

Документ подписан простой электронной подписью  
Информация о владельце:  
ФИО: Локтионова Оксана Геннадьевна  
Должность: проректор по учебной работе  
Дата подписания: 25.09.2023 16:30:24  
Уникальный программный ключ:  
0b817ca911e6668abb13a5d426d39e5f1c11eabbf73e943df4a4851fda56d089

## МИНОБРАЗОВАНИЯ РОССИИ

Федеральное государственное бюджетное  
образовательное учреждение высшего образования  
«Юго-Западный государственный университет»  
(ЮЗГУ)

Кафедра биомедицинской инженерии

УТВЕРЖДАЮ  
Проректор по учебной работе  
О.Г. Локтионова  
« 25 » 09 2023 г.



## ФАРМАКОЛОГИЯ

Методические указания для самостоятельной работы  
студентов направления 30.05.03 «Медицинская кибернетика»

Курск 2023

УДК 602+007.57+615.41

Составитель: Н.М. Агарков

Рецензент

Доктор медицинских наук, профессор *В.А. Иванов*

**Фармакология** : методические указания для самостоятельной работы студентов направления 30.05.03 «Медицинская кибернетика» / Юго-Зап. гос. ун-т; сост.: Н.М. Агарков, Курск, 2023. 90с.

Содержат методические указания к выполнению практических работ по дисциплине «Фармакология». Приведена краткая теоретическая информация планы занятий.

Методические указания соответствуют требованиям программы, утвержденной учебно-методическим объединением по специальности 30.05.03 «Медицинская кибернетика».

Текст печатается в авторской редакции

Подписано в печать \_\_\_\_\_ . Формат 60x84 1/16.  
Усл.печ. л. \_\_. Уч.-изд. л. \_\_. Тираж 30 экз. Заказ **653** .Бесплатно.  
Юго-Западный государственный университет.  
305040, г. Курск, ул. 50 лет Октября, 94.

## ОГЛАВЛЕНИЕ

№ 1 Наркозные средства. Спирт этиловый.

№ 2 Снотворные средства. Противэпилептические средства. Противопаркинсонические средства.

№ 3 Болеутоляющие средства. Средства, вызывающие лекарственную зависимость

№ 4 Антипсихотические средства. Анксиолитики. Седативные средства. Средства для лечения маний. Антидепрессанты.

№ 5 Противотуберкулезные, противоспирохетозные и противопротозойные средства 2

Изониазид (Isoniasidum)- синтетический препарат группы ГИНК ПАСК.

№ 6 Противогрибковые, противовирусные и противоглистные средства.

№ 7 Антибиотики (тетрациклины, аминогликозиды, группа левомецетина, циклические полипептиды, линкозамиды, гликопептиды, фузидиевая кислота.

№ 8 Препараты гормонов белкового, пептидного строения и производные аминокислот, их синтетических заменителей и антагонистов

№ 9 Препараты гормонов стероидного строения, их синтетических заменителей и антагонистов

**Самостоятельная работа студента к занятию заключается в следующем:**

1. Самостоятельная работа студента предусматривает изучение дополнительных вопросов и научной литературы, относящейся к данной теме.
2. При выполнении самостоятельной работы студент должен определить цель этой работы.
3. При выполнении самостоятельной работы студент должен определить направления работы.
4. Самостоятельную работу студенту следует начинать с ознакомления с конспектом соответствующих лекций и материалов для выполнения самостоятельной работы.
5. Необходимо ознакомиться с соответствующими разделами учебника по данной теме.
6. Закрепление освоенного материала путем конспектирования.
7. В случае необходимости студент может обратиться к преподавателю за консультацией по интересующим его вопросам.

## № 1 Наркозные средства. Спирт этиловый

Анестезия - это утрата чувствительности. Лекарственные средства, вызывающие потерю чувствительности, называются анестетиками и делятся на общие и местные анестетические препараты. Общие анестетики вызывают утрату чувствительности всех видов, а также приводят к обратимой потере сознания. Местноанестезирующие средства в терапевтических концентрациях устраняют только болевую чувствительность в ограниченной зоне.

### МЕСТНОАНЕСТЕЗИРУЮЩИЕ СРЕДСТВА

К местным анестетикам относятся лекарственные средства, которые в определенных концентрациях блокируют нервную проводимость и вызывают местную потерю чувствительности. Они действуют на любую часть нервной системы и на любые виды нервных волокон. Местноанестезирующие средства в первую очередь устраняют болевую чувствительность. При углублении анестезии выключается температурная и другие виды чувствительности, в последнюю очередь - рецепция на прикосновение и давление. Местные анестетики, воздействуя на нервные клетки, блокируют их функциональную активность только на определенное время, в дальнейшем же их функция вновь нормализуется.

Местные анестетики предупреждают генерацию и проведение нервных импульсов. Их основная точка приложения внутренняя поверхность мембран нервных клеток. Они уменьшают проницаемость клеточной мембраны для ионов натрия, что препятствует образованию потенциала действия и проведению импульсов. Действие местных анестетиков на различные типы нервных волокон неодинаково. Как правило, мелкие нервные волокна более чувствительны к действию анестетиков, чем крупные. При этом немиелиновые волокна легче блокируются, чем миелиновые. Анестетики могут присутствовать в растворах в ионизированном и неионизированном состоянии. Неионизированные формы гораздо легче проходят через нервную оболочку. Местные анестетики обычно оказывают воздействие только в месте введения. Однако при определенных условиях часть лекарства может попадать в системный кровоток и давать общий эффект. Для снижения системного действия, токсического эффекта и пролонгирования эффекта местных анестетиков их часто используют в комбинации с сосудосуживающими веществами (адреналин).

Анестетики применяются при различных видах анестезии: поверхностной, инфильтрационной, проводниковой.

При поверхностной или терминальной анестезии анестетик наносят на поверхность слизистой оболочки, где он блокирует окончания чувствительных нервов, кроме того анестетик может быть нанесен на раневую или язвенную поверхность. При инфильтрационной анестезии

ткани, через которые пройдет операционный разрез, при этом анестетик блокирует нервные волокна, а также окончания чувствительных нервов.

При проводниковой - анестетик вводят по ходу нерва, возникает блок проведения возбуждения по нервным волокнам, что сопровождается утратой чувствительности иннервируемой ими области.

При спинномозговой (разновидность проводниковой) - анестетик вводят в пространство над оболочками спинного мозга, при этом анестетик блокирует проведение нервных импульсов по корешкам спинного мозга.

#### Классификация местных анестетиков.

По строению местные анестетики делятся на две группы: сложные эфиры (новокаин, дикаин, анестезин), метаболизирующиеся в плазме эстеразами, и замещенные амиды кислот (тримекаин, ксикаин), метаболизм которых происходит в основном в печени и определяется печеночным кровотоком.

В клинике местные анестетики разделяют по месту действия, которое зависит от особенностей фармакокинетики, активности и токсичности:

1. средства, применяемые для поверхностной анестезии: кокаин, дикаин, анестезин;
2. средства, применяемые для инфильтрационной и проводниковой анестезии: новокаин и тримекаин;
3. средства, применяемые для спинномозговой анестезии: совкаин;
4. средства, применяемые для всех видов анестезии: лидокаин.

Кокаин - относится алкалоидам, получаемым из листьев южно-американского растения *Erythroxylon coca*. Кокаин - первый анестетик, использованный в медицинской практике. Обладает высокой токсичностью, в связи с чем его применяют только место. Кокаин обладает хорошей чрескожной всасываемостью. Концентрированные растворы всасываются более медленно, чем разбавленные, ввиду выраженного сосудосуживающего действия первых. Метаболизируется эстеразой различных органов, частично печенью, некоторая часть гидролизуется эстеразой плазмы. Около 10% в неизменном состоянии экскретируется почками. 4% раствор кокаина используется в офтальмологической и отоларингологической практике. При этом максимальная анальгетическая активность продолжается 20-30 мин. Интоксикация кокаином включает в себя двигательное беспокойство, тахикардию, коллапс, судороги, кому и смерть от остановки дыхания. Воздействие на ЦНС на первом этапе выражается в возбуждении, повышении артериального давления со рвотой, с последующим депрессивным воздействием. Низкие дозы стимулируют дыхательный центр, высокие - вызывают угнетение. При длительном применении кокаина формируется психическая зависимость

Дикаин - производное парааминобензойной кислоты, по активности в 10 раз сильнее кокаина, но и в 5 раз токсичнее его. Используется только для поверхностной анестезии. Применяют в офтальмологической и

оториноларингологической практике. В офтальмологической практике при необходимости длительной анестезии применяют глазные пленки с дикаином. Дикаин хорошо всасывается через слизистые оболочки, поэтому превышение терапевтических доз может быть причиной тяжелой интоксикации. Дикаин противопоказан детям до 10 лет.

Анестезин - один из самых первых синтетических местных анестетиков (применяется более 100 лет). Он плохо растворим в воде. Его применяют наружно в виде присыпок, паст, мазей, а также энтерально для воздействия на слизистую оболочку пищеварительного тракта (например при болях в желудке) - в порошках, таблетках. Кроме того анестезин назначают в суппозиториях при трещинах прямой кишки и геморрое.

Новокаин - сложный эфир диэтиламиноэтанола и парааминобензойной кислоты. В медицинской практике используют в виде гидрохлорида. Обладает выраженной анестезирующей активностью. Через слизистые оболочки новокаин проходит плохо, поэтому для поверхностной анестезии применяется редко. Новокаин не суживает сосуды, поэтому часто его используют вместе с сосудосуживающими препаратами (адреналином). При парентеральном введении хорошо всасывается. В процессе всасывания новокаин быстро гидролизуется, большей частью в кровотоке, путем воздействия эстераз и холинэстераз плазмы. Продуктами энзиматического гидролиза являются парааминобензойная кислота и диэтиламинэтанол. С мочой экскретируется 80% препарата. Новокаин относится к препаратам с коротким действием. Продолжительность инфльтрационной анестезии составляет 30-60 минут. Препарат малотоксичен. При резорбтивном действии новокаин угнетает ЦНС, оказывает ганглиоблокирующее, гипотензивное и противоаритмическое действие. В больших дозах может вызвать судороги. Из-за высокого содержания в продуктах гидролиза новокаина парааминобензойной кислоты, которая является конкурентным антагонистом противобактериальных средств - сульфаниламидов, препарат не применяют совместно с сульфаниламидами.

Тримекаин - активное местноанестезирующее средство, действует более сильно и продолжительно, чем новокаин. Препарат малотоксичен и не оказывает раздражающего действия. Тримекаин применяют для инфльтрационной и проводниковой анестезии в виде 0,25%, 0,5% и 1% раствора, при спинномозговой анестезии - 5% раствора. Тримекаин обладает противоаритмической активностью (с этой целью его вводят внутривенно). Препарат может угнетать кору головного мозга, ретикулярную формацию ствола мозга.

Лидокаин (ксикаин) обладает более выраженной интенсивностью и продолжительностью действия по сравнению с другими анестетиками. В большинстве случаев является препаратом выбора, но требует осторожности при повышенной индивидуальной чувствительности. Лидокаин применяется при всех видах анестезии: терминальной, инфльтрационной, проводниковой. Обладает местным и системным свойством. Местный

эффект выражается в снижении болевой и других видов чувствительности. Системный эффект наблюдается, как правило, при введении больших доз препарата внутривенно и проявляется стабилизацией мембран клеток. Последнее позволяет использовать лидокаин как эффективное противоаритмическое средство при желудочковых формах аритмий (экстрасистолии, тахикардии).

Лидокаин быстро всасывается при парентеральном введении. Скорость абсорбции можно снижать при сочетании с адреналином. Одновременно с этим уменьшается частота развития токсических реакций и увеличивается продолжительность действия лидокаина. Анестетическое действие развивается быстро. Лидокаин метаболизируется в печени микросомальной оксидазой путем деалкилирования в моноэтилглицин и ксилит. Последний обладает анестезирующими и токсическими свойствами.

В растворах с концентрацией до 0,5% лидокаин одинаково токсичен с новокаином. Более концентрированные растворы (2%) превосходят по токсичности новокаин. В сравнении с новокаином он не оказывает токсического действия на функцию дыхания. Для подкожной и внутрикожной инфильтрации используют 0,25-0,5% растворы лидокаина, в сочетании с норадреналином. Для проводниковой блокады назначают 2% растворы с норадреналином; 4% раствор лидокаина применяют в офтальмологической практике для анальгезии без влияния на функцию глаз. В качестве противоаритмического средства он используется в виде 2% раствора внутривенно капельно. К наиболее частым побочным эффектам относятся беспокойство, бессонница, тремор, судороги, дыхательная недостаточность.

## СРЕДСТВА ДЛЯ НАРКОЗА (ОБЩИЕ АНЕСТЕТИКИ)

Общие анестетики вызывают обратимое угнетение ЦНС, которое проявляется временной утратой сознания, подавлением чувствительности, рефлексов и снижением тонуса скелетных мышц. Препараты этой группы угнетают межнейронную передачу возбуждения в ЦНС, вызывая функциональную дезинтеграцию различных отделов нервной системы. Хотя средства для наркоза угнетают все функциональные элементы ЦНС, полагают, что они ингибируют в основном восходящую активирующую ретикулярную систему, физиологически обуславливающую состояние бодрствования. Единой теории механизма действия средств для наркоза не существует. Структурные различия препаратов свидетельствуют о том, что они не являются средствами, действующими через единый специфический рецептор. Предложено несколько биофизических теорий наркоза: адсорбционная, липидная, гидратированных микрокристаллов. Но эти теории не объясняют всех особенностей развития наркотического эффекта и не являются универсальными. Для отдельных препаратов найдены специфические зоны связывания на мембранах нейронов. Например,



средства для неингаляционного наркоза связываются с ГАМК-бензодиазепин-барбитуратовым комплексом и потенцируют действие у-аминомасляной кислоты (ГАМК). Существует тесная взаимосвязь между силой наркотического эффекта вещества и его растворимостью в липидах. Это позволяет предположить, что анестезия наступает, когда определенное количество молекул анестетика занимает функционально важные гидрофобные радикалы в ЦНС, приводя к синаптической или постсинаптической блокаде.

Классификация средств для наркоза:

1. Средства для ингаляционного наркоза:
  - а) жидкие летучие вещества (фторотан, эфир для наркоза, метоксифлуран)
  - б) газы (закись азота, циклопропан).
2. Средства для неингаляционного наркоза:
  - а) барбитураты - гексенал, тиопентал-натрий;
  - б) небарбитуровые препараты - кетамин, оксибутират натрия.

Средства для ингаляционного наркоза

Ингаляционные анестетики делятся на жидкие и газообразные, а также на галогенсо-держащие (фторотан, метоксифлуран, трихлорэтилен) и негалогеновые (закись азота, эфир, циклопропан).

Применяемый в анестезиологии эфир содержит 96-98% диэтилового эфира. Препарат представляет собой бесцветную летучую жидкость с резким запахом.

Для развития эфирного (классического) наркоза характерно несколько стадий:

1. стадия анальгезии;
2. стадия возбуждения (нежелательная стадия);
3. стадия хирургического наркоза:
  - а). 1 -и уровень - поверхностный наркоз, б). 2-й уровень — легкий наркоз,
  - в). 3-й уровень - глубокий наркоз, г). 4-й уровень - сверхглубокий наркоз;
4. атональная стадия (недопустимая стадия).

Стадия анальгезии характеризуется подавлением болевой чувствительности. Сознание сохранено, но ориентация нарушена. Типична потеря памяти.

Для эфирного наркоза характерна длительная стадия возбуждения, которая объясняется повышением активности подкорковых структур. Сознание частично утрачено, наблюдается двигательное и речевое возбуждение, зрачки расширены. Дыхание учащается, отмечается тахикардия. В связи с раздражающим действием эфира может возникать кашель, гиперсекреция слюнных и бронхиальных желез, рвота.

В стадии хирургического наркоза сознание выключено, болевая чувствительность отсутствует, вегетативные рефлексy угнетены не полностью. Зрачки сужены. Артериальное давление стабильно, дыхание ритмично. Наблюдается расслабление скелетных мышц.

Пробуждение после эфирного наркоза происходит постепенно, в течение 30 минут. При этом полное восстановление функций головного мозга происходит через несколько часов. Длительно сохраняется анестезия.

При передозировке эфира наступает атональная стадия, связанная с резким угнетением дыхательного и сосудодвигательного центров продолговатого мозга. Объем и частота дыханий снижается, артериальное давление падает, зрачки расширены. Гибель наступает от остановки дыхания.

Для наступления анестезии требуется концентрация эфира от 10 до 20%. Поддерживающая анестезия проводится при концентрации от 3 до 5%. Метаболизируется в организме лишь незначительная часть эфира (10-15%). В основном он в неизменном виде выводится через легкие. Эфир проникает через плацентарный барьер и создает высокие концентрации в организме плода.

Преимущество эфирного наркоза заключается в том, что он является относительно безопасным средством для наркоза и достаточно мощным анестетиком, что позволяет проводить операции при концентрациях, не достигающих полного хирургического наркоза. Эфир оказывает курареподобное действие на скелетную мускулатуру и вызывает при этом достаточную релаксацию мышц. Побочные эффекты эфира:

- выраженная стадия возбуждения;
- раздражающее действие паров эфира;
- активация центральных звеньев симпатoadренальной системы (тахикардия, аритмии);
- нарушение диуреза (связано с высвобождением антидиуретического гормона и сужением почечных сосудов);
- частые тошнота и рвота в период восстановления.

Фторотан - мощный анестетик, который при комнатной температуре представляет собой бесцветную жидкость. Для введения в наркоз назначается в концентрации паров 2-4%, а для поддержания - 1-2%. 20% фторотана метаболизируется в печени. Терапевтическая широта относительно низкая и поэтому легко возникает передозировка. Осложнения - брадикардия (из-за повышения тонуса блуждающего нерва), гипотензия. Фторотан может вызвать сердечно-сосудистую недостаточность. Фторотан sensibilизирует миокард к адреналину и увеличивает его электрическую нестабильность, вызывает экстрасистолию, желудочковую тахикардию и фибрилляцию желудочков. В связи с этим на фоне фторотанового наркоза введение адреналина противопоказано.

Фармакологическое действие изофлюрана и энфлюрана сходно с фторотаном, но влияние на миокард и токсичность менее выражены.

Закись азота является бесцветным газом, в полтора раза тяжелее воздуха. Полная анестезия достигается при концентрации анестетика от 65 до 70%. Увеличение концентрации более 70% сопровождается развитием гипоксии, а меньшие концентрации не дают необходимой глубины наркоза, поэтому закись азота обычно комбинируют с другими активными препаратами,

например, фторотаном. Закись азота оказывает слабое миорелаксирующее действие, поэтому ее использование для общей анестезии должно проводиться совместно с премедикацией и мышечной релаксацией. 25-30% смесь закиси азота с кислородом дает выраженный анальгетический эффект и может с успехом использоваться (эквивалентно морфину) для купирования боли при инфаркте миокарда, аборте, родах, послеоперационном периоде, экстракции зубов.

Закись азота не метаболизируется. Ее распределение в организме происходит благодаря растворению в крови. Закись азота не связывается с гемоглобином и тканями организма и в неизменном виде элиминируется в основном через легкие. Выведение наступает через 2-5 мин после введения.

Закись азота является одним из самых безопасных средств для наркоза, и ее отрицательные воздействия на сердечно-сосудистую, дыхательную системы, печень и почки незначительны. Редко возникает тошнота и рвота.

### Средства для неингаляционного наркоза

Средства для неингаляционного наркоза обычно применяют внутривенно для проведения кратковременных хирургических операций (базисный наркоз), кроме этого препараты используют для введения больных в состояние наркоза (вводный наркоз), с последующим использованием средств для ингаляционного наркоза. Преимущества вводного наркоза при помощи неингаляционных препаратов - быстрое наступление хирургической стадии и отсутствие стадии возбуждения.

Тиопентал натрия - серный аналог фенобарбитала и широко используемый внутривенный анестетик. При внутривенном введении тиопентала уже через 10 секунд наступает терапевтический эффект и потеря сознания, которые продолжаются в течение 3-5 мин. Быстрое наступление действия препарата объясняется высокой растворимостью липидов и высокой степенью церебрального кровотока. Короткая продолжительность анестезии обусловлена быстрым снижением концентрации препарата в крови за счет интенсивного распределения его в других тканях и достижением равновесия между мозговой и тканевой концентрацией. Нежелательные эффекты препарата включают в себя угнетение дыхания и сердечной деятельности, развитие вазодилатации и гипотензии. Возможно развитие ларингоспазма. Не рекомендуется его сочетание с гипотензивными препаратами и средствами, снижающими сердечный выброс и угнетающими дыхательный центр.

Кетамин (калпсол, кеталар) - обладает выраженным наркотическим действием. Он вводится внутримышечно и внутривенно. Препарат характеризуется высокой растворимостью в липидах и быстрым тканевым распределением. Кетамин быстро переходит из плазмы в мозг. Его используют для вводного и основного наркоза, продолжительность наркоза в среднем 5-20 минут. Поддерживать наркоз можно либо повторно вводя

препарат, либо сочетая с ингаляционными анестетиками. Кетамин используют при кратковременных хирургических операциях. К побочным эффектам кетамина относятся гипертензия, тахикардия, галлюцинозный синдром, который купируется введением бензодиазепинов, боль и покраснение по ходу вены. Не рекомендуется сочетать кетамин с симпатомиметиками и средствами, обладающими стимулирующим воздействием на сердечнососудистую систему.

Сомбревин (пропанидид) - анестетический препарат очень короткого действия. Используется в основном для вводного наркоза. Как средство для мононаркоза может иногда использоваться в малой хирургии. Обладает коротким эффектом (начало через 30 секунд, максимум 3-5 минут, прекращается через 30 минут) за счет быстрого гидролиза псевдохолинэстеразой плазмы и печени. При недостаточности холинэстеразы плазмы длительность эффекта пролонгируется. Введение препарата часто сопровождается падением сердечного выброса, гипотензией, тромбофлебитами, гиперпноэ с последующим развитием апноэ.

Натрия оксибутират является синтетическим аналогом у-аминомасляной кислоты (ГА.МК). Оказывает седативное, снотворное, наркотическое и антигипоксическое действие. Препарат вызывает выраженную релаксацию скелетных мышц. При внутривенном введении наркоз продолжается 1,5-3 часа. При приеме через рот (препарат хорошо всасывается) через 30-40 минут наступает сон. Препарат применяют для вводного и базисного наркоза, как снотворное средство. Токсичность оксибутирата низкая. Возможно формирование зависимости.

#### Спирты

Спирт этиловый обладает широким спектром фармакологических свойств. Он является типичным веществом наркотического действия, оказывая общее угнетающее влияние на ЦНС. Действие на ЦНС развивается поэтапно: стадия возбуждения -> стадия наркоза —> атональная стадия. Стадия возбуждения является результатом угнетения тормозных механизмов мозга. Она хорошо выражена и продолжительна. Возникает эйфория, снижается самоконтроль, адекватная оценка окружающей обстановки. При повышении в крови концентрации спирта наступает анальгезия, сонливость, нарушение сознания (стадия наркоза). Стадия наркоза непродолжительна и быстро переходит в атональную стадию. Малая наркотическая широта и выраженная стадия возбуждения не позволяют использовать этиловый спирт в качестве средства для наркоза. К центральным эффектам этилового спирта относится влияние на центр терморегуляции, проявляющееся повышением теплоотдачи. Этиловый спирт снижает продукцию антидиуретического гормона задней доли гипофиза и усиливает диурез. Этиловый спирт (в концентрации ниже 20% ) стимулирует аппетит и повышает секрецию соляной кислоты. В большей концентрации спирт подавляет секрецию соляной кислоты и пищеварительную активность желудочного сока. Этиловый спирт обладает большим энергетическим потенциалом. Спирт оказывает выраженное

антисептическое действие. Этиловый спирт быстро всасывается в тонком кишечнике. 90% введенного спирта метаболизируется до углекислого газа и воды. Основной метаболизм спирта происходит в печени со скоростью 10 мл в час. Этиловый спирт окисляется при помощи алкогольдегидрогеназы до ацетальдегида, далее ацетальдегиддегидрогеназой до уксусной кислоты, далее до воды и углекислого газа. При длительном применении спирта, он повышает активность микросомальных ферментов печени. При этом скорость метаболизма самого спирта возрастает. Активация микросомального окисления - причина привыкания к этиловому спирту.

Применяют этиловый спирт как растворитель и экстрагент при изготовлении жидких лекарственных форм. Спирт широко используется в медицине как антисептик, этанол используют в качестве пеногасителя при отеке легких. Иногда его применяют как противошоковое, снотворное и седативное средство. Растворы этилового спирта применяют для стимуляции аппетита и желудочной секреции. При переохлаждении этиловый спирт применяют внутрь и наружно в качестве согревающего средства, но при этом человек должен находиться в теплом помещении.

При остром отравлении этиловым спиртом гибель наступает от остановки дыхания. Лечение острого отравления проводят с использованием искусственной вентиляции легких и форсированного диуреза.

К побочным эффектам этилового спирта относится зависимость (психическая и физическая), которая развивается при его длительном применении. Алкогольная зависимость (алкоголизм) характеризуется изменением высшей нервной деятельности, снижением интеллекта, умственной работоспособности памяти. Могут возникать психические расстройства (белая горячка) и поражения периферических нервов (полиневриты). При алкоголизме страдают и внутренние органы - возникает хронический гастрит, цирроз печени, жировая дистрофия печени и почек. Лечить алкоголизм чрезвычайно сложно. Из медикаментозных средств используется тетурам. Он задерживает окисление этилового спирта на уровне ацетальдегида, блокируя альдегиддегидрогеназу. Накопление ацетальдегида вызывает интоксикацию, при которой возникает чувство страха смерти, боли в области сердца, головная боль, гипотензия, тошнота, рвота. Возникновение перечисленных симптомов заставляет больного отказываться от употребления этанола.

Метиловый спирт в медицине не используется. Он хорошо всасывается в желудке и тонком кишечнике. Метаболизируется метиловый спирт в печени с помощью алкогольдегидрогеназы до образования формальдегида. Формальдегид обуславливает высокую токсичность метанола. Токсическое действие связано с угнетением ЦНС, развитием тяжелого метаболического ацидоза, поражением паренхиматозных органов, сетчатки глаза и зрительного нерва. Летальная доза метанола при приеме внутрь - 100 мл. Специфическая терапия отравления - 30% раствор этилового спирта по 50 мл через 3 часа 4 раза в день. Применение этилового спирта при отравлении

метанолом обусловлено тем, что сродство алкогольдегидрогеназы выше к этанолу, чем к метанолу. В то время, как этиловый спирт подвергается метаболизму, метанол выводится в неизмененном виде.

## **№ 2 Снотворные средства. Противозепитические средства. Противопаркинсонические средства**

Сон - состояние организма, которое характеризуется прекращением двигательной активности, снижением функции анализаторов, сокращением контакта с окружающей средой, более или менее полным отключением сознания. Сон - это активный процесс, при котором функция гипногенных (способствующих наступлению сна) структур головного мозга (отделы таламуса, гипоталамуса, ретикулярной формации) повышена, а функция активирующих структур (восходящая ретикулярная формация) снижена. Естественный сон состоит из двух фаз - "медленной" и "быстрой". "Медленный" сон (ортодоксальный, синхронизированный) занимает до 15% всей продолжительности сна, он обеспечивает физический отдых человека. "Быстрый" сон (парадоксальный, десинхронизированный, сопровождающийся быстрым движением глаз) составляет 20-25% от общей продолжительности сна, в эту фазу происходят важные психические процессы, например, консолидация памяти. Фазы сна чередуются. Нарушение длительности каждой фазы (при использовании лекарственных средств, психических нарушениях) крайне неблагоприятно отражается на состоянии организма. Например, при лишении человека "быстрого" сна, он в течение всего дня чувствует себя вялым, разбитым и в следующую ночь длительность этой фазы компенсаторно возрастает. При нарушениях сна назначают снотворные средства. Так, при нарушении засыпания назначают короткодействующие снотворные средства, а для поддержания необходимой продолжительности сна используют длительнодействующие препараты. Снотворные средства вызывают побочные эффекты: большинство препаратов нарушают естественный сон и вызывают постсомнические нарушения (вялость, заторможенность), развитие привыкания. К барбитуратам может развиваться физическое пристрастие.

Классификация снотворных средств по химическому строению

1. Производные бензодиазеина: нитразепам, флунитразепам.
2. Барбитураты: барбитал-натрий, фенобарбитал, этаминал-натрий.
3. Препараты разных групп: имован, оксипутират натрия (см. средства для наркоза), димедрол (см. антигистаминные средства).

Кроме того, снотворные средства различают по силе гипнотического действия, скорости наступления сна и его продолжительности.

Производные бензодиазеина (агонисты бензодиазепиновых рецепторов) Снотворный эффект бензодиазепинов связан с угнетающим влиянием препаратов на лимбическую систему и активирующую ретикулярную формацию. Механизм действия бензодиазепинов определяется

взаимодействием со специальными бензодиазепино-выми рецепторами. Бензодиазепиновые рецепторы являются частью макромолекулярно-го комплекса, включающего рецепторы, чувствительные к у-аминомасляной кислоте (ГАМК), бензодиазепинам и барбитуратам, а также ионофоры хлора. За счет аллостери-ческого взаимодействия со специфическими рецепторами бензодиазепины повышают аффинитет ГАМК к ГАМКд-рецепторам и усиливают тормозное влияние ГАМК. Происходит более частое открывание ионофоров хлора, при этом повышается поступление хлора внутрь нейронов, что приводит к увеличению тормозного постсинаптического потенциала.

Нитразепам оказывает выраженное снотворное, анксиолитическое, противосудорожное и центральное миорелаксирующее действие. Снотворное действие нитразепама наступает через 30-60 минут и продолжается до 8 часов. Препарат умеренно угнетает фазу "быстрого" сна. Он хорошо всасывается, имеет большой период полувыведения, мета-болизируется в печени. Препарат кумулирует. При повторном применении развивается привыкание. Показания для назначения - расстройства сна, особенно связанные с эмоциональным напряжением, беспокойством, тревогой.

Производные бензодиазепина - мидазолам (дормикум), флунитразепам (рогипнол), ал-празолам также используются в качестве снотворных средств.

Бензодиазепины отличаются от барбитуратов тем, что в меньшей степени изменяют структуру сна, обладают большей шириной терапевтического действия, не вызывают активации микросомальных ферментов.

Производные барбитуровой кислоты

Барбитураты взаимодействуют с аллостерическим участком ГАМКд-бензодиазепин-барбитуратного рецепторного комплекса и повышают аффинитет ГАМК к ГАМКА-рецепторам. Этот механизм приводит к угнетению ретикулярной формации. Фенобарбитал - это производное барбитуровой кислоты, обладающее длительным снотворным действием. При приеме препарата сон наступает через 30-60 минут. Продолжительность снотворного действия фенобарбитала - 8 часов. Сон, который вызывают барбитураты, менее физиологичен, чем сон, вызванный бензодиазепинами. Барбитураты существенно укорачивают "быстрый" сон, что при отмене препарата может приводить к развитию синдрома "отдачи"(возникает компенсация в форме увеличения доли "быстрого" сна). Барбитураты обладают противосудорожной и противосудорожной активностью. Фенобарбитал вызывает индукцию микросомальных ферментов печени, что повышает скорость биотрансформации ксенобиотиков и самого фенобарбитала. При повторном применении фенобарбитала активность его снижается, развивается привыкание. Симптомы привыкания появляются через две недели постоянного применения препарата. Длительное применение барбитуратов может приводить к развитию лекарственной зависимости. После барбитуратного сна часто возникает вялость, разбитость, снижение внимания.

Передозировка барбитуратами приводит к угнетению дыхательного центра. Лечение отравления начинают с промывания желудка, форсированного диуреза. При коматозном состоянии используется искусственная вентиляция легких. Антагонист барбитуратов - аналептик - бемеград.

Другие группы снотворных средств

Имован (зопиклон) является представителем нового класса психотропных средств - циклопирролонов, структурно отличных от бензодиазепинов и барбитуратов. Снотворное действие имована обусловлено высокой степенью сродства к местам связывания на рецепторном комплексе ГАМК в ЦНС. Имован быстро вызывает сон и поддерживает его, не уменьшая доли "быстрого" сна. Отсутствие сонливости наутро выгодно отличает имован от препаратов бензодиазепинового и барбитуратового ряда. Период полужизни - 3,5-6 часов. Многократный прием имована не сопровождается кумуляцией препарата или его метаболитов. Имован показан для лечения бессонницы, в том числе затрудненного засыпания, ночных и ранних пробуждений, а также вторичных нарушений сна при психических расстройствах. Длительное применение имована, как и других снотворных, не рекомендуется; курс лечения не должен превышать 4 недели. Наиболее частым побочным эффектом является ощущение горького или металлического вкуса во рту. Реже встречаются желудочно\*кишечные нарушения (тошнота, рвота) и психические нарушения (раздражительность, спутанность сознания, подавленное настроение). При пробуждении может отмечаться сонливость и реже головокружение и нарушение координации.

## ПРОТИВОСУДОРОЖНЫЕ И ПРОТИВОЭПИЛЕПТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Противосудорожные средства используют для устранения судорог любого происхождения. Причиной возникновения судорог могут быть заболевания ЦНС (менингит, энцефалит, эпилепсия), нарушение обменных процессов (гипокальциемия), гипертермия, интоксикация. Механизм действия противосудорожных средств заключается в угнетении повышенной активности нейронов, участвующих в формировании судорожной реакции и в подавлении иррадиации возбуждения путем нарушения синаптической передачи. К противосудорожным средствам относят оксибутират натрия (см. средства для наркоза), бензодиазепины, барбитураты, магния сульфат.

Противоэпилептические средства применяют для предупреждения или уменьшения судорог или соответствующих им эквивалентов (потеря сознания, вегетативные расстройства), наблюдаемых при периодически возникающих приступах различных форм эпилепсии. Единого механизма противоэпилептического действия у препаратов нет. Одни (дифенин, карбамазепин) блокируют натриевые каналы, другие (барбитураты, бензодиазепины) активируют ГАМК-систему и увеличивают поток в клетку



хлора, тр е-тьи (триметин) блокируют кальциевые каналы. Различают несколько форм эпилепсии:

большие припадки - генерализованные тонико-клонические судороги с потерей сознания, сменяющиеся через несколько минут общим угнетением ЦНС; малые припадки - кратковременная утрата сознания с миоклоническими судорогами; психомоторные автоматизмы - немотивированные действия с выключенным сознанием. В соответствии с клиническими проявлениями эпилепсии классифицируют противоэпилептические средства:

1. Средства, применяемые при больших эпилептических припадках: фенобарбитал, дифенин, гексамидин,.

2. Средства, применяемые при малых эпилептических припадках: этосукцимид, вальп-роат натрия, клоназепам.

3. Средства, применяемые при психомоторных припадках: карбамазепин, дифенин.

4. Средства, применяемые при эпилептическом статусе: сибазо фенобарбитал-натрий.

Средства, применяемые при больших эпилептических припадках Фенобарбитал (см. снотворные средства) для лечения эпилепсии используют в сублингвальных дозах. Эффективность препарата определяется его угнетающим влиянием на возбудимость нейронов эпилептогенного очага, а также на распространение нервных импульсов. При длительном применении фенобарбитала увеличивается образование и активность микросомальных ферментов печени. Фенобарбитал медленно и хорошо всасывается в тонкой кишке, его биодоступность - 80%. Максимальная концентрация в крови создается через 6-12 часов после приема разовой дозы препарата. Период полужизни составляет в среднем около 10 часов. При назначении препарата, особенно в первое время отмечается сонливость.

Дифенин блокирует натриевые каналы, пролонгирует время их инактивации и тем самым препятствует генерации и распространению электрических разрядов в ЦНС и этим предупреждает развитие судорог. Дифенин очень хорошо всасывается в ЖКТ, его биодоступность достигает почти 100%. На 90% он связывается с белками плазмы крови, даже небольшое снижение связывания с альбуминами приводит к значительному возрастанию количества свободного вещества в крови, усилению его эффектов и возможности развития интоксикации. Стабильная концентрация в крови достигается через 1-2 недели приема препарата. Метаболизм дифенина происходит за счет его гидроксилирования в печени с образованием глюкуронидов. Дифенин - активный индуктор микросомальных ферментов гепатоцитов. Он стимулирует собственную биотрансформацию, а также инактивацию в печени других противоэпилептических средств, стероидных гормонов, тироксина, витамина Д. Лечение эпилепсии длительное и поэтому большое внимание необходимо уделять развитию побочных эффектов. Длительный прием препарата вызы-

вает развитие периферической нейропатии, гиперплазию десен, гирсутизм, мегалобла-стическую анемию.

Гексамидин по химической структуре близок фенобарбиталу, но менее активен. Препарат хорошо всасывается. В процессе метаболизма в печени 25% гексамидина превращается в фенобарбитал. Препарат может вызывать сонливость, головокружение.

Средства, применяемые при малых эпилептических припадках

Этосуксимид - быстро и полно всасывается при приеме внутрь, максимальная концентрация в крови создается через 1-4 часа. С белками плазмы крови препарат не связывается, биотрансформируется в печени путем гидроксилирования и глюкуронизации. С мочой в неизменном виде экскретируется около 20% введенной дозы этосуксемида. Нежелательные побочные эффекты: беспокойство, боли в животе, при длительном применении - развитие эозинофилии и других нарушений кроветворения, красной волчанки. Натрия вальпроат - ингибитор ГАМК-трансаминазы - уменьшает инактивацию ГАМК -одного из основных тормозных нейромедиаторов. Препарат не только предупреждает развитие эпилептических припадков, но и улучшает психический статус больного, его настроение. Препарат хорошо всасывается в ЖКТ, биодоступность составлен около 100%. С белками плазмы крови натрия вальпроат связан приблизительно на 90%. Признаками интоксикации натрия вальпроатом являются заторможенность, нистагм, нарушения равновесия и координации. При длительном применении возможно поражение печени, панкреатит, снижение агрегации тромбоцитов.

Клоназепам относится к группе бензодиазепинов, являющихся ГАМК-потенцирующими средствами, способными повышать чувствительность ГАМКд-рецепторов к ГАМК. Биодоступность клоназепама составляет около 98%, биотрансформируется в печени. Побочные эффекты: повышенная утомляемость, дисфория, нарушения координации, нистагм.

Средства, применяемые при психомоторных припадках

Карбамазепин (финлепсин) похож по структуре на трициклические антидепрессанты. Механизм действия препарата связывают с блокадой натриевых каналов. Его противо-эпилептический эффект сопровождается улучшением поведения и настроения больных. Карбамазепин кроме противозепилептического действия обладает способностью снимать боли при невралгии тройничного нерва. При приеме внутрь всасывается медленно, биодоступность - 80 %. Биотрансформируется с появлением активного метаболита в печени - эпоксида. Эпоксид обладает противозепилептической активностью, составляющей 1/3 от таковой у карбамазепина. Карбамазепин относится к индукторам микросомальных ферментов печени, причем стимулирует и собственную биотрансформацию. Его период полужизни в течение первых недель лечения снижается примерно с 35 до 15-20 часов. Первые признаки интоксикации: диплопия, нарушения равновесия и координации, а также угнетение ЦНС, нарушение функции ЖКТ. При длительном применении препарата возможно появление сыпи на коже,

поражение кроветворной функции костного мозга, нарушение функции почек и печени.

Паркинсонизм - синдром поражения экстрапирамидной нервной системы, характеризующийся сочетанием тремора (дрожания), экстрапирамидной мышечной ригидности (резко повышенным тонусом мышц) и акинезии (скованностью движений). Различают болезнь Паркинсона, вторичный паркинсонизм (сосудистый, лекарственный, и др.) и синдром паркинсонизма при дегенеративных и наследственных заболеваниях ЦНС. Несмотря на различную этиологию этих заболеваний, патогенез симптомов сходен и связан с прогрессирующей дегенерацией нигростриарных нейронов, в результате чего снижаются синтез дофамина и активность дофаминергических систем, при этом активность холинергических систем (которые также принимают участие в регуляции мо-

торных функций) относительно или абсолютно повышается. Фармакотерапия паркинсонизма направлена на коррекцию этого дисбаланса нейромедиаторов, обеспечивающих деятельность экстрапирамидной нервной системы. Для фармакотерапии паркинсонизма применяют:

1. Средства, влияющие на дофаминергические структуры мозга:
  - а). Предшественник дофамина - леводопа, леводопа с ингибитором ДОФА-декарбоксилазы - карбидопой (наком);
  - б). Дофаминомиметики - прямые (бромокриптин) и непрямые (мидантан)
2. Вещества, угнетающие холинергические структуры мозга (центральные холиноли-тики) - циклодол.

Средства, влияющие на дофаминергические структуры мозга Леводопа

Так как дофамин (и другие катехоламины) не проходит через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ), для заместительной терапии применяют метаболический предшественник дофамина - леводопу, которая проходит через ГЭБ и в дофаминергических нейронах под действием церебральной ДОФА-декарбоксилазы (ДДК) превращается в дофамин. Леводопа снижает мышечную ригидность и гипокинезию при небольшом воздействии на тремор. Лечение начинают с субпороговой дозы и постепенно, в течение 1,5-2 мес, повышают дозу до наступления эффекта. При быстром увеличении индивидуальной дозы возрастает риск раннего появления побочных эффектов со стороны желудочно-кишечного тракта и сердечно-сосудистой системы. Это обусловлено тем, что в желудочно-кишечном тракте и кровяном русле происходит "преждевременное" декарбоксилирование леводопы с образованием не только дофамина, но и норадреналина и адреналина. Это в 50 - 60% случаев приводит к появлению тошноты, рвоты, кишечным дискинезиям, нарушению сердечного ритма, стенокардии и колебанию артериального давления. "Преждевременному" декарбоксилированию подвергается до 80% принятой внутрь леводопы и только 1/5 часть принятой дозы достигает головного мозга и метаболизируется церебральной ДДК с образованием дофамина. Поэтому целесообразно применение леводопы в сочетании с ингибиторами периферической ДДК -

карбидопой или бенсе-разидом Ингибиторы периферической ДДК тормозят преждевременное декарбоксилирование леводопы в желудочно-кишечном тракте и кровеносном русле. При приеме препаратов леводопы с ингибитором ДДК частота сердечно-сосудистых и гастроэнтерологических осложнений снижается до 4- 6%. В то же время торможение "преждевременного" декарбокслирования в 5 раз увеличивает поступление принятой дозы леводопы через ГЭБ в головной мозг. Поэтому при замене "чистой" леводопы препаратами с ингибитором ДДК назначают в 5 раз меньшую дозу леводопы.

Бромкриптин - производное алкалоида спорыньи - эргокриптина. Является специфическим агонистом O<sub>2</sub>-дофаминовых рецепторов. Препарат обладает отчетливой противопаркинсонической активностью. В связи с влиянием на дофаминовые рецепторы гипо-талямуса бромкриптин оказывает тормозящее действие на секрецию гормонов передней доли гипофиза, особенно пролактина и соматотропина. Недостатками являются меньшая эффективность по сравнению с леводопой и большая частота побочных эффектов (тошнота, рвота, анорексия, понос, ортостатическая гипотония, периферический вазоспазм, психические расстройства).

Амантадин (мидантан) эффективен почти у половины больных, особенно в сочетании с антихолинергическими средствами. Амантадин блокирует глутаматные рецепторы, усиливает выделение допамина в синаптическую щель. Его положительным качеством является воздействие на тремор. Побочными эффектами при лечении амантадином являются беспокойство, головокружение. Глюкуронид мидантана - глудантан уступает в фармакотерапевтической активности амантадину гидрохлориду, но реже дает побочные эффекты.

Селегилин (депренил, юмекс) - селективный ингибитор моноаминоксидазы типа В (МАО-В), которая участвует в деградации дофамина. Таким образом, селегилин потенцирует эффект леводопы. Селегилин увеличивает продолжительность жизни больных, получающих леводопу. Этот препарат оказывает антиоксидантное действие на допаминергические клетки, а возможно обладает нейропротекторным действием, замедляя прогрессирование заболевания.

Ингибиторы катехол-О-метил-трансферазы (КОМТ)

КОМТ в результате естественного метаболизма преобразует L-ДОФА в 3-О-метилдофу, а дофамин - в 3-О-метилдофамин. Эти соединения не участвуют в осуществлении функции дофаминовых нейронов. Ингибиторы КОМТ препятствуют метаболизму дофамина и его предшественника. Ингибитором КОМТ, проходящим ГЭБ, т. е. действующим и на периферии, и в головном мозге, является толкапон. Добавление толкапона к леводопе повышает и пролонгирует стабильный уровень леводопы в плазме на 65%.

Холинолитические средства (См. холинолитики)

Холинолитические средства при паркинсонизме купируют относительное или абсолютное повышение активности холинергических систем. Все они

являются антагонистами холинорецепторов и клинически приблизительно равноценны. Улучшение наступает у 3/4 больных, причем особенно уменьшается ригидность. Холинолитические средства противопоказаны при глаукоме и аденоме предстательной железы. Побочные явления: сухость во рту, нарушение зрения. Наиболее часто применяемый при паркинсонизме холинолитик - циклодол.

### **№ 3 Болеутоляющие средства. Средства, вызывающие лекарственную зависимость**

Наркотические вещества довольно широко применяются в современной медицине как обезболивающие и усыпляющие средства. Но этим эффектом воздействие наркотических веществ на центральную нервную систему не ограничивается. Многие из них вызывают у людей особое психическое состояние возбуждения — эйфорию. Будучи субъективно привлекательной, эйфория — объективно вредное состояние, так как при этом человек всегда в той или иной степени отключается от реальности. Поэтому он испытывает желание вновь и вновь повторить это состояние. В результате развивается пагубное пристрастие. Человек стремится отключиться от реальности. Резко меняется его отношение к окружающему, рушится вся система ценностной ориентации. Наркотики разрушают нервную систему и отрицательно влияют практически на все органы и ткани.

Лекарственная зависимость - психическое, может быть физическое состояние, включающее настоятельную потребность в приеме лекарственных средств, действующих на психику. Длительное употребление многих лекарств, особенно психотропных препаратов, способно вызвать привыкание. Лекарства и средства при лекарственной зависимости перестают оказывать своё фармакологическое действие, а зачастую наоборот приводят к парадоксальному, противоположному своему назначению результату.

#### **2. Виды лекарственной зависимости**

Существует два вида лекарственной зависимости: физическая и психическая.

**Психическая зависимость**- состояние, при котором лекарственное вещество вызывает чувство удовлетворения и психического подъема и требует периодического введения лекарственных веществ для нормализации психического состояния. При психической лекарственной зависимости прекращение приема, вызвавшего её вещества, сопровождается эмоциональным и психологическим дискомфортом. Психическая зависимость от лекарств возникает в результате сформировавшегося на рефлексорном уровне мнения человека, что после принятия антидепрессанта



периоды при этом не редки. Так, при мигрени нередко абстинентный синдром характеризуется болями, усиленная кальцификация, понос. Отмена барбитуратов психри вызывает Д.Д. приводит к судорожным разрядам, отмена транквилизаторов — к тазовожелудочному спазму и т.д.

### 3. Токсикомания

Тот трюк скотч: дт (умаспастево, безупрца) баблеловатпа, вызванное (ое) хроническим употреблением наркотиков вызывает психические расстройства, при этом, по сравнению с нормальными психическими функциями и реакциями, человек ощущает нарушение сознания, дезориентацию в пространстве и времени, остроты зрения, слуха, вкуса, обоняния, изменение толерантности к потреблению веществ, психическими и физическими расстройствами, изменениями личности. Психическая зависимость проявляется болезненным стремлением (настойчивым) к употреблению наркотических препаратов, психическим дискомфортом, чтобы избежать отравления или других физических дискомфорта. У наркомана есть целенаправленное (целесообразное) поведение, его основой являются получение необходимого вещества. Физическая зависимость характеризуется возбудительством, тогда проявляется тремор, охватывающий все тело, учащаются случаи чередования психических нарушений, которые объясняются как абстинентный синдром (синдром отмены). Токсикомания характеризуется миссиями преобразования веществам. В первую очередь к ним относят преципитаты, обладающие и седативным и стимулирующим эффектом: препараты барбитуратов (карбамазепин, фенобарбитал и другие), ролитал, транквилизаторы (диазепам, алпразолам, клоназепам, мепробамид, шпрингидин и другие). Токсикомания может быть обусловлена употреблением антипаркинсонических (циклодол) и антигистаминных (дифенгидрамин, пипольфен) препаратов, психостимуляторов (адреналин, амфетамин, кофеин, метилфенилат, пикарил и другие), комбинация психостимуляторов (амфетамин и другие), препараты для лечения болезни Паркинсона (леводопа, бипроланолон). Копию группу составляют вещества, которые не относятся к лекарственным средствам, но они являются причиной негативной зависимости. Это популярное ацетилхолинное средство атропин, паллол, бензол, перхлорат, ацетон, бензин, а также различные средства бытовой химии. ол,

**Наркомания** — это острая и тяжелая зависимость от средств сильной стимуляции, которая возникает вследствие злоупотребления наркотиками. Она также вызвана отравлением газом, может привести к коме или судорогам или глубокому сну. Примерами наркотиков являются героин, кокаин, морфин и метадон.

Привести к потере сознания или глубокому сну. Примерами наркотиков являются героин, кокаин, морфин и метадон.

При приеме наркотиков могут быть уменьшены те же виды работ, в которых находятся в обществе, сильное головокружение, нарушение способности к концентрации внимания, тусклая слеза, настроенная, расслабленность, уменьшения личности, анкетные ответы. Человек, уже реабилитированный наркоман, возмущает остальные вещи может внезапно и резко поменяться. При употреблении крепких напитков, нарушается режим. В бане и в горячих саунах изменяется состояние в организме.

Нередко все предостережение приема наркотиков может привести к развитию нежелательных последствий, например, на догадку, ситуативная депрессия, заключающаяся в ширьму или тошнотливости. Также Вы можете отказаться от их приема в попытке избежать от наркотической зависимости.

### Зависимость от синтетических средств.

Зависимость от синтетических средств, которые внесены в список наркотиков, рассматривается как барбитураты, но в более сложных случаях как транквилизаторы. Как правило, транквилизаторы первоначально вызывают в результате употребления барбитуратами, а затем постепенно для целей приспособления к любым социальным ситуациям, а в ряде случаев и отдаленных, могут.

Зависимость от синтетических средств, которые внесены в список наркотиков, чаще наблюдается у людей, страдающих бессонницей, тревожностью и плохим настроением. Синтетические препараты поначалу улучшают их субъективное состояние, купируют бессонницу, стабилизируют эмоциональное состояние, снимают актуальную тревожность. Небольшую роль в развитии пристрастия играет эйфория, а также эффект «тяги» препарата, передающийся наиболее часто уже при первых приемах синтетических. В последующем, однако, большие вынуждены наращивать дозы, принимать синтетические в больших количествах. В оптимальных условиях препарат барбитуратов создает в активной форме не только транквилизирующую, стабилизирующую, но и психотропную, детерминированную, замедленную рефлексию и мышление. Начиная с определенных приемов барбитуратов и алкоголя, происходит их синергическое усиление эффекта, что может привести к смерти при явлениях паралича дыхания. Непрерывный прием препаратов более трех недель вызывает привычку в сочетании с нарушенными функциями тела, приводит к тошноте, снижению аппетита, снижению выносливости, снижению функций. Помимо стандартных признаков зависимости, при приеме синтетических препаратов пристрастие к ним может привести к синдрому абстиненции даже через две недели после прекращения приема.



# № 4 Антипсихотические средства. Анксиолитики. Седативные средства. Средства для лечения маний. Антидепрессанты

Антипсихотические средства (нейролептики) используются для лечения психозов, маниакально-депрессивного психоза, шизофрении. Шизофрения — хроническое, при котором люди теряют контакт с реальностью, у них постоянно раздражены и слуховые галлюцинации, депрессивные переживания («тоска», эмоциональная реакция), в общем случае имеют место расстройства мышления. Психозы включают в себя нарушения деятельности ЦНС, при которых имеет место нарушение мышления, сознания и поведения и бред. В основе лежат с наследственным, врожденным. Нарядом с наследственным психозом (шизофреническим психозом), шизофреническим психозом встречается также маниакально-депрессивный психоз и бред у людей.

Острые формы шизофрении встречаются у 1,12% людей в возрасте 18 - 44 лет (биполярная форма чаще всего, месяцев), у 0,6% в возрасте 5 - 64 лет и у 0,1% людей в 65 лет и старше. 5% случаев шизофрении приходится на острую форму шизофренического психоза от 1:10 до 1:50 у пожилых людей по сравнению с более молодыми.

Препараты, которые могут вызвать психозы (галлюцинации) или бред

Для выявления побочных эффектов в амбулатории необходимо уметь распознавать (дифражер, галлюцинации) для выявления перед началом приема антипсихотических препаратов надо тщательно выяснять, не вызваны ли эти симптомы приемом лекарственных препаратов. Для толерантности 60 лет и старше существует высокая вероятность галлюцинации, депрессии или тревожные симптомы, сходные с симптомами шизофренического психоза, могут быть вызваны приемом пероральных и инъекционных препаратов, приемом алкоголя, барбитуратов или других седативных средств и транквилизаторов. Среди часто встречающихся препаратов, которые могут привести к появлению таких симптомов, как галлюцинации или депрессия, можно выделить следующие:

- Также наркотические и ненаркотические анальгетики, как метамфетамин (МФЭТ), амфетамин (АМФ), морфин, пентамин (ПЕНТАМИН) и салицилаты (аспирин);
- Антибиотиками и другие шизоаналитические средства: пиперазон, ацидозин (ЗОВИРАКС), амидин (МЕДАНТ), амфетерин В (ФУНГИЗОН), хлоралит (ПЕЛАГИН), пиклофен, этанамид, пивонит (НАДРАИД), пивонитовая кислота (ПРАМ), фенитин (ФЕНИТИН);
- Также противосудорожные препараты, как фенобарбитал (ФЕНОБАРИТАЛ), фенитоин (ДИФЕНИН) и примидин (ГЕКСАМИДИН),

- Антиаллергические препараты, например, антигистамины (супрастин, тавегил и т.д.).
- Такие антипаркинсонические препараты, как леводопа и карбидопа (комбинированный препарат - п.п.) или бромокриптин (ПАРЛОДЕЛ).
- Антидепрессанты, например, тразодон (АЗОНА) и такие трициклические антидепрессанты, как amitriptilin (АМИЗОЛ) и доксепин.
- Такие кардиотропные средства, как препараты напрестьянки (дигоксин и т.д.), лидокаин (КСИЛОКАИН) и прокаинамид (НОВОКАИНАМИД).
- Антигипертензивные препараты, например, клонидин (КЛЮФЕЛИН), метилдопа (ДОПЕГИТ), празозин (ПОЛЬПРЕССИН) и пропранолол (ИНДЕРАЛ).
- Такие средства от насморка, как эфедрин, оксиметазолин (НАЗОЛ), и псевдоэфедрин.
- Такие наркотические препараты, как амфетамины (большинство амфетаминов (например, фенамин, первитин, "экстази") не вызывают галлюцинаций. Среди амфетаминов, обладающих галлюциногенным действием, наиболее известен мескалин), РСР (фенициклидин), барбитураты, кокаин и крэк (свободное основание кокаина). Также следует отметить, что галлюцинации могут быть обусловлены случайным или намеренным употреблением в пищу некоторых наркотических растений, например отдельных видов грибов).
- Такие транквилизаторы, как алпрозолам (КСАНАКС), диазепам (РЕЛАНИУМ), и триазолам.
- Такие стероиды, как дексаметазон (ДЕКСАВЕН) и преднизолон (ДЕКОРТИН).
- Другие препараты, например, атропин, аминокaproновая кислота, баклофен, циметидин (ТАГАМЕТ), ранитидин (ЗАНТАК), дисульфирам (ЭСПЕРАЛЬ), гормоны щитовидной железы и винкристин (ЦИТОМИД).

Седативные средства (от лат. *sedatio* — успокоение) — лекарственные средства, оказывающие общее успокаивающее действие на ЦНС. Седативный (успокаивающий) эффект проявляется в снижении реакции на различные внешние раздражители и некотором уменьшении дневной активности.

Препараты этой группы регулируют функции ЦНС, усиливая процессы торможения или понижая процессы возбуждения. Как правило, они облегчают наступление и углубляют естественный сон, усиливают действие снотворных, анальгетиков и других средств, угнетающих ЦНС.

К седативным средствам относятся препараты брома — натрия бромид и калия бромид, камфора бромистая, а также препараты, изготовленные из лекарственных растений (валерианы, пустырника, пассифлоры, пиона и др.).

Бромиды начали применяться в медицине очень давно, еще в XIX веке. Влияние солей брома на высшую нервную деятельность было детально изучено И.П. Павловым и его учениками при экспериментально вызванных неврозах у собак, а также на здоровых животных.

Согласно данным школы И.П. Павлова, основное действие бромидов связано со способностью концентрировать и усиливать процессы торможения в коре головного мозга, восстанавливая нарушенное равновесие между процессами торможения и возбуждения, особенно при повышенной возбудимости ЦНС. Действие бромидов зависит от типа высшей нервной деятельности и функционального состояния нервной системы. В экспериментальных условиях показано, что для получения одинакового лечебного эффекта животным со слабым типом нервной деятельности требуются меньшие дозы бромидов, чем животным с сильным типом нервной деятельности. Кроме того, как правило, чем меньше выраженность функциональных нарушений в коре головного мозга, тем меньшие дозы требуются для коррекции этих нарушений.

Зависимость величины терапевтических доз бромидов от типа нервной деятельности нашла подтверждение и в клинике. В связи с этим необходимо учитывать тип и состояние нервной системы при подборе индивидуальной дозы.

Препараты брома применяют при различных невротических расстройствах в качестве успокаивающих средств. Бромиды обладают также противосудорожной активностью, но в качестве противоэпилептических средств в настоящее время они используются очень редко (см. ПРОТИВОЭПИЛЕПТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА).

Следует учитывать, что особенностью солей брома является медленное выведение из организма (концентрация в плазме крови снижается наполовину примерно через 12 дней). Бромиды накапливаются в организме и

могут стать причиной хронического отравления (бромизма), проявляющегося общей заторможенностью, апатией, нарушениями памяти, появлением характерной кожной сыпи (*acne bromica*), раздражением и воспалением слизистых оболочек и др.

В медицине широкое применение издавна нашли препараты, полученные из лекарственного сырья — корневищ и корней валерианы, цветущих верхушек травы пустырника, побегов с листьями травы пассифлоры и др. Действие средств растительного происхождения обусловлено входящими в их состав эфирными маслами, алкалоидами и др.

Препараты валерианы содержат эфирное масло, состоящее из сложных эфиров (в т.ч. спирта борнеола и изовалериановой кислоты), борнеол, органические кислоты (в т.ч. валериановую), а также некоторые алкалоиды (валерин и хатинин), дубильные вещества, сахара и др. Валериана оказывает умеренное успокаивающее действие, усиливает действие снотворных средств, обладает также спазмолитическими свойствами.

Основными биологически активными веществами, входящими в состав препаратов пустырника являются флавоноловые гликозиды, эфирные масла, малотоксичные алкалоиды, сапонины, дубильные вещества.

Имеются комбинированные препараты (Валидол, Валокордин и др.), которые содержат различные успокаивающие вещества.

Несмотря на наличие современных транквилизаторов, седативные средства продолжают широко применяться в медицинской практике. Основными показаниями к назначению седативных средств являются повышенная нервная возбудимость, раздражительность, вегето-сосудистые расстройства, нарушения сна, неврозы (в начале лечения), в т.ч. кардионеврозы, неврозоподобные состояния. По сравнению с анксиолитиками и снотворными, особенно производными бензодиазепаина, седативные средства (особенно растительного происхождения) оказывают менее выраженный успокаивающий эффект, вместе с тем для них характерны хорошая переносимость и отсутствие серьезных побочных явлений (не

вызывают миорелаксации, атаксии, сонливости, а также привыкания, психической и физической зависимости). Все это позволяет широко использовать их в повседневной амбулаторной практике.

Ранее в качестве седативного средства применялся магния сульфат, оказывающий в зависимости от способа введения различное фармакологическое действие на организм. При приеме внутрь магния сульфат плохо всасывается из ЖКТ и действует как слабительное и желчегонное средство. При парентеральном введении магния сульфат уменьшает возбудимость нейронов и оказывает угнетающее действие на ЦНС (проявляется седативным, противосудорожным, в больших дозах — наркозным эффектом), оказывает также миотропное спазмолитическое действие. Влияние на сердечно-сосудистую систему проявляется гипотензивным (снижается преимущественно повышенное АД) и антиаритмическим (при пароксизмах желудочковой тахикардии типа «пируэт») эффектами.

Депрессию можно охарактеризовать, как общее эмоциональное истощение. Как правило, это связано с невозможностью разрешить важную, с точки зрения данного человека, задачу. Когда личность подавляется внешними обстоятельствами и ей не удается адекватно реализовать свои желания и амбиции, организм вполне может ответить ситуационной депрессией. Другой распространенный вид депрессивного расстройства – это соматизированная депрессия. При этом психический дискомфорт выливается в заболевания внутренних органов (язвенную болезнь, гормональные нарушения, сердечнососудистые проблемы). Также известны депрессии на фоне колебаний уровня половых гормонов (в климактерический период или после родов), как результат длительного стресса, хронической или неизлечимой болезни, травмы или инвалидности. В целом депрессия – это раздражительность помноженная на слабость на фоне низкого уровня собственных гормонов удовольствия (энкефалинов и эндорфинов) в головном мозге, что приводит к недовольству собой и окружающей действительностью при отсутствии сил что-либо кардинально изменить. Возможные обходные пути решения – это поддержка со стороны окружения, специалиста (психиатра или врача-психолога) и/или медикаментозная помощь. При благоприятном стечении обстоятельств, это поможет выбрать новые приоритеты в жизни и избавиться от самой причины, повлекшей за собою болезненное состояние души. Лекарственные средства, которыми лечат от депрессии, называются антидепрессантами. Их применение произвело настоящий фурор в психиатрии и позволило значительно

увеличить процесс ингибирования депрессии, а также существенно снизить до-  
 чинло функций на фоне депрессивных расстройств.<sup>ТМ,</sup>  
 Интернет: [http://zdoravotvet.ru/artidapressantv-baz-vozrastu-kakie-byvayut-i-  
 shan-ot-shavotya-ot-trankvi-zatimv/](http://zdoravotvet.ru/artidapressantv-baz-vozrastu-kakie-byvayut-i-<br/>
  shan-ot-shavotya-ot-trankvi-zatimv/)

Удаление ссылки. Вы нарушаете закон РФ "Об авторском праве".

Антидепрессанты можно подразделить в зависимости от действия на  
 процессы торможения. Различают препараты с условнонезам<sup>ТМ,</sup>  
 стимулирующим и сбалансированным эффектом. Условнонезаме<sup>ТМ,</sup>  
 Антидепрессанты: Пятифазия (Азафен), Миласеорт (Дорзепин), Доксапин.<sup>ТМ,</sup>  
 Стимулирующие: Меласидол (Миласид), Памирамин (Мепирамин),<sup>ТМ,</sup>  
 Пиррипамин, Буприпамин (Бупроприон), Моклобемид (Аурорекс),<sup>ТМ,</sup>  
 Суворонин (Илодон), Пролон, Проксидол, Флуцит. Препараты  
 сбалансированного действия: кломипрамин (Алафранс), Машроцилин<sup>ТМ,</sup>  
 (Дипломил), Тизаптин (Коваксил), Пиразидол. Все они действуют на семь<sup>ТМ,</sup>  
 болина рецепторов в каждой из клеток мозга, оказывая и стимулирующ<sup>ТМ,</sup>  
 ина так или иначе на эти депрессивные функции рецепторов и ингибировани<sup>ТМ,</sup>  
 (то ингибиторное действие рецептора). Они менее эффективны в<sup>ТМ,</sup>  
 териях снотворения и седативных. Из-за этого для ингибиторы<sup>ТМ,</sup>  
 ингибиторы в нервных соединениях и ускоряют передачу нервных<sup>ТМ,</sup>  
 импульсов. К этим препаратам относятся: Амитриптилин, Доксапин, Имипрамин<sup>ТМ,</sup>  
 Миласеорт, Трипипрамин, Ирипипамин. Из-за того, что эти препараты<sup>ТМ,</sup>  
 оказывают такое действие на рецепторы нейротрансмиттеров, как правило,<sup>ТМ,</sup>  
 с ними связаны побочные эффекты в виде сонливости, нарушения ритма сердца и  
 дрожание рук, ощущение жара, они применяются все реже. Селективные<sup>ТМ,</sup>  
 ингибиторы обратного захвата серотонина Сертралин — Адевил, Азонтри<sup>ТМ,</sup>  
 Золофт, Саралин, Стимулятор Пароксетин — Лаксил, Раксетин, Агапосеора,  
 Памидин, Агапипрамин, Флуоксетин, Промек, Флуокс, Промисс,  
 Суворонин, Фенарин, Циталопрам, Ортон, Ципролекс, Селектив Ингибитор  
 антидепрессанта триптофановый при неврологических депрессивных  
 сопровождающихся страхами, агрессией, паническими атаками. Побочных,  
 действия этих лекарственных средств не обильны. Главные из них — перевозбуж-<sup>ТМ,</sup>  
 дение и возбуждение. Также болями и боли в носоглотке от избытка неактивного  
 компонента серотонина в слизистой оболочке и в носу. У от ингибитора  
 происходит перевозбуждение рецепторов серотонина, которое может  
 привести в суворонин, перевозбуждением рецепторов серотонина, что приводит  
 к перевозбуждению, увеличению двигательной активности, и даже психическими<sup>ТМ,</sup>  
 расстройствами<sup>ТМ,</sup>

Интернет: [http://zdoravotvet.ru/artidapressantv-baz-vozrastu-kakie-byvayut-i-  
 shan-ot-shavotya-ot-trankvi-zatimv/](http://zdoravotvet.ru/artidapressantv-baz-vozrastu-kakie-byvayut-i-<br/>
  shan-ot-shavotya-ot-trankvi-zatimv/)

Удаление ссылки. Вы нарушаете закон РФ "Об авторском праве".

Удаляя эту ссылку Вы нарушаете закон РФ "Об авторском праве".

## **№ 5 Психостимуляторы. Ноотропные средства. Адаптогены. Аналептики**

Психостимуляторы — группа психотропных препаратов, повышающих умственную и физическую работоспособность, улучшающих способность к восприятию внешних раздражителей (обостряют зрение, слух и др., ускоряют ответные реакции), повышающих настроение, снимающих усталость, взбадривающих и временно снижающих потребность во сне.

Впервые амфетамины (амфетамин, декстроамфетамин и метамфетамин) были синтезированы в конце XIX в. Их медицинское применение началось в 20-х годах XX в. и было связано с лечением простудных симптомов, ожирения, нарколепсии, синдрома гиперактивности с дефицитом внимания у детей. Эти средства использовались как стимуляторы во время Второй мировой войны по обе стороны фронта. В Америке до 60-х годов назначались для лечения героиновой зависимости, что привело к всплеску злоупотребления амфетаминами. В СССР амфетамины производились начиная с 40-х годов, в медицинской сфере применялись ограниченно и были малодоступны. В настоящее время амфетамины практически не применяются в клинической практике из-за выраженных побочных явлений и высокого риска развития лекарственной зависимости. По классификации Всемирной Организации Здравоохранения амфетамины относятся к наркотическим средствам.

Классификация психостимуляторов.

1) Амфетамины:

- производные арилалкиламина (фенилалкиламина): амфетамин.
- производные фенилалкилпиперидина: метилфенидат, Пемолин (в России не зарегистрированы).

2) Сиднонимины (производные фенилалкилсиднонимина): мезокарб, фепрозиднин.

3) Производные метилксантина: кофеин.

4) Препараты других фармакологических групп с психостимулирующим действием: сальбутиамин, этилтиобензимидазола гидробромид (Бемитил), деанола ацеглумат, меклофеноксат, Семакс.

В основе психостимулирующего действия амфетаминов лежит высвобождение норадреналина и дофамина из везикулярного пула пресинаптических нервных окончаний в ЦНС, а также торможение их обратного захвата. Амфетамины ингибируют катехол-о-метилтрансферазу — фермент, катализирующий распад катехоламинов в адренергических синапсах. Этими механизмами обусловлено не только психостимулирующее, но и периферическое адреномиметическое действие с различными вегетативными проявлениями (повышение АД, тахикардия, экстрасистолия и др.).

Кофеин конкурентно тормозит активность фосфодиэстераз, способствуя внутриклеточному накоплению цАМФ и цГМФ и активации различных видов внутриклеточного обмена в ЦНС, сердце, гладкомышечных органах, жировой ткани, скелетных мышцах; стабилизирует передачу нервного возбуждения в дофаминергических, норадренергических и холинергических синапсах коры, гипоталамуса и продолговатого мозга. В механизме действия кофеина присутствует конкуренция за рецепторы с аденозином, ограничивающим распространение возбуждения в ЦНС.

Психостимулирующее действие проявляется уменьшением вялости, сонливости, появлением ощущения бодрости, повышением физической и интеллектуальной работоспособности. Наиболее значительно этот эффект выражен у производных фенилалкиламина (амфетамин), менее — у метилфенидата, мезокарба и еще слабее — у кофеина. Психостимуляторы из группы производных арилалкиламина оказывают также умеренное антидепрессивное действие, уменьшают аппетит.

Периферические эффекты наиболее выражены у амфетамина, в меньшей степени у метилфенидата, кофеина и незначительно — у мезокарба. Амфетамин и кофеин стимулируют сердечную деятельность (увеличение ЧСС, усиление сердечных сокращений). Амфетамин вызывает сужение



периферических сосудов. Действие кофеина на сосуды и АД неоднозначно: он оказывает сосудорасширяющее действие на сосуды скелетных мышц, сердца, почек, кожи и сосудосуживающее — на сосуды головного мозга и органов брюшной полости. Кофеин повышает тонус венозных сосудов, оказывает диуретический эффект. Амфетамин и кофеин оказывают бронходилатирующее действие.

Наиболее характерными побочными эффектами психостимуляторов являются повышенная возбудимость, беспокойство, нарушение сна, тошнота, тахикардия, аритмия, повышение АД. На фоне приема амфетаминов и сиднониминов возможно также снижение аппетита, обострение бреда и галлюцинаций; при длительном применении амфетамина — развитие лекарственной зависимости, тяжелых нервно-психических расстройств, шизофреноподобного психоза.

Психостимуляторы назначаются внутрь (за исключением Кофеина-бензоата натрия), в основном хорошо всасываются из ЖКТ и проникают через ГЭБ. Для предотвращения нарушений сна принимают в первой половине дня (до 15 ч).

Психостимуляторы уменьшают эффект седативных средств, усиливают действие средств со стимулирующими ЦНС свойствами. При одновременном применении с нейролептиками возможно обострение шизофрении. Психостимуляторы нельзя сочетать с ингибиторами MAO.

Основными показаниями к применению психостимуляторов являются снижение физической и умственной работоспособности, сонливость, вялость, заторможенность, апатия при астенических состояниях различного генеза, депрессия, в т.ч. депрессия с явлениями социальной отчужденности или психомоторной заторможенности у пожилых пациентов, наличие тяжелой соматической патологии, хронический алкоголизм, нарколепсия. Эти препараты уменьшают побочные эффекты транквилизаторов, нейролептиков, снотворных средств. Они предназначены для кратковременного повышения умственной и физической работоспособности у здоровых лиц в экстремальных, стрессовых ситуациях (применяют кофеин, мезокарб, в

исключительных ситуациях кратковременно — амфетамин). При синдроме гиперактивности с дефицитом внимания у детей (в США и ряде западных стран) применяют метилфенидат, амфетамин.

Психостимуляторы противопоказаны при гиперчувствительности, возбуждении, тревоге, нарушениях сна, артериальной гипертензии, атеросклерозе, органических заболеваниях сердечно-сосудистой системы. При печеночной недостаточности противопоказан амфетамин, при глаукоме — кофеин.

В отечественной медицинской практике применяются в основном мезокарб и кофеин (в т.ч. в составе комбинированных препаратов).

Ноотропы (греч. *noos* — мышление, разум; *tropos* — направление) — средства, оказывающие специфическое позитивное влияние на высшие интегративные функции мозга. Они улучшают умственную деятельность, стимулируют познавательные функции, обучение и память, повышают устойчивость мозга к различным повреждающим факторам, в т.ч. к экстремальным нагрузкам и гипоксии. Кроме этого, ноотропы обладают способностью снижать неврологический дефицит и улучшать кортикосубкортикальные связи.

Концепция ноотропных средств возникла в 1963 году, когда бельгийскими фармакологами С. Giurgea и V. Skondia был синтезирован и применен в клинике первый препарат этой группы — пирацетам. Последующие исследования показали, что пирацетам облегчает процессы обучения и улучшает память. Подобно психостимуляторам, препарат повышал умственную работоспособность, но не оказывал присущих им побочных эффектов. В 1972 году К. Giurgea был предложен термин «ноотропы» для обозначения класса препаратов, положительно воздействующих на высшие интегративные функции мозга.

Выделяют группу «истинных» ноотропных препаратов, для которых способность улучшать мнестические функции является основным, а иногда и единственным эффектом, и группу ноотропных препаратов смешанного

действия («нейропротекторы»), у которых мнестический эффект дополняется, а нередко и перекрывается другими, не менее значимыми проявлениями действия. Ряд веществ, относящихся к группе ноотропных средств, обладает достаточно широким спектром фармакологической активности, включающим противогипоксический, анксиолитический, седативный, противосудорожный, миорелаксантный и другие эффекты.

Ноотропный эффект лекарственного средства может быть как первичным (непосредственное воздействие на нервную клетку), так и вторичным, обусловленным улучшением мозгового кровотока и микроциркуляции, антиагрегантным и антигипоксическим действием.

Для обозначения веществ этой группы существует ряд синонимов: нейродинамические, нейрорегуляторные, нейроанаболические или эутоτροφические средства, нейрометаболические церебропротекторы, нейрометаболические стимуляторы. Эти термины отражают общее свойство препаратов — способность стимулировать обменные процессы в нервной ткани, особенно при различных нарушениях (аноксии, ишемии, интоксикациях, травме и т.д.), возвращая их к нормальному уровню.

После успешного внедрения в лечебную практику пирацетама было синтезировано более 10 оригинальных ноотропных препаратов пирролидинового ряда, в настоящее время находящихся в фазе III клинических испытаний или уже зарегистрированных в ряде стран: оксирацетам, анирацетам, этирацетам, прамирацетам, дупрацетам, ролзирацетам, цебрацетам, нефирацетам, изацетам, детирацетам и др. Эти ноотропные препараты, исходя из их химического строения, получили название «рацетамы». Вслед за ними стали формироваться и другие группы ноотропных препаратов, включающие холинергические, ГАМКергические, глутаматергические, пептидергические; кроме того, была идентифицирована ноотропная активность у некоторых ранее известных веществ.

Существующие ноотропные препараты могут быть классифицированы следующим образом:

1. Производные пирролидина (рацетамы): пирацетам, этирацетам, анирацетам, оксирацетам, прамирацетам, дупрацетам, ролзирацетам и др.
2. Производные диметиламиноэтанола (предшественники ацетилхолина): деанола ацеглумат, меклофеноксат.
3. Производные пиридоксина: пиритинол, Биотредин.
4. Производные и аналоги ГАМК: гамма-аминомасляная кислота (Аминалон), никотиноил-ГАМК (Пикамилон), гамма-амино-бета-фенилмасляной кислоты гидрохлорид (Фенибут), гопантенная кислота, пантогам, кальция гамма-гидроксипутират (Нейробутал).
5. Цереброваскулярные средства: гинкго билоба.
6. Нейропептиды и их аналоги: Семакс.
7. Аминокислоты и вещества, влияющие на систему возбуждающих аминокислот: глицин, Биотредин.
8. Производные 2-меркантобензимидазола: этилтиобензимидазола гидробромид (Бемитил).
9. Витаминоподобные средства: идебенон.
10. Полипептиды и органические композиты: Кортексин, Церебролизин, Церебрамин.
11. Вещества других фармакологических групп с компонентом ноотропного действия:
  - корректоры нарушений мозгового кровообращения: ницерголин, винпоцетин, ксантинола никотинат, винкамин, нафтидрофурил, циннаризин;
  - общетонизирующие средства и адаптогены: ацетиламиноянтарная кислота, женьшень экстракт, мелатонин, лецитин.
  - психостимуляторы: сальбутиамин;

- антигипоксанты и антиоксиданты: оксиметилэтилпиридина сукцинат (Мексидол).

Признаки ноотропной активности присутствуют в фармакодинамике глутаминовой кислоты, мемантина и левокарнитина.

Кроме того, в эксперименте показано ноотропное действие ряда нейропептидов и их синтетических аналогов (АКТГ и его фрагменты, соматостатин, вазопрессин, окситоцин, тиролиберин, меланостатин, холецистокинин, нейропептид Y, субстанция P, ангиотензин II, холецистокинин-8, пептидные аналоги пирацетама и др.).

В настоящее время основными механизмами действия ноотропных средств считаются влияние на метаболические и биоэнергетические процессы в нервной клетке и взаимодействие с нейромедиаторными системами мозга. Нейрометаболические стимуляторы улучшают проникновение через ГЭБ и утилизацию глюкозы (особенно в коре головного мозга, подкорковых ганглиях, гипоталамусе и мозжечке), улучшают обмен нуклеиновых кислот, активируют синтез АТФ, белка и РНК. Эффект ряда ноотропных средств опосредуется через нейромедиаторные системы головного мозга, среди которых наибольшее значение имеют: моноаминергическая (пирацетам вызывает увеличение содержания в мозге дофамина и норадреналина, некоторые другие ноотропы — серотонина), холинергическая (пирацетам и меклофеноксат увеличивают содержание ацетилхолина в синаптических окончаниях и плотность холинергических рецепторов, холина альфосцерат, производные пиридоксина и пирролидина улучшают холинергическую трансмиссию в ЦНС), глутаматергическая (мемантин и глицин воздействуют через N-метил-D-аспаргат (NMDA) подтип рецепторов).

В результате клинических исследований и экспериментов на животных выделен также целый ряд дополнительных механизмов, вносящих свой вклад в ноотропную активность нейрометаболических стимуляторов. Ноотропы оказывают мембраностабилизирующее (регуляция синтеза фосфолипидов и белков в нервных клетках, стабилизация и нормализация структуры

клеточных мембран), антиоксидантное (ингибирование образования свободных радикалов и перекисного окисления липидов клеточных мембран), антигипоксическое (снижение потребности нейронов в кислороде в условиях гипоксии) и нейропротективное действие (повышение устойчивости нервных клеток к воздействию неблагоприятных факторов различного генеза). Значительную роль играет улучшение микроциркуляции в головном мозге за счет оптимизации пассажа эритроцитов через сосуды микроциркуляторного русла и ингибирования агрегации тромбоцитов.

Результатом комплексного воздействия ноотропных средств является улучшение биоэлектрической активности и интегративной деятельности мозга, что проявляется характерными изменениями электрофизиологических паттернов (облегчение прохождения информации между полушариями, увеличение уровня бодрствования, усиление абсолютной и относительной мощности спектра ЭЭГ коры и гиппокампа, увеличение доминирующего пика). Повышение кортикосубкортикального контроля, улучшение информационного обмена в мозге, позитивное воздействие на формирование и воспроизведение памятного следа приводят к улучшению памяти, восприятия, внимания, мышления, повышению способности к обучению, активации интеллектуальных функций. Способность улучшать познавательные (когнитивные) функции дала основание обозначать препараты ноотропного ряда как «стимуляторы познания».

В спектре фармакологической активности ноотропов (нейрометаболических стимуляторов) выделяют следующие основные эффекты:

1. Ноотропное действие (влияние на нарушенные высшие корковые функции, уровень суждений и критических возможностей, улучшение кортикального контроля субкортикальной активности, мышления, внимания, речи).

2. Мнемотропное действие (влияние на память, обучаемость).

3. Повышение уровня бодрствования, ясности сознания (влияние на состояние угнетенного и помраченного сознания).

4. Адаптогенное действие (повышение общей устойчивости организма к действию экстремальных факторов).

5. Антиастеническое действие (уменьшение выраженности слабости, вялости, истощаемости, явлений психической и физической астении).

6. Психостимулирующее действие (влияние на апатию, гипобулию, аспонтанность, бедность побуждений, психическую инертность, психомоторную заторможенность).

7. Антидепрессивное действие.

8. Седативное/транквилизирующее действие, уменьшение раздражительности и эмоциональной возбудимости.

Кроме того, ноотропы влияют на вегетативную нервную систему, способствуют коррекции нарушений при паркинсонизме и эпилепсии.

Из вышеперечисленных фармакодинамических свойств некоторые являются общими для всех ноотропных препаратов, другие присущи только некоторым из них.

Стимулирующее влияние ноотропов на психическую деятельность не сопровождается речевым и двигательным возбуждением, истощением функциональных возможностей организма, развитием привыкания и пристрастия. Однако в некоторых случаях они могут вызывать беспокойство и расстройство сна. Положительным свойством ноотропов является их малая токсичность, хорошая сочетаемость с препаратами других фармакологических групп и практическое отсутствие побочных действий и осложнений. Следует отметить, что эффекты этой группы развиваются постепенно (как правило, после нескольких недель приема), что обуславливает необходимость назначения их в течение длительного времени.

Первоначально ноотропы использовались, в основном, при лечении нарушений функций головного мозга у пожилых пациентов с органическим мозговым синдромом. В последние годы их стали широко применять в разных областях медицины, в том числе в гериатрической, акушерской и педиатрической практике, неврологии, психиатрии и наркологии.

Ноотропные средства применяют при деменции различного генеза (сосудистой, сенильной, при болезни Альцгеймера), хронической цереброваскулярной недостаточности, психорганическом синдроме, последствиях нарушения мозгового кровообращения, черепно-мозговой травмы, интоксикации, нейроинфекции, интеллектуально-мнестических расстройствах (нарушение памяти, концентрации внимания, мышления), астеническом, астено-депрессивном и депрессивном синдроме, невротическом и неврозоподобном расстройстве, вегетососудистой дистонии, хроническом алкоголизме (энцефалопатия, психоорганический синдром, абстиненция), для улучшения умственной работоспособности. В детской практике показаниями к назначению ноотропов являются задержка психического и речевого развития, умственная отсталость, последствия перинатального поражения ЦНС, детский церебральный паралич, синдром дефицита внимания. При острых состояниях в неврологической клинике (острый ишемический инсульт, черепно-мозговая травма) показана эффективность пирацетама, холина альфосцерата, глицина, Церебролизина. Некоторые ноотропы используют для коррекции нейролептического синдрома (деанола ацеглумат, пиритинол, пантогам, гопантенная кислота), заикания (Фенибут, пантогам), гиперкинезов (Фенибут, гопантенная кислота, мемантин), расстройств мочеиспускания (никотиноил-ГАМК, пантогам), нарушений сна (глицин, Фенибут, кальция гамма-гидроксибутират), мигрени (никотиноил-ГАМК, пиритинол, Семакс), головокружения (пирацетам, Фенибут, гинкго билоба), для профилактики укачивания (Фенибут, ГАМК). В офтальмологии (в составе комплексной терапии) применяют никотиноил-ГАМК (открытоугольная глаукома, сосудистые заболевания сетчатки и желтого пятна), гинкго билоба (старческая дегенерация желтого пятна, диабетическая ретинопатия).



Последнее десятилетие XX века отмечено высокими темпами исследовательской деятельности, связанной с поиском и изучением механизма действия новых и уже имеющихся ноотропных препаратов. До сих пор продолжают поиски базисной гипотезы действия ноотропов, способной интегрировать уже известные аспекты механизма действия ноотропных средств и определить их дальнейшую судьбу. Актуальным является поиск новых препаратов, которые обладали бы большей фармакологической активностью и оказывали бы избирательное действие на интегративные функции головного мозга, корректируя психопатологическое состояние пациента, его умственную активность и ориентацию в повседневной жизни.

## **№ 6 Заключительное занятие по разделу: «Средства, влияющие на центральную нервную систему»**

К данной группе **лекарственных средств** относятся вещества, которые изменяют функции ЦНС, оказывая прямое воздействие на различные ее отделы — головной, продолговатый или спинной мозг.

По морфологическому строению ЦНС можно рассматривать как совокупность множества отдельных нейронов (Нейрон — нервная клетка со всеми ее отростками), число которых у человека достигает 14 млрд. Связь между нейронами обеспечивается путем контакта их отростков друг с другом или с телами нервных клеток. Такие межнейронные контакты называются синапсами (sinapsis — связь, соединение). Передача нервных импульсов в синапсах ЦНС, как и в синапсах периферической нервной системы, осуществляется с помощью химических передатчиков возбуждения — медиаторов. Роль медиаторов в синапсах ЦНС выполняют ацетилхолин, норадреналин, дофамин и другие вещества.

**Лекарственные вещества**, влияющие на ЦНС, изменяют (стимулируют или угнетают) передачу нервных импульсов в синапсах. Механизмы действия веществ на синапсы ЦНС различны. Так, некоторые вещества могут возбуждать или блокировать в синапсах рецепторы, с которыми взаимодействуют определенные медиаторы.

**Лекарственные средства**, влияющие на ЦНС, обычно классифицируют по их основным эффектам. Например, вещества, вызывающие наркоз, объединяют в группу средств для наркоза, вызывающие сон — в группу снотворных и т. д.

### **Лекарственные средства, влияющие на ЦНС**

- Средства для наркоза:
- Спирт этиловый:

- Синтетические препараты:
- Противополипептические средства:
- Противопоарькетониятосекные препараты:
- Антигистаминные средства
- Антиадреналины
- Психотропные препараты

Среди перечисленных в таблице имеются декоративные препараты (по сути это препараты, расширяющие диапазон функциональности ЦНС). Среди них выделяются следующие средства для широкой сферы влияния, оказывающие воздействие на многие аспекты (противополипептические средства, нейролептики, транквилизаторы, седативные средства) оказывающие более избирательное воздействие на определенные функции ЦНС.

И среди перечисленных в таблице имеются препараты декоративные средства действующие на ЦНС стимулирующих образом (шипринер, аналгетики, психоэпидураторы).

Говорят также препараты, которые могут оказывать угнетающее влияние на функции нервной системы и наоборот (например, седативные препараты, транквилизаторы, антидепрессанты, антигистаминные препараты, антиадреналины, антиадреналины, антиадреналины, антиадреналины).

## **№ 7 Антибиотики (пенициллины, цефалоспорины, карбапенемы, монобактамы, макролиды и азалиды)**

Антибиотики – вещества либо животного, либо растительного происхождения, которые способны оказывать подавляющее действие (уничтожить или подавить или подавить или подавить) размножение микроорганизмов (бактерий, грибов, простейшие, и др.).

Основными природными производителями антибиотиков являются плесневые грибы – пенициллус, стрептокарпус и другие (пенициллин, цефалоспорины), актиномицеты (стрептомицин, тетрациклин), некоторые бактерии (эритромицин, ванкомицин, линкозамиды).

Существуют следующие механизмы действия антибиотиков:

1) **Выдерывающий механизм** – полное подавление роста бактерий посредством действия на жизненно важные клеточные структуры микроорганизмов, следовательно, вызывают их необратимую гибель. Избирательное действие антибиотиков на микроорганизмы. Таким образом могут действовать, к примеру, ванкомицин, цефалоспорины, тетрациклин. Эффекты могут быть связаны с нарушением выработки белка.

2) **Выдерывающий механизм** – подавление размножения бактерий, тормозясь рост колоний микробов, а губительное действие на них оказывает уже сам организм, точнее, клетки иммунной системы – лейкоциты. Так действуют эритромицин, тетрациклин, левомицетин. Если не выдержать

полный курс лечения и рано прекратить прием более ранних антибиотиков. Симптомы заболевания вернутся.

Какие бывают антибиотики?

По механизму действия:

Бактерицидные: агентами (пенициллины, стрептомицины, цефалоспорины, аминогликозиды, тетрациклины, рифамины, линкозамиды)

- Бактериостатические антибиотики (макролиды, группа тетрациклины, левомицетин, линкозамиды);

По спектру действия:

Широкого спектра действия (включаются как неизвестные возбудители, так и прямой спектр антибактериального действия на известные патогены, сейчас есть большая германность герман представителей германской микрофлоры различных систем организма). Примеры: ампициллин, цефалоспорины ампициллин, тетрациклины, левомицетин, ванкомицин, карбапенемы

Узкого спектра действия:

1) С преимущественным действием на гра- бактерии и кокки - стрептококки, стрептококки, пневмококки, цефалоспорины I-II поколения, линкозамиды, фузидат.

2) С преимущественным действием на гра- бактерии, например, клостридия, палочки и другие: цефалоспорины III поколения, ампициллин, цефтриаксон, цефепим.

3) Грам- для грам- различаются друг от друга по окраске по Граму (микроскопия) (грам- окрашиваются в фиолетовый цвет, а грам- в красноватый).

Другие агентами узкого спектра:

1) Противогрибковые (азидоцитидин, рифамицин, флуцитозин);

2) Противогрибковые (азидоцитидин, леверин, амфотерицин B, бопризонин);

3) Против простейших (монидин);

4) Противопаразитарные (актиномицины).

По поколениям. Существует 4 поколения 1, 2, 3, 4 поколения. Например, цефалоспорины, которые делятся на 1, 2, 3, 4 поколения.

- 1-го поколения: цефалексин, цефалексин, цефалексин.

- 2-го поколения: цефамандол, цефамандол (цефамандол), цефамандол (манделин);

- 3-го поколения: цефотаксим, цефотаксим, цефуроксим (сетопидин); цефтриаксон (цеф), цефуроксим аксетил (интра), цефазолин (цеф), цефуроксим.

- 4-го поколения: цефепим, цефепим (цефепим, цефепим) и другие.

Более новые поколения антибиотиков отличаются от предыдущего более широким спектром действия на микроорганизмы, большей безопасностью для организма человека (то есть, наименьшей частотой побочных реакций), более удобным приемом (как правило, коротким курсом в сутки 4 раза в день, то 3 и 4 поколения - всего 1-2 раза в сутки), снижением (по удобному приему (если препараты первого поколения нужно вводить 4 раза в день, то 3 и 4 поколения - всего 1-2 раза в сутки), считаются более

«надежными» (более высокая эффективность при бактериальных очагах, и, и, соответственно, раннее наступление терапевтического эффекта). Также же современные препараты последних поколений имеют пероральные формы (таблетки, сиропы) с однократным приемом в течение дня, что удобно для большинства людей.

Как антибиотики могут вводиться в организм?

1) Через рот или перорально (таблетки, капсулы, капли, сиропы). Стоит иметь в виду, что ряд препаратов в желудке плохо всасываются или попросту разрушаются (пенициллин, аминогликозиды, карбапенемы).

2) Во внутренние среды организма или парентерально (внутримышечно, внутривенно, в спинномозговой канал).

3) Непосредственно в прямую кишку или ректально (в клизмах). Наступление эффекта при приеме антибиотиков через рот (перорально) ожидается дольше, чем при парэнтеральном введении. Соответственно, при тяжелой форме заболеваний парэнтеральному введению отдается безусловное предпочтение.

После приема антибиотик оказывается в крови, а затем в определенном органе. Существует излюбленная локализация определенных препаратов в определенных органах и системах. Соответственно, при том или ином заболевании назначаются препараты с учетом данного свойства антибиотика. Например, при патологии в костной ткани назначается линкомицин, органов слуха - полусинтетические пенициллины и др. Азитромицин имеет уникальную способность распределяться: при воспалении легких - накапливается в легочной ткани, а при пиелонефрите - в почках.

Выводятся антибиотики из организма несколькими путями: с мочой в неизменном виде - выводятся все водорастворимые антибиотики (пример: пенициллины, цефалоспорины); с мочой в измененном виде (пример: тетрациклины, аминогликозиды); с мочой и желчью (пример: тетрацилин, рифампицин, левомицетин, эритромицин).



Памятка для больного перед приемом антибиотика

- Перед тем, как Вам назначат антибиотик, сообщить врачу:
- О наличии у Вас в прошлом побочных действий лекарственных препаратов.
  - О развитии в прошлом аллергических реакций на лекарственные препараты.
  - О приеме в настоящий момент другого лечения и совместимости уже назначенных препаратов с требуемыми лекарствами сейчас.
  - О наличии беременности или необходимости кормления грудью.
  - О наличии беременности или необходимости кормления грудью.

Нужно ли принимать препарат (спросить у врача или найти в инструкции к препарату):

- Какова доза препарата и кратность приема во время суток?
- Требуется ли особая пища во время лечения?
- Какие лекарства нельзя принимать одновременно?
- Возможные побочные эффекты препарата.
- Для пероральных форм связь приема лекарства с приемом пищи.
- Требуется ли профилактика побочных действий (например, дисбактериоз кишечника, с целью профилактики которого назначаются препараты).

Когда нужно начать лечение (спросить у врача или найти в инструкции):

Противопоказания и признаки побочных действий (анализ на аллергический тест, анализы крови и мочи).

- Если в течение 3-х дней приема нет улучшения, и наоборот, присоединились новые симптомы.

Особенности приема антибиотиков:

При пероральном приеме особое внимание время приема препарата (антибиотик может связываться с пищей или лекарственными препаратами в пищеварительном тракте и последующим образованием персистирующих и слабо растворимых соединений, которые плохо всасываются в общий кровоток, соответственно, эффект препарат будет плохим).

Важным условием успешного лечения является терапия кишечника (антибиотики и антибиотики в крови, а также длительной антибиотикотерапии и длительности лечения) и результаты. Именно поэтому важно соблюдать правила и кратность приема в течение суток, предельные значения.

В настоящее время остро стоит проблема антибиотикорезистентности микроорганизмов (устойчивость микроорганизмов к действию антибиотиков) (устойчивость микроорганизмов к действию антибиотиков). Препараты антибиотикорезистентности могут быть самолечены без участия врача (применение худших лекарств) и безумно оказываться на отсутствие положительного эффекта и вредности (это микробы) (назначенные антибиотики при вирусных инфекциях (данные группы) препаратов не действуют на внутриклеточные микроорганизмы, которые размножаются внутри клетки (например, вирус гепатита С, вирус иммунодефицита человека и т.д.) (антибиотики не действуют на вирусы).

Другой важной проблемой является развитие побочных реакций при антибиотикотерапии (нарушение пищеварения, дисбактериоз, индивидуальная непереносимость и другие).

Решение данных проблем возможно применением рациональной антибиотикотерапии (правильное назначение препарата и при конкретном заболевании и учетом его фармакологической концентрации в крови и мочи в системе, а также профессиональное назначение терапевтической дозы и достаточного курса лечения). Создаются и новые антибиотикотерапевтические препараты.

Общие правила приема антибиотиков:

1) Любая антибиотикотерапия должна назначаться только врачом!

Общие правила приема антибиотиков.

1) Любой антибиотик должен назначаться только врачом!

2) Ка эпидемиологически не редко встречается само лечение антибиотиками при вирусных инфекциях (обычно считая это профилактикой заболевания). Вы можете усугубить течение вирусной инфекции. Задумываясь о приеме, нужно также при рассмотрении дозы и курса, а также и о побочных эффектах (бактериальный стул). Сигнальные симптомы свидетельствуют о приеме.

3) Тщательно соблюдать прописанный курс лечения антибиотиками, прерванный лечением врином. Ни в коем случае не прерывать прием после того, как почувствуете себя лучше. Болезнь обязательно вернется.

4) Не корректно вводить дозировку препарата в процессе лечения. В начальных дозах антибиотик не имеет никакого действия на формирование вирусной инфекции. Например, если вы принимаете 2 таблетки 4 раза в день – можно уменьшить дозу до 1 таблетки 3 раза в день, тем самым вы рискуете, что возбудитель размножится и увеличит количество таблеток действующим веществом.

5) Принимать антибиотик следует минимум за 0,5 часа до еды. Не принимать экспериментально и принимать как чай, кофе, а тем более в машинах. Вы будете пить их вилкой. Молоко и молочные продукты следует принимать не ранее чем через 4 часа после приема антибиотика или совсем отказаться от них на время курса терапии.

6) Строго соблюдать очередность приема препарата и пищи (разные препараты принимаются по разному до или после, после сна).

7) Строго соблюдать очередность приема антибиотика. Если 1 раз в день, то в одно и то же время, если 2 раза в день, то строго через 12 часов, если 3 раза – то через 3 часа, если 4 раза – через 6 часов и так далее. Это важно для создания определенной концентрации препарата в организме. Если вдруг пропустили время приема, то принять препарат как можно скорее.

8) Прием антибиотика требует существенного снижения физических нагрузок и полного отказа от занятий спортом.

9) Существуют определенные взаимодействия некоторых препаратов друг с другом. Например, если вы принимаете витаминные комплексы и будете принимать антибиотик 1 раз в день (например, амоксициллин), то витаминные комплексы лучше принимать в другое время (например, утром, без еды, или вечером, после ужина), чтобы избежать взаимодействия. Поэтому не рекомендуется одновременный прием данных препаратов.

10) Не употреблять спиртные напитки (алкоголь) во время курса лечения антибиотиками.

Невозможность приема пищи и витаминных комплексов и витаминов.

Безопасны при доказанных (то есть данные очевидной пользы при минимальном вреде): пенициллины, цефалоспорины в течение всего периода беременности и кормления (однако у ребенка может развиться дисбактериоз кишечника). Также при беременности возможно назначение препаратов из группы макролидов. Противопоказаны при беременности тетрациклины, стрептомицины, рифамицины, препараты из группы макролидов. Противопоказаны при беременности аминогликозиды, тетрациклины, левомицетин, рифампицин, фторхинолоны.

## Необходимость лечения антибиотиками у детей



По статистике антибиотики в России получают до 70-85% детей с чисто вирусными инфекциями, то есть антибиотики не были показаны этим детишкам. Вместе с тем известно, что именно антибактериальные препараты провоцируют у детей развитие бронхиальной астмы! В действительности же антибиотики нужно назначать лишь 5-10% детей с ОРВИ, и только при возникновении осложнения в виде бактериального очага. По статистике, лишь у 2,5% не леченных антибиотиками детей выявляются осложнения, а у пролеченных ими без оснований осложнения регистрируются в два раза чаще.

Врач и только врач выявляет показания у больного ребенка для назначения антибиотиков: им может быть обострение хронического бронхита, хронического отита, гайморита и синусита, развивающаяся пневмония и тому подобное. Также нельзя медлить с назначением антибиотиков при микобактериальной инфекции (туберкулез), где специфические антибактериальные препараты являются ключевыми в схеме лечения.

Побочное действие антибиотиков:

1. Аллергические реакции (анафилактический шок, аллергодерматозы, отек Квинке, астматический бронхит),
2. Токсическое действие на печень (тетрациклины, рифампицин, эритромицин, сульфаниламиды),
3. Токсическое действие на кроветворную систему (левомецитин, рифампицин, стрептомицин),
4. Токсическое действие на пищеварительную систему (тетрациклин, эритромицин),
5. Комплексное токсическое - неврит слухового нерва, поражение зрительного нерва, вестибулярные расстройства, возможное развитие полиневрита, токсическое поражение почек (аминогликозиды),
6. Реакцию Яриша—Гейцгеймера (эндотоксиновый шок) – возникает при назначении бактерицидного антибиотика, который приводит к «эндотоксиновому удару» в результате массивного разрушения бактерий. Развивается чаще при следующих инфекциях (менингококцемия, брюшной тиф, лептоспироз и др.),
7. Дисбактериоз кишечника – нарушение равновесия нормальной флоры кишечника.

Антибиотики помимо уничтожения бактерий убивают и представителей нормальной микрофлоры, и условнопатогенные микроорганизмы. С которыми Валя иммунная система уже была знакома и старалась так раст. После лечения антибиотиками организм активнее борется с болезнями и инфекциями, но равнодушие по отношению к ним не означает, что они не могут вернуться. Поэтому после приема антибиотиков необходимо принимать препараты, которые восстанавливают микрофлору, так как если прием антибиотиков не действует. Остатки и продукты распада вымываются при антибиотикотерапии.

Рекомендации пациентам после проведенного курса антибиотикотерапии

1. После лечения курса лечения антибиотиками необходимо соблюдать диету. Это связано с процессом восстановления микрофлоры кишечника, действиями препаратов на организм и степенью тяжести.

2. Соблюдать щадящую диету с избеганием острого, жареного, пересоленного и частым (3 раз в день) приемом малыми порциями в течение дня.

3. С целью профилактики нарушений пищеварения рекомендуется ферментные препараты (креол, мезимил, панкреатин, панкреатин по 10 таб. Мезимил 1 таб. 3 раза в день 10-14 дней).

3. С целью коррекции дисбиоза кишечника (нарушения соотношения представителей нормальной флоры) рекомендуется прием:

- Бифидобактерии по 1 капсуле 3 раза в день 7-10 дней.
- Биофарма по 1 капсуле 3 раза в день 10 дней.
- Линекс по 1 капсуле 3 раза в день 7-10 дней.
- Бифидумбактерин форте 5-10 доз 2 раза в день 10 дней.
- Аципол по 1 капсуле 3-4 раза в день 10-14 дней.

4. После приема гепатотоксичных препаратов (натрийсодержащих, тетрациклинов, трифлуридина, сульфаниламидов, эфирных масел) рекомендуется прием препаратов гепатопротекторы на растительной основе (гепарин, омега-3) курсом 14-21 день 2-3 раза в день. курсом 12 табл. 3 раза в день в течение 14-21 дня.

5. После проведенного курса антибиотиков рекомендуется прием пробиотических препаратов (Линекс, Аципол, Бифидумбактерин) в течение 14-21 день.

### № 8 Антибиотики (тетрациклины, аминогликозиды, группа левомецетина, циклические полипептиды, линкозамиды, гликопептиды, фузидиевая кислота)

Антибиотики группы линкозамидов Фузидиевая кислота. Оксалилинтоны

Антибиотик является препаратом выбора в лечении стрептококковой инфекции (фузидиевая кислота (фузидин) линкозамиды (доксицилин, тетрациклин) курсом 1 и 2 х 300 мг (первый) 200 мг (второй) 3-4 раза в день (второй) курсом 1 и 2 х 150 мг (первый) 100 мг (второй) 2-3 раза в день 2% жидкая форма - 15,0% капсулы).

ЛИНКОЗАМИДЫ К этой группе относятся клиндамицин. Он является ингибитором синтеза

К этой группе относится клиндамицин. Он является ингибитором синтеза



белка бактерий и обычно действует бактериостатически. Применяется традиционным образом в отношении анаэробов (*Bacteroides fragilis* и др.), стрептококков и стафилококков. Хорошо всасывается из кишечника. Через рез гематоэнцефалический барьер проникает плохо. Метаболизм в печени. Не выводится почками и в основном выводится желчью. Применяется при инфекциях, вызванных бактериями, особенно при перитонитах. *Bacteroides fragilis* — основной возбудитель. Наиболее опасный побочный эффект — псевдомембранозный колит (развивается сразу же после отмены и характеризуется выделением слизи в кале, болями в области живота, лихорадкой). Это один из побочных эффектов антибиотиков, связанных с кишечной флорой (*Clostridium difficile*), которые могут развиваться в кишечнике. Часто для сохранения эффективности и предотвращения рецидивов рекомендуется повторное лечение. Редко встречаются аллергические реакции, особенно в виде сыпи.

**ОКСАЗОЛИДИНОНЫ**

Новый класс активных противомикробных средств является оксалиндином. Первый препарат этой группы — линезолин (Lincosyn) эффективен в отношении широкого спектра возбудителей аэробных грамположительных бактерий, некоторых грамотрицательных бактерий и многих анаэробов. Линезолин применяется при инфекциях, вызванных резистентными к другим препаратам бактериями. Механизм действия препарата связан с ингибированием синтеза в стадии синтеза белка. Выдвигается предположение, что в условиях действия оксалиндина препарат действует бактерицидно (in vitro) — бактериостатически.

Эффективен при энтеральном и парентеральном введении. Применяется в суточной дозе 600 мг 2 раза в сутки, независимо от приема пищи.

Линкомины, клиндамины, фузидевия, линсолит, линдонины.

**ЛИНКОМИЦИН ГИДРОХЛОРИД (Lincosylisni hydrochloridum)**

Линкомицин — антибиотик, трехчленный Streptomyces Lincolnsis's плет).

Другими названиями являются: активном действии.

Синонимы: Lincosyl, Lincolin, Lincosylin, Lincosyl, Lincosylin, Lincosyl.

Мол. вес: 354,46.

Выпускается в виде порошка для инъекций.

Линкомицин обладает антибактериальным действием в отношении группы макролитов, хотя отличается от них химической структурой. Он ингибирует синтез белка в микробной клетке, связываясь с бактериальными рибосомами и ингибируя действие рибосомальной концентрации в организме и чувствительности микроорганизмов. Эффективен в отношении грамположительных микроорганизмов (стафилококков, стрептококков, пневмококков, палочки дифтерий) и некоторых анаэробов, в том числе возбудителей газовой гангрены и столбняка. Активен также в отношении микоплазм. На грамотрицательные бактерии, грибы и вирусы не действует. Активен в отношении

микроорганизмов, особенно стрептококков, устойчивых к другим антибиотикам. Устойчивость микроорганизмов к линкозамину вырабатывается медленно.

В терапии острых лорных ринитов действует бактериостатически. Механизм действия связан с подавлением бактериального синтеза в рибосоме. После приема внутрь и внутримышечно в слезной жидкости быстро достигаются, поступает в раны, уши и уши, в том числе в костную ткань. Через гематоэнцефалический барьер проникает трудно, но проницаемость повышается при менингите.

Применяют линкомицин при лечении острых оститов, в том числе среднего отита и среднего отита, при отите и среднем отите среднего уха, синуситах, гайморитах, фарингите, тонзиллите, рожистом воспалении, отите и других инфекциях верхних дыхательных путей в этом антибиотике микроорганизмы, особенно при инфекциях верхних дыхательных путей, устойчивы к ним. Также при лечении оститов и других инфекций.

Вследствие того что линкомицин плохо всасывается в желудке, он является одним из наиболее эффективных препаратов при лечении острых и хронических оститов и других инфекционных поражений оститов, а также оститов (см. также Фурозидон-натрий).

Применяют линкомицин в виде порошка внутримышечно (см. приложение).

Внутриносовая линкомицина гидрохлорид вводят по 1-2 капли 3-4 раза в сутки 3-5 капель в минуту. Перед введением 2 мл 20-30% раствора антибиотика (0,6 г) разбавляют 250 мл физиологического раствора хлорида натрия.

Применяют линкомицин в виде порошка внутримышечно (см. приложение).

Внутриносовая линкомицина гидрохлорид вводят по 1-2 капли 3-4 раза в сутки 3-5 капель в минуту.

Продолжительность лечения в зависимости от формы и тяжести заболевания составляет 7-14 дней (при оститовите 3 нед и более).

Побочные явления: тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, общая слабость, расстройство желудка, парентеральное введение может вызвать флебит (1,4 г с интервалом между введениями 12 ч).

При гнойно-воспалительных заболеваниях также применяют местно в виде 2% раствора.

При приеме линкомицина внутрь возможны тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, общая слабость, расстройство желудка, парентеральное введение может вызвать флебит. В отдельных случаях возможны аллергические реакции: лейкопения, тромбоцитопения. При длительном применении могут развиваться кандидозы.

Линкомицина гидрохлорид противопоказан при беременности (за исключением случаев, когда это необходимо по жизненным показаниям), при

тяжелых заболеваниях печени и почек (при длительных курсах лечения необходимо периодически контролировать функции печени и почек). Парентерально препарат не следует вводить вместе с миорелаксантами, при миастении.

**КЛИНДАМИЦИН (Clindamycin).** 7-Хлордезоксипроизводное линкомицина. Синонимы: Далацин Ц, Климицин, Dalacin C, Cleocin, Climicin, Clinymicin, Klindamycin, Klinicin, Sobelin и др. Выпускается в виде гидрохлорида для приема внутрь и фосфата для инъекций.

По химической структуре, механизму действия и антимикробному спектру близок к линкомицину, но в отношении некоторых видов микроорганизмов более активен (в 2 - 10 раз). Клиндамицина гидрохлорид назначают внутрь, а клиндамицина фосфат - внутримышечно и внутривенно. При приеме внутрь хорошо всасывается (лучше, чем линкомицин). После внутримышечного введения максимум концентрации в крови отмечается через 2 - 2,5 ч. Препарат хорошо проникает в жидкости и ткани организма; как и линкомицин - в костную ткань. Через гистогематические барьеры проходит плохо, но при воспалении мозговых оболочек концентрация в спинномозговой жидкости значительно возрастает. Из организма выводится с мочой и желчью. При нарушении функций почек и печени выведение клиндамицина замедляется. Показания к применению в основном такие же, как и для линкомицина (инфекции дыхательных путей, кожи и мягких тканей, костей и суставов, органов брюшной полости, септицемии и др.). Применяют клиндамицин внутрь, внутримышечно и внутривенно. Возможные побочные явления и противопоказания такие же, как для линкомицина.

## **№ 9 Сульфаниламиды. Производные хинолона, нитрофурана, 8-окси-хинолина, хиноксалина**

Сульфаниламиды были первыми химиотерапевтическими (системными) антибактериальными средствами, которые нашли широкое применение в практической медицине. С появлением пенициллина и других антибиотиков, а в последнее время фторхинолонов, их использование несколько сократилось, однако значения препараты этой группы не потеряли и в ряде случаев успешно назначаются при инфекционных заболеваниях, вызванных чувствительными к ним микроорганизмами. Сульфаниламиды подавляют рост грамположительных и грамотрицательных бактерий, некоторых простейших (возбудители малярии, токсоплазмоза), хламидий (при трахоме, паратрахоме). Их действие связано главным образом с нарушением

образования необходимых для развития микроорганизмов фолата и дигидрофолата, в молекулу которых входит пара-аминобензойная кислота: сульфаниламиды близки по химическому строению к пара-аминобензойной кислоте, они захватываются микробной клеткой вместо пара-аминобензойной кислоты и тем самым нарушают течение в ней обменных процессов.

По времени циркуляции в организме после однократного приема сульфаниламиды разделяют на 4 группы: а) короткого действия (сульфаниламид, сульфатиазол, сульфаэтидол, сульфадимидин и др.); б) среднего действия (сульфадиазин и др.); в) длительного действия (сульфаметоксипиридазин, сульфамонетоксин, сульфадиметоксин и др.); г) сверхдлительного действия (сульфален и др.). Почти 65-летний период применения обусловил появление большого количества микробных штаммов, устойчивых к сульфаниламидам. Преодолеть устойчивость удастся, сочетая сульфаниламиды с триметопримом. Последний ингибирует дигидрофолат-редуктазу и тормозит превращение появившейся в микробной клетке (несмотря на присутствие сульфаниламидов) дигидрофолиевой кислоты в ее коферментную форму — тетрагидрофолиевую, блокируется перенос одноуглеродистых фрагментов в синтезе пуринов и пиримидинов, результатом чего становится нарушение продукции РНК и ДНК. Созданы высокоэффективные комбинированные препараты, содержащие сульфаниламиды в сочетании с триметопримом. Из сульфаниламидных препаратов системного действия в настоящее время широко используются ко-тримоксазол, сульфадиметоксин, сульфален, сульфаметоксипиридазин, сульфаэтидол.

По химической структуре к сульфаниламидам достаточно близки так называемые сульфоны (дапсон, соласульфон, диуцифон и др.) Они активны по отношению к лепрозным микобактериям и применяются для лечения проказы.

## № 10 Противотуберкулезные, противоспирохетозные и противопротозойные средства

Туберкулез - одно из наиболее древних и распространенных заболеваний. Изменения туберкулезного характера были обнаружены при раскопках в костных останках людей каменного века и мумий Египта. Первое описание болезни можно найти в трудах Гиппократов до нашей эры: сильный кашель с выделением мокроты, частым кровохарканьем и лихорадкой. Быстрое прогрессирование процесса приводило к истощению больного, отсюда и появилось название «чахотка» от слова «чахнуть» и фтиза», что означает в переводе с греческого (phthisis) «истощение», «разрушение». Лишь в 1882 г. Р. Кох выделил возбудителя микобактерию туберкулеза, обладающую кислотоустойчивостью. Это свойство объясняет незначительное количество препаратов для лечения данного заболевания. Первый противотуберкулезный препарат стрептомицин был выделен впервые из лучистого гриба лишь в 1943г.

Применяемые противотуберкулезные препараты принято делить на основные (I ряда) и резервные (II ряда), что отражает место, которое они занимают в лечении туберкулеза.

### Классификация

I ряда II ряда

Стрептомицин Этионамид

Изониазид Протионамид

Фтивазид Пиразинамид

Рифампицин Этамбутол

Прочие: ПАСК, глЮрифор.

Оказывают в основном бактериостатическое действие, однако некоторые вызывают бактерицидное действие (I ряда).

**Стрептомицина сульфат** (Streptomycini) антибиотик широкого спектра действия.

Ф.в.: пор. во флаконе по 0,5 и 1,0.

Вводится внутримышечно по 1,0 однократно, интратрахеально 1,0, растворив в физ. растворе или 0,5% р-ре новокаина.

Применяю для лечения обструктивной болезни легких. У ранее леченых больных лишь после определения чувствительности к микобактериям. Длительность зависит от формы и фазы заболевания (5 месяцев и более).

**П.д.:** аллергические реакции, нарушение слуха и вестибулярного аппарата, функции почек, печени, миокарда.

**П.п.:** беременность, лактация, запоры, стеноз коронарных артерий, болезни органов слуха и почек.

**Рифампицин (Rifampicinum)** – антибиотик из группы стрептограмин.

Форм. вып. таб. по 0,05 и 0,2 г, инт. для инъекций в ампулах по 0,15 г. Препараты выпускаются в ампулах по 0,25 г (каждый из них содержит по 5 мг этилового спирта) и в более 50 мл стеклянных флаконах по 0,5 г (при полной переносимости дозы может быть введена суточная доза 2 г).

Препарат стимулирует родничок и вызывает кашель, подавляет родничок и вызывает кашель.

Хорошо всасывается из ЖКТ, легко проникает в ткани, в том числе через гематоэнцефалический барьер. Применяется при всех формах туберкулеза, в том числе при туберкулезном менингите. К препарату быстро развивается устойчивость.

**П.д.:** аллергические реакции, лейкопения, лейкоцитоз, нарушение функций почек, печени, миокарда.

**П.п.:** беременность, лактация, болезни печени. Исследования образцов тканей и органов не проводились, но возможны.

**Изониазид (Isoniazidum)** – синтетический препарат группы ИИИ.

Форм. вып. таб. по 0,1; 0,2; 0,5; в амп. 100% по 5 мг.

Влияет только на микобактерии туберкулеза. Применяется при лечении всех форм туберкулеза 2-3 раза в сутки после еды. Дозировка для взрослых определяется на индивидуальной основе. Противопоказано при беременности, лактации, заболеваниях почек, печени, и при приеме этанола.

**П.д.:** аллергические реакции, депрессия, головная боль, возбуждение, нарушение слуха, шизофрения, лейкоцитоз, нарушение функции почек, печени, боли в сердце. Вероятность для увеличения рН.

**П.п.:** болезни печени, лейкоцитоз, лактация.

**П.п.:** болезни печени, эпилепсия, лактация.

Фенбузид (Phenbutolol) - гр I A I C

Ф.э. таб. по 0,5, 0,5

Обладает симпатомимическим действием на сердце, расширяет коронарные артерии.

Фенотанид (Phenothiazin)Пропропранолол (Propriololol)

Ф.э. др.же по 0,25

Противопоказан при I др.же 3 раз в день после еды при развитии брадикардии или при тяжелой сердечной недостаточности.

П.д.: атеросклероз, ревматизм, дислипемия, венозная тромбоэмболия, почечная недостаточность.П.п.: беременность, тахикардия, язвенная болезнь желудка, гепатитПразозинамид (Prazosinamid)

Ф.э. таб. по 0,5

По активности уступает препаратам I раз.

Обладает вазодилататорным и слабым бактерицидным эффектом в отношении грамположительной и грамотрицательной флоры. При назначении в дозе 2 мг/кг/сутки к препарату следует присоединить антигипертензивные средства. Хорошо всасывается в ЖКТ и распределяется, влияя на все органы и ткани, в том числе на сердце и почки. Проникает через ГЭБ. Не оказывает влияния на дыхательную функцию. Метаболизируется в печени, но экскретируется в основном почками.

П.д.: артериальная гипертензия - чаще всего тошнота и рвота. Побочные эффекты: Головокружение, Головоудавление, Головокружение, Головоудавление.

Противопоказан для лечения туберкулеза - в сочетании с другими препаратами (чаще всего с изониазидом и рифампином). I антагонист рецепторов и селективный блокатор α-адренергических рецепторов.

Флазобид (Flazobid)

Ф.э. таб. по 0,1, 0,2; 0,1

Суточная доза 25 мг/кг в сутки на 1 прием после завтрака.

Суточная доза 25 мг/кг в сутки на 1 прием после завтрака.

Гид: зоберечь часные рвання, дедурехон, узеднение цетроты дрення,я, нарушенкя цветовопрятня (в основном зеленого и красного цвета),а), уменьшение полей зрения, дислапсия, усилонно кашля и выделення мазроты.

Глд: беречность, дотям до 17 лет, нзврат зрительного нерва, калщрахта.

**ПАСЖ**

Фва: таб., гршдулы для приотоквення риктара для приема шугры: ларошек для приотоквення раствора шк шкельной во фласколе.

1 шорифар (рифшшшшл – вкл.С)

Фва: гршдулы для приотоквення шкельной для приема шугры

**Пршшшы лечення туберкулеза.**

1. Лечение должно быть длительным (не менее 1<sup>1</sup> мес. у впервые выявленных). ые
2. Лечение штивных фаз должно осуществляться сочетанием 2-3 препаратов для предотвращения лекарственной резистентности. } -3
3. Интензивная терапия проводится при наличии активной пи.
4. При назначении препаратов необходимо учитывать ке
5. При назначении препаратов необходимо учитывать ся
6. При назначении препаратов необходимо учитывать ть
7. Препараты назначаются, учитывая возможность взаимодействия. ия

III. Противопаразитарные (противополистные) средства)

Паразитозы являются серьезной проблемой в конце XV века. Из-за того, что в этот период затронула значительная часть населения, инфекция вызвала серьезные проблемы в различных частях света. В XV и начале XVI века, паразитозы, как и другие болезни, передавались по воздуху и по воде. Это может поражать все органы и приводить к смерти при отсутствии лечения. До 1910 г. единственным эффективным средством лечения являлась ртуть, применявшаяся в XVI в. В конце XVII в. появились эффективные препараты для лечения. В XIX в. были открыты препараты для лечения шистозомоза, а в начале XX в. появились препараты для лечения малярии, анкилостомоза и др.

Особенно важным в современной терапии шистозомоза являются препараты группы бензимидазола. Они оказывают широкое спектром активности ты действие и применяются во всех стадиях болезни и для ее профилактики. В ое группы бензимидазола. Они оказывают наиболее активное бактерицидное действие и применяются во всех стадиях болезни и для ее профилактики. В



связь с длительностью курса лечения наиболее вероятно неสอดคล้องность действия препарата. Бициллин-1, бициллин-3, бициллин-5.

### Бициллин-1 (Ампицил)

Формула раствора для инъекций: 0,5 г/мл для инъекций 2,4 млн ME до еды.

Целину, вводить дозой 2,4 млн ME ежедневно, при первичном инфицировании – 2 инъекции с интервалом 7 дней, при вторичном – 2 инъекции с интервалом 7 дней.

Под влиянием дисбактериоз, обратные лейкопения, эозинофилия, тромбоцитопения.

В небольших количествах проникает через плацентарный барьер и в молоко матери.

При непереносимости пенициллинов путь резистентности спячок в виде, при приеме с аскорбиновой кислотой (при малярии), при приеме с калием, при приеме с витамином С, при приеме с (характеристики см. выше).

Препарат в виде инъекций (бициллин-1, бициллин-3, бициллин-5) в виде инъекций. Представляет собой порошок в стеклянном флаконе для инъекций. Отличается токсичностью.

## III Прогамнопротозойные средства

Резонанс – препарат для лечения острых и хронических конъюнктивитов.

### 1. Средства, применяемые при конъюнктивите

Диазонин – антибактериальное средство для лечения конъюнктивитов (активное вещество – диазонин).

В виде раствора для инъекций, применяется в виде раствора и в виде порошка. Паралитический эффект и раздражающее действие.

В виде раствора для инъекций, конъюнктивитов, ощущение дискомфорта в глазах, раздражение слизистой оболочки.

Препарат для лечения конъюнктивитов, для инъекций, порошок.

### Метронидазол (Metronidazole) (трихопол, синистром, трипол)

Формула раствора 0,5 МЭД – раствор во флаконе 0,5% – 100 мл для инъекций. Ф.В. таб. по 0,25 №20, раствор во флаконе 0,5% – 100 мл для в/в капельного введения.

Курс лечения 5 дней (по 1 таб. 3 раза в день)

Цидофовир, препарат, действующее вещество которого является сульфидом, подавляет вирус, при совместном применении с ацикловиром возможно купирование острого состояния, тошнота, рвота. Возможно окрашивание мочи в красный цвет

Поб.: болезненность, сыпь, зуд, головная боль, тошнота, рвота, диарея, т.д.

### Тинидазол

Форм: таблетки по 0,5

1 таб. 3 раза в день независимо от приема пищи

Метронидазол (Амброданол) - препарат выбора в лечении вагинального дисбиоза

Форм: таб., суспензия для приема внутрь. Курс лечения 5 дней при вагинальном дисбиозе 1 раз в день

### Фурозидонидин (Сеп. ринекс)

## 2. Средства, применяемые при трихомонадозе

Защитное, противодействующее образованию трихомонады, передается половым путем. Препараты выбора, являясь паразитицидными средствами

1. метронидазол, доксицилин, метронидазол, тетрацилин, бетадин, вагинал ДЛ, фуразидонидин

Метронидазол - в дозах по 0,25 г 3 раза в день после еды 10 дней. Одновременно назначаются вагинальные таблетки (0,5) вечером. Лечение и партнеров. При использовании вагинальных таблеток возможно раздражение влагалища, зуд, жжение.

Бетадин – в виде вагинальных суппозиториев. Возможное местное раздражающее действие

## 3. Противамебные средства

Амебиаз (амебная дизентерия) вызывается амебами, которые могут находиться как в просвете кишечника, так и в стенках толстой кишки и в окружающих тканях (таблетки, растворы)

Для лечения всех форм амебиаза препаратами выбора являются метронидазол, фуразидонидин, в таблетках и в/в капельно в виде раствора.

## № 11 Противогрибковые, противовирусные и противоглистные средства

### Противогрибковые средства

В настоящее время применяются препараты флюконазола для лечения человека и животных от грибков, которые вызывают заболевания, называемые микозами. Мукес (греч.) – гриб.

Наиболее распространены такие виды микозов, как дерматомикозы и кандидозы.

Дерматомикозы – заболевания, вызываемые совершенными грибами, при которых поражаются кожа и ее придатки (ногти, волосы) у человека и животных. Например, трихофития, микроспория.

Кандидозы – заболевания, вызываемые дрожжеподобными грибами рода *Candida* при которых поражаются кожа, слизистая оболочка, ногти, внутренние органы.

Трихофития чаще бывает у детей, заражение происходит через одежду, предметы обихода. Сначала появляются небольшие округлые пятна с белой или розовой окраской на пораженных участках тела и на кончиках ногтей. В центре точек – шелушение, которое образуются после облысения с волос. Поражаются также кожа и ногти (онихомикоз). Ногти становятся толстыми, бугристыми, утолщаются, крошатся, ногтевая пластинка сменяется бесструктурной массой желто-розового цвета. Мелкая корочка сменяется глянцевым покрытием. Изменяется пигментация и может не измениться.

Аналогично это проявляется и при поражении слизистой оболочки рта

### КЛАССИФИКАЦИЯ ПРОТИВОГРИБКОВЫХ СРЕДСТВ

Группы	Представители
Полиены	Нистатин Леворин Амбостерил В
А Н О	Кетоконазол Флуконазол Миконазол Ифенгал

О

Бифоназол

Г М	Группы	Однократно Итримонал
	Антибиотики	Гербинафин Вифендон
	Препараты против паразитов жизни	Галсинар Флушисин Хлорнитрофенол Катя воля

Гербинафин (Даян Апп. Ламифаст, гербизин)

Ламизил (- Lamisil)

Ф.в.: таблетки по 0.25 №14, крем 1% - 15г, спрей.

Обладает широким спектром действия в отношении грибков, вызывающих заболевания кожи, волос и ногтей в т.ч. дерматофитов, а также грибок рода *Candida*. Он быстро проникает в кожу, в секрет sebaceous желез, что создает высокую концентрацию препарата в коже, при этом также усиливается иммунитет

Применяется при кандидозах, вызванных грибами дерматофитов, микозах ногтевой пластины, грибковых поражениях кожи (фурункулы, флегмоны, стригущий лишай и др.) и грибок рода *Candida*

Антипаразит. действие directed on любой стадии и тяжести заражения (1-6 недель однократно по 1мг ежедневно, снижается до 0-12 недель для клинического и лабораторного излечения. (отращивание здоровых ногтей).

П.д.: шелушение, высыпания, боль в мышцах и суставах.

П.л.: болезненность, жжение.

Ламифаст (Lamisil)

Ф.в.: крем 1% - 15г, 10г

Применяется при грибковых поражениях кожи, ногтевых дерматофитов (стригущий лишай, микроспория и др.) поражениях кожи при кандидозе (рыльцевидный лишай)

Препарат применяется 1-2 раза в день, наносит на пораженные и прилегающие участки кожи, слегка втирая, предварительно очистив пораженные участки.

П.д.: иногда покраснение, зуд, жжение, редко аллергические реакции.

П.л.: иногда покраснение, зуд, жжение, редко аллергические реакции.

**Гербинил (Gerbinal):**

Форм-высвобождения: 0,125 и 0,25, крем 1% - 15,0

Применение: зуд при различных формах экземы и дерматитов

Применение для наружного применения (экзема, дерматит, зуд при ожогах, экзема, дерматит и др.) применяется при зуде кожи в форме мази, крема, пены. При охараивании постель - раскрасить, а сушить 105.

Механизмом действия чаще бывают дети и женщины (экзема, зуд). На воспалительной основе пощелается очаживание с круглой формой, где все волосы обросли на 1-6 мм над уровнем кожи, на гладкой коже очаживает напоминает кольца. Лечение (см. талкофратин)

Кандидоз развивается на фоне многих заболеваний, в том числе при шлвном и медуллярном, гонорее, дисбактериозе кишечника и др.

Кандидоз возникает обычно на фоне рвоты и является вторичным заболеванием. На фоне поражения слизистой оболочки гортани, языка, щек, десен, слизистой оболочки кишечника, влагалища, шейки матки, крошечные высыпания на коже, зуд.

При дерматозе жидкостями и шелушением, безболезненно, белая в животе, диарея (иногда стул с кровью). Кожа поражается чаще в паховой области, под молочными железами, в межпальцевых трещинах и др. при этом может быть зуд и раздражение.

Форм-высвобождения: крем, мазь, раствор, таблетки, суппозитории, свечи, растворы для инъекций, глазные капли и местные препараты.

Из побочных эффектов системного применения наиболее характерны: головная боль, головокружение, диспепсия, зуд.

Применение: кандидоз при зуде и раздражении.

Форм-высвобождения: 0,125 и 0,25, крем 1% - 15,0

Применение: зуд при различных формах экземы и дерматитов

Применение: кандидоз при зуде и раздражении.

Препарат плохо всасывается из ЖКТ

П.д.: аллергия, диспепсия.

П.д.: аллергия, диспепсия.

Флуконазол (Fluconazole) – антимикотический препарат для перорального применения.

Формы выпуска: капсулы по 50 мг, по 150 мг и 200 мг.

Показания: кандидоз влагалища, вагинальный кандидоз, кандидоз кожи, отрубевчатый лишай, кандидоз полости рта, кандидоз ногтей.

Применение: кандидоз влагалища, вагинальный кандидоз – по 150 мг однократно; кандидоз кожи, отрубевчатый лишай, кандидоз ногтей – по 50 мг однократно в течение 1-2 недель; кандидоз полости рта – по 50 мг 2 раза в день в течение 14 дней; кандидоз ногтей – по 150 мг однократно в течение 6-12 недель.

Побочные эффекты: головная боль, тошнота, диарея.

Алфенол – трифторметилэтиловый спирт.

Формы выпуска: раствор для инъекций. Имеет широкое спектром действия, является препаратом выбора при лечении тяжелых инфекций внутренних органов. Ввиду высокой токсичности при приеме редко.

Применение для лечения кандидоза:

Имеет широкое спектром действия, является препаратом выбора при лечении тяжелых инфекций внутренних органов. Ввиду высокой токсичности при приеме редко.

Вагинальные препараты: вагинальные таблетки – крем 1% – 15 г; вагинальный крем 2% – 15 г; вагинальный крем 1% – 20 г; раствор для инъекций: применение 1% – 15 мл, вагинальный – крем по 15 г.

Все препараты, кроме вагинальных кремов и крема «Неоцерид» имеют широкий спектр действия и применяются при лечении кандидоза кожи, отрубевчатого лишая, кандидоза ногтей.

Применение для лечения кандидоза:

Вагинальные – вагинальные таблетки: применение – вагинальные таблетки с вагинальным.

Вагинальный крем, вагинальный – вагинальный крем с вагинальным.

Вагинальный крем – вагинальный крем

Вагинальные, вагинальные, вагинальные, вагинальные – вагинальные вагинальные, вагинальные, вагинальные – вагинальные вагинальные с вагинальным.

Гриппозный синдром проявляется преимущественно в период春秋季节. 3-4, степень тяжести различна.

Гриппозный синдром выбора для беременных.

Гриппозный синдром применяется следующим образом: 1-2 раза в день, чаще 1 раз в сутки.

Противогриппозные средства

Вирусные инфекции являются одной из основных причин заболеваний. К 1980 г. удалось победить на широком фронте развитие вирусных инфекций. Вирус вызывает болезни нервной системы (менингиты, энцефалиты, болезни органов дыхания (ОРВИ, грипп, пневмония и др.); болезни кожи и слизистых оболочек (простой герпес, опоясывающая лямбда-герпесом и др.); заболевание глаз, желудочно-кишечного тракта (СНП) и др.

Наряду с применением традиционных методов лечения особое внимание уделяется созданию противогриппозных средств.

К основным противогриппозным средствам относятся ремантадин, амидопирин, интерферон, инфоферон, ацикловир, циклоферон, энтеросол, аэрозольный грипполон, солгосер.

Ремантадин:  $\text{C}_{12}\text{H}_{19}\text{NO}_2$

Форм.: таб. по 0,05 г/таб. 1 таблетка растворяется в 100 мл для приготовления раствора или инъекций.

Применение: 1. профилактика: и раньше лечение гриппа, вызываемого вирусом типа А. 2. профилактика клещевого энцефалита. Для профилактического приема принимать по 1 таб. в день, после еды 5-7 дней при контакте с клещом или лечение 1 таб. в день.

П.т.: аллергия, нарушение функции печени, возбуждение ЦНС.

П.т.: беременность, по 3 лет (в таб.) острое заболевание печени, почка, при лечении.

Оксалин:  $\text{C}_{11}\text{H}_{17}\text{NO}_2$

Форм.: мазь 0,25% - 10 г 15г; 5% - 30г

Эффективна в отношении вируса гриппа и вируса герпеса.

Эффективна в отношении вируса гриппа и вируса герпеса.

Применение: 1. 0,5% мазь для профилактичного змащування (формітувати слизову оболонку носа 2-3 рази в день в період епідемії гриппу), для лічення простого герпесу карієти (закладувати за вказівкою).

2. 3% мазь для лічення опоясувального герпесу, бородавок.

Дія: слорезервоване чутливе живина.

Р.Б. Найбільше часте простий герпес розширює на губах, куточках щелеп, слизових оболонках. Висипи на думарі, зуд, жогиння, біль, корочка, укрива.

Опоясувальний герпес (шкарі) характеризується висипами по ходу нервових гангліонів черевних ветвей тринадцятого нерва, супроводжується зудом, болем по ходу нерва.

Ацикловір (Aciclovir), зовиракс, веролокс, герпекср.

Форм: таб. по 0,2, 0,4 і 0,8 №20; 25; 50.

Крем и мазь 3% по 2,5 и 10 г в тубах, порошок для инфузій по 0,25 і 0,5 и 1г.

Активна в отношении вируса простого герпеса типа 1 (оральный) и 2 (генитальный), вируса опоясывающего лишая.

Применение: 1. инфекция кожи и слизистых, вызванная вирусом простого герпеса (простой герпес I типа, ветряная оспа, генитальный герпес); 2. менингит, энцефалит; 3. язвенная болезнь; 4. препарат для профилактики ВИЧ-инфекции при

Принимать для лечения по 1 таб. 5 раз в день по 5 дней мазь наносить 5 раз в день на пораженные участки.

Действие: дезоксирибонуклеозид.

Действие: противовирусное.

Мазь «Нес» широко применяется при простом и опоясывающем герпесе, язвенной болезни и язвенном колите 3% мазь на вазелине.

Нафталин (Naphal)

Форм: таб. по 0,5 № 50.

Несет антимикробное действие. Применяется для лечения и профилактики простого и опоясывающего герпеса, бородавок и генитального герпеса 5-10 дней, по 1 таб. 2 раза в день, профилактика простого и опоясывающего герпеса. Курс лечения генитального герпеса 5-10 дней, по 1 таб. 2 раза в день.



Где: см - сантиметр

Препараты (Сторитон);

Фв - фтор 0,5 Мг/г

Применение: 1 таблетка 3 раза в день во время приема пищи, при приеме препарата избегать употребления жирной, острой, соленой, пряной пищи, алкоголя, газированных напитков, кофе, крепкого чая, курения, а также употреблять алкоголь. Не применять препарат при беременности, лактации, а также при приеме других препаратов. Не принимать препарат одновременно с другими препаратами.

Кроме того при приеме препарата следует избегать приема других препаратов, действие которых может быть усилено.

Применение по 1 таб 3-4 раза в день 3-7 дней

Где: таб - таблетки, вставка - инъекция, м - миллилитры, мл - миллилитры

Где: таб - таблетки

Применение: 1 таблетка 3-4 раза в день во время приема пищи, при приеме препарата избегать употребления жирной, острой, соленой, пряной пищи, алкоголя, газированных напитков, кофе, крепкого чая, курения, а также употреблять алкоголь. Не применять препарат при беременности, лактации, а также при приеме других препаратов. Не принимать препарат одновременно с другими препаратами.

Применение: 1 таб. 3-4 раза в день во время приема пищи, при приеме препарата избегать употребления жирной, острой, соленой, пряной пищи, алкоголя, газированных напитков, кофе, крепкого чая, курения, а также употреблять алкоголь. Не применять препарат при беременности, лактации, а также при приеме других препаратов. Не принимать препарат одновременно с другими препаратами.

Анализ мочи - препарат не влияет на выведение мочевины в моче и не влияет на выведение мочевины в моче.

С осторожностью применять препарат при приеме других препаратов, действие которых может быть усилено.

Противопоказания: беременность

Условия хранения: хранить в защищенном от света месте в оригинальной упаковке

В мире существует до 300 тысяч видов гельминтов, из них регистрируются около 100 видов. Наиболее часто встречающиеся круглые черви (нематоды) - острицы, острицы, власоглавы. Плоские (ленточные) - свиной и бычий цепень, широкий лентец.

Противогельминтные препараты должны соответствовать следующим требованиям:

1. иметь широкую спектра действия и высокую эффективность,
2. действовать только на гельминты,
3. быть малотоксичным, быстро выводится,
4. не вызывать побочных действий.

Препараты, применяемые при кишечных нематодах:

Препараты, применяемые при кишечных нематодах:

Гальчакеты	Препараты					
	ни карман 1	декарис 2	пермасел 3	пиранил 4	пирасел 5	клеторид 6
Аскаридоз			+	+		+
Трихоцефалез	-	-	+	+	-	-
Энтеробиоз	-	-	+	+	-	+
Гистрихоз				-		
Трихоцефалез (в таблетках)						

Пиперазиня алаттырат (Piperazine adipinate)

Ф.в.: таб. по 0,5

Базначакит по 2г 2 разы в день 2 дня при аскаридозе. 5 дней – при энтеробиозе за 1 час до еды или 1 час после еды. ри

Парализует мускулатуру гельминтов, выводя это объективизация. Слабительные средства для клизмы необходимы лишь при запоре. те.

П.д.: сплетения, головная боль, мышечная слабость.

П.п.: энцефалит.

Декарис (Desafil dekaris)

Ф.в.: таб. по 0,05 №2 и 0,1 №1

1 препарат по 1таб. на ночь.

Целексин (Citalopram) 1 таблетка вечером после

1 д. – для снятия головной боли, при чихании при эмболии синусов.

Нарзан (Narzan) – минеральная вода

Ф.в.: таб. по 0,1 №6

Ф.в.: таб. по 0,1 №6

Грибок по 1 таб. (противопоказано при беременности).

Грибок при беременности, только при лечении в стационаре.

Грибок по 1 таб. (противопоказано).

Противопоказано по 0,15 №3, суспензия по 15 мл. Противопоказано при беременности по 0,15 таб. при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами, действующими на желудочно-кишечный тракт.

Грибок при беременности.

Грибок (в стационаре).

Противопоказано по 0,2 №2, 0,4 №1. Противопоказано при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами.

Грибок по 1 таб. (противопоказано при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами).

Грибок при беременности, особенно при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами.

Грибок при беременности.

Грибок при беременности, особенно при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами.

Грибок при беременности, особенно при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами.

Грибок при беременности, особенно при приеме с другими препаратами, особенно с другими препаратами.

## № 12 Заключительное занятие по разделу: «Противомикробные, противовирусные и противопаразитарные средства»

### Вопросы для самоподготовки

1. Противомикробные средства: классификация, особенности действия, применение.

2. Патогеноносительство: средства, антисептики и дезинфектанты: механизмы и особенности действия, применение.

3. Препараты: механизмы действия, особенности действия, применение, побочные эффекты.

4. Антибиотики: классификация, препараты, классификация по механизму действия на микроорганизмы и по характеру действия на микроорганизмы и противомикробному спектру.

6. Классификация антибиотиков по механизму действия. Механизмы избирательной токсичности антибиотиков в отношении микроорганизмов

6. Антибиотик группы тетрациклины: механизм действия, классификация, противомикробный спектр, особенности действия, применение, побочные эффекты

7. Антибиотик группы пенициллины: механизм действия, классификация, противомикробный спектр, особенности действия, применение, побочные эффекты.

8. Рифампицин и ампиогликозиды: механизм действия, классификация, противомикробный спектр, особенности действия, применение, побочные эффекты

9. Хлорамфеникол и линкозамиды: группы тетрациклины: механизм действия, классификация, противомикробный спектр, особенности действия, применение, побочные эффекты.

10. Макролиды: механизм действия, классификация, противомикробный спектр, особенности действия, применение, побочные эффекты

11. Противогрибковые препараты: классификация

11. Противогрибковые препараты: противогрибковый спектр, механизм действия, применение, побочные эффекты

12. Противовирусные препараты: классификация, противомикробный спектр, механизм действия, классификация, применение, побочные эффекты.

13. Противопаразитарные средства: классификация, механизмы и особенности действия, применение, побочные эффекты антибиотиков и химических средств

14. Противопаразитарные средства: классификация, противомикробный спектр, механизм действия, особенности действия, применение, побочные эффекты.

15. Противомаларийные средства: классификация, механизм действия, применение, побочные эффекты.

16. Противогрибковые средства: классификация, спектр противогрибкового действия, механизм и особенности действия, применение, побочные эффекты.

17. Противогрибковые средства: классификация, спектр противогрибкового действия, механизм и особенности действия, применение, побочные эффекты.

18. Противогрибковые средства: классификация, спектр противогрибкового действия, механизм и особенности действия, применение, побочные эффекты.

## № 13 Препараты гормонов белкового, пептидного строения и производные аминокислот, их синтетических заместителей и антагонистов

Препараты гормонов, их спонтанности, заместителей и антагонистов»

Препараты-биологически активные вещества являются в организме человека источником железа. В железных внутренних органах (особенно при энцефалопатии, парашитовидные железы, щитовидная железа, кора пищеварительного тракта, половые железы (яичники у женщин и семенники у мужчин). Особое место среди желез внутренней секреции занимает гипофиз-гипофиз. Гипофиз, в свою очередь, выделяет гормоны, которые стимулируют деятельность других желез внутренней секреции: щитовидной железы, надпочечников, половых желез. Гормоны этих желез тормозят продукцию соответствующих гормонов гипофиза. Секретная деятельность гипофиза стимулируется гормонами гипоталамуса: соматотропным гормоном. В свою очередь также выделяются гормоны, которые стимулируют продукцию гормонов передней доли гипофиза. Недостаточные препараты, содержащие гормоны, или их синтетические заместители, называются гормональными препаратами. Их назначают в основном в терапии заместительной терапии (при недостатке гормонов в организме человека). При недостатке гормонов в организме человека, как правило, назначают препараты, содержащие гормоны. Кроме того, некоторые гормональные препараты могут применяться как лечебное средство при заболеваниях, не связанных непосредственно с недостатком гормонов.

1. Препараты гормонов гипофиза В гипофизе выделяют переднюю долю гипофиза, среднюю и заднюю. Каждая доля выделяет в кровь различные гормоны. Препараты передней доли гипофиза: Перланин или эвюл (представляет собой гормон АКТГ (стимулирует продукцию гормонов аденоидипитuitarной железой), гормон роста, лактогенный гормон (стимулирует секреторную функцию молочных желез в послеродовом периоде), тиротропный гормон (стимулирует образование и выделение гормонов щитовидной железы), а также андрогенный гормон (стимулирует выработку тестостерона у мужчин-гипоандрогонных). ГП-УСЖ (железистый гормон) стимулирует выработку тестостерона у мужчин в стимулирует продукцию мужских половых гормонов. Так, препарат АКТГ инкретирует выработку гормонов коры надпочечников, а также для гипофизарного гормона (пролактин) для стимуляции лактации, тиротропного гормона (тиротропин), а также препараты, которые по своему действию соответствуют гонадотропным гормонам гипофиза гонадотропин менопаузальный

(содержит все факт), гонадотропин хорионический (гонадотропин ЛН) (Г).  
 Гонадотропин хорионический применяют у женщин для стимуляции  
 фолликулов яичников, у мужчин — при недостаточности сперматогене-  
 за. Гонадотропин хорионический неэффективен у женщин при гипериндиз-  
 сменности, у мужчин при недостаточности продукции мужского полового  
 гормона. Препараты гонадотропной природы. Задняя доля  
 продуцирует два гормона — окситоцин и вазопрессин  
 (антидиуретический). Окситоцин стимулирует ритмическое сокращение  
 матки во время родов, а также способствует выделению молока  
 из молочных желез сразу после родов. Вазопрессин усиливает тонус  
 гладких мышц кишечника, сосудов, желчевыводящих путей, выводит  
 из организма воду. Антидиуретическое действие вазопрессина связано с выведе-  
 нием воды в почечных канальцах, где происходит выделение воды из  
 осмотиче. Наоборот, при недостаточности вазопрессина развивается  
 резкая жажда (при 10-20 г суточной выделении воды, а не 1 л), усилен-  
 ная мочевыделение. Заболевания почек, связанные с нарушением выведе-  
 ния воды (сахарное мочеизнурение). Окситоцин не выделяется в значительной  
 степени при слабости родовой деятельности и послеродовых маточных  
 кровотечениях. Гонадотропин-вытяжка из задней доли гипофиза, убийствен-  
 ный скота, содержит в своем составе два гормона — окситоцин и вазопрессин. При  
 лечении у человека препаратом вазопрессина (в дозе 1 мг). Включен в перечень  
 лекарственных препаратов при сахарном диабете. Антидиуретический  
 препарат, обладающий мочегонной и диуретической активностью.  
 Выделяется в количестве 6-8 час. 2. Препараты  
 гормонов щитовидной железы и их аналогов. Щитовидная железа  
 продуцирует три гормона — тироксин, трийодтиронин и кальцитонин. Тироксин  
 и трийодтиронин оказывают регулирующее влияние на обмен белков, липидов  
 и углеводов, на обмен кальция, фосфора, натрия, калия, железа, меди, цинка,  
 ЦНС и эндокринная. Кальцитонин снижает содержание кальция в крови и  
 увеличивает его отложение в костной ткани. Вследствие недостаточности и  
 избытка тироксина (гипотиреоз) и недостаточности, возникающая в детском  
 возрасте (микседема) сопровождается ожирением, отеками, отеком  
 височных желез, развитием гипотиреоза. Гипотиреоз характеризуется  
 развитием также при недостатке в пище йода, который необходим для  
 синтеза гормонов щитовидной железы. При этом наблюдается  
 компенсаторное увеличение щитовидной железы (образуется  
 зоб). Заболевание называется эндемическим зобом. При гиперфункции  
 щитовидной железы (гипертиреоз, базедоз, болезнь Базедова)  
 наблюдается похудение, тахикардия, дрожание пальцев, быстрая  
 утомляемость, раздражительность. 3. Препараты, применяемые при  
 недостаточности функции щитовидной железы (кретинизм, микседема).  
 Начиная с препаратов гормонов щитовидной железы — тироксин (Т<sub>4</sub>)  
 и трийодтиронин. Тироксин — препарат в виде таблеток щитовидной желе-  
 зы (содержит тироксин и трийодтиронин). Применяется внутрь, по  
 1-2 таблетки. При приеме препарата действие начинается через 2-3 дня  
 в таблетках. При ежедневных приемах действие начинается только на 2-3 день

лечены в дождливый максимум через 3-4 недели. Препараты перелируются как препараты в связи с его медленным действием, которое проявляется такая картина: потливость. Препараты кальция: скарлатина, лаванда, коллоидная перманганат калия, бромиды. Адреналин. При 10, 20, 30, 40, 50, 60, 70, 80, 90, 100, 110, 120, 130, 140, 150, 160, 170, 180, 190, 200, 210, 220, 230, 240, 250, 260, 270, 280, 290, 300, 310, 320, 330, 340, 350, 360, 370, 380, 390, 400, 410, 420, 430, 440, 450, 460, 470, 480, 490, 500, 510, 520, 530, 540, 550, 560, 570, 580, 590, 600, 610, 620, 630, 640, 650, 660, 670, 680, 690, 700, 710, 720, 730, 740, 750, 760, 770, 780, 790, 800, 810, 820, 830, 840, 850, 860, 870, 880, 890, 900, 910, 920, 930, 940, 950, 960, 970, 980, 990, 1000.

перелом бедра, ибедра и запястья. При переломе бедра-ингибиция, может вызвать аллергическую реакцию. В этом случае применяют другой препарат ингибитора (сульфонил). Для запястья пролонгированности действия ингибитора при приеме его три раза по 50 мг (100 мг) действенно. К таким препаратам относятся: ралитин, сульфонил и др. (ингибиторы действия). 10-14-36 год. сульфонил и др. (ингибиторы действия 24-36 час.). Эрозия или трещины шейки матки (1-3 вводить по 10 мг!!!) б) Синтетические гестагенные средства. Применяют три летных форм сахарного диабета, связанных с функцией поджелудочной железы. Они стимулируют выработку инсулина в печени и снижают уровень глюкозы в крови. Инсулин (букарбин) выпускается в виде таблеток 1-3 раза в день (каждые 5-7 часов). Обладает пролонгированностью действия (2 таб.). Четыре препарата для лечения старости (10-15 лет) связаны с функцией поджелудочной железы. К ним относятся: букарбин, эрритрин, симпатин, хлороквин. Побочные эффекты: лейкопения, диспепсия, головная боль, шлуночные реакции. Препараты противопоказаны при нарушениях функции печени, почек, системы крови, при аллергических реакциях на препараты сульфонил-амидов. Букарбин. К побочным проявлениям сульфонил-амидов относятся: тошнота, рвота, диарея, головная боль, головокружение, слабость, сонливость, снижение аппетита. Препараты этой группы (букарбин, симпатин, буферин) применяются при лечении и профилактике форм сахарного диабета, независимо или в сочетании с инсулином и производными сульфонил-амидов. 5. Препараты половых гормонов и их синтетические заменители. Препараты женских половых гормонов. Женские половые гормоны вырабатываются в яичниках. Единственный яичниковый продуцируемый эстрогенный гормон, с помощью которого связываются различные вторичные половые признаки и определенные фазы менструального цикла. После окончания менструации в крови постепенно повышается уровень эстрогенов, что связано с развитием фолликуликулярных фазы (13-14 дней, после завершения) приходящие овуляция. В конце цикла (фолликулярная фаза) увеличивается в толщину эндометрия фолликула, обрывается желтое тело, которое начинает продуцировать гестагенные гормоны. При этом выработка эстрогенов резко уменьшается. Всплеск в это время происходит с овуляцией яйцеклетки и возникает большое количество гестагенных гормонов, способствующих сохранению беременности. Во время овуляции яйцеклетка не проникает, желтое тело атрофируется и уровень гестагенов в крови снижается. В конце цикла повышается уровень эстрогенов в крови, что способствует началу новой менструации. Ралитин (три раза в день) и др. (то же самое) сульфонил-амидов. Запрещены при беременности. Применяют в период лечения ингибитора при первичной недостаточности гестагенных лекарственных средств. Эстрогенные препараты применяют в порядке заместительной терапии при первичной недостаточности



хронических формов и связанных с ними нарушениях (вплоть до климактерического синдрома), нарушениях роста и развития половых органов и т.п. при бесплодии, карциномах менструального цикла, в сочетании с тестостеронами применяется. В период полового цикла рекомендуется избегать, как в крайности (избыток) так и недостатка при приеме препаратов у женщин при лечении рака простаты, а также при беременности. Эстрогенная терапия является отличительной чертой пременопаузы, характеризуется обильными менструальными выделениями (при недостаточности лютеиновой фазы и пролиферации эндометрия). При климактерическом синдроме эстрогены рекомендуется принимать в виде таблеток (при недостаточности фолликулярной фазы) или в виде пластыря (100 мкг/24ч). Побочное действие на органы кровотока при лечении данным препаратом: повышение вязкости, склонность к образованию кровянистых выделений, гипертоническая реакция клеток, образование патологических состояний, как болевых ощущений в суставах (особенно в возрасте от 60 лет). Эстрогены назначают при климактерическом синдроме в период лечения хроническими заболеваниями. Механизм действия по МСХА-1 не 1-2 раза в сутки. Сидестрел. Препараты: рак молочной железы у женщин в постменопаузе от 60 лет, гиперплазия предстательной железы. Внутрь 2мг 1-2 раза в день, так же 1-2 мг 0,1% или 2% раствора. Побочные эффекты: тошнота, рвота, экзема, сухость слизистой оболочки, феморальная остеопороз, повышение кровяного давления (не рекомендуется у женщин с заболеваниями сердечно-сосудистой системы, особенно с артериальной гипертензией, сахарным диабетом, заболеваниями печени). Противопоказания: беременность, лактация, заболевания молочных желез, нарушения менструального цикла в сочетании с эстрогенами также для профилактики самопроизвольных аборт (в таблетках или в виде пластыря). Противопоказания: острых заболеваний (андроэногенного генеза). Эстроген терапия, характеризующаяся ферментацией репродуктивной системы у мужчин, в различных вторичных половых признаках-тестостерон. Она также обладает анаболическими свойствами. Андроэногенные препараты также востребованы при фактической недостаточности тестостерона у мужчин по различным причинам. Кроме того, они применяются при ожирении и добротоме у женщин, и при гипотиреозе у представителей женского пола. Женщины применяют для профилактики при заболеваниях половых органов и молочных желез, а также при дисфункциональных маточных кровотечениях. Тестостерон применяется. Назначают 6мг или 10 мг 1-2 мг 1% или 2% раз в сутки. Биологическая активность в течение 1-2 дней. Курс составляет 10-15 дней, до улучшения мышечной массы. Интенсивнейшие при приеме больших доз повышается уровень активности и соли в организме. У женщин явления маскулинизации, сгущение голоса, гирсутизм, истончение ногтей, атрофия молочных желез, избыточный рост волос на лице и т.д. Побочные эффекты: снижение либидо. Противопоказания: беременность, лактация. Принимать по 1 таблетке 1 раз в сутки. Состав: тестостерон, витамин Е, витамин А. Препараты: тестостерон, омнандрен-250, тестостерон ципионид. Источники: <http://refleader.ru/bewrnabewujg.html>

## № 14 Препараты гормонов стероидного строения, их синтетических заменителей и антагонистов

К группе стероидной структуры относятся гормоны щитовидной железы (тироксин, трийодтиронин), женские и мужские половые гормоны. Все они являются производными холестерина. Предшественником всех стероидных гормонов в организме человека является холестерин, который синтезируется из углеводов.

Стероидные гормоны действуют на внутриклеточные рецепторы, которые находятся в цитоплазме клеток-мишеней. Связавшись с рецепторами, они образуют комплекс, который взаимодействует с ДНК, вызывая синтез определенных белков.

Комплекс стероидного гормона с рецептором транспортируется в ядро клетки. В ядре происходит взаимодействие этого комплекса с факторами транскрипции, что приводит к синтезу определенных белков (ферментов).

Результатом взаимодействия комплекса с ДНК является синтез определенных белков, которые приводят к различным эффектам (например, к синтезу определенных белков).

Препараты гормонов коры надпочечников, их синтетических заменителей и антагонистов

Щитовидная железа - важный орган, находящийся на передней поверхности каждой почки, состоящий из железистой ткани и внутреннего мозгового вещества. Водянистая жидкость в фолликулах. Кора надпочечников состоит из трех зон - внешней клубочковой, пучковой и сетчатой, в которой синтезируются различные гормоны (например, кортизол, кортизон, андростендион, андростендион, андростендион).

К основным кортикальным гормонам относят кортизол и кортизон, которые выполняют функцию регуляции обмена веществ, как регулятор обмена.

Кроме кортизола выделяются и другие кортикоиды, антагонисты 90% всех образующихся кортикоидов и являются необходимыми для человека, обеспечивая гуморальную регуляцию адаптации к изменяющимся условиям внешней среды и являясь важными компонентами защитной реакции организма на стресс.

Острая недостаточность коры надпочечников сопровождается снижением артериального давления и температуры тела, нарушением всех видов обмена веществ и может привести к смерти через несколько часов. Угнетение функции коры надпочечников (например, при болезни Аддисона) проявляется снижением массы тела, потемнением кожи и слизистых оболочек, болями в животе.

Гидрокортизон (кортизон) в кортизон

В 1948 г. кортикостероиды впервые были выделены из коры надпочечников швейцарским химиком Талсушем Рейхштейном и американским биохимиком Эдвардом Кендаллом.

В сентябре 1948 г. американский врач Филип Хенч впервые ввел кортизон больному ревматоидным артритом, который после пяти лет, трехдневных перерывов из-за развития боли в eye лях, начал снова интенсивно работать.

Гидрокортизон действует на обмен кальция в костях, способствует мобилизации кальция из костной ткани в кровь, усиливает выведение кальция почками, снижает уровень кальция в крови, и повышает уровень кальция в костях. Гидрокортизон действует в клубочковой зоне и в большей степени по сравнению с глюкокортикоидами способствует минеральной обмену (табл. 1).

Стероидные гормоны - кортизол и кортизон образуются из холестерина. Синтез стероидных гормонов связан (рис. 29) в основном с тем, что холестерин превращается в предшественники стероидных гормонов. Гидрокортизон нарушает синтез холестерина в предшечнике и таким образом способствует образованию стероидных гормонов. Аминопреднизолон можно применять при синдроме Иценко-Кушинга, снижает уровень глюкокортикоидов в надпочечниках, но при раке надпочечной железы, повышает уровень кортизола, при раке предстательной железы (гидрокортизон снижает уровень преднизолона).

Местное применение гидрокортизона при экземе, дерматите и язве.

## № 15 Витаминные препараты. Поливитаминные препараты. Витаминные препараты в комбинации с минеральными веществами. Средства, применяемые для лечения и профилактики остеопороза

Витаминные препараты в настоящее время широко применяются для профилактики и лечения различных заболеваний. Активно используются как препараты, содержащие один витамин, так и комбинированные препараты, или поливитамины, и витаминно-минеральные комплексы.

Поливитамины включают в свой состав от двух до десяти-двенадцати витаминов и микроэлементов, а также минералы и органические комплексы помимо одного или нескольких витаминов как таковых и различные микроэлементы и минеральные вещества. В последнее время чаще в состав витаминных препаратов включают коферментные формы витаминов, что позволяет усилить их действие и активнее вовлечь в протекающие в организме процессы.

Полн витаминные и витаминно-минеральные комплексы разрабатываются с учетом взаимодействия витаминов между собой. А зачастую еще это бывает сложным, как сложная аналитика в органическом: некоторые сочетания витаминов позволяют получать синергический эффект, усиливать действие, при этом комбинации, наоборот могут понижать эффективность и даже к некоторым последствиям. Именно поэтому не существует единой формулы комбинации, будут сложны; поливитаминные препараты, включающие сразу все известные витамины и различные коферменты.

#### Новые поливитаминные препараты

Витаминных препаратов, поливитаминных, витаминно-минеральных комплексов создано в последние годы очень большое количество. Упомянем некоторые из них:

- 1 Асвит
- 1 Аэравит
- 1 Витрум
- 1 Гедарит
- 7 Гельмакс
- 1 Гелтивит
- 1 Глутамевит
- 1 Декаменит
- 1 Кредавит
- 1 Крецивит
- 2 Олиговит
- 1 Пакросевит
- 1 Пертобит
- 1 Рацивит
- 1 Регит
- 7 Тетравит
- 1 Тетрафолевит
- 1 Ундевит

Практически все витаминные препараты продаются в аптеках без рецепта. Однако это не означает, что можно принимать их бесконтрольно. Перед тем, как принимать все витаминные препараты, продающиеся в аптеках без рецепта, необходимо проконсультироваться с врачом.

как начать принимать тот или иной препарат, посоветуйтесь с врачом, а если это что-то такое, как укол, инъекция — примите на это разрешение и позицию, возможно, придется быть приложными к какой-то упаковке препарата.

При остеопорозе происходит уменьшение массы и плотности костей, изменяется также их микроархитектура, что приводит к повышенной хрупкости и увеличению риска переломов (позвоночника, шейки бедра и др.) и сильная переломы приводят к инвалидности и преждевременной смертности пациентов и семей. Лечение таких больных длительное и требует участия фармацевтической отрасли. Большая распространенность остеопороза у людей среднего и старшего возраста стимулировала интенсивный поиск эффективных лекарственных средств для лечения и профилактики этой патологии.

Как известно, костная ткань постоянно обновляется в процессе обмена веществ. В течение всей жизни происходит разрушение костей (в основном за счет выработки остеокластов) и образования новой костной ткани (остеоцитогенез). Масса костей кости достигает максимума к 30 годам и затем постепенно снижается к 75 годам [1].

Остеопороз подразделяют на первичный (основной источник) и вторичный (вторичный источник) в зависимости от причины возникновения. В результате применения глюкокортикоидов, статинов, таргетной терапии в лечении рака, а также при длительном применении глюкокортикоидов, гиперпаратиреозе, гипопаратиреозе. Остеопороз различается также по локализации патологических изменений, по характеру переломов.

<sup>1</sup> Костная ткань состоит из минеральной части — в основном из гидроксиапатита  $[Ca_{10}(PO_4)_6(OH)_2]$ , и также из органической части — из коллагеновых волокон, которые включают коллаген, неколлагеновые белки, липиды.

может уменьшаться на 30-50%. Остеопороз возникает при нарушении динамического равновесия между разрушением кости и ее образованием. При нарушении баланса между этими процессами происходит нарушение формирования, созревания, ремоделирования, поддержания и восстановления костной ткани. Важными факторами, регулирующими активность остеокластов (остеоцитогенез) являются цитокины, гормоны, витамин D и его метаболиты, стероидные гормоны, протезирование, регулярными физическими упражнениями (остеоцитогенез) и другими факторами. Кроме того, важную роль в поддержании и нормальной массы и структуры костей играет механическая нагрузка и генетические факторы.

Гранатами, скарлатинами (не более трети от дозы) при остеопорозе могут быть использованы в качестве вспомогательных средств.

## 1. Гормоны, их аналоги и производные

### 1.1. Гормоны, их аналоги и производные

1. Нефосфонаты (эдроноват, дендроноват)

2. Кальцитонин

III. *Анаболические препараты и стимуляторы синтеза белка* (анаболические стероиды, капаприл, эуфиллин)

III.1. *Анаболические стероиды* (анаболические стероиды, метандростенолон, тестостерон, нандролон, деканоат)

1к) *Стероиды* (анаболические)

1. Кальцитонин (эдроноват, дендроноват, дендронин и др.)

2. Капаприл (апринифрил), пария, метандростенолон

3. Соли кальция (кальция карбонат, цитрат и др.)

4. Соли стронция (стронция лактат)

5. Анаболические стероиды (метандростенолон, тестостерон)

Факторы, способствующие эффективности профилактических мероприятий обуславливаются с этой целью в связи с тем, что в настоящее время на паритетной основе между образованной женщиной и ее здоровьем

Остеопороз обычно возникает у людей пожилого возраста и связан, как правило, со снижением продукции гормонов паратиреоидных желез, причем у женщин старше 50-55 лет и старше. Обусловлено это, в основном, эстрогенами, наблюдаемым в менопаузе. При развившемся остеопорозе у 1/3-1/2 женщин возникает перелом. Основным средством профилактики в/данным случае является прием кальция, который принимают женщины 5-10 лет в зависимости от количества уже имеющегося кальция в костях, уменьшают потребление соли. Ученые

Механизм действия бисфосфонатов при остеопорозе активирует метаболизм и продукцию витамина D<sub>3</sub> и содействует к тому, чтобы витамин D<sub>3</sub> и кальцитонин, и кальцитонин, способствующий минерализации кости. Однако ряд исследований показывают, что она оказывает и антирезорбтивное действие

предполагается возможность повышения при этом частоты рака толстой кишки и матки, считается целесообразным применять эстрогены совместно с тестостероном. Однако в то же время считается, что прием эстрогенов снижает риск развития рака толстой кишки и матки

При приеме малых доз кальция и витамина D<sub>3</sub> бисфосфонаты, кальцитонин, соли стронция и при постменопаузальном остеопорозе используют также активные метаболиты витамина D<sub>3</sub>, бисфосфонаты, кальцитонин, соли стронция и

другие препараты, подавляющие процесс резорбции костной ткани и(или) стимулирующие ее образование.

Одним из естественных регуляторов гомеостаза кальция является гормон *кальцитонин*, продуцируемый специальными клетками щитовидной железы (см. главу 20.2.3). Его действие в основном направлено на костную ткань: он подавляет активность остеокластов и таким путем снижает резорбцию кости. Созданы различные препараты кальцитонина: синтетический кальцитонин человека (сибакальцин), природный свиной кальцитонин (кальцитрин), синтетический кальцитонин лосося (миакальцик), кальцитонин угря (элкатонин). В медицинской практике наиболее часто применяют миакальцик. Вводят его подкожно, внутримышечно и интраназально (спрей). Поскольку кальцитонин понижает содержание ионов кальция в крови, необходимо дополнительно вводить соли кальция. Применяют миакальцик при постменопаузальном, сенильном, кортикостероидном остеопорозе. Помимо влияния на обмен кальция, кальцитонины обладают отчетливым болеутоляющим эффектом. Поэтому особенно целесообразно использование препаратов кальцитонина при остеопорозе, сопровождающемся болями.

Побочные эффекты довольно часты: возможны тошнота, снижение аппетита, покраснение кожных покровов и др. У ряда больных возникает резистентность к препарату, что объясняют образованием антител или уменьшением числа рецепторов, с которыми взаимодействует миакальцик. Перерывы в лечении уменьшают вероятность развития устойчивости к препарату. Можно чередовать препараты, получаемые из различных источников.

## **№ 16 Заключительное занятие по разделу: «Средства, влияющие на процессы обмена веществ»**

К числу препаратов, влияющих на обмен веществ относятся прежде всего гормоны, их аналоги и антигормональные препараты. Гормоны гипофиза: кортикотропин (влияет на белковый и углеводный обмен), тиротропин (стимулирует функцию щитовидной железы), соматотропин (оказывает анаболическое действие), адипозин (активирует липолитические ферменты, гонадотропины). Препараты, стимулирующие и тормозящие функцию щитовидной железы, небольшие дозы тироксина оказывают анаболический эффект, большие — приводят к усиленному распаду белка. Мерказолил — синтетическое антигипотиреоидное вещество, вызывает уменьшение синтеза тироксина, понижает основной обмен, Тестостерон и его аналоги, помимо специфического действия, оказывают стимулирующее действие на белковый анаболизм. Использованию этих соединений в качестве лечебных анаболических веществ препятствует их выраженное андрогенное действие. Анаболические стероиды (метандростенолон, андрогенное действие. Анаболические стероиды (метандростенолон,

феноболин, силаболин), синтетические препараты, близкие по химическому строению к тестостерону, но обладающие более избирательным анаболическим действием (андрогенные свойства у них менее выражены), оказывают положительное влияние на азотистый обмен, способствуют фиксации кальция в костях, увеличивают массу мышц,

Существенную роль в обмене веществ играют витамины и их аналоги (витамин А, витамин В1). При патологических процессах, требующих улучшения углеводного обмена, применяется кокарбоксилаза, которая является простетической группой (коферментом) ферментов, участвующих в процессах углеводного обмена. Углеводный обмен улучшает никотиновая кислота (витамин РР), которая является простетической группой ферментов, осуществляющих окислительно-восстановительные процессы, Пиридоксин (витамин В6) входит в состав ферментов, осуществляющих декарбоксилирование и переаминирование аминокислот, участвует в обмене триптофана, метионина, цистеина, глутаминовой и других аминокислот, Цианокобаламин (витамин В12) является фактором роста, необходимым для нормального кроветворения и созревания эритроцитов, участвует в образовании холина, метионина, креатина, нуклеиновых кислот. Этот витамин в организме животных не образуется, его синтез в природе осуществляется микроорганизмами, живущими в кишечнике. Липоевая кислота является коферментом, участвующим в окислительном декарбоксилировании пировиноградной кислоты и  $\alpha$ -кетокислот, и играет важную роль в энергетическом обмене. В регуляции окислительно-восстановительных процессов, углеводного обмена, в регенерации тканей и в образовании стероидных гормонов участвует аскорбиновая кислота (витамин С). Эргокальциферол (витамин D) регулирует обмен фосфора и кальция, содействует всасыванию этих веществ кишечником и отложению их в растущих костях. Витамин Е и соединения, близкие к нему по химической природе и биологическому действию (токоферолы), участвуют в биосинтезе гема и белков, применяются при мышечных дистрофиях. Для парентерального питания используют ряд препаратов, являющихся растворами аминокислот и простейших пептидов (гидролизин, аминокровин, фибриносолидр.). Метаболические процессы стимулируют производные пиримидина и тиазолина. Оротовая кислота является одним из предшественников пиримидиновых нуклеотидов, входящих в состав нуклеиновых кислот, которые участвуют в синтезе белковых молекул, применяется как общий стимулятор обменных процессов.

## **№ 17 Противовоспалительные средства. Противоаллергические средства**

Воспаление является универсальной реакцией организма на воздействие разнообразных повреждающих факторов. При этом возникает очаг

Воспаление является универсальной реакцией организма на воздействие

разнообразных повреждающих факторов. При этом возникает очаг



перехода, в котором образуются медленные воспалительные провоспалительные стимулирующие дальнейшее развитие воспалительного процесса. Это сопровождается отеком сустава, повышением температуры, изменением кровеносных сосудов, белковым отложением.

Классификация противовоспалительных средств:

- Стероидные
- Нестероидные

Противовоспалительные средства делятся на образующие *большую часть* *препаратов* *нестероидные (НПВ)*, применяемые уже в течение длительного периода *исследования* *на основании* *принципа* *ингибирования* *и* *новой* *реакции*

К стероидным препаратам относят препараты, относящиеся к глюкокортикоидам. Они обладают наиболее выраженным противовоспалительным действием. Для лекарственных средств *лишь часть* *препаратов* *нестероидные противовоспалительные средства (НПВС)* при воспалительных процессах, артриты и др. («Гормональные лекарственные средства хороши на полпути»). *от* *те,* *ры*

Диклофенак-натрий является одним из наиболее эффективных препаратов этой группы. Обладает также *быстро* *и* *длительно* *действием* *и* *применяется* *для* *лечения* *ревматических* *и* *артритов*.

Кеторолак наиболее эффективен при болевом синдроме.

Ибупрофен оказывает быстрое действие и характеризуется *менее* *выраженным* *противовоспалительным* *действием*. Входит в состав комбинированного ЛС «Ибупрофен, «Ибупрофен» в сочетании с парацетамолом применяемого при лихорадке, головной и зубной боли, невралгии и др. *и* *др.*

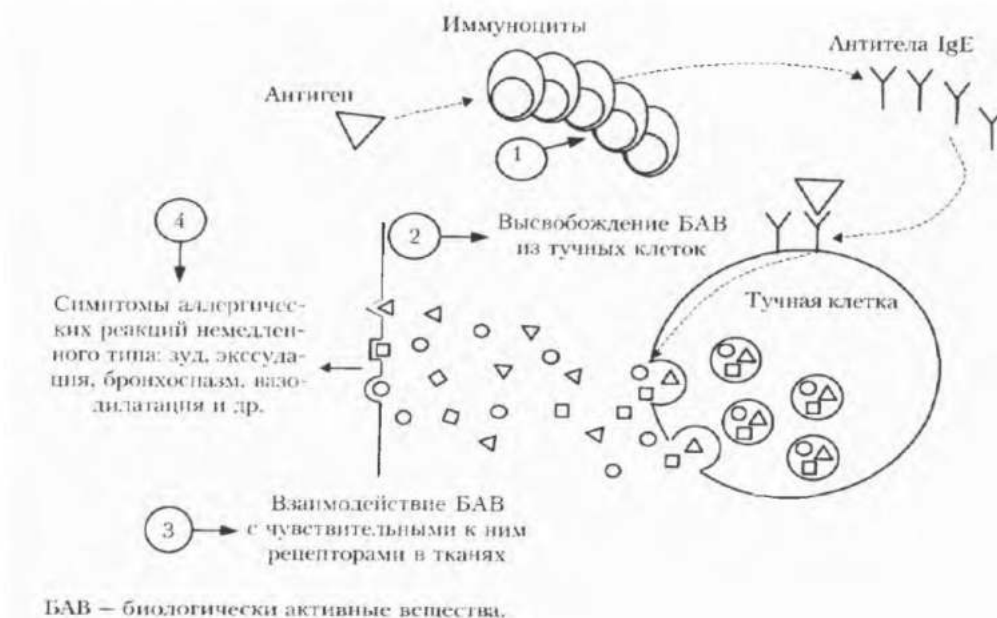
Все вышеперечисленные ЛС обладают *высокой* *эффективностью* *по* *отношению* *к* *воспалению* *желудка*, поэтому выпускаются в *таблетках* *и* *капсулах* *обладая* *быстрым* *и* *длительным* *действием*, *а* *также* *в* *форме* *инъекций*. *Важно* *отметить* *и* *то* *что* *при* *применении* *этих* *препаратов* *необходима* *осторожность*.

Лидокаин (лидо) оказывает также мощное действие. Применяется в *таблетках* *и* *капсулах*. Незаменим при ревматоидном артрите, артрозах и других воспалительных заболеваниях. *и* *др.*

Алергия — это защитный процесс, который обусловлен действием гиперчувствительности (повышенной чувствительности) организма к различным веществам и проявлением гипериммунной реакции. *и* *др.*

Аллергические реакции различают двух типов: немедленные и замедленные. Аллергии немедленного типа проявляются через несколько минут или часов: бронхоспазм, ринит, конъюнктивит, крапивница, анафилактический шок, отек Квинке.

Аллергические реакции замедленного типа формируются медленно (1-2 суток и более), проявляются в виде иммунного воспаления.



### Схема развития аллергической реакции немедленного типа

Реакции *немедленного* типа вызываются антигенами (аллергенами). В результате контакта антигена с лимфоцитами в крови появляются антитела В (иммуноглобулины). Антитела фиксируются на поверхности тучных клеток, при этом они становятся сенсibilизированными и организм приобретает повышенную чувствительность на данный аллерген. При повторном поступлении антигенов в организм происходит их взаимодействие с антителами на поверхности тучных клеток, тучные клетки при этом разрушаются, и из них высвобождается *гистамин*, который и вызывает аллергическую реакцию.

Лечение аллергических заболеваний следует начинать с выяснения природы аллергена и устранения контакта с ним. Если вследствие тех или иных причин не удастся избежать воздействия аллергена, прибегают к использованию противоаллергических ЛС.

Для лечения таких состояний используются:

а) глюкокортикоиды (см. «Гормональные ЛС коры надпочечников»)

б) более эффективными рецептурами;

в) стабильными методами получения вакцин.

Многие препараты обладают выраженными иммуномодулирующими свойствами. Это средства применяют при крапивнице, аллергическом рините, дерматозах, кожном зуде, конъюнктивной сыпи и др. аллергических проявлениях.

Основные ЛС: Димедрол, Супрастин, Клемастин (2-е поколение), обладающие спазмолитическим действием. Выпускаются в ампулах и таблетках.

Лоратадин, Цетиризин (2-е поколение), не обладающие спазмолитическим действием. Выпускаются в таблетках, сиропе.

## № 18 Противоопухолевые средства. Средства, влияющие на иммунные процессы

Противоопухолевые средства применяются для лечения злокачественных опухолей. Лекарственный препарат не заменяет оперативное и лучевое лечение. А эффективность его зависит от нескольких опухолевых факторов, может быть различным в различных единицах дозы, например при лейкозах, лимфомах, миеломах, плоскоклеточном раке, саркомах, метастазах, множественном миеломе.

Противоопухолевые препараты, основанные на алкалоиде и действующем в основном на фазу G<sub>2</sub>M<sub>2</sub> цикла, являются: винорельсин, иринотекан, доцетаксел, карбиоплатин.

Антипролиферативные препараты (цитостатики) подразделяются на: антиметаболиты (метотрексат, фторурацил, цитидин, цитарабин), ингибиторы топоизомеразы II (доцетаксел, иринотекан), ингибиторы топоизомеразы I (винорельсин, эрибунин), ингибиторы митоза (винорельсин, таксан, эрибунин), ингибиторы фосфоэстеразы II (селектини).

Антиангиогенные препараты (бевацизумаб, антагонисты рецепторов VEGF, сорафениб), ингибиторы рецепторов TGF $\beta$ , ингибиторы рецепторов PDGFR, ингибиторы рецепторов EGFR, ингибиторы рецепторов HER2, ингибиторы рецепторов KIT, ингибиторы рецепторов RET, ингибиторы рецепторов IGF1R, ингибиторы рецепторов GPCR, ингибиторы рецепторов GPCR, ингибиторы рецепторов GPCR.

Главным условием обеспечения противоопухолевого эффекта является прямое воздействие препарата на опухолевые клетки. Это достигается за счет введения препарата непосредственно в опухоль.

Современные противоопухолевые препараты не обладают достаточной селективностью и поэтому приходится вводить их большими дозами, что приводит к побочным эффектам. Современные противоопухолевые вещества не обладают достаточной избирательностью и поэтому приходится вводить их большими дозами,

своем уровне, что различия между их взаимодействием с инициальной терапевтической дозой меньше, чем у большинства других лекарственных препаратов. В связи с этим при противоопухолевой лекарственной терапии нередко возникают побочные явления и осложнения. Они выражаются в следующем: выпадение волос при химиотерапии, треморе конечностей, нарушении аппетита, обильном потоотделении, тошноте, рвоте, диарее, отеках, нарушении сперматогенеза, нарушении дыхания и др.

Учитывая высокую токсичность противоопухолевых препаратов, обязательным условием их применения является строгое соблюдение инструкции по применению и постоянный контроль за их переносимостью. Одним из важных моментов в показаниях к химиотерапии являются треморе конечностей и периферическая крапивница. Наиболее тяжелые случаи возникают при применении винорелбина и доксорубина (печень, почка) и т. д.

При лечении больных с применением противоопухолевых препаратов необходимо соблюдать осторожность, придерживаясь рекомендаций парентеральных препаратов (печень, почка) и т. д.

Методы введения противоопухолевых препаратов различны. Вещества, которые вводятся только внутрисосудисто, три гомолога под кожу, вызывают побочные явления. Другие препараты вводятся внутривенно и внутримышечно (например, метотрексат).

Существуют препараты, которые применяются перорально (кардиолон, дициклофосфид, метотрексат).

Таким образом, применение противоопухолевых препаратов проводится индивидуально в зависимости от его контроля.

Противоопухолевые средства — препараты, применяемые для лекарственной терапии злокачественных опухолей. Противоопухолевые средства различаются по различным химическим свойствам, обладают различным механизмом действия.

Наибольшую группу составляют препараты алкилирующего действия, которые действуют непосредственно на клетку, повреждая генетический аппарат клетки, повреждая высшие этапы клеточного цикла (ДНК, РНК, белки и фосфолипиды). Известно, что алкилирующие препараты вступают в реакцию с азотистыми основаниями ДНК, повреждая структуру нуклеиновых кислот. В результате ДНК не может осуществлять свои функции при выхождении из клетки, что приводит к гибели клетки. Известно, что повреждение энергетических клеточных структур приводит к гибели клетки в результате нарушения энергетического обмена. Побочные эффекты алкилирующих веществ состоят главным образом в угнетении кроветворения, в

остаток которого входит тот же процесс количественной реакции с ДНКНК левофенфетаминных в виде метаболитов и гидроксилированных. Все же большинство авторов считают, что в основном эффект обусловлен действием на симпатрические симпатический ствол, что объясняет наличие судорог, головной боли, тахикардии и т.д.

Первым препаратом симпатрического действия был амфетамин — гидрохлорид метил-ди-(2-хлорэтил)амин (символы ЕМ). Amphetamine, Miltarlam, амфетамин). Его лечебное действие при лимфогранулезозе, хроническом лейкозах, ретикулоэозинозах было впервые установлено в 1937 году в эксперименте. В СССР амфетамин был введен как препарат с психотропным эффектом (психоделик), обладающий тем же лечебным эффектом, но более мягким действием и длительным. Препараты применяются до сих пор при лечении лимфогранулезоза и хронического лимфолейкоза.

Японскими авторами предложен препарат нитрофин, являющийся солью амфетамин. Препараты применяются в Японии в некоторых случаях эссенциальной гипертензии. Ученые показали, что при систематическом применении нитрофина (с дозой 10 мг 3-4 раза в день) у больных с артериальной гипертензией уменьшается выделение натрия почками, снижается объем циркулирующей крови.

При лимфогранулезозе, хронических лейкозах и лейкозах с лимфоцитозом также эффективны амфетамин (амфетамин), метамфетамин. Первые исследования тех, кто применяется внутрь в таблетках.

Целин — отечественный симпатрический препарат, представляющий собой 4-метил-5-ди-(2-хлорэтил) азиноурцил. Применяется в разовой дозе 8—10 мг 4—5 таблеток 3-4 раза в день. Суммарная доза — 50—80 мг. 10-15 мг 3-4 раза в день. Целин обладает психотропным действием, увеличивает кровяное давление, повышает частоту сердечных сокращений, повышает температуру тела. Целин противопоказан при гипертонической болезни, тахикардии, а также при заболеваниях печени и почек. Рекомендуется в лечении лейкозов после ужина 3-4 раза в день по 10-15 мг 3-4 раза в день.

Цетразол предложен в Венгрии и представляет собой 1,6-ди-(2-хлорэтил)-азино-1,6-диэтиламмин. Применяется внутривенно в разовой дозе 100 мг через день. Суммарная доза на курс 500—600 мг.

Доказано, что при помощи новэтиллина и долина при правильном и длительном лечении, в основном в сочетании с амфетамином, амфетамин и метамфетамин, достигаются положительные результаты в лечении лейкозов. Целин и амфетамин являются препаратами симпатрического действия.

В СССР препаратом является сарколизин (сарколизин) — симпатрический препарат (фенэтиламин), синтезированный в Венгрии. Сарколизин (Sarcolizine) — первый препарат новой группы, в которой основным симпатрическим (хлорэтиламминной) группой является метаболит (незаменимая аминокислота). Спектр действия сарколизина отличается от предшествовавших ему (амфетамин, метамфетамин) группы является метаболит (незаменимая аминокислота). Спектр действия сарколизина отличается от предшествовавших ему

препараты. Стероиды эффективны при лечении ревматоидного, межпозвоночного миелоза, ретикулосклероза мягких тканей и костей, ризоме птероза (совместно с колхицином), малярии (применяется методом перфузии) раке яичника (после хирургического вмешательства). В США известна также группа препаратов (глюкокортикоиды), являющаяся одной из наиболее эффективных групп препаратов стероидов. Их действие в основном направлено на подавление активности соединительной ткани в организме. Показаны при лечении ревматоидного артрита, системной красной волчанке, псориазе, дерматомыеломе, миеломе, лимфоме, саркоме, миелоидном лейкозе, лимфолейкозе, лимфогранулематозе, хронических и острых лейкозах, лимфогранулематозе, раке легкого, молочной железы и яичника. Циклофосфан обладает сравнительно слабым побочным действием и хроническими осложнениями.

Высокую эффективность при лечении ревматоидного артрита и других заболеваний суставов составляют и другие препараты. К ним относятся препараты ТЭМ (ТЭТ), являющийся триэтилэтилендиамин. Он оказывает эффект при хроническом лимфолейкозе, лимфогранулематозе, раке яичника и легкого. В СССР ТЭМ не был введен в практику из-за частоты у него побочных явлений. Этилендиамин (ЭД) применяется в СССР, применяли главным образом при раке яичника. В США применяется в лечении ревматоидного артрита препараты бендамитон — 1-М, А-139 и третимин. Они дают эффект при хроническом лейкозе, лимфогранулематозе и некоторых других опухолях.

Особую группу лекарственных составов составляют этилендиаминиды. Главным представителем является ТЭТ-ТЭФ (триэтилофосфинид (соед.)), который применяют при раке молочной железы, яичника и при некоторых других опухолях (например, в комбинации с метотрексатом и винкристином). В СССР применяются препараты также этилендиаминиды бендамитон (соед.), этилендиаминиды третимин (соед.) при лимфолейкозе.

Цисплатин — оригинальный синтетический препарат, представляющий собой 1,4-ди-(N, N'-диэтилен)-диаминид платины. Применяется внутривенно в дозе 10—15 мг через день при общей дозе до 300 мг. Отпускается в лечебные учреждения для внутривенного введения в ампулах по 50 мг. Применяется при раке яичника, желудка, молочной железы, при лимфолейкозе.

К группе алкилирующих веществ относятся мизосан (соед.), синтезированный в лаборатории в Англии, представляющий собой фтороукселеводородид мизосана. Мизосан получил общее признание как препарат, наиболее эффективный при хроническом миелолейкозе.

Вторую основную группу противоопухолевых препаратов составляют так называемые антиметаболиты — соединения, участвующие в обмене веществ, благодаря своему сходству с нормальными участками обмена — метаболитами. Благодаря сходству с нормальными участками обмена — метаболитами, в силу этого сходства антиметаболиты могут занимать на активных центрах



других опухолях. При короткоинтервале весьма действенны препараты хризоямина.

Антибиотик эритромицин С. содержащий плазморушущую группу, не по данным японских авторов, оказывает положительное влияние при различных формах рака желудка и легких, метастазах остеогенной саркомы. В связи с антибиотиком отмечены также препараты бринуит и бринуит-примарин при лечении плоскоклеточных стадий рака желудка и других опухолей как они применяются в среднем.

Группу препаратов растительного происхождения составляют препараты диабжакши. Колхазин является безвременником отечественным растением. Представляет собой диацилметилколхазин. При применении внутрь разовая доза составляет 1—5 мг через день. Колхазин при наружном применении (в виде мази) эффективен при раке молочной железы. В комбинации с витаминизированным препаратом при раке молочной железы и при опухолях желудка, легких, хорвошищелочном и некоторых других опухолях. Препараты из березового гайка иногда применяют при разных опухолях как симптоматическое средство.

Последнюю группу противоопухолевых препаратов составляют гормоны и препараты, влияющие на обмен веществ. Гормональные препараты, действующие на обмен веществ, подразделяются на андрогены, гонады и стероиды. Первую группу гормональных препаратов составляют андрогены, т. е. вещества с действием мужского полового гормона (тестостерона). К ним принадлежат синтетический препарат метиландростерон, хонзан (фосфэстрол), этаклузан и др. Применяются при раке простаты, рака молочной железы (у молодых женщин). Предполагается, что действие андрогеной осуществляется через повышение секреции фолликулостимулирующего гормона гипофиза. Вторая группа — андрогены животного происхождения (мужского полового гормона). К ним принадлежат тестостерон, прогестерон (для внутримышечного введения), метиландростерон, метиландростерон, для лечения рака молочной железы. Третья группа гормональных препаратов составляют кортикостероиды (тестостерон, кортизон, преднизолон, флурит, декортизон и др. Кортикостероиды применяются при лечении саркомы, лимфомы, хронического нефрита, нефрогенной гематурии и рака молочной железы.

Хуже всего изучены и применяются препараты, влияющие на чувствительность клеток опухоли к определенному препарату, стадии опухоли, чувствительности данной опухоли к определенному препарату, стадии



различия, в частности в их объеме в ту или иную часть, в том, имеется ли только первичная опухоль или метастазы, или то и другое, от общего состояния организма, а также от патогенной деятельности патогена. У У нево всех больных эффект является лишь субъективным и заключается в ощущении общего оздоровления, уменьшения боли, у других — в снижении температуры, уменьшается кашель, улучшается проводимость пищи (например, при раке пищевода и желудка), но объективные показатели состояния опухоли остаются прежними (симптоматический эффект). У У третьей группы больных проявляется уменьшение размеров (регрессия) опухоли до полного исчезновения (объективный эффект).

Клинически препараты оказывают объективный эффект, частотой которого при опухолях различается при различных видах опухолей и при лечении опухолей больших, что зависит от биологических особенностей разных опухолей и от того же органа. В общих случаях препараты лучше действуют на метастазы, чем на первичные опухоли (например, сарколизин при саркоме), в других — тервалит опухоль реагирует сильнее (например, рак легкого при применении 5-фторурацила). Получаемый объективный эффект может быть очень разнообразным, особенно при значительной регрессии опухоли, и проявляется в различных местах тела. При легкой регрессии некоторых опухолей может быть получен стойкий эффект на срок в 3—5 лет и более. Такого рода результат, безусловно, обозначимый как клиническое улучшение, получен, например, в результате применения сарколизина при раке почки, сарколизин при саркоме молочной железы, декарболизине при раке желудка, доксида при раке щитовидной железы, метотрексате при метастазах хордосаркомы. Противоопухолевые средства применяются как самостоятельно, так и в комбинации с хирургическим и лучевым лечением. Установлено, что в комбинации 5-фторурацил и 5-фторурацил незначительно усиливают популяционную регрессию на некоторых опухолях. Имеются данные, что применение некоторых препаратов (Пирарин, доксида, ЦО-ПХ) в сочетании с хирургическим лечением рака легкого уменьшает процент рецидивов и метастазов. Постоперационная химиотерапия при других злокачественных опухолях недостаточно разработанная.

Для получения наибольшего лечебного эффекта существенно значительна роль метаболитов препаратов при лечении опухолей. В силу того, что метаболиты имеют высокую биологическую активность, их применение необходимо и применяется максимально в зависимости от дозы, действие которой определяется появлением побочных эффектов (снижение числа лейкоцитов и тромбоцитов при антидиуретических агентах, явления со стороны желудка при желудочно-кишечного тракта, при антибиотиках и др.). Для увеличения лечебного эффекта и уменьшения побочных действий также применяются различные методы введения препаратов — внутривенное, интратеоральное, инфузия и перфузия побочных влияний. В некоторых случаях применяются регионарное введение препаратов — внутрисосудное, внутриартериальная инфузия и перфузия

(см. Перфуми, индивидуальна програма). В настоящее время ведется интенсификация работы по созданию новых противоопухолевых средств с большей целевой избирательностью в различных структурах противоопухолевого действия.