует, а лишь несколько задерживает всасывание лекарственных веществ. Их применяют при воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта, при отравлениях кислотами, щелочами и другими едкими жидкостями. Обволакивающие средства нередко включают в состав микстур, присыпок и клизм. В качестве обволакивающих средств используют крахмал (Amylum) картофельный, кукурузный, которые с горячей водой образуют слизь (Mucilago Ату И), и семя льна (Semen Lini), слизь из которого готовят в соотношении 1 : 30 перед употреблением.

Адсорбирующие средства Адсорбция — это способность вещества осаждать на своей поверхности другие вещества, газы, яды и т.д. Такой способностью обладают вещества с высокой поверхностной активностью, например активированный уголь, белая глина, магнезия окись и др. В медицинской практике чаще других используют УГОЛЬ АКТИВИРОВАННЫЙ (Carbo activatus). Его назначают при диспепсии, метеоризме (вздутии живота), пищевых отравлениях, отравлениях солями тяжелых металлов, алкалоидами. Осаждая на своей поверхности ядовитые вещества и газы, уголь активированный препятствует, таким образом, их всасыванию из желудочно-кишечного тракта и раздражению рецепторов. Применяют уголь активированный по 20—30 г на прием в виде взвеси в воде при отравлениях или по 1—3 таблетки на прием 3—4 раза в день при расстройствах кишечника, метеоризме или повышенной кислотности. Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,25 и 0,5 г. ЭНТЕГНИН (Entegninum) — энтеросорбент растительного происхождения, обладающий способностью сорбировать микроорганизмы и их токсины, аллергены, газы, ядовитые вещества, при этом он не травмирует слизистую желудочно-кишечного тракта. В основе энтегнина лежит природный полимер растительного происхождения, состоящий в основном из лигнина с добавлением 0,4 г полифепана, обладающего способностью связывать токсические вещества. Применяют препарат как адсорбирующее, дезинтоксикационное, противомикробное и адаптогенное средство при острых кишечных инфекциях, пищевой и лекарственной аллергии, отравлениях, метеоризме, расстройстве кишечника и т.д. Энтегнин полностью выделяется из кишечника, не вызывает дисбактериоза при длительном применении, хорошо переносится больными детьми, беременными женщинами и пожилыми людьми. Выпускается энтегнин в таблетках по 0,4 г.

Раздражающие средства Эти вещества стимулируют (возбуждают) чувствительные рецепторы. Раздражение рецепторов кожи и слизистых оболочек приводит к возникновению импульсов, которые через центральную нервную систему вызывают ответную реакцию со стороны органов или мышц. Следовательно, механизм действия раздражающих средств рефлекторный. Кроме того, они оказывают местное и отвлекающее действие. Рефлекторное действие раздражающих средств легко проследить при применении раствора аммиака (нашатырный спирт) при обмороке. После вдыхания его паров раздражаются рецепторы верхних дыхательных путей и происходит рефлекторное возбуждение центральной нервной системы и дыхательного центра, после чего импульс достигает легких и происходит выдох, вследствие чего усиливается дыхание и восстанавливается сознание. Подобное действие оказывает ментол в составе валидола, при действии которого рефлекторно расширяются сосуды сердца, что используется при лечении стенокардии. Отвлекающее и лечебное действие раздражающих средств

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	70стр. из 164

используют при воспалительных заболеваниях органов дыхания, внутренних органов, мышц, суставов и т.д. В основе раздражающего действия лежит влияние препаратов на определенные участки кожи на теле человека (зоны Захарьина — Геда), которые имеют сопряженную иннервацию с внутренними органами. Например, при воспалительных заболеваниях органов дыхания растирают раздражающими средствами грудь, область лопаток или используют горчичники. Местное действие раздражающих средств проявляется в виде чувства жжения, тепла, пощипывания и покраснения. При этом расширяются сосуды, улучшается питание больных органов и тканей, увеличивается кровоток, количество лейкоцитов и фагоцитов, что способствует уменьшению воспалительного процесса и активизирует функциональное состояние органа или мышцы. Раздражение рецепторов слизистой носа ментолом, наоборот, приводит к сужению сосудов, уплотнению клеточных оболочек, снижению отечности слизистой и прекращению выделения секрета при насморке, расширению носовых проходов и обегчению дыхания. Раздражающие средства используют для лечения воспалительных заболеваний органов дыхания (бронхит), мышц (миозит), нервных корешков спинного мозга (радикулит), суставов (артрит), насморка (ринит) и т.д. К раздражающим средствам относят горчичники, раствор аммиака, препараты ментола, масло терпентинное очищенное (скипидар), пластырь перцовый, различные растирания, которые содержат в своем составе спирт, камфору, кислоту салициловую, змеиный или пчелиный яд. **ГОРЧИЧНИКИ** (*Sinapismata*) представляют собой покрытые обезжиренной горчицей листы бумаги. Перед употреблением их смачивают теплой 36—40 °С водой и в таком виде накладывают на определенные участки кожи на 5—15 минут. Лечебный эффект их обусловлен рефлекторной реакцией, возникающей в результате раздражения нервных окончаний кожи эфирным горчичным маслом. **РАСТВОР АММИАКА** (*Solutio Ammonii caustici*) — прозрачная, летучая, с острым характерным запахом жидкость, содержащая около 10% аммиака. Его применяют для рефлекторного возбуждения дыхания и восстановления сознания при обмороках, отравлениях, травмах, для чего осторожно подносят к носу ватный тампон, смоченный раствором аммиака. Резкое вдыхание больших доз паров аммиака может вызвать урежение сердечного ритма и остановку дыхания (!). Иногда раствор аммиака в качестве рвотного средства по 5—20 капель в 0,5 стакана воды назначают при отравлении, например, алкоголем. В хирургической практике ранее раствор аммиака (25 мл на 5 л теплой воды) использовали для обработки рук хирурга по методу С.И. Спасокукоцкого и И.Г. Кочергина как хорошее моющее и противомикробное средство. **Формы выпуска:** флаконы по 30 мл, ампулы по 1 мл. **МЕНТОЛ** (*Mentholum*) — кристаллический порошок с мятным запахом и охлаждающим вкусом. При втирании в кожу или нанесении на слизистые вызывает ощущение холода, легкого жжения и покалывания, оказывает слабое местное обезболивающее, успокаивающее и противомикробное действие. Применяют ментол при воспалительных заболеваниях верхних дыхательных путей (ринит, фарингит, трахеит) в форме 1 и 2% масляных растворов, в виде таблеток, пастилок для рассасывания в полости рта, капель для носа, а также для смазывания слизистых и ингаляций. При невралгиях, миозитах, суставных болях в виде растирания используют 1 и 2% спиртовые растворы, а при мигрени ментоловым карандашом растирают кожу в области висков. Ментол входит в состав таблеток Валидол, является составной частью капель Зеленина и препарата Корвалол, мазей Бороментол, Эф- камон, анестезирующей жидкости «Меновазин». **Форма выпуска:** порошок, 1 и 2% масляный раствор ментола, 1 и 2% спиртовый раствор, карандаш ментоловый. **МАСЛО ТЕРПЕНТИННОЕ ОЧИЩЕННОЕ** (*Oleum Therebinthi- пае*), или скипидар очищенный, — прозрачная, бесцветная жидкость с

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	71стр. из 164	

характерным запахом и жгучим вкусом. Применяется в качестве раздражающего и отвлекающего средства в составе мазей, линиментов, растираний при миозитах, радикулите, ревматизме, простудных заболеваниях органов дыхания и т.д. Форма выпуска: во флаконах по 50 мл и в виде 10% мази. Кроме перечисленных препаратов к группе раздражающих средств относятся настойка перца (жгучего), перцовый пластырь, препараты, содержащие яд пчел и змей, а также рвотные, слабительные и другие лекарственные средства.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Перечислите основные фармакологические группы, влияющие на афферентную иннервацию.
2. В каких концентрациях раствор новокаина используется для разведения антибиотиков?
3. Почему анестезин и дикаин используются только для поверхностной анестезии?
4. Чем лидокаин отличается от новокаина?
5. Укажите вяжущие средства органической природы.
6. В каких случаях показано применение вяжущих средств?
7. Почему уголь активированный применяют при отравлениях?
8. Укажите несколько препаратов из группы раздражающих средств.
9. При каких заболеваниях показано применение раздражающих средств?
10. Каков механизм действия раствора аммиака при обмороке?

1. Тема. Средства, влияющие на периферическую нервную систему.

2. Цель. При изучении данного раздела необходимо обратить внимание на следующее.

1. Особенности строения эфферентной иннервации.
2. Локализация холинорецепторов и адренорецепторов.
3. Принципы и классификацию средств, влияющих на эфферентную иннервацию.
4. Характеристика фармакологических групп и отдельных препаратов.
5. Показания и противопоказания к применению отдельных лекарственных средств.
6. Формы выпуска и выписывание лекарственных средств в рецептах.
7. Особенности хранения лекарственных средств в условиях лечебного учреждения.
8. Модели работы с лекарственными средствами:
 - а) «от препарата к диагнозу»; б) «от диагноза к препарату».

3. Тезисы лекции.

Эфферентная нервная система несет свои импульсы от центральной нервной системы к исполнительным (эффекторным) органам (внутренние органы, мышцы, железы) и, таким образом, регулирует их функции. Эфферентная нервная система состоит из двух частей: 1) двигательной, или соматической, нервной системы; 2) вегетативной нервной системы, которая в свою очередь делится еще на две: а) парасимпатическую нервную систему (ПСНС), б) симпатическую нервную систему (СНС). Двигательные нервные волокна представляют собой длинные отростки (аксоны), идущие от двигательных нервных клеток (мотонейроны), расположенных в спинном и головном мозге, до скелетных мышц (рис. 9). Импульс (возбуждение), возникающий в двигательных клетках головного или спинного мозга, по нервным волокнам передается к скелетным мышцам и вызывает их сокращение.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	72стр. из 164	

Вегетативная нервная система иннервирует внутренние органы и железы. Каждый внутренний орган, железа одновременно иннервируются двумя системами: с одной стороны, парасимпатической нервной системой, с другой — симпатической нервной системой. Эта иннервация органа осуществляется нервными системами по принципу антагонизма, т.е. одна система, например, расширяет зрачок, усиливает сердечную деятельность, другая, наоборот, — суживает зрачок, ослабляет деятельность сердца. Такая двойная иннервация эффекторных органов необходима для регуляции их деятельности и используется в медицинской практике для восстановления функций, утраченных органом во время болезни.

В структуре и физиологической активности вегетативная нервная система по сравнению с соматической нервной системой имеет свои особенности.

1. Она делится на парасимпатическую (ПНС) и симпатическую (СНС) нервную систему, которые иннервируют органы по принципу антагонизма. Центры парасимпатической нервной системы располагаются в стволовой части головного мозга и в крестцовой части спинного мозга. Центры симпатической нервной системы располагаются между ними, т.е. в грудном и поясничном отделах спинного мозга

2. Нервные волокна парасимпатической и симпатической нервной системы состоят из двух частей. Первые волокна, идущие от клеток, расположенных в центральной нервной системе, называются преганглионарными. Они заканчиваются у промежуточных (ганглионарных) нервных клеток, которые находятся в толще исполнительных органов или вне их. Вторые волокна, идущие от этих нервных клеток до исполнительных (эфферентных) органов, носят название постганглионарных. 3. Между преганглионарным нервным волокном и нервной клеткой, куда оно приходит, а также между постганглионарным волокном и эффекторным органом находятся синапсы — место передачи возбуждения (импульса) с одного нервного волокна на другое, или эффекторный орган. Скопление нервных клеток (синапсов) образует нервный узел, который называется ганглий. Они встречаются как в парасимпатической, так и в симпатической нервной системе. 4. Во всех синапсах эфферентной иннервации возбуждение передается с помощью особых химических веществ — медиаторов. Они образуются в нервных окончаниях и выделяются в синаптическую щель, где вступают в реакцию с соответствующими рецепторами нервных клеток или эффекторных органов, вызывая их возбуждение. Действие медиатора кратковременно, и каждое последующее возбуждение нервных волокон вызывает выделение новых порций медиатора. В окончаниях нервных волокон парасимпатической нервной системы и в преганглионарных волокнах симпатической нервной системы (а также в соматической нервной системе) образуется медиатор ацетилхолин, и эти нервные волокна называют холинергическими. Постганглионарные волокна симпатической нервной системы образуют медиатор норадреналин. Эти нервные волокна называют адренергическими. 5. Рецепторы нервных клеток и эффекторных органов, воспринимающие возбуждение, имеют свои названия. Рецепторы, возбуждающиеся под влиянием медиатора ацетилхолина, получили название холинорецепторов, а возбуждающиеся под действием норадреналина — адренорецепторов.

КЛАССИФИКАЦИЯ ВЕЩЕСТВ, ВЛИЯЮЩИХ НА ЭФФЕРЕНТНУЮ ИННЕРВАЦИЮ
 Фармакологические средства способны влиять на различные этапы передачи возбуждения в синапсах, например на образование медиатора, его выделение, на рецепторы и т.д. В медицинской практике чаще всего используют вещества, действующие на рецепторы. С одной стороны, вещества могут возбуждать рецепторы и как бы повторять действие медиатора, а с другой — блокировать их, проявляя при этом обратное (противоположное)

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	73стр. из 164	

действие. Вещества, возбуждающие рецепторы и оказывающие действие, подобное медиаторам, принято называть миметическими (mimesis — подражание, подобие). Так, вещества, возбуждающие холинорецепторы, т.е. действующие подобно ацетилхолину, называются холиномиметическими, а действующие подобно норадреналину и возбуждающие адренорецепторы — адреномиметическими. Вещества, блокирующие рецепторы, называют литическими, или блокаторами. Следовательно, вещества, блокирующие холинорецепторы, будут называться холинолитическими, или холиноблокаторами, а блокирующие адренорецепторы — адренолитическими, или адреноблокаторами.

ВЕЩЕСТВА, ДЕЙСТВУЮЩИЕ НА ХОЛИНЕРГИЧЕСКИЕ СИНАПСЫ (холинергические средства)

Холинорецепторы неодинаково возбуждаются различными фармакологическими средствами. Одни проявляют высокую чувствительность к яду мухомора — мускарину, и их называют М-холинорецепторами. Другие холинорецепторы очень чувствительны к алкалоиду табака — никотину, поэтому их называют Н-холинорецепторами. В связи с тем, что фармакологические средства возбуждают или блокируют в основном один вид рецепторов, различают: а) М-холиномиметические средства; б) Н-холиномиметические средства; в) М-холиноблокирующие средства; г) Н-холиноблокирующие средства. Особую группу составляют антихолинэстеразные средства, повторяющие своим действием эффекты ацетилхолина. М-холинорецепторы находятся: ■ во всех исполнительных органах (сердце, легкие и т.д.), кроме надпочечников; ■ в потовых, слюнных и других железах; ■ в центральной нервной системе; ■ редко — в сосудах. Н-холинорецепторы находятся: ■ во всех ганглиях ПНС и СНС; ■ в надпочечниках и синокаротидных клубочках; ■ в центральной нервной системе; ■ в сосудах; ■ в скелетных мышцах.

М-холиномиметические средства Действие М-холиномиметических средств заключается в возбуждении М-холинорецепторов. Эти рецепторы локализуются в клетках органов и тканей, куда приходят постганглионарные волокна парасимпатической нервной системы (см. табл. 5). Следовательно, действие М-холиномиметических средств вызывает такие же эффекты, что и возбуждение парасимпатической нервной системы. Под влиянием М-холиномиметических средств зрачки глаз суживаются, урежаются сердечные сокращения и возникает брадикардия, расширяются кровеносные сосуды и падает артериальное давление, возникает спазм (сокращение) бронхов, усиливается перистальтика желудочно-кишечного тракта (ЖКТ) и секреция его желез, а также слюнных и бронхиальных желез.

ПОМНИТЕ! Возбуждение блуждающего нерва, передаваемое на М-холинорецепторы сердца, тормозит его работу и вызывает брадикардию. Одновременно возбуждение блуждающего нерва вызывает спазм бронхов и повышение тонуса желудочно-кишечного тракта и мочевого пузыря.

Наиболее часто М-холиномиметические средства используются для лечения глаукомы — заболевания, основным симптомом которого является повышение внутриглазного давления, нередко приводящее к потере зрения. Она может быть первичная, вторичная, острая и хроническая. При всех типах глаукомы основной задачей является снижение внутриглазного давления, для чего несколько раз в день в глаза закапывают специальные капли, улучшающие отток жидкости из глаза или снижающие ее образование. К числу таких препаратов относится пилокарпина гидрохлорид (М-холиномиметик) и ряд подобных ему препаратов, а также некоторые мочегонные средства (ацетазолamid). Из М-холиномиметических средств в медицинской практике наиболее часто используют

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	74стр. из 164	

пилокарпина гидрохлорид и ацеклидин. ПИЛОКАРПИНА ГИДРОХЛОРИД (*Pilocarpini hydrochloridum*) - довольно токсическое вещество, поэтому применяется только наружно в виде глазных капель для лечения глаукомы. При нанесении на слизистую оболочку глаза он возбуждает М-холинорецепторы круговой мышцы радужной оболочки глаза. Она сокращается (к центру), открываются углы передней камеры глаза, фонтановы пространства, шлеммов канал, и внутри происходит отток глазной жидкости, а внутриглазное давление снижается. Кроме того, пилокарпин увеличивает кривизну хрусталика глаза и на некоторое время суживает зрачок. Это явление называется спазмом аккомодации (человек хорошо видит близкие предметы и плохо — отдаленные). Выпускают пилокарпина гидрохлорид в виде порошка для приготовления растворов: 1 и 2% растворов во флаконах по 5 и 10 мл; 1 и 2% глазной мази и в виде глазных пленок по 0,0027 г для введения в конъюнктивальный мешок глаза. Хранят препарат по списку А в защищенном от света месте.

АЦЕКЛИДИН (*Aceclidinum*) — синтетическое средство, менее токсичное, чем пилокарпин, поэтому его используют не только в глазной практике, но и вводят парентерально при атонии и парезах кишечника, атонии мочевого пузыря и т.д. В глазной практике ацеклидин применяют в виде 2—5% растворов (глазные капли) при глаукоме, а при атонии кишечника под кожу вводят 0,2% стерильный раствор. Выпускают ацеклидин в виде порошка для приготовления растворов и 0,2% раствора в ампулах по 1 и 2 мл. Высшие дозы под кожу: разовая — 2 мл, суточная — 6 мл. Хранят препарат по списку А в защищенном от света месте.

Задание. После прочитанного выпишите в рабочей тетради рецепт на раствор пилокарпина в виде глазных капель для лечения глаукомы и раствор ацеклидина для парентерального введения. Разберите их действие на глаза и кишечник. Вспомните, при каких заболеваниях можно использовать ацеклидин.

Н-холиномиметические средства Механизм действия Н-холиномиметических средств заключается в возбуждении Н-холинорецепторов. Периферические Н-холино- рецепторы обладают различной чувствительностью к фармакологическим средствам, поэтому их делят на рецепторы двух типов. К первому типу относят рецепторы вегетативных ганглиев, синокаротидной зоны и мозгового вещества надпочечников, ко второму — рецепторы нервно-мышечных синапсов. Медицинская практика использует в основном вещества, действующие на первый тип Н-холинорецепторов в целях рефлекторного возбуждения дыхания, например при асфиксии новорожденных, при удушении, отравлении угарным газом и т.п. Такими веществами являются цититон и лобелина гидрохлорид. При их внутривенном введении происходит возбуждение Н-холино- рецепторов синокаротидной зоны (область разветвления сонных артерий), откуда оно передается в центральную нервную систему, дыхательный центр и далее к органам дыхания. Таким образом происходит рефлекторное возбуждение дыхания, оно становится более глубоким и частым. **ВНИМАНИЕ!** Если рефлекторная возбудимость блокирована полностью; например средствами для наркоза или снотворными средствами, Н-холиномиметические вещества как стимуляторы дыхания будут неэффективны.

ЦИТИТОН (*Cytitopum*) представляет собой 0,15% раствор цитизина. После внутривенного введения действие препарата проявляется быстро и продолжается несколько минут. Взрослым обычно вводят 0,3—0,5 мл, детям до 1 года — 0,1 мл. Высшие дозы (для взрослых): разовая — 1 мл, суточная — 3 мл. Выпускается Цититон в ампулах по 1 мл. Хранят по списку Б как сильнодействующее лекарственное средство. ЛОБЕЛИНА ГИДРОХЛОРИД (*Lobelini hydrochloridum*) по характеру действия подобен Цититону, но

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	75стр. из 164	

обладает несколько меньшей активностью. Вводят в вену взрослым по 0,3 мл 1% раствора, детям — по 0,1 — 0,2 мл в зависимости от возраста. Высшие дозы (для взрослых): разовая — 0,5 мл, суточная — 1 мл 1% раствора. Выпускают препарат в виде 1 % раствора в ампулах по 1 мл. Хранят по списку Б, в защищенном от света месте. Цитизин в составе таблеток «Табекс» и лобелии в составе таблеток «Лобесил», а также таблетки анабазина гидрохлорида по 0,003 г принимают как вспомогательное средство для борьбы с курением. Как известно, курильщики табака часто не могут самостоятельно избавиться от этой вредной привычки из-за тягостных ощущений (абстиненция), а так как цитизин, лобелии, анабазин имеют близкую к никотину химическую структуру и почти полностью повторяют его эффект, прием внутрь ослабляет явления абстиненции, что способствует прекращению курения. Кроме того, курение табака на фоне действия этих препаратов вызывает у человека неприятные ощущения. Проблема борьбы с курением в настоящее время является актуальной во всем мире. Во многих странах приняты законы, запрещающие или ограничивающие курение табака. В нашей стране запрещено курить в общественном транспорте, в спортивных сооружениях, лечебных учреждениях и т.д. Эти мероприятия направлены на охрану здоровья населения, потому что современная медицина располагает неопровержимыми данными о вреде этой привычки.

Антихолинэстеразные (М-, Н-холиномиметические) средства Это особая группа лекарственных средств, которая своим воздействием напоминает действие ацетилхолина. Мы уже говорили о том, что медиатор после передачи возбуждения разрушается и что для проведения следующего импульса необходима новая порция медиатора. В холинергических синапсах медиатор ацетилхолин разрушается ферментом ацетилхолинэстеразой, образующимся на внешней поверхности постсинаптической мембраны. В ряде случаев в организме образуется избыток фермента ацетилхолинэстеразы, который препятствует проведению возбуждения и вызывает, таким образом, блокаду эффекторных органов. Искусственный паралич, вызываемый избытком ацетилхолинэстеразы, приводит к разрушению ацетилхолина, расслаблению мышц, нарушению деятельности органов и развитию таких заболеваний, как атония кишечника и мочевого пузыря, глаукома и т.д. Механизм действия антихолинэстеразных средств заключается в связывании ацетилхолинэстеразы, что дает возможность ацетилхолину беспрепятственно передавать возбуждение с преганглионарного волокна на постганглионарное и далее на эффекторный орган. При этом происходит одновременное возбуждение М- и Н-холинорецепторов, повышение тонуса мышц, восстанавливается активность кишечника, мочевого пузыря, желез внутренней и внешней секреции, круговой мышцы глаза и т.д. В связи с этим антихолинэстеразные средства применяют для лечения глаукомы, миастении (мышечная слабость), атонии кишечника и мочевого пузыря, слабой родовой деятельности и параличей после полиомиелита. К числу препаратов этой группы относятся Прозерин, Калимин, Оксазил, Физостигмин и др. ПРОЗЕРИН (Proserinum) — синтетический препарат, действие которого связано с блокадой фермента ацетилхолинэстеразы. Он косвенно суживает зрачок (спазм аккомодации), снижает внутриглазное давление, вызывает брадикардию, расширение кровеносных сосудов, снижение артериального давления. Прозерин повышает тонус гладких мышц, бронхов, желудочно-кишечного тракта, облегчает передачу импульсов к скелетным мышцам. Его применяют для лечения глаукомы, атонии кишечника, мочевого пузыря, для стимуляции родов и при миастении. Кроме того, Прозерин используют в качестве антагониста (противоядия) мышечных релаксантов антидеполяризующего конкурентного типа действия. Препарат назначают в глазной практике в виде 0,5% раствора, а в остальных случаях — в порошках

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	76стр. из 164	

и таблетках по 0,01—0,015 г или в виде 0,05% раствора в ампулах по 1 мл для парентерального введения. Прозерин плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, поэтому почти не влияет на деятельность центральной нервной системы и, следовательно, непригоден для лечения мышечных параличей после полиомиелита. Вышие дозы Прозерина (для взрослых): внутрь разовая — 0,015 г, суточная — 0,05 г; под кожу: разовая — 0,002 г, суточная — 0,005 г. Выпускают Прозерин в порошке и таблетках по 0,015 г, а также в ампулах по 1 мл 0,05% раствора. Хранят по списку А в защищенном от света месте. КАЛИМИН (Kalymin) — менее активное, чем Прозерин, антихолин- эстеразное средство, но действует более продолжительно по сравнению с ним. Показаниями к применению Калимина служат миастения, парезы, мышечная слабость, нарушение двигательной активности после травм, энцефалита, полиомиелита и др. Назначают препарат внутрь в драже по 0,06 г и в виде 0,5% раствора для введения в мышцу по 1—2 мл. Калимин противопоказан при эпилепсии и бронхиальной астме. Выпускают препарат в драже по 0,06 г и в виде 0,5% раствора в ампулах по 1—2 мл. К группе антихолинэстеразных средств относится еще ряд препаратов, например Убретид, Армии, Галантамин и др.

К антихолинэстеражным средствам относят так называемые ФОСФОРОРГАНИЧЕСКИЕ СОЕДИНЕНИЯ (ФОС). В отличие от Про- зерина и его аналогов фосфорорганические соединения длительно блокируют ацетилхолинэстеразу. Некоторые из этих веществ используются в медицине для лечения глаукомы (армии), но большая часть ФОС обладают высокой токсичностью, поэтому используются как инсектицидные средства (дихлофос, карбофос) для борьбы с бытовыми насекомыми и вредителями садов и огородов. Применение ФОС в быту и сельском хозяйстве нередко служит причиной отравления, симптомами которого являются миоз (стойкое сужение зрачков), обильное потоотделение и слюнотечение, брадикардия, рвота, боли в животе, затрудненное дыхание и др. Смерть при отравлении может наступить от паралича дыхательного центра. Поскольку при передозировке антихолинэстеразных средств и при отравлении ФОС происходит резкое возбуждение М-холинорецеп- торов, то для оказания помощи необходимо срочное введение средств, блокирующих их активность, а именно М-холиноблокаторов (атропин). Используют в этих случаях реактиваторы холинэстеразы, восстанавливающие активность фермента. К последним относятся ди- пироксим (15% раствор в ампулах по 1 мл), который вводят под кожу или внутривенно, и изонитразин (40% раствор в ампулах по 3 мл), его вводят в мышцу или в вену 1 или несколько раз в день в зависимости от состояния пострадавшего.

М-холиноблокирующие средства М-холиноблокирующими называют лекарственные средства, которые блокируют М-холинорецепторы в эффекторных органах, железах и тканях, куда приходят постганглионарные парасимпатические нервные волокна. При действии М-холиномиметических средств преобладающим становится влияние на организм парасимпатической нервной системы, а при применении М-холиноблокаторов парасимпатическая нервная система как бы денервируется (блокируется), и резко возрастает преимущество симпатической нервной системы. Следовательно, М-холиноблокирующие средства являются антагонистами ацетилхолина, М-холиномиметических и антихолинэстеразных средств и оказывают противоположное действие по сравнению с ними. Под влиянием М-холиноблокирующих средств расширяются зрачки, учащается ритм сердечных сокращений, снижается тонус гладких мышц бронхов, желудочно-кишечного тракта, желчного пузыря и желчных протоков, мочевого пузыря и мочеточников, уменьшается секреция слюнных, слезных, пищеварительных, бронхиальных и потовых желез. Кроме того, М-холиноблокаторы

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	77стр. из 164

проявляют свое действие в синапсах центральной нервной системы, где расположены М-холинорецепторы. К М-холиноблокирующим средствам относятся атропина сульфат, препараты красавки, платифиллина гидротартрат, метацин и др. Ведущим препаратом этой группы является атропина сульфат, поэтому его иногда называют группой атропина, или атропиноподобным средством. АТРОПИНА СУЛЬФАТ (Atropini sulfas) — один из сильнейших М-холиноблокаторов, алкалоид, содержащийся в растениях: красавке, дурмане, белене и др. Атропин блокирует М-холинорецепторы круговой мышцы радужной оболочки, вызывает стойкое (до 8—7 дней) расширение зрачка. Этот эффект используется медицинской практикой для исследования глазного дна. Способность атропина расширять зрачки используется также для лечения воспалительных заболеваний глаз и травм, когда необходим функциональный покой мускулатуре глаз (ириты, ири доцикл иты). Воздействуя на глаз, атропин не только расширяет зрачки, но и изменяет кривизну хрусталика. Он при этом становится плоским, уменьшается преломляющая способность хрусталика, и глаз видит хорошо только дальние предметы, а ближние плохо. Такое явление носит название паралич аккомодации. Он после применения атропина продолжается несколько дней и используется при подборе очков с целью определения истинной кривизны хрусталика.

ВНИМАНИЕ! Атропин расширяет зрачки и одновременно повышает внутриглазное давление, почему категорически противопоказан при глаукоме!

Известно, что блуждающий нерв, вернее его возбуждение, является для сердца тормозом, поэтому блокада М-холинорецепторов сердца приводит к выключению этого участка блуждающего нерва и развитию преобладающего влияния на сердце симпатической нервной системы, вследствие чего под действием атропина сердце учащает свою работу, возникает тахикардия. Такое влияние атропина на работу сердца используется при урежении его деятельности (брадикардия), а также для предупреждения остановки сердца при атриовентрикулярном блоке или эфирном наркозе. Наряду с учащением работы сердца атропин вызывает расслабление гладких мышц бронхов (опять через влияние симпатической нервной системы), поэтому применяется для профилактики, лечения и купирования приступов бронхиальной астмы. Одновременно атропин расслабляет гладкие мышцы внутренних органов (желудок, кишечник, желчный пузырь и т.д.). Болезненные спазмы этих органов называются коликами, и атропин применяют для их устранения. Способность атропина расслаблять гладкие мышцы внутренних органов используется также для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Кроме того, при язвенной болезни желудка часто имеет место избыточная секреция пищеварительных желез. Атропин снижает секрецию и устраняет раздражающее влияние хлористоводородной кислоты желудка на язву. Более того, атропин угнетает секрецию слюнных, бронхиальных, потовых и других желез. Все эти качества широко используются для премедикации (предварительное введение лекарственных средств) перед операциями, особенно если они проводятся под эфирным наркозом. В этом случае устраняются такие нежелательные симптомы, как слюнотечение, рвота, предупреждаются урежение ритма сердца и его остановка при одновременном углублении дыхания. Атропин оказывает также стимулирующее действие на центральную нервную систему, которое при передозировке препарата может проявиться в виде психомоторного возбуждения. При применении атропина возможны побочные явления в виде сухости во рту, тахикардии, паралича аккомодации, фотофобии (светобоязнь) и др. Применяют атропина сульфат внутрь в порошках и таблетках по 0,00025—0,0005 г или по 5—8 капель на прием в виде 0,1% раствора, парентерально (под кожу, в мышцу, в вену) вводят 0,1% раствор по 0,25—1 мл. В глазной практике применяют 1% раствор препарата в виде глазных капель или в виде 0,5—

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	78стр. из 164	

1% глазной мази. Заменить глазные капли 1% раствора атропина сульфата может препарат «Тропика - мид», вызывающий при исследовании глазного дна паралич аккомодации не более чем на 3 часа, в то время как атропин нарушает зрение на 5—7 суток. Высшие дозы атропина сульфата (для взрослых) внутрь и под кожу: разовая — 0,001 г, суточная — 0,003 г. Выпускают препарат в порошках и таблетках по 0,0005 г; ампулах и шприц-тюбиках по 1 мл 0,1% раствора; в виде глазных капель — 1% раствор, глазной мази — 1%. Хранят атропина сульфат по списку А. Для передозировки атропином характерны следующие симптомы: расширение зрачков, тахикардия, сухость во рту, чувство жажды, хриплый голос, покраснение и сухость кожи, нарушение координации, головокружение. В тяжелых случаях у больных повышается температура тела, нарастает двигательная активность и психическое возбуждение, они перестают узнавать окружающих, у них появляются слуховые и зрительные галлюцинации, путается сознание, возможны судороги и смерть от паралича дыхания. Помощь при отравлении атропином затруднена и занимает много времени, потому что у него нет прямого антагониста (противоядия). В связи с этим для оказания помощи используется целый комплекс мероприятий: промывание желудка 0,1% раствором перманганата калия или раствором танина, внутрь назначают активированный уголь, слабительные средства, дают обильное питье. Из организма яд удаляют, применяя методы гемосорбции и форсированного диуреза. В мышцы и под кожу вводят антихолинэстеразные вещества, например 0,05% раствор Прозерина, который, блокируя фермент ацетилхолинэстеразу, будет способствовать накоплению ацетилхолина, а он в свою очередь будет постепенно возбуждать М-холинорецепторы и восстанавливать активность эффекторных органов. Атропин является основным компонентом и действующим началом препаратов красавки. **НАСТОЙКА КРАСАВКИ** (Tinctura Belladonnae) — прозрачная, зеленовато-бурая жидкость. Применяется при брадикардии, болях в животе, оказывает успокаивающее действие. Назначают внутрь по 5—10 капель. Входит в состав капель Зеленина. Высшие дозы (для взрослых): разовая — 0,5 мл (23 капли), суточная — 1,5 мл (70 капель). Хранят препарат по списку Б. **ЭКСТРАКТ КРАСАВКИ СУХОЙ** (Extractum Belladonnae siccum), как и настойка, применяется при спазмах желудочно-кишечного тракта, язвенной болезни, остром гастрите, геморрое, трещинах прямой кишки. Его назначают в порошках, таблетках и суппозиториях по 0,015 г. Высшие дозы (для взрослых): разовая — 0,1 г, суточная — 0,3 г. Хранят экстракт красавки по списку Б. **СКОПОЛАМИН** (Scopolamini hydrobromidum) содержится в тех же растениях, что и атропин. Отличается от последнего отчетливым угнетающим действием на центральную нервную систему. Применяется при заболеваниях, связанных с расстройством вестибулярного аппарата (нарушение координации, головокружение), для профилактики морской и воздушной болезни (в составе таблеток «Аэрон»). В остальных случаях скополамин используют как и атропин, т.е. перед наркозом, для исследования глазного дна и т.д. Назначают препарат для приема внутрь и под кожу, а также 0,25% раствор в виде глазных капель. Выпускают препарат в виде порошка и в ампулах по 1 мл 0,05% раствора. Хранят скополамин по списку А, в защищенном от света месте. **ПЛАТИФИЛЛИНА ГИДРОТАРТРАТ** (Platyphyllini hydrotartras) - алкалоид крестовника широколистного. В основном подобен атропину, но имеет от него ряд отличительных особенностей. Действие платифиллина на глаз продолжается лишь 5—6 часов (атропин — 5—7 суток); он в меньшей степени влияет на секрецию желез и частоту сердечных сокращений, успокаивает центральную нервную систему. Помимо М-холиноблокирующего действия платифиллин обладает ярко выраженным миотропным спазмолитическим действием на волокна гладких мышц, поэтому он наиболее удобен для купирования желудочных, кишечных, печеночных,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	79стр. из 164	

почечных и других колик и, кроме того, снижает артериальное давление. Как и атропин, платифиллин категорически противопоказан при глаукоме. Его применяют при язве желудка и двенадцатиперстной кишки, гипертонической болезни, спазмах сосудов мозга, бронхиальной астме. Назначают препарат в порошках и таблетках по 0,003—0,005 г, вводят под кожу по 1—2 мл 0,2% раствора и закапывают в глаза 1 % раствор. Выпускают платифиллина гидротартрат в порошках, таблетках по 0,005 г, ампулах по 1 мл 0,2% раствора. Высшие дозы (для взрослых) внутрь и под кожу: разовая — 0,01 г, суточная — 0,03 г. Хранят препарат по списку А. МЕТАЦИН (Methacinum) — синтетический препарат, не проникает через гематоэнцефалический барьер и поэтому почти не влияет на деятельность центральной нервной системы и мало изменяет величину зрачка. По бронхолитическому эффекту превосходит атропин. Применяют Метацин при бронхиальной астме, язвенной болезни, при коликах, брадикардии. Противопоказан при глаукоме. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,002—0,005 г и парентерально по 0,5—1 мл и 0,1% раствора. Выпускают Метацин в таблетках по 0,002 г и в ампулах по 1 мл 0,1% раствора. Высшие дозы (для взрослых) внутрь: разовая — 0,005 г, суточная — 0,01 г под кожу; в мышцу и в вену: разовая — 0,002 (2 мл), суточная — 0,006 г (6 мл). Хранят препарат по списку А. ИПРАТРОПИУМА БРОМИД (Ipratropii bromidum), синоним: атро-вент, — М-холиноблокатор, действующий преимущественно на хо- линорецепторы бронхов. Механизм его действия связан с блокадой блуждающего нерва, активность которого вызывает спазм бронхов, при этом он почти не оказывает влияния на работу сердца. Применяют ипратропиума бромид в виде аэрозоля для лечения хронического обструктивного (abstructio — закупорка) бронхита, умеренной формы бронхиальной астмы, в том числе бронхиальной астмы у больных с нарушениями в работе сердца. Выпускают ипратропиума бромид в виде дозированного аэрозоля в специальных баллончиках по 15 мл, содержащих 300 доз препарата.

Н-холиноблокирующие средства Н-холинорецепторы вегетативных ганглиев, синокаротидной зоны и мозгового вещества надпочечников отличаются от Н-холинорецепторов нервно-мышечных синапсов. Лекарственные средства на эти рецепторы действуют различно. В связи с избирательной блокадой Н-холинорецепторов Н-холиноблокирующие средства делятся на две группы: 1) ганглиоблокирующие средства; 2) мышечные релаксанты (расслабители), или курареподобные средства. Первые блокируют Н-холинорецепторы в парасимпатических и симпатических ганглиях, синокаротидной зоне и мозговом веществе надпочечников, вторые — Н-холинорецепторы, находящиеся в скелетных мышцах. Ганглиоблокирующие средства Блокируя Н-холинорецепторы парасимпатических и симпатических ганглиев, эти вещества препятствуют передаче возбуждения с преганглионарного волокна на постганглионарное. Таким образом устраняется влияние парасимпатической и симпатической нервной системы на эффекторные органы и ткани. Блокируя ганглии симпатической нервной системы, эти вещества устраняют ее влияние на сосуды, они расширяются, и артериальное давление падает. Блокада парасимпатических ганглиев вызывает расслабление гладких мышц внутренних органов (желудочно-кишечный тракт, мочевой пузырь) и снижение секреции всех желез, в том числе и пищеварительных. Таким образом, ганглиоблокирующие средства могут быть использованы для лечения гипертонической болезни, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, спазмов периферических сосудов (эндартериит) и т.д. В настоящее время медицинская практика использует ганглиоблокирующие средства в основном для лечения гипертонической болезни и купирования ее кризов. К числу препаратов этой группы относят бензогексоний, пентамин, пирилен, димеколин, гигроний,

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	80стр. из 164	

арфонад и др. Последние два оказывают кратковременное действие (10—15 минут) и используются чаще всего для управляемой гипотензии, когда снижение артериального давления бывает необходимо при хирургических операциях. **БЕНЗОГЕКСОНИЙ** (Benzohexonium) — белый, хорошо растворимый в воде порошок. Препарат хорошо снижает артериальное давление и используется для лечения гипертонии и купирования ее кризов. Реже его назначают для лечения язвенной болезни или эндартериита.

Для бензогексония, как и для многих ганглиоблокаторов, характерно наличие ряда побочных эффектов, например атония кишечника, ортостатический коллапс (резкое падение артериального давления при изменении положения тела из горизонтального в вертикальное), во избежание которого больным рекомендуется лежать после применения препарата 1,5—2 часа. Кроме того, эти препараты вызывают сухость во рту, нарушают аккомодацию, к ним быстро развивается привыкание. Применяют бензогексоний в виде инъекций и вводят под кожу или внутримышечно 2,5% раствор по 1—2 мл. Выпускают препарат в таблетках по 0,1 г и в виде 2,5% раствора в ампулах по 1 мл. Хранят по списку Б. Мышечные релаксанты (курареподобные средства) Курареподобные средства, или мышечные релаксанты (relaxatio — расслабление), блокируют Н-холинорецепторы скелетных мышц и вызывают их расслабление. Расслабление мышц после введения наступает в определенной последовательности: сначала расслабляются мышцы лица и шеи, затем конечностей, туловища и в последнюю очередь — диафрагма. Парализующее действие препаратов на мышцы является обратимым, так что через определенное время (5—60 минут) активность мышц восстанавливается. Передозировка миорелаксантов может привести к расслаблению мышц бронхов, что вызовет остановку дыхания (апноэ) и смерть. Медицинская практика использует мышечные релаксанты для расслабления при операциях, сопоставлениях (репозиция) отломков костей, а также при вправлении сложных вывихов, для интубации, лечения столбняка и судорог. По механизму действия мышечные релаксанты в настоящее время делят на две группы: 1) антидеполяризующие; 2) деполяризующие. Представителями препаратов антидеполяризующего типа действия являются диплацин, анатруксоний, ардуан, паркуроний и др. **ДИПЛАЦИН** (Diplacinum) — антидеполяризующий миорелаксант. Его эффект после введения выражается во временном нарушении нервно-мышечной проводимости и расслаблении скелетной мускулатуры. Применяют диплацин для расслабления мышц с целью облегчения интубации трахеи при эндотрахеальном наркозе и для более полного расслабления мускулатуры при операциях в условиях наркоза с искусственной вентиляцией легких. Вводят диплацин в виде 2% раствора в вену. Расслабление мышц после введения начальной дозы продолжается около 1 часа. При передозировке диплацина и подобных ему средств в качестве антагониста используют антихолинэстеразные вещества (прозерин), способствующие накоплению ацетилхолина, а он в свою очередь ослабляет действие антидеполяризующих мышечных релаксантов. Выпускают диплацин в виде 2% раствора в ампулах по 5 мл № 10. Список А. Подобно диплацину действуют препараты квалидил, диаксоний, ардуан, нуркон и др. **ДИТИЛИН** (Dithylinum) — вводится внутривенно. Продолжительность действия препарата — в пределах 5—10 минут, поэтому с целью длительного расслабления мышц его вводят капельно через каждые 6—10 минут. Выпускается Дитилин в герметически закрытых флаконах в виде стерильного порошка по 0,1; 0,25 и 0,5 г, а также в форме 2% раствора в ампулах по 10 мл. Хранят препарат по списку А.

ВЕЩЕСТВА, ДЕЙСТВУЮЩИЕ НА адренергические СИНАПСЫ

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	81стр. из 164	

Адренергическими называют лекарственные средства, которые оказывают влияние на деятельность адренорецепторов, находящихся в адренергических синапсах. Адренергическими являются постанглионарные волокна симпатической нервной системы, потому что их окончания выделяют в качестве медиатора норадреналин или адреналин. В эффекторных органах и тканях располагаются рецепторы, возбуждающиеся под влиянием норадреналина. Они-то и получили название адренорецепторов. Установлено, что адренорецепторы имеют различную структуру и под действием медиатора, а также лекарственных средств вызывают неодинаковые эффекты. В связи с этим различают α -адренорецепторы и β -адренорецепторы. Последние в свою очередь делятся на β_1 -адренорецепторы и β_2 -адренорецепторы; α_1 - и α_2 -адренорецепторы встречаются почти в каждом эффекторном органе, но обычно одни из них преобладают над другими. Так, α_1 -адренорецепторы находятся преимущественно в крупных кровеносных сосудах брюшной полости, в сосудах кожи, слизистых оболочек, α_2 — в сфинктерах желудочно-кишечного тракта, в радужной оболочке глаза и т.д. Возбуждение α_1 -адренорецепторов вызывает сужение кровеносных сосудов и повышение артериального давления, а α_2 -рецепторов — расширение зрачка. Бета-адренорецепторы располагаются в мышце сердца, и при их возбуждении усиливается и учащается сердечный ритм, улучшается проведение импульсов от предсердий к желудочкам, повышается автоматизм сердца. Бета $_2$ -адренорецепторы находятся в мышцах бронхов, а также в кровеносных сосудах мозга, сердца и скелетных мышц. При их возбуждении происходит расслабление мышц бронхов и расширение кровеносных сосудов. Адренергические средства либо возбуждают адренорецепторы, либо их блокируют. В связи с этим различают: 1) адреномиметические средства — они оказывают действие, подобное медиатору норадреналину; 2) адреноблокирующие средства, которые оказывают противоположное медиатору норадреналину действие. Кроме того, к адренергическим средствам относят: 1) симпатомиметические средства, которые усиливают выброс медиатора и, следовательно, повторяют его эффекты; 2) симпатолитические или симпатоблокирующие средства — уменьшают выброс медиатора нервными окончаниями и оказывают действие, подобное адреноблокирующим средствам.

1. Адреномиметические средства В зависимости от чувствительности адренорецепторов к фармакологическим средствам этой группы адреномиметические средства делятся: 1) на α -адреномиметические; 2) β -адреномиметические; 3) α - и β -адреномиметические. 1.1. Альфа-адреномиметические средства. Эта группа лекарственных средств возбуждает только α -адрено-рецепторы, причем если они располагаются: а) в сосудах, то последние суживаются и артериальное давление повышается; б) слизистых — происходит их уплотнение, уменьшение припухлости, набухания воспаленного участка; в) мышцах радужной оболочки глаза — это приводит к их возбуждению и расширению зрачков. Эти качества α -адреномиметических средств позволяют применять их при гипотонии, коллапсе, для лечения ринита (насморк), конъюнктивита и исследования глазного дна. К препаратам этой группы относят Мезатон, Нафтизин, Галазолин и др. МЕЗАТОН (Mesatonum) — синтетический препарат, более стойкий, чем адреналин, и превосходит его по длительности действия. Его назначают парентерально (под кожу, в мышцу, в вену) и внутрь. При нанесении на слизистую оболочку он вызывает сужение сосудов и уменьшение воспалительных процессов. При коллапсе и гипотонии Мезатон вводят в вену по 0,1—0,5 мл медленно с 20—40 мл 5—40% растворов глюкозы или капельно по 1 мл 1% раствора 200—500 мл и 5% раствора глюкозы. Под кожу и в мышцу вводят до 1 мл 1% раствора препарата. Внутрь Мезатон назначают в порошках по 0,01—0,025 г. Для лечения ринита

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	82стр. из 164	

используют 0,25—0,5% растворы, конъюнктивита — 1—2% растворы. Как сосудосуживающее средство Мезатон нередко добавляют к растворам местноанестезирующих средств. Противопоказаниями к применению Мезатона служит гипертоническая болезнь, спазм сосудов и атеросклероз.

Выпускают препарат в порошке и в ампулах по 1 мл 1% раствора. Хранят Мезатон по списку Б. НАФТИЗИН (Naphthyzinum) отличается более высокой токсичностью, поэтому применяется только местно и в основном для лечения ринита и гайморита, редко — для остановки носовых кровотечений. При рините в полости носа вводят по 2—3 капли 0,05—0,1% раствора до 4 раз в день. Длительное применение Нафтизина вызывает привыкание к нему, а последующее увеличение доз может привести к нежелательным последствиям в виде головной боли, тахикардии и угнетения центральной нервной системы у детей. Подобное Нафтизину действие оказывает препарат Галазолин и его аналоги. Выпускают Нафтизин в виде 0,05 и 0,1% растворов во флаконах по 10 мл. Хранят препарат по списку Б, в защищенном от света месте.

1.2. Бета-адреномиметические средства Их механизм действия заключается в возбуждении β -адренорецепторов. При возбуждении β -адренорецепторов, которые преимущественно находятся в сердце, усиливаются и учащаются сердечные сокращения, повышается автоматизм сердца, улучшается проведение импульсов от предсердий к желудочкам (атриовентрикулярная проводимость). Возбуждение β_2 -адренорецепторов приводит к расслаблению гладких мышц бронхов и расширению сосудов. Наиболее часто β_2 -адреномиметические средства используются для лечения, профилактики и купирования приступов бронхиальной астмы, т.е. как бронхолитические средства. К ним относятся изадрин (но- водрин), сальбутамол, орципреналина сульфат (астмопент) и др. ИЗАДРИН (Isadrinum) одновременно возбуждает β_1 и β_2 -адренорецепторы. Его влияние на β_2 -адренорецепторы и последующее за этим расширение легких используется для лечения и купирования приступов бронхиальной астмы. В последнем случае препарат наиболее удобно применять в виде аэрозоля. Возбуждение β_1 -адренорецепторов способствует лучшему проведению импульсов по проводящей системе сердца и используется для устранения атриовентрикулярного блока. В этом случае изадрин назначают в виде таблеток для рассасывания под языком. Выпускают изадрин в таблетках по 0,005 г и в виде 0,5 и 1 % растворов во флаконах по 25 и 100 мл (для ингаляций). Список Б. САЛЬБУТАМОЛ (Salbutamol) в отличие от изадрина избирательно возбуждает β_2 -адренорецепторы, оказывает более длительное действие на бронхи, не влияет на деятельность сердца. Эффективен не только в ингаляциях, но и при приеме внутрь. Применяется сальбутамол в основном для купирования и профилактики приступов бронхиальной астмы. Выпускают препарат в аэрозольной упаковке по 10 и 20 мл. Хранят по списку Б. Действием, подобным сальбутамолу, обладают орципреналина сульфат (Астмопент), фенотерол (Беротек) и др. Следует отметить, что β_2 -адреномиметики ослабляют сокращения матки, и поэтому их иногда применяют для предупреждения преждевременной родовой деятельности.

1.3. Альфа- и бета-адреномиметические средства Эти средства одновременно возбуждают α - и β -адренорецепторы, проявляя эффекты, характерные для α - и β -адреномиметических средств. К препаратам этой группы относятся норадреналина гидротартрат и адреналина гидрохлорид. НОРАДРЕНАЛИНА ГИДРОТАРТРАТ (Noradrenalin hydrotartras) почти полностью соответствует естественному медиатору норадреналину, но в отличие от него возбуждает только (α_1 -адренорецепторы, не влияя при этом на β_2 -адренорецепторы. Действуя на α -адренорецепторы кровеносных сосудов, норадреналин вызывает их сужение и резко повышает артериальное давление. Это качество препарата используется в

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казakhstanская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	83стр. из 164	

неотложной помощи при остром падении артериального давления (шок, коллапс). Вводят 0,2% раствор норадреналина гидротартрата только внутривенно капельно (!), чаще всего с 5% изотоническим раствором глюкозы.

ПОМНИТЕ! Вводить норадреналин под кожу или в мышцу нельзя из-за резкого спазма кровеносных сосудов и возможного развития некроза тканей.

Иногда при остановке сердца норадреналин вводят в полость левого желудочка с целью повышения возбудимости α -адренорецепторов и большей эффективности непрямого массажа. Норадреналин противопоказан при гипертонической болезни, сердечной слабости, атеросклерозе, фторотановом и циклопропановом наркозе. Выпускают норадреналина гидротартрат в виде 0,2% раствора в ампулах по 1 мл. Хранят по списку Б, в защищенном от света месте.

АДРЕНАЛИНА ГИДРОХЛОРИД (*Adrenalinum hydrochloridum*) возбуждает все виды адренорецепторов, поэтому и оказывает разностороннее действие на организм. Сосуды, где находятся преимущественно α -адренорецепторы (сосуды кожи, слизистых, брюшной полости), он суживает, а сосуды, где располагаются β -адренорецепторы (сосуды сердца, мозга, скелетных мышц), — расширяет, но, несмотря на это, в целом артериальное давление повышается. Кроме того, адреналин вследствие возбуждения (β -адренорецепторов сердца) повышает его возбудимость и автоматизм, облегчает проведение импульсов по проводящей системе, усиливает и учащает сердечный ритм. Это свойство препарата также способствует повышению артериального давления и используется для восстановления сердечной деятельности при его остановке. В последнем случае адреналина гидрохлорид вводят в полость левого желудочка. Адреналин, возбуждая β -адренорецепторы бронхов, вызывает расслабление и поэтому применяется в медицинской практике для купирования приступов бронхиальной астмы. В этом случае препарат преимущественно вводят под кожу, так как при таком введении адреналин действует около 60 минут. Под влиянием адреналина увеличивается распад гликогена и повышается содержание сахара в крови. Этот факт говорит о том, что адреналин противопоказан при сахарном диабете, но с успехом может быть применен при гипогликемии (снижение содержания сахара в крови), возникающей, например, при передозировке инсулина. Адреналин часто добавляют к растворам анестезирующих средств в целях уменьшения их всасывания и увеличения времени действия. Однако при избытке адреналина в организме или его передозировке у больного возникает чувство страха, беспокойства, нарушается сердечный ритм, появляется головная боль, повышается артериальное давление и создается угроза кровоизлияния в мозг. Адреналин, усиливая работу сердца, повышает потребность миокарда в кислороде, в связи с чем он противопоказан при ишемической болезни сердца; его нельзя применять при гипертонической болезни, атеросклерозе, фторотановом наркозе (возможны аритмии), а также при беременности. Выпускают адреналина гидрохлорид в виде 0,1% раствора в ампулах по 1 мл. Хранят по списку Б, в защищенном от света месте.

2. Адреноблокирующие средства Адреноблокирующие средства непосредственно блокируют α - и β -адренорецепторы, препятствуя, таким образом, взаимодействию с ними медиатора норадреналина и передаче возбуждения с постганглионарного симпатического нервного волокна на эффекторный орган. Поскольку одни лекарственные средства блокируют только α -адренорецепторы, а другие — β -адренорецепторы, адреноблокирующие средства делят: 1) на α -адреноблокирующие; 2) β -адреноблокирующие.

2.1. Альфа-адреноблокирующие средства Блокада α -адренорецепторов приводит к тому, что возбуждение, идущее из центральной нервной системы по симпатическим нервным волокнам к эффекторным органам, не достигает цели.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	84стр. из 164	

Это приводит к расширению крупных кровеносных сосудов кожи, слизистых, в результате чего снижается артериальное давление, улучшается кровоснабжение и питание тканей, мышц, кровотоков в капиллярах. Альфа-адреноблокирующие средства являются антагонистами а-адреномиметических средств (Мезатон) и используются для лечения гипертонической болезни, трофических язв, облитерирующего эндартериита (спазм сосудов конечностей), пролежней, болезни Рейно (спазм прекапиллярных сфинктров) и феохромоцитомы (опухоль мозгового вещества надпочечников). При феохромоцитоме в кровь выделяется избыток адреналина, и а-адренорецепторы, находясь под его атакой, вызывают стойкое сужение сосудов, повышение артериального давления и нарушение питания тканей. Интересно, что на фоне действия а-адреноблокирующих средств адреналин не только не суживает сосуды, а, наоборот, расширяет их и снижает артериальное давление за счет его влияния на р₂-адренорецепторы кровеносных сосудов. К а-адреноблокирующим средствам относятся фентоламин, празозин, тропafen, дигидроэрготамин, пирроксан и др. **ФЕНТОЛАМИНА ГИДРОХЛОРИД** (*Phentolaminum hydrochloridum*) в основном расширяет периферические кровеносные сосуды и улучшает питание тканей, поэтому чаще всего применяется для лечения облитерирующего эндартериита, болезни Рейно и трофических язв. Для лечения гипертонической болезни почти не используется. При применении фентоламина в качестве побочных эффектов может наблюдаться тахикардия, головокружение, набухание слизистых оболочек вследствие расширения кровеносных сосудов. Назначают препарат внутрь по 0,025—0,05 г на прием до 3—4 раз в день. Выпускают фентоламина гидрохлорид в порошке и таблетках по 0,025 г. Хранят по списку Б, в защищенном от света месте. **ПРАЗОЗИН** (*Prazosinum*) — типичный селективный α₁-адреноблокатор, эффективно снижающий артериальное давление. Используется для лечения гипертонической болезни. Стойкий эффект препарата развивается постепенно, и он в меньшей степени, чем фентоламин, вызывает тахикардию. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,002—0,005 г в первые дни перед сном, а затем 2—3 раза в день. Выпускают празозин в таблетках по 0,001; 0,002 и 0,005 г. **ПИРРОКСАН** (*Rugthoxapit*) блокирует периферические и центральные α₁-адренорецепторы. Применяется для лечения гипертонической болезни и купирования гипертонических кризов, сопровождающихся психическим напряжением, тревогой и другими отрицательными эмоциями. Пирроксан оказывает также успокаивающее действие, улучшает сон, уменьшает зуд у больных с аллергическими дерматозами. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,015—0,03 г или вводят под кожу и внутримышечно 1% раствор по 1—3 мл в день. Противопоказанием к применению препарата служат тяжелые формы атеросклероза с нарушением мозгового кровообращения и ишемическая болезнь сердца с приступами стенокардии. Выпускают Пирроксан в таблетках по 0,015 г и ампулах по 1 мл 1% раствора. Хранят по списку Б, в защищенном от света месте.

2.2. Бета-адреноблокирующие средства Бета-адреноблокирующие средства являются антагонистами β-адреномиметических средств. При блокаде β-адренорецепторов, находящихся в сердце, снижается частота и сила сердечных сокращений, замедляется атриовентрикулярная проводимость и устраняется тахикардия. Если же будут заблокированы р₂-адренорецепторы, то повышается тонус кровеносных сосудов и бронхов. В последнем случае у больного может появиться бронхоспазм и одышка. Среди β-адреноблокирующих средств есть препараты, которые одновременно блокируют р₁ и р₂-адренорецепторы (Анаприлин, надолол), и препараты, блокирующие избирательно только р₁-адренорецепторы (талинолол, метопролол), их называют еще кардиоселективными β-адреноблокаторами. **АНАПРИЛИН** (*АпаргШтт*) блокирует все β-адренорецепторы. В связи с

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс		85стр. из 164

блокадой Р-адренорецепторов препарат снижает автоматизм сердца, ослабляет и урежает сердечные сокращения, снижает потребление кислорода миокардом. Это качество анаприлина медицинская практика использует для лечения тахикардии, экстрасистолии и т.д. Урежение сердечной деятельности при систематическом применении анаприлина способствует снижению артериального давления. Кроме того, препарат блокирует выделение почками особого биогенного вещества — ренина, который в свою очередь усиливает образование в организме сосудосуживающих веществ (ангиотензин), повышающих артериальное давление. Назначают Анаприлин внутрь в таблетках по 0,01—0,04 г до 3 раз в день или вводят в вену по 1 мл 0,1% раствора. Не рекомендуется назначать препарат при сердечной недостаточности, нарушениях атриовентрикулярной проводимости, спазмах периферических сосудов (Р2-адренорецепторы) и при бронхиальной астме из-за возможного бронхоспазма. Кроме того, нежелательно применять его с антидиабетическими средствами, так как эта комбинация может привести к резкому снижению уровня сахара в крови и развитию гипогликемии.

Выпускают Анаприлин в таблетках по 0,01 и 0,04 г, а также в ампулах по 1 и 5 мл 0,1% раствора. Список Б. Близким к Анаприлину действием обладают также препараты окспренолол, пиндолол, надолол и др. ТАЛИНОЛОЛ (Talinololum) — кардиоселективный Р-адреноблокатор, отличается от других средств способностью блокировать только Р1-адренорецепторы. Оказывает противоаритмическое и гипотензивное действие. Назначают талинолол внутрь в драже по 0,05 г для лечения стенокардии, артериальной гипертензии, тахикардии, экстрасистолии и т.д. В качестве побочных явлений у больных иногда возникают чувство жара, головокружение, появляется тошнота и даже рвота. Выпускают талинолол в драже по 0,05 г в упаковке по 50 шт. Хранят препарат в обычных условиях. АТЕНОЛОЛ (Atenololum) — кардиоселективный рг адреноблокатор. Отличается от своих аналогов более продолжительным действием, поэтому его назначают 1, реже — 2 раза в сутки. Он увеличивает потребность мышцы сердца в кислороде, снижает его автоматизм. Применяют атенолол для лечения гипертонии, стенокардии, в комплексном лечении инфаркта миокарда, аритмии сердца, мигрени и т.д. Его можно использовать больным со склонностью к бронхоспазму. Назначают атенолол внутрь в таблетках по 0,05—0,1 г перед едой. Выпускают препарат в таблетках по 0,05 и 0,1 г. Список Б.

3. Симпатомиметические средства Препараты этой группы нередко являются непрямыми адреномиметическими средствами, потому что в основе их механизма действия лежит увеличение выброса медиатора из окончаний постганглионарных симпатических нервных волокон. Фактически на рецепторы эффекторных органов действует не препарат-симпатомиметик, а медиатор, поэтому эффекты, вызываемые симпатомиметическими средствами, схожи с эффектами адреномиметических средств. Представителем этой группы лекарственных средств является эфедрин — алкалоид травянистого растения эфедра хвощевая. ЭФЕДРИНА ГИДРОХЛОРИД (Ephedrini hydrochloridum) по химической структуре и фармакологическим эффектам сходен с адреналином, но отличается от него механизмом действия (см. выше). Непосредственного влияния на рецепторы исполнительных органов почти не оказывает, а при истощении запасов медиатора в нервных окончаниях быстро теряет свое действие. По сравнению с адреналином эфедрин менее активен, но отличается большей стойкостью и более продолжительным временем действия. Под влиянием эфедрина суживаются кровеносные сосуды и повышается артериальное давление, учащается работа сердца. Повышение артериального давления под действием эфедрина происходит медленнее, чем при действии адреналина, но продолжается до 1,5—2 часов. Сосудосуживающее действие эфедрина проявляется и при

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	86стр. из 164	

его нанесении на слизистые, что ведет к снижению воспалительных процессов на данном участке. Под действием эфедрина происходит расслабление мышц бронхов, возбуждается центральная нервная система и жизненно важные центры — дыхательный и сосудодвигательный. Показаниями к применению эфедрина служат низкое артериальное давление (коллапс), бронхиальная астма, аллергические заболевания, ринит, угнетение центральной нервной системы. Назначают препарат внутрь в порошках и таблетках по 0,025 г и вводят парентерально 0,5—1 мл 5% раствора, 2—3% растворы эфедрина используют в виде капель для носа. Отрицательным качеством эфедрина является то, что при частом применении его эффективность быстро падает. Такое явление носит название тахифилаксия (быстрое привыкание), что связывают с истощением запасов медиатора в окончаниях адренергических волокон. Именно этим объясняется «обратный эффект», или «синдром рикошета», эфедрина, когда, например, на фоне приступа бронхиальной астмы применение препарата усугубляет положение больного. В этом случае необходимо срочное введение (под кожу) адреналина гидрохлорида. Для эфедрина характерны и побочные эффекты: нервное возбуждение, задержка мочи, дрожание рук, бессонница, потеря аппетита. Он противопоказан при гипертонической болезни, атеросклерозе, тахикардии. Высшие дозы препарата (для взрослых) внутрь: разовая — 0,05 г, суточная — 0,15 г; под кожу: разовая — 1 мл 5% раствора, суточная — 3 мл 5% раствора. Выпускают эфедрина гидрохлорид в порошке, таблетках 0,025 г, ампулах по 1 мл 5% раствора, флаконах по 10 мл 2 и 3% раствора. Хранят препарат по списку Б, в защищенном от света месте.

4. Симпатоблокирующие (симпатолитические) средства Симпатолитическими, или симпатоблокирующими, называют средства, которые блокируют активность симпатической нервной системы на уровне окончаний постганглионарных нервных волокон. Они никакого отношения к адренорецепторам не имеют, т.е. не оказывают на них действие. Механизм действия симпатолитических средств заключается в том, что они в нервных окончаниях блокируют выброс медиатора норадреналина и нарушают его синтез. Таким образом, возбуждение из центральной нервной системы по симпатическим нервным волокнам на эффекторный орган не передается, потому что рецепторы эффекторных органов из-за отсутствия медиатора не возбуждаются. Происходит своеобразная блокада симпатической нервной системы, и развивается преобладающее влияние на организм парасимпатической нервной системы (!). В результате действия симпатоблокирующих средств замедляется сердечный ритм, расширяются кровеносные сосуды, снижается артериальное давление. Способность симпатолитических средств снижать артериальное давление и используется медицинской практикой для лечения гипертонической болезни, профилактики гипертонических кризов и инсультов (кровоизлияние). К симпатолитическим средствам относятся октадин (исмелин, изобарин), резерпин, раунатин и др. ОКТАДИН (Octadinum) избирательно накапливается в нервных окончаниях, вытесняет из них норадреналин и нарушает его синтез. На центральную нервную систему препарат не влияет, так как не проникает через гематоэнцефалический барьер. Используют октадин в основном для лечения гипертонической болезни. Назначают его внутрь в таблетках 1 раз в день. Его действие развивается медленно и достигает максимума на 5—7-й день, но и после отмены препарата его эффект сохраняется до двух недель. Октадин применяют для лечения стационарных больных, потому что в качестве побочных эффектов он вызывает иногда ортостатическую гипотензию, тошноту, расстройство кишечника и т.д. Противопоказанием к применению препарата служат выраженный атеросклероз, нарушения мозгового кровообращения, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	87стр. из 164	

кишки. Выпускают препарат в таблетках по 0,025 г. Хранят препарат по списку Б, в защищенном от света месте.

РЕЗЕРПИН (Reserpinum) — алкалоид растения раувольфия змеиная, произрастающего в Индии. Он накапливается в мембранах окончаний адренергических волокон и нарушает поступление в нервные окончания дофамина — вещества, являющегося предшественником в синтезе норадреналина. Таким образом, нарушается синтез медиатора и передача возбуждения. Резерпин в отличие от октадина легко проникает через гематоэнцефалический барьер и снижает количество норадреналина в центральной нервной системе. Именно этим объясняется характерное для него успокаивающее (седативное) действие. Устраняя отрицательные эмоции, резерпин как бы предупреждает связанное с этим повышение артериального давления. Препараты резерпина противопоказаны при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, потому что преобладающее влияние парасимпатической нервной системы вызывает спазм мышц желудочно-кишечного тракта и боли, которые усиливаются за счет раздражающего действия на язву желудочного сока, выделяющегося в избыточном количестве при применении резерпина. Сегодня резерпин как самостоятельный препарат потерял свое значение и используется ограниченно в составе комбинированных препаратов Адельфан, Кристепин и Трирезид К.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Задание 1

1. Укажите различия в действии на организм между: а) атропином и скополамином; б) атропином и платифиллином; в) атропином и Метацином.
2. Перечислите основные заболевания, при которых показано применение М-холиноблокирующих средств.
3. Укажите процентные концентрации атропина, платифиллина и Метацина, растворы которых применяются в виде инъекций.

Задание 2. Ответьте на вопросы.

1. Какой препарат из М-холиноблокирующих средств наиболее удобен и активен в купировании колик?
2. Чем объяснить тот факт, что М-холиноблокаторы противопоказаны при глаукоме?
3. Какую помощь следует оказать больному при отравлении атропином?

1. Тема. Средства, влияющие на центральную нервную систему.

2. Цель. Для успешного изучения раздела при разборе материала особое внимание следует обратить на следующее.

1. Классификация средств, влияющих на центральную нервную систему.
2. Характеристика отдельных фармакологических групп, особенности их действия на организм и применение в различных областях медицины.
3. Характеристика и особенности применения отдельных препаратов (тактика применения, возможность кумуляции, привыкания, лекарственной зависимости и т.д.).
4. Правила выписывания в рецептах отдельных лекарственных средств.
5. Правила хранения и учета отдельных лекарственных средств в лечебных учреждениях.

3. Тезисы лекции.

Лекарственные средства, влияющие на центральную нервную систему, классифицируют по их основным эффектам, и среди них различают: 1) средства для наркоза; 2) спирт этиловый; 3) снотворные средства; 4) противосудорожные и противосудорожные средства; 5)

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	88стр. из 164	

средства для лечения паркинсонизма; 6) анальгетические средства; 7) психотропные средства; 8) аналептики.

1. Средства для наркоза Наркоз — временный (обратимый) паралич нервной системы с выключением всех видов чувствительности, сознания, двигательной активности при частичном сохранении функций продолговатого мозга. Во время наркоза снижается или выключается рефлекторная возбудимость, тонус мышц, в норме лишь сохраняются функции органов дыхания и сердечно-сосудистой системы. Наркоз обратим, поэтому после прекращения действия препарата функции организма полностью восстанавливаются. На центральную нервную систему средства для наркоза действуют в определенном порядке. В первую очередь они угнетают, а затем выключают кору головного мозга (сознание), далее — спинной мозг и в последнюю очередь частично (!) — продолговатый мозг. Полное угнетение продолговатого мозга во время наркоза недопустимо, так как там находятся жизненно важные центры: центр дыхания и сосудистодвигательный центр. В зависимости от путей введения средства для наркоза делят на две группы:

1) средства для ингаляционного наркоза; 2) средства для неингаляционного наркоза.

1. Средства для ингаляционного наркоза Ингаляционные наркотические анальгетики вводят в организм путем вдыхания. Наиболее доступным и простым является открытый способ, когда средство для наркоза, например эфир, наносят на обычную марлевую маску и накладывают ее на рот и нос больного. В современных условиях ингаляционный наркоз проводят с помощью специальной аппаратуры, позволяющей дозировать концентрацию наркотического вещества в крови и таким образом управлять глубиной и продолжительностью наркоза. С помощью наркозных аппаратов средство для наркоза может быть введено через специальную маску (масочный наркоз) или через специальную трубку в трахею (интратрахеальный наркоз). В случае необходимости наркозный аппарат можно переключить с подачи наркотического вещества на подачу кислорода. В течении наркоза, т.е. действия препаратов на организм больного, существует определенный порядок и особенности. Рассмотрим их на примере эфира для наркоза. ЭФИР ДЛЯ НАРКОЗА {Aether pro narcosi) — самое известное и часто используемое наркотическое средство. Это легколетучая, бесцветная, с характерным запахом жидкость, обладающая высокой наркотической активностью и большой широтой наркотического действия и сравнительно небольшой токсичностью. Он хорошо расслабляет скелетные мышцы, что является непременным условием хирургической операции. В течении наркоза, в том числе и эфирного, различают четыре стадии. 1. Стадия анальгезии характеризуется утратой болевой чувствительности, нарушением ориентации, шумом в ушах при сохранении рефлексов и сознания. Дыхание, пульс, артериальное давление остаются неизменными. Этот период напоминает состояние человека, когда он вот-вот заснет. Заканчивается стадия выключением коры головного мозга и сознания. 2. Стадия возбуждения — выключение коры головного мозга, что вызывает растормаживание и возбуждение нижележащих отделов и подкорковых центров. Возникает, как говорил И.П. Павлов, «бунт подкорки», что проявляется в повышении двигательной, речевой активности, повышении артериального давления, учащении пульса и дыхания. В этой стадии у больного может возникнуть кашель, рвота, обильное слюноотделение (соливатация) и даже остановка сердца и дыхания. Дальнейшее увеличение концентрации наркотического вещества в крови приводит к постепенному выключению подкорковых центров и спинного мозга, больной успокаивается и наступает следующая стадия. 3. Стадия хирургического наркоза включает четыре уровня (степени) глубины наркоза, которые зависят от степени угнетения продолговатого мозга. Она характеризуется отсутствием болевой чувствительности,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	89стр. из 164

расслаблением мышц, сужением, а затем расширением зрачков, стабилизацией дыхания и сердечного ритма. Регулируя концентрацию наркотического вещества в организме больного, можно поддерживать стадию наркоза на различном уровне и длительное время, что позволяет проводить самые сложные хирургические операции. 4. Стадия пробуждения (восстановления) наступает после прекращения введения наркотического вещества и протекает в обратном наркозу порядке, т.е. рефлексы, утрачиваемые при наркозе последними, восстанавливаются в первую очередь и наоборот. Последним, как правило, возвращается сознание, но ненадолго, потому что больные вскоре засыпают посленаркозным сном. Несмотря на то что эфир для наркоза обладает многими положительными качествами, он имеет целый ряд отрицательных свойств. Во-первых, у него довольно длительная стадия возбуждения, во-вторых, он сильно раздражает слизистые дыхательных путей, повышая слюноотделение. При его применении возможна рвота, остановка сердца и дыхания. Для профилактики этих осложнений перед операцией больному вводят раствор атропина сульфата или целый комплекс — атропин-промедол-дроперидол. Введение лекарственных препаратов для профилактики возможных осложнений, а также для потенцирования наркоза называется премедикацией. Кроме того, эфир сильно раздражает дыхательные пути, вызывает их переохлаждение, что может привести к развитию послеоперационных бронхитов и пневмоний, почему больным нередко еще до операции и во время нее для профилактики воспалительных процессов вводят антибиотики. Выпускают эфир для наркоза в склянках темного стекла по 100 мл. В современной хирургии эфир для наркоза используется сравнительно редко.

ВНИМАНИЕ! Эфир для наркоза требует определенной осторожности так как он легко воспламеняется, а смесь его с воздухом или кислородом взрывоопасна (I), поэтому сохранять его необходимо вдали от источников огня.

ФТОРОТАН (Phthorotanium) по наркотической активности превосходит эфир, не уступает ему по широте наркотического действия, но не горит, не воспламеняется и не взрывоопасен. Это мощное наркотизирующее средство, которое может применяться самостоятельно и в качестве компонента комбинированного наркоза, особенно с закисью азота. Фторотановый наркоз развивается быстро, первая его стадия заканчивается через 1—2 минуты после начала вдыхания препарата, а через 3—5 минут начинается стадия хирургического наркоза. Стадия возбуждения при этом почти не наблюдается, раздражения слизистых не происходит, угнетается секреция слюнных желез. Препарат не лишен недостатков, он снижает артериальное давление, вызывает брадикардию за счет повышения тонуса блуждающего нерва, иногда тошноту, рвоту и головную боль, снижает тонус матки и отрицательно действует на печень (гепатотоксичность). Чтобы избежать его побочных эффектов, больным перед фторота- новым наркозом вводят раствор атропина или метацина. Фторотан противопоказан при гипотонии, нарушении ритма сердца, беременности и во время родов. Выпускают Фторотан в склянках темного стекла по 50 и 100 мл. Список Б. **АЗОТА ЗАКИСЬ** (Nitrogenium oxydulatum) — бесцветный, инертный газ с довольно слабой наркотической активностью. С целью повышения наркотической активности и получения более глубокого наркоза ее комбинируют с эфиром, фторотаном, циклопропаном и т.д. Азота закись не раздражает дыхательные пути, вызывает наркоз почти без стадии возбуждения и после прекращения наркоза выделяется из организма в течение 10—15 минут. Недостатком препарата считается неполное расслабление скелетных мышц, поэтому во время операции возникает необходимость использовать мышечные релаксанты. Азота закись обладает довольно сильным анальгетическим (обезболивающим) действием, и ее нередко используют в смеси с кислородом (1 : 1; 1 : 2), например при инфаркте миокарда,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	90стр. из 164	

в детской практике — в послеоперационный период, а также для обезболивания родов и при малых хирургических вмешательствах.

Выпускают азота закись в металлических баллонах серого цвета по 1 и 10 л под давлением в 50 атмосфер с надписью «Для медицинских целей».

Кроме указанных средств для ингаляционного наркоза используют циклопропан, трихлорэтилен, хлорэтил, наркотан и другие препараты.

1.2. Средства для неингаляционного наркоза Под неингаляционным понимают наркоз, который достигается путем введения наркотического средства в вену, реже — в мышцу или ректально, т.е. минуя дыхательные пути. В разработку и внедрение неингаляционного наркоза в медицинскую практику большой вклад внесли русские ученые Н.И. Пирогов, И.П. Кравков и С.П. Федоров. Предложенный в начале XX в. Н.П. Кравковым метод внутривенного наркоза с помощью гексенала получил широкое распространение и был известен не только в нашей стране, но и за рубежом, где получил название «русский наркоз». Неингаляционный наркоз по сравнению с ингаляционным — более простой, не требует использования сложной аппаратуры, развивается быстро, протекает почти без стадии возбуждения, и у больных почти не возникает побочных явлений в виде тошноты, рвоты, кашля, удушья, обильного слюноотделения (соликации) и т.д. Однако неингаляционный наркоз сравнительно плохо управляем, поэтому довольно сложно точно регулировать его глубину, и это является серьезным недостатком. В настоящее время медицинская практика для неингаляционного наркоза использует гексенал, тиопентал натрия, натрия оксибутират, кетамин (калипсол), пропанидид и другие препараты. ГЕКСЕНАЛ (Hexenalum) — производное барбитуровой кислоты, легко растворим в воде, но растворы его нестойки, поэтому готовят его непосредственно перед употреблением (ex tempore) на изотоническом растворе натрия хлорида или воде для инъекций. Препарат обладает высокой наркотической активностью и быстрым развитием эффекта. Самостоятельно используется для кратковременных (15—20 минут) внеполостных операций в виде 1 и 2%, реже 2,5% растворов, которые вводят в вену очень медленно. Иногда его применяют в психиатрии для купирования возбуждения у больных.

Выпускают гексенал по 1,0 г в виде стерильного порошка в герметически закрытых флаконах. Хранят препарат как сильнодействующее вещество по списку Б. ТИОПЕНТАЛ НАТРИЯ (Thiopentalum natrium) по своим качествам близок к гексеналу. Его растворы также готовят непосредственно перед употреблением, используя в качестве растворителя воду для инъекций. Растворы готовят 2—2,5% и вводят в вену медленно. После однократной дозы наркоз продолжается 20—25 минут. При его передозировке в качестве антагониста используют раствор бемегида или другие препараты из группы аналептиков. Выпускается тиопентал натрия в виде стерильного порошка по 1 г в герметически закрытых флаконах. Список Б. КЕТАМИНА ГИДРОХЛОРИД (Ketamini hydrochloridum), синоним: калипсол, оказывает наркотизирующее и анальгетическое действие. Используется для вводного и базисного наркоза при кратковременных хирургических операциях. Вводят кетамин в вену или в мышцу, в последнем случае наркоз развивается чуть медленнее, но длится до 40 минут. Кетамин может применяться самостоятельно (моонаркоз) или в комбинации с другими средствами для наркоза, особенно у больных с низким артериальным давлением. Кетамин противопоказан при артериальной гипертонии и нарушении мозгового кровообращения. Выпускают кетамин в виде 5% раствора во флаконах по 10 мл. Список Б. ПРОПАНИДИД (Propanididum), синоним: сомбревин, препарат предназначен для внутривенного введения взрослым в виде 5% раствора, а детям и истощенным больным вводят 2,5% раствор. Наркотический эффект после внутривенного

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс		91стр. из 164

введения препарата развивается через 20—40 секунд и продолжается в течение 3—5 минут. Препарат предназначен для кратковременного наркоза, который бывает необходим при вправлении вывихов, репозиции (сопоставлении) отломков, при биопсии, снятии швов и присохших повязок ит.д. Пропанидид противопоказан при сердечной недостаточности и заболеваниях почек. Выпускают пропанидид в виде 5% раствора в ампулах по 10 мл. Список Б. НАТРИЯ ОКСИБУТИРАТ (Natrii oxybutiras) — натриевая соль гамма-максимасляной кислоты (ГОМК), которая в отличие от своего аналога гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК), выполняющей роль основного тормозящего фактора центральной нервной системы, легко всасывается из крови в мозг. Малые дозы препарата оказывают успокаивающий, анальгетический и мышечно-расслабляющий эффект, большие дозы — снотворное и наркотическое действие. Препарат обладает достаточной широтой наркотического действия. Для наркоза используют 20% раствор препарата в ампулах по 10 мл. После внутривенного введения препарата наркоз наступает через 20—30 минут без стадии возбуждения и продолжается до 2 часов. Во время наркоза препарат не угнетает дыхание и повышает устойчивость мозга и сердца к условиям гипоксии. Его можно использовать для устранения психического возбуждения и обезболивания родов. Выпускают натрия оксибутират в виде 20% раствора в ампулах по 10 мл и 5% сиропа во флаконах по 400 и 500 мл. Список Б.

2. Спирт этиловый Это лекарственное средство представляет собой бесцветную, прозрачную, легко воспламеняющуюся жидкость с характерным запахом и вкусом. Медицинская практика чаще всего использует спирт этиловый 95, 70 и 40% концентрации. По своему действию на центральную нервную систему он является наркотическим средством, но для наркоза не применяется, так как вызывает длительную стадию возбуждения при одновременно малой широте наркотического действия, т.е. концентрация спирта этилового в крови, вызывающая наркоз, близка к смертельной. Он в равной степени угнетает центры спинного и продолговатого мозга, что приводит к нежелательным последствиям. При приеме внутрь в слабых концентрациях спирт этиловый, раздражая слизистые желудка, увеличивает его секрецию и повышает аппетит, в больших концентрациях — разрушает ферменты и нарушает процесс пищеварения. Всасываясь в кровь, спирт этиловый в первую очередь угнетает головной мозг, подавляет процессы торможения, вызывает нарушение координации движения, снижает критическую оценку действий и поступков, повышает агрессивность, притупляет память, способствует эмоциональному возбуждению, развитию эйфории, состоянию, при котором притупляется чувство страха, тоски, боли, «улучшается» общее состояние и настроение. В организме спирт этиловый медленно, но полностью разрушается (окисляется) до углекислого газа и воды, при этом образуется большое количество тепла, поэтому его иногда используют как согревающее средство при обморожениях и переохлаждениях. После приема спирта внутрь человек на первых порах ощущает тепло, но чувство это обманчиво, особенно если человек находится в условиях низкой температуры, потому что одновременно с возрастанием теплообразования возрастает и теплоотдача за счет расширения сосудов и потоотделения. Именно этим объясняется быстрая гибель на морозе людей, находящихся в состоянии сильного опьянения. При местном применении спирт этиловый отнимает у клеток тканей и микроорганизмов воду (дегидратирующий эффект), свертывает белок (денатурация) и вызывает их гибель. Благодаря этому свойству спирт широко применяется как антисептическое средство. Наиболее сильное противомикробное действие выражено у 95% спирта этилового, но за счет быстрого, сильного и необратимого свертывания белка (дубящее действие) обеззараживает лишь поверхностный слой и не проникает в глубь

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	92стр. из 164	

клетки. Его используют для обработки хирургического инструментария, игл, катетеров, реже — рук хирурга и ожогов. Сильным противомикробным действием обладает 70% спирт этиловый, который легко проникает в глубь клетки и за счет дегидратации вызывает ее гибель. Он считается пригодным для обработки рук хирурга, операционного поля, места инъекций и т.д. У 40% спирта этилового противомикробное действие выражено слабее, но он обладает хорошим раздражающим, согревающим, отвлекающим действием, поэтому применяется для компрессов, растираний, обработки пролежней, при воспалительных заболеваниях суставов, мышц, а также способствует улучшению функционального состояния отдельных органов. Кроме того, он оказывает анальгетическое действие, в связи с чем его иногда применяют для профилактики травматического (болевого) шока. Итак, спирт этиловый обладает антисептическим, дубящим, раздражающим, отвлекающим, согревающим и обезболивающим действием, но для наркоза не применяется, хотя в целом угнетает деятельность ЦНС. Прием внутрь спирта этилового даже в малых дозах может вызвать острое отравление, для которого характерно резкое угнетение центральной нервной системы, головокружение, галлюцинации, расслабление мышц, снижение активности и последующая потеря сознания. Развивается состояние, напоминающее наркоз. Наиболее опасным в этом случае является резкое ослабление дыхания, а смерть чаще всего наступает от паралича дыхательного центра. Хроническое отравление спиртом этиловым возникает при частых повторных употреблении спиртных напитков, вследствие чего развивается лекарственная зависимость, заболевание, которое носит название алкоголизм. При этом страдает центральная нервная система, изменяется психика, нарушается физическая и умственная работоспособность, работа сердечно-сосудистой системы, нередко психозы в виде белой горячки, бредовых галлюцинаций и т.д. При приеме внутрь спирт этиловый равномерно распределяется по всему организму, легко проникает через все его барьеры, в том числе и плацентарный, вызывает нарушение наследственного аппарата, что нередко приводит к рождению детей с умственными и физическими дефектами.

Кроме того, алкоголизм способствует нарушению трудовой дисциплины и росту преступности. Алкоголизм — социальное зло, борьба с которым должна вестись постоянно! Лечение больных алкоголизмом проводится различными методами в специальных наркологических клиниках и отделениях психиатрических больниц. Чаще всего для лечения используют вещества, вызывающие отвращение к алкоголю, например тетурам, диамид и др. Эти препараты замедляют распад (окисление) алкоголя на фазе уксусного альдегида, который для организма является токсическим веществом. В обычных условиях он легко распадается с образованием углекислого газа и воды, а в присутствии, например, тетурама накапливается в организме, вызывает сильные головные боли, тошноту, рвоту, боли в сердце, нарушение дыхания и сильное чувство страха за свою жизнь. И если во время лечения повторить одновременное применение тетурама и алкоголя хотя бы 2—3 раза, но обязательно (!) под контролем врача, то можно у больного выработать отрицательный условный рефлекс на спиртные напитки. Для более длительного воздействия на организм используют депонированную (продолгованную) форму тетурама — Эспераль. Это стерильно приготовленные запаянные в ампулы по 10 штук таблетки, содержащие по 0,1 г тетурама. Таблетки вшивают в подкожную жировую клетчатку бедра, ягодицы, области спины или нижней части живота. Постепенное рассасывание таблеток обеспечивает постоянную концентрацию препарата в крови на длительное время. Отрицательный рефлекс на спиртное можно выработать у больного одновременным применением небольших доз алкоголя и сильного рвотного средства, например апоморфина

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	93стр. из 164	

гидрохлорида. Кроме того, с целью нормализации деятельности организма при лечении алкоголизма проводится общеукрепляющая терапия, т.е. назначают витаминные препараты, глюкозу, сердечно-сосудистые и другие средства. В настоящее время для лечения алкоголизма используют и другие методы, например гипноз, психотерапию; проводится анонимное лечение больных. СПИРТ ЭТИЛОВЫЙ (Spiritus aethylicus) — прозрачная, бесцветная, легковоспламеняющаяся жидкость с характерным запахом и вкусом. Применяется преимущественно наружно как антисептическое, раздражающее и согревающее средство. Иногда вводят в вену при гангрене или абсцессе легкого в виде 20—30% раствора с изотоническим 0,9% раствором натрия хлорида или водой для инъекций. Его широко применяют для приготовления растворов, настоек, экстрактов и ряда других лекарственных форм. В лечебных учреждениях спирт этиловый хранится под замком и подлежит ежедневному количественному учету. ТЕТУРАМ (Teturamum) — белый кристаллический порошок, почти нерастворимый в воде. Применяется внутрь по 0,15—0,5 г на прием для лечения алкоголизма. Тетурам-алкогольные пробы во время лечения можно проводить только в стационаре в присутствии врача и желательно в специально оборудованном кабинете. Тетурам является основой препарата Эспераль, используемого также для лечения алкоголизма. Тетурам противопоказан при тиреотоксикозе, сахарном диабете, бронхиальной астме, в период обострения язвенной болезни, при психических заболеваниях. Выпускают Тетурам в таблетках по 0,1; 0,15; 0,25 г. Хранят препарат по списку Б. ЦИАМИД (Cyamidum) — таблетки, состоящие из циамида кальция и лимонной кислоты. Применяются для лечения хронического алкоголизма. Методика лечения, меры предосторожности и противопоказания — такие же, что и при применении тетурама. Выпускают циамид в таблетках по 0,05 г. Хранят препарат по списку Б.

3. Снотворные средства Сон — это сложное состояние организма человека, характеризующееся определенной периодичностью процессов торможения и активной деятельности мозга. Он регулируется, с одной стороны, тормозящей сомногенной (гипногенной) системой, а с другой — активирующей ретикулярной формацией. Обе системы находятся в верхнем отделе центральной нервной системы, и определенный баланс в их деятельности способствует наступлению здорового сна. Если же преобладает деятельность активирующей ретикулярной формации, то сон нарушается и наступает гипносомия. Особенно резко активность ретикулярной формации возрастает при наличии неприятных ощущений боли, эмоциональных переживаний, в результате нарушения деятельности других систем организма и т.д. В таких случаях сон становится поверхностным, беспокойным, с частым или вообще ранним пробуждением. В связи с этим снотворными называют вещества, ослабляющие активирующее влияние ретикулярной формации на кору головного мозга, нормализующие сон, делающие его близким к физиологическому. Во время сна происходит эмоциональная разрядка мозга, осуществляется своеобразная сортировка информации, полученной за день, и перенос ее в долговременную память. Сон имеет свой биоритм, который состоит из двух фаз: фазы медленного сна (МС) и фазы быстрого сна (БС). Медленный сон занимает 75—80% общего времени сна, и он характеризуется снижением активности нейронов мозга, частоты пульса и дыхания. На фазу быстрого сна приходится 20—25% времени сна, и длится она в среднем от 5 до 20 минут (рис. 11). Для этой фазы характерно повышение активности нейронов головного мозга, повышение артериального давления, учащение пульса, дыхания, зрачки суживаются, появляется быстрое движение глаз, особенно хорошо заметное у детей. Во время быстрого сна человек видит сны, меняет положение тела, иногда разговаривает и т.д.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	94стр. из 164	

К утру время быстрого сна постепенно увеличивается, а медленного соответственно уменьшается, но в сумме биоритм остается постоянным и равен примерно 90 минутам. Итак, за ночь у человека проходит 5—6 ритмических чередований медленного и быстрого сна. И.П. Павлов утверждал, что для наступления нормального сна необходимы определенные условия, а именно выключение первой и второй сигнальных систем. Первой сигнальной системой он считал внешние и внутренние раздражители: шум, свет, боль, голод и др.; второй — слово, поэтому до тех пор, пока человек лежит и думает, сон у него не наступает. Последняя форма нарушения сна или расстройства засыпания характерна для молодых людей, отличающихся большей эмоциональной активностью, чем пожилые люди. Другой формой нарушения сна является раннее пробуждение (укороченный сон), она присуща лицам пожилого и старшего возраста и объясняется снижением активности тормозящей сомногенной системы (somnus — сон). Однако любая форма бессонницы отрицательно сказывается на деятельности всего организма. Лечение бессонницы следует начинать с регуляции режима дня, питания, правильной организации труда и устранения основного заболевания. Если же этиотропная (причинноустраняющая) терапия не нормализует сон, то в этих случаях прибегают к назначению снотворных средств, которые по своему характеру действия являются симптоматическими средствами, т.е. выполняют вспомогательную роль в лечении основного заболевания.

ПОМНИТЕ! Снотворные средства назначают строго по показаниям или от случая к случаю, чтобы не вызвать привыкание к ним со стороны организма человека.

В соответствии с химической структурой средства, применяемые при нарушениях сна, делят: 1) на производные барбитуровой кислоты (фенобарбитал и др.); 2) производные бензодиазепаина (нитразепам и др.); 3) производные этаноламина (донормил); 4) снотворные средства иной химической структуры. Назначение пациентам снотворных средств проводится строго по показаниям, а дозы подбираются индивидуально. В действии снотворных средств есть одна особенность, которую следует учитывать. Нередко у больных, сравнительно часто прибегающих к применению снотворных средств, развивается характерный рефлекс «таблетка — сон», у них появляется чувство, что без таблетки они не заснут. Чтобы не допустить развития подобного рефлекса, снотворные средства назначают за 30—60 минут до сна, а между приемом таблетки и сном вводят «вставку», «отвлекающий момент» (ванна, книга, вязание), чтобы больной не сосредоточивал внимание на действии препарата, а наступление сна проходило бы естественным путем.

ПОМНИТЕ! Снотворные средства несовместимы с алкоголем, так как усиливают угнетающее действие последнего на жизненно важные центры продолговатого мозга, что может привести к серьезным последствиям, вплоть до смертельного исхода.

Производные барбитуровой кислоты, к которым относится фенобарбитал, в качестве снотворных средств почти не используются из-за большого числа вызываемых ими побочных эффектов, например нарушения координации движения, кумуляции, привыкания, к ним часто развивается толерантность, психологическая и физическая зависимость, лишь иногда фенобарбитал применяют для устранения судорог при эпилепсии. Производные бензодиазепаина тоже полностью не отвечают требованиям, предъявляемым к снотворным средствам, но по сравнению с барбитуратами они лучше переносятся, вызывают глубокий сон, не кумулируют, оказывают транквилизирующее, мышечно-расслабляющее и противосудорожное действие. Одновременно они устраняют чувство тревоги, напряжения, страха и т.д. Представителями этой группы снотворных средств являются нитразепам, регипиол (флунитразепам), триазолам и др. НИТРАЗЕПАМ

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	95стр. из 164	

(Nitrazepamum) обладает выраженным снотворным, успокаивающим и противосудорожным действием. Сон после применения препарата наступает через 20—40 минут и продолжается до 6—8 часов. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,005—0,01 г на прием за полчаса до сна. Используют препарат при различных нарушениях сна, неврозах, сопровождающихся чувством тревоги, страха и напряжения, иногда его применяют для премедикации перед операциями. Противопоказанием к применению нитразепама служат беременность, особенно первые три месяца, миастения и заболевания печени. Не рекомендуют применять препарат лицам, работа которых требует быстрой смены физической и психической реакции (водители транспорта), так как нитразепам притупляет внимание и замедляет ответную реакцию. Выпускают нитразепам в таблетках по 0,005 г. Список Б. ФЛУНИТРАЗЕПАМ (Flunitrazepam), синоним: рогипнол, оказывает седативное, снотворное и противосудорожное действие. Он укорачивает время засыпания, углубляет сон и уменьшает число ночных пробуждений. Назначают флуниитразепам при различных видах бессонницы за 30 минут до сна в таблетках по 0,001—0,002 г. В анестезиологии препарат иногда вводят парентерально (в вену или в мышцу) для премедикации и введения в наркоз. Побочные эффекты, противопоказания такие же, как у нитразепама. Выпускают флуниитразепам в таблетках по 0,001—0,002 г и в ампулах по 1 мл, содержащих по 2 мг флуниитразепама, с приложением растворителя. Список Б. ДОКСИЛАМИН (Doxylaminum), синоним: донормил, — представитель класса этаноламинов из группы блокаторов H₁ гистаминовых рецепторов. Подобно димедролу, но гораздо сильнее оказывает снотворное, седативное и M-холиноблокирующее действие. Показаниями к применению доксиламина служат нарушения сна, раннее пробуждение и бессонница. Препарат сокращает время засыпания, повышает качество сна и увеличивает его продолжительность до 6—8 часов. Применяют доксиламин по 0,5—1 таблетке за 15—20 минут до сна с небольшим количеством воды. Среди побочных явлений возможны дневная сонливость, сухость во рту, задержка мочи и запор (M-холиноблокирующие эффекты). Побочные эффекты обычно проходят самостоятельно после уменьшения дозы или отмены препарата. Доксиламин (как и димедрол) не рекомендуют применять лицам, работа которых требует внимательности, сосредоточения, связана с быстрой сменой психической и двигательной реакции (водители транспорта, станочники, спортсмены). Он несовместим с алкоголем из-за возможности отрицательных последствий. Препарат противопоказан при глаукоме, увеличении предстательной железы у мужчин, кормящим матерям и детям до 15 лет. Выпускают доксиламин в таблетках по 0,015 г. Список Б.

Противосудорожные и противозипелитические средства Судороги — это неконтролируемые центральной нервной системой произвольные сокращения мышц, вызывающие искажение нормальной формы тела и конечностей. Они могут развиваться при воспалительных заболеваниях головного мозга и его оболочек (энцефалит, менингит), отравлениях судорожными ядами (никотин), при столбняке, эпилепсии, эклампсии (токсикоз второй половины беременности). У детей судороги иногда развиваются при высокой температуре или в результате родовой травмы. Эпилепсия (припадок) — хроническое нервно-психическое заболевание, сопровождающееся судорожными припадками, изменением психики, поведения и характера больных. Она может быть самостоятельным заболеванием или симптомом другого заболевания, связанного с инфекционным поражением мозга, его опухолью или травмой. Независимо от вида и причин заболевания различают три основных типа эпилептических припадков: 1) большие судорожные припадки, характеризующиеся потерей сознания, тоническими и клоническими судорогами, охватывающими все тело;

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	96стр. из 164	

2) малые припадки, протекающие с кратковременной, иногда в несколько секунд, потерей или притуплением сознания без заметных судорог; 3) психомоторные припадки, для которых характерны нарушение сознания, провалы памяти, двигательное и психическое беспокойство. Больной в таком состоянии способен совершать необдуманные поступки (бесконечные и бесцельные поездки, выступления, разрушение чего-нибудь, поджоги и т.д.). Для эпилепсии характерно усиление процессов возбуждения вследствие повышенной активности нейромедиаторов в области головного мозга и, наоборот, снижения процессов торможения в ЦНС из-за недостатка гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК), основного ее медиатора торможения. Противосудорожные средства подавляют возбудимость нейронов головного мозга, усиливают процессы торможения двигательных зон головного и спинного мозга, способствуют накапливанию веществ, тормозящих активность центральной нервной системы, в том числе и ГАМК, снижают секрецию гормонов коры надпочечников. При их применении количество припадков значительно снижается и одновременно замедляется процесс деградации личности. В настоящее время для лечения эпилепсии используют препараты различных химических групп, избирательно подавляющие судорожные припадки, но не вызывающие (в лечебных дозах) снотворного эффекта. Среди них — производные барбитуровой кислоты (Фенobarбитал, Бензонал), стимуляторы ГАМК (Ацедипрол, Вальпромид), препараты смешанного нейродермического действия (Дифенин, карбамазепин), производные бензодиазепа (Клоназепам), антиспастические (Мидокалм, Миолгин, Тизанидин) и другие противосудорожные средства (Этосуксимид, Хлоракон). АЦЕДИПРОЛ (Acediprolum), синоним: Депакин, — противоэпилептический препарат широкого спектра действия, основным компонентом которого является вальпроат натрия. Применяют Ацедипрол взрослым и детям при различных формах эпилептических припадков. Он также улучшает психическое состояние и настроение больных, снижает чувство тревоги, страха и волнения. Принимают препарат внутрь 1—2 раза в день во время еды или сразу после нее, начиная с небольших доз, постепенно увеличивая их до получения терапевтического эффекта, после чего больному подбирают индивидуальную поддерживающую дозу.

При применении Ацедипрола возможны побочные явления в виде тошноты, боли в животе, головной боли, кожных аллергических реакций, носящих временный характер. Осторожно применяют препарат больным с нарушениями функций печени, поджелудочной железы и плохой свертываемостью крови. Выпускают Ацедипрол в таблетках по 0,3 и 0,5 г и в виде 5% сиропа для детей. Список Б. Аналогичным Ацедипролу действием обладают препараты вигаба- трин и вальпромид. ДИФЕНИН (Dipheninum), синоним: фенитоин, оказывает выраженное противосудорожное действие без седативного и снотворного эффекта. Его применяют при эпилепсии, протекающей с большими судорожными припадками. Механизм действия Дифенина связывают с блокадой им натриевых каналов нервных клеток, со способностью ограничивать распространение судорожной активности и задержкой высвобождения возбуждающих аминокислот. Лечение Дифенином начинают с малых доз, назначая по 1 таблетке 1—2 раза в день во время или сразу после еды. При необходимости суточную дозу увеличивают до 3—4 таблеток. Иногда Дифенин назначают для устранения тахикардии, вызванной передозировкой сердечных гликозидов. Побочные эффекты дифенина проявляются в виде тошноты, тремора, аллергических реакций и гиперплазии десен. Противопоказан препарат при заболеваниях печени, почек, сердечной недостаточности и кахексии. Выпускают Дифенин в таблетках по 0,2 г № 20. Список Б. КАРБАМАЗЕПИН (Carbamazepinum), синоним: финлепсин, — активное противоэпилептическое средство, обладающее противосудорожным, умеренным

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	97стр. из 164	

антипсихотическим, антидепрессивным, нормотимическим и анальгетическим действием. Применяют карбамазепин при всех формах эпилепсии и невралгии тройничного нерва. Механизм действия препарата объясняют его способностью блокировать натриевые каналы нервных клеток, его ГАМКергическими свойствами, вследствие чего снижается возбуждающее влияние на головной мозг нейромедиаторных аминокислот (глутаминовой и аспарагиновой).

Назначают карбамазепин внутрь во время еды, начиная с 0,1 г 2—3 раза в день, постепенно увеличивая дозу до 0,4—1,2 г. Препарат хорошо переносится больными и лишь иногда вызывает тошноту, снижение аппетита, головную боль, нарушение аккомодации и аллергические реакции. Его не назначают в первые 3 месяца беременности, и он противопоказан при нарушении атриовентрикулярной проводимости. Выпускают карбамазепин в таблетках по 0,1 и 0,2 г и таблетках - ретард по 0,2 и 0,4 г № 30 и № 50. Список Б. КЛОНАЗЕПАМ (Clonazepam) по химической структуре близок к ни- тразепаму и другим производным бензодиазепаина. Он оказывает выраженное противосудорожное действие. Проявляет успокаивающий, снотворный, мышечнорасслабляющий и анксиолитический (транквилизирующий) эффект. Клоназепам активизирует ГАМКергические процессы и взаимодействие с бензодиазепиновыми рецепторами, что приводит к уменьшению припадков. Применяется клоназепам для лечения взрослых и детей при различных формах судорог и психомоторных кризах. Начинают лечение с малых доз (0,0005—0,001 г) на ночь в течение 4 дней, после чего дозу постепенно увеличивают. При использовании препарата для устранения судорог возможны расстройство координации движения, миалгия, угнетение кроветворения, аллергические реакции и т.д. С осторожностью его советуют назначать лицам, работа которых требует быстрой реакции и концентрации внимания (водители транспорта, операторы и др.). Противопоказанием к применению препарата служат заболевания печени, почек, миастения, беременность и кормление грудью. Выпускают клоназепам в таблетках по 0,0005, 0,001 и 0,002 № 30, в виде 0,25% раствора для приема внутрь в виде капель и 0,5% раствора в ампулах по 2 мл. Список Б. ТРИМЕТИН (Trimetinum) — активный препарат для лечения различных форм малых припадков, он обладает хорошим успокаивающим и анальгетическим действием. Назначают Триметин в таблетках по 0,1 г 3 раза в день после еды. Курс лечения составляет 3—4 месяца. Выпускают Триметин в таблетках по 0,1 г. Список Б. МИОЛГИН (Myolgin) относится к группе антиспастических средств, представляет собой комбинированный препарат, состоящий из хлорзоксазона (миорелаксант) и парацетамола, оказывает мышечнорасслабляющее и анальгетическое действие. Применяют Миолгин при болях, связанных с растяжением мышц, вывихами и при поясничных ревматических болях. Назначают препарат по 1—2 капсулы 2—3 раза в день. Выпускают препарат в капсулах. Список Б. Подобным действием обладает препарат тизанидин, который выпускается в таблетках по 0,002; 0,004 и 0,006 г. Его, как и Миолгин, с осторожностью следует назначать лицам, работа которых требует быстрой психической и физической реакции (водители транспорта и др.). Следует помнить, что противоэпилептические средства для лечения применяют непрерывно и длительно, поэтому необходимо следить за их переносимостью больными, а отмена подобных препаратов во всех случаях должна проводиться постепенно во избежание рецидива. Замену одного противоэпилептического препарата другим проводят также постепенно, снижая дозу ранее используемого препарата и заменяя его новым препаратом в нарастающих дозах.

5. Средства для лечения паркинсонизма Паркинсонизм — клинический синдром, характеризующийся наличием у больного тремора (дрожание) конечностей, ригидности и

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	98стр. из 164	

незначительных самопроизвольных движений. Наиболее выраженным симптомом болезни является тремор одной руки, который постепенно распространяется на ногу этой же половины тела, а затем на другие конечности. При паркинсонизме отмечается недостаток нейромедиатора дофамина в базальных ганглиях мозга, снижение чувствительности дофаминовых рецепторов и преобладающее действие нейромедиаторов, импульсы которых и определяют картину паркинсонизма. Механизм действия противопаркинсонических средств основан на восстановлении равновесия между дофаминовыми и ацетилхолиновыми (холинергическими) импульсами в головном мозге. Для снижения симптомов заболевания используют холиноблокирующие (холинолитические) средства, ослабляющие или выключающие действие ацетилхолина как нейромедиатора. Они оказывают сильное центральное Н-холиноблокирующее и периферическое М-холиноблокирующее действие, в результате чего повышается количество дофамина, расслабляется гладкая мускулатура, снижается количество слюны и пота, расширяются зрачки, а главное, уменьшается тремор рук, шеи и головы. Такое действие оказывают препараты группы атропина (М-холиноблокаторы), его аналоги (циклодол, тропацин) и агонисты дофамина (леводопа и др.). ЦИКЛОДОЛ (Cyclodolum) — синтетический холиноблокатор с выраженным центральным (Н-холиноблокирующим) и периферическим М-холиноблокирующим действием. У больных паркинсонизмом уменьшается тремор, слюно- и потоотделение, исчезают другие неприятные симптомы. Применяют Циклодол при паркинсонизме, спастических параличах, для улучшения движения при парезах пирамидального характера. Принимают Циклодол внутрь во время или после еды в таблетках, начиная с малых доз (0,0005—0,001 г) в день, а в последующие дни увеличивают дозу до 0,002 г до 2—3 раз в день. Среди побочных эффектов при применении Циклодола возможны сухость во рту, нарушение зрения, тахикардия, психическое и двигательное возбуждение. Не следует принимать препарат при глаукоме, беременности и аденоме простаты. Выпускают Циклодол в таблетках по 0,001; 0,002 и 0,005 г. Список А. ТРОПАЦИН (Tropacinum) — эффективный противопаркинсонический препарат из группы холиноблокаторов. Он также обладает ганглиоблокирующим действием и оказывает непосредственный спазмолитический эффект на гладкую мускулатуру внутренних органов и кровеносных сосудов. Тропацин эффективен при спастических парезах и параличах, судорожных пароксизмах у детей и других заболеваниях, сопровождающихся повышенным тонусом мышц, например при спазме гладкой мускулатуры брюшной полости, язвенной болезни желудка и т.д. Назначают Тропацин внутрь в таблетках после еды 1—2 раза в день. Побочные эффекты и противопоказания такие же, как и у других холинолитических средств. Выпускают Тропацин в таблетках по 0,001; 0,003; 0,01 г. Список А. ЛЕВОДОПА (Levodopa) является предшественником медиаторов дофамина и норадреналина. Сам дофамин плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, а леводопа, проникая в ЦНС, подвергается биотрансформации и превращается в дофамин, пополняет его запасы в базальных ганглиях и стимулирует дофаминовые рецепторы, обеспечивая при паркинсонизме лечебный эффект.

Назначают препарат в таблетках или капсулах во время или после еды. С осторожностью его назначают при бронхиальной астме, эмфиземе, язве желудка и лицам, перенесшим инфаркт миокарда. В процессе лечения необходимо проводить анализы крови, проверять функции печени и почек. Выпускают леводопу в капсулах и таблетках по 0,25 и 0,5 г № 100. Список Б.

6. Анальгетические средства В этом подразделе рассматриваются фармакологические свойства лекарственных средств, оказывающих обезболивающее действие, особенности их

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к 99стр. из 164	
Лекционный комплекс		

влияния на организм, показания и противопоказания к применению, а также правила хранения и учета в соответствии с приказами и инструкциями Министерства здравоохранения и социального развития РФ.

Целевая установка

При изучении данного подраздела особое внимание следует обратить на следующее. 1. Классификация анальгетических средств. 2. Понятия «анальгетические средства», «наркотические анальгетики», «лекарственная зависимость», «ненаркотические анальгетики» и др. 3. Особенности действия наркотических анальгетиков на центральную нервную систему, сердечную деятельность, дыхание, деятельность органов пищеварения и др. 4. Особенности действия и применения ненаркотических анальгетиков, их влияние на функции желудочно-кишечного тракта и кроветворение. 5. Различия в характере обезболивающего действия между наркотическими и ненаркотическими анальгетиками. 6. Показания и противопоказания к применению анальгетических средств. 7. Правила выписывания и хранения наркотических средств. Вещества, блокирующие болевые импульсы и болевой центр головного мозга, вследствие чего ослабляется и подавляется болевая чувствительность, называют анальгетическими средствами, или анальгетиками. Часто их называют просто «обезболивающие средства». Симптом боли имеет рефлекторную природу, характерен для многих заболеваний и служит своеобразным физиологическим сигналом о патологических изменениях в том или ином отделе организма. Боли могут быть причиной бессонницы, неврозов, нарушений двигательной активности и т.д. По своему характеру боль может быть слабой, средней (терпимой) и сильной. Первые две хотя и с трудом, но все же определенное время переносятся организмом. Сильные боли, возникающие, например, при больших или множественных травмах, обширных ожогах, инфаркте миокарда, хирургических вмешательствах, нередко приводят к развитию болевого шока, сопровождающегося быстрым падением артериального давления, нарушением жизненно важных функций организма, способных привести к летальному исходу. Устранение боли часто предупреждает возможные тяжелые последствия, например травматический шок, снимает чувство страха, улучшает эмоциональное состояние пациента, способствует появлению «симптома надежды» на выздоровление. Болевые ощущения можно устранить с помощью средств для наркоза, но их обезболивающее действие существенно отличается от действия анальгетических средств. Средства для наркоза устраняют боль одновременно с выключением сознания и всех видов чувствительности, тогда как анальгетические средства в терапевтических дозах не устраняют сознание и не угнетают другие (кроме болевых) виды чувствительности. Отсюда нетрудно сделать вывод, что анальгетики как болеутоляющие средства обладают большей избирательной способностью, чем средства для наркоза. По характеру обезболивающего действия и способности влияния на функции организма анальгетические средства делят на две большие группы: наркотические и ненаркотические анальгетики.

6.1. Наркотические анальгетики Наркотическими анальгетиками называют вещества, оказывающие сильное обезболивающее действие при болях любого происхождения, но вызывающие при повторном применении лекарственную зависимость. К ним относят алкалоиды опия, его препараты и их синтетические заменители. Огий — это высохший млечный сок головок мака. Он содержит в своем составе большое количество веществ, которые по химической структуре являются производными либо фенантрена, либо изохинолина. Первые, например морфин, обладают выраженным обезболивающим действием, вторые, представителем которых является папаверин, анальгетическим

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	100стр. из 164	

действием не обладают, но они вызывают миотроп- ный спазмолитический эффект, т.е. расслабляют гладкие мышцы внутренних органов и кровеносных сосудов.

МОРФИНА ГИДРОХЛОРИД (*Morphini hydrochloridum*) получен в чистом виде в 1806 г. немецким ученым, фармацевтом Сертюрнером и назван так в честь мифического древнегреческого бога сна Морфея. На центральную нервную систему морфин оказывает сложное и многоплановое действие. Он угнетает болевые центры, кашлевой, дыхательный центры и в то же время возбуждает (!) центры блуждающего нерва (брадикардия) и глазодвигательного нерва (миоз). Морфин угнетает рвотный центр, но у ряда лиц, наоборот, вызывает рвоту за счет раздражения рецепторов пусковых (триггерных) зон продолговатого мозга. Во время боли в организме резко повышается активность ретикулярной формации, что приводит к возбуждению центров головного мозга, и в качестве ответной реакции на это возбуждение у человека изменяется общее состояние, характер движения, ритм работы и т.д. Морфин, угнетая проведение болевых импульсов на уровне спинного мозга и ретикулярной формации, ограничивает их поступление в кору головного мозга и болевые центры. В настоящее время обезболивающий эффект морфина объясняют его способностью взаимодействовать с особыми рецепторами, которые называют опиатными. Они находятся в области головного мозга и задних рогов спинного мозга. Полагают, что с ними взаимодействуют специальные вещества, образующиеся в организме, энкефалины и эндорфины, которые устраняют боль в естественных условиях. Эндорфины повышают эмоциональное настроение в лучшую сторону и ослабляют болевые симптомы. Длительное применение морфина угнетает их продукцию и способствует развитию лекарственной зависимости.

ВНИМАНИЕ! Лекарственная зависимость — это болезненное, труднопреодолимое влечение организма к повторному применению препарата с целью создания для организма состояния эйфории. Лекарственная зависимость развивается при повторном применении наркотических анальгетиков, спирта этилового, никотина, кокаина и других подобных лекарственных средств.

Особенность действия морфина еще в том, что он, подавляя боль, не вызывает угнетения других видов чувствительности и потери сознания, но устраняет чувство страха, тревоги, голода, улучшает эмоциональное состояние, что также способствует развитию анальгетического эффекта.

После применения морфина развивается особое состояние — эйфория, которая характеризуется быстрым чередованием мыслей, галлюцинациями, рассеиванием внимания, появлением чувства легкости, беззаботности, изменяется критическое отношение к окружающему, создается впечатление покоя и безразличия. Постепенно, по мере углубления действия морфина наступает сон. Морфин оказывает выраженное угнетающее действие на дыхательный центр. При этом снижается его чувствительность к физиологическому раздражителю — углекислому газу, что приводит сначала к урежению и углублению дыхания, а затем оно становится поверхностным и объем вдыхаемого воздуха резко снижается. В этом случае возможно развитие гипоксии, а в тяжелых случаях отравления морфином может наступить остановка дыхания. Морфин повышает тонус сфинктеров желудочно-кишечного тракта, замедляет перистальтику кишечника, снижает секрецию пищеварительных желез, что задерживает продвижение пищевых масс, и возникает запор. Кроме того, он повышает тонус мускулатуры матки, бронхов, желче- и мочевыводящих путей. Все эти явления объясняются возбуждением блуждающего нерва под влиянием морфина. Подобное действие морфина на организм следует рассматривать как отрицательное, которое может быть устранено с помощью М-холино- блокирующих

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казakhstanская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	101стр. из 164	

средств, например атропина сульфата. Морфин также угнетает кашлевой центр, оказывая, таким образом, противокашлевой эффект. Применяют морфина гидрохлорид в порошках, таблетках по 0,01 г и в виде 1 % раствора в ампулах по 1 мл. Действие морфина на организм развивается быстро: через 20—30 минут после приема внутрь и через 10—15 минут после подкожного введения и продолжается до 5 часов. Назначают морфина гидрохлорид при сильных болях, например, возникающих при травмах, ожогах, инфаркте миокарда, злокачественных опухолях, в послеоперационный период и т.д. Не рекомендуют использовать препарат детям до 5 лет, кормящим матерям, потому что, выделяясь с молоком и попадая в организм ребенка, он может вызвать у него тяжелое отравление. По этой же причине не советуют применять морфин для обезболивания родов, так как он легко проникает через плаценту и вызывает угнетение дыхания у плода. Следует помнить, что морфина гидрохлорид в любой лекарственной форме хранится в сейфе, а применение его строго регламентируется и он должен назначаться только по соответствующим показаниям, потому что при повторных применениях к нему сравнительно быстро развивается лекарственная зависимость. Высшая разовая доза морфина гидрохлорида при приеме внутрь и под кожу равна 0,02, а суточная — 0,05. Препарат относится к списку А. При передозировке морфина развивается острое отравление, характеризующееся стойким сужением зрачков (миоз), спутанностью сознания, резким и поверхностным дыханием, часто переходящим в прерывистое дыхание по типу Чейн — Стокса, замедлением сердечного ритма, пульса и падением артериального давления. В последующем возможна потеря сознания, коматозное состояние и смерть от паралича дыхательного центра. Помощь при отравлении морфином, как и в любом случае отравления, должна быть комплексной. Она включает в себя промывание желудка, назначение слабительных, средств, стимулирующих сердечную деятельность и дыхание, а главное — введение специальных противоядий. Специфическими противоядиями при отравлении морфином являются налорфина гидрохлорид и налоксона гидрохлорид. Первый вводят в вену по 1—2 мл в виде 0,5% раствора, второй в мышцу, под кожу или в вену по 1 мл с содержанием препарата по 0,4 г в каждой ампуле. Кроме того, независимо от пути введения морфина при остром отравлении обязательно проводят многократное промывание желудка 0,02—1 % растворами калия перманганата, учитывая то обстоятельство, что морфин в организме способен не раз выделяться в желудочно-кишечный тракт и всасываться обратно. В этом случае морфин окисляется и переходит в неядовитое соединение диоксиморфин. Если нет перманганата калия, промывание желудка проводят взвесью угля активированного. Назначают в качестве слабительного магния сульфат, который к тому же препятствует обратному всасыванию морфина, а во избежание разрыва мочевого пузыря рекомендуют вызывать мочеиспускание с помощью катетера. С целью возбуждения дыхания под кожу вводят раствор кофеина бензоата натрия 20% или делают искусственное дыхание. Для снижения концентрации морфина в крови в вену вводят 0,9% изотонический раствор натрия хлорида, 5% раствор глюкозы или плазмозамещающие растворы, а также назначают быстродействующие мочегонные средства, например фуросемид. В тяжелых случаях отравления используют наиболее эффективный способ удаления яда из организма — гемодиализ, который осуществляется с помощью аппарата «искусственная почка», а также перитонеальный диализ.

Хроническое отравление морфином и другими наркотическими анальгетиками встречается у лиц, у которых развилась лекарственная зависимость. Этому способствует состояние, с одной стороны, эйфории, а с другой — абстиненции, сопровождающейся тяжелыми психическими переживаниями и резкими изменениями в работе отдельных органов и всего

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	102стр. из 164	

организма. Так, в стадии абстиненции появляется дрожание конечностей, наблюдается бледность кожи, резкое падение артериального давления, возникают нарушения со стороны сердечной деятельности и дыхания, усиливаются боли и другие неприятные ощущения, появляются судороги и страх за свою жизнь. Стремясь выйти из этого неприятного состояния, человек повторно принимает препарат, при этом вновь развивается стадия абстиненции. Так замыкается «порочный круг», в который чаще всего попадает молодежь, лица с неуравновешенной или еще несформировавшейся психикой, после чего они становятся наркоманами. У таких людей наблюдается деградация личности, ослабление памяти, снижение интеллекта, настроения, потеря аппетита, истощение, чувство тоски, страха, все их действия и желания сводятся к решению проблемы любыми способами достать наркотик. Нередко это становится причиной преступлений. Лечение лиц, страдающих хроническим применением наркотических средств, проводится в специальных лечебных учреждениях, где используют различные методы комплексной терапии. Омнопон (Отпоропит) — новогаленовый препарат опия, состоящий из смеси его алколоидов и максимально очищенный от балластных веществ. Ведущим алколоидом опия является морфин, которого в препарате содержится около 50%. По силе обезболивающего действия омнопон уступает морфину, но лучше переносится больными и не вызывает спазмов глазной мускулатуры, так как содержит в своем составе папаверин и наркотин. Омнопон более эффективен, чем морфин, во время оказания помощи при почечной или печеночной коликах. Назначают Омнопон в основном по тем же показаниям, что и морфин. Его принимают внутрь по 0,01—0,02 г на прием и вводят под кожу по 1 мл 1 и 2% растворов. Побочное действие, картина отравления, помощь при отравлении и противопоказания к применению такие же, что и у морфина. Выпускают омнопон в виде порошка и в ампулах по 1 мл 1 и 2% раствора. Список А.

ВНИМАНИЕ! Наркотические анальгетики, как и другие препараты списка А, хранят в сейфах, и они находятся на ежедневном количественном учете.

В настоящее время широко используются синтетические заменители морфина, которые по ряду показателей превосходят его и одновременно лишены некоторых его отрицательных свойств. К таким препаратам относятся Промедол, фентанил, валорон, пентазоцин и др. ПРОМЕДОЛ (Promedolum) по действию близок к морфину, но уступает ему по силе анальгетического эффекта. Он в значительно меньшей степени возбуждает центры блуждающего нерва, оказывает хорошее спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру внутренних органов (сравни с омнопонем!) и в то же время усиливает ритмические сокращения матки, оказывая родовспомогательное действие. Показания к применению Промедол а такие же, что и у морфина, но его часто используют для обезболивания родов, а также при кишечных, почечных и печеночных коликах. Широко используют Промедол в анестезиологии, где он является одним из основных компонентов премедикации. Назначают Промедол внутрь по 0,025—0,02 г или вводят под кожу по 1—2 мл 1 или 2% раствора. Выпускают Промедол в порошке и таблетках по 0,025 г и в ампулах по 1 мл 1 и 2% раствора. Сохраняют препарат по списку А.

ВНИМАНИЕ! Ответственными за хранение, выдачу и использование наркотических и ядовитых веществ в лечебно-профилактических учреждениях являются заведующие отделением (кабинетом) и старшая медицинская сестра.

ФЕНТАНИЛ (Phentanylum) во много раз превосходит морфин по анальгетическому эффекту, действует быстро, но непродолжительно — в пределах 20—40 минут. После введения в вену эффект фентанила развивается через 1—3 минуты. При необходимости поддержания анальгезии повторно через 15—30 минут вводят 0,005% раствор фентанила

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	103стр. из 164	

по 1—2 мл. Благодаря быстрому и ярко выраженному обезболивающему эффекту фентанил используют вместе с нейролептическим средством дроперидол для нейролептанальгезии. Последняя отличается от наркоза тем, что обезболивание осуществляется без исключения сознания. Применяемый вместе с фентанилом дроперидол (комбинированный препарат называется «Таламонал») усиливает анальгетический эффект и одновременно подавляет чувство страха, тревоги, беспокойства, т.е. снимает состояние нарколепсии. Используют фентанил в хирургической практике для купирования боли при инфаркте миокарда, тяжелых приступах стенокардии, травмах и профилактике шока. Отрицательным моментом действия фентанила считают его более сильное, чем у морфина, угнетающее действие на дыхательный центр. Он противопоказан для обезболивания родов, при бронхиальной астме, инфаркте легкого, пневмонии, гипертензии в малом кругу кровообращения. При повторном применении к нему может развиваться привыкание и лекарственная зависимость. Выпускают фентанил в ампулах по 2 и 10 мл 0,005% раствора. Препарат, как и все наркотические вещества, хранят в сейфе. Список А.

6.2. Ненаркотические анальгетики (нестероидные противовоспалительные средства) НПВС Ненаркотическими анальгетиками называют вещества, которые оказывают обезболивающее действие, но не вызывают при этом состояния эйфории, а при повторном применении — лекарственной зависимости. Анальгетический эффект ненаркотических анальгетиков значительно слабее, чем у наркотических, поэтому они практически оказывают действие и не применяются при сильных болях, отдающих в другие органы и отделы, при травматических и послеоперационных болях, а также при болях, возникающих при инфаркте миокарда и злокачественных опухолях. Обезболивающее действие ненаркотических анальгетиков проявляется при так называемых локализованных, или гностических (gnosis — знание), болях, т.е. тогда, когда мы точно знаем или ощущаем их конкретное место нахождения. К ним относятся головная, зубная, мышечная или суставная боли, которые, как правило, захватывают небольшой участок и слабо иррадируют (отдают) в другие органы или отделы организма. Эти боли относятся к числу слабых или средних, и хотя сами по себе неприятны, но шока не вызывают, а происхождение их чаще всего связано с развитием воспалительного процесса. Кроме обезболивающего действия в отличие от наркотических анальгетиков ненаркотические анальгетики оказывают еще жаропонижающее и противовоспалительное действие, они лишены снотворного эффекта, не угнетают дыхания и почти не вызывают привыкания.

ПОМНИТЕ! Основными фармакологическими эффектами ненаркотических анальгетиков является анальгетический жаропонижающий и противовоспалительный, но выражены они у каждого препарата в разной степени.

Боль — это рефлекторный акт, предупреждающий человека о патологических изменениях в том или ином отделе организма. В настоящее время причиной боли считают резкое повышение чувствительности периферических нервных окончаний в ответ на накопление в тканях организма биологически активных веществ — простагландинов (медиаторов воспаления). Они образуются в больших количествах во время травм, ожога, обморожения, переохлаждения организма, развития воспалительного процесса. Простагландины образуются в этих случаях из фосфолипидов клеточных мембран через метаболизм арахидоновой кислоты при непосредственном участии фермента простагландин-синтетазы, в результате повышается чувствительность болевых рецепторов, возникают импульсы, несущие в кору головного мозга сигнал боли. Механизм обезболивающего действия ненаркотических анальгетиков заключается в том, что они: 1) блокируют синтез (рис. 12) или инактивируют фермент простагландин-синтетазу и

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	104стр. из 164	

образование простагландинов, чем снижают чувствительность нервных окончаний к ним; 2) повышают в организме уровень эндогенных морфиноподобных компонентов, усиливающих обезболивающий эффект; 3) блокируют межнейронную передачу импульсов, которые возникают при болевом раздражении, в области гипоталамуса и нарушают проведение афферентных болевых импульсов к коре головного мозга. Как обезболивающие средства ненаркотические анальгетики назначают при головных, мышечных, суставных болях, а также при ревматизме, радикулите, подагре, невралгии, артрите, артрозе и других заболеваниях, сопровождающихся слабыми и средними болями.

Противовоспалительное действие ненаркотических анальгетиков объясняется их способностью блокировать синтез медиаторов воспаления и за счет этого ослаблять воспалительный процесс и сопутствующую боль. Кроме того, они снижают активность фермента гиалуронидазы и повышают синтез гиалуроновой кислоты, которая в свою очередь повышает тонус и плотность клеточных оболочек, препятствуя, таким образом, дальнейшему распространению воспалительного процесса. Особенно это важно при лечении ревматизма, радикулита, артрита и других заболеваний. По химической природе ненаркотические анальгетики делят на производные: 1) салициловой кислоты (кислота ацетилсалициловая); 2) индолуксусной кислоты (индометацин); 3) фенилуксусной кислоты (диклофенак натрия); 4) пропионовой кислоты (ибупрофен); 5) пиразонола (бутадион); 6) других органических кислот и иной химической структуры (до-нал ьгин, пироксикам, тародал и др.). К производным салициловой кислоты относятся кислота ацетилсалициловая, натрия салицилат, метилсалицилат и другие вещества. Наибольшее применение получила кислота ацетилсалициловая, которая широко известна еще под названием «Аспирин». **КИСЛОТА АЦЕТИЛСАЛИЦИЛОВАЯ (Acidum acetylsalicylicum)** оказывает выраженное обезболивающее, жаропонижающее и противовоспалительное действие. Установлено, что салицилаты, в том числе и кислота ацетилсалициловая, блокируют фермент простагландин-синтетазу, снижая, таким образом, синтез воспалительных простагландинов.

Противовоспалительное действие кислоты ацетилсалициловой широко используется при лечении ревматизма, заболеваний опорнодвигательного аппарата (артриты, артрозы, миозиты), невритов, радикулита и т.д. Как жаропонижающее средство, увеличивающее процессы теплоотдачи и потоотделения, ее часто назначают самостоятельно или в комплексе с антибиотиками и сульфаниламидными препаратами при пневмонии, бронхите, плеврите, острых респираторных заболеваниях (ОРЗ) и как обезболивающее средство — при головных, зубных, мышечных, суставных и других болях. Назначают кислоту ацетилсалициловую как жаропонижающее и анальгетическое средство взрослым по 0,5—1,0 на прием. Как противоревматическое и противовоспалительное средство, например, при ревматоидном полиартрите, инфекционно-аллергическом миокардите, препарат назначают взрослым до 3,0—5,0 г в сутки при условии, что у больного нет высокой температуры. Кислота ацетилсалициловая обладает сильным раздражающим действием, поэтому во избежание побочных эффектов необходима правильная тактика (!) применения препарата. Лучше всего кислоту ацетилсалициловую применять в виде порошка (таблетки измельчать), после еды, запивая большим количеством воды или щелочной воды (нарзан, боржоми, содовая вода) или молоком (обволакивающий эффект). Побочное действие кислоты ацетилсалициловой проявляется в раздражении и повреждении слизистой оболочки желудка, где она тормозит продукцию слизи, в норме защищающей стенку желудка от разрушения (самопереваривания). Это может вызывать чувство боли, тошноты, жжения, тяжести в поджелудочной области и образование язвы желудка (ульцерогенное

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	105стр. из 164	

действие, от лат. *ulcus* — язва). Ее способность снижать синтез тромбосана и протромбина крови вместе с раздражающим действием может привести к возникновению желудочных, маточных и других кровотечений, поэтому кислоту ацетилсалициловую не рекомендуют применять перед родами и операциями. Иногда она вызывает нарушение слуха и аллергические реакции, легко устранимые антигистаминными препаратами (супрастин) или раствором кальция хлорида. Кислота ацетилсалициловая является составной частью ряда комбинированных препаратов, например Цитрамон, Седальгин, Кверса-лин и др. Они, как правило, назначаются в тех случаях, что и кислота ацетилсалициловая, но переносятся лучше и значительно реже вызывают побочные явления. Выпускают кислоту ацетилсалициловую в порошках, таблетках по 0,25 и 0,5 г. Сохраняют препарат в защищенном от света месте. Новые препараты аспирина, не действующие на слизистую желудка, — Тромбо АСС, Аспирин УПСА и др. БУТАДИОН (*Butadionum*) — производное пиразолона. Оказывает анальгезирующее и жаропонижающее действие, но по противовоспалительной активности превосходит производные салициловой кислоты. Применяют для лечения острого ревматизма и всех видов ревматоидного полиартрита, болезни Бехтерева, тромбоза, тромбоза вен, суставных и мышечных болей воспалительной патологии. Назначают Бутадион внутрь во время или после еды по 0,1—0,15 г, а детям — по 0,01—0,1 г в зависимости от возраста 3—4 раза в день. В качестве побочных эффектов иногда возможны боли в животе, тошнота, аллергические реакции, угнетение кроветворения, поэтому необходимо хотя бы раз в неделю делать анализ крови. Выпускают Бутадион в таблетках по 0,15 г и в виде 5% мази, используемой для лечения поверхностных тромбозов нижних конечностей, миозитов, артритов и воспалений геморроидальных узлов. ПАРАЦЕТАМОЛ (*Paracetamolium*) снижает синтез простагландинов и возбудимость центра терморегуляции, нерастворим в воде. Применяют в тех же случаях, что производные салициловой кислоты и пиразолона, но значительно слабее. Положительным у Парацетамола считается то, что он по сравнению с кислотой ацетилсалициловой не раздражает слизистую желудка, но отрицательно влияет на печень (!). Выпускается в таблетках по 0,2 и 0,5 г и в ректальных суппозиториях по 0,005 ; 0,1; 0,25 и 0,5 г, а также в виде 5% мази. Входит в состав таблеток Панадол, Эффералган и детского препарата «Калпол». МЕТАМИЗОЛ НАТРИЯ (*Metamizolum natrium*), синоним: анальгин, — производное метансульфоновой кислоты. Почти в равной степени оказывает анальгетическое, жаропонижающее и противовоспалительное действие. Он угнетает активность медиаторов воспаления и свободных радикалов. Применяют метамизол натрия при головных, зубных, менструальных болях, небольших травмах, ожогах, лихорадочных состояниях, укусах насекомых и т.д. Входит в состав препаратов Темпалгин, Те- тральгин и др.

Противопоказан при угнетении кроветворения, тяжелых нарушениях функций печени и почек, беременности и в период кормления ребенка. Выпускают препарат часто под названием «Анальгин» с припиской внизу «Метамизол натрия» в таблетках по 0,25 и 0,5 г, а также в виде 25 и 50% раствора в ампулах по 1 и 2 мл. В настоящее время широкое применение получили ненаркотические анальгетики — производные других органических кислот и иной химической структуры: индометацин, диклофенак натрия, ибупрофен, напроксен и др. Это связано с тем, что у них наиболее ярко выражено противовоспалительное действие, хотя по жаропонижающему и обезболивающему эффекту они превосходят кислоту ацетилсалициловую, бутадион и другие ненаркотические анальгетики (табл. 15). ИНДОМЕТАЦИН (*Indometacinum*) — производное индолуксусной

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казakhstanская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	106стр. из 164	

кислоты, блокирует синтез простагландинов и миграцию лейкоцитов в области воспаления, оказывает активное противовоспалительное и хорошее жаропонижающее и обезболивающее действие. Его противовоспалительный эффект в 2—3 раза выше, чем у кислоты ацетилсалициловой и производных пиразолона. Используют индометацин при ревматизме, особенно в стадии обострения, при подагрических приступах, ревмокардите, неспецифических и инфекционных полиартритах, бурситах, болезни Бехтерева ит.д. При применении индометацина возможны побочные эффекты в виде головной боли, головокружения, сонливости, обострения язвенной болезни, гастрита, развития внутренних кровотечений. Индометацин противопоказан при язвенной болезни, нарушении кроветворения, при беременности и кормлении ребенка грудью. Выпускают препарат в капсулах по 0,025 г в упаковке по 30 штук, ректальных суппозиториях по 0,05 и 0,1 г и в виде 10% мази в тубах по 40 г. ДИКЛОФЕНАК НАТРИЯ (Ортофен, Вольтарен) (Diclofenac sodium) по силе противовоспалительного действия превосходит кислоту ацетилсалициловую и производные пиразолона, оказывает выраженное жаропонижающее и анальгезирующее действие, снижает агрегацию тромбоцитов. По эффективности лечения ревматизма и болезни Бехтерева не уступает индометацину. Используется для лечения ревматоидного артрита, артрозов и подагры. Противопоказан при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, циррозе печени и в первые три месяца беременности.

Выпускают диклофенак натрия в таблетках по 0,025 г и в ампулах по 3 мл с содержанием активного вещества 0,025 г в 1 мл. ИБУПРОФЕН (Ibuprofenum) по противовоспалительной активности уступает индометацину, но одновременно оказывает сильное жаропонижающее и обезболивающее действие. Побочные эффекты те же, что и у других ненаркотических анальгетиков. Показан при ревматоидном артрите, остеопорозе, артрозе и подагре, назначают по 0,2 г 3—4 раза в день после еды. Аналогами ибупрофена являются Кетопрофен, Фенопрофен, Напроксен, Нурофен, МИГ идр. Выпускают препарат в таблетках по 0,2 г в упаковке по 100 штук. Список Б.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Что означают термины «ингаляционный наркоз» и «неингаляционный наркоз»?
2. В чем заключается механизм действия средств для наркоза?
3. В каком порядке угнетают центральную нервную систему средства для наркоза?
4. Почему недопустимо полное угнетение продолговатого мозга?
5. Какие препараты используют для ингаляционного наркоза?
6. Какие осложнения может вызвать эфир во время наркоза?
7. Что такое «премедикация» и с какой целью она применяется?

1. Тема. Психотропные средства. Аналептики.

2. Цель. При изучении данного раздела особое внимание следует обратить на следующее.

1. Классификация психотропных средств.
2. Различия в понятиях «антипсихотические средства», «транквилизаторы», «седативные средства», «ноотропные средства», «антидепрессанты» и другие средства.
3. Различия в действии антипсихотических, транквилизирующих и седативных средств на организм человека.
4. Показания и противопоказания к применению препаратов.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	107стр. из 164	

5. Возможность использования психотропных средств в различных областях медицины.

3. Тезисы лекции.

Психотропными называют вещества, способные направленно изменять психическое и эмоциональное состояние человека, которое может проявляться в виде невроза, психоза, но всегда стремится (по желанию человека) к норме. Невроз — это функциональное заболевание нервной системы, возникающее в результате острого или хронического перенапряжения нервной системы. Он чаще всего протекает в виде неврастении, истерии, психостении, для которых характерны повышенная раздражительность, громкий голос, повышение двигательной активности, реже — плаксивость, истерические припадки, сопровождающиеся головными болями, повышением или снижением артериального давления, расстройством сна, аппетита и т.д. При неврозах нередко изменяются функции вегетативной нервной системы (вегетоневроз), которые приводят к развитию тахикардии, потере аппетита, болям в животе и в области сердца. Для неврозов характерно то, что человек во время приступов в большинстве случаев сохраняет в определенной мере контроль за своими действиями и даже способен критически оценивать свои поступки. Психоз — это более тяжелая форма расстройства психики. Он чаще развивается после инфекционных заболеваний, связанных с поражением мозга, черепно-мозговыми травмами, нарушениями в эндокринной системе человека, при его отравлениях, атеросклерозе (старческий психоз), злоупотреблении алкоголем (алкогольный психоз) и др. Для психозов характерно расстройство памяти, нарушение логического мышления и умозаключения, появление бреда, зрительных и слуховых галлюцинаций, изменение эмоциональной и двигательной активности, неправильное восприятие окружающего мира. При психозах нарушается контроль за своими действиями, критическая оценка совершаемых поступков, которые часто бывают лишены какого-либо смысла. Неврозы и психозы могут возникать как на фоне резкого возбуждения, так и на фоне глубокого угнетения психики. Каждое психическое заболевание характеризуется целым набором симптомов, которые вместе составляют определенный синдром. Так, например, маниакальный синдром протекает на фоне маниакального возбуждения, при котором у больного отмечается хорошее настроение, повышенная, а порой навязчивая двигательная и речевая активность, появляется чувство безысходности, самообвинения, тоски и даже стремление покончить собой. Все это происходит в результате нарушения биохимических процессов в области мозга, поэтому механизм действия лекарственных средств направлен прежде всего на регуляцию химических процессов в тканях мозга, восстановление и сохранение баланса биологически активных веществ в нем, таких как ацетилхолин, норадреналин, дофамин, серотонин, ГАМК и др. Кроме того, психотропные средства тормозят активность ретикулярной формации, через которую патологические импульсы поступают в мозг. Они замедляют межнейронную передачу импульсов и влияют на лимбическую систему мозга, ответственную за эмоциональное состояние организма.

В связи с различным влиянием психотропных средств на центральную нервную систему их можно разделить на две большие группы:

- 1) психотропные средства угнетающего ЦНС типа действия;
- 2) психотропные средства возбуждающего ЦНС типа действия.

В составе этих групп различают еще самостоятельные группы лекарственных средств, отличающихся друг от друга химической структурой, особенностями действия и применения (табл. 1).

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	108стр. из 164	

Классификация психотропных средств

Угнетающего ЦНС типа действия	Возбуждающего ЦНС типа действия
Антипсихотические средства (нейролептики)	Антидепрессанты
Анксиолитические средства (транквилизаторы)	Психостимуляторы
Седативные средства (успокаивающие средства)	Нормотимические средства
	Ноотропные средства

7.1. Антипсихотические (нейролептические) средства Антипсихотическими называют вещества, способные оказывать своеобразное сильное угнетающее действие на центральную нервную систему, в результате чего снижается психомоторное возбуждение, двигательная активность и реакция организма на внешние раздражители. От других психотропных средств отличаются наличием у них антипсихотического действия, благодаря которому они устраняют бред, галлюцинацию, агрессивность и другие психопатологические синдромы. Именно поэтому эту группу лекарственных средств используют чаще всего для лечения психозов. Механизм действия антипсихотических средств связан с блокадой ферментов, участвующих в синтезе нейромедиаторов, возбуждающих центральную нервную систему, например дофамина, норадреналина, а также простагландинов. Одновременно они повышают активность тормозящей парасимпатической нервной системы и способствуют накоплению ГАМК. В результате этого подавляется активное влияние ретикулярной формации на кору головного мозга с последующим снижением функций двигательных центров спинного мозга и расслаблением скелетной мускулатуры. Антипсихотические средства оказывают также анксиолитическое (транквилизирующее), седативное (успокаивающее), противорвотное и адреноблолирующее действие. Благодаря последнему антипсихотические средства используют в комплексной терапии гипертонической болезни.

К антипсихотическим относятся лекарственные средства различной химической природы, среди которых — производные фенотиази- на (левомепразин, этаперазин), тиоксантена (хлорпротиксен), бутиро- фенона (галоперидол, дроперидол), индола (карбидин), замещенные бензамиды (сульпирид) и др. Первыми антипсихотическими средствами были производные фенотиазина, которые долгое время как основной представлял препарат аминазин, но значительные побочные эффекты ограничивали его применение. В настоящее время используют аналоги аминазина, отличающиеся более сильным и быстрым действием и меньшим числом побочных эффектов. ЛЕВОМЕПРАЗИН (Levomoprazinum) по химической структуре близок к аминазину, но превосходит его по анальгетическому и гипотермическому действию. Он уменьшает двигательную активность, обладает противорвотным действием, снижает артериальное давление, увеличивает время действия снотворных, наркотических и анестезирующих средств. Отличается от аминазина большей активностью и быстротой седативного эффекта, что позволяет использовать его при алкогольных психозах. Применяют левомепразин при психомоторных возбуждениях

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	109стр. из 164	

различной этиологии, особенно протекающей с явлениями тревоги, страха и двигательного беспокойства. Лечение начинают с внутримышечного введения 1—3 мл 2,5% раствора, и по мере развития антипсихотического и седативного эффектов дозу препарата снижают, а через некоторое время больных переводят на прием левомепразина в таблетках по 0,025—0,1 г 3—4 раза в день. В конце курса лечения больному назначают поддерживающую терапию. Левомепразин противопоказан при гипотонии, поражениях печени и почек, кроветворной системы и декомпенсированном пороке сердца. Выпускают препарат в таблетках и драже по 0,025 г № 50 и в виде 2,5% раствора в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 штук. Список Б. ЭТАПЕРАЗИН (Aethaperazinum) — активное психотропное средство, превосходящее аминазин по антипсихотическому и противорвотному действию. Он снижает артериальное давление, оказывает мышечно расслабляющее действие и устраняет икоту. Применяют Этаперазин при шизофрении, интоксикационных психозах, неврозах, сопровождающихся чувством страха и напряжения. Как противорвотное средство его используют в хирургической, терапевтической, акушерской и онкологической практике. Назначают Этаперазин внутрь в таблетках после еды, начиная с малых доз 0,004—0,01 г, а в дальнейшем их увеличивают, подбирая каждому больному индивидуальную дозу. Лечение Этаперaziном можно проводить в комбинации с другими психотропными средствами. Противопоказания к применению Этаперазина такие же, как и у левомепразина. Выпускают Этаперазин в таблетках по 0,004; 0,006 и 0,01 г, покрытых оболочкой, в упаковке по 50 и 100 штук. Список Б. Подобным действием обладают производные фенотиазина тиопро- перазин, тиоридазин, флуфеназин и др. ГАЛОПЕРИДОЛ (Haloperidolum) относится к группе бутирофе- нонов, обладает ярко выраженным антипсихотическим, анксиолитическим (транквилизирующим) и противорвотным действием. Он не вызывает апатии, чувства вялости и безразличия, устраняет бред и галлюцинации, усиливает действие снотворных, наркотических и анальгетических средств. Назначают галоперидол при шизофренических психозах, маниакальных и бредовых состояниях, алкогольных психозах и психомоторном возбуждении. Применяют препарат внутрь после еды в таблетках по 0,0015— 0,005 г, или его 0,5% раствор вводят внутримышечно. Методика использования галоперидола во многом сходна с аналогичными методиками большинства антипсихотических средств. При применении галоперидола возможны осложнения в виде бессонницы, падения артериального давления, токсикодермии, а при приеме внутрь натошак возникают тошнота и рвота. Галоперидол противопоказан при истерии, тяжелых поражениях печени, почек и гипотонии, его осторожно применяют при сердечнососудистых заболеваниях с явлениями декомпенсации. Выпускают галоперидол в таблетках по 0,0015 и 0,005 г и в ампулах по 1 мл 0,5% раствора. Список Б. ДРОПЕРИДОЛ (Droperidolum) — аналог галоперидола, обладает сильным антипсихотическим, противорвотным и противосудорожным действием. Применяют дроперидол в психиатрической практике при психомоторных возбуждениях, сопровождающихся бредом и галлюцинациями. Широкое применение препарат нашел в анестезиологии, где вместе с фентанилом он используется для нейролептанальгезии. Они вместе вызывают быстрый антипсихотический и анальгезирующий эффект, предупреждают шок и оказывают противорвотное действие. Вводят дроперидол под кожу, в мышцу и в вену. Для премедикации и нейролептанальгезии его вводят внутримышечно за 30—45 минут до операции по 1—2 мл 0,25% раствора вместе с 1—2 мл 0,005% раствора фентанила (комбинированный препарат называется «Галамонал»). Одновременно с ними вводят 0,5 мл 0,1 % раствора атропина, а для расслабления мышц применяют мышечные релаксанты. Выпускают дроперидол в виде 0,25% раствора в ампулах по 5 и 10 мл. Список

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	110стр. из 164	

Б. ХЛОПРОТИКСЕН (Chlorprothixenum) относится к производным тиоксанта, обладает антипсихотическим, седативным и противорвотным действием. Препарат применяют при психозах и психоневротических состояниях, сопровождающихся беспокойством, страхом, агрессивностью, психомоторным возбуждением, для лечения некоторых форм шизофрении и острых алкогольных психозов. Назначают хлорпротиксен внутрь до еды, начиная с малых доз 0,025—0,05 г 3—4 раза в день с последующим их увеличением до 0,2—0,4 г в сутки. При остром психическом возбуждении препарат вводят в мышцу по 1—2 мл 2,5% раствора. Он хорошо переносится больными, но иногда вызывает падение артериального давления, тахикардию, сухость во рту и т.д. Его не рекомендуют применять, как и многие антипсихотические средства, во время работы водителям транспорта и лицам, деятельность которых требует большого внимания, быстрой смены психической и физической реакции. Хлорпротиксен противопоказан при склонности к коллапсу, эпилепсии, паркинсонизму, при поражениях печени и нарушении кроветворения. Выпускают препарат в таблетках или драже по 0,015 и 0,05 г в виде 2,5% раствора в ампулах по 1 мл.

7.2. Транквилизаторы (анксиолитические средства) В отличие от препаратов предыдущей группы транквилизаторы не обладают антипсихотическим действием, но оказывают сильное анксиолитическое или антифобическое действие, с чем связано их применение при неврозах, сопровождающихся чувством страха, напряжения, тревоги, волнения и беспокойства. Они ослабляют ответные реакции организма на внешние раздражители, снижают двигательную, эмоциональную и мыслительную активность, углубляют сон, усиливают действие алкоголя и наркотических препаратов. В основе механизма действия транквилизаторов лежит их влияние на те зоны, где происходит формирование эмоций и снижение возбудимости подкорковой области мозга (таламус, гипоталамус, лимбическая система). Неврозы сопутствуют многим заболеваниям, поэтому диапазон применения транквилизаторов довольно широк. Их назначают при неврозах сердечно-сосудистой системы (гипертензия), заболеваниях желудочно-кишечного тракта (язвенная болезнь), травмах, кожных поражениях (экзема), подготовке больных к операциям, после них и т.д. Транквилизаторы в большинстве случаев выполняют вспомогательную роль и являются симптоматическими средствами, не влияющими на причину заболевания, а лишь создающими благоприятные условия для быстреего выздоровления. Назначение транквилизаторов должен делать врач, так как бесконтрольное и необоснованное употребление их часто приводит к нежелательным последствиям. У больных в таких случаях нередко развивается мышечная слабость, ночное недержание мочи, запоры, аллергические реакции, возможны нарушения функций печени и почек, а при резкой отмене препаратов даже судороги. При длительном применении они могут вызвать привыкание, лекарственную зависимость, «синдром отмены» и вернуть заболевание к начальной форме. Противопоказаниями к применению транквилизаторов служат заболевания печени и почек. Их не рекомендуют применять во время работы лицам, деятельность которых связана с быстрой сменной реакцией, так как ее замедление может привести к аварии и браку в работе. Они несовместимы с алкоголем, потому что усиливают угнетающее действие последнего на дыхательный центр, вследствие чего возможен летальный исход. К транквилизаторам относятся препараты различных химических групп, и среди них — производные бензодиазепа (хлорзепид, феназепам, сибазон), дифенилметана (амезил, гидроксизин) и представители других соединений (оксидин, мебикар). ФЕНАЗЕПАМ (Phenazepamum) — один из сильнейших транквилизаторов группы бензодиазепа. Он оказывает антифобическое (phobia — навязчивый, болезненный страх), противосудорожное, снотворное действие, вызывает расслабление

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	111стр. из 164	

скелетной мускулатуры, усиливает действие наркотических и анальгетических средств. Его действие объясняют влиянием на ряд отделов центральной нервной системы, отвечающих за эмоциональное состояние организма, и повышением активности ГАМК — основного угнетающего фактора нервной системы. Применяют Феназепам при неврозах, сопровождающихся чувством страха, тревоги, эмоциональной неуравновешенности, реже — при эпилепсии и в качестве снотворного средства. Иногда его применяют в хирургии для премедикации перед операцией. Выпускают Феназепам в таблетках по 0,0005 и 0,001 г. Список Б. СИБАЗОН (Sibazonum) вызывает эффекты, подобные феназе-паму, но уступает ему по активности. Он оказывает спазмолитическое действие, что позволяет использовать Сибазон для устранения колик. Сибазон показан при неврозах, сопровождающихся чувством страха, тревоги, бессонницей, повышенным тонусом скелетных мышц. Хороший эффект наблюдается при его применении у больных, склонных к эпилептическому статусу. Назначают Сибазон внутрь в таблетках по 0,005—0,01 г или вводят в вену по 1—2 мл 0,5% раствора с 20 мл 40% раствора глюкозы. Выпускают Сибазон в таблетках по 0,005 г и в ампулах по 2 мл 0,5% раствора. Список Б. ХЛОЗЕПИД (Chlozepidum), синоним: Элениум, по действию близок к Сибазону, устраняет навязчивый страх, неприятные мысли, воспоминания, поэтому применяют при неврозах, сопровождающихся внутренней напряженностью, чувством тревоги, повышенной раздражительностью и бессонницей. Его применяют в комплексном лечении алкогольной и наркотической абстиненции, эпилепсии и гипертензии. Назначают препарат в таблетках или драже 1—3 раза в день в зависимости от характера заболевания. При длительном применении препарата его отмена должна проводиться постепенно во избежание возможных осложнений. Выпускают Хлозепид в таблетках по 0,01 и 0,05 г. Список Б. МЕБИКАР (Mebicarit) оказывает умеренное транквилизирующее действие, снижает возбудимость центральной нервной системы, усиливает действие снотворных, наркотических и анальгезирующих средств. На расслабление скелетных мышц действия не оказывает.

Применяют Мебикар при неврозах и неврозоподобных состояниях с элементами раздражительности, эмоциональной возбудимости и некоторых видах тахикардии. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,3—0,5 г 2—3 раза в день. Курс лечения Мебикаром составляет 2—3 месяца. При применении препарата возможны осложнения в виде снижения артериального давления, аллергических реакций (кожный зуд) и др. Выпускают Мебикар в таблетках по 0,3 и 0,5 г. Список Б.

Примеры рецептов Rp.: Phenazepamі 0,0005 D.t.d. № 20 in tabul S. По 1 таблетке на ночь.

Rp.: Sol. Sibazoni 0,5% — 2 ml D.t.d. № 10 in ampull S. В мышцу по 2 мл в день.

7.3. Седативные (успокаивающие) средства Седативные (sedatio — успокоение) — это средства, которые способны усиливать процессы торможения и ослаблять активные функции центральной нервной системы. Они не обладают транквилизирующим действием и менее избирательно влияют на эмоциональную сферу человека. Препараты этой группы используют для лечения неврозов, повышенной возбудимости, раздражительности и для усиления действия снотворных и анальгетических средств. Они способны сделать сон более глубоким и продолжительным. К седативным средствам относятся препараты брома, валерианы и ее аналогов: пустырника, хмеля, пиона и боярышника. Препараты брома Препараты брома представляют собой соли бромистоводородной кислоты. В медицинской практике в настоящее время используют натрия бромид, калия бромид, комбинированный препарат Адонис-бром и др. Работами И.П. Павлова было доказано, что препараты брома, накапливаясь (!) в организме, ускоряют процессы торможения в коре головного мозга. Они восстанавливают баланс между процессами торможения и возбуждения.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	112стр. из 164	

Препараты брома применяют для лечения неврастении, истерии и других заболеваний, характеризующихся ослаблением процессов торможения и повышенной возбудимостью. Дозы препаратов брома зависят от типа нервной деятельности человека. Лицам со слабым типом нервной деятельности назначают препараты брома в меньших дозах, а с сильным — в больших. Действие препаратов брома развивается медленно, иногда через несколько дней после их применения. Выводятся они из организма также медленно в основном через почки, потовые железы и слизистые. При длительном применении препараты брома кумулируют и могут вызвать отравление (бромизм), которое проявляется в виде сонливости, притупления памяти, зуда и сыпи на коже, воспаления конъюнктивы, кашля, насморка из-за раздражающего действия бромидов. В подобных случаях больным назначают соленую диету, ежедневные гигиенические ванны и обильное питье. Методика лечения бромизма основана на законе седьмой группы таблицы Д.И. Менделеева: элемент, стоящий выше в группе, способен вытеснять из соединений элемент, расположенный ниже. Элемент хлор в таблице стоит выше брома и поэтому легко вытесняет его из организма. **НАТРИЯ БРОМИД** (*Natrii bromidum*) взрослым назначают по 0,1 — 1,0 г до 4 раз в день в виде 1—3% растворов. Нередко его включают в состав успокаивающих микстур вместе с препаратами валерианы, пустырника, адониса и другими, обладающими седативным действием. Подобным образом действует и применяют **КАЛИЙ БРОМИД**, хотя он чаще назначается лицам, страдающим сердечно-сосудистыми заболеваниями. Препараты валерианы Они оказывают седативное и спазмолитическое действие. В отличие от бромидов действуют сразу после всасывания. Действующими веществами корней валерианы являются валериановая и изовалериановая кислоты, а также изовалериановый эфир. Препараты валерианы в виде настоя, настойки или сухого экстракта в таблетках, покрытых оболочкой, используют как успокаивающие и спазмолитические средства при неврозах сердечно-сосудистой системы, сопровождающихся болью, тахикардией, болями в животе и спазмах гладкой мускулатуры внутренних органов. Комбинированные препараты валерианы: капли Зеленина, Корвалол, валокордин, Валосердин, Валокормид, Ново-пассит и др. — используют для лечения и профилактики стенокардии, тахикардии, начальной стадии гипертонии, бессонницы и других заболеваний. **НАСТОЙ КОРНЯ ВАЛЕРИАНЫ** (*Infusum radices Valerianae*) 10,0 - 200 мл назначают внутрь по 1—2 столовые ложки несколько раз в день, настойку валерианы (*Tinctura Valerianae*) — по 20—40 капель на прием и таблетки экстракта валерианы (*Extraction Valerianae*), покрытые оболочкой,— по 0,02 г 2—4 раза в день. **КОРВАЛОЛ** (*Corvalolum*) — широко известный комбинированный препарат валерианы, фенобарбитала и других ингредиентов. Применяют его по 15—20 капель на прием для устранения неврозов, тахикардии, спазмов кишечника и снижения артериального давления в начальной фазе гипертонии. Выпускают Корвалол в склянках-капельницах по 15 мл. Для устранения состояния стресса, повышенной раздражительности, повышенного психического напряжения, легкой формы бессонницы, мигрени, головной боли, обусловленной нервным перенапряжением, и других неврозов применяют комплексный растительный препарат Ново-пассит, который выпускается в форме раствора и таблеток.

7.4. Антидепрессанты Депрессия — это состояние организма, характеризующееся замедлением активности, подавленностью, нарушением сна, аппетита, внимания, появлением вялости, апатичности, неприятными, обвиняющими себя галлюцинациями, чувством безысходности, краха несбыточных надежд. При депрессии нарушается передача возбуждения по нервным волокнам, снижается концентрация нейромедиаторов норадреналина, серотонина и дофамина в синапсах. Причина тому — повышенная активность ферментов, в том числе фермента моноаминоксидазы (МАО), разрушающих

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	113стр. из 164	

или связывающих нейромедиаторы или осуществляющих «обратный захват» их нервными окончаниями, в результате чего нарушается передача импульсов, ухудшается настроение, появляется безразличие к окружающему миру и другие симптомы, характерные для депрессии. Для устранения депрессии используют лекарственные средства, ингибирующие MAO или препятствующие «обратному захвату» нейромедиаторов нервными окончаниями, после чего накапливается необходимое их количество в синапсах и восстанавливается передача возбуждения. Ингибитор — вещество, препятствующее протеканию какого-либо процесса или реакции. Подобное действие оказывают препараты пиразидол, азафен, мапротилин, флуоксетин, кломипрамин и др., имеющие различную химическую структуру. ПИРАЗИДОЛ (Pyrazidolum) — отечественный препарат, обладающий выраженным антидепрессивным действием. Он ингибирует моноаминоксидазу в отношении нейромедиаторов норадреналина и серотонина и одновременно нарушает их «обратный захват» окончаниями симпатических нервов. Благодаря этой способности пиразидола в синапсах накапливается необходимое количество нейромедиаторов и улучшается передача возбуждения в ЦНС, что приводит к постепенному устранению симптомов депрессии. Применяют препарат при депрессиях с психомоторной заторможенностью, сопровождающихся тревогой, хандрой, бредом, для лечения алкоголизма в стадии абстиненции, когда снижаются умственные способности, внимание к себе, нарушается ориентация в окружающей обстановке, например при болезни Альцгеймера. Назначают препарат внутрь, начиная с 2—3 таблеток (0,05—0,075 г) в день, постепенно увеличивая дозу до 0,15—0,3 г в сутки. Терапевтический эффект после начала лечения наступает на 7—14-й день, и больной начинает принимать поддерживающую дозу, которую к концу курса лечения постепенно снижают. Побочные эффекты при использовании Пиразидола проявляются редко, однако его не рекомендуют принимать при острых воспалительных заболеваниях печени и кроветворной системы. Выпускают Пиразидол в таблетках по 0,025 и 0,05 г № 50 и № 100. Список Б. КЛОМИПРАМИН (Clomipraminum) — препарат из группы ингибиторов обратного захвата нейромедиаторов, проявляющих особую активность в отношении серотонина; он повышает его содержание в синаптической щели и улучшает передачу возбуждения. Препарат оказывает выраженное тимолитическое действие, т.е. снижает чувство тоски, устраняет двигательную заторможенность, повышает общий тонус организма, способствует появлению силы, бодрости и хорошего настроения. Назначают кломипрамин внутрь после еды в капсулах или таблетках по 0,025 г 3 раза в день, а при необходимости дозу увеличивают.

В тяжелых случаях депрессии его вводят парентерально по 2—4 мл 1,25% раствора. Побочные эффекты возможны в виде головной боли, нарушения сердечного ритма, потливости и других симптомов. Кломипрамин не рекомендуют принимать вместе с ингибиторами моноаминоксидазы. Выпускают кломипрамин в таблетках и капсулах по 0,01; 0,025 и 0,05 г № 30 и № 50 и в ампулах по 2 мл 1,25% раствора. Список Б. МАПРОТИЛИН (Maprotilinum) — активный ингибитор обратного захвата, тормозит захват пресинаптическими нервными окончаниями норадреналина и одновременно усиливает его сосудосуживающий эффект. Применяют мапротилин при различных формах депрессий, сопровождающихся раздражительностью, страхом и апатией. Назначают препарат внутрь в драже по 0,05 г 3 раза в день и при необходимости дозу увеличивают. В тяжелых случаях депрессии его вводят парентерально по 2—4 мл 0,5% раствора. Побочные эффекты при использовании мапротилина проявляются редко и выражаются в виде сухости во рту, задержки мочеиспускания и аллергических реакций. Противопоказан препарат при острых заболеваниях почек, печени, при глаукоме и аденоме предстательной железы. Выпускают

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии		044/41-19к
Лекционный комплекс		114стр. из 164

мапротилин в драже по 0,01; 0,025 и 0,05 г и в ампулах по 5 мл 0,5% раствора. ФЛУОКСЕТИН (Fluoxetine) — ингибитор обратного захвата серотонина нервными окончаниями. Применяют флуоксетин при различных формах депрессии, особенно тех, которые сопровождаются тревогой и страхом. Побочные эффекты при использовании препарата возникают редко и возможны в виде тошноты, потери аппетита, запора и т.д. Флуоксетин не следует применять вместе с ингибиторами моноаминооксидазы, и во время лечения исключается употребление алкоголя. Выпускают флуоксетин в капсулах по 0,02 г.

7.5. Нормотимические средства Лекарственные препараты этой группы способны устранять острое маниакальное возбуждение у психических больных и предупреждать аффективные приступы. Аффект в психиатрии — это эмоциональное проявление психического тонуса и настроения человека. Он может сопровождаться специфическим мышлением, непонятными рассуждениями, идеями, странным поведением и т.д. Это происходит вследствие избыточного содержания в тканях мозга нейромедиаторов норадреналина и серотонина. Снизить их содержание в тканях мозга могут препараты лития и ряда других фармакологических групп. Под влиянием препаратов лития возрастает процесс дезаминирования (разрушение, биотрансформация) норадреналина и серотонина, концентрация их в тканях мозга падает и снижается раздражение адренергических рецепторов, а чувствительность участков лимбической системы повышается. Таким образом, препараты лития, оказывая влияние на нейрохимические процессы в тканях мозга, регулируют передачу возбуждения в ЦНС и приводят больного в нормальное состояние. К препаратам подобного действия относятся лития карбонат, мика- лит, лития оксидбутират и др.

7.6. Психостимуляторы Психостимуляторы — это вещества, повышающие активность всех функциональных систем психики человека. Они устраняют вялость, сонливость, улучшают настроение, повышают физическую и умственную работоспособность, стимулируют работу сердца и повышают артериальное давление. К психостимулирующим средствам относят кофеин, называемый «бытовым стимулятором», а также сиднофен, сиднокарб, адрено- и симпатомиметические средства. При работе с психостимуляторами следует соблюдать определенные меры предосторожности, так как большинство препаратов относятся к списку А (кроме кофеина, см. «Аналептики»).

7.7. Ноотропные средства В основе действия ноотропных средств лежит улучшение мыслительной деятельности, памяти и внимания у пациента, но они отличаются от психостимуляторов тем, что не повышают артериального давления и не вызывают двигательного и психического возбуждения. Они избирательно улучшают обменные процессы в тканях мозга и повышают его устойчивость к гипоксии.

Их применяют при нарушениях работы мозга, расстройствах памяти у лиц пожилого возраста, после черепно-мозговых травм и при нарушении мозгового кровообращения. Иногда их рекомендуют применять детям с отдельными формами умственной отсталости и задержкой психического развития и при ряде психических заболеваний. В качестве ноотропных средств используют пирацетам (ноотропил), аминалон и вещества, улучшающие мозговое кровообращение, — цин- наризин (Стугерон), винпоцетин (Кавинтон), тегретол и др. ПИРАЦЕТАМ (Piracetamum) оказывает положительное влияние на обменные процессы и кровообращение мозга, способствует концентрации памяти, облегчает процесс обучения, восстанавливает и стабилизирует нарушенные функции мозга. Его применяют при атеросклерозе, нарушениях мозгового кровообращения, при ряде психических заболеваний и в геронтологической практике. Применяют пирацетам в таблетках по 0,2 г, капсулах по 0,4 г до 4 раз в день или вводят в мышцу или в вену по 5 мл

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	115стр. из 164	

20% раствора. Среди побочных явлений возможны раздражительность, беспокойство, нарушение сна; его не советуют применять при беременности и острой сердечной недостаточности. Выпускают пирацетам в таблетках по 0,2 г, в капсулах по 0,2 и 0,4 г и в ампулах по 5 мл 20% раствора для инъекций. Список Б. ЦИННАРИЗИН (Cinnarizinum) улучшает мозговое и коронарное кровообращение, периферическое кровоснабжение, блокирует поступление кальция в клетки тканей и тормозит сокращение гладких мышц. Применяют циннаризин при нарушении мозгового кровообращения, снижении памяти, после инсульта, при атеросклерозе, для лечения болезни Рейно, облитерирующих состояний и расстройствах вестибулярного аппарата. Иногда при его применении у больных возникает головокружение, сухость во рту, слабость и повышенное потоотделение. Выпускают циннаризин в таблетках по 0,025 г. ФЕЗАМ (Phezanum) — комбинированный препарат, содержащий в одной капсуле 0,4 г пирацетама и 0,025 г циннаризина. Оба препарата снижают сопротивление сосудов мозга, способствуют улучшению мозгового кровообращения. Препарат используют при атеросклерозе сосудов мозга, после ишемического инсульта, черепно-мозговых травм, при нарушении памяти, концентрации внимания, головокружении, шуме в ушах, для улучшения памяти у детей, отстающих в интеллектуальном развитии. Назначают Фезам по 1—2 капсулы 3 раза в день в течение 1—3 месяцев в зависимости от тяжести заболевания. Детям старше 5 лет — по 1 капсуле в день. КОРТЕКСИН (Cortexinum) оказывает ноотропное, церебропротекторное и противосудорожное действие, уменьшает токсические эффекты средств, влияющих на нервную систему, улучшает память и процесс обучения, восстанавливает функции мозга после стрессовых состояний. Препарат регулирует соотношение количества тормозящих и возбуждающих аминокислот, уровень серотонина и дофамина в области мозга, обладает антиоксидантным действием и способен восстанавливать биоэлектрическую активность головного мозга. Применяют кортексин при черепно-мозговых травмах, нарушении мозгового кровообращения, вирусных и бактериальных инфекциях, эпилепсии, энцефалите, для улучшения памяти, мышления и повышения способности к обучению при различных формах детского церебрального паралича, задержке психомоторного и речевого развития у детей. Вводят препарат внутримышечно ежедневно по 0,01 г в течение 5—10 дней. Перед применением препарат разводят 0,5% раствором новокаина, водой для инъекций или изотоническим раствором натрия хлорида. При необходимости курс лечения повторяют через 1—6 месяцев. Выпускают препарат в виде стерильного порошка во флаконах по 0,01 г № 10. АМИНАЛОН (Aminalonum) — это и есть гамма-аминомасляная кислота (ГАМК), которая участвует в обменных процессах головного мозга, оказывает тормозящее влияние на центральную нервную систему, улучшает процессы питания, насыщения тканей мозга кислородом, кровообращение, переработку глюкозы и токсических веществ. Применяют Аминалон при сосудистых заболеваниях мозга с нарушением памяти, внимания, речи, при атеросклерозе, гипертонической болезни и после инсульта. Назначают Аминалон до еды в таблетках по 0,25—0,5 г на прием 2—3 раза в день. Выпускают препарат в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,25 г. Хранят Аминалон в защищенном от света месте. Список Б.

ФЕНОТРОПИЛ (Phenotropilum) — отечественный препарат, обладающий ноотропным, транквилизирующим, антиастеническим и противосудорожным действием. Он улучшает обмен веществ, кровообращение и окислительно-восстановительные процессы в мозге. Фенотропил способствует концентрации внимания, восприятия и памяти, регулирует процессы возбуждения и торможения в центральной нервной системе, улучшает зрение, самочувствие и настроение. Применяют препарат при невротических состояниях,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	116стр. из 164	

протекающих на фоне истощенности, снижения психомоторной активности, при различных видах депрессии, ухудшении памяти, для устранения судорог и лечения хронического алкоголизма. Побочные эффекты при применении препарата могут иногда проявляться в виде нарушения сна, повышения артериального давления, гиперемии кожных покровов, ощущения тепла и др. Не рекомендуют применять Фенотропил при беременности, кормлении ребенка грудью и повышенной чувствительности к нему. Выпускают Фенотропил в таблетках по 0,01 г в упаковке № 30 и № 50.

Тема Аналептики.

Цель. При изучении раздела следует обратить внимание на следующее.

1. Понятие «аналептики» и их основное действие на организм человека.
2. Особенности действия аналептиков на центральную нервную систему, работу сердца, артериальное давление и дыхание.
3. Перечень заболеваний, где аналептики могут быть использованы как средства неотложной помощи.
4. Другие показания и противопоказания к применению аналептиков.
5. Побочное действие аналептиков.
6. Правила выписывания аналептиков в рецептах.

Аналептические средства (analeptica — восстанавливающий, оживляющий) — это вещества, которые оказывают стимулирующее действие на сосудодвигательный и дыхательный центры продолговатого мозга, благодаря этому они восстанавливают жизненно важные функции организма: дыхание, сердечную деятельность и кровообращение. К группе аналептиков относятся кофеин, кордиамин, камфора, сульфокамфокаин и др. КОФЕИН (Coffeinum) по фармакологическим свойствам является одновременно психостимулятором и аналептиком. Его стимулирующее действие на центральную нервную систему приводит к повышению умственной и физической работоспособности. Аналептические свойства кофеина проявляются в стимуляции дыхания, сердечной деятельности и кровообращения. Физиологические особенности действия кофеина на центральную нервную систему были изучены в лаборатории И.П. Павлова, где было доказано, что кофеин усиливает и регулирует процессы возбуждения в коре головного мозга, но действие препарата на нее определяется правильным выбором дозы и типом высшей нервной деятельности человека. Например, большие дозы кофеина противопоказаны лицам с ослабленным типом высшей нервной деятельности из-за возможного истощения нервных клеток и развития нервно-психических расстройств. Работа сердца под влиянием прямого стимулирующего действия кофеина усиливается, сокращения миокарда становятся более интенсивными, пульс становится частым. На тонус сосудов кофеин оказывает двойное действие. С одной стороны, он оказывает прямое действие на сосуды, расширяя при этом сосуды мозга, сердца, почек, скелетных мышц, что даже при усиленной работе сердца нормального артериального давления не изменяет. С другой стороны, кофеин оказывает на сосуды центральное (через сосудодвигательный центр) действие, что приводит к резкому сужению сосудов брюшной полости, и при большей нагрузке сердца артериальное давление повышается. Прямое (сосудорасширяющее) действие кофеина на сосуды наблюдается чаще при нормальном артериальном давлении (покраснение лица при приеме горячего крепко заваренного чая), а центральное (сосудосуживающее) — при патологических состояниях, когда артериальное давление понижено. Под влиянием кофеина, за счет увеличения скорости кровотока, увеличивается диурез. В неотложной помощи кофеин используют при шоке, коллапсе, асфиксии, при спазмах сосудов головы (мигрень), а также инфекционных и других

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	117стр. из 164	

заболеваниях, сопровождающихся угнетением центральной нервной системы, пониженным артериальным давлением, снижением умственной и физической работоспособности и для устранения сонливости. В качестве лекарственного средства чаще используют КОФЕИН БЕНЗОАТ НАТРИЯ (Coffeinum natrii benzoas). Он по своим фармакологическим эффектам не отличается от чистого кофеина, но очень хорошо растворяется в воде, что позволяет использовать его в растворах для инъекций и в составе микстур. Назначают кофеин бензоат натрия в порошках и таблетках по 0,1— 0,2 г или вводят под кожу по 1 мл в виде 10 и 20% раствора. Нередко кофеин включают в состав таблеток вместе с кислотой ацетилсалициловой, анальгином, например Цитрамон и др. Не рекомендуют применять кофеин бензоат натрия при повышенной возбудимости, бессоннице, гипертонии, атеросклерозе, в старческом возрасте и при глаукоме. Выпускают кофеин бензоат натрия в таблетках по 0,1—0,2 г и в ампулах по 1 и 2 мл в виде 10 и 20% раствора. Список Б. КОРДИАМИН (Cordiaminum) по характеру действия на организм близок к кофеину, но не оказывает психостимулирующего и прямого стимулирующего действия на сердце. Он стимулирует ЦНС, возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры, особенно при пониженном тоне последнего. Применяют Кордиамин при острых и хронических расстройствах кровообращения, снижении сосудистого тонуса, ослаблении дыхания у инфекционных больных, при коллапсе, шоке и асфиксии новорожденных. Назначают Кордиамин внутрь по 15—30 капель на прием до 3 раз в день или вводят под кожу или в мышцу по 1 или 2 мл. Подкожные и внутримышечные инъекции препарата болезненны. Выпускают Кордиамин в ампулах по 1 и 2 мл, а также во флаконах по 15 и 25 мл для приема внутрь. Кроме кофеина и Кордиамина к группе аналептиков относится еще целый ряд препаратов, например камфора, которую в настоящее время используют в основном для наружного применения в виде 10% масляного раствора при воспалении среднего уха, для растирания при артритах и ревматизме и в виде 10% спиртового раствора для растираний и профилактики пролежней. В качестве заменителя камфоры иногда используют Сульфокамфо- каин в виде 10% раствора для парентерального введения. Он хорошо растворим в воде, по действию близок к Кордиамину и камфоре. Используют препарат для профилактики и лечения сердечной и дыхательной недостаточности. Выпускают Сульфокамфокаин в ампулах по 2 мл 10% раствора.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Задание 1. Выпишите в рецептах: 1) раствор Аминазина для инъекций; 2) Трифтазин для приема внутрь; 3) транквилизатор в качестве вспомогательного средства при бессоннице; 4) раствор натрия бромид для приема внутрь; 5) Корвалол при тахикардии.

1. Тема. Средства, влияющие на сердечно-сосудистую систему.

2. Цель. При изучении данного раздела особое внимание следует обратить на следующее.

1. Понятия «сердечная недостаточность», «тахикардия», «брадикардия», «ишемическая болезнь сердца», «антиангинальные» и «гипотензивные средства».
2. Классификация сердечно-сосудистых средств.
3. Классификация, действие и особенности применения сердечных гликозидов.
4. Классификация, особенности действия и применения противоаритмических средств.
5. Классификация, особенности действия и применения гипотензивных средств.
6. Применение, действие, побочные эффекты антиангинальных средств.
7. Группы лекарственных средств, применяемых при инфаркте миокарда.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	118стр. из 164	

8. Выбор препарата и его лекарственной формы в зависимости от пути введения, состояния здоровья пациента, поставленной цели при оказании помощи и т.д.

9. Средства, влияющие на кровообращение мозга.

10. Особенности выписывания препаратов в рецептах.

3. Тезисы лекции.

1. Сердечные гликозиды Сердечные гликозиды относятся к группе кардиотонических средств, применяемых для лечения сердечной недостаточности. Сердечная недостаточность характеризуется нарушением биохимических процессов в миокарде и тахикардией, на фоне которых нарушается кровообращение, развиваются застойные явления в большом и малом кругах кровообращения и, как следствие, возникает одышка, цианоз и отеки. Различают хроническую сердечную недостаточность, при которой симптомы развиваются медленно и бывают выражены нечетко, и острую сердечную недостаточность, когда симптомы нарастают быстро, ярко выражены, развивается тяжелое состояние, угрожающее жизни человека. Однако при той и другой сердечной недостаточности прежде всего наблюдаются нарушения сократительной функции миокарда. Основные симптомы сердечной недостаточности: тахикардия, одышка, цианоз и отек тканей. Тахикардия при сердечной недостаточности развивается в результате повышенной возбудимости синусного узла и увеличения скорости прохождения импульсов по проводящей системе сердца. Оно теряет способность перебрасывать венозную кровь в малый и большой круги кровообращения, скорость кровотока падает, и возникает застой крови, который в малом круге приводит к нарушению газообмена и развитию одышки, в большом круге — к возникновению отеков. За счет накопления в крови углекислого газа и метгемоглобина слизистые оболочки и кожа приобретают синюшный оттенок, развивается цианоз, и все это — из-за нарушения сократительной функции миокарда. Одними из самых эффективных средств, регулирующих работу сердца, являются сердечные гликозиды — особые фармакологические средства, содержащие в своем составе основную действующую часть (агликон) и сахарную часть (гликон). Вещества этой группы находятся в различных растениях, среди которых наиболее известны ландыш майский, строфант, различные виды наперстянки, горицвет весенний (адонис), желтушник, олеандр и др. Сердечные гликозиды, содержащиеся в этих растениях, близки по химической структуре и механизму действия, но отличаются друг от друга по способности растворяться в воде и жирах, скорости всасывания, прочности соединения с белками крови и тканей, времени наступления эффекта после их введения, продолжительности действия, способности накапливаться (кумулироваться) в организме и т.д. Действие сердечных гликозидов направлено на нормализацию работы сердца, где наиболее ценным их свойством является способность усиливать сердечные сокращения (кардиотонический эффект). Под влиянием терапевтических доз сердечных гликозидов: а) снижается возбудимость всей проводящей системы сердца, скорость проведения импульсов по пучку Гиса и волокнам Пуркинье, замедляется атриовентрикулярная проводимость, увеличивается промежуток времени между сокращениями предсердий и желудочков; б) диастола становится более продолжительной, улучшается приток крови к желудочкам, сердечная мышца больше отдыхает, получает достаточное количество питания, энергии и кислорода; в) систола становится короткой по времени, но более мощной, что позволяет всю поступившую во время диастолы кровь перебросить в артерии и улучшить кровообращение. Увеличение времени диастолы и урежение сердечных сокращений связано также с рефлекторным возбуждением блуждающего нерва, а механизм стимулирующего действия сердечных гликозидов связан с увеличением в миокарде ионов

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	119стр. из 164	

кальция, повышающих его сократительную активность. При этом одновременно снижается содержание в клетках ионов калия, которые тормозят работу сердца. Таким образом, ведущей в действии сердечных гликозидов, благотворно влияющих на работу сердца, является их способность усиливать систолу, увеличивать время диастолы и повышать скорость кровотока. Результатом такого действия сердечных гликозидов будет улучшение кровообращения. Увеличение скорости кровотока в малом кругу кровообращения кроме ликвидации застойных явлений повысит газообмен, устранил одышку и цианоз. Тот же эффект в большом кругу кровообращения устранил отеки вследствие повышения диуреза по причине большего количества крови, проходящей через почки. Итак, сердечные гликозиды, изменяя работу сердца и повышая скорость кровотока, полностью устраняют застойные явления и основные симптомы, характерные для сердечной недостаточности. Различают хроническую и острую сердечную недостаточность. Современная практика делит сердечные гликозиды на три группы: 1) препараты медленного, но длительного действия; 2) препараты средней продолжительности действия; 3) препараты быстрого, но короткого действия. К первой группе относятся препараты, действие которых развивается иногда через 10—12 часов и продолжается до нескольких суток. К ним относятся сердечные гликозиды различных видов наперстянки, горицвета весеннего (адонис) и других лекарственных растений, применяемых чаще при хронической сердечной недостаточности. **ДИГИТОКСИН (Digitoxinum)** — гликозид наперстянки пурпурной, оказывает сильное кардиотоническое действие, урежает сердечный ритм, увеличивает силу сокращений сердечной мышцы, восстанавливает кровообращение.

После приема внутрь максимальное действие препарата развивается через 8—12 часов и продолжается до 10 суток, поэтому его применяют по специальной схеме, начиная с 5—6 таблеток в сутки и постепенно снижая их число до 1—2 в день. Используют дигитоксин для лечения хронической сердечной недостаточности с нарушением кровообращения второй и третьей стадии. При назначении дигитоксина необходимо учитывать то, что препарат способен кумулировать (!) в организме и вызывать токсический эффект, что ограничивает его применение. Выпускают дигитоксин в таблетках по 0,0001 г (0,1 мг) и в форме ректальных суппозиторий по 0,00015 г (0,15 мг) в упаковке по 10 штук. Список А. Сердечные гликозиды средней продолжительности проявляют максимальный эффект после приема внутрь через 5—6 часов, который продолжается 2—3 дня. При внутривенном введении препаратов действие наступает через 15—30 минут, а при приеме внутрь максимальный эффект развивается через 2—3 часа. К сердечным гликозидам этой группы относятся препараты наперстянки шерстистой (дигоксин, целанид), обладающие умеренной кумуляцией, и препараты горицвета (адониса) весеннего. Среди препаратов наиболее часто используют целанид, дигоксин, лантозид, дигален-нео и др. **ДИГОКСИН (Digoxinum)** — эффект этого препарата развивается быстрее, чем у дигитоксина, но зависит от избранного пути введения. При хронической сердечной недостаточности его назначают внутрь в таблетках по 0,00025 г по специальной схеме и под контролем врача. В случаях острой сердечной недостаточности 0,025% раствор по 1—2 мл вводят в вену с 10—20 мл 0,9% раствора натрия хлорида или глюкозы. Препарат замедляет сердечный ритм, обладает (косвенно) диуретическим действием, меньше кумулирует, чем дигитоксин, изменяет характер систолы и диастолы. Не рекомендуется использовать препарат при выраженной брадикардии, полной атриовентрикулярной блокаде, частых приступах стенокардии и недавно перенесенном инфаркте миокарда. Выпускают дигитоксин в таблетках по 0,00025 г (0,25 мг) и в ампулах по 1 мл 0,025% раствора в упаковке по 10 штук. Список А. **ЦЕЛАНИД (Celanidum)** — сердечный гликозид, полученный из листьев наперстянки

O'NTÛSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	120стр. из 164

шерстистой (*Digitalis lanata*), действует на работу сердца подобно дигитоксину. Назначают при острой и хронической сердечной недостаточности, тахикардии. Выпускают в таблетках по 0,00025 г № 30 и в ампулах по 1 мл 0,02% раствора № 10. Список А.

ЛАНТОЗИД (*Lantosidum*) — новогаленовый препарат из листьев наперстянки шерстистой. Используют при хронической сердечной недостаточности второй и третьей степени, сопровождающейся тахикардией. Назначают препарат по 15—20 капель 2—3 раза в день. Выпускают лантозид во флаконах-капельницах по 15 мл. Сердечные гликозиды горицвета (адониса) весеннего по характеру действия близки к препаратам наперстянки, но отличаются меньшей активностью, продолжительностью действия и стойкостью. Последнее качество гликозидов горицвета практически исключает опасность их кумуляции. Кроме того, препараты горицвета оказывают выраженное седативное действие, поэтому их рекомендуют применять для лечения начальных форм сердечной недостаточности, неврозов и вегетодистонии. ТРАВА ГОРИЦВЕТА (*Herba Adonidis*) используется для приготовления настоя 6,0 — 200 мл, который назначают внутрь по 1 столовой ложке до 4 раз в день. Настой травы горицвета входит в состав микстуры Бехтерева. Трава служит сырьем для приготовления сухого экстракта, входящего в состав таблеток «Адонис-бром». Представителями сердечных гликозидов, оказывающих быстрое, но короткое действие и используемых как средства неотложной помощи при острой сердечной недостаточности и тяжелых формах недостаточности кровообращения, являются гликозиды строфанта и ландыша. СТРОФАНТИН К (*Strophanthin K*) представляет собой сумму гликозидов одного из видов строфанта. Его характеризует высокая эффективность, быстрота и непродолжительность действия. Применяют Строфантин при острой сердечной недостаточности, в том числе и на почве острого инфаркта миокарда и при тяжелых формах хронической недостаточности кровообращения второй и третьей степени. При приеме внутрь оказывает слабое действие, так как плохо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Чаще Строфантин вводят в вену по 0,5—1 мл 0,025 или 0,05% растворов с 10—20 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствором глюкозы, медленно и под контролем пульса. После внутривенного введения действие Строфантина проявляется уже через несколько минут. Не следует применять Строфантин при органических изменениях в сердце и сосудах, остром миокардите, эндокардите и выраженном атеросклерозе.

Выпускают Строфантин К в ампулах по 1 мл 0,025 и 0,05% растворов в упаковке по 10 штук. Список А. КОРГЛИКОН (*Corglyconum*) содержит сумму гликозидов ландыша майского, которые, как и Строфантин, оказывают подобное действие и не кумулируют. По характеру действия близок к Строфантину, не уступает ему по скорости наступления эффекта, но действует более продолжительно. Коргликон оказывает более выраженное действие на функции блуждающего нерва и применяется в тех же случаях, что и Строфантин, а также для купирования приступов пароксизмальной тахикардии. Выпускают коргликон в ампулах по 1 мл 0,06% раствора в упаковке по 10 штук. Список Б.

ПОМНИТЕ! Сердечные гликозиды в виде инъекций вводят в вену по 0,5—1 мл с 10—20 мл изотонического раствора натрия хлорида либо 5, 20 или 40% растворами глюкозы. Очень медленно в течение 5—6 минут. Под контролем пульса!

Отравление сердечными гликозидами возможно лишь при их передозировке или кумуляции. При этом у пациентов наблюдается тошнота, рвота, резкое замедление пульса (брадикардия), затем развивается аритмия (тахикардия), возможен бред, галлюцинации, судороги, быстрое падение артериального давления, не исключен летальный исход. При появлении первых признаков токсического действия препаратов их отменяют и с целью

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	121стр. из 164	

оказания помощи назначают препараты калия (калия хлорид, калия оротат, таблетки «Аспаркам»), антагонист сердечных гликозидов — унитиол, противоаритмические средства (лидокаин), блокаторы кальциевых каналцев (верапамил) и т.д.

2. Противоаритмические средства Противоаритмическими называют лекарственные средства, используемые для лечения нарушений сердечных сокращений. Водителем сердечного ритма является синусный узел, где генерируются (зарождаются) импульсы. Однако способность синусного узла автоматически вырабатывать импульсы и вызывать ритмические сокращения сердца может быть нарушена. Это возможно при некоторых заболеваниях сердца (миокардит), отравлениях (сердечные гликозиды), нарушениях функций вегетативной нервной системы. Нарушение ритма сердца возможно и при различных блокадах его проводящей системы.

Противоаритмические средства эффективны при различных формах сердечных аритмий, но в связи с тем, что они по-разному влияют на проводящую систему сердца и ее отделы, их делят на несколько групп, среди которых ведущими являются: 1) мембраностабилизирующие средства; 2) р-блокирующие средства (атенолол); 3) препараты, замедляющие реполяризацию (амиодарон); 4) блокаторы (антагонисты) кальциевых каналцев (верапамил). Препараты первой группы в связи с некоторыми особенностями их действия делят еще на три подгруппы: 1 А — хинидин, новокаинамид, ритмилен; 1 В — местные анестетики или блокаторы натриевых каналцев (лидокаин, тримекаин); 1 С — аймалин, этацин, аллапинин. В механизме действия всех противоаритмических средств главную роль играет их влияние на клеточные мембраны, транспорт через них ионов натрия, калия и кальция. Так, препараты подгрупп 1 А и 1 С в основном подавляют транспорт ионов натрия через быстрые натриевые каналы клеточной мембраны. Препараты подгруппы 1 В повышают проницаемость мембран для ионов калия. Итак, препараты первой группы снижают скорость деполяризации, замедляют проводимость импульсов по пучку Гиса и волокнам Пурки- нье, замедляют восстановление реактивности мембран кардиомиоцитов (клетки сердечной мышцы). ХИНИДИНА СУЛЬФАТ (Chinidini sulfas) — алкалоид хинного дерева, родоначальник противоаритмических средств первой группы. Одновременно с угнетением транспорта ионов натрия снижает поступление в клетки сердечной мышцы ионов кальция, что обеспечивает накопление в клетках миокарда ионов калия, тормозящих сердечный ритм. Хинидина сульфат обладает сильным противоаритмическим действием, активен при различных видах аритмий — экстрасистолии, мерцательной аритмии, но довольно часто вызывает побочные явления (тошнота, рвота и др.). Назначают хинидин внутрь в таблетках по 0,1 г 4—5 раз в день, а при хорошей переносимости дозу увеличивают до 0,8—1 г в сутки. Выпускают хинидина сульфат в таблетках по 0,1 и 0,2 г. Список Б. НОВОКАИНАМИД (Novocainamidum) по химической структуре близок к новокаину, сходен с ним по фармакологическим свойствам, обладает местным анестезирующим действием. У него наиболее выражена способность снижать возбудимость сердечной мышцы и подавлять очаги автоматизма в местах, где образуются импульсы. Препарат обладает хининоподобным действием, и применяют его для лечения экстрасистолии, мерцательной аритмии, пароксизмальной тахикардии, при операциях на сердце и т.д. Назначают новокаинамид внутрь в таблетках по 0,25 г или вводят в мышцу по 5—10 мл 10% раствора или в вену по 5—10 мл 10% раствора с раствором глюкозы или 0,9% раствором натрия хлорида. Не следует использовать препарат при выраженной сердечной недостаточности и повышенной чувствительности к нему. Выпускают новокаинамид в таблетках по 0,25 и 0,5 г, а также в виде 10% раствора в ампулах по 5 мл. Список Б. РИТМИЛЕН (Ritmilenum),

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	122стр. из 164	

синоним: дизопирамид, по действию близок к хинидину, снижает прохождение через мембрану ионов натрия, замедляет проведение импульсов по пучку Гиса. Применяют Ритмилен при предсердных и желудочковых экстрасистолиях, тахикардии, аритмии, после инфаркта миокарда и при хирургических вмешательствах. Назначают Ритмилен внутрь в капсулах или таблетках до 3 раз в день. Среди побочных явлений отмечена сухость во рту, нарушение аккомодации, затрудненное мочеиспускание и редко — аллергические реакции. Выпускают Ритмилен в таблетках и капсулах по 0,1 г и в виде 1% раствора в ампулах по 1 мл. К подгруппе 1 В относятся местные анестетики (см. «Местноанестезирующие средства»). Они увеличивают проницаемость мембран для ионов калия, которые тормозят работу сердца. Подгруппа 1 С включает в себя препараты Аллапинин, Аймалин, Этмозин и др. Они, как и препараты подгруппы 1 А, подавляют транспорт натрия через быстрые натриевые каналы клеточной мембраны. АЛЛАПИНИН (Allapininum) оказывает противоаритмическое действие, замедляя проведение импульсов по предсердиям, пучку Гиса и волокнам Пуркинье, не вызывает гипотензии, обладает местноанестезирующим и седативным действием. Применяют Аллапинин при наджелудочковой и желудочковой экстрасистолии, мерцании и трепетании предсердий, пароксизмальной желудочковой тахикардии и при аритмии на фоне инфаркта миокарда.

Назначают Аллапинин внутрь в таблетках, которые предварительно измельчают и принимают за 30 минут до еды по 0,025 г каждые 8 часов, а при отсутствии эффекта — каждые 6 часов. Побочные явления препарата могут выражаться в форме головокружения, ощущения тяжести в голове, покраснения лица и иногда аллергических реакций. Выпускают Аллапинин в таблетках по 0,025 г и в виде 0,5% раствора в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 штук. Вторую группу противоаритмических средств представляют р-адреноблокаторы, главными представителями которых являются Анаприлин, Атенолол, Вискен, Индерал и др. ВИСКЕН (Viskeri), синоним: пиндолол, представляет собой неселективный р-блокатор, оказывает антиангинальное, противоаритмическое и гипотензивное действие. Как противоаритмическое средство особенно эффективен при предсердных экстрасистолиях, стенокардии и гипертонической болезни. В кардиологии вискен применяют по 1 таблетке 3 раза в день после еды. Среди побочных эффектов иногда наблюдаются спазм бронхов, брадикардия, головная боль, тошнота и диарея. Выпускают вискен в таблетках по 0,005 г. Основными представителями противоаритмических средств третьей группы, замедляющих реполяризацию мембран клеток, являются амиодарон, орнид и другие препараты. ОРНИД (Ornidum) проявляет симпатолитический эффект за счет блокады выделения норадреналина из нервных окончаний. Блокирующего влияния на рецепторы не оказывает, что приводит к снижению артериального давления, устранению тахикардии, и экстрасистолии. Для купирования приступов аритмии орнид вводят в вену или в мышцу по 0,5—1 мл 5% раствора, а для профилактики и лечения аритмий вводят тот же раствор в мышцу в тех же дозах 2—3 раза в день. Не следует принимать препарат при острых нарушениях мозгового кровообращения, гипотонии и выраженной почечной недостаточности. Выпускают орнид в ампулах по 1 мл 5% раствора в упаковке по 10 штук. Четвертую группу противоаритмических средств представляют антагонисты ионов кальция, или, как их еще называют, блокаторы кальциевых каналов (БКК). Основными препаратами этой группы являются верапамил, нифедипин, диалтиазем и др.

Известно, что ионы кальция повышают сократительную активность миокарда и потребление им кислорода, влияют на тонус синусного узла и атриовентрикулярную проводимость, суживают сосуды, активизируют биохимические процессы, стимулируют деятельность гипофиза и высвобождение адреналина надпочечниками, поэтому

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	123стр. из 164	

повышается артериальное давление. Основное применение антагонисты кальциевых каналов нашли в качестве сердечно-сосудистых средств, они снижают артериальное давление, улучшают коронарный кровоток, оказывают антиангинальное и противоаритмическое действие. ВЕРАПАМИЛ (Verapamilum) — блокатор кальциевых каналов, снижает сократимость миокарда, агрегацию тромбоцитов, оказывает угнетающее влияние на проводящую систему сердца, повышает содержание калия в миокарде. Применяют верапамил при артериальной гипертензии, для профилактики стенокардии напряжения, особенно в комплексе с предсердной экстрасистолией и тахикардией. Назначают препарат внутрь за 30 минут до еды в таблетках по 0,04 или 0,08 г при стенокардии 3 раза в день, а при гипертензии — 2 раза в день. Для устранения аритмий верапамил рекомендуют применять по 0,04—0,12 г 3 раза в сутки. Не рекомендуют использовать верапамил при острой сердечной недостаточности, выраженной брадикардии и повышенной чувствительности к препарату. Выпускают верапамил в таблетках по 0,04 и 0,08 г № 50. Список Б. НИФЕДИПИИ (Nifedipinum), синонимы: Кордафен, Коринфар, подобно верапамилу расширяет коронарные и периферические сосуды, снижает артериальное давление и потребность миокарда в кислороде, обладает противоаритмическим действием. Применяют нифедипин при хронической сердечной недостаточности, ишемической болезни сердца с приступами стенокардии, для снижения артериального давления при различных формах гипертензии. Назначают препарат в таблетках по 0,01—0,03 г 3—4 раза в день. Среди побочных явлений иногда отмечают покраснение лица, верхней челюсти и туловища. Противопоказан нифедипин при тяжелых формах сердечной недостаточности, выраженной гипотонии, беременности и кормлении ребенка грудью. Выпускают нифедипин в таблетках по 0,01 г № 40 и № 50. Список Б. К этой же группе относятся препараты кардил, пазикор и средства, улучшающие мозговое кровообращение (циннаризин, кавинтон, трентал и др.).

3. Гипотензивные средства Гипотензивными называют средства, способные снижать артериальное давление. Их иногда называют антигипертензивными средствами. К ним относятся препараты, снижающие артериальное давление и применяемые для лечения и профилактики различных форм гипертензии, купирования гипертонических кризов и других состояний, сопровождающихся спазмом кровеносных сосудов. Современная классификация гипотензивных средств включает в себя: 1) нейротропные средства; 2) средства миотропного действия; 3) периферические вазодилататоры; 4) антагонисты кальциевых каналов; 5) блокаторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ); 6) диуретические средства и др. Большое количество гипотензивных средств позволяет осуществлять индивидуальный подход к лечению различных форм гипертензии, но требует знаний механизмов действия различных групп препаратов, тщательного выбора лекарственных средств с учетом их побочных эффектов.

3.1. Нейротропные средства Нейротропные гипотензивные средства включают в себя несколько подгрупп: 1) влияющие на сосудодвигательные центры головного мозга; 2) блокирующие проведение импульсов на уровне вегетативных ганглиев (ганглиоблокаторы); 3) симпатолитические; 4) блокирующие α_1 , α_2 и β -адренорецепторы. К нейротропным гипотензивным средствам относятся препараты, влияющие на сосудодвигательные центры головного мозга. Представителями этой группы препаратов являются Клофелин, Метилдофа, Гуанфацин и др. КЛОФЕЛИН (Clonidine), синоним: Гемитон, — типичное гипотензивное средство, действие которого связано с возбуждением α_2 -адренорецепторов сосудодвигательных центров головного мозга, при этом снижается поток симпатических импульсов из ЦНС к сосудам, снижается

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	124стр. из 164	

высвобождение норадреналина из нервных окончаний, и все это приводит к расширению сосудов и падению артериального давления. Но Клофелин не так прост, вначале он возбуждает α -адрено- рецепторы периферических сосудов и кратковременно повышает артериальное давление. Однако Клофелин легко проникает через гематоэнцефалический барьер, где проявляется его гипотензивное действие посредством возбуждения α_2 -адренорецепторов сосудодвигательного центра головного мозга. Кроме того, Клофелин урежает частоту сердечных сокращений, оказывает седативное действие и снижает внутриглазное давление. Используют Клофелин при всех формах гипертонии и для купирования гипертонических кризов, а также для лечения первичной открытоугольной глаукомы. Препарат применяют внутрь, вводят в мышцу, под кожу, в вену и в виде капель закапывают в глаза. Внутрь назначают в таблетках по 0,000075 и по 0,00015 г независимо от времени и приема пищи 2—4 раза в день. В мышцу и под кожу вводят от 0,5 до 1,5 мл 0,01% раствора или вводят такие же дозы в вену, но с 10—20 мл изотонического раствора натрия хлорида. В вену препарат вводят очень медленно в течение 5—6 минут. Парентеральное введение Клофелина обычно используют в условиях стационара или в случаях неотложной помощи. Среди побочных явлений при использовании препарата отмечают сухость во рту, сонливость, слабость, реже — запор и ортостатический коллапс. Клофелин не рекомендуют применять при работе, требующей повышенного внимания, быстрой психической и двигательной реакции (водители транспорта, станочники). Препарат несовместим с алкоголем, потому что одновременное их применение вызывает тяжелые последствия и даже летальный исход. Выпускают Клофелин в таблетках по 0,000075 и 0,00015 г, в ампулах по 1 мл 0,01% раствора и тьюбиках-капельницах по 2 мл 0,125; 0,25 и 0,5% растворов для закапывания в глаза. Список Б. МЕТИЛДОФА (Methyldopa), синоним: Допегит, действует подобно Клофелину, после приема внутрь проникает в клетки сосудов и головного мозга, где через ряд химических реакций превращается в α -метилнорадреналин. Последний, подобно Клофелину, стимулирует α_2 -адренорецепторы сосудодвигательных центров, что приводит к снижению артериального давления, замедлению ритма сердца, расширению его сосудов и увеличению выброса крови в артерии. Применяют метилдофу в таблетках по 0,25 г 2—3 раза в день для лечения гипертонической болезни. В конце лечения отмена Клофелина и метилдофы должна быть постепенной из-за возможного резкого повышения артериального давления. Выпускают метилдофу в таблетках по 0,25 г. Список Б. Средства, блокирующие проведение импульсов на уровне ганглиев, см. «Ганглиоблокирующие средства». Средства, блокирующие α -, (α_1 - и α_2 -) и (β_1 - и β_2 -)адренорецепторы, см. тему «Адреноблокирующие средства».

3.2. Гипотензивные средства миотропного действия Эти препараты непосредственно действуют на гладкие мышцы кровеносных сосудов, расслабляют их и снижают артериальное давление. Они оказывают лишь симптоматическое действие, так как постепенное снижение лечебной концентрации может вновь вызвать спазм сосудов и повысить артериальное давление. Однако эти препараты играют важную роль при оказании неотложной помощи, когда высокое артериальное давление грозит развитием инсульта. В этих случаях препараты вводят в вену медленно с 10—20 мл 0,9% раствора натрия хлорида. При этом эффект снижения артериального давления наступает довольно быстро, что позволяет избежать тяжелых последствий и даже летального исхода. К этой группе препаратов относятся папаверина гидрохлорид, Дибазол, Но-шпа, магния сульфат и др. ПАПАВЕРИНА ГИДРОХЛОРИД (Papaverini hydrochlorilum) — алкалоид опийного мака, обладающий миотропным спазмолитическим действием, в больших дозах снижает возбудимость миокарда и замедляет внутрисердечную проводимость. Применяют препарат

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	125стр. из 164	

при спазмах сосудов головного мозга, для лечения стенокардии, холецистита, спастического колита, спазмов мочевыводящих путей и для лечения гипертонической болезни. Применяют препарат внутрь в таблетках по 0,04 г до 5 раз в день, в вену вводят по 1 мл 2% раствора с 10—20 мл изотонического раствора натрия хлорида, а в мышцу — по 1—2 мл 2% раствора для лечения гипертонии 2—3 раза в день. Нередко папаверин комбинируют с дибазолом (Папазол) и фенобарбиталом.

Среди побочных эффектов у него иногда отмечают атриовентрикулярную блокаду, желудочковую экстрасистолию, резкое падение артериального давления и запор. Выпускают папаверина гидрохлорид в таблетках по 0,04 г № 10 и в виде 2% раствора в ампулах по 2 мл, а также в форме ректальных суппозиторий по 0,2 г. ДИБАЗОЛ (Dibazolium) оказывает сосудорасширяющее и гипотензивное действие, обладает иммуностимулирующим действием. Для купирования гипертонического криза препарат вводят в вену или в мышцу по 2—4 мл 1 % раствора. Его можно сочетать с другими гипотензивными средствами. Внутрь Дибазол назначают в таблетках по 0,02—0,04 г за 2 часа до еды или через 2 часа после приема пищи. Курс лечения составляет примерно 2—3 недели. Дибазол хорошо переносится больными и почти не вызывает побочных эффектов. Выпускают Дибазол в таблетках по 0,02 и 0,4 г и в виде 1 % раствора в ампулах по 1 и 2 мл. Список Б. ДРОТОВЕРИНА ГИДРОХЛОРИД (Drotoverini hydrochloridum), синоним: Ношпа, по химической структуре и фармакологическому действию близок к папаверину. Используют его при спазмах желудка и кишечника, приступах жел- че- и мочекаменной болезни, при спазмах периферических сосудов и повышении артериального давления. Назначают дротверин внутрь в таблетках по 0,04—0,08 г 2—3 раза в день, а при необходимости вводят в мышцу по 2—4 мл 2% раствора. В медицинской практике используют комбинированные препараты Никошпан, Никоверин, Бишпан и др. Иногда при парентеральном введении у больных возникает жар, потливость и головокружение. Выпускают дротверина гидрохлорид в таблетках по 0,04 г № 100 и в виде 2% раствора в ампулах по 2 мл. Список Б.

3.3. Периферические вазодилататоры Слово «вазодилататор» происходит от латинского vas — сосуд и dilatation — расширение, что означает расширение какого-либо полого органа, например кровеносного сосуда. Препараты этой группы используют в терапии гипертонической болезни, сердечной недостаточности, острого инфаркта миокарда. Они снижают приток крови к левому желудочку, пред- и постнагрузку на миокард, артериальное давление и уменьшают потребность миокарда в кислороде.

К периферическим вазодилататорам относятся препараты различных фармакологических групп, в том числе адрено- и симпатобло- каторы, вызывающие расширение периферических сосудов. Однако следует помнить, что применение большинства вазодилататоров подобного типа требует строгого соблюдения доз, постоянного контроля состояния крови и их эффективности. Представителями этой группы препаратов являются натрия нитро- пруссид, апрессин, празозин и др. НАТРИЯ НИТРОПРУССИД (Natrii nitroprussidum) — один из наиболее эффективных периферических вазодилататоров. При введении в вену оказывает быстрый, сильный, но относительно непродолжительный гипотензивный эффект. Он расширяет артериолы и частично вены, снижает нагрузку на сердце и потребность миокарда в кислороде. Используют препарат при гипертонических кризах, угрожающих развитием инсульта, для быстрого снижения артериального давления, а также при осложненной сердечной недостаточности, в том числе при остром инфаркте миокарда. Вводят натрия нитропруссид в вену, а растворы его готовят непосредственно перед употреблением. Сначала содержимое ампулы разводят в 5 мл 5% раствора глюкозы,

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	126стр. из 164	

а полученный раствор дополнительно разводят в 500 или 1000 мл 5% раствора глюкозы, после чего приступают к капельному использованию препарата. Применение препарата требует определенной осторожности, и в случае развития побочных эффектов (резкое падение артериального давления, тошнота, рвота) введение его следует прекратить. Выпускают натрия нитропруссид в ампулах темного стекла по 0,03 г с приложением растворителя в ампулах по 5 мл. АПРЕССИН (.Apressinum) — активный вазодилататор, снижает сопротивление артериол и артериальное давление, уменьшает нагрузку на миокард и усиливает сердечный выброс. Применяют апрессин при различных формах гипертонии. Его рекомендуется использовать короткими курсами для снижения артериального давления. Среди побочных явлений возможны головная боль, головокружение, боли в области сердца, приливы к голове, потливость, повышение температуры, реже развивается ортостатический коллапс. Назначают апрессин внутрь после еды в таблетках по 0,01 и 0,025 г 2—4 раза в день. Курс лечения составляет 2—4 недели, но в конце его лечение следует прерывать не сразу, а постепенно уменьшая дозу.

Выпускают апрессин в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,01 и 0,025 г. ПРАЗОЗИН (Prazosinum) — типичный α_1 адреноблокатор и периферический вазодилататор. Он оказывает одновременно артерио- и венорасширяющее действие, снижает венозный приток крови к сердцу, пред- и постнагрузку на миокард, облегчает его работу и тормозит агрегацию тромбоцитов. Используют празозин при всех формах гипертонии (гипертонии). Принимают препарат независимо от времени приема пищи, начиная с небольших доз 0,0005—0,001 г, которые лучше принимать перед сном, после чего больной должен находиться в постели 6—8 часов (возможно резкое падение артериального давления, это так называемый феномен первой дозы, вплоть до коллапса). Празозин при медленном развитии гипотензивного эффекта можно комбинировать с диуретиками, Р-адреноблокаторами, клофелином и другими средствами. Празозин не советуют применять при беременности, детям до 12 лет и больным с поражением почек. Выпускают празозин в таблетках по 0,001 и 0,005 г № 50. Список Б. 3.4. Бета-адреноблокирующие средства (см. тему «Адреноблокирующие средства») 3.5. Антагонисты кальциевых каналов (см. тему «Блокаторы кальциевых каналов») 3.6. Блокаторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) Важную роль в регуляции артериального давления играет система ренин-ангиотензин. Альдостерон — гормон коры надпочечников, отвечающий за реабсорбцию первичной мочи и возвращающий ее обратно в кровяное русло. Ренин — это фермент, синтезируемый специальными клетками почек. Ангиотензин — полипептид, образующийся из белка плазмы крови ангиотензиногена. Под влиянием ренина ангиотензиноген, не влияющий на артериальное давление, превращается в ангиотензин-1, который также не оказывает сосудосуживающего действия. Однако под влиянием ангиотензинпревращающего фермента (АПФ), образующегося при определенных условиях, в легких ангиотензин-1 преобразуется в ангиотензин-2, обладающий сильным и быстрым прессорным (сосудосуживающим) действием, что приводит к повышению артериального давления и развитию гипертонической болезни. Кроме того, ангиотензин-2 способствует высвобождению норадреналина из нервных окончаний симпатической нервной системы, что приводит к еще большему сужению сосудов и повышению артериального давления. Лекарственные средства, блокирующие АПФ, устраняют переход ангиотензина-1 в ангиотензин-2 и тем самым не позволяют повышать артериальное давление. Основными ингибиторами АПФ являются каптоприл, эналаприл, лизиноприл, рамиприл, цилазаприл и др. Они улучшают кровоток, повышают диурез, поэтому

O'NTUSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	127стр. из 164	

эффективны не только при артериальной гипертонии, но и при застойной сердечной недостаточности.

КАПТОПРИЛ (Captoprilum), синоним: Капотен, — один из наиболее активных синтетических блокаторов ангиотензинпревращающего фермента. Он расширяет периферические сосуды, снижает артериальное давление, уменьшает пред- и постнагрузку на миокард, улучшает кровообращение в почках, эффективен при застойной сердечной недостаточности. Применяют каптоприл как гипотензивное средство при различных формах гипертонической болезни и для лечения больных с сердечной недостаточностью. Его можно комбинировать с другими гипотензивными средствами. Назначают каптоприл внутрь в таблетках, начиная с дозы 0,025 г 2—3 раза в день, но если снижение артериального давления происходит медленно, дозу увеличивают до 0,05 г (2 таблетки). При гипертонических кризах препарат по 1 таблетке можно применять сублингвально. Однако при применении препарата, особенно в начальный период, необходим строгий врачебный контроль. Каптоприл обычно хорошо переносится больными, но иногда у них может развиваться тахикардия, головокружение, потеря аппетита и кожные аллергические проявления.

Применение каптоприла противопоказано при беременности, кормлении грудью, лейко- и тромбопении. Выпускают Каптоприл в таблетках по 0,025 г в упаковке по 40 штук. **ЭНАЛАПРИЛ** (Enalaprilum), синонимы: Энап, Ренитек, по химической структуре и фармакологическому действию близок к Каптоприлу. Представляет собой своеобразный «полуфабрикат», который в организме гидролизруется в эналаприлат, блокирующий АЛФ. Применяют эналаприл для лечения артериальной гипертонии и сердечной недостаточности, при этом он может использоваться самостоятельно и в комплексе с другими гипотензивными средствами. Для лечения гипертонической болезни дозу эналаприла подбирают индивидуально, начиная с однократного применения таблеток по 0,0025 г (2,5 мг) до 4 раз в день с последующим (если необходимо) повышением дозы препарата до 10—20 мг. При применении эналаприла возможны головные боли, гипотония, аллергические реакции, он противопоказан при тяжелых поражениях почек, печени, беременности и т.д. Выпускают эналаприл в таблетках по 0,0025; 0,005 и 0,01 г № 20. Список Б. **ЛИЗИНОПРИЛ** (Lisinopril) по структуре близок к эналаприлу, но оказывает более длительное (до 36 часов) антигипертензивное действие. Показания и противопоказания и меры предосторожности такие же, как у каптоприла и эналаприла. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,0025 г (2,5 мг) до 4 раз в сутки. Выпускают лизиноприл в таблетках по 0,0025; 0,005 и 0,01 г. Список Б. 3.7. Диуретические средства

Под влиянием диуретических средств увеличивается процесс образования и выделения мочи из организма, вследствие чего снижается объем плазмы крови в сосудах и падает артериальное давление. Таким действием обладают антагонисты альдостерона, тиазидные, калийсберегающие и другие диуретики. **ВЕРОШПИРОН** (Verospironum), синоним: спиронолактон, — стероидный препарат, являющийся антагонистом гормона альдостерона, который повышает процесс реабсорбции первичной мочи. Верошпирон тормозит этот процесс, увеличивает выделение из организма ионов натрия и воды, сохраняя в нем ионы калия, что благотворно сказывается на работе сердца и величине артериального давления. Используют Верошпирон при отеках, вызванных сердечнососудистой недостаточностью, при асцитах на фоне цирроза печени и в комплексной терапии гипертонической болезни. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,025 г 4 раза в сутки, а в ряде случаев суточную дозу увеличивают до 0,3 г. Не следует применять Верошпирон при острой почечной недостаточности, а среди побочных эффектов иногда наблюдается сонливость,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	128стр. из 164

головокружение, гипонатриемия и гиперкалиемия. Выпускают Верошпирон в таблетках по 0,025 г № 20. Список Б. Подобным образом для лечения гипертензии используются препараты дихлотиазид (гипотиазид), Фуросемид, Диакарб и др. (Подробнее см. тему «Мочегонные (диуретические) средства».)

Итак, изучив тему «Гипотензивные средства», можно сделать вывод, что лучше всего лечить гипертоническую болезнь комплексными препаратами, влияющими одновременно на различные отделы нервной системы, гладкие мышцы, на процесс образования мочи, блокаду АПФ и т.д. К ним относятся Адельфан, Трирезид-К, Кристепин и др. Все они назначаются внутрь по 1 таблетке до 4 раз в день для лечения гипертонической болезни 2-й и 3-й стадии и симптоматической артериальной гипертензии.

4. Средства для лечения ишемической болезни сердца Ишемия — это местное малокровие, которое может быть вызвано закупоркой или сужением артерии, питающей орган. В результате этого нарушается его кровоснабжение, он не получает в необходимом количестве питание, кислород, энергию, что отрицательно сказывается на его деятельности. Особенно в подобных случаях страдает постоянно работающее сердце, спазм или закупорка сосудов которого способствует развитию ишемической болезни сердца (ИБС). Недостаточность кровообращения сердца сопровождается болями за грудиной, иррадиирующей в левую лопатку, левое плечо и руку, реже в нижнюю челюсть. Это состояние носит название стенокардии. При длительном нарушении кровоснабжения сердца развивается некроз участка сердечной мышцы, или инфаркт миокарда.

Для лечения ишемической болезни сердца используют средства, которые в зависимости от показаний делят: 1) на средства для лечения стенокардии, или антиангинальные средства; 2) средства для лечения инфаркта миокарда.

4.1. Средства для лечения и профилактики стенокардии (антиангинальные) Поскольку в основе стенокардии лежит недостаточность кровообращения, острая кислородная недостаточность, развивающаяся на фоне спазмов сосудов сердца, то для прекращения или профилактики ее приступов используют лекарственные средства, улучшающие коронарный кровоток, снижающие нагрузку на миокард, потребность сердца в кислороде и улучшающие процессы обмена веществ. К средствам, применяемым при стенокардии, относятся препараты группы нитроглицерина, блокаторы кальциевых каналов, спазмолитики миотропного действия и др. Главная задача применения анти-ангинальных средств сводится к тому, чтобы не допустить развития инфаркта миокарда. Для купирования острых приступов стенокардии чаще всего используют НИТРОГЛИЦЕРИН (Nitroglycerinum), который относится к числу наиболее эффективных, быстродействующих антиан-гинальных средств. Его таблетки по 0,0005 г, капсулы, содержащие 0,0005 или 0,001 г масляного раствора, помещают под язык. При таком введении препарат быстро всасывается, эффект развивается через 1—2 минуты и продолжается 20—40 минут. Подобный эффект развивается при использовании нитроглицерина в форме спрея, когда в случаях оказания срочной помощи препарат впрыскивают под язык или в полость рта. Ценность нитроглицерина состоит в том, что он приспособливает работу сердца к условиям ишемии. Он уменьшает приток к сердцу венозной крови и одновременно снижает артериальное давление, оказывая прямое миотропное коронарорасширяющее действие, уменьшает при этом преднагрузку на сердце. Под действием нитроглицерина снижается и постнагрузка, когда расширение артерий облегчает выброс в них крови из сердца. Все это улучшает работу сердца: снижает потребление им кислорода, вызывает увеличение скорости кровотока и обмена веществ, что приводит к устранению ишемии и болевого синдрома.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	129стр. из 164	

Существенным недостатком нитроглицерина является кратковременность его действия, а частое применение препарата приводит к привыканию и снижению эффекта. При использовании нитроглицерина возможны побочные эффекты, из которых два заслуживают определенного внимания, что следует учитывать при назначении препарата. Во-первых, нитроглицерин часто вызывает сильные головные боли, головокружение, шум в ушах, что объясняют его способностью расширять сосуды мозга и повышать внутричерепное давление. Во-вторых, нитроглицерин может резко снижать артериальное давление, если пациент находится в положении стоя, и вызывать коллапс, особенно при передозировке препарата, поэтому рекомендуют применять препараты нитроглицерина при купировании приступа стенокардии в положении сидя. Однако необходимо помнить, что даже при таких побочных эффектах отменять прием препаратов нитроглицерина не следует из-за возможного развития инфаркта миокарда. Противопоказанием к применению нитроглицерина служат глаукома, повышенное внутричерепное давление, нарушение мозгового кровообращения и острый период инфаркта миокарда. Выпускают нитроглицерин в таблетках по 0,0005 г № 40, капсулах в форме 1% масляного раствора № 20 с содержанием нитроглицерина в одной капсуле 0,0005 и 0,001 г и в форме спрея. Особую лекарственную форму представляет ТРИНИТРОЛОНГ (Trininrolongum). Его выпускают в форме небольших полимерных пластинок, которые прижимаются к нижней десне и рассасываются. Препарат хорошо всасывается и оказывает быстрое и продолжительное действие, поэтому он может быть использован для купирования и профилактики приступов стенокардии. Действие Тринитролонга длится до 4 часов, а при необходимости прекратить действие препарата раньше пластинку удаляют. Использовать пластинку рекомендуют после приема пищи. Выпускают Тринитролонг в упаковке по 50 пластинок, содержащих по 0,001 и 0,002 г разного цвета. Для системной профилактики и лечения хронической стенокардии используют препараты нитроглицерина пролонгированного действия. Среди них наиболее известны Сустак, Нитронг, Нитросорбид и др. Сустак и Нитронг в форме таблеток принимают внутрь 2—3 раза в день. Специальная структура таблеток, состоящая из микрокапсул, позволяет содержащемуся в них нитроглицерину постепенно переходить в свободное состояние и оказывать свое действие. Этим обеспечивается эффект Сустака и подобных ему препаратов до 4—8 часов. Выпускают Сустак в двух формах: Tabulettae Sustac-mite по 0,0026 г и Tabulettae Sustac-forte по 0,064 г в упаковках по 25 штук. В аналогичных лекарственных формах и дозах выпускают Нитронг. НИТРОСОРБИД (Nitrosorbidum) оказывает антиангинальное действие в течение 3—5 часов и сравнительно медленно всасывается из желудочно-кишечного тракта. Применяют препарат внутрь в таблетках по 0,005—0,01 г 2—3 раза в день для предупреждения приступов стенокардии и при спазмах периферических сосудов. Побочные эффекты выражаются в виде головокружения, головной боли, тошноты и шума в ушах. Выпускают нитросорбид в таблетках по 0,01 г № 25. Список Б. КАРДИКЕТ-РЕТАРД (Kardicet) снижает потребность миокарда в кислороде за счет уменьшения преднагрузки и постнагрузки, оказывает прямое коронарорасширяющее действие. Применяют для профилактики приступов стенокардии, легочной гипертензии, в комплексной терапии инфаркта миокарда в восстановительный период. Дозы препарата устанавливаются индивидуально в зависимости от стадии и характера заболевания. Назначают препарат в таблетках «Ретард» по 0,02 г 2—3 раза в сутки, по 0,04 г 2 раза в сутки, а в дозе 0,06 г 1, реже — 2 раза в сутки. Капсулы ретард по 0,12 г рекомендуют назначать 1 раз в сутки, предпочтительнее утром. Побочные эффекты в виде головной боли, снижения артериального давления, тошноты, рвоты и эритемы проявляются не всегда.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	130стр. из 164	

Выпускают Кардикет-ретард в таблетках по 0,02; 0,04 и 0,06 г № 50 и № 100; капсулы ретард — по 0,12 г № 20 и № 50. Кроме препаратов группы нитроглицерина для лечения и профилактики приступов стенокардии используют р-блокаторы (Анаприлин, метопролол), которые не расширяют сосуды сердца, но урежают сердечные сокращения и значительно снижают потребность миокарда в кислороде. Однако при постоянном их применении отмена препаратов должна проходить постепенно из-за возможного обострения сердечной недостаточности. АМИОДАРОН (Amiodaronum) оказывает противоаритмическое и антиангинальное действие, урежает и ослабляет сокращения сердца, снижает потребление миокардом кислорода, уменьшает сопротивление коронарных сосудов и увеличивает коронарный кровоток. При приеме внутрь всасывается медленно, но и также медленно выводится из него, что обеспечивает его длительное действие, хотя подобные свойства не исключают возможности кумуляции препарата. Как антиангинальное средство амиодарон назначают при хроническом течении ишемической болезни сердца с синдромом стенокардии, а как противоаритмическое средство — при различных формах тахикардии, экстрасистолии и при застойной сердечной недостаточности. Применяют амиодарон внутрь в таблетках по 0,2 г 2—3 раза в день, а через некоторое время дозу снижают и переходят на поддерживающую терапию. Амиодарон противопоказан при брадикардии, беременности и при кормлении ребенка грудью. Осторожно назначают препарат больным с бронхиальной астмой. Выпускают амиодарон в таблетках по 0,2 г и в виде 5% раствора в ампулах по 3 мл. Блокаторы кальциевых каналцев (верапамил, фенигидин) затрудняют вход ионов кальция через мембраны клеток мышечных волокон сердца и кровеносных сосудов. Это вызывает расширение сосудов, улучшение коронарного кровотока, урежение работы сердца и снижает потребность его в кислороде. Препараты этой группы используют для профилактики приступов стенокардии и для лечения гипертонической болезни. Блокаторы кальциевых каналцев противопоказаны при сердечной недостаточности, гипотонии, нарушениях атриовентрикулярной проводимости. Их не рекомендуют применять вместе с р-адреноблокаторами из-за возможного усиления побочных эффектов. Для профилактики и лечения стенокардии иногда используют миотропные коронарорасширяющие средства. Нередко их используют в случаях, когда коронарная недостаточность развивается вследствие спазмов сосудов сердца. К ним относятся известные препараты папаверина гидрохлорид, дротверина гидрохлорид, дилтиазем (Курантил) и др. Дилтиазем, кроме того, тормозит агрегацию тромбоцитов и препятствует образованию тромбов, что немаловажно в лечении и профилактике ишемической болезни сердца.

4.2. Средства, применяемые при инфаркте миокарда
 Инфаркт миокарда — некроз участка сердечной мышцы, развивающийся вследствие резкого нарушения в ней кровотока. Причиной его может быть тромбоз, длительный спазм коронарных сосудов, атеросклероз сосудов сердца и т.д. Основными симптомами инфаркта миокарда являются сильная боль в левой части груди, особенно в области сердца, сердечная недостаточность, аритмия и снижение артериального давления. Возможно развитие кардиогенного шока и появление у больного чувства страха за свою жизнь. Больные с диагнозом «инфаркт миокарда» обязательно подлежат госпитализации, где для купирования острого состояния применяется интенсивная терапия. Многообразие симптомов заболевания определяет необходимость назначения различных лекарственных средств из целого ряда фармакологических групп. Сильную боль при инфаркте миокарда купируют с помощью наркотических анальгетиков (морфин, омнопон) или применением нейроролептанальгезии, когда в вену одновременно вводят наркотический анальгетик фентанил и нейроролептик

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	131стр. из 164	

дроперидол (комбинированный препарат Таламонал). Таким образом, вместе с устранением чувства боли у пациента исчезает чувство страха за свою жизнь и появляется «симптом надежды» на благополучный исход заболевания и возвращение к нормальной жизни. Среди противоаритмических средств при инфаркте миокарда чаще используют лидокаин или новокаинамид. Предпочтение в большинстве случаев отдают лидокаину, так как он почти не влияет на сократимость миокарда и не нарушает прохождение импульсов по проводящей системе сердца. В случае развития острой сердечной недостаточности немедленно вводят в вену сердечные гликозиды быстрого действия — строфантин или коргликон. При падении артериального давления вводят мезатон или норадrenalин (в вену). Раствор адреналина гидрохлорида при инфаркте противопоказан, так как повышает автоматизм сердечной мышцы, способствует развитию аритмии, увеличивает потребность миокарда в кислороде, что в совокупности может ухудшить состояние больного из-за углубления коронарной недостаточности. Учитывая, что одной из причин инфаркта миокарда является тромбоз, т.е. закупорка коронарной артерии тромбом, в комплекс лечебных мероприятий включают вещества, препятствующие свертыванию крови, и прежде всего гепарин, а для растворения свежего тромба используют фибринолитические вещества.

5. Средства, влияющие на кровообращение мозга В настоящее время ведущими и относительно избирательно действующими на сосуды мозга являются препараты циннаризин, Кавинтон, нимодипин, Винпоцетин и др. ЦИННАРИЗИН (Cinnarizine) оказывает непосредственное спазмолитическое действие на кровеносные сосуды, снижая их реакцию на ангиотензин-2 и другие сосудосуживающие вещества. Одновременно он блокирует кальциевые каналы клеточных мембран, препятствуя поступлению ионов кальция в клетки. Применяют циннаризин при нарушениях мозгового кровообращения на фоне спазмов сосудов, атеросклероза, перенесенных черепно мозговых травм, инсульта и при мигрени. Препарат улучшает деятельность мозга, общее состояние, устраняет головную боль, шум в ушах ит.д. Назначают циннаризин внутрь в таблетках до 3 раз в день. Препарат не следует применять при беременности и кормлении ребенка грудью. Выпускают циннаризин в таблетках по 0,025 г. Список Б. КАВИНТОН (Cavinton) — действует непосредственно на гладкие мышцы, расширяет сосуды мозга, улучшает кровоток, снабжение мозга кислородом, способствует утилизации глюкозы. Используют препарат при неврологических и психических нарушениях, связанных с расстройством кровообращения (после инсульта, черепно мозговой травмы), при расстройстве памяти. Назначают Кавинтон по 1—2 таблетки на прием до 3 раз в день. Курс лечения составляет 2 и более месяцев. Кавинтон не рекомендуют применять при беременности, тяжелых формах ИБС, а в виде инъекций он несовместим с гепарином. Выпускают Кавинтон в таблетках по 0,005 г и в виде 0,5% раствора в ампулах по 2 мл для внутривенного капельного введения. Улучшают кровообращение, повышают обеспечение кислородом и усиливают метаболические процессы в области мозга препараты различных фармакологических групп. Большинство из них расширяют не только сосуды мозга, но и другие сосуды. Например, расширяют сосуды мозга нитроглицерин и его производные, слабее это делают производные пурина (кофеин, Теобромин). Относительно кратковременное сосудорасширяющее действие оказывает никотиновая кислота и ее комплексные препараты Никоверин, Никошпан и др.

Улучшают мозговое кровообращение блокаторы кальциевых каналов, спазмолитические средства (папаверин), а производные гамма-аминомасляной кислоты (Аминолон) и

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	132стр. из 164	

ноотропные средства улучшают не только кровообращение мозга, но и метаболические процессы в нем.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. Верно ли утверждение, что сердечные гликозиды применяют только при острой сердечной недостаточности?
2. Что лучше использовать для лечения и профилактики приступов стенокардии: нитроглицерин или Сустан?
3. Можно ли отменить нитроглицерин при остром приступе стенокардии, если у больного он вызывает сильную головную боль?
4. Правильно ли утверждение, что при гипертонии Клофелин следует отменять постепенно? Если да, то почему?
5. Необходимо ли использовать противоаритмические средства при инфаркте миокарда?
6. Празозин, Клофелин, дибазол, магния сульфат, фуросемид, каптоприл, Энап — какие из этих препаратов можно использовать для купирования гипертонического криза?
7. Почему при внутривенном введении фуросемида артериальное давление падает сравнительно быстро? Какой побочный эффект может развиваться при этом?
8. Правильно ли утверждение, что магния сульфат при приеме внутрь не снижает артериальное давление?
9. В каких случаях используют таблетки Аспаркам?
10. Возможно ли применение препаратов адониса в составе микстур, обладающих седативным действием?

1. Тема. Мочегонные средства. Лекарственные средства, влияющие на миоэпителий.

2. Цель. При изучении этого раздела следует обратить внимание на следующее.

1. Классификация мочегонных средств.
2. Механизм образования и выведения мочи из организма.
3. Роль различных солей (ионов натрия, калия, хлора и др.), фермента карбоангидразы, гормона альдостерона и других факторов, влияющих на процесс мочеобразования.
4. Фармакологические свойства отдельных групп мочегонных средств.
5. Показания и противопоказания к применению мочегонных средств.
6. Особенности применения мочегонных средств в зависимости от характера заболевания.
7. Побочные эффекты, возникающие при применении мочегонных средств и возможные способы их устранения.

3. Тезисы лекции.

Диуретическими, или мочегонными, называют средства, увеличивающие образование и выведение из организма вторичной мочи, снижающие содержание жидкости в его тканях, органах и полостях. При сердечной недостаточности, гипертонической болезни, заболеваниях печени (цирроз) и почек нередко происходит задержка воды в организме, в результате чего появляются отеки, повышается артериальное давление, накапливается жидкость в брюшной (асцит) или плевральной полостях. Основную роль в происхождении отеков и накоплении жидкости в полостях играют ионы натрия, избыточное содержание которых и приводит к задержке воды в организме.

Почки имеют сложную структуру, основу которой составляет нефрон, состоящий из сосудистого клубочка и канальцевого аппарата, между которыми находится капсула Шумлянского — Боумана. Через капилляры сосудистого клубочка в капсулу фильтруется

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	133стр. из 164	

плазма крови, которая затем поступает в почечные каналцы (проксимальные и дистальные), где и происходят основные мочеобразующие процессы: канальцевая реабсорбция и образование вторичной мочи. Количество фильтрата в сутки составляет 150—200 л. Поступивший в почечные каналцы фильтрат всасывается (реабсорбируется) обратно, а оставшаяся после реабсорбции жидкость (около 1%) образует вторичную мочу (1,5—2 л), которая выделяется наружу. Таким образом, задержка реабсорбции всего на 1% увеличивает количество выделяемой мочи в 2 раза, а увеличение на 2% — в 3 раза и т.д. В процессе реабсорбции в почечных каналцах принимают участие различные ферменты (карбоангидраза и др.), гормоны (альдостерон) и др. Объем реабсорбции зависит от скорости и количества всасывания ионов натрия, хлора, калия и угольной кислоты. Диуретические средства оказывают на почки специфическое действие и способны увеличивать мочеотделение против нормы в 3—4 раза. В большинстве своем эти вещества снижают обратное всасывание ионов натрия, хлора, воды и улучшают функции многих органов и тканей. Диуретические средства используют при заболеваниях, сопровождающихся задержкой жидкости в организме, при сердечной недостаточности, хронической недостаточности кровообращения, циррозе печени, гипертонической болезни, глаукоме, нефропатическом синдроме, а также при отравлениях, когда возникает необходимость быстрого выведения яда из организма через почки. Все мочегонные средства оказывают различное по силе и продолжительности действие, которое в конечном итоге сводится к снижению процесса реабсорбции и увеличению процесса образования вторичной мочи. В зависимости от механизма действия, химической природы диуретические средства делят на три основные группы: 1) салуретики; 2) калийсберегающие диуретики; 3) осмотические диуретики.

САЛУРЕТИКИ

Салуретиками называют мочегонные средства, в действии которых главным является выведение из организма солей, в основном натрия хлорида, и воды. Группа салуретиков включает в себя вещества с различной химической структурой и механизмами действия. Наиболее активными и часто применяемыми являются дихлотиазид (Гипотиазид), фуросемид (Лазикс), кислота этакриновая, диакарб и др. ДИХЛОТИАЗИД (*Dichlothiazidum*), синоним: Гипотиазид, — диуретическое средство из группы тиазидов. Он снижает реабсорбцию ионов натрия, хлора, калия, угольной кислоты и т.д. Повышенное против нормы выведение указанных ионов из организма способствует снижению отеков, артериального давления, улучшению функций внутренних органов. Своеобразие действия дихлотиазида заключается в том, что он уменьшает выведение из организма ионов кальция и снижает диурез при несахарном диабете. Назначают дихлотиазид внутрь в таблетках по 0,1 г 1 раз в день утром натощак. После этого действие препарата развивается через 1 — 1,5 часа и продолжается до 12 часов. При лечении гипертонии и для профилактики отеков дихлотиазид применяют в таблетках в дозе 0,025 г во время или после еды до 3 раз в день. Продолжительность курса лечения дихлотиазидом составляет от 3 до 7 дней, что зависит от тяжести заболевания и цели, поставленной перед собой медицинским работником. Дихлотиазид хорошо переносится больными, но при длительном применении вследствие выведения из организма ионов калия вызывает гипокалиемию и жалобы пациента на частое сердцебиение (тахикардия). Этому же способствует избыточное количество ионов кальция, выведение которых тормозит препарат. В связи с этим лечение дихлотиазидом желательно проводить на фоне диеты, богатой калием (картофель, бобы, бананы), а при первых признаках гипокалиемии включать в курс лечения препараты калия (калия хлорид, таблетки «Аспаркам» и др.). Дихлотиазид противопоказан при тяжелой

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	134стр. из 164

почечной недостаточности, поражениях почек, тяжелых формах сахарного диабета и подагры. Выпускают дихлотиазид в таблетках по 0,025 и 0,1 г. Список Б. ФУРОСЕМИД (Furosemidum), синоним: Лазикс, имеет иную, чем дихлотиазид, химическую структуру и относится к числу сильнейших диуретиков. Его действие проявляется как при пероральном, так и при парентеральном введении. Эффект после введения внутрь развивается в течение первого часа, а при внутривенном введении — через несколько минут и продолжается до 4 часов. Мочегонное действие Фуросемида подобно дихлотиазиду и основано на ускоренном выведении из организма ионов натрия, хлора и калия. Благодаря способности расширять периферические сосуды и повышать диурез препарат обладает гипотензивным действием. Фуросемид используют для устранения отеков, лечения гипертонии и особенно при отравлениях. Препарат относят к числу лучших диуретиков экстренного действия и применения, когда необходимо срочно устранить отек мозга, легких или через почки вывести яд из организма (форсированный диурез). При использовании Фуросемида также возможна гипокалиемия и на ее фоне — возникновение тахикардии, поэтому одновременно с ним назначают препараты калия (калия оротат). Не следует назначать Фуросемид при непроходимости мочевыводящих путей, гипокалиемии, в первой половине беременности и т.д. Выпускают Фуросемид в таблетках по 0,04 г № 50 и в виде 1% раствора в ампулах по 2 мл для введения в мышцу или в вену. Список Б.

Калий является одним из основных клеточных ионов, играющих важную роль в поддержании изотоничности клеток, передаче импульсов, в регуляции важных функций различных органов, в том числе и сердца. Повышение содержания калия в сердечной мышце снижает проводимость и возбудимость миокарда, урежает сердечный ритм. Снижение содержания калия в сыворотке крови повышает опасность развития аритмии и других отрицательных симптомов, поэтому использование фуросемида и аналогичных ему препаратов, вызывающих гипокалиемию, проводят на фоне диеты, богатой калием. Калийсберегающие диуретики повышают выделение ионов натрия и снижают выведение ионов калия. Эти препараты действуют в области дистальных канальцев, где обмениваются ионы натрия и калия. Ценность калийсберегающих диуретиков заключается в том, что, увеличивая диурез, снижая артериальное давление, они почти не вызывают изменений в работе сердца и других органов, что особенно важно для лиц пожилого возраста, у которых целый ряд сердечно-сосудистых заболеваний (стенокардия, гипертония) сопровождаются тахикардией.

К этой группе препаратов относятся спиронолактон (Верошпирон), триамтерен, амилорид и другие препараты, отличающиеся друг от друга по химической структуре и механизму действия. ВЕРОШПИРОН (Verospironum), синоним: спиронолактон, — его диуретический эффект основан на конкурентном антагонизме с гормоном коры надпочечников альдостероном. Последний повышает реабсорбцию солей и воды в почечных канальцах и снижает количество выделяемой из организма вторичной мочи. Веришпирон, наоборот, повышает выведение из организма ионов натрия и воды, но резко снижает выведение ионов калия. Используют спиронолактон как мочегонное средство при отеках, связанных с нарушением сердечной деятельности, при асцитах, развивающихся на фоне цирроза печени, отеках иного происхождения и при гипертонической болезни. Диуретический эффект препарата развивается постепенно, обычно в полной мере проявляется на 2—5-й день, при этом количество выделяемой мочи увеличивается, но по сравнению с нормой незначительно, что позволяет медленно, без резких перепадов снижать артериальное давление. Для ускорения и усиления мочегонного эффекта его иногда комбинируют с препаратами других групп (фуросемид). Подобные комбинации снижают возможность развития

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	135стр. из 164	

гипокалиемии. Не рекомендуют применять Верошпирон в первые 3 месяца беременности и при острой сердечной недостаточности. Выпускают препарат в таблетках по 0,025 г № 20. Список Б. ТРИАМТЕРЕН (Triamterenum) снижает реабсорбцию ионов натрия и воды, увеличивает их выделение с мочой без выведения ионов калия. Препарат способен устранять гипокалиемию, вызванную применением дихлотиазида и фуросемида, усиливая их диуретический эффект. Используют триамтерен при отеках, связанных с недостаточностью кровообращения, циррозе печени, нефротическом синдроме и т.д. Его можно применять в комплексном лечении вместе с другими мочегонными средствами. Назначают препарат внутрь по 0,05—0,2 г 1—2 раза в сутки после завтрака и обеда. Диуретический эффект в этом случае развивается через 15—20 минут и удерживается до 8—12 часов. Триамтерен входит в состав комплексных препаратов, например Триампур композитум и Триамтезид, где его сочетают с дихлотиазидом. Выпускают триамтерен в желатиновых капсулах по 0,05 г. Список Б.

Осмотические диуретики используют в основном для дегидратирующей терапии отеков мозга и легких. Их действие основано на том, что после введения в вену их гипертонических растворов они создают высокое осмотическое давление в сосудах и способствуют переходу жидкости из тканей в кровяное русло, чем вызывают обезвоживание (дегидратация) тканей и таким образом устраняют отеки. Препараты этой группы в организме не всасываются и, попадая вместе с плазмой крови в почечные каналы, также создают там высокое осмотическое давление, вследствие чего снижается реабсорбция и увеличивается объем выделяемой мочи. Основными представителями осмотических диуретиков являются маннит и мочевины для инъекций. МАННИТ (Mannitum) — гипертонические растворы его оказывают сильное мочегонное действие. Этот эффект обусловлен повышением осмотического давления плазмы крови, уменьшением реабсорбции воды и увеличением объема вторичной мочи и количества солей, выделяемых из организма. Применяют маннит в виде 15% раствора для снижения внутричерепного давления, устранения отеков мозга и легких, при острой почечной недостаточности и отравлениях. Вводят препарат в вену капельно из расчета 1—1,5 г сухого вещества на 1 кг массы тела больного. В случае передозировки препарата возможно обезвоживание организма, которое устраняется применением достаточного количества жидкости. Выпускают маннит в виде стерильного порошка для инъекций по 30 г во флаконах емкостью 500 мл и в виде 15% стерильного раствора во флаконах емкостью 200, 400 и 500 мл.

СРЕДСТВА, ПРЕПЯТСТВУЮЩИЕ ОБРАЗОВАНИЮ КОНКРЕМЕНТОВ И ОБЛЕГЧАЮЩИЕ ИХ ВЫВОД С МОЧОЙ

При нарушении обмена веществ, например мочевой кислоты, в результате инфекций мочевыводящих путей, изменения рН мочи, вследствие неправильного применения сульфаниламидных препаратов в почках, мочевом пузыре и мочевыводящих путях образуются мелкие конкременты (песок), а затем более крупные образования (камни). Таким образом развивается почечно- и мочекаменная болезнь. По химическому составу конкременты делят на фосфаты (соли фосфорной кислоты), ураты (соли мочевой кислоты), оксалаты (соли щавелевой кислоты) и карбонаты (соли угольной кислоты). Нередко встречаются конкременты смешанного типа, когда в их состав входят представители различных кислот. Эти конкременты могут мигрировать с «насиженных» мест и при определенных условиях вызывать сильные, приступообразные боли (колики), часто требующие оказания неотложной помощи и даже операции. Особую опасность представляют соли мочевой кислоты, которые при гиперурикемии (избыточное содержание мочевой кислоты в крови) способны откладываться не только в мочевых путях, но и в

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	136стр. из 164	

сосудах, суставах, позвоночнике, хрящевых и других тканях. Они вызывают выраженные изменения в виде уплотнения тканей, образования «шишек» в суставах, затрудняя их подвижность, и возникновение в этих местах болей и воспалений. Подобное заболевание носит название подагра и характеризуется постепенной утратой подвижности суставов, возникновением в них и позвоночнике резких болей при прикосновении к ним, во время ходьбы и наклонах, скрючиванием пальцев и образованием на них «шишек». В народе такое заболевание носит характерное название «отложение солей». Среди препаратов, уменьшающих образование конкрементов и облегчающих их выведение, различают несколько групп: 1) средства, предупреждающие образование мочевой кислоты и ее солей; 2) средства, снижающие реабсорбцию мочевой кислоты и ее солей; 3) средства, способствующие созданию в моче щелочной среды, растворению конкрементов и выведению их из организма; 4) препараты растительного происхождения, обладающие спазмолитическим, мочегонным, противовоспалительным действием и облегчающие выведение мелких камней. К числу препаратов этой группы относятся аллопуринол, этамид, блемарен, препараты растений — толокнянки, брусники, кукурузы (рыльца), хвоща полевого, можжевельника (плоды), горца птичьего (спорыш, трава), марены красильной (трава) и др. АЛЛОПУРИНОЛ (Allopurinolum) — антиподагрическое средство. Обладает способностью инактивировать фермент ксантиноксидазу, участвующий в синтезе мочевой кислоты, при этом количество последней и ее солей в организме резко снижается, чем предупреждается их отложение в органах (почках) и тканях. Используют аллопуринол для лечения подагры, почечнокаменной и мочекаменной болезней, для лечения и профилактики заболеваний, вызванных повышенным содержанием мочевой кислоты в крови (гиперурикемия). Назначают аллопуринол внутрь после еды по 1 таблетке до 4 раз в день. Курс лечения довольно продолжительный и зависит от характера заболевания. Аллопуринол хорошо переносится больными, но иногда в начале лечения болезни возникает ее обострение, временное расстройство кишечника, появляется кожная сыпь и лихорадка. В процессе дальнейшего лечения эти симптомы постепенно исчезают.

Выпускают аллопуринол в таблетках по 0,1 г. Список Б. ЭТАМИД (Aethamidum) в отличие от аллопуринола тормозит реабсорбцию мочевой кислоты и ее солей в почечных канальцах и способствует выведению ее с мочой из организма. Одновременно снижается концентрация мочевой кислоты в крови. Применяют этамид при подагре, полиартритах, мочекаменной болезни и других состояниях, сопровождающихся накоплением в организме мочевой кислоты. Назначают этамид внутрь по 1—2 таблетки до 4 раз в день после еды в течение 10—12 дней, а после недельного перерыва курс лечения повторяют. Выпускают этамид в таблетках по 0,35 г № 50. БЛЕМАРЕН (Blemaren) — комбинированный препарат, в состав которого входят кислота лимонная, калия гидрокарбонат и натрий лимоннокислый. Препарат способствует нейтрализации мочи и поддержанию рН на уровне 6,5—6,8, что создает хорошие условия для растворения отложений мочевой кислоты и ее солей, предотвращая образование новых мочекислых камней. Препарат выпускается в упаковке по 200 г в виде гранул с приложением ложки-дозатора. Принимают препарат 2—3 раза в сутки по 2 измерительные ложки гранулята с водой. Кроме указанных для лечения подагры и мочекаменной болезни используют препараты магурлит, уродан, цистенал, фитолизин, уролесан и др.

Средства, влияющие на мускулатуру матки

Данная тема посвящена лекарственным средствам, используемым в акушерской и гинекологической практике. В ней рассматриваются препараты, отвечающие за течение

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	137стр. из 164	

беременности, предупреждение ранних родов (выкидыш) и стимулирующие нормальные роды. Актуальность темы заключается в том, что демографическая обстановка, к сожалению, не всегда отвечает требованиям современности, поэтому здоровье матери и ребенка является важной задачей в решении проблемы роста населения страны.

Цель. При изучении данной темы особое внимание следует обратить на следующее.

1. Классификация средств, влияющих на мускулатуру матки.
2. Понятия «ритмические сокращения мышц матки», «тонические сокращения мышц матки», «токолитики».
3. Механизм влияния препаратов на мускулатуру матки.
4. Роль окситоцина и его аналогов в родовспоможении.
5. Условия применения и особенности введения препаратов этой группы.
6. Особенности действия и применения препаратов из группы простагландинов.
7. Особенности действия и применения препаратов спорыньи и ее аналогов.
8. Значение токолитиков в течении беременности.
9. Необходимость использования кровоостанавливающих средств в акушерской и гинекологической практике.

Маточные средства по своему влиянию на сократительную активность миометрия делят на три группы: 1) средства, стимулирующие мускулатуру матки и вызывающие ее ритмические сокращения (родовспомогательные средства); 2) средства, стимулирующие мускулатуру матки, но вызывающие ее тонические сокращения (послеродовые средства); 3) токолитики, или средства, расслабляющие мускулатуру матки. К средствам, стимулирующим мускулатуру матки и вызывающим ритмические ее сокращения, относятся гормональные препараты задней доли гипофиза (препараты окситоцина) и препараты простагландинов. Их называют родовспомогательными и используют в акушерской практике для стимуляции родов, а при необходимости — для раннего прерывания беременности (аборт).

1. Средства, вызывающие ритмические сокращения матки 1.1. Препараты группы окситоцина **ОКСИТОЦИН** (Oxytocinum) — гормональный препарат задней доли гипофиза, вызывает сильные ритмические сокращения мышц матки, особенно в конце беременности, и способствует более быстрому продвижению плода по родовым путям. Как родовспомогательное средство окситоцин вводят в мышцу или в вену, но обязательно (!) при открытой шейке матки. Несоблюдение последнего условия может вызывать гипоксию и гибель плода. Окситоцин применяют для стимуляции родов при их задержке или слабой родовой активности и атонии матки, при раннем отхождении околоплодных вод и с целью предупреждения маточных кровотечений. Наиболее эффективен окситоцин при внутривенном капельном введении, для чего 1 мл препарата разводят в 500 мл изотонического 5% раствора глюкозы. Препарат противопоказан при несоответствии таза и размеров плода, его поперечном предлежании, угрожающем разрывом матки. Выпускают окситоцин в ампулах по 1 мл (5 ЕД). Список Б. **ПИТУИТРИН** для инъекций (Pituitrinum pro injectionibus) — гормональный препарат задней доли гипофиза, представляющий собой ее экстракт, основу которого составляют гормоны окситоцин и вазопрессин. Первый вызывает ритмические сокращения мускулатуры матки, второй — повышает реабсорбцию воды и солей в почечных канальцах, одновременно повышая артериальное давление. Именно поэтому питуитрин противопоказан роженицам с гипертонией. Используют питуитрин для возбуждения и усиления сократительной активности матки как родовспомогательное средство роженицам с низким артериальным давлением, гипотоническими кровотечениями и с целью создания условий обратного развития матки (инвалюция) в послеродовый

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	138стр. из 164	

период. Вводят питуитрин в мышцу или под кожу по 0,5—1 мл в зависимости от характера течения родов. Непременным условием введения питуитрина при родовспоможении является открытая шейка матки. Выпускают питуитрин в ампулах по 1 мл (5 ЕД). Список Б.

ГИФОТОЦИН (Hyphotocinum) — очищенный экстракт задней доли гипофиза, по действию близок к окситоцину и почти не содержит вазопрессина. Применяют гифотоцин при слабой родовой деятельности, переносимой беременности, гипотонических маточных кровотечениях, для нормальной инволюции матки после родов или аборта. Вводят гифотоцин в мышцу и в вену. В последнем случае 1 мл препарата разводят в 500 мл 5% раствора глюкозы и вводят капельно. Противопоказан гифотоцин в тех же случаях, что и окситоцин. Выпускают гифотоцин в ампулах по 1 мл (5 ЕД). Список Б. 1.2. Препараты простагландинов Простагландины — высокоактивные биологические вещества из класса ненасыщенных жирных кислот. Основными свойствами некоторых из них, особенно простагландинов E2- и P2-альфа, является способность стимулировать сократительную активность мускулатуры матки. В отличие от препаратов группы окситоцина, которые возбуждают мускулатуру матки преимущественно в конце беременности, простагландины действуют на матку на протяжении всей беременности, одновременно способствуя открытию шейки матки, чего самостоятельно не делают окситоцин и его аналоги. Препараты простагландинов применяют для стимуляции родов, возбуждения и стимуляции сократительной активности матки в различные периоды беременности, для ее искусственного прерывания (аборт) по медицинским показаниям. Простагландины вводят в вену, экстраамниально (снаружи оболочек плода), интраамниально и интравагинально. Путь введения и дозу препарата выбирают в зависимости от показаний и переносимости препарата. Например, с целью прерывания беременности в сроки до 15 недель рекомендуют экстраамниальное введение препаратов, а после 15 недель — интраамниальное. Желательно препараты простагландинов использовать в условиях стационара, так как при их введении нередко возникают побочные эффекты в виде тошноты, рвоты, бронхоспазма, а при внутривенном введении — повышение температуры, раздражение и воспаление вен (флебиты). Основными представителями препаратов группы простагландинов являются динопрост, динопростон, простенон и др. ДИНОПРОСТ (Dinoprost), синоним: Простин P2-альфа, — лекарственная форма простагландина P2-альфа, одного из основных представителей этой группы, используемых в акушерской практике. Он оказывает прямое стимулирующее действие на миометрий в любые сроки беременности и в независимости от степени открытия шейки матки. Показанием к применению препарата служат необходимость активации родовой деятельности или прерывания беременности. Для стимуляции родовой активности динопрост вводят в вену капельно, для чего 5 мг препарата разводят в 500 мл 5% раствора глюкозы или изотонического раствора натрия хлорида. При необходимости прерывания беременности препарат используют только по медицинским показаниям, главным образом в поздние сроки беременности (с 13-й по 25-ю неделю). Динопрост противопоказан при наличии рубцов в матке, анатомически узком тазе, эпилепсии, бронхиальной астме и ряде заболеваний сердечно-сосудистой системы и язвенном колите. Выпускают динопрост в ампулах, содержащих 1 и 5 мг препарата. ДИНОПРОСТАН (Dinoprostan), синоним: простагландин E2, подобен по действию предыдущему препарату, вызывает ритмические сокращения матки в любой период беременности. Используют препарат для стимуляции родов в конце беременности и при необходимости изгнания плода при его внутриутробной гибели, а также в случаях, когда показан аборт. Для стимуляции родов препарат назначают в таблетках по 0,5 мг через

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	139стр. из 164

каждый час до полного разрешения родов, но не более 1,5 мг в час, или используют его внутривенное капельное введение. Выпускают препарат в таблетках по 0,5 мг, в ампулах, содержащих по 1 и 5 мг сухого вещества, и в форме вагинального геля в специальных шприцах.

2. Средства, вызывающие тонические сокращения матки К этой группе относятся средства, стимулирующие мускулатуру матки, но в отличие от препаратов предыдущей группы вызывающие длительные, стойкие, тонические сокращения матки. Их используют только (!) в послеродовой период с целью остановки маточных кровотечений и ускоренного обратного развития матки после родов. Подобным действием обладают алкалоиды спорыньи (*Secale comutum*), некоторые синтетические средства и ряд препаратов, получаемых из лекарственных растений.

ЭРГОМЕТРИНА МАЛЕАТ (*Ergometrini maleas*) относится к числу наиболее сильных и быстродействующих алкалоидов спорыньи. Он на длительное время повышает тонус матки. Его применяют в акушерской практике при кровотечениях после родов, после ручного отделения последа, замедленной инволюции матки, при кровотечениях после кесарева сечения и аборта. Назначают препарат по 1—2 таблетки 2—3 раза в день или вводят в мышцу или в вену. В последнем случае наблюдается наиболее быстрый эффект.

ВНИМАНИЕ! Препарат противопоказан к применению во время беременности.

Выпускают препарат в таблетках по 0,0002 г и в ампулах по 1 мл 0,02% раствора. ЭРГОТАЛ (*Ergotalum*) представляет собой смесь фосфатов алкалоидов спорыньи. Он повышает тонус мышц матки, способствует быстрому обратному развитию ее после родов. Назначают эрготал внутрь в таблетках по 0,0005—0,001 г 2—3 раза в день или вводят под кожу и в мышцу по 0,5—1 мл 0,05% раствора. Выпускают эрготал в таблетках по 0,0005 и 0,001 г и в ампулах по 1 мл 0,05% раствора. Список Б. Подобным действием обладает эрготамина гидротартрат, но его эффект более продолжителен по сравнению с эргометрином. Его назначают для остановки маточных кровотечений, ускоренного обратного развития матки после аборта, атонии матки и т.д. Выпускают в таблетках по 0,001 г и в ампулах по 1 мл 0,05% раствора. КОТАРНИНА ХЛОРИД (*Cotarnini chloridum*) — синтетический аналог алкалоидов спорыньи. Подобно им оказывает тонизирующее действие на мускулатуру матки и используется при маточных кровотечениях, не связанных с менструальным циклом, а также для ускоренного обратного развития матки после родов и абортов. Применяют препарат внутрь в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,05 или 0,1 г в день. Выпускают котарнина хлорид в таблетках по 0,05 г № 20. Для остановки послеродовых маточных кровотечений нередко используют препараты лекарственных растений в форме настоев, отваров, настоек и экстрактов. Например, вызывать сокращения мускулатуры матки, суживать ее сосуды, останавливать кровотечения, сокращать время обратного развития матки способны настойки листьев барбариса обыкновенного, цветов арники горной, жидкие экстракты травы пастушьей сумки и водяного перца, настои и экстракты травы тысячелистника, отвар коры калины и др. Они широко применяются в акушерской и гинекологической практике.

3. Средства, расслабляющие мускулатуру матки (токолитики) Средства, расслабляющие мускулатуру матки, называют токолитами (от лат. *tocus* — роды и *lysis* — прекращаю). Их назначают в основном при угрозе раннего прерывания беременности, для предупреждения преждевременных родов и ослабления их при чрезвычайно бурной родовой активности. Для снижения тонуса и сократительной активности матки используют препараты различных фармакологических групп, среди которых р2-адреномиметические, седативные, гормональные и другие средства. Наиболее широкое применение в акушерско-

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	140стр. из 164	

гинекологической практике нашли р-блокирующие средства, которые кроме расслабления мышц матки улучшают маточно-плацентарное кровообращение, способствуя, таким образом, нормальному течению беременности и развитию плода. Основными представителями токолитиков из группы р-адреноми- метических средств являются Партусистен (фенотерол), сальбутарт (сальбутамол), ритодрин и др. ПАРТУСИСТЕН (Partusisten), синоним: фенотерол, — один из наиболее эффективных препаратов, предотвращающих преждевременные роды и не оказывающих отрицательного влияния на плод. Вводят Партусистен в вену и внутрь в форме таблеток. После внутривенного введения препарата отмечают уменьшение болей и ослабление напряжения мышц матки. Через некоторое время эти симптомы полностью исчезают, но даже после достижения положительного эффекта желательно продолжить применение препарата внутрь. Применяют Партусистен в стационаре (под тщательным наблюдением врача) в таблетках по 0,005 г каждые 2—3 часа или вводят в вену по 0,0005 г в 250—500 мл 5% раствора глюкозы капельно до полного прекращения сократительной активности матки.

Партусистен иногда вызывает побочные эффекты в виде тахикардии, снижения артериального давления, тремора рук, потливости и мышечной слабости. Выпускают Партусистен в таблетках по 0,005 г и в ампулах в виде стерильного порошка по 0,0005 г в упаковке по 5 ампул. САЛЬБУТАМОЛ (Salbutamolium) — препарат из группы р2-адреномиметиков средней продолжительности действия. Он оказывает токолитическое действие, снижает тонус и сократительную активность матки, устраняет угрозу преждевременных родов и применяется после операций на беременной матке. Его не следует применять в первые 3 месяца беременности, инфекциях родовых путей, внутриутробной гибели плода и т.д. Выпускают препарат как токолитическое средство в виде 0,1% раствора в ампулах по 1 мл № 10. За рубежом выпускается под названием «Сальбутарт». К группе токолитиков относятся гормональные препараты из группы гестагенов: прогестерон, оксипрогестерон, прегнин, Туринал и др. ПРОГЕСТЕРОН (Progesteronum) — гормон желтого тела или его синтетический аналог. Препарат используют при бесплодии, недоношенной беременности, маточных кровотечениях и аменорее. Главная задача гормона и его аналогов заключается в том, чтобы расслабить мышцы матки, обеспечить ее рост, создать условия для нормального течения беременности, развития плода и подготовки организма женщины к родам. Вводят прогестерон в виде масляного 1 и 2% растворов по 1 мл в течение 7 дней. При угрожающем выкидыше вводят по 1 мл 1 % масляного раствора ежедневно или через день до исчезновения симптомов, указывающих на возможность выкидыша. Выпускают прогестерон в ампулах по 1 мл 1 и 2% масляного раствора. Список Б.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Задание 1. Известно, что мочегонные средства делят на три основные группы. Исходя из первого задания определите, к какой группе относятся указанные препараты, и занесите их в таблицу Препараты: диакарб, Верошпирон, маннит, дихлотиазид, триамтерен, кислота этакриновая, мочевины для инъекций, клопамид, фуросемид.

Салуретики	Калийсберегающие диуретики	Осмотические диуретики

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии		044/41-19к
Лекционный комплекс		141стр. из 164

Задание 2. Решите, какие из указанных средств: 1) оказывают родовспомогательное действие;

2) предупреждают выкидыш;

3) способствуют инволюции матки в послеродовый период (эрготамин, питуитрин, партусистен, окситоцин, эрготал, котарнина хлорид, гифотоцин, динопрост, сальбутамол).

1. Тема. Средства, влияющие на дыхательную систему.

2. Цель. При изучении данной темы следует обратить особое внимание на следующее.

1. Классификация средств, влияющих на функции органов дыхания.

2. Особенности использования стимуляторов дыхания в зависимости от состояния пациента.

3. Классификация, особенности действия и применения противокашлевых средств.

4. Особенности действия и применения отхаркивающих средств, возможность совместного применения их с противокашлевыми средствами.

5. Различия в действиях отхаркивающих и муколитических средств.

6. Классификация, особенности действия и применения бронхолитических средств.

7. Особенности в действии и применении средств, устраняющих отек легких.

8. Характеристика основных лекарственных средств, оказывающих влияние на функции органов дыхания.

3. Тезисы лекции.

СТИМУЛЯТОРЫ ДЫХАНИЯ

Дыхание является одним из важнейших факторов существования живого организма, и любое нарушение приводит к изменениям в работе его тканей, органов и систем. Функции дыхания регулируются дыхательным центром, расположенным в области продолговатого мозга. Физиологическим раздражителем дыхательного центра является углекислота, которая оказывает на него, с одной стороны, прямое возбуждающее действие, а с другой — стимулирует рецепторы синокаротидной зоны и, таким образом, вызывает рефлекторное возбуждение дыхательного центра.

По своему возбуждающему влиянию на дыхательный центр стимуляторы дыхания делят:

1) на прямого типа действия (кофеин, кордиамин); 2) рефлекторного типа действия (цититон, лобелии). Препараты прямого действия оказывают непосредственное возбуждающее действие на дыхательный центр, увеличивая частоту дыхания (выдох и глубину вдоха). Одновременно некоторые из них (кофеин) повышают чувствительность дыхательного центра к углекислоте и, таким образом, еще больше усиливают дыхание.

Препараты этой группы вводят под кожу, в мышцу и в вену в зависимости от характера заболевания, лекарственной формы и фармакологических свойств препарата. В отличие от них стимуляторы дыхания рефлекторного типа эффективны только при внутривенном введении, так как они повышают активность дыхательного центра через возбуждение Н-холинорецепторов синокаротидной зоны и ЦНС. Только после этого возбуждение передается в дыхательный центр и легкие. Последние сокращаются, и происходит выдох.

Применение препаратов подобного типа действия (цититон, лобелии) сегодня довольно ограничено и возможно только при наличии рефлексов, например при асфиксии новорожденных, отравлениях угарным газом и т.д. Стимуляторы дыхания прямого действия могут быть использованы для возбуждения дыхания при нарушении его во время операции, родов, травм, асфиксии, при отравлении бытовым газом, продуктами горения, легких формах отравления снотворными и наркотическими средствами.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	142стр. из 164	

Примечание. При изучении данного раздела желательно повторить ранее проработанные темы «Н-холиномиметические средства», «Психостимуляторы» и «Аналептики».

ПРОТИВОКАШЛЕВЫЕ СРЕДСТВА

Кашель следует рассматривать с двух позиций. С одной стороны, это защитный акт организма, предупреждающий попадание в дыхательные пути инородных тел и раздражающих средств, а с другой — симптом простудного или иного заболевания легких или верхних дыхательных путей, когда нормальному дыханию мешает постоянное першение в горле, раздражение его чувствительных рецепторов в результате воспаления. Однако в обоих случаях механизм кашля — рефлекторный. В нем участвуют чувствительные рецепторы, находящиеся в слизистых дыхательных путей, центральная нервная система, кашлевой центр, расположенный в области продолговатого мозга и тесно связанный с дыхательным центром. Поскольку кашель является рефлекторным актом, то его можно прервать путем блокады кашлевого центра или угнетения чувствительных рецепторов дыхательных путей. В соответствии с этим противокашлевые средства делят на две группы: 1) центрального типа действия; 2) периферического типа действия. Первые блокируют кашлевой центр и прерывают кашлевой рефлекс, вторые угнетают чувствительные рецепторы и препятствуют возникновению кашлевого рефлекса. К противокашлевым средствам центрального типа действия относится алкалоид опия кодеин, его хорошо растворимая соль кодеина фосфат и полусинтетический аналог этилморфина гидрохлорид. Оба препарата отличаются от своего предшественника морфина большой избирательной способностью подавлять активность кашлевого центра и в малых дозах почти не угнетают работу дыхательного центра. КОДЕИН (Codeinum) и ЭТИЛМОРФИНА ГИДРОХЛОРИД (Aethyl- morphini hydrochloridum) применяют в порошках и таблетках по 0,015 г внутрь при острых заболеваниях легких и верхних дыхательных путей (бронхит, трахеит, пневмония), сопровождающихся тяжелым, затяжным, сухим кашлем, мешающим работать и спать. Кроме того, кодеин входит в состав ряда комбинированных препаратов, таких как Коделак, Терпинкод и др., а КОДЕИНА ФОСФАТ (Codeini phosphas) часто включают в состав отхаркивающих микстур. Все указанные препараты имеют один существенный недостаток: при длительном применении они способны вызвать лекарственную зависимость, что в определенной степени ограничивает их применение. Среди противокашлевых средств центрального действия особое место занимают ГЛАУЦИНА ГИДРОХЛОРИД (Glaucini hydrochloridum), ТУСУПРЕКС (Tusuprex) и ЛЕДИН (Ledinum), отличающиеся от предыдущих препаратов еще большей избирательной активностью в отношении кашлевого центра, не влияющих на функции дыхательного центра и не вызывающих лекарственной зависимости. Назначают глауцина гидрохлорид внутрь в таблетках, покрытых оболочкой, по 0,05 г до 3 раз в день, а тусупрекс — по 0,01 и 0,02 г 3—4 раза в сутки. К противокашлевым средствам периферического действия относятся препараты Либексин, Битидион и др. Они угнетают чувствительные рецепторы слизистых оболочек дыхательных путей, блокируют их раздражение и препятствуют развитию кашлевого рефлекса. По противокашлевому эффекту они уступают препаратам центрального действия, так как не оказывают выраженного влияния на кашлевой центр, но и не вызывают лекарственную зависимость. ЛИБЕКСИН (Libexin) по противокашлевой активности примерно равен Кодеину, оказывает местное анестезирующее действие на слизистую оболочку дыхательных путей, не угнетает дыхательный центр. Применяют Либексин при острых и хронических бронхитах, бронхопневмонии, бронхиальной астме, эмфиземе легких и т.д. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,1—0,2 г до 4 раз в день.

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	143стр. из 164	

Среди побочных явлений возможны сухость во рту, тошнота, расстройство кишечника и аллергические реакции. Выпускают Либексин в таблетках по 0,1 г № 20.

ОТХАРКИВАЮЩИЕ И МУКОЛИТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

При воспалительных и других заболеваниях органов дыхания, сопровождающихся кашлем с очень вязкой и трудноотделяемой мокротой, используют отхаркивающие и муколитические средства, которые повышают секрецию бронхиальных желез, снижают вязкость секрета, мокроты и улучшают отделение последней. Эти средства способствуют усилению ритмических сокращений бронхиол, повышают активность мерцательного эпителия, с помощью которого «грязная» мокрота продвигается из нижних отделов легких в верхние дыхательные пути и затем наружу. В зависимости от механизма действия отхаркивающие средства делят на две группы: 1) рефлекторного типа действия; 2) прямого (общего) типа действия. К отхаркивающим средствам рефлекторного типа действия относятся трава термопсиса, корень истода, солодки, алтея и препараты из них, а также синтетические средства натрия бензоат, терпингидрат и др. При приеме внутрь эти вещества оказывают раздражающее действие на рецепторы желудка, рефлекторно увеличивают секрецию бронхиальных желез и двигательную активность мерцательного эпителия. ТРАВА ТЕРМОПСИСА (*Herba Thermopsisidis*) содержит до 2,5% алкалоидов, из которых ведущим является термопсин. Траву термопсиса используют для приготовления настоя, который применяют внутрь по 1 столовой ложке до 4 раз в день. Порошок травы термопсиса входит в состав таблеток от кашля, а экстракт термопсиса сухой применяется в таблетках по 0,05 г самостоятельно, и нередко его включают в состав комплексных препаратов. Высшая разовая доза травы термопсиса для взрослых на прием внутрь равна 0,1г. При использовании отхаркивающих средств рефлекторного типа действия не рекомендуется превышать лечебные дозы из-за возможного развития рвоты.

ТЕРПИНГИДРАТ (*Terpinum hydratum*) — отхаркивающее средство, используется самостоятельно или в сочетании с другими веществами. Назначают его при хроническом бронхите, сопровождающемся кашлем, обструкцией, закупоркой дыхательных путей вязкой мокротой. Применяют терпингидрат внутрь в порошках и таблетках по 0,25 и 0,5 г, а также в составе таблеток с гидрокарбонатом натрия. Вместе с кодеином он входит в состав широко применяемого препарата Терпинкод. Противопоказанием к применению препарата служит язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки. Выпускают терпингидрат в порошке и таблетках по 0,25 и 0,5 г.

Пример рецепта Rр.: Infusi herbae Thermopsisidis 0,6 — 180 ml D.S. По 1 столовой ложке 3 раза в день.

К отхаркивающим средствам прямого типа действия относятся калия йодид аммония хлорид, капли нашатырно-анисовые и др. КАЛИЯ ЙОДИД (*Kalii iodidum*) используется чаще в виде 1—3% растворов при затянувшемся бронхите с вязкой, трудноотделяемой мокротой. От других отхаркивающих средств он отличается более длительным действием, однако долгое время его применять не следует из-за возможного раздражения слизистых оболочек в местах выделения йодидов (слизистая носа и др.). Препараты, содержащие эфирные масла (трава аниса, душицы, багульника, фиалки трехцветной, почки сосны), оказывают одновременно рефлекторное и прямое отхаркивающее действие. Эфирные масла выделяются из организма в основном через дыхательные пути и, раздражая бронхиальные железы, усиливают их секрецию, разжижают мокроту и способствуют ее отхождению. Большинство отхаркивающих средств растительного происхождения принимают внутрь до еды в виде настоев, отваров, экстрактов и в составе соответствующих микстур. Действие муколитических средств направлено главным образом на разжижение

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	144стр. из 164	

мокроты путем изменения ее физико-химических свойств. Они увеличивают объем мокроты, способствуют быстрому удалению ее из бронхов, оказывают выраженное противовоспалительное действие. К ним относятся ферментативные препараты (трипсин и др.), синтетические препараты (ацетилцистеин, бромгексин), натрия гидрокарбонат и др. Под влиянием ферментативных препаратов, которые используются чаще в форме ингаляций, происходит расщепление белковых веществ мокроты и она становится менее вязкой. Подобный эффект вызывают синтетические муколитики и натрия гидрокарбонат, который, обладая щелочными свойствами, разжижает вязкий секрет и способствует отхождению мокроты. Для ингаляций натрия гидрокарбонат используют в виде 0,5—2% растворов. АЦЕТИЛЦИСТЕИН (Acetylcysteinum), синоним: АЦЦ, — активный муколитик, разжижает мокроту, увеличивает ее объем, способствует ее отделению и отхаркиванию, одновременно оказывает противовоспалительное действие. Применяют ацетилцистеин при заболеваниях органов дыхания, сопровождающихся вязкой мокротой с присоединением гнойной инфекции (острый и хронический бронхит, пневмония и др.). Его нередко используют вместе с бронхолитическими средствами при лечении бронхиальной астмы. Назначают препарат в виде ингаляций по 2—5 мл 20% раствора до 4 раз в день по 15 минут и в гранулах по 3 г, чтобы приготовить раствор для приема внутрь. Выпускают ацетилцистеин в виде 20% раствора по 5 мл и 5% раствора по 10 мл, в пакетах по 3 г в форме гранул и таблетках для приготовления растворов для приема внутрь. БРОМГЕКСИН (Bromhexinum) оказывает отхаркивающее и муколитическое действие, способствует образованию сурфактанта, поверхностно-активного вещества, синтезируемого в альвеолах и закрывающего тонкой пленкой их внутреннюю поверхность, защищая, таким образом, рецепторы от влияния на них неблагоприятных факторов, улучшает свойства бронхолегочного секрета, облегчает выведение мокроты из дыхательных путей, повышает активность мерцательного эпителия. Применяют бромгексин при острых и хронических бронхитах, инфекционно-аллергической бронхиальной астме, для санации бронхов перед операцией и для предупреждения накопления в бронхах густой и вязкой мокроты после операции. Назначают препарат внутрь по 1—2 таблетки на прием до 3 раз в день. Бромгексин относится к медленно действующим препаратам, его полный эффект развивается лишь через 24 часа после начала лечения. Выпускают бромгексин в таблетках по 0,008 г и в форме драже по 0,004 г для детей в упаковке по 20 и 50 штук.

АМБРОКСОЛ (Ambroxolum), синоним: Лазолван, по химической структуре и механизму действия близок к бромгексину. Он также стимулирует образование сурфактанта и используется в тех же случаях, что и бромгексин. Назначают амброксол после еды в таблетках по 0,03 г 3 раза в день. Его можно использовать для ингаляций и парентерального введения в мышцу и в вену. Выпускают амброксол в таблетках по 0,03 г, в ампулах по 2 мл, содержащих 0,015 г препарата, для ингаляций в упаковке по 100 штук.

СРЕДСТВА, ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ ОТЕКЕ ЛЕГКИХ Отек легких — одно из наиболее тяжелых и опасных состояний для жизни человека. Он развивается вследствие застоя крови в легких, при левожелудочковой недостаточности, отравлениях токсическими средствами, воспалительных заболеваниях органов дыхания, бронхиальной астме и другой патологии. С целью устранения отека легких используют ряд фармакологических средств, среди которых дегидратирующие, мочегонные, гипотензивные препараты, а также сердечные гликозиды и глюкокортикоиды. Дегидратирующие средства, повышая осмотическое давление крови, способствуют переходу жидкости из отечных тканей в кровяное русло и через почки, за счет блокады процесса реабсорбции увеличивают объем вторичной мочи и выводят ее из организма. Основными представителями этих средств являются МАННИТ

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	145стр. из 164	

для инъекций (Mannitum pro injectionibus) и МОЧЕВИНА для инъекций {Urea pro injectiobibus); 15% раствор маннита или 30% раствор мочевины для инъекций вводят в вену капельно не только при отеке легких, но и при угрожающих отеках других тканей, например при отеке мозга. Оба препарата оказывают мочегонное действие, снижая, таким образом, гидратацию организма за счет выведения из него жидкости. Аналогичную цель преследует применение при отеке легких активных мочегонных средств, таких как фуросемид, этакриновая кислота и др. Фуросемид в экстренных случаях вводят в вену по 2—4 мл в виде 1 % раствора. Гипотензивные средства (папаверин, но-шпа), снижая артериальное и венозное давление, уменьшают кровенаполнение ткани легких и переход части плазмы крови в просвет альвеол. Таким образом, устраняется процесс накапливания жидкости в легких и последующего ее вспенивания.

В случаях развития отека легких на фоне острой сердечной недостаточности используют сердечные гликозиды, препараты строфантин, коргликон и др. Они регулируют работу сердца, повышают скорость кровотока, устраняют застойные явления, оказывают косвенное мочегонное действие, способствуют переходу жидкости из отечных тканей в кровь и затем через почки наружу. Растворы СТРОФАНТИНА (Sol. Strophanthini) 0,05% и КОРГЛИКОНА (Sol. Corglyconi) 0,06% вводят в вену по 0,5—1 мл медленно с 10—20 мл растворителя. Высокую эффективность при отеке легких проявляют глюкокортикоиды из группы гормональных средств. Они препятствуют развитию отека за счет блокады синтеза простагландинов и уплотнения клеточных мембран. Кроме того, они оказывают противовоспалительное, противоаллергическое, противошоковое и антиоксическое действия, которые могут сыграть положительную роль в устранении отека. Представителями этой группы препаратов являются широко известные ПРЕДНИЗОН, ДЕКСАМЕТАЗОН и др. При отеке легких происходит набухание слизистой органов дыхания, в результате чего просвет бронхов уменьшается и нарушается дыхание. При этом в просвет альвеол и бронхов через слизистые оболочки выделяется жидкость, обладающая малым поверхностным натяжением, которая во время вдоха и выдоха перемешивается и легко вспенивается, занимая значительный объем легких, что еще больше осложняет дыхание. В таких случаях развивается гипоксия, и если не принять срочных мер, пациент может погибнуть, именно поэтому вместе с противоотечными средствами используют препараты, препятствующие выходу экссудата в просвет легких и исключаящих пенообразование. Такими препаратами является кислород и спирт этиловый. Пациенту при оказании помощи дают вдыхать кислород через влажную салфетку, смоченную водой или этиловым спиртом.

Примеры рецептов Rр.: Bromhexini 0,008 D.t.d. № 20 in tab. S. По 1 таблетке 3 раза в день.
 Rр.: Tab. Ambroxoli 0,03 D.t.d. № 50 S. По 1 таблетке 3 раза в день после еды.

ПРОТИВОАСТМАТИЧЕСКИЕ (БРОНХОЛИТИЧЕСКИЕ) СРЕДСТВА

Бронхиальная астма — заболевание, характеризующееся приступами удушья, в основе которых лежит спазм бронхов. Причинами развития приступа бронхиальной астмы могут быть окружающая среда (различные аллергены, инфекционные факторы, метеорологические условия), повышенная активность вегетативной нервной системы, особенно ее парасимпатического отдела, наследственность и другие факторы. Приступы удушья возможны на фоне отека легких или обструкции (закупорки) бронхов густой мокротой, когда нарушен процесс выведения ее из органов дыхания. Для лечения и купирования приступов бронхиальной астмы используют препараты нескольких фармакологических групп. Среди них — бронхолитические, антигистаминные средства,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	146стр. из 164	

гормональные и другие препараты. Бронхолитическими называют средства, способные расслаблять мускулатуру бронхов, устранять их спазм и облегчать дыхание. Известно, что тонус бронхов регулируется симпатическим и парасимпатическим отделами нервной системы. Возбуждение парасимпатической нервной системы приводит к сужению бронхов (влияние блуждающего нерва), а возбуждение симпатической нервной системы — к их расслаблению (возбуждение β_2 -адренорецепторов). В связи с этим бронхолитические средства делят: 1) на α - и β -адреномиметические (адреналин); 2) (3-адреномиметические (сальбутамол); 3) симпатомиметические (эфедрин); 4) М-холиноблокирующие (атропин); 5) спазмолитические средства миотропного действия (эуфиллин).

Примечание. При изучении данной темы желательно повторить некоторые разделы темы «Вещества, влияющие на функции эфферентной нервной системы».

Представителем α - и β -адреномиметических средств является АДРЕНАЛИНА ГИДРОХЛОРИД (Adrenalini hydrochloridum), 0,1% раствор которого в ампулах по 1 мл вводят под кожу. Он относится к числу сильнейших и быстродействующих бронхолитических средств, но, к сожалению, время его действия непродолжительно. К средствам, возбуждающим β_2 -адренорецепторы бронхов и расширяющим их, относятся ШАДРИН, САЛЬБУТАМОЛ, ФЕНОТЕРОЛ и другие препараты. Их аэрозольные лекарственные формы используют для профилактики и купирования приступов бронхиальной астмы, а таблетки — для лечения и профилактики приступов удушья. Более длительным действием по сравнению с адреналином обладает ЭФЕДРИНА ГИДРОХЛОРИД (Ephedrini hydrochloridum) из группы симпатомиметических средств. Его применяют в таблетках по 0,025 г для лечения и профилактики, а 5% раствор в ампулах по 1 мл — для лечения и купирования приступов. Из М-холиноблокирующих средств наибольшей активностью обладает 0,1 % раствор АТРОПИНА СУЛЬФАТА (Atropini sulfas), выпускаемый в ампулах по 1 мл, и 0,2% раствор ПЛАТИФИЛЛИНА ГИДРОТАРТРАТА в ампулах по 1 мл. Однако наличие целого ряда побочных эффектов, характерных для этой группы препаратов, ограничивает их применение. Наиболее часто для купирования приступов бронхиальной астмы из группы этих препаратов используют ипратропиума бромид, аэрозольная форма которого применяется самостоятельно и в составе препарата Беродуал. Миотропные спазмолитические средства действуют непосредственно на гладкую мускулатуру бронхов, расслабляют ее и облегчают дыхание. Чаще с этой целью используют ЭУФИЛЛИН в таблетках по 0,15 г, а для купирования приступов препарат вводят по 1 мл в мышцу в виде 24% раствора или по 5—10 мл 2,4% раствора в вену с 10—20 мл раствора глюкозы. Кроме бронхолитического эффекта эуфиллин способствует уменьшению отека мозга, снижает артериальное и внутричерепное давление, усиливает работу сердца и возбуждает центральную нервную систему. Его нередко применяют для лечения гипертонической болезни и нарушения мозгового кровообращения. Подобным действием обладают дипрофиллин, ксантинола никотинат, Трентал (пентоксифиллин) и др. При бронхиальной астме аллергической природы кроме бронхолитических средств используют антигистаминные препараты, подавляющие действие медиаторов аллергии. К ним относятся известные препараты: Димедрол, Супрастин, Тавегил, Фенкарол и др. Высокую активность при бронхиальной астме проявляют гормональные препараты из группы глюкокортикоидов: преднизолон, дексаметазон, гидрокортизон и др. Они повышают чувствительность и возбудимость β_2 -адренорецепторов органов дыхания, оказывают противовоспалительное и противоотечное действие. Препараты этой группы используют самостоятельно или в комплексе с препаратами других фармакологических групп для купирования приступов бронхиальной

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	147стр. из 164	

астмы. Например, при длительном тяжелом приступе (астматический статус) наиболее эффективным оказывается внутривенное введение преднизолона. Если приступы бронхиальной астмы сопровождаются отеками или обструкцией бронхов, в комплекс противоастматических средств включают отхаркивающие препараты и средства, устраняющие отек легких. Итак, оказание помощи при приступе бронхиальной астмы и ее лечение желательно проводить комплексно препаратами различных фармакологических групп в зависимости от природы заболевания, состояния здоровья пациента и чувствительности его организма к лекарственным средствам.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

1. К какому типу действия отхаркивающих средств следует отнести траву термопсиса?
2. Почему кодеин назначают при тяжелом затяжном кашле и в исключительных случаях?
3. Как можно объяснить противоотечное действие маннита?
4. Почему спирт этиловый оказывает противовспенивающее действие?
5. Какие существуют фармакологические группы бронхолитических средств?
6. Укажите концентрации растворов адреналина и атропина для инъекций. Чем они отличаются друг от друга как бронхолитические средства?
7. Какому из этих препаратов следует отдать предпочтение при купировании приступа бронхиальной астмы? Почему?
8. Каков механизм бронхолитического действия эуфиллина?
9. Какие лекарственные препараты используют для купирования приступов бронхиальной астмы?

1. Тема. Средства, влияющие на пищеварительную систему.

2. Цель. При изучении отдельных разделов данной темы следует обратить внимание на следующее.

1. Классификация средств, влияющих на функции органов пищеварения.
2. Понятия «заместительная терапия», «гепатопротекторные, гастропротекторные» и другие подобные средства.
3. Противоположный характер действия средств, используемых при пониженной и повышенной активности органов пищеварения.
4. Особенности действия и применения средств, влияющих на аппетит.
5. Особенности действия средств, влияющих на секрецию желудка.
6. Назначение рвотных и противорвотных средств.
7. Различия в характере действия и применения средств, используемых при нарушениях секреции поджелудочной железы.
8. Классификация, особенности действия и применения желчегонных средств.
9. Характер действия и особенности применения средств, влияющих на моторику кишечника.
10. Многообразие лекарственных средств и фармакологических групп, используемых при лечении заболеваний, связанных с нарушением функций органов пищеварения.

3. Тезисы лекции.

1. Средства, влияющие на аппетит Аппетит — акт рефлекторный, связанный с раздражением специальных чувствительных рецепторов полости рта, пищевода, желудка и активностью центров голода и насыщения, расположенных в области гипоталамуса. Деятельность этих центров у здорового человека взаимосвязана и уравновешена, т.е.

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	148стр. из 164

активность одного из них зависит от функционального состояния другого. Когда человек хочет есть, у него возбуждается центр голода, а в это время угнетается центр насыщения. По мере употребления пищи происходит обратный эффект: возбуждается центр насыщения, но угнетается центр голода. Проходит определенное время, пища переваривается и переходит из желудка в кишечник, и все повторяется сначала. Нормальный ритм возбуждения и угнетения центров голода и насыщения может быть нарушен целым рядом заболеваний и функциональных расстройств органов пищеварения. В одних случаях это приводит к снижению, а в других — к чрезмерному повышению аппетита. То и другое плохо, и чтобы восстановить его, используют средства, повышающие или снижающие аппетит.

1.1. Средства, повышающие аппетит. Наиболее часто для повышения аппетита используют средства, содержащие горечи. Они, раздражая вкусовые рецепторы полости рта, рефлекторно возбуждают центр голода и повышают аппетит. На образование и выделение желудочного сока, содержащего кислоту хлористоводородную и пепсин, горечи прямого действия не оказывают. Это функции центра голода, который готовит желудок к приему пищи. Кроме того, горечи повышают чувствительность вкусовых рецепторов к принимаемой пище, что вызывает рефлекторно дополнительное образование и выделение желудочного сока. Все это способствует лучшему перевариванию пищи, ее более быстрому переходу из желудка в двенадцатиперстную кишку и восстановлению аппетита. Особенностью препаратов, содержащих горечи и повышающих аппетит, является то, что их применяют за 20—30 минут до еды с небольшим количеством воды. Назначают горечи при гипоацидных хронических гастритах, после перенесенных тяжелых инфекционных заболеваний, после операций ит.д. Из лекарственных средств, повышающих аппетит, чаще всего используют препараты растений, содержащих горечи: полыни горькой, одуванчика обыкновенного, аира болотного, вахты трехлистной и др.

НАСТОЙКА ПОЛЫНИ (Tinctura Absinthii) — прозрачная жидкость буровато-зеленого цвета с характерным полынным запахом и очень горьким вкусом. Назначают настойку полыни внутрь по 15—20 капель на прием 3 раза в день за 20—30 минут до еды с небольшим количеством воды. Выпускают настойку полыни во флаконе по 25 мл. Из корней одуванчика, корневища аира, листьев вахты трехлистной готовят настои и отвары 10,0 — 200 мл и принимают их внутрь по ¼ стакана за 20—30 минут до еды 3 раза в день. Кроме горечей аппетит могут повышать другие фармакологические средства. Известно, что повышение содержания сахара и глюкозы в крови возбуждает центр насыщения, а снижение, наоборот, возбуждает центр голода. В связи с этим при введении инсулина, снижающего содержание глюкозы в крови, возбуждается центр голода и появляется аппетит.

1.2. Средства, снижающие аппетит. Чувство голода и насыщения регулируется соответствующими центрами головного мозга, расположенными в области гипоталамуса. Лекарственные средства, снижающие аппетит и препятствующие ожирению, называют анорексигенными. Они улучшают обмен веществ, в том числе жиров и углеводов, способствуют снижению объема потребляемой пищи, раннему появлению чувства насыщения, препятствуют переяданию, стимулируют работу кишечника и его своевременное опорожнение. Кроме того, они снижают содержание холестерина в крови и отложение его на стенках сосудов, помогают соблюдать диету, контролировать вес и предупреждают развитие запоров. Специальные анорексигенные препараты дезопимон, мазиндол и фепранон по ряду причин применяются ограниченно. Чаще используют биологически активные добавки (БАД), которые в своем составе содержат вещества, способствующие активизации инсулина и утилизации сахаров, «сжиганию» (всасыванию и

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	149стр. из 164	

распаду) жиров, снижающие аппетит, содержание холестерина в крови, оказывающие мягкое послабляющее действие. Анорексигенные средства применяют в комплексной терапии патологических состояний, сопровождающихся ожирением, избыточной массой тела и повышенным содержанием холестерина, склонностью к атеросклерозу, при сахарном диабете 2-го типа и т.д.

Наиболее часто применяют отечественные биологически активные добавки Идеал, Турбослим-день и Турбослим-ночь, ФЭТ-Х (пиколинат хрома), зарубежный препарат Холестенорм и др. В составе биологически активной добавки Идеал содержатся флаваноиды, антрохиноны и другие вещества. Они тормозят усвоение жиров, активизируют их расщепление, повышают перистальтику кишечника, оказывают мягкое послабляющее действие, устраняют запоры. Их рекомендуют применять для нормализации обмена веществ, устранения последствий переедания, застойных явлений в желудочно-кишечном тракте и для контроля веса. Применяют препарат во время еды по 1—3 пилюли 1 раз в день. Курс применения — 4—8 недель. Выпускают препарат в виде пилюль по 0,5 г № 60 во флаконе. ФЭТ-Х (пиколинат хрома) оказывает мягкое анорексигенное действие, нормализует липидный и углеводный обмен, восполняет дефицит хрома в организме. Хром в составе препарата снижает аппетит, улучшает пищеварение, снижает тягу к сладкому и мучному, повышает активность инсулина и снижает содержание сахара в крови, делает кожу и мышцы упругими и т.д. Применяют препарат при алиментарном ожирении, для коррекции веса, профилактики атеросклероза, лечения сахарного диабета 2-го типа, для повышения иммунитета, улучшения работоспособности сердца, при повышенной утомляемости и т.д. Назначают препарат внутрь во время еды по 10—20 капель 1—2 раза в день, при этом рекомендуется сначала подержать его во рту, а затем проглотить. Выпускают его во флаконах по 25 мл и во флаконах со спрей-дозатором по 50 мл.

2. Средства, влияющие на секреторную функцию желудка Отклонения от нормальной секреторной функции желудка могут быть либо в сторону снижения, либо в сторону увеличения образования секрета. То и другое нежелательно и может быть вызвано анатомо-физиологическими качествами организма, рядом заболеваний, ведущих к расстройству нормальной деятельности желудка и всего желудочно-кишечного тракта.

Средства, влияющие на секрецию желудка, делят на две группы: 1) повышающие секрецию желез желудка; 2) снижающие секрецию желез желудка.

2.1. Средства, повышающие секрецию желудка. Эти средства используют при недостаточной секреции желез желудка, т.е. при анацидной и гипоацидной ее формах. В таких случаях применяют стимулирующую или заместительную терапию. Первая связана с действием особого вещества гистамина, который синтезируется в тучных клетках организма. Попадая в желудок, он, с одной стороны, возбуждает H₂-гистаминовые рецепторы желез желудка и повышает их секрецию, а с другой — возбуждает H₂-гистаминовые рецепторы сосудов, расширяет их, выходит в подкожную клетчатку или ткани, вызывая аллергические реакции. Побочные эффекты гистамина почти не позволяют использовать его в лечебной практике. Иногда его применяют в лабораторной практике для определения секреторной функции желудка. Если после его введения в желудке сок не появляется, делают вывод о полной атрофии слизистой желудка. Для стимуляции секреторной функции желез желудка назначают горечи или углекислую минеральную воду, например Эссендуки-17. Если применение этих и подобных им средств не дает результата, тогда для улучшения процесса пищеварения назначают средства заместительной терапии. К ним относятся сок желудочный натуральный, кислота хлористоводородная разведенная, пепсин, Абомин, Ацидин-пепсин и др. СОК ЖЕЛУДОЧНЫЙ НАТУРАЛЬНЫЙ (Succus

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	150стр. из 164	

gastricus natura- lis) — одно из лучших средств заместительной терапии, потому что содержит все ферменты, необходимые для нормального пищеварения. Назначают желудочный сок при недостаточной активности желез желудка, ахилии, гипо- и анацидных гастритах, диспепсии и т.д. Применяют его по 1—2 столовые ложки 2—3 раза в день во время еды или до нее. Выпускают сок желудочный натуральный во флаконах по 100 мл. **КИСЛОТА ХЛОРИСТОВОДОРОДНАЯ РАЗВЕДЕННАЯ (Acidum hydrochloricum dilutum)** — используют ее 1—3% раствор в составе микстуры, часто вместе с пепсином, одним из ведущих протеолитических ферментов желудочного сока, участвующим в пищеварении и расщеплении всех природных белков. Данную микстуру назначают при ахилии, гипо- и анацидных гастритах по 1—2 столовые ложки во время еды.

Недостатком данной микстуры является то, что она отрицательно действует на дентин зубов, поэтому вместо нее чаще используют препарат Ацидин-пепсин. **АЦИДИН-ПЕПСИН (Acidin-pepsinum)** состоит из 1 части пепсина и 4 частей бетаина гидрохлорида. Таблетки для приема внутрь перед употреблением следует развести в $V_4 \text{—} \frac{1}{3}$ стакана воды и принимать до 4 раз в день за 15—20 минут до еды. Препарат способствует перевариванию пищи и назначается при ахилии, гипо- и анацидных гастритах и диспепсии. Выпускают Ацидин-пепсин в таблетках по 0,25 и 0,5 г в упаковке по 50 штук. **АБОМИН (Abominum)** содержит сумму протеолитических ферментов, способствующих перевариванию пищи. Применяется при пониженной кислотности желудочного сока и возникающих на этой основе заболеваниях (гастриты, гастроэнтериты, энтероколиты и др.). Назначают Абомин для приема внутрь по 1 таблетке 3 раза в день в течение 1—2 месяцев. При острых гастритах и колитах по 1 таблетке 3 раза в день 2—3 дня подряд. Выпускают Абомин в таблетках по 0,2 г (50.000 ЕД) в упаковке по 10 и 20 штук.

2.2. Средства, снижающие секрецию желез желудка Препараты, обладающие подобным действием, делятся на четыре группы: 1) блокаторы М-холинорецепторов желудка; 2) блокаторы H₂-гистаминовых рецепторов желудка; 3) антацидные средства; 4) блокаторы протонного насоса.

Блокаторы М-холинорецепторов желудка Блокада тех и других рецепторов вызывает расслабление желез желудка и уменьшение образования желудочного сока. Известно, что импульсы, идущие по парасимпатической нервной системе (блуждающий нерв) к желудку, возбуждают М-холинорецепторы, это вызывает увеличение его секреторной и двигательной функции, спазм гладкой мускулатуры и боли в желудке. Устранение влияния блуждающего нерва на рецепторы желудка с помощью М-холиноблокаторов позволяет снизить избыточную секрецию желудочного сока, купировать спазм гладкой мускулатуры и возникшую боль.

К препаратам, блокирующим М-холинорецепторы, относятся широко известные атропина сульфат, препараты красавки, платифиллина гидротартрат и метацин. Использование этих препаратов нередко сопровождается рядом побочных эффектов в виде сухости во рту, тахикардии, паралича аккомодации и т.д. В последнее время широкое применение получил препарат Гастро- цепин (пирензепин). **ГАСТРОЦЕПИН (Gastrozepine)** — специфический Мг холино- блокатор, который в отличие от других М-холиноблокирующих средств избирательно блокирует железы желудка и тормозит секрецию хлористоводородной кислоты и пепсиногена. Он почти не влияет на М₂-холинорецепторы слюнных желез, глаз, сердца и, следовательно, не вызывает побочных эффектов, характерных для атропина и его аналогов. Механизм действия Гастроцепина связан с блокадой стимулирующего влияния блуждающего нерва на секрецию желудка, за счет чего резко уменьшается количество желудочного сока. Применяют Гастроцепин для лечения острой и хронической форм

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	151стр. из 164	

язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гиперацидного гастрита, язвенных поражений желудочно-кишечного тракта. Назначают препарат внутрь в таблетках по 0,05 г утром и вечером за 30 минут до еды. Курс лечения в этом случае продолжается не менее 4 недель без перерыва. В тяжелых случаях Гастроцепин вводят в вену или в мышцу, а растворы его готовят непосредственно перед применением. Побочные эффекты при применении препарата наблюдаются редко, но все же его с осторожностью назначают больным с сопутствующей глаукомой и гипертрофией предстательной железы. Не рекомендуют применять Гастроцепин в первые три месяца беременности. Выпускают Гастроцепин в таблетках по 0,05 г № 50 и в ампулах, содержащих 0,01 г препарата с приложением растворителя, в упаковке по 5 ампул. Блокаторы H₂-гистаминовых рецепторов желудка Непосредственным стимулятором образования выделения желудочного сока является гистамин. Его действие проявляется вследствие раздражения им гистаминовых H₂-рецепторов. Блокада этих рецепторов приводит к снижению секреции желез желудка, уменьшению активности пепсина, что препятствует образованию или способствует заживлению уже возникших язв. Препараты этой группы — ранитидин, фамотидин, циметидин — используют для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. РАНИТИДИН (Ranitidine) — один из активных блокаторов H₂-гистаминовых рецепторов желудка, подавляющих его секрецию. Используют ранитидин для лечения язвенных заболеваний желудка и двенадцатиперстной кишки и других заболеваний желудочно-кишечного тракта, развивающихся на фоне избыточного образования желудочного сока с высоким содержанием хлористоводородной кислоты и пепсина. Назначают ранитидин внутрь по 1 таблетке 2 раза в день утром и вечером независимо от времени приема пищи. Курс лечения составляет 1—2 месяца. При применении ранитидина у пациентов иногда возникают побочные эффекты в виде головной боли, тошноты, кожной сыпи и головокружения. Выпускают ранитидин в таблетках по 0,15 г № 20. ФАМОТИДИН (Famotidine) — препарат третьего поколения блокаторов H₂-гистаминовых рецепторов, снижает секрецию соляной кислоты и подавляет активность пепсина. Основное фармакологическое действие — противоязвенное. Назначают фамотидин в тех же случаях, что и ранитидин. Назначают фамотидин внутрь в таблетках по 0,04 г 1 раз на ночь или по 0,02 г 2 раза в сутки — утром и вечером. Курс лечения составляет 1—2 месяца. Выпускают фамотидин в таблетках по 0,02 г № 20.

Антацидные средства Действие лекарственных средств этой группы основано на нейтрализации избыточного количества хлористоводородной кислоты желудочного сока. Снижение кислотности желудочного сока уменьшает агрессивность фермента пепсина в отношении слизистой желудка, что предупреждает появление язвы, возможные кровотечения и создает условия для ее заживления. Особенностью антацидных средств является то, что их обычно назначают за 1—2 часа до приема пищи. В качестве антацидных средств используют магния окись, препараты алюминия гидроокиси (Альмагель, Гастал), Фосфалюгель, Маалокс и др.

МАГНИЯ ОКИСЬ (Magnesii oxydum) — одно из наиболее активных антацидных средств, не всасывающихся из желудочно-кишечного тракта и нейтрализующих хлористоводородную кислоту без выделения углекислого газа. Назначают магния окись в порошках и таблетках внутрь по 0,25—1 г на прием до 3 раз в день, но чаще в составе комплексных препаратов Альмагель, Аквамаг и др. Выпускают магния окись в виде порошка и в таблетках по 0,5 г. АЛЬМАГЕЛЬ (Almagel) — комбинированный препарат, состоящий из алюминия гидроокиси, магния окиси и сорбита, обладает антацидным, адсорбирующим и обволакивающим действием. Лекарственная форма в виде геля создает

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	152стр. из 164	

условия для равномерного распределения препарата по желудку и более продолжительного действия. Применяют Альмагель для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гиперацидных гастритов, эзофагитов и других заболеваний, где показано снижение кислотности желудочного сока. Разновидностью препарата является Альмагель А, в состав которого входит анестезин. Назначают Альмагель внутрь по 1—2 чайные ложки до 4 раз в день, за 30 минут до еды и на ночь. После приема препарата рекомендуется лечь и несколько раз повернуться вокруг своей оси для более равномерного распределения Альмагеля по стенкам желудка. Выпускают Альмагель во флаконах по 170 мл. **ФОСФАЛЮГЕЛЬ (Phosphalugel)** — комплексный препарат, обладающий обволакивающим, адсорбирующим, антипептическим действием. Препарат поддерживает рН содержимого желудка в нормальных пределах и не способствует дополнительной секреции хлористоводородной кислоты. Фосфалюгель за счет высокой адсорбционной активности связывает бактерии, вирусы, токсины, газы и способствует их выведению из пищеварительного тракта. Показанием к применению Фосфалюгеля служит язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, колит, ситмондит, отравление кислотами, щелочами, ядами и др. Назначают Фосфалюгель по 1—2 пакетика 2—3 раза в день. Курс лечения продолжается 2—4 недели. Выпускают препарат в специальных пакетиках по 16,0 г № 20. **МААЛОКС (Maalox)** представляет собой смесь магния гидроксида и алюминия гидроксида, что обеспечивает его высокую нейтрализующую способность. Он оказывает антацидное, адсорбирующее и обволакивающее действие. Назначают Маалокс для лечения острого и хронического гастрита, язвы желудка и двенадцатиперстной кишки. Применяют препарат внутрь по 1—2 таблетки, или по 15 мл суспензии (1 столовая ложка), или 1 пакетик после еды через 1,5—2 часа. Выпускают Маалокс в таблетках № 40 и в виде суспензии в специальных пакетиках по 15 мл в упаковке по 30 штук. **НАТРИЯ ГИДРОКАРБОНАТ (Natrii hydrocarbonas)** — широко известное, быстродействующее антацидное средство, но, к сожалению, имеющее ряд недостатков, резко ограничивающих его применение. Натрия гидрокарбонат легко всасывается из желудочно-кишечного тракта, быстро проникает в кровь и может изменить кислотнощелочное равновесие организма. Кроме того, при взаимодействии с хлористоводородной кислотой образует углекислый газ, наполняющий желудок, создающий растягивающий, распирающий эффект, ведущий к возникновению прободной язвы желудка. К тому же углекислый газ, раздражая секреторные железы желудка, вновь способствует избыточному образованию и выделению желудочного сока (повторная гиперсекреция). Выпускают натрия гидрокарбонат в порошке и таблетках по 0,3 и 0,5 г. В настоящее время для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки используют комплексные препараты, включающие в себя вяжущие, обволакивающие, антацидные, анестезирующие, спазмолитические и другие средства. Среди них ведущими препаратами являются Де-Нол, Вентер, Викалин, Викаир и др. **ВЕНТЕР (Venter)**, синоним: Сукралфат, представляет собой алюминиевую соль октасульфата сахарозы, оказывающую антацидное, адсорбирующее и обволакивающее действие. В желудке, кроме того, образует защитную пленку и оказывает цитопротекторное действие (защищает клетки слизистой желудка от разрушения) и препятствует образованию язвы или способствует ее заживлению. Назначают Вентер по 1—2 таблетке перед едой при язвенной болезни и гиперацидных гастритах. Выпускают препарат в таблетках по 0,5 г в упаковке по 100 штук. Блокаторы протонного насоса Известно, что избыток хлористоводородной кислоты в желудке может вызвать неприятные последствия в виде заброса содержимого желудка в пищевод и последующее его воспаление (эзофагит), изжоги, кислой отрыжки, язвы желудка и двенадцатиперстной кишки, язвы желудочно-

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	153стр. из 164	

кишечного тракта и т.д. Регулятором кислотности желудочного сока является протонный насос, представляющий собой фермент $H^+-K^+-ATPase$, присутствующий в париетальных клетках желудка и вызывающий секрецию кислоты за счет реакции обмена иона водорода на ион калия. Блокада этого фермента прекращает выход свободных ионов водорода в просвет желудка и образование хлористоводородной кислоты. К блокаторам протонного насоса относятся препараты Омепразол, Омезол, Гастразол и др. ОМЕПРАЗОЛ (iOmeprazole) легко проникает в париетальные клетки слизистой оболочки желудка, накапливается в них и активизируется при кислом значении pH. Омепразол блокирует протонный насос секреторной мембраны париетальных клеток, прекращает выход ионов водорода и образование хлористоводородной кислоты. Применяют омепразол при язве желудка и двенадцатиперстной кишки в стадии обострения, язвах, развившихся в результате стресса, неправильного применения нестероидных противовоспалительных средств (диклофенак), пептидных язвах и язвах, вызванных *Helicobacter pylori*, рефлюкс-эзофагите и других заболеваниях желудочно-кишечного тракта с повышенной кислотностью желудочного сока. Назначают препарат внутрь в капсулах по 0,02 г 1—2 раза в день 2—4 или 8 недель подряд в зависимости от характера заболевания. При применении омепразола возможны диспепсические расстройства, боли в животе, метеоризм, снижение аппетита, сухость во рту, кожные аллергические реакции, лейкопения и др. Не следует применять препарат при беременности и кормлении грудью. Выпускают омепразол в капсулах по 0,02 г.

Средства, оказывающие действие на *Helicobacter pylori* Наличие бактерии *Helicobacter pylori* в слизистой оболочке желудка и двенадцатиперстной кишки нередко служит одной из ведущих причин развития гастрита и язвенной болезни в них. Наибольшее количество заболеваний слизистой двенадцатиперстной кишки связывают именно с этим возбудителем, который, проявляя определенную активность, разрушает слизистую, вызывая ее изъязвление.

К препаратам, оказывающим бактерицидное действие на бактерии *Helicobacter pylori*, относятся Де-нол, Бисмофальк, Хеликоцин, Пилорид и др. ДЕ-НОЛ (De-Not) оказывает гастропротективное действие, образует на поверхности язв и эрозий защитную пленку, способствующую их заживлению, увеличивает образование слизи (обволакивающий эффект) и оказывает бактерицидное действие в отношении возбудителя заболевания. Применяют Де-Нол при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гастродезодените, гастрите, связанных с наличием *Helicobacter pylori*. Назначают препарат внутрь в таблетках до 3 раз в день за 30 минут до еды и последний раз перед сном. Курс лечения зависит от степени и характера заболевания. Не рекомендуется применять Де-нол при беременности, кормлении ребенка грудью, заболеваниях почек и при повышенной чувствительности к препарату. Выпускают Де-Нол в таблетках по 0,12 г в упаковке по 112 штук. БИСМОФАЛЬК (Bismofalk) — комбинированный противоязвенный препарат, обладающий бактерицидной активностью в отношении *Helicobacter pylori*. Применяют Бисмофальк при язвенной болезни желудка, двенадцатиперстной кишки, хроническом гастрите в стадии обострения. Назначают препарат по 2 таблетки 3 раза в день за 1—2 часа до еды. Курс лечения — 2 месяца. Выпускают Бисмофальк в таблетках, в упаковке по 50 и 100 штук. ХЕЛИКОЦИН (Helicocin) — комбинированный препарат, содержащий два противомикробных антибиотика, активных в отношении *Helicobacter pylori*. Назначают препарат при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, а также при хроническом гастрите. Для лечения принимают по 1 таблетке обоих видов 3 раза в сутки в течение 12 дней. Хеликоцин не рекомендуют применять при беременности, в

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	154стр. из 164	

период лактации, при заболеваниях нервной системы и повышенной чувствительности к компонентам препарата. Выпускают препарат в упаковке по 36 штук, включающих в себя 18 таблеток амоксициллина по 0,75 г и 18 таблеток метронидазола по 0,5 г.

Примеры рецептов Rp.: Sued gastrici naturalis 100 ml D.S. По 1 столовой ложке 3 раза в день во время еды.

Rp.: Tinct. Absinthii 25 ml D.S. По 20 капель в 1/3 стакана воды 3 раза в день за 15 минут до еды.

Rp.: Almagel 17 ml D.S. По 1 чайной ложке 4 раза в день за 30 минут до еды.

Rp.: Tab. Nastrozepine 0,05 № 50 D.S. По 1 таблетке 3 раза в день.

Rp.: Tab. De-Nol 0,12 D.S. По 1 таблетке 3 раза в день за 30 минут до еды и на ночь.

3. Средства, влияющие на двигательную активность желудка Двигательная активность (моторика) желудка регулируется парасимпатической нервной системой. При ее возбуждении, например, М-холиноблолирующими или антихолинэстеразными средствами, тонус, сократительная и двигательная активность возрастают. Подобные препараты сравнительно редко используются в медицинской практике, в основном при атонии желудка. К средствам, стимулирующим двигательную активность желудка, относятся рвотные средства, но в отличие от предыдущих средств они вызывают обратную перистальтику (снизу вверх), способствуя выбросу содержимого желудка наружу. Блокада блуждающего нерва парасимпатической нервной системы с помощью М-холиноблолирующих средств снижает двигательную и секреторную активность желудка. М-холиноблолирующие средства (атропин и его аналоги) чаще используют для лечения язвенной болезни желудка и гастрита с повышенной кислотностью желудочного сока. Снижая кислотность желудочного сока, двигательную активность мышц желудка, они одновременно устраняют спазм гладкой мускулатуры и боли, которые часто сопровождают эти заболевания.

3.1. Рвотные средства Рвота, с одной стороны, — это защитный акт, препятствующий проникновению в организм раздражающих и токсических средств. С другой стороны, рвота является симптомом какого-либо заболевания. Нередко она возникает в результате общего отравления, обусловленного поступлением в организм токсического вещества, в том числе и лекарства, в результате возбуждения вестибулярного аппарата, при черепно-мозговых травмах и некоторых инфекционных заболеваниях ит.д. Рвота — сложный рефлекторный акт, являющийся ответной реакцией на раздражение рецепторов слизистой пищеварительного тракта и результатом прямого возбуждения рвотного центра, расположенного в области продолговатого мозга. Различают рвоту рефлекторного и центрального типа. Первая возникает вследствие раздражения рецепторов желудочно-кишечного тракта. Далее импульсы идут в триггер-зону (пусковая зона) продолговатого мозга. Она осуществляет подготовку организма к акту рвоты, возбуждает центры дыхания, деятельности сердечно-сосудистой системы и других и в последнюю очередь посылает импульсы к желудку. Таким образом, замыкается рефлекторная дуга и возникает рвота. Рвота центрального происхождения чаще возникает вследствие прямого возбуждения триггер-зоны, расположенной в непосредственной близости с рвотным центром. Например, рвота подобного типа возникает в случаях, если человек плохо переносит поездки на автобусе или самолете, т.е. при морской или воздушной болезни. Рвотные средства чаще всего используются в случаях оказания неотложной помощи, когда возникает необходимость быстрого удаления раздражающего, токсического вещества или недоброкачественной пищи. Различают рвотные средства рефлекторного и центрального типа действия. К первому типу относятся средства, раздражающие рецепторы полости рта,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	155стр. из 164	

пищевода и желудка, вызывающие рефлекторное возбуждение рвотного центра. К ним относятся препараты термопсиса в больших дозах, меди сульфат, цинка сульфат, но в последнее время они почти не применяются, так как рвоту рефлекторного типа можно легко вызвать раздражением рецепторов корня языка или задней стенки зева. Рвотным средством центрального типа является апоморфина гидрохлорид.

АПОМОРФИНА ГИДРОХЛОРИД (*Apomorphini hydrochloridum*) после подкожного введения в дозе 0,2—0,3 мл 1% раствора непосредственно раздражает рецепторы триггер-зоны и вызывает возбуждение рвотного центра. Препарат используют при отравлении алкоголем и для лечения алкоголизма, когда подкожное введение сочетают с приемом алкоголя, вырабатывая устойчивый рефлекс отвращения к употреблению алкоголя. Применение раствора апоморфина гидрохлорида требует некоторой осторожности, особенно у лиц с высоким артериальным давлением. Выпускают апоморфина гидрохлорид в порошке и ампулах по 1 мл 1 % раствора. Список А.

3.2. Противорвотные средства При некоторых патологических состояниях организма развивается неприятное чувство тошноты и даже рвота, что вызывает естественное желание устранить или предупредить эти симптомы. С этой целью используют противорвотные средства различных фармакологических групп, оказывающие блокирующее действие на различные звенья передачи импульсов, возбуждающих рвотный центр. Если рвота вызвана местным раздражением желудка, то после удаления раздражающего вещества можно использовать вяжущие или обволакивающие средства, а чтобы уменьшить раздражение рецепторов желудка, рекомендуется принимать местноанестезирующие вещества (анестезин) или комплексные препараты (Альмагель А). Противорвотное действие нейротропных средств связано с угнетающим их влиянием на нейромедиаторные системы рвотного центра и хоморецепторы пусковой (триггер) зоны. К последним относятся дофаминовые, серотониновые, гистаминовые и М-холинергические рецепторы, которые находятся в пусковой зоне и в зоне вестибулярного аппарата. Их блокада позволяет прекратить передачу импульсов в рвотный центр и устранить тошноту и рвоту. Так, М-холинолитические (блокирующие) средства применяют для профилактики рвоты, возникающей при морской и воздушной болезни (Аэрон), перед операцией (атропин); антигистаминные средства (димедрол, дипразин) оказывают противорвотное действие, блокируя Н₁ гистаминовые рецепторы за счет своего седативного и холинолитического действия.

ТИЭТИЛПЕРАЗИН (*Thiethylperazinum*) обладает сильным противорвотным действием по сравнению с другими производными фенотиазина. Механизм противорвотного действия основан на успокаивающем действии его на рвотный центр и хоморецепторы пусковой (триггерной) зоны продолговатого мозга. Применяют тиэтилперазин для профилактики и прекращения тошноты и рвоты различной этиологии, в том числе при рвоте беременных и развивающейся при лучевой и химиотерапии онкологических больных. Назначают по 1 драже внутрь 1—3 раза в день или вводят по 1 свече утром и вечером. В острых случаях его применяют внутримышечно по 1—2 мл в день. Из побочных эффектов иногда наблюдается сухость во рту и насморк. Детям до 15 лет препарат принимать не рекомендуют. Он противопоказан при резком угнетении ЦНС и коматозном состоянии. Выпускают тиэтилперазин в драже, суппозиториях (6,5 мг) и в ампулах по 1 мл. **МОТИЛИУМ** (*Motilium*) — препарат из группы нейролептических средств, производных бутирофенона. Противорвотное действие его проявляется вследствие блокады дофаминовых рецепторов, что в свою очередь приводит к увеличению перистальтики желудка и быстрому его опорожнению. Препарат показан к применению при тошноте и рвоте различного

O'NTÜSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	156стр. из 164	

происхождения. Назначают Мотилиум внутрь за 15—20 минут до еды по 1—2 таблетки 3 раза в день и перед сном. Среди побочных явлений иногда отмечают головную боль, сухость во рту, спазмы кишечника и повышение уровня пролактина в плазме крови. Не следует применять Мотилиум при желудочно-кишечных кровотечениях, перфорации желудка и повышенной чувствительности организма к нему. Выпускают препарат в таблетках по 0,01 г в упаковке по Юи30штук. Список Б. МЕТОКЛОПРАМИД (Metoclopramidum) оказывает противорвотное действие, регулирует функции желудочно-кишечного тракта, повышает его тонус и двигательную активность. Лечебный эффект препарата связан с блокадой дофаминовых и серотониновых рецепторов, что повышает тонус желудка и способствует ускоренному переходу его содержимого в кишечник.

Назначают препарат при рвоте различного происхождения, нарушении моторной функции желудочно-кишечного тракта, атонии желудка после операции и т.д. Применяют внутрь до еды по 1—2 таблетки 3 раза в день, реже вводят в мышцу или в вену. Противопоказанием к его применению служат кровотечения в желудочно-кишечном тракте, стеноз привратника и кишечная непроходимость. Выпускают препарат в таблетках по 0,01 г № 50 и в ампулах по 2 мл с содержанием в 1 мл 0,005 и 0,01 г препарата. Среди М-холиноблокирующих средств в качестве противорвотного средства чаще используют таблетки «Аэрон» (Tabuletae Легопит) для профилактики и лечения морской и воздушной болезни. Их действие связывают с наличием в составе таблеток скопаламина, оказывающего угнетающее действие на холинорецепторы вестибулярного аппарата.

4. Средства, влияющие на секреторную функцию поджелудочной железы Поджелудочная железа является одним из важнейших органов желудочно-кишечного тракта, секрет которой участвует в процессе пищеварения. Воспаление поджелудочной железы, сопровождающееся нарушением секреторной функции, носит название панкреатит. Он может проявляться в хронической и острой форме. Хронический панкреатит и острый панкреатит — это два совершенно разных заболевания, требующих различного подхода к их лечению и использованию лекарственных средств с различными механизмами действия. В норме у здорового человека поджелудочная железа вырабатывает секрет, содержащий некоторое количество неактивных ферментов, например трипсиноген. Выделяясь в кишечник, секрет попадает под влияние хлористоводородной кислоты желудочного сока, его ферменты становятся активными (трипсиноген переходит в трипсин) и принимают участие в процессе пищеварения. Хронический панкреатит характеризуется малым образованием секрета и недостаточным содержанием ферментов, необходимых для нормального пищеварения. Причиной хронического панкреатита может быть недостаточная активность желез желудка и низкая кислотность желудочного сока. При лечении хронического панкреатита стремятся повысить секрецию поджелудочной железы или используют препараты заместительной терапии, т.е. препараты, содержащие готовые ферменты поджелудочной железы или их синтетические аналоги. Естественным стимулятором секреции поджелудочной железы является хлористоводородная кислота желудочного сока. Она, попадая в кишечник, раздражает рецепторы двенадцатиперстной кишки и рефлекторно усиливает секрецию поджелудочной железы. Именно этот механизм действия лежит в основе лечения хронического панкреатита, развивающегося на фоне пониженной кислотности желудочного сока. В этом случае назначают кислоту хлористоводородную разбавленную по 10—15 капель в половине стакана воды на прием или употребляют 3% раствор кислоты хлористоводородной, разведенной по 1—2 столовые ложки на прием до или во время еды. Данный способ стимуляции поджелудочной железы используется сравнительно редко, чаще назначают препараты заместительной терапии, к

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	157стр. из 164

которым относятся Панкреатин, Мезим форте, Трифермент, Фестал, Панзинорм и др. ПАНКРЕАТИН (Pancreatinum) — препарат высушенной поджелудочной железы животных, содержит сумму активных и неактивных ферментов поджелудочной железы, преимущественно трипсин и амилазу, участвующих в переваривании пищи. Применяют препарат при хроническом панкреатите, расстройствах пищеварения, связанных с заболеваниями печени и поджелудочной железы, анацидном и гипоанацидном гастрите. Назначают панкреатин по 1—2 таблетки на прием до или во время еды 3 раза в день. В случае использования порошка его принимают до еды и запивают щелочной водой (нарзан, содовая вода). Выпускают панкреатин в порошке и таблетках, растворимых в кишечнике, по 0,25 и 0,5 г. МЕЗИМ ФОРТЕ (Mezym forte) содержит панкреатин, амилазу, липазу и протеазу, т.е. ферменты, обеспечивающие хорошую перевариваемость жиров, белков и углеводов. Используют препарат при недостаточной секреторной и переваривающей способности желудка и кишечника, хроническом панкреатите, холецистите и гепатите. Назначают Мезим форте по 1 драже перед приемом пищи до 3 раз в день. Выпускают препарат в виде драже или таблеток, покрытых оболочкой, в упаковке по 20 штук. ФЕСТАЛ (Festal) содержит ферменты поджелудочной железы, гемоцеллюлозу и желчь животных, которые способствуют лучшему перевариванию пищи.

Применяют Фестал при хронической недостаточности функций поджелудочной железы, метеоризме, холецистите, а также при недостаточности пищеварения в пожилом возрасте. Назначают препарат во время еды или после нее по 1—2 драже 3 раза в день. Выпускают Фестал в форме драже в упаковке по 100 штук. ПАНЗИНОРМ ФОРТЕ (Panzynorm forte) включает экстракт слизистой оболочки желудка (пепсин), сухой экстракт желчи и панкреатин. Наружная часть таблетки оказывает действие в желудке, а внутренняя часть, состоящая из желчи и панкреатина, действует активно в двенадцатиперстной кишке. Препарат используется в курсе заместительной терапии при нарушении пищеварения, гипофункции поджелудочной железы, гастродуодените, гепатите, холецистите, после операции на желудочно-кишечном тракте, поджелудочной железе и печени. Назначают препарат внутрь по 1 таблетке во время еды до 3 раз в день. Выпускают Панзинорм форте в таблетках в упаковке по 30 штук. При остром панкреатите один из важнейших и активнейших ферментов трипсин, участвующий в расщеплении белков, образуется в самой поджелудочной железе. В этом случае трипсин и другие ферменты начинают активно воздействовать на клетки поджелудочной железы и разрушают ее. Происходит «самопереваривание» тканей железы, которое нередко сопровождается сильными приступообразными болями. Для лечения острого панкреатита используют средства, снижающие секрецию поджелудочной железы, или средства, угнетающие активность ее ферментов. К первой группе относятся антацидные средства, нейтрализующие хлористоводородную кислоту и препятствующие ее рефлекторному влиянию на процесс выделения секрета поджелудочной железой. Подобным действием обладают М-холноблолирующие средства, которые, блокируя рецепторы желудка и поджелудочной железы, также снижают синтез и выделения секрета последней. Больным с острым панкреатитом иногда назначают внутрь 0,1% раствор атропина сульфата по 5—8 капель на прием. К препаратам, нарушающим синтез и снижающим активность поджелудочной железы, относятся Контрикал, Интиграл, Тразилол и др. КОНТРИКАЛ (Contrycal) — антиферментный препарат, угнетающий активность трипсина и других ферментов поджелудочной железы.

Назначают Контрикал при остром панкреатите, обострении хронического панкреатита, для профилактики панкреатита при операциях на поджелудочной железе. Кроме того,

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к
Лекционный комплекс	158стр. из 164

Контрикал способен снижать фибринолитическую активность, поэтому его иногда используют для остановки острых кровотечений. В качестве побочных явлений при применении Контрикала возможны аллергические реакции. Вводят Контрикал внутривенно (медленно!) или капельно по 20.000 ЕД или 30.000 ЕД, но не более 50.000 ЕД одновременно. Выпускают Контрикал в ампулах по 20.000 и 30.000 ЕД с приложением растворителя.

5. Желчегонные средства Желчегонными называют средства, повышающие образование желчи и способствующие ее выходу в двенадцатиперстную кишку. Их включают в состав гепатотропных средств, куда кроме желчегонных входят гепатопротекторные и холелитические средства. Желчь, которой в сутки образуется около литра, играет важную роль в процессе пищеварения. Выделяясь в двенадцатиперстную кишку, она участвует в переваривании жиров, всасывании жирорастворимых витаминов и оказывает существенное влияние на перистальтику кишечника. Однако процесс образования и выделения желчи может быть нарушен. Чаще всего это наблюдается при воспалительных заболеваниях желчного пузыря (холецистит), желчных протоков (холангит), в результате спазма или закупорки (камнем) желчных протоков, часто сопровождающихся резкими и сильными болями, носящими название печеночная колика, требующими оказания неотложной помощи. Желчегонные средства принято делить на две основные группы: 1) средства, повышающие образование желчи (желчеобразующие средства, или холесекретики); 2) средства, способствующие выделению желчи из желчного пузыря в двенадцатиперстную кишку (желчегонные средства, или холекинетики). Механизм образования желчи — рефлекторный. В норме желчь, вышедшая в кишечник, раздражает рецепторы слизистой оболочки и рефлекторно повышает образование желчи паренхиматозными клетками печени. Образующаяся желчь накапливается в желчном пузыре или выходит в кишечник. Желчеобразующие средства служат препаратами заместительной терапии при недостаточной функции печени. Они чаще всего в своем составе содержат желчь или ее компоненты (желчные кислоты и др.), эфирные масла, флавоноиды и другие вещества, способные рефлекторно влиять на секреторную функцию печени. К средствам, повышающим образование желчи, относятся таблетки Аллохол, Холензим, Лиобил, содержащие желчь, а также цветы бессмертника песчаного, кукурузные рыльца, барбарис и синтетические средства, обладающие еще противовоспалительным действием (никодин, циквалон). Все эти препараты увеличивают количество образующейся желчи, делают ее более жидкой, повышают ток желчи по желчным путям, снижают возможность выпадения в осадок холестерина желчи, предупреждают образование желчных камней. Они же усиливают секреторную и двигательную активность желудочно-кишечного тракта. ТАБЛЕТКИ АЛЛОХОЛ (Tabulettae Allocholum) содержат экстракты чеснока, крапивы, сухую желчь и активированный уголь. Препарат усиливает не только секреторную функцию печени, но секреторную и двигательную функцию желудочно-кишечного тракта, снижая одновременно процессы гниения, брожения и образования газов в кишечнике. Используют Аллохол для лечения гепатитов, холангитов, холециститов и хронических запоров, развивающихся на фоне атонии кишечника. Не рекомендуют применять препарат при острых формах гепатита, острой дистрофии печени и обтурационной желтухе. Выпускают в таблетках, покрытых оболочкой, желтого цвета по 10 и 50 штук в упаковке. ТАНАЦЕХОЛ (Tanacesecholum) — препарат из цветков пижмы обыкновенной, усиливает секрецию и выделение желчи, оказывает спазмолитическое действие на желчный пузырь и желчные протоки. Применяют Танацехол при хроническом холецистите и при дискинезии желчных путей. Назначают его внутрь после еды по 1—2 таблетки до 4 раз в день в течение

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	159стр. из 164	

3—4 недель. При использовании Танацехола возможны аллергические реакции. Выпускают препарат в таблетках по 0,05 г. НИКОДИН (Nicodinum) — синтетический препарат, обладающий желчегонным, противовоспалительным и противомикробным действием.

Применяют никодин для лечения холеститов, гепатитов, гепатохо- лециститов, при инфекциях желче- и мочевыводящих путей, а также при гастроэнтеритах. Его можно использовать вместе с антибиотиками и анальгетиками. Назначают никодин внутрь по 1— 2 таблетки на прием перед едой до 4 раз в день. Выпускают никодин в таблетках по 0,5 г в упаковке по 10 штук. БЕССМЕРТНИКА ПЕСЧАНОГО ЦВЕТЫ (Flores Helichrysi arenarii) содержат флавоновые гликозиды смолы и красящие вещества. Препараты бессмертника оказывают желчеобразующее действие, улучшают ток желчи, усиливают секреторную и двигательную функцию желудочно-кишечного тракта. Назначают внутрь в виде отвара из цветков (10,0 : 200 мл) по 1/2 стакана 2—3 раза в день в теплом виде за 30 минут до еды при желчекаменной болезни, хроническом холецистите, дискинезии желчных путей, хронических гепатитах и др. Выпускают в форме высушенных цветков в упаковке по 50 г. КУКУРУЗНЫЕ РЫЛЬЦА (Stigmata Maydis) — столбики с рыльцами, собранные в период созревания початков кукурузы. Они содержат ситостерол, стигмастерол, жирные и эфирные масла, сапонины, витамины К и С, горечи и другие вещества, оказывающие желчегонное, мочегонное и кровоостанавливающее действие. Используют в виде отвара (10,0 : 200 мл) по 1—3 столовые ложки каждые 3—4 часа, а экстракт — по 30—40 капель до 3 раз в день для лечения холецистита, холангита, гепатита, кровотечений и т.д. Выпускают высушенные столбики с рыльцами в коробках по 50 г или в виде жидкого экстракта во флаконах по 25 мл. К средствам, повышающим выделение желчи из желчного пузыря (холекинетики), относятся магния сульфат, препараты барбариса обыкновенного, оливковое масло и другие средства. МАГНИЯ СУЛЬФАТ (Magnesii sulfas) как желчегонное средство применяют внутрь или в лабораторной практике при исследовании функций печени, когда препарат вводят через зонд. Механизм действия препарата рефлексорный, но в отличие от желчеобразующих средств его импульсы повышают тонус желчного пузыря, вызывая его ритмические сокращения и открытие сфинктера Одди, давая свободный выход желчи в двенадцатиперстную кишку. Обычно для лабораторных исследований желчи используют не более 50 мл 30—33% стерильного раствора магния сульфата. Большие дозы вызывают слабительный эффект (!), что следует учитывать при использовании препарата. Для облегчения выделения желчи в случае спазмов желчевыводящих протоков, возникающих при холециститах, желчекаменной болезни, используют М-холиноблокирующие средства (атропин, платифиллин) и спазмолитические средства миотропного действия (папаверин, Но-шпа) и другие средства. Эти препараты расслабляют гладкие мышцы желчных протоков, облегчая выход желчи в кишечник.

6. Гепатопротекторные средства Гепатопротекторными называют вещества, повышающие устойчивость печени к воздействию токсических веществ, усиливающих обезвреживающие функции путем повышения активности ее ферментативных систем, и способствующие восстановлению нормального, рабочего состояния при различных повреждениях печени, например при алкогольной интоксикации. В состав гепатопротекторных препаратов входят ферменты и близкие к ним по химической структуре вещества — флаваноиды, участвующие в процессе переваривания пищи, защищающие печень от воздействия на нее вредных веществ, препятствующие гибели клеток печени и улучшающие их регенерацию и общее состояние больной печени. Гепатопротекторным действием обладают препараты различных фармакологических групп, среди которых препараты расторопши пятнистой

OÑTÚSTIK QAZAQSTAN MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	160стр. из 164	

(Карсил, Силибор), содержащие флаванойды, витамины группы Р и близкие к ним вещества (Рутин, Квертицин), препараты растений (ЛИВ-52) и др. **КАРСИЛ** (Carsil) содержит сухой экстракт расторопши пятнистой, в состав которого входит ряд флаванойдов. Механизм действия препарата обусловлен мембраностабилизирующим действием на клетки печени, устранением токсического разрушающего действия свободных радикалов, синтезом протеинов и фосфолипидов в пораженных клетках печени, обеспечивающих их регенерацию и восстановление функций. Это нормализует работу печени, улучшает общее состояние организма, повышает аппетит и настроение. Применяют Карсил при токсических поражениях печени, после перенесенного острого гепатита, стенозе печени, в комплексной терапии цирроза печени, для профилактики поражений печени вследствие длительного применения лекарств, алкоголя и хронической интоксикации печени различными веществами в условиях производства.

Назначают Карсил в драже по 0,035 г до еды 1—2 раза в день, а в более тяжелых случаях — до 4 раз в день. Курс лечения составляет 2—3 месяца. Побочные эффекты при использовании Карсила наблюдаются редко и протекают в форме тошноты, диспепсии, диареи, и в ряде случаев возможны кожные аллергические реакции. Не рекомендуют принимать препарат при беременности и кормлении грудью. Выпускают Карсил в драже по 0,035 г в упаковке по 80 шт. **СИЛИБОР** (Siliborum) содержит флаванойды расторопши пятнистой. Применяют его для лечения гепатитов, цирроза и других заболеваний печени. Назначают Силибор внутрь до еды по 1—2 таблетки на прием 3 раза в день в течение 1—2 месяцев. При применении возможны кожные аллергические реакции. Выпускают Силибор в таблетках по 0,04 г № 50. **ЭССЕНЦИАЛЕ** (Essentiale), **ЭССЕНЦИАЛЕ ФОРТЕ** (Essentiale forte) и **ЭССЕНЦИАЛЕ ФОРТЕ Н** (Essentiale forte Н) включают в свой состав эссенциальные фосфолипиды, витамины группы В, Е и другие вещества. Они нормализуют функции печени, метаболизм жиров и белков, повышают дезинтоксикационную функцию печени, восстанавливают ее структуру, улучшают регенерацию и препятствуют развитию соединительной ткани. Применяют при хронических гепатитах, циррозе печени, ее токсических поражениях, токсикозах беременности и при псориазе. Применяют Эссенциале форте Н во время еды внутрь по 1—2 капсулы 2—3 раза в день в течение 3 месяцев, а при необходимости курс лечения может быть продолжен. Иногда Эссенциале форте Н в виде раствора вводят в вену по 5—10 мл. При этом его не рекомендуют смешивать в одном шприце с другими лекарственными средствами. Среди побочных явлений при приеме внутрь иногда встречаются расстройства желудочно-кишечного тракта и аллергические реакции. Выпускают Эссенциале форте Н в капсулах по 30 или 100 штук и в ампулах по 5 мл в упаковке по 5 ампул.

7. Средства, влияющие на моторику кишечника Работа кишечника во многом зависит от деятельности парасимпатической нервной системы. Ее возбуждение приводит к повышению тонуса и усилению перистальтики кишечника, при этом возможно возникновение болей вследствие спазма гладкой мускулатуры. Подобное действие оказывают М-холиномиметические (ацеклидин), антихолинэстеразные (прозерин) средства, используемые иногда в хирургической практике после операций на желудочно-кишечном тракте с целью профилактики пареза или атонии кишечника. Блокада парасимпатической нервной системы вызывает расслабление мышц кишечника, устранение спазмов и боли, повышает склонность к запорам. Таким действием обладают М-холиноблокирующие (атропин и др.) средства, используемые для купирования кишечной колики и острых приступов язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Аналогичное действие могут оказывать ганглиоблокаторы (бензогексоний), но их

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ		SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	161стр. из 164	

применение очень ограничено из-за целого ряда вызываемых ими побочных эффектов. Для регуляции моторики кишечника и устранения воспалительных процессов иногда используют вяжущие, обволакивающие и адсорбирующие средства, которые тормозят перистальтику кишечника. Расслабить гладкую мускулатуру кишечника можно с помощью миотропных средств (Но-шпа, папаверин), применяемых для устранения болей при спазмах желудка и кишечника. Обратный эффект вызывают слабительные средства, используемые для устранения запоров, очистки кишечника при отравлениях, а также перед операцией, рентгеновским обследованием и иногда для изгнания гельминтов.

7.1. Слабительные средства Слабительные средства, раздражая рецепторы слизистой оболочки кишечника, повышают его тонус и перистальтику. Они же за счет задержки воды и электролитов разжижают содержимое кишечника и способствуют его более быстрому опорожнению. По характеру и силе действия слабительные средства оказывают послабляющий, слабительный и проносный эффект. В первом случае препараты вызывают нормальное опорожнение кишечника, во втором — образуют жидкий стул с постепенным опорожнением кишечника и в третьем — вызывают бурную перистальтику, жидкий стул и быстрое опорожнение кишечника. Выделяют слабительные, действующие: 1) на все отделы кишечника; 2) моторику тонкого кишечника; 3) моторику толстого кишечника. К первой группе относятся солевые слабительные, представителями которых являются магния сульфат и натрия сульфат. Назначают их по 15—30 г в стакане воды и запивают еще 1—3 стаканами воды. При таком способе проносный эффект наступает через 1,5—2 часа. Подобное действие препаратов объясняется тем, что они создают в кишечнике высокое осмотическое давление и препятствуют всасыванию жидкости. Это приводит к увеличению содержимого кишечника, его растяжению, вследствие чего раздражаются рецепторы, увеличивается перистальтика и происходит быстрое опорожнение кишечника. Солевые слабительные не только очищают кишечник, но и в случае отравления задерживают всасывание и поступление яда в кровь. Иногда в комбинации с противоглистными средствами их используют для удаления гельминтов из кишечника. К слабительным средствам, действующим в области тонкого кишечника, относятся в основном растительные масла: касторовое, оливковое, миндальное и др. **КАСТОРОВОЕ МАСЛО** (*Oleum Ricini*) — жирное масло, получаемое из семян травянистого растения клещевина (*Ricinus communis*). Препарат представляет густую, вязкую слегка желтоватую маслянистую жидкость со своеобразным неприятным вкусом. Назначают касторовое масло внутрь по 15—30 мл на прием (детям — 5—15 мл) лучше натощак. В тонком кишечнике под влиянием липазы оно расщепляется с образованием действующего вещества — рициноловой кислоты, которая, раздражая рецепторы кишечника, усиливает его перистальтику. Слабительный эффект после однократного приема препарата развивается через 5—6 часов, поэтому касторовое масло можно назначать на ночь, например, перед рентгеновским обследованием желудочно-кишечного тракта. Касторовое масло назначают при острых запорах, но не рекомендуется применять его при запорах в период беременности, вследствие того, что оно вызывает рефлекторное сокращение матки и, как следствие, преждевременные роды (выкидыш). Это свойство касторового масла иногда используют для рефлекторной стимуляции родов. Выпускают касторовое масло во флаконах по 30 мл и в желатиновых капсулах по 1,0 г. К группе слабительных средств, действующих на толстый кишечник, относятся препараты сенны, крушины, ревеня, содержащие в качестве действующего начала антрагликозиды, а также синтетические средства (Гутталакс, бисакодил). **ПРЕПАРАТЫ ЛИСТЬЕВ СЕННЫ** (*Folia Sennae*) используют в виде настоя 10 — 200 мл и в таблетках «Сенаде», «Сенадексин» и др. Из

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	162стр. из 164	

препаратов КРУШИНЫ используют жидкий экстракт или таблетки «Рам-нил» по 0,05 г. ГУТТАЛАКС (Guttalax) — слабительное средство, действие которого развивается за счет прямого стимулирования толстого кишечника. Используют препарат при всех видах запоров как атонических, так и спастических и для облегчения опорожнения кишечника при геморрое, трещинах прямой кишки и в послеоперационном периоде. Назначают препарат по 5—10 капель на прием с небольшим количеством воды 1—2 раза в сутки. Можно препарат применять на ночь, потому что слабительный эффект после его употребления развивается через 6—10 часов. Не рекомендуется применять препарат при диагнозе «острый живот» и при беременности. Выпускают Гутталакс во флаконах, содержащих по 10 мл препарата. БИСАКОДИЛ (Bisacodylum) — синтетический препарат, оказывающий сильное слабительное действие. Препарат расщепляется в щелочном содержимом кишечника, раздражает рецепторы и усиливает его перистальтику. При приеме внутрь в виде таблеток оказывает слабительное действие через 5—7 часов, а при введении в прямую кишку в виде суппозиториев — в течение первого часа.

Используют бисакодил при хронических запорах и для очистки кишечника при подготовке больных к операции или рентгеновскому исследованию органов брюшной полости. В последнем случае вечером принимают по 2—4 таблетки препарата, а утром вводят одну свечу. В качестве побочных эффектов возможны спазмы желудочно-кишечного тракта. Выпускают бисакодил в таблетках по 0,005 г в упаковке по 30 штук и в виде ректальных суппозиториев по 0,01 г в упаковке по 12 штук.

4. Иллюстративный материал. Презентация.

5. Литература. Приложение 1

6. Контрольные вопросы (обратная связь)

Задание 1. Заполните (по памяти) таблицу классификации «Средства, влияющие на функции органов пищеварения».

Повышают аппетит	Повышают секрецию желудка	Антацидные средства	Желчегонные средства	Слабительные средства

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казахстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к	
Лекционный комплекс	163стр. из 164	

Управление временем

№	Название этапа занятия	Теоретическое занятие (лекция, комбинированное занятие, мин.)
1	Организационный момент: а) организация рабочей обстановки на занятиях б) определение целей и задач занятия	10 минут
2	Актуализация опорных знаний по пройденной теме (методы и приемы)	20 минут
3	Изложение нового материала (план лекции)	40 минут
4	Закрепление пройденного материала (методы и приемы)	15 минут
5	Итоговый этап занятия: а) оценивание учащихся б) задание на дом	15 минут
		100 минут

Приложение №1

1. Основная литература

1. Орманов, Н. Ж. Фармакология. 1-кітап :оқулық / Н. Ж. Орманов, Л. Н. Орманова. - Алматы : Эверо, 2013. - 656 бет.с.
2. Орманов, Н. Ж. Фармакология. 2-кітап :оқулық / Н. Ж. Орманов, Л. Н. Орманова. - Алматы : Эверо, 2013. - 512 бет.с.
3. Харкевич, Д. А. Основы фармакологии:учебник.- М.:ГЭОТАР - Медиа, 2015. - 720 с.
4. Харкевич, Д. А. Фармакология :оқулық. - М. : ГЭОТАР - Медиа, 2014. - 784 бет.

1.1 Дополнительная литература

1. Машковский М.Д. Лекарственные средства. 16-е издание.перераб., доп. и испр. М. Новая волна. 2012. – 1216 с.
2. Орманов , Н. Ж. Фармакологический справочник лекарственных препаратов (классификация, номенклатура, механизм действия и показания к применению) : учеб.-методическое пособие /ЮКГФА. - ; Утв. на ученом Совете ЮКГФА. - Алматы :Эверо, 2013. - 138 с.

ОҢТҮСТІК ҚАЗАҚСТАН MEDISINA AKADEMIASY «Оңтүстік Қазақстан медицина академиясы» АҚ	 SKMA -1979-	SOUTH KAZAKHSTAN MEDICAL ACADEMY АО «Южно-Казакстанская медицинская академия»
Кафедра фармакологии, фармакотерапии и клинической фармакологии	044/41-19к 164стр. из 164	
Лекционный комплекс		

3. Фармакология терминдері мен түсініктері. Тезис рус қазақ-орыс тілдерінде : оқу құралы ; Ред. басқ. Қ. Д. Рахимов. - Алматы : Б. ж., 2011. - 449 бет.с.
4. Орманов, Н. Ж. Фармакология кесте мен сызбасы : оқу-әдістемелік құрал. - Алматы :Эверо, 2011. - 368 бет.с.

1.2 Электронная база

№	Название	Ссылка
1	Репозиторий ЮКМА	http://lib.ukma.kz/repository/
2	Республиканская межвузовская электронная библиотека	http://rmebrk.kz/
3	Консультант студента	http://www.studmedlib.ru/
4	Открытый университет Казахстана	https://openu.kz/kz
5	Закон (доступ в справочно -информационном секторе)	https://zan.kz/ru
6	Параграф	https://online.zakon.kz/Medicine/
7	Научная электронная библиотека	https://elibrary.ru/
8	Ашық кітапхана	https:// kitap.kz/
9	Thomson Reuters (Web of science)	www.webofknowledge.com
10	ScienceDirect	http://www.sciencedirect.com/
11	Scopus	https://www.scopus.com/