Лекция №1: Предмет и задачи фармакологии. Лекарственные вещества. Дозы. Фармакопея.

Фармакология – наука о взаимодействии лекарств с организмом и о путях изыскания новых лекарственных средств. Фармакология оказывает большое влияние на развитие теоретических медико-биологических и клинических дисциплин. Появление анестетиков, средств для наркоза, ганглиоблокаторов способствовало успеху хирургии. Синтез гормональных средствсущественно изменил результаты лечения больных с эндокринными заболеваниями. После создания иммунодепрессивных средств удалось осуществить пересадку органов. Прогресс в фармакологии привёл к тому, что выделились ряд научных дисциплин:

1) Фармакодинамика – изучает специфическое действие лекарств на организм, механизмы и особенности этого действия.
2) Фармакокинетика– изучает процессы всасывания лекарств в кровь, их распределение, превращение, длительность пребывания в организме и пути выведения из организма.
3) Фармакотерапия – изучает лечебные качества лекарств при различных заболеваниях, определяет дозы и схемы их применения.
4) Фармакопрофилактика – занимается вопросами предупреждения болезней с помощью лекарственных средств.
5) Лекарственная токсикология – изучает токсическое действие лекарств на организм, разрабатывает методы предупреждения и лечения отравлений лекарственными веществами.

Основные этапы развития фармакологии связаны со сменой общественно-экономических формаций.

- Во времена первобытно-общинного строя в качестве лекарств использовали главным образом растения. Этот период называется эмпирическим.
- При рабовладельческом строе врачевание становится привилегией служителей религии. Этот период называется эмпирико-мистический.
- При феодальном строе медицина перешла в руки монахов, проповедовавших религиозно-идеалистическую философию средневековья. Действия лекарств связывали с определённым положением луны, созвездий, планет. Этот период называлирелигиозно-схоластическим.
- Фармакология как наука начала развиваться при капиталистическом строе в конце XVIII начале XIX века. Это проявилось в том, что для

анализа действия лекарственных средств стали использовать экспериментальные методы.

В допетровской Руси лекарства были главным образов в руках лекарей и знахарей. При Петре I в 1701 году специальным указом были открыты 8 аптек, вне которых торговать лекарствами было запрещено. Первые руководства по лекарствоведению были написаны в России Н.М.Максимович–Амбодиком и А.П.Нелюбиным в конце XVIII века. Значительное влияние на развитие отечественной фармакологии оказал И.П.Павлов. Он начал свою деятельность в области фармакологии в клинике С.П.Боткина, где руководил экспериментальной лабораторией в течение 11 лет. Под его руководством были исследованы сердечные гликозиды, жаропонижающие средства и другие соединения. В течение 5 лет И.П.Павлов заведовал кафедрой фармакологии Военно-медицинской академии и создал крупную школу отечественных фармакологов. Вскоре после И.П.Павлова эту же кафедру возглавил Н.П.Кравков и руководил ею 25 лет. Большое внимание Н.П.Кравков уделял проблемам общей фармакологии (выяснению зависимости биологического эффекта от дозы и концентрации веществ; комбинированному действию фармакологических средств и др.)

Многие исследования были посвящены фармакологии сердечно-сосудистой системы, эндокринных желез, обмена веществ. Н.П.Кравков написал двухтомное руководство «Основы фармакологии», по которому училось несколько поколений медицинских работников. Большой вклад в дальнейшее развитие отечественной фармакологии внесли многие учёные и последователи Н.П.Кравкова: М.П.Николаев, С.В.Аничков, А.И.Черкес, М.Д.Машковский, Д.А.Харкевич и др.

Основные источники получения лекарственных веществ:

1) химический синтез препаратов;
2) получение препаратов из лекарственного сырья животного и растительного происхождения, из минералов;
3) Выделение лекарственных веществ, являющихся продуктами жизнедеятельности грибов и микроорганизмов;

Пути изыскания лекарственных средств:

Первый этап:

1) Синтез новых соединений;
2) Химическая модификация соединений;

3) Эмпирический путь (Напиример, снижение уровня сахара в крови приприменение сульфаниламидов привело к синтезу их производных с выраженными гипогликемическими свойствами;
4) Скрининг – разновидности эмпирического поиска – любые химические соединения, которые могут быть предназначены и для немедицинских целей, проверяют на биологическую активность с использованием разнообразных методик;

Когда ценность нового вещества становится очевидной, результаты экспериментального исследования представляют в фармакологический комитет министерства здравоохранения РФ.

Второй этап –это клиническое исследование препарата. Оно проводится на добровольцах. Новое лекарственное средство должно отличаться от имеющихся препаратов той же группы в лучшую сторону. Так же, новый лекарственный препарат сравнивают с индифферентным веществом, которое по форме напоминает новый препарат – плацебо э(пустышка). Больные не знают, что им назначено, а в некоторых случаях не знает даже лечащий врач. Секрет хранится у заведующего отделением или у врача, ответственного за исследование.

Лекарственное средство – это одно или несколько лекарственных веществ, используемых в медицине.

Лекарственное вещество – это индивидуальное химическое соединение, используемое в качестве лекарственного средства.

Лекарственный препарат - это лекарственное средство, приготовленное в виде определённой лекарственной формы.

Лекарственная форма – это наиболее удобная для применения и хранения форма лекарственного препарата. Различают твёрдые, жидкие и мягкие лекарственные формы.

Фармакокинетика

Всасывание лекарственных веществ происходит несколькими путями:

1. Пассивная диффузия веществ –проникновение веществ через мембрану, возможна в обоих направлениях, т.е. как внутрь клетки, так и из нее и направлена в сторону меньшей концентрации вещества. Через мембрану путём пассивной диффузии проникают липофильные неполярные вещества, т.е. вещества, хорошо растворимые в липидах и не несущие электрических зарядов.

2. Фильтрация лекарственных веществ – происходит в основном через межклеточные промежутки, через которые проходит вода и растворённые в ней вещества. Путём фильтрации проходят гидрофильные полярные вещества. Они также идут в ткани и из тканей в обоих направлениях в сторону меньшей концентрации вещества.
3. Активный транспорт вещества – лекарственные вещества проникают через биологические мембраны с помощью молекул-носителей.
4. Пиноцитоз – захват крупных молекул лекарственных веществ клеточной мембраной и образование вакуоли (пузырька), содержащего захваченное вещество.

Пути введения лекарственных средств:

1) Энтеральные (через пищеварительный тракт)
2) Парэнтеральные (минуя пищеварительный тракт)

Энтеральные пути введения:

Пероральный путь введения (peros – через рот) –не требует стерилизации препарата, не требует специальных инструментов. Можно вводить твердые и жидкие лекарственные формы. При этом их действие развивается только через определенный промежуток времени (30 мин). Препарат может разрушаться в содержимом желудка и кишечника, может частично инактивироваться в печени,

Сублингвальный путь – препарат помещают под язык, всасывание его происходит быстро, лекарство не подвергается воздействию пищевых ферментов и соляной кислоты. Вещество попадает в общий кровоток через верхнюю полую вену, минуя печеночный барьер.

Ректальный путь введения - в прямую кишку лекарственные препараты вводятся в форме суппозиториев или микроклизм объемом до 100 мл. Из прямой кишки лекарство быстро всасывается в кровь и попадает в общий кровоток через систему полой вены, минуя печень.

Сила действия препаратов при ректальном введении выше, чем при приеме внутрь.

Парэнтеральные пути введения:

Включают в себя инъекцию лекарства под кожу, в мышцы, в вену, в полости организма(брюшину, плевральную, в сумки суставов, под оболочки спинного мозга – субарахноидальный), ингаляционный способ (путем вдыхания лекарственного вещества), накожный способ (втирание мазей, введение

лекарственного вещества при помощи электрофореза), перидурально. Внутриартериальное введение используют при лечении сосудистых и некоторых онкологических заболеваниях. Иногда вводят R-контрастные вещества. Внутрикостное введение используют, когда затруднено введение лекарств другими путями.

При парентеральных путях введения лекарства по сравнению с энтеральными эффект развивается более быстро, особенно при внутривенном и внутриартериальном введении.

При внутривенном введении вещество сразу попадает в кровь, действие наступает через 1-2 минуты. Чтобы не создавать слишком высокую концентрацию вещества в крови, его разводят на изотоническом растворе (9мг/мл) натрия хлорида, изотоническом растворе (50мг/мл) глюкозы или в воде для инъекций. В вену нельзя вводить масляные растворы и взвеси (суспензии) в связи с опасностью закупорки сосудов (эмболии). Иногда внутривенно можно вводить небольшие количества гипертонических растворов. Внутримышечно можно вводить липофильные неполярные и гидрофильные полярные соединения. Внутримышечно нельзя вводить гипертонические растворы и раздражающие вещества, но можно вводить масляные растворы и взвеси (суспензии). Из мышцы лекарственное вещество может длительно всасываться в кровь. При подкожном введении лекарственные вещества всасываются ещё медленнее. Масляные растворы при подкожном введении могут образовывать инфильтраты.

Условия всасывания препаратов:

1. Быстрее всасываются легкорастворимые (водные растворы), а масляные и мелкоизмельченные препараты всасываются медленнее;
2. Способ введения;
3. Комбинация лекарственных веществ, которая может усиливать или ослаблять действие лекарственных препаратов (например парааминосалициловая кислота уменьшает всасывание рифампицина);
4. Заболевания ЖКТ (гастриты, колиты, язвенная болезнь желудка и т.д.), при которых меняется характер перистальтики, pHсодержимого, микробная флора и активность ферментов желудка и кишечника;

Распределение в организме:

На распределение лекарственных веществ в организме влияют биологические барьеры: стенка капилляра, клеточная мембрана, гематоэнцефалический барьер, гематоофтальмический барьер, плацентарный барьер. Гематоэнцефалический барьер препятствует

проникновению гидрофильных полярных веществ из крови в ткани мозга. Гематоофтальмический барьер препятствует проникновению гидрофильных полярных веществ из крови в ткани глаз. Плацентарный барьер во время беременности препятствует проникновению ряда веществ из организма матери в организм плода.

После всасывания или непосредственного введения в кровоток лекарственного вещества начинается его распределение в организме. Лекарственное вещество может распределяться в организме равномерно или избирательно депонироваться (накапливаться) в том или ином органе или ткани (йод депонируется в щитовидной железе, сердечные гликозиды – в сердечной мышце). Многие вещества депонируются в крови, связываясь с белками плазмы. Часть веществ, высвобождающаяся из связи с белками, оказывает фармакологическое действие.

Биотрансформация – это различные изменения и превращения лекарственного вещества в организме.

Различают:

1) Метаболическую трансформацию, которая идёт за счёт окисления, восстановления или гидролиза лекарственных веществ;
2) Конъюгацию– когда к лекарственному веществу присоединяются некоторые химические группировки или молекулы биогенных соединений. Главную роль в конъюгации играет печень, т.к. биогенные соединения образуются в ней;
   При патологии печени действие лекарственного вещества увеличивается, возможно отравление организма, ацетилирование;

Выведение из организма лекарств и продуктових превращения происходит различными путями: через ЖКТ, лёгкие, кожу, молочные и другие железы. Основным путём выведения являются почки. Если применить мочегонные средства, то можно ускорить выведение лекарственных веществ из организма. Заболевания почек может привести к задержке лекарств в организме. Это приводит к более сильному и длительному эффекту вплоть до отравления. Некоторые лекарственные вещества, которые плохо всасываются в ЖКТ, выводятся с калом. Слизистой оболочкой желудка может выделяться морфин, принятый парэнтерально (внутривенно). Поэтому при отравление морфином необходимо промывание желудка. Лёгкими выделяются летучие вещества (эфир, фторотан, этиловый спирт). Во время лактации возможно выделение лекарственных веществ молочными железами и их поступление с молоком матери в организм ребёнка.

В фармакокинетике существует понятие ***период полувыведения***.

Период полувыведения (Т1/2) – время, необходимое для уменьшения вдвое концентрации ЛВ в крови.

Зоны клеток, с которыми связываются лекарственные вещества, называются клеточными рецепторами. Рецепторы, чувствительные к ацетилхолину, называются холинорецепторами; которые чувствительны к адреналину и норадреналину – адренорецепторы; к гистамину – гистаминовые рецепторы; к серотонину – серотониновые рецепторы.

Лекарственные средства делятся на 2 группы:

1) Средства, возбуждающие рецепторы (миметики);
2) Средства, блокирующие рецепторы (блокаторы или литики);

В нервной системе содержатся синапсы, где происходит передача импульса с одной нервной клетки на другую.

Или с нервных волокон на клетку

Лекарственные вещества действуют на синапсы, способствуют передаче импульсов или тормозя проведение импульсов.

Различают клеточные рецепторы:

1) Мембранные
2) Рецепторы цитоплазмы
3) Внутриклеточные рецепторы

Виды действия лекарственных веществ:

Местное действие - действие лекарственного вещества в местах их нанесения или введения.

Резорбтивное действие - (резорбция – всасывание) начинается после всасывания в кровь независимо от путей введения.

Основное действие (лечебное действие) – действие лекарства, на которое рассчитывает врач.

Побочное действие – способность вещества одновременно с основным терапевтическим эффектом оказывать нежелательное или вредное влияние.

Прямое действие – проявляется в тканях, с которыми оно непосредственно контактирует. Например, сердечные гликозиды усиливают работу сердца, влияя непосредственно на миокард.

Косвенное действие – лекарство, действуя на основной орган, улучшает функцию других органов. Например, сердечные гликозиды, усиливая сокращения сердца (прямое действие), улучшают кровообращение и функцию других органов – печени, почек (косвенное действие).

Рефлекторное действие – разновидность косвенного действия, в котором участвует нервная система (рефлекторная дуга). Например, горчичник, приложенный к коже, рефлекторно улучшает функцию внутренних органов.

Обратимое действие – действие лекарственных препаратов при однократном введении, которое заканчивается в течение нескольких часов или суток и не сопровождается гибелью клеток.

Необратимое действие–действие лекарственных веществ сопровождается глубокими нарушениями структуры клеток, вызывая их гибель. Например, прижигание бородавок нитратом серебра.

Фармакологический эффект – это ожидаемый эффект, который наступает в результате действия препарата.

Этиотропная терапия – это действие лекарств, направленное на причину заболевания.

Патогенетическая терапия - это действие лекарств, направленное на механизм развития болезни.

Симптоматическая терапия – действие лекарств, направленное на устранение отдельных симптомов заболевания.

Доза - это количество введённого в организм лекарственного вещества. Выражается в весовых (мг) или объёмных единицах измерения (мл).

Минимальная терапевтическая доза – то наименьшее количество препарата, которое способно вызвать лечебный эффект.

В медицинской практике чаще всего используются средние терапевтические дозы.

Высшая терапевтическая доза – это предельно допустимая лечебная доза.

Минимальная токсическая доза – доза препарата, при которой начинают возникать токсические явления.

Смертельная доза – количество препарата, которое вызывает гибель человека или животного.

Диапазон доз между минимальной терапевтической и минимальной токсической дозами называется терапевтической широтой действия препарата.

Чувствительность организма к лекарственным препаратам меняется в зависимости от возраста. Особенно осторожно назначают лекарства маленьким детям и пожилым людям. Организм ребёнка находится в стадии формирования. Дети особенно чувствительны к препаратам, угнетающим ЦНС (морфин, снотворные средства), ядам и сильнодействующим веществам. В справочниках даются специальные таблицы с указанием высших разовых и суточных доз ядовитых и сильнодействующих средств для детей различных возрастных групп. Дозировки лекарств для взрослых предусмотрены больным 14-60 лет. Больным старше 60 лет дозы уменьшаются на 1/2 -1/3. Чем больше масса тела больного, тем больше должна быть доза (в пределах диапазона терапевтических доз). В период беременности нельзя принимать ряд препаратов, т.к они могут привести к врожденным уродствам. При заболеваниях печени или почек активность лекарственных веществ может усиливаться вплоть до отравления. Это связано с замедленным разрушением лекарств в печени и затруднением их выведения из организма почками.

Аллергическая реакция – это повышенная чувствительность к некоторым лекарственным препаратам в виде зуда, крапивницы, анафилактического шока.

Идиосинкразия - врожденная индивидуальная непереносимость некоторых лекарств.

Привыкание–постепенное ослабление действия лекарственного вещества при повторном его введение. При этом нужно увеличивать дозу препарата или заменять его другим.

Тахифилаксия – быстрое привыкание к лекарственному веществу при повторных введениях.

Кумуляция – в результате замедленного превращения или выведения лекарств, в организме может возникнуть их накопление и отравление организма.

Материальная кумуляция– в тканях идёт накопление самого вещества, например, сердечные гликозиды.

Функциональная кумуляция– когда эффект от предыдущего приёма лекарства сохраняется и усиливается при повторных его приёмах – при нормальном метаболизме – алкоголь.

При повторных введения некоторых лекарственных веществ может развиваться лекарственная зависимость. У больного возникает непреодолимое желание повторить приём данного лекарственного препарата, например, наркотики. Они улучшают настроение, устраняют переживания. Зависимость, которую вызывают наркотики называют наркоманией. Люди, принимающие наркотики называются наркоманами. Прекращение приёма наркотиков приводит к тяжёлым субъективным ощущениям и нарушениям функций внутренних органов. Такое состояние называется абстиненцией.

Сенсибилизация – повышенная чувствительность лекарственному веществу при его повторном введение в организм.

Синергизм – усиление фармакологического действия при одновременном применении двух или более лекарственных препаратов.

Антагонизм – ослабление фармакологических действий приприменение двух или более лекарственных препаратов. Явления антагонизма используются для оказания помощи при отравлениях. Реакция, которая происходит между веществами, называется реакцией нейтрализации, а вводимое вещество называется антидотом.

Эмбриотический эффект возникает в первые 3 недели после оплодотворения (мёртвый плод).

Тератогенный эффект - возникает в период с начала 4-ой недели и до конца 10-ой недели беременности. При этом возникают аномалии внутренних органов.

Фармакопея – это специальное руководство, в котором описываются методы изготовления различных лекарственных форм; представлены списки ядовитых и сильнодействующих веществ.

Государственная фармакопея – это сборник обязательных общегосударственных стандартов и положений, нормирующих качество лекарственных средств. В настоящее время каждая страна имеет свою фармакопею. Кроме того, создана Международная фармакопея. Требования фармакопеи носят законодательный характер и обязательны для всех предприятий и учреждений, изготавливающих, хранящих, контролирующих и применяющих лекарственные средства. Лекарственные вещества, неудовлетворяющие требованиям фармакопеи, не могут быть использованы с лечебной целью. Фармакопея содержит статьи, устанавливающие требования к отдельным лекарственным препаратам, лекарственному сырью и лекарственным формам. В статьях на лекарственные формы указывается способ их приготовления.

В 11-ом издании фармакопеи повышены требования к качеству лекарственных препаратов, улучшены многие методы их анализа., включен ряд новых лекарств и пересмотрены списки ядовитых веществ (список А) и сильнодействующих веществ (список Б).

В 12-ой фармакопее отменены списки А и Б и внесены списки наркотических средств в соответствии со списками Единой конвенции ООН о наркотических средствах 1961 года.

Список 1 – список наркотических средств и психотропных веществ, оборот которых в РФ запрещён.

Список 2 – список наркотических средств и психотропных веществ, оборот которых в РФ ограничен.

Список 3 – список психотропных веществ, оборот которых в РФ ограничен и в отношение которых допускается исключение некоторых мер контроля.

Список 4 – список прекурсоров, оборот которых в РФ ограничен и в отношение которых устанавливаются меры контроля.

Прекурсоры – это вещества, часто используемые при производстве, изготовление, переработке наркотических средств и психотропных веществ, включенные в перечень наркотических средств и психотропных веществ.

Аптека (Apotheka – хранилище) – это медицинское учреждение, основными задачами которого являются изготовление и отпуск лекарств населению и ЛПУ, снабжение их перевязочным материалом, предметами санитарии, гигиены и ухода за больными. Аптеки деляться на муниципальные и частные.

Приказ № 785 от 14.12.2005 г.

«Порядок отпуска лекарственных средств»

- отпуску подлежат ЛС, в том числе наркотические, психотропные, сильнодействующие средства и ядовитые вещества, зарегистрированные в РФ.
- Отпуск по рецепту и без рецепта врача осуществляется аптечными учреждениями, имеющими лицензию на фармацевтическую деятельность.
- Выписанные по рецепту врача лекарственные средства подлежат отпуску аптеками и аптечными пунктами
- Все ЛС, за исключением включённых в перечень ЛС, отпускаемых без рецепта врача, должны отпускаться аптечными учреждениями только по рецептам, оформленным в установленном порядке на рецептурных бланках соответствующих учётной форме.

Перечислить формы бланков:

Рецепты списка 2 действительны в течение 5 дней.

Рецепты списка 3 действительны в течение 10 дней.

Остальные ЛС, не включенные в перечень ЛС, отпускаемых без рецепта врача, выписываются на рецептурных бланках № 107/у.

- отпуску аптечным Управлением подлежат наркотические средства и психотропные вещества, внесённые в список 2 и 3.

- АУ, отпускающие вещества списков 2 и 3, должны иметь лицензию

Рецептурные бланки:

I. «Специальные рецептурные бланки на наркотическое средство и психотропное вещество»
   Приказ № 110.
II. «Рецептурные бланки для сильнодействующих веществ»
   Форма № 148 – 1/у – 88
III. «Рецепт» льготный с копией
   Форма № 148 – 1/у – 04 (л)
IV. Обычный рецептурный бланк – форма № 107-у
   - отпускает ЛС списков 2 и 3 фармацевтический работник, имеющий на это право.
   - отпуск ЛС, списка 2 осуществляется больным, прикреплённым к конкретному амбулаторно – поликлиническому учреждению, которое закреплено за аптечным учреждением.

- выписанные больному ЛС списка 2 и 4 отпускаются больному, или лицу, его представляющему, при предъявление документа, удостоверяющего личность.
- предъявить рецепт ф. 148 – 1/у – 04 (1), если ЛС 2 и 3 списка льготно или бесплатно.

Лекция №2. Тема: Рецепт. Лекарственные формы.

Рецепт – это письменное обращение врача, фельдшера или акушерки в аптеку об отпуске лекарственного средства в определённой лекарственной форме и дозировке, с указанием способа его употребления. Рецепт является важным медицинским и юридическим документом и служит единственным основанием для отпуска из аптек большинства лекарств. В случае бесплатного или на льготных условиях отпуска лекарств рецепт является также денежным документом.

Структура рецепта – читай в книге.

Рецепты выписывают на специальных бланках:

- для отпуска лекарств за полную стоимость;
- для отпуска лекарств бесплатно или на льготных условиях;

Особые рецептурные бланки предназначены для выписывания средств, которые могут вызвать наркоманию. Рецепты необходимо писать чётко, разборчиво, шариковой ручкой или чернилами. Исправления в рецепте не допускаются. Состав лекарства, название лекарственной формы, указание об изготовлении и выдаче лекарства пишутся на латинском языке. Необходимо выработать привычку внимательно прочитывать рецепт перед тем, как отдать его больному. Врач, фельдшер, акушерка несут личную ответственность за выписанный ими рецепт.

Мягкие лекарственные формы:

К ним относятся мази, пасты, линименты, суппозитории. В состав мягких лекарственных форм входят формообразующие вещества – жиры и жироподобные вещества. Их называют ***основы.*** Основы должны хорошо смешиваться с лекарственными веществами, не вступать с ними в химические взаимодействия, обладать хорошей мажущей способностью, не оказывать вредного влияния на кожу, быть стойкими при хранении и плавиться при t тела.

По происхождению различают 4 группы основ:

I. *Основы животного происхождения:*

- очищенный свиной жир – t° плавления 34 – 46°С
- ланолин - t° плавления 26 - 42°С

Источником его получения являются промывные воды при обработке овечьей шерсти.

- спермацет – вещество из жира кашалота. Чаще используется в косметических мазях,

t° плавления 45 - 54°С

- жёлтый воск – выплавляется из пчелиных сот, t° плавления 63 - 65°С.

II. *Основы растительного происхождения:* подсолнечное масло, оливковое, персиковое, касторовое масло. Их используют для изготовления

линиментов и пластырей. Масло какао используется как основа для суппозиториев, твёрдой консистенции при t ° 18 - 20°С и плавится при t° тела.

III. *Основы, получаемые из нефти:*

Вазелин – не активен в химическом отношении, не раздражает кожу и слизистые, не разлагается при хранение, t ° плавления 37 - 50°С.

Вазелиновое масло – маслянистая бесцветная жидкость, используется для изготовления линиментов.

IV. *Синтетические основы – полимеры:*

полиэтиленгликоли и полиэтиленоксиды.

Мази – лекарственная форма для наружного применения. Мазь, состоящая из одного лекарственного вещества и основы, называется простой. Выписывается развёрнутым и сокращённым способом.

1) Rp: Zinci oxydi 2,5
   Vaselini ad 50,0
   M.f. ung.
   D.S. Смазывать поражённые участки тела.
2) Rp: Ung. Zinci oxidi 5% - 50,0
   D.S. Смазывать поражённые участки тела.
3) Официнальные мази выписываются в сокращённом виде.

Пасты- это густые мази, содержащие от 25% до 60% порошкообразных веществ. Пасты обладают адсорбирующей подсушивающей способностью и более длительным действием, чем мази. Если количество порошкообразных веществ в пасте менее 25%, то добавляют одно или несколько индифферентных порошков: крахмал, тальк, цинка окись, белую глину и др.

Выписываются в развернутом виде, официнальные – в сокращенном.

Rp: Laevomycetini 1,0

Talci 5,0

Naphthalani ad 20,0

M.f. pasta

D.S. Наносить на пораженный участок кожи.

Линименты– представляют собой густую жидкость или студенистую массу, которая плавится при температуре тела. Для основ линиментов используют жидкие масла. К линиментам относятся также суспензии и эмульсии.

Линименты выписываются в развернутом и сокращенном виде.

Rp: Linimenti Streptocidi 5% - 20,0

D. S. Наносить на пораженный участок кожи.

Суппозитории – в состав входит лекарственное вещество и масло какао. Различают суппозитории ректальные и вагинальные. Масла ректальных суппозиториев 1,0 – 4,0, масла вагинальных суппозиториев 1,5 – 6,0.

Выписываются в развернутой и сокращенной форме.

Пластыри – для наружного применения, размягчаются при температуре тела. Состоят из лекарственных веществ и пластырной массы, обладающей свойством плотно прилипать к коже. Могут оказывать лечебное действие на кожу.

Липкий пластырь фиксирует повязки, используется для сближения краев раны.

Лекарственные пленки и пластинки – это лекарственные формы, в которых на полимерной основе содержатся лекарственные вещества. Например, пленки глазные, пленки с нитроглицерином. Глазные пленки помещают на конъюнктиву глаза. Она смачивается слезной жидкостью и начинает постепенно растворяться. Действие сохраняется 24 часа. Пленки с нитроглицерином помещаются на верхнюю десну.

Rp: Membranulae ophthalmicae

Pilocarpini hydrochloridi № 30

D.S. Помещать по 1 пленке за край нижнего века ежедневно.

Твёрдые лекарственные формы

Таблетки– твёрдая дозированная лекарственная форма. Получают методом прессования смеси лекарственных и вспомогательных веществ. Предназначены для приёма внутрь, иногда для приготовления растворов для наружного применения. Имеют вид круглых или овальных пластинок с плоской или двояковыпуклой поверхностью . В состав таблеток , кроме лекарственных веществ, могут входить вспомогательные вещества(сахар, крахмал и т.д.). Рецепт пишется в развёрнутой или сокращённой форме.

Rp: Metamizoli – natrii 0,25

Coffeini 0,03

Phenobarbitali 0,02

D.t.d.№ 12 intab.

S: По 1 таб.при головной боли.

Если таблетки состоят из одного вещества, то рецепт выписывается сокращенно или развернуто:

Rp: Tab. Octadini 0,01 № 20

D.S. По 1 таб. 2 раза в день.

Если таблетки имеют название, то они выписываются так:

Rp: Tab. « Nicoverinum» № 20

D.S. По 1 таб. 2 раза в день

Драже – твёрдая дозированная лекарственная форма для внутреннего применения. Изготавливают на заводе путём наслаивания (дражирования) лекарственных и вспомогательных веществ на гранулы. Выписывается в развёрнутой и сокращённой форме. Прописываются двумя способами:

Rp: Drag. Mebhydrolini 0,1 № 20

D.S. по 1 драже 2 раза в сутки

Rp: Nitroxolini 0,05

D.t.d. № 50 in drag.

S. По 2 драже 4 раза в сутки.

Порошки– твёрдая сыпучая лекарственная форма для внутреннего, наружного или инъекционного применения. Они могут быть простыми, состоящими из одного вещества и сложными, состоящими из нескольких компонентов. Порошки, разделённые на дозы, принимаются внутрь. Их масса может быть от 0,1 до 1,0 – 1,5

Rp: Diphenhydraminihydrochloridi 0,015

Sacchari 0,3

M.f. pulv.

D.t.d. № 10

S. По 1 порошку 2 раза в день.

Не разделённые порошки используются наружно. Их масса колеблется от 5,0 до 100,0.

Rp: Natrii hydrocarbonatis 30,0

D.S. По ¼ чайной ложки через 2 часа после еды.

Капсулы– крахмальные или желатиновые оболочки, в которых заключены дозированные порошкообразные, ганулированные, пастообразные, полужидкие и жидкие лекарственные вещества. Лекарственные вещества заключают в капсулу для увеличения срока хранения, маскировки неприятного запаха или вкуса, предотвращения раздражающего действия на слизистые оболочки. Выписываются развёрнутым способом.

Rp: Olei Ricini 1,0

D.t.d. № 30 in caps. gelat.

S. 15 капсул на прием (принять в течении 30 мин).

Гранулы– порошкообразные смеси в виде мелких или крупных крупинок – зерен округлой, цилиндрической или неправильной формы. Состоят из лекарственных и вспомогательных веществ. Дозируются специальными ложечками. Перед употреблением их растворяют.

Rp: Gran. Glycerophosphatis 100,0

D.S. По ½ чайной ложки 3 раза в день, растворить в ¼ стакана воды.

Глоссеты– разновидность таблеток для сублингвального или защечного применения.

Карамели и пастилки– твердая лекарственная форма, приготовленная в виде конфет с содержанием сахара и патоки. Применяются для лечения заболеваний полости рта и глотки.

Жидкие лекарственные формы:

Раствор – жидкая однородная лекарственная форма, которая получается путем растворения лекарственного вещества в растворителе.
Растворимое вещество может быть твердым, жидким или газообразным. В качестве растворителя используют дистиллированную воду, этиловый спирт, глицерин, растительные масла. Растворители должны хорошо растворять лекарственные вещества, не вступать с ними в реакции, быть индифферентным для организма человека, не оказывать местного и резорбтивного действия, быть стойкими при хранении, не содержать микробов и их токсинов.
Концентрация раствора – это содержание вещества в определенном объеме раствора. Она может быть выражена в процентах (количество граммов вещества в 100 мл раствора), (mg/ml – количество ЛВ в 1 мл) или в виде отношения, показывающего, в каком объеме раствора должен содержаться 1 г растворяемого вещества (1:500; 1:1000) или в массо-объёмных отношениях, с обозначением в каком объеме раствора содержится требуемое количество растворяемого вещества:
0,6 – 180 ml

0,5 – 200 ml

5mg/ml – 5 миллиграммов вещества в 1 миллилитре

Rp: Sol. Natrii bromidi 30 mg/ml - 200 ml

D.S. По 1 столовой ложке 3 раза в сутки до еды.

Rp: Natrii bromidi 6,0

Aq. destill. ad 180 ml

M.D.S.По 1 столовой ложке з раза в день.

Rp: Sol. Nitrofurali 1: 5000 – 500 ml

D.S. Полоскать рот 4 раза в сутки.

По виду растворителя различают водные, спиртовые и масляные растворы. При выписывании водных растворов вода в рецепте не указывается.

Rp: Sol. Kaliipermanganatis 1: 1000 – 500 ml

D.S. Для промывания ран.

При выписывании масляных или спиртовых растворов после Solutionis и названия лекарственного вещества обозначается характер раствора - oleosae

(масляного) или spirituosae (спиртового), затем его концентрацию и количество.

Rp: Sol. Camphoraeoleosae 1% – 200 ml

D.S. Для растирания поясницы.

Различают растворы для наружного и внутреннего применения.

Раствор для наружного применения:

К ним относятся примочки, полоскания, промывания (отпускаются по 50 – 500 мл) и капли глазные, ушные и носовые (отпускаются по 5 – 10 мл)

Выписываются развернутым и сокращенным способом.

Растворы для приема внутрь– дозируются ложками и каплями. Раствор применяемый внутрь ложками, отпускается на 10 -12 приемов, т.е. на 3 – 4 дня.

Необходимо знать, что:

- в 1 столовой ложке содержится 15 мл раствора;

- в 1 десертной ложке – 10 мл раствора;

- в 1 чайной ложке – 5 мл раствора;

- в 1 мл воды содержится приблизительно 20 капель;

- в 1 мл масляного раствора – 30 капель;

- в 1 мл спирта – 40 -60 капель.

Количество отпускаемого раствора зависит от способа дозирования:

- чайными ложками – 50 -60 мл;

- десертными ложками – 100 – 120 мл;

- столовыми ложками – 150 – 180 мл → это общее количество выписываемого вещества.

Официнальными – называются растворы, состав которых приведен в Фармакопее.

Самый древний источник получения лекарств – растения. Из растительного лекарственного сырья получают:

Алкалоиды-вещества, обладающие высокой биологической активностью. В медицинской практике используются в виде солей.

Гликозиды – сложные эфироподобные вещества.

Сапонины – это вещества, образующие с водой легко пенящиеся растворы.

Эфирные масла – летучие жидкости с характерным запахом и жгучим вкусом.

Дубильные вещества – обладают вяжущим или раздражающим действием на кожу и слизистую оболочку.

Фитонциды– обладают противомикробной активностью.

Баластные вещества– это клетчатка, слизи, крахмал, белки, жиры, смолы, органические и неорганические соли, микроэлементы.

Галеновы препараты– получили свое название в честь знаменитого римского врача и фармацевта Клавдия Галена (131 – 201 г до н.э.), который первый стал применять эти препараты в практике. Это настои, отвары, настойки, экстракты, микстуры, сборы лекарственные. Назначаются peros (энтерально).

Настой– жидкая лекарственная форма. Готовят из листьев, цветов, травы растений. Реже используется корневище и корни. Измельченные части растений заливают водой, нагревают на кипящей водяной бане 15 мин, охлаждают в течении 45 мин и процеживают.

Отвары – готовят из корня, коры, корневища. Измельченные части растений заливают водой, нагревают на водяной бане в течении 30 мин, охлаждают 10 мин, затем процеживают.

Настои и отвары прописывают на 3 -4 дня и дозируют ложками.

Rp: Dec. CorticisQuercus 1:10 – 200 ml

D.S. По 1 столовой ложке 3 раза в день.

Настойки – это спиртовые, спирто-водные или спирто-эфирные вытяжки из растительного сырья, получаемые на фармакологических предприятиях. Сильнодействующие настойки выписываются в количестве 5 – 10 ml, остальные 20 – 30 ml. Дозируются каплями.

Rp: Tinct. Absinthii 20ml

D.S. По 20 капель за 30 минут до еды.

Экстракты – концентрированные вытяжки действующих лекарственных веществ из растительного лекарственного сырья. Их приготовляют на фармакологических предприятиях теми же способами, что и настойки, после чего выпаривают до нужной концентрации. Различают экстракты жидкие, сухие и густые.

Микстуры– жидкая лекарственная форма, состоящая из смеси нескольких лекарственных средств, находящихся во взвешенном состоянии. Дозируется ложками, каплями.

Rp: Tinct. Convallariae

Tinct. Valerianaeaa 7,5ml

M.D.S. по 15 капель 3 раза в день.

Новогаленовы препараты – это вытяжки из растительного сырья, получаемые путём специальной обработки на фармакологических предприятиях. Подвергаются высокой степени очистки от баластных веществ и могут использоваться парентерально. Выпускаются в таблетках, флаконах, ампулах.

Дисперсные системы – дисперсионной средой является вода, масло, газ и другие, а дисперсной фазой – нерастворимыемелкие частицы. К ним относятся суспензии, аэрозоли, линименты, эмульсии, микстуры.

Линименты– жидкие мази для наружного применения.

Аэрозоли – дисперсной средой служит газ или газовая смесь, дисперсной фазой – жидкость или мельчайшие частицы. Используются для ингаляционного и наружного применения.

Rp: Aerosoli “Ephatinum” №1

D.S. по 3 ингаляции в сутки.

Суспензии – это взвеси мелких частиц твёрдых лекарственных веществ, не растворимых в воде. Используются внутрь и наружно. Перед употреблением взбалтывать.

Эмульсии– жидкие лекарственные формы, в которых нерастворимые в воде жидкие масла находятся во взвешенном состояние в виде мельчайших частиц. Применяются внутрь и наружно.

Сборы лекарственные – состоят из смеси нескольких видов измельчённого растительного лекарственного сырья. Отпускаются из аптек в сухом виде с

указанием о способе приготовления и применения. Сборы бывают дозированные, если в их состав входят растения с сильнодействующими веществами; и не дозированные. Фармацевтическая промышленность выпускает ряд официнальных сборов: сбор грудной, витаминный (vitaminosae), желчегонный (cholagogae), мочегонный, слабительный.

Слизи – коллоидные растворы растительного происхождения, представляют собой вязкие, клейкие жидкости. Получают слизь из крахмала при обработке его горячей водой – крахмальная слизь - mucilageAmyli. Применяют слизь в качестве обволакивающих средств для уменьшения раздражающего действия других лекарственных средств.

Rp: Chloralihydrati 1,5

MucilaginisAmyli

Aq. destillataeāā 25 ml

M. D.S. Для одной клизмы.

К лекарственным формам для инъекций относятся стерильные водные и масляные растворы, суспензии, эмульсии, новогаленовы и органопрепараты, а так же порошки и таблетки, которые растворяются непосредственно перед введением. ***Требования***: лекарственные формы для инъекций должны быть стерильными, стойкими при хранении, не содержать механических примесей и не вызывать повышения t° тела у пациентов. Растворы для инъекций готовят на фармацевтических заводах или в аптеках. Инъекционные растворы аптечного производства выпускаются во флаконах различной ёмкости, на которых наклеивают этикетки с надписью «Стерильно». Растворы , приготовленные в аптеке выписываются развёрнутым и сокращённым способом.

Rp: Glucosi 10,0

Aq. destillataead 200 ml

M.D.S. Ввести внутривенно капельно.

Rp: Sol. Glucosi 50mg/ml - 500 ml

D.t.d. № 10

S. для в/в капельного введения

Растворы для инъекций заводского производства выписываются сокращённым способом.

Rp: Sol. Neostigmini methylsulfatis 0,5mg/ml - 1 ml

D.t.d. №10 inamp.

S. по 1 мл подкожно

Во флаконах или ампулах могут выпускаться порошки или таблетки, из которых готовят стерильный раствор. Растворяют их перед употреблением, используя в качестве растворителя воду для инъекций, изотонический раствор NaCl, раствор прокаина (новокаина) (2,5 mg/ml) или лидокаина (5mg/ml).

Rp: Susp. Hydrocortisoni acetatis 25 mg/ml – 2 ml

D.t.d. №5 inamp.

S. Вводить по 2 мл внутримышечно

Если препарат выписывается во флаконах, то infiaconis не пишется.

Rp: Benzylpenicillini – natrii 500000 ED

D.t.d. №10

S. Развести в 5 мл стерильного раствора прокаина в концентрации 5mg/ml.

Водные растворы вводятся в/в, в/м, п/к. Масляные растворы – п/к и в/м. Суспензии вводятся в/м.

Большинство лекарственных препаратов имеют название по химической формуле.

В Единицах Действия в настоящее время дозируются только пенициллины.

Таблица перевода ЕД в граммы для антибиотиков.		
г	мг	ЕД
1,0	1000 мг	1.000.000 ЕД
0,1	100 мг	100.000 ЕД
0,01	10 мг	10.000 ЕД
0,001	1 мг	1.000 ЕД

Лекция №3. Тема: Противомикробные средства. (Антисептические и дезинфицирующие средства)

Противомикробные средства применяют для профилактики и лечения инфекционных заболеваний. Выделяют:

Антисептические средства – предназначены для уничтожения микроорганизмов на поверхности кожи и слизистых оболочек. Они не должны раздражать и повреждать ткани организма (кожу, слизистые оболочки). Они оказывают бактерицидное и бактериостатическое действие.

Дезинфицирующие средства - предназначены для обеззараживания внешних предметов (помещение, предметы ухода за больными, медицинский инструментарий).

Химиотерапевтические средства – используются для уничтожения возбудителей заболевания внутри организма (в крови, в тканях органов). Они должны быть безвредны для организма человека.

Антисептические средства

Механизм действия антисептиков – вызывают денатурацию (свёртывание) бактериальных белков.

Классификация антисептических средств:

1) Галоидосодержащие вещества
2) Окислители
3) Соединения алифатического ряда
4) Соединения ароматического ряда
5) Красители
6) Кислоты и щелочи
7) Соли тяжёлых металлов
8) Производные нитрофуранов
9) Детергенты

I. Галоидосодержащие вещества (галогены)

К этой группе относятся препараты, содержащие хлор и йод. Противомикробное действиеоказываю толькосвободные (активные)галогены (хлор и йод). Они денатурируют (сворачивают) протоплазму клеток. В связанной форме галогены не оказывают противомикробного действия. По этому используют препараты, содержащие свободные галогены (например,

раствор йода спиртовой). Либо используют соединения, отщепляющие галогены в свободном виде (например, хлорная известь). Хлор в сухом виде не активен. По этому для дезинфекции помещений и выделений больных используются растворы хлорной извести.

Хлорамин Б – обладает антисептическим и дезодорирующим действием. Используют растворы 0,25% – 0,5% для дезинфекции рук, 1% - 5% раствор для обеззараживания предметов ухода за больными. (Chloraminum – B) Форма выпуска – порошок.

Хлоргексидин – применяют в 0,5% спиртовом растворе для обработки операционного поля и рук хирурга и водный раствор для обработки ран, при гингивитах, стоматитах.

Раствор йода спиртовой – 5% или 10% раствор применяют наружно для обработки ссадин, царапин.

Повидон – йод (Бетадин) – комплекс йода с поливинилпирролидоном. Используется в виде 0,5-1%растворов для обработки кожи пациентов до и после операций, для лечения ран, ожогов. В вагинальных суппозиториях назначают при острых и хронических вагинитах .

Йодинол – водный раствор, содержащий йод, калия йодид, поливиниловый спирт. Используется при хронических тонзиллитах, гнойном отите, трофических язвах.

Йодоформ – органическое соединение йода, способное высвобождать активный йод. Применяют в виде присыпок, мазей при лечении инфицированных ран.

II. *Окислители.*

При контакте с тканями происходит разложение этих веществ с выделение кислорода, который вызывает гибель микробных клеток. Наиболее сильное противомикробное действие оказываю препараты, выделяющие атомарный кислород. Вещества, отщепляющие молекулярный кислород, обладают меньшей окислительной способностью.

Калия пермаганатобладает выраженным противомикробным действием за счет отщепления атомарного кислорода. В малых концентрациях он оказывает вяжущее действие, а в больших концентрациях оказывает раздражающее и прижигающее действие. Для промывания ран, полоскания рта и горла, спринцевания, промывания мочеиспускательного каналаиспользуют раствор в концентрации 0,01% - 0,1% - 0,5% ;

2% - 5% раствор используется при лечении язв, ожогов.

Перекись водорода – по сравнению с перманганатом калия обладает более слабым противомикробным действием. При обработке раны раствор перекиси водорода очень сильно вспенивается. Образующаяся пена уносит из раны и поверхности кожи частички инородных тел, частички некротических тканей, сгустки крови, гноя. Это способствует очищению раны. Также перекись водорода действует как местное кровоостанавливающее средство.

3% раствор перекиси водорода используется для обработки ран; 1 столовая ложка 3% раствора на стакан воды – для полоскания ротовой полости при ангинах; 6% раствор для холодной стерилизации металлических предметов. Концентрированный раствор 27% - 31% используется для приготовления разведённых растворов.

III. Соединения алифатического ряда.

Механизм действия этой группы препаратов - отнимают жидкую часть у белка бактерии, что приводит к его денатурации. Сюда относятся спирт этиловый и группа формальдегида.

Формалин (формальдегид)–действует на бактерии, грибы, вирусы. Используется в виде 0,5% - 1% растворов для дезинфекции инструментов; используют как дезинфицирующее и дезодорирующее средство для обработки кожи ног.

Спирт этиловый *(Spiritusaethilicus)* – этанол, оказывает бактерицидное действие, используют 96% раствор для дезинфекции хирургических инструментов, 70% раствор используют для обработки рук хирурга и операционного поля.

Метенамин **(уротропин)** – в кислой среде высвобождает формальдегид. Применяют внутрь в таблетках при инфекциях мочевыводящих путей.

IV. Соединения ароматического ряда.

Сюда относятся фенол, резорцин, дёготь берёзовый, ихтиол.

Фенол - его получают из продуктов перегонки каменного угля, действует в основном на вегетативные формы бактерий и грибы.На споры микроорганизмов фенол действует слабо, 3%-5% растворымогут использоваться для дезинфекции инструментов, белья. На кожу и слизистые оболочки фенол оказывает раздражающее и прижигающее действие вплоть до некроза этих тканей. Так же нельзя применять для обеззараживания кожи

и слизистых оболочек, так как всасываясь через кожу, может вызвать головокружение, угнетение дыхания, судороги, сосудистый коллапс. При попадании концентрированных растворов фенола на кожу обязательно её нужно обработать спиртом.

Резорцин (резорцинол) – действует на вегетативные формы грибов и бактерий. Используется при кожных заболеваниях виде 2-5% растворов и 5-20% мази.

Дёготь берёзовый– на кожу оказывает раздражающее действие, при этом улучшается кровообращение в пораженном участке кожи. Это ведет к ускорению эпителизации и уменьшению признаков воспаления в пораженном участке. Применяют при заболеваниях кожи в виде 10-20% мази, входит в состав линимента бальзамического по Вишневскому.

Линимент бальзамического по Вишневскому–содержит дёготь, ксероформ и масло касторовое. Обладает антисептическими свойствами и способствует ускорению процессов регенерации тканей. Применяют при лечении ран, пролежней.

Ихтиол – входит в состав мазей, применяемых при ожогах и различных кожных заболеваниях; в виде суппозиториев ректальных и вагинальных.

IV. *Красители*

Эти антисептики обладают относительно невысокой токсичностью для человека.

Бриллиантовый зелёный – применяют в виде 1 – 2% спиртового или водного раствора для обработки ссадин и различных заболеваний кожи.

Метилтиониния хлорид*(метиленовый синий)* - используют в виде 0,02%раствора; 1–3% водных и спиртовых растворов при ожогах и гнойничковых заболеваний кожи; при воспалительных заболеваниях мочевыделительной системы. Его используют также как антидот при отравлениях соединениями синильной кислоты (цианиды), азотистой кислоты, сероводородом, окисью углерода. При этом вводят его водный раствор внутривенно.

Этакридина лактат *(риванол)* - используется для промывания гнойных ран в виде 0,05% - 0,1% растворов; 1% мазь, 5% - 10% пасты для перевязок.

VI. Кислоты и щёлочи

Кислота борная *(acidumboricum)* – применяется наружно в виде растворов, 2%-4%, 5%-10% мазей, паст, линиментов и присыпок . Хорошо впитывается через кожу и слизистые оболочки и может вызвать отравление острое или хроническое. Отравление характеризуется тошнотой, рвотой, головной болью, судорогами. Применение борной кислоты противопоказано при нарушении функции почек, при беременности, кормящим матерям, детям.

Бензилбензоат *(Benzyliibensoasmedicinalis)* – используется в виде10- 20% водномыльной эмульсии, мазь при чесотке.

Кислота салициловая *(ac.Salicylicum)* – применяется в виде присыпок, мазей, спиртовых растворов.

Нашатырный спирт *(раствор аммиака)* – SolutioAmmoniicaustici, 10% раствор применяют для мытья рук перед операцией (25 мл на 5 л воды), дают вдыхать при обмороках.

VII. Соли тяжёлых металлов

Реагируют с белками образуя соединения альбуминаты. Кроме противомикробного оказывают местное действие на ткани: вяжущее, раздражающее или прижигающее.

Ртути дихлорид *(сулема)* – раньше применяли его 0,1 – 0,2% растворы для дезинфекции белья, предметов ухода. Сулема высокотоксична для организма, поэтому в настоящее время её не используют. Другие препараты ртути: окись ртути, ртути оксицианид – менее токсичны. Используются в мазях для лечения гнойничковых заболеваний кожи.

Препараты серебра:

Серебра нитрат *(ляпис)* – используется для лечения кожных заболеваний, в ЛОР- практике, глазной и урологической практике. Прижигающее действие используется для удаления избыточных грануляций.

Цинка сульфат – применяется наружно в растворах и внутрь в порошках в глазной и урологической практике.

Цинка окись – применяется в виде мази, пасты и присыпки.

Меди сульфат *(Cuprisulfas)* – используется в глазной и урологической практике.

Свинца окись– входит в состав простого свинцового пластыря, свинцовой воды.

Дерматол и ксероформ - органические соединения висмута, используются в виде присыпок и мазей для лечения заболеваний кожи и слизистых.

Клиническая картина при отравлениях солями тяжёлых металлов: острые боли в животе, понос с примесями слизи и крови, головные боли, гемолиз крови, нарастающая недостаточность функции почек.

Помощь: внутрь молоко, яичный белок (белки связывают ртуть), осторожно промыть желудок с активированным углем или другими сорбентами, унитиол в/м или п/к.

VIII. Производные нитрофурана.

Обладают широким спектром действия и малой токсичностью для человека. Губительно влияют на грамположительные и грамотрицательные бактерии, а также на некоторых простейших.

Нитрофурал *(фурацилин)* – 0,02% (1:5000) водный раствор, для обработки ран, кожи, слизистых оболочек, полоскания горла при ангинах, рта при стоматитах. Его назначают внутрь в виде таблеток при бактериальной дизентерии.

XI. Детергенты **–** катионные и анионные мыла, обладают моющими и антисептическими свойствами. При прибавлении детергентов к воде они изменяют её поверхностное натяжение и тем самым способствуют очищению кожи и загрязненных предметов. Сюда относят церигель, роккал, бензалкония хлорид, мирамистин. Их применяют для обработки рук хирурга, стерилизации инструментов, обработки предметов ухода за больными.

Лекция №4. Тема: Химиотерапевтические средства, применяемые при инфекционных заболеваниях. Антибиотики.

К химиотерапевтическим средствам относятся противобактериальные, противогрибковые, противопротозойные и противогельминтные средства.

Антибиотики – это химические вещества, которые вырабатываются различными видами микроорганизмов (грибами или бактериями) или их получают синтетическим путем. Они подавляют рост и размножение других микроорганизмов, включая болезнетворные. Начало эры антибиотиков было положено А. Флемингом, который в 1928 году получил вещество из плесневых грибов рода Penicillinum. В 1940 году Флори и Чейн выделили кристаллический пенициллин из культуральной жидкости. Кристаллический пенициллин давал стабильный лечебный эффект и получил применение в медицинской практике.

В 1939 году Дюбо получил из почвенной бактерии антибиотик пептидной природы - грамицидин, который нашел широкое применение в медицинской практике. В 1942 году Ваксман получил стрептомицин, который оказался первым противотуберкулезным антибиотиком.

Классификация антибиотиков.

По характеру действия на микроорганизмы антибиотики делят на:

1. бактериостатические (подавляют рост и размножение микроорганизмов);

2. бактерицидные (уничтожают бактерии);

По механизму действия различают:

1. Антибиотики, нарушающие синтез стенки микробной клетки (пенициллины, цефалоспорины);
2. Нарушающие проницаемость цитоплазматической мембраны (полимиксины);
3. Нарушающие синтез нуклеиновых кислот и белка (стрептомицин, левомицетин, тетрациклин, макролиды, неомицины, рифампицин).

По спектру действия выделяют:

1.Действующие преимущественно на грамположительные бактерии (пенициллины, макролиды, линкомицин);

2.Действующие преимущественно на грамотрицательные бактерии (стрептомицин, канамицин, гентамицин, полимиксин Б и др.);

3.Действующие на оба типа бактерий (ампициллин, цефалоспорины, рифампицины, неомицины);

4.Антибиотики, подавляющие рост патогенных грибов (нистатин, леворин, гризеофульвин и др.).

5.Противоопухолевые антибиотики;

По происхождению

антибиотики могут быть природными (биосинтетические), полусинтетические и синтетические.

Биоситетические антибиотики (природные):

Получают путём выращивания плесневых и лучистых грибов в специальных приспособлениях. Для выделения и очистки антибиотика используют определённые физико – химические методы. Затем производиться стандартизация препарата и установление антимикробной активности, которая выражается в единицах действия (ЕД)

Полусинтетические антибиотики:

Получены путём изменения химической структуры ядра природного антибиотика (цефалоспорины, тетрациклины). Они устойчивы к микробным ферментам, ферментам ЖКТ, часто имеют более широкий спектр противомикробной активности.

Много антибиотиков получают *синтетическим путём*, он оказался более рентабельным (дешёвым), чем биосинтетический метод. Синтетическим путём получают хлорамфеникол (левомицетин), циклосерин.

β лактамные антибиотики:

Содержат β- лактамное кольцо.

Пенициллины

Механизм действия всех пенициллинов заключается в том, что они нарушают синтез клеточной стенки бактерий. Хорошо проникают во все органы и ткани за исключением костей и мозга. Выводятся с мочой в неизменном виде.

Различают:

1)природные пенициллины непродолжительного и продолжительного действия.

2)полусинтетические пенициллины:

- Не устойчивые к пенициллиназам (ампициллин, амоксициллин)
- Устойчивые к пенициллиназам (оксациллин, клоксациллин, нафциллин)

<u>Природные пенициллины.</u>

<u>Бензилпенициллин</u> – получают из зеленой плесени. Подавляет стрептококки, стафилококки, пневмококки, гонококки, бледную спирохету, возбудителя газовой гангрены, столбняка, сибирской язвы. Вводят только парентерально, т.к. он разрушается в кислой среде желудка.

Используются различные соли бензилпенициллина:

<u>Бензилпенициллина натриевая соль</u> – хорошо растворима в воде, быстро всасывается из мышцы. Вводится в/м, в/в, внутрисуставно, эндолюмбально. Растворы готовят перед употреблением. Растворяют в растворе прокаина в концентрации 5мг/мл для в/м введения. Для в/в введения растворяют в изотоническом растворе NaCl (9мг/мл), дозируется в ЕД. Вводят 4-6 раз в сутки.

<u>Побочные действия:</u>крапивница, повышение температуры тела, озноб, головная боль, боль в суставах, отек Квинке, иногда анафилактический шок. Выпускаются в виде порошка во флаконах.

Феноксиметилпенициллин- Хорошо всасывается при приеме внутрь, не разрушается в желудке, малотоксичен. Применяется при пневмониях, бронхите, ангине, рожистом воспалении. Назначается внутрь. Выпускается в таблетках. Дозируется в миллиграммах. Принимают 4 раза в сутки.

Бициллин-1 (бензатина бензилпенициллин) . Применяют для лечения сифилиса, профилактики и лечения ревматизма. Назначают в/м 1 раз в неделю или 2 раза в месяц. Выпускается в виде порошка во флаконах.

<u>Противопоказания -</u> повышенная чувствительность к пенициллину и прокаину. Дозируется в ЕД.

Препараты природных пенициллинов обладают выраженной бактерицидной активностью. Однако, у некоторых микроорганизмов вырабатывается фермент пенициллиназа, который разрушает пенициллин. Поэтому были

созданы полусинтетические препараты пенициллина, устойчивые к этим ферментам.

<u>Полусинтетические пенициллины, неустойчивые к пенициллиназам</u>

Ампициллин – широкого спектра действия, не разрушается под влиянием соляной кислоты, хорошо всасывается при приеме через рот. Показания те же, что у бензилпенициллина. Побочные реакции те же. Выпуск в таблетках и капсулах по 0,25 порошок по 50 суспензий. При лечении дизентерии это препарат выбора. Применяется ампициллина натриевая соль.

Амоксициллин - имеет широкий спектр действия. Лучше, чем ампициллин всасывается внутрь. Широко применяют для лечения инфекций ЛОР, активно подаваляет Helicobacterpylori, поэтому используют для лечения язвенной болезни желудка и 12п. кишки. Используют при лечении острых инфекций мочевыводящих путей.

<u>Полусинтетические пенициллины, устойчивые к пенициллиназам</u>

Оксациллин (оксациллина – натриевая соль) – устойчив к пенициллиназе, устойчив в кислой среде. Применяется внутрь, в/м, в/в.

Диклоксациллин – имеет более выраженное противомикробное действие, чем оксациллин. Используется в виде натриевой соли (диклоксациллин – натрий).

К этой группе относятся также клоксациллин, нафциллин.

<u>Карбоксипенициллины</u>. Сюда относятся карбенициллин, карфециллин, азлоциллин, мезлоциллин. Эти группы антибиотиков против синегнойной палочки.

<u>Комбинированные препараты</u>

Это препараты, содержащие пенициллин и***ингибиторы β-лактамаз (сульбактам, клавулановая кислота). Ингибиторы лактамаз, это вещества, которые связывают β-лактамазы (β-лактамазы это ферменты выделяемые некоторыми микроорганизмами и вызывающие разрушение антибиотиков).***

<u>Цефалоспорины:</u> Механизм действия, как у пенициллинов – нарушают биосинтез стенки бактерии. По сравнению с пенициллинами имеют более широкий спектр действия. Они более устойчивы кβ-лактамазам, реже вызывают аллергические реакции. Существует 4 генерации (поколения) цефалоспоринов:

1. Поколение (генерация) – цефазолин, цефалексин;

2. Поколение – цефаклор, цефокситин, цефуроксим;
3. Поколение – цефотаксим, цефиксим, цефтазидим, цефтриаксон (азаран).
4. Поколение – цефпиром, цефипим (максицеф).

Комбинированный препарат сульпирацеф, состоит из : цефоперазон + сульбактам.

Побочные эффекты цефалоспоринов: аллергические реакции, диспепсия. Возможна нефротоксичность, особенно при применении препаратов первого поколения.

Монобактамы.

Азтреонам –действует на Гр- бактерии, включая синегнойную палочку. По действию сходен с аминогликозидами, но лучше переносится больными и вызывает меньше побочных эффектов.

Карбопенемы. Сюда относятся *имипенем* и *меропенем*. Имеют широкий спектр действия. Применяют для тяжелых инфекций, главным образом госпитальной.

Аминогликозиды **–** обладают широким спектром действия и бактерецидной активностью. Выделяют 3 поколения аминогликозидов:

1. Поколение: стрептомицин, неомицин, канамицин. Используют для лечения туберкулеза, чумы, туляремии;
2. Поколение: гентамицин и тобрамицин. Влияет на синегнойную палочку. Хорошо действует на стафилококк.
3. Поколение: амикацин, нетилмецин. Воздействуют на микроорганизмы, устойчивые к гентамицину.

Побочные эффекты: нефротоксичность и ототоксичность.

Макролиды**–** к ним относятся эритромицин, рокситромицин (рулид), кларитромицин (клацид), азитромицин (сумамед).

Эритромицин – природного происхождения. Спектр его действия сходен с природными пенициллинами. Он также воздействует на легионеллы, микоплазмы и хламидии, tbc, helicobacterpylori. Новые макролиды сходны по спектру действия с эритромицином, но более активно влияют, на гемофильную палочку (азитромицин).

Тетрациклины – Механизм действия угнетают синтез белка в рибосомах бактерий. Тетрациклины накапливаются в печени, костях, зубах и слизистой ЖКТ. Нарушают функцию печени, ЖКТ, нарушают развитие зубов у детей. Могут повышать чувствительность кожи к солнечным лучам. Такое состояние называется ***фототоксичность***.

К этой группе относятся тетрациклин, доксициклин. Воздействуют на хламидии, микоплазмы, легионеллы, холерный вибрион, риккетсии, спирохеты, актиномицеты.

Противопоказания: беременность, кормление грудью, детям в возрасте до 8 лет.

Линкозамиды – линкомицин (линкоцин), клиндамицин (далацин). Хорошо проникают в костную ткань, легкие, желчь, плохо – через гематоэнцефалический барьер. Применяются для лечения инфекций брюшной полости и малого таза, эндометрита, абцесса легкого.

Гликопептиды– ванкомицин, тейкопланин– препараты выбора при непереносимости пенициллинов.Циклосерин применяется для лечения туберкулёза. Бацитрацин – применяют местно.

Хлорамфениколы *(*левомицетин) эффективен при брюшном тифе, паратифах, коклюше, чуме, менингите, при глазных инфекционных заболеваниях (трахома).

Синтомицин (Synthomycinum) 1% - 5% - 10% линименты; вагинальные суппозитории по 0,25.

Фузидин– натрий – применяют для лечения туберкулеза, остеомиелита.

Рифампицины– рифампицин. Чаще используют для лечения туберкулеза, легионеллеза, хламидиоза.

Полимиксины – полимиксин Б и колистин. Действуют на синегнойную палочку. Высокотоксичны. ИХ ПРИМИНЕНИЕ ОГРАНИЧЕННО. ПРИМЕНЯЮТСЯ МЕСТНО.

Лекция №5.Тема: ***Сульфаниламидные препараты. Синтетические антибактериальные средства,***

Сульфаниламидные препараты.

Механизм действия – они нарушают синтез фолиевой кислоты в микробной клетке и тем самым оказывают бактериостатическое действие. Применяют при токсоплазмозе, конъюнктивитах, острых инфекциях мочевыводящих путей, кишечника, бронхов.

Препараты: *сульфадиазин* (сульфазин), *сульфаэтидол* (этазол), *сульфадимидин* (сульфадимезин) назначают внутрь 4-6 раз в сутки, *сульфадиметоксин* - 1 раз в сутки, *сульфален* – 1 раз в неделю. *Сульфацетамид* (сульфацил – натрий) – применяют в виде глазных капель при конъюнктивитах, блефаритах 4-6 раз в день.

Сульфакарбамид (уросульфан) – применяют при острых инфекциях мочевыводящих путей.

Фталилсульфатиазол (фталазол) и сульфагуанидин (сульгин) – назначают внутрь при кишечных инфекциях 4-6 раз в день.

*Триметоприм*и *пириметамин* (хлоридин) - по спектру действия сходны с сульфаниламидами.

В клинической практике широко применяют комбинированные препараты сульфаниламидов с триметопримом. Это *ко-тримоксазол* (бисептол, бактрим, гросептол). Ко-тримоксазол используют при инфекциях дыхательных путей, инфекциях почек, мочевыводящих путей, ЖКТ.

Сульфаниламиды противопоказаны при тяжелых заболеваниях кроветворных органов, при беременности, при повышенной чувствительности к сульфаниламиду.

Хинолоны – налидиксовая кислота (невиграмон), пипемидовая кислота (полин), оксолиновая кислота (грамурин) применяют при инфекциях мочевыводящих путей.

Фторхинолоны– офлоксацин, ципрофлоксацин, пефлоксацин (абактал), норфлоксацин (нолицин), ломефлоксацин, спарфлоксацин. По действию они напоминают антибактериальные препараты, кроме норфлоксацина, который избирательно действует на мочеполовую систему. Полифлоксацин применяют для лечения туберкулеза.

Нитрофураны(антисептики) – нитрофурантоин (фурадонин), фуразолидон используются для лечения инфекций мочевыводящих путей, ЖКТ, трихомониаза. Фурацилин (нитрофурал) используют внутрь при бактериальной дизентерии, местно в виде растворов и мазей для повязок.

Нитромидазолы– метронидазол (трихопол, флагил), тинидазол (фазижин), используют для лечения лямблиоза, амебной дизентирии и трихомониаза.

<u>Производные 8-оксихинолина:</u>

Нитроксолин (5-НОК) применяется, при инфекциях мочевыводящих путей.

Лекция №6.Тема: ***Противотуберкулёзные, противоспирохетозные, противопротозойные, противогрибковые, противоглистные, противовирусные, противоглистные средства.***

<u>Противотуберкулезные,противоспирохетозные, противопротозойные, противогрибковые средства.</u>

<u>Противотуберкулезные средства.</u>

Туберкулез – хроническое инфекционное заболевание, возбудителем которого является микробактерия туберкулеза, открытая Р. Кохом в 1882 году.

Различают противотуберкулёзные средства I и II ряда. К противотуберкулёзным средствам I ряда относят изониазид, рифампицин, этамбутол. При недостаточной эффективности средств I ряда дополнительно назначают средства IIряда: пиразинамид, стрептомицин, циклосерин, ломефлоксацин.

Под влиянием противотуберкулезных средств уменьшается интоксикация, нормализуется температура тела, уменьшается кашель.

<u>Противоспирохетозные средства.</u>

Инфекции, вызываемые спирохетами: сифилис, возвратный тиф и др.

Препараты для лечения сифилиса: бензилпенициллина натриевая соль, бициллины, макролиды, цефалоспорины. Используется также препараты висмута (бийохинол и бисмоверол) – это взвеси органических соединений висмута в персиковом масле. Вводят только в/м в комбинации с препаратами пенициллина.

<u>Противопротозойные средства.</u>

Простейшие (Protozoa) – это одноклеточные микроорганизмы, среди которых многие являются возбудителями различных заболеваний человека, например малярии, лямблиоза, амёбиоза и др.

Классификация противопротозойных средств:

- Противоамёбиозные: метронидазол, эметин, хлорохин, хиниофон (ятрен), тетрациклины.
- Противолямблиозные: метронидазол, фуразолидон,мепакрин (акрихин) .
- Противомалярийные: хинин, пириметамин (хлоридин), хингамин (хлорохин), примахин.
- Противотрихомонадозные: метронидазол, тинидазол, аминитрозол, фуразолидон.
- Противотоксоплазмозные: хлоридин, сульфадимезин, фансидар.
- Противолейшманиозные: солюсурьмин, мепакрин, мономицин.

Противогрибковые средства.

Возбудителями грибковых заболеваний (микозов) являются различные патогенные грибы.

Лечение дерматомикозов. Дерматомикозы – это грибковые поражения кожи, волос, ногтей: стригущий лишай, парша и грибковые заболевания стоп (эпидермофития). Лечение: амиказол, нитрофунгин, клотримазол, раствор йода, миконазол, резорцин, гризеофульвин.

Лечение кандидомикозов. Кандидомикозы чаще возникают при длительном назначении антибиотиков, особенно тетрациклинов. Характерно поражение слизистых оболочек рта, глотки, кишечника, бронхов. Лечение: нистатин, амфотерицин В, леворин.

Системные микозы – это поражение патогенными грибами внутренних органов, костей, мозга. Лечение: амфотерицин В и микогептин, миконазол, флуконазол.

Синтетические противогрибковые средства

Флуцитозин, миконазол, кетоконазол, клотримазол, эконазол, флуконазол, интраконазол, тербинафин, аморолфин.

Противовирусные средства.

Вирусы содержат в себе ДНК или РНК.

Классификация противовирусных препаратов:

1) При заболеваниях, вызванных ДНК – содержащими вирусами (герпесы и лишаи кожи и слизистых оболочек, оспа, гепатиты) используют ацикловир, валацикловир, ганцикловир, рибавирин.

2) При заболеваниях, вызванных РНК – содержащими вирусами (грипп, некоторые бронхопневмонии, адено-вирусные инфекции), назначают: мидантан, ремантадин, рибамидил, арбидол, оксомен.
3) При ретровирусных инфекциях (ВИЧ – инфекция, СПИД) показаны: зидофудин, диданозин, ламивудин, санквинавир, индинавир.
4) При всех вирусных заболеваниях показаны интерфероны.

Интерфероны– это группа соединений, которые вырабатываются клетками организма при воздействии на них вирусов, а также других веществ экзогенного и эндогенного происхождения. Интерфероны повышают устойчивость клеток в отношении вирусов. Они обладают также противоопухолевой и иммуномодулирующей активностью.

Для профилактики и лечения гриппа применяются ремантадин,амантадин, занамивир, осельтамивир, арбидол.

Для лечения СПИДа используются зидовудин, ставудин, диданозин. Они тормозят развитие болезни, но полного излечивания не дают. При этой патологии применяются также препараты интерферона, интерлейкина, пересадка костного мозга.

Ремантадин **-** назначают внутрь. Выпускается в таблетках. Принимается по схеме.

Интерферон **–** выпускается в ампулах в сухом виде. Применяют в виде свежеприготовленного раствора. Закапывают в носовые ходы.

Оксолин **–** применяют наружно в мазях и растворах для смазывания или закапывания глаз, носа.

Метисазон **–** назначают внутрь. Выпускается в таблетках.

Противоглистные средства

В организме человека гельминты могут паратизировать в просвете кишечника или вне кишечника (в печени, желчном пузыре, легких, кровеносных сосудах, подкожной клетчатке и .т.д.).

Все виды червей, паразитирующих в организме человека можно разделить на три класса:

1) Нематоды (круглые черви).
2) Цестоды (плоские черви).
3) Трематоды (сосальщики).

Противоглистные средства делятся на две группы:

1) Средства, применяемые при кишечных гельминтозах.
2) Средства, применяемые при внекишечных гельминтозах.

<u>Средства для лечения кишечных гельминтозов:</u>

Паразитирующие круглые черви: аскариды, острицы, власоглавы, анкилостомы и т.д. заболевания, вызванные круглыми червями, называются нематодозами.

<u>Препараты для изгнания круглых червей:</u>

Пиперазина адипинат – парализует нервно мышечный аппарат червей. Противопоказания: заболевания ЦНС, недостаточность функции почек.

Левамизол (декарис) – принимают однократно перед сном. Является также иммуномодулятором, т.е. улучшает работу именной системы.

Мебендазол – угнетает усвоение гельминтами глюкозы и тормозит образование АТФ.

Пирантел – применяют внутрь, противопоказан при беременности.

<u>Для изгнания ленточных червей используют</u>

Никлозамид (фенасал).

Празиквантел .

Лекция №7: <u>Вещества, влияющие на афферентную иннервацию.</u>

Эти вещества делятся на 2 группы:

1. Вещества, препятствующие восприятию или проведению импульсов чувствительным нервам (анестезирующие, обволакивающие и адсорбирующие средства).
2. Вещества возбуждающие или раздражающие чувствительные нервные окончания.

Местноанестезирующие средства.

Способны временно блокировать восприятия и проведение импульсов чувствительными нервами. Они широко используются для различных видов местной анестезии.

<u>Виды местной анестезии:</u>

- *<u>Поверхностная</u>*– достигается путем смазывания анестезирующим веществом слизистых оболочек глаз, носа, носоглотки. Используются в глазной практике, при операциях на слизистой оболочке носа, носоглотки, при ЭГДС.
- *<u>Проводниковая анестезия</u>* – введение анастетика непосредственно в нерв или окружающие его ткани. При этом вся область, иннервируемая данным нервом, теряет чувствительность.

Разновидностью является спинномозговая анестезия. Она делается в области L1-L2-L3 поясничного отдела позвоночника. При этом наступает анестезия нижней половины туловища и нижних конечностей.

- *Инфильтрационная анестезия – достигается путем введения большого объема анастетика в ткани того учатска, где предполагается делать операцию. Используется при многих хирургических операциях.*

Требования, предъявляемые к анастезирующему веществу:

1. Оно должно обладать высокой анестезирующей активностью и действовать достаточно долго.
2. Не раздражать ткани и не оказывать токсического действия на организм.
3. Обладать хорошей растворимостью в воде и не разрушаться при стерилизации.
4. Вызывать сужение кровеносных сосудов или быть совместимым с сосудосуживающими средствами.

Кокаин – был первым анестетиком. Имеет токсическое действие. При отравлении кокаином смерть наступает от паралича дыхательного центра.

Бензокаин (анестезин) – не растворим в воде, поэтому применяется в виде мазей, паст, присыпок, а также в суппозиториях.

Прокаин (новокаин) – низкотоксичен. Используются растворы в концентрации 1,25мг/мл-5мг/мл для инфильтрационной анестезии, растворы в концентрации 10-20мг/мл для проводниковой анестезии, растворы в концентрации 20-50 мг/мл для спинномозговой анестезии.

Тетракаин (дикаин) – сильнее и токсичнее прокаина. Используют только для поверхностной анестезии.

Лидокаин (ксикаин) – используется для всех видов анестезии растворы в концентрации 1,23 мг/мл-2,5 мг/мл-5 мг/мл-10 мг/мл-20 мг/мл-50 мг/мл.

Тримекаин – используется для всех видов анестезии.

Артикаин – используется для всех видов анестезии. Входит в состав препаратов «Ультракоин Д-С», «Ультркоин Д-С форте» с эпинефрином.

Бупивакаин – используется для местной анестезии.

Вяжущие средства.

Их относят к противовоспалительным препаратам местного действия. Их применяют при лечении воспалительных процессов слизистых оболочек и кожи. На месте их нанесения возникает частичная коагуляция белков внеклеточной жидкости, слизи, экссудата. При этом образуется пленка,

которая предохраняет окончания чувствительных нервов от раздражения и чувства боли ослабевает.

Вяжущие вещества подразделяются на 2 группы:

- *Органические*(танин, отвар коры дуба)
- *Неорганические* (свинца ацетат, висмута нитрат основной, квасцы, цинка окись, цинка сльфат, меди сульфат, серебра нитрат).

Органические вяжущие средства

Танин – используют водные и глицериновые растворы для полосканий при стоматитах, гингивитах, фарингитах (1-2% растворы), 3-10% растворы и мази при лечении ожогов, язв, трещин, пролежней. При отравлении солями тяжелых металлов используют 0,5% водный раствор для промывания желудка. Препараты Танина: танальбин, тансал применяются при острых и подострых энтеритах и колитах.

*Кора дуба,листья шалфея, цветы ромашки, плоды черники,трава зверобоя*применяют в виде отваров и настоевпри воспалительных заболеваниях слизистой зева, рта, гортани.

Неорганические вяжущие средства:

Висмута нитрата основной (висмута субнитрат)– обладает вяжущим, слабым антисептическим, закрепляющим свойством.

Применяют при болезни желудка и 12п. кишки, энтеритах, колитах. Входит в состав таблеток «Викалин», «Викаир». Наружно назначают в мазях и присыпках при воспалительных заболеваниях кожи и слизистых оболочек.

*Висмута субгаллат (дерматол), трибромфенолята висмута и висмута оксида комплекс (ксероформ), квасцы,цинка сульфат**,** серебранитрат* в небольших концентрациях обладает вяжущим действием, а в больших концентрациях – прижигающим действием.

Обволакивающие средства

Образую в воде коллоидные растворы – слизи, которые покрывают слизистые оболочки, защищая их от действия раздражающих веществ. Для лечения используют крахмальную слизь, слизь семян льна, некоторые органические и неорганические в-ва, которые могут образовывать коллоидные растворы.

Альмагель – комбинированный препарат из геля алюминия гидрооксия, магния окиси с добавлением Д-сорбита.

Обволакивающие средства назначают при воспалительных процессах и язвенных заболеваниях ЖКТ, при отравление кислотами, щелочами и едкими жидкостями. Из пищевых средств обволакивающими свойствами обладают молоко, раствор яичного белка, отвар овсяной крупы.

Адсорбирующие средства

Относятся вещества, обладающие высокой адсорбирующей активностью. Они удерживают на своей поверхности химические соединения и тем самым предохраняют окончания чувствительных нервов от их раздражающего действия. Сюда относятся полисорб, полифепан, альгисорб, энтеросгель, уголь активированный, порошок белой глины, «Смекта».

Раздражающие средства

Оказывают избирательное возбуждающее влияние на окончания чувствительных нервов кожи или слизистых оболочек и не повреждают окружающие ткани. К ним относятся раствор аммиака, горчичное эфирное масло, спирт этиловый (этанол), ментол, мазь „Финалгон", перцовый пластырь.

Горчичники – используются при воспалениb дыхательных путей или легких, накладывая на грудную клетку. Раздражение определенных участков кожи благоприятно сказывается на течении патологического процесса (уменьшается боль и воспалительная реакция в тех органах, которые имеют иннервацию, сопряженную с данным участком кожи).

При избирательном раздражении холодовых рецепторов полости рта рефлекторно расширяются коронарные сосуды сердца. Таким свойством обладает ментол, который входит в состав «валидола» для снятия приступов стенокардии.

Нашатырный спирт– при вдохе его паров при обмороках раздражаются рецепторы верхних дыхательных путей, происходит рефлекторное возбуждение ЦНС и восстанавливается сознание.

Масло терпентинное очищенное – используется также для отвлекающего эффекта. Применяется в мазях и линиментах.

К раздражающим средствам относят такжегоречи: настойка полыни, настойка горькая; рвотные и отхаркивающие средства: апоморфина гидрохлорид, трава термопсиса, амброксол, ацетилцистеин, калия йодид; желчегонные средства: аллохол, холосас. Слабительные средства: магния сульфат, масло касторовое, сенаде, экстакт крушины жидкий, бисакодил.

Требования к хранению лекарственных препаратов

1.Для хранения лекарственных препаратов и изделий медицинского назначения необходимо иметь приспособленные помещения:

а) помещения для хранения лекарственных препаратов;

б)помещения для хранения лекарственных препаратов;

в)помещения для хранения изделий медицинского назначения:

г)должны выполняться условия хранения лекарственных препаратов, требующих защиты от света, термолабильных лекарственных препаратов, легковоспламеняющихся веществ, сильнодействующих и ядовитых веществ (идентифицированные шкафы , стелажи для хранения отдельных групп лекарственных препаратов , кондиционеры, холодильники для хранения термолабильных препаратов) .

д) хранение лекарственных препаратов должно быть систематизировано по фармакологическим группам и способу применения:

наличие стелажных карт, должен быть организован контроль за сроками годности лекарственных препаратов на бумажном носителе, должна быть организована работа по выявлению, принятию мер и направлению информации в контролирующие органы по забракованным фальсифицированным лекарственным препаратам и изделиям медицинского назначения.

2.порядок распределения лекарственных препаратов в отделения :

а) приказ на ответственное лицо;

б)оформление накладных –требований(на латинском языке, наличие указаний на дозировку фасовку, количество экземпляров).

в) оформление журналов учета (в соответствии с приказом Минздрава СССР №747 от 2.06.1987г ,, Об утверждении инструкции по учету медикаментов, перевязочных средств и изделий медицинского назначения в лечебно – профилактических учреждениях’’).

Лекция № 8. Тема: Эфферентная иннервация. М- холиномиметики

Эфферентная иннервация состоит из двигательных нервных волокон (они иннервируют скелетные мышцы) и вегетативных нервов, иннервирующих внутренние органы, кровеносные сосуды, железы. Двигательные нервные волокна представляют собой длинные отростки двигательных нервных клеток, которые расположены в головном и спинном мозге. Возбуждение двигательных волокон в центральной нервной системе передается по нервным волокнам к скелетным мышцам и вызывает их сокращение. Вегетативную иннервацию делят на парасимпатическую и симпатическую. Она иннервирует внутренние органы и железы. В симпатической иннервации

медиатор – норадреналин. Он выделяется постганглионарными симпатическими волокнами. То есть, с помощью норадреналина передается возбуждение с симпатических нервных волокон на клетки органов и тканей. Поэтому симпатическую иннервацию называют также адренергической. Симпатические нервные волокна берут начало от специальных клеток грудного и поясничного отделов спинного мозга и оканчиваются в симпатических ганглиях (они расположены вне иннервируемых органов). В ганглиях берут начало постганглирнарные симпатические волокна, которые оканчиваются в исполнительных органах.

В парасимпатической иннервации медиатором является ацетилхолин. Благодаря ацетилхолину в парасимпатической иннервации возбуждение передается в вегетативных ганглиях, нервно - мышечных синапсах и в синапсах постганглионарных парасимпатических волокон. Ее также называютхолинергической.Парасимпатические нервные волокна берут начало от специальных клеток стволовой части головного мозга и от клеток крестцовой части спинного мозга и оканчиваются в парасимпатических ганглиях, расположенных в иннервируемых органах или около них. Из ганглиев постганглионарные волокна оканчиваются на клетках иннервируемых органов. Симпатические и парасимпатические волокна изменяют функцию органов в противоположных направлениях.

При возбуждении симпатической нервной системы наблюдаются: тахикардия, сужение сосудов, повышение АД, расширение зрачков, снижение тонуса мышц бронхов, ослабление перистальтики ЖКТ, ослабление секреции желез: слюнных, бронхиальных, желез ЖКТ.

При возбуждении парасимпатической нервной системы наблюдаются: брадикардия, расширение сосудов, понижение АД, сужение зрачков, повышение тонуса мышц бронхов, усиление перистальтики ЖКТ, значительное усиление секреции желез (слюнных, бронхиальных, желез ЖКТ).

Контакты между окончаниями нервных волокон и клетками органов, тканей называются синапсами.

Во всех синапсах эфферентной иннервации возбуждение передается с помощью химических веществ – медиаторов. Медиаторы выделяются окончаниями нервных волокон и воздействуют на рецепторы клеток. Действие медиаторов кратковременное. Следующее возбуждение нервных волокон вызывает выделение новой порции медиатора. Основные медиаторы для проведения импульсов - это ацетилхолин и норадреналин. Процесс в синапсе:

1.импульс доходит до пузырька

2.медиатор высвобождается из пузырька

3. медиатор проходит через пресинаптическую мембрану

4.медиатор поступает в синаптическую щель

5.медиатор воздействует на чувствительные участки постсинаптической мембраны

6.затем медиатор разрушается или подвергается обратному захвату пузырьками.

Фармакологические вещества могут воздействовать в синапсе на все вышеперечисленные этапы передачи импульса.
Рецепторы, чувствительны к мускарину (яду мухомора) называются мускариночувствительными (М-холинорецепторами). Рецепторы, чувствительные к никотину, называются никотиночувствительными (Н-холинорецепторами). Синапсы, в которых медиатором является ацетилхолин называют холинергическими или холинорецепторами. Синапсы, в которых роль медиатора выполняет норадреналин, называют адренергическими синапсами, а рецепторы – адренорецепторами. Выделяют две большие группы лекарственных веществ:

1.ЛВ, действующие в области холинергических синапсов.
2.ЛВ, действующие в области адренергических синапсов.
Холиномиметики – лекарственные вещества, возбуждающие холинорецепторы.
Холиноблокаторы (холинолитики)– лекарственные вещества, блокирующие холинорецепторы.
Различают :
1.М – холиномиметики
2.Н – холиномиметики
3.М -,Н – холиномиметики
4.Антихолинэстеразные средства –это вещества, блокирующие ацетилхолинэстеразу (фермент, который разрушает ацетилхолин) и удлинняют действие ацетилхолина.
5.М – холиноблокаторы
6.Н – холиноблокаторы
7.М -, Н -холиноблокаторы

М – холиномиметические вещества

возбуждают М- холинорецепторы клеток тканей и органов. При этом наступают явления, как при возбуждении парасимпатической нервной системы: уменьшается частота сердечных сокращений (брадикардия), расширяются кровеносные сосуды, снижается артериальное давление, суживаются зрачки, повышается тонус гладких мышц бронхов, усиливается перистальтика желудочно-кишечного тракта, усиливается секреция желез ЖКТ, слюнных, бронхиальных желез.

Наиболее часто используют препараты: пилокарпин и ацеклидин.

Пилокарпин - алкалоид из растений Южной Америки. Также получен синтетически. Суживает зрачок, понижает внутриглазное давление, улучшает питание тканей глаза. Повышает тонус гладких мышц кишечника, желчного и мочевого пузыря, матки, бронхов. Усиливает секрецию пищеварительных, бронхиальных и потовых желез. Применяют в виде глазных капель, мази, пленки, в таблетках. Входит в состав глазных капель “Фотил “.

Ацеклидин –синтетический препарат. Применяется для лечения атонии мускулатуры ЖКТ, мочевого пузыря, матки, для понижения внутриглазного давления при глаукоме.

Цевимелин – применяется для лечения ксеростомии (сухости полости рта).

Противопоказания.

Бронхиальная астма, стенокардия, желудочно-кишечные кровотечения, эпилепсия, беременность.

Клиническая картина при отравлении М-холиномиметиками.

(в том числе мускарином, содержащемся в мухоморах)

Наблюдается значительное урежение сердечных сокращений, падение АД, сужение зрачков, сильное слюнотечение, рвота, понос.

Помощь: назначить М – холиноблокаторы: атропин, скополамин

Лекция № 9. Тема: Эфферентная иннервация. Н- холиномиметики.

М-, Н-холиномиметики. Антихолинестеразные вещества

Н – холиномиметические вещества

Это вещества, возбуждающие Н – холинорецепторы (никотиночувствительные холинорецепторы). Н - холинорецепторы находятся в нервных клетках симпатических и парасимпатических ганглиев, в синокаротидной зоне, в клетках мозгового вещества надпочечников и в нервно – мышечных синапсах (т.е. в клетках скелетных мышц) и в ЦНС.В связи с разной чувствительностью Н – холинорецепторов к фармакологическим веществам их можно разделить на рецепторы двух видов:

1.рецепторы вегетативных ганглиев, синокаротидной зоны и мозгового вещества надпочечников;При этом возбуждаются дыхательный и сосудодвигательный центры продолговатого мозга, происходит выделение адреналина из надпочечников, он суживает просвет сосудов, повышается АД.

2.рецепторы нервно – мышечных синапсов;

Никотин – алкалоид листьев табака. Влияет на периферические и центральные Н – холинорецепторы, влияет на ЦНС. ***При остром отравлении*** никотином наблюдаются гиперсаливация, тошнота, рвота, понос. Появляется брадикардия, которая сменяется тахикардией. АД повышается, появляется одышка , которая сменяется угнетением дыхания. Бывают расстройства зрения, слуха и даже судороги.

Постоянным эффектом никотина является его сосудосуживающее действие. Поэтому никотин способствует развитию гипертонической болезни, суживает сосуды сердца, это приводит к стенокардии, инфаркту миокарда, облитерирующему атеросклерозу сосудов нижних конечностей.

В табачном дыме содержится более трех сот вредных веществ. В частности в табачном дыме содержится радиоактивное вещество полоний 210, производные бензпирена. Эти вещества обладают раздражающим и канцерогенным действием на бронхи и легкие.

Цититон – получают из цитизина, алкалоида травы термопсис. Используют при рефлекторной остановке дыхания, угнетении дыхания и кровообращения. Вводят внутривено медленно, предварительно растворив в изотоническом растворе NaCl (9мг/мл).

Лобелин – алкалоид североамериканского растения лобелии.

Лобелина гидрохлорид – вводят раствор внутривенно медленно по 0,3 – 0,5мл, предварительно растворив в изотоническом растворе NaCl (концентрация NaCl 9мг/мл).

Механизм действия лобелина и цититона– при внутривенном введении они раздражают Н – холинорецепторы синокаротидной зоны, при этом рефлекторно возбуждается дыхательный центр и дыхание становится более глубоким и частым. Одновременно возбуждается и сосудодвигательный центр, что приводит к повышению АД. Для облегчения отвыкания от курения табака используют таблетки “Табекс”, где содержится цитизин; таблетки “Лобесил”,где содержится лобелин.

NB.(обрати внимание) Так как цититон и лобелин возбуждают дыхательный центр в основном рефлекторно, их стимулирующее действие на дыхание проявляется лишь в том случае, когда рефлекторная возбудимость дыхательного центра не нарушена. Но при угнетении дыхания веществами, блокирующими его рефлекторную возбудимость (например, средствами для наркоза, снотворными, наркотическими средствами) лобелин и цититон как стимуляторы дыхания неэффективны.

М -, Н -, холиномиметики

Ацетилхолин – медиатор. Он одновременно возбуждает парасимпатическую и симпатическую нервную систему. При этом преобладает его действие на парасимпатическую нервную систему. Поэтому ацетилхолин вызывает брадикардию, снижение АД, повышение тонуса мышц бронхов и внутренних органов, увеличение секреции желез. Если блокировать парасимпатическую нервную систему, то проявится действие ацетилхолина на симпатическую иннервацию.

Карбахолин – синтетический препарат. Действие, как у ацетилхолина. Применяют при атонии кишечника, мочевого пузыря, иногда при глаукоме. Используют в виде таблеток внутрь по 0,0005 – 0,001 2 -3 раза в день, подкожно и внутримышечно раствор в концентрации 0,1мг/мл – 0,25мг/мл по 1 мл в ампуле, глазные капли 0,5% раствор.

Антихолинэстеразные вещества.

Они блокируют ацетилхолинэстеразу – фермент, разрушающий ацетилхолин.Если этот фермент блокируется, то действие ацетилхолина удлиняется или усиливается, наступают: брадикардия, снижение АД, сужение зрачков, повышение тонуса гладкой мускулатуры внутренних органов(ЖКТ, бронхов, мочевого пузыря),значительно повышает тонус скелетных мышц.

Различают 2 группы антихолинэстеразных веществ:

1.обратимого действия, когда через несколько часов после их введения в организм активность ацетилхолинэстеразы полностью восстанавливается.

2.вещества необратимого действия.

К первой группе относятся:

Физостигмин – используется раствор в концентрации 1мг/мл подкожно, в виде глазных капель, глазной мази.

Неостигмина метилсульфат (прозерин)—применяют при атонии мочевого пузыря, кишечника, особенно в послеоперационном периоде, миастении, для лечения глаукомы.

Пиридостигмина бромид – по действию сходен с прозерином. Применяют при миастении.

Галантамин—действие продолжительнее, чем у неостигмина. Применяют при атонии кишечника, мочевого пузыря, при миастении.

Ривастигмин—выпускают в капсулах, применяют внутрь для симптоматического лечения болезни Альцгеймера.

2.Вторую группу антихолинэстеразных веществ составляют фосфорорганические соединения, которые обладают высокой активностью и высокой токсичностью (лекарственный препарат ***армин***, применяющийся при глаукоме; инсектициды ***хлорофос,карбофос***, ***пирофос*** и боевые отравляющие вещества: ***табун,зорин***, ***заман***).

Клиническая картина при отравлении антихолинэстеразными веществами: затруднение дыхания из-за бронхоспазма и усиления секреции бронхиальных желез, брадикардия, падение АД, сильное слюнотечение, рвота, понос, сужение зрачков.

Первая помощь: ввести М – холиноблокаторы: раствор атропина в концентрации 1мг/мл подкожно, дипироксим (тримедоксима бромид) и изонитрозин, дача кислорода и ИВЛ. При попадании ФОС на кожу нужно вытереть её сухим тампоном, затем вымыть 5-6% раствором натрия гидрокарбоната и тёплой водой с мылом.

Лекция № 10. Тема: М- холиноблокаторы

Воздействуя на М - холинорецепторы, блокируют влияние парасимпатической нервной системы на внутренние органы, железы. Они учащают сердечные сокращения, облегчают предсердно-желудочковую проводимость, расширяют зрачки, снижают тонус гладких мышц бронхов, ЖКТ, мочевого пузыря и других внутренних органов, уменьшают секрецию желез. К М - холиноблокаторам относятся :атропин,скополамин,платифиллин, ипратропия бромид, тропикамид, пирензепин.

Атропин– *алкалоид, содержащийся в красавке, дурмане, белене.* Фармакологический эффектатропина:

1-блокирует тормозящее влияние на сердце со стороны блуждающих нервов, поэтому он вызывает учащение сердечных сокращений. Используют в кардиологии при предсердно-желудочковой блокаде. Используется в премедикации при хирургических операциях для предупреждения рефлекторной брадикардии, а также для уменьшения избыточной секреции слюнных и бронхиальных желез.

2-расслабляет круговую мышцу радужной оболочки глаза. При этом расширяется зрачок, повышается внутриглазное давление. Поэтому он строго противопоказан при глаукоме.

3 – вызывает расслабление гладких мышц внутренних органов, поэтому используется для устранения спазмов кишечника, желчевыводящих путей, мочевыводящих путей (кишечная колика, печеночная колика, почечная колика).

4 - вызывает расслабление гладких мышц бронхов. Используется при бронхиальной астме для профилактики и купирования (прекращения) приступов удушья, для уменьшения секреции соляной кислоты при язве желудка и 12-перстной кишки.

Клиническая картина при отравлении атропином: у пострадавшего психическое и двигательное возбуждение, расширенные зрачки, нарушение зрения, хриплый голос, нарушение глотания, тахикардия, сухость и покраснение кожи (возможно повышение температуры тела, особенно у детей), головная боль, нарушение координации, нарушение мочеиспускания. При нарастании интоксикации возможны бред ,

галлюцинации, судороги. У пострадавшего наступает кома. Смерть наступает от паралича дыхательного центра. Помощь: промывание желудка слабо розовым раствором калия перманганата, раствором танина или крепкого чая. Внутрь назначают адсорбирующие вещества (полисорб, альгисорб, энтеросгель, активированный уголь), солевые слабительные. При остановке дыхания проводят ИВЛ. Для удаления яда из крови применяют гемосорбцию, форсированный диурез.

Из других средств, содержащих атропин, иногда используют препараты белладонны (красавки) – настойку и экстракты (сухой и густой).

Скополамин- алкалоид красавки, белены, дурмана. Действие с атропином сходное, но в отличии от него оказывает на ЦНС угнетающее влияние, оказывая успокаивающее действие. Назначают при головокружениях, нарушении равновесия. Входит в состав таблеток ,,Аэрон", которые назначают при морской и воздушной болезни (укачивание). Применяют для лечения паркинсонизма, в глазной практике. Также могут применять перед наркозом для предупреждения рефлекторной брадикардии и уменьшения секреции слюнных и бронхиальных желез, а также в качестве спазмолитического средства.

Платифиллин – алкалоид крестовника. Расширяет кровеносные сосуды и немного снижает АД. Назначают при бронхиальной астме, язвенной болезни желудка и 12 перстной кишки, для расширения зрачка. Применяется в порошках, таблетках, каплях, растворах в ампулах для подкожного введения.

Ипратропия бромид – (атровент) и тиотропия бромид, бронхолитик в аэрозольных баллонах по 15мл.

Тропикамид – применяют в офтальмологии для исследования глазного дна в виде капель. Длительность действия 2-4 часа.

Пирензепин(гастроцепин) применяется при заболеваниях желудка. Снижает секрецию соляной кислоты. Выпускается в таблетках и в виде раствора в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения.

Лекция № 11. Тема: Н- холиноблокаторы. М-, Н – холиноблокаторы

Н- холиноблокаторы (Н-холинолитики)

Эти ЛВ делятся на две группы :

1.Вещества, блокирующие Н-холинорецепторы вегетативных ганглиев, синокаротидной зоны и мозгового вещества надпочечников, называются ганглиоблокирующими веществами (ганглиоблокаторы).

давления при переходе их горизонтального положения в вертикальное).

2.Вещества, блокирующие Н-холинорецепторы нервно-мышечных синапсов, называются курареподобными веществами или миорелаксантами периферического действия.

Ганглиоблокаторы - уменьшают стимулирующее влияние симпатической иннервации на сердце и кровеносные сосуды. Как результат этого действия снижается артериальное и венозное давление. Их используют при гипертонических кризах, при лечении облитерирующего эдартериита (это заболевание при котором развивается сужение сосудов нижних конечностей. Препараты: ***гексаметония бензосульфонат***(бензогексоний) или ***азаметония бромид*** (пентамин). После введения ганглиоблокаторов больным рекомендуют лежать в постели не менее 1,5-2 часа, так как возможна ортостатическая гипотензия (резкое падение артериального давления).

Курареподобные средства **-** блокируют нервно-мышечные синапсы, воздействуя на рецепторы скелетных мышц, и вызывают расслабление этих мышц. Кураре – один из видов стрельного яда. Индейцы Южной Америки смазывали этим ядом наконечники своих охотничьих стрел. Попадая в организм животного, кураре вызывает паралич скелетных мышц, и животное теряет способность двигаться (мясо таких животных годится в пищу, т.к. кураре плохо всасывается в ЖКТ). Кураре содержит значительное число различных алкалоидов; одним из основных является **тубокурарин**. По механизму действия различают две группы: ***антидеполяризующие*** и ***деполяризующие***. Кураре вызывают паралич скелетных мышц: вначале мимической мускулатуры лица, мышц конечностей, голосовых связок, туловища, диафрагмы и межреберных мышц. Наступает остановка дыхания.

Антидеполяризующие курареподобные вещества

Тубокурарина – хлорид – продолжительность действия 20 – 40 минут. Из современных препаратов - ***векурония бромид***, ***пипекурония бромид***,***атракурия безилат***.Соединяясь с холинорецепторами, препятствуют воздействию на них ацетилхолина. Для прекращения действия курареподобных веществ конкурентного действия используют антихолинэстеразные вещества – неостигмина метилсульфат (прозерин).

Курареподобные вещества деполяризующего действия

Наиболее широко применяется ***суксаметония йодид (дитилин)*** и ***суксаметония хлорид (листенон)***.Сначала он действует как ацетилхолин (вызывает стойкую деполяризацию мембраны клеток, что сопровождается сокращением мышечных волокон,), после этого наступает расслабление скелетных мышц.Но ,в отличии от ацетилхолина, дитилин разрушается не ацетилхолинэстеразой, а ложной холинэстеразой, содержащейся в плазме крови. Миорелаксация продолжается до тех пор, пока дитилин не разрушится ложной холинэстеразой.Прекратить действие дитилина можно путем переливания свежей крови.

Миорелаксанты применяют при хирургических операциях для расслабления скелетных мышц, при вправлении вывихов, при переломах для репозиции костных отломков. При лечении столбняка, отравлении стрихнином миорелаксанты вызывают расслабление мышц при судорогах.

М - , Н- холиноблокаторы

Способны блокировать М-,Н-холинорецепторы центральной нервной системы.

Циклодол - используется при лечении болезни Паркинсона и сходных состояний [паркинсонизм].

Лекция № 12. Тема:Вещества, влияющие на передачу импульсов в адренергических синапсах.

Адреномиметики. Симпатомиметики.

Симпатические постганглионарные волокна являются адренергическими: их окончания выделяют в качестве медиатора норадреналин. Медиатор возбуждает рецепторы клеток органов и тканей у окончаний адренергических волокон. Эти рецепторы называются адренорецепторами. Норадреналин образуется в адренергических нервных окончаниях из аминокислоты тирозин. Схема образования норадреналина:

Тирозин – ***диоксифенилаланин***(ДОФА) – ***дофамин*** – ***норадреналин***. Норадреналин депонируется в везикулах аксонов (везикулы – пузырьки). Под влиянием нервных импульсов норадреналин выделяется из везикул и, попадая в синаптическое пространство, воздействует на адренорецепторы постсинаптической мембраны эффекторной клетки. Действие его кратковременное. Затем он частично инактивируется специальными ферментами, частично подвергается обратному захвату нервными окончаниями.

Различают α_1 **-**, α_2 **- *адренорецепторы*** и β_1 **- ,** β_2 **- ,** β_3 **– *адренорецепторы.***

α – адренорецепторы находятся в сосудах кожи, почек, кишечника, сфинктерах ЖКТ, селезенке, радиальной мышце радужки глаза.

β_1 **- *адренорецепторы*** находятся в мышцах сердца, при их возбуждении усиливаются и учащаются сердечные сокращения, облегчается проведение импульсов от предсердий к желудочкам, повышается автоматизм сердца.

β_2 **- *адренорецепторы*** находятся в кровеносных сосудах и бронхах , при их возбуждении происходит расширение сосудов, расслабление бронхиальных мышц.

β_3 **- *адренорецепторы*** находятся в жировых клетках. При стимуляции этих клеток активируется липолиз.

При возбуждении α – адренорецепторов происходит сужениекровеносных сосудов (в основном сосудов кожи, слизистых оболочек, почек).

Вещества, облегчающие передачу возбуждения в адренергических синапсах, называются ***адреномиметики*** и ***симпатомиметики***. Вещества, угнетающие адренергическую передачу возбуждения, называются ***адреноблокаторы*** и ***симпатолитики***.

Различают три группы ***адреномиметиков***:

1 α – адреномиметики
2 β – адреномиметики
3 α и β адреномиметики

Альфа адреномиметики

Фенилэфрин, ***нафазолин*** – обладают способностью суживать кровеносные сосуды.

Фенилэфрин (мезатон) – суживает кровеносные сосуды, при этом повышается АД. Вводят подкожно, внутримышечно, внутривенно, а также назначают внутрь. Применяют при снижении АД, иногда при ринитах в виде капель в нос. Противопоказан при гипертонической болезни, атеросклерозе, спазме сосудов.

Нафазолин (нафтизин) – в виде раствора, ***эмульсия нафазолина*** (санорин), ***ксилометазолин*** (галазолин), ***оксиметазолин***(назол) применяются только местно при ринитах. При закапывании этих лекарств сужаются сосуды слизистой оболочки и уменьшается воспалительная реакция.

Клонидин (клофелин) и ***гуанфацин*** (эстулик) – препараты для снижения АД. Они действуют на α_2- рецепторы, находящиеся в продолговатом мозге.

Бета - адреномиметики

При возбуждении β_1 – адренорецепторов (находятся в основном в сердце) усиливаются и учащаются сердечные сокращения, облегчается проведение импульсов от предсердий к желудочкам. При возбуждении β_2 – адренорецепторов расслабляются гладкие мышцы бронхов, снижаются тонус и сократительная активность миометрия.

Препараты:

β_1 – адреномиметики:Добутамин - Увеличивает силу и частоту сердечных сокращений. Применяют как кардиотоническое средство при острой сердечной недостаточности.

β_2 – адреномиметики:

Сальбутамол (вентолин), ***фенотерол*** (беротек, партусистен), ***кленбутерол***, ***салметерол***, ***формотерол***. Применяют для купирования приступов бронхиальной астмы, в основном ингаляционно, а также для прекращения преждевременной родовой деятельности.

β_1 –, β_2 - адреномиметики:

Изопреналин (изадрин) - применяют при бронхиальной астме, эмфиземе легких, пневмосклерозе, при атриовентрикулярной (предсердножелудочковой) блокаде. Выпускают растворы для ингаляций и таблетки под язык.

Альфа- и бета- адреномиметики

К этой группе относятся:

Адреналин – гормон мозгового слоя надпочечников и препараты:

Норэпинефрина гидротартрат– по химическому строению и биологическому действию соответствует естественному ***норадреналину*** – медиатору. Используют при остром снижении АД, которое возможно при травмах, хирургических вмешательствах, отравлениях, кардиогенном шоке. Противопоказан при атеросклерозе, гипертонической болезни. Его нельзя вводить ***внутримышечно*** и ***подкожно***, так каквызывает сильный спазм сосудов в месте введения, а это может привести к некрозу ткани в месте введения. Вводится внутривенно капельно.

Эпинефрин (адреналин) – синтетический аналог ***натурального адреналина***. Под его влиянием учащаются сокращения сердца, улучшается атриовентрикулярная проводимость, суживаются периферические сосуды, повышается АД, расслабляются гладкие мышцы бронхов. Применяют для прекращения приступов бронхиальной астмы, для стимуляции сердечной деятельности и повышения АД. Добавление эпинефрина (адреналина) к растворам местных анестетиков задерживает их всасывание в кровь и, тем самым, удлиняет анестезирующий эффект. Вводят внутривенно. Противопоказан при гипертонической болезни, склерозе сосудов, недостаточности коронарного кровообращения, беременности.

Симпатомиметики

Эфедрин–алкалоид травянистого растения эфедры. Оказывает сходное с адреналином действие на организм, но менее активен, чем адреналин. Непосредственно на адренорецепторы он влияет мало. Он способствует высвобождению из пресинаптических окончаний норадреналина и поэтому усиливает адренергические реакции. Стимулирует ЦНС, в частности дыхательный и сосудодвигательный центры, расслабляет мышцы бронхов. Обладает умеренным психостимулирующим действием. Назначают внутрь, парентерально и местно. Противопоказан при артериальной гипертензии, атеросклерозе, тяжелых органических поражениях сердца, нарушениях сна.

Может вызвать лекарственную зависимость. **Симпатомиметики называют также адреномиметиками непрямого действия.**

Лекция № 13. Тема: Адреноблокаторы. Симпатолитики.

Адреноблокаторы – это вещества, блокирующие адренорецепторы.

Различают α – адреноблокаторы, β - адреноблокаторы и α –, β - адреноблокаторы.

α – адреноблокаторы – применяют при облитерирующем эндартериите для расширения сосудов нижних конечностей.

Празозин, ***теразозин***, ***доксазозин*** – снижают артериальное давление.

Тамсулозин (омник) – расслабляет гладкие мышцы шейки мочевого пузыря и простатической части уретры. На артериальное давление не влияет.

Фентоламин – снижает артериальное давление,оказывает выраженное гипотензивное действие при феохромоцитоме (опухоль мозгового вещества надпочечников, выделяющая в кровь избыточное количество адреналина и норадреналина).

Бета – адреноблокаторы

Различают неселективные и селективные.

Неселективныебета – адреноблокаторы

Пропранолол (анаприлин, обзидан), ***сотагексал,***

Надолол – блокируют β - 1 адренорецепторы сердца, урежая частоту сердечных сокращений и блокируют β - 2 адренорецепторы бронхов, вызывая спазм бронхов. Противопоказаны при сердечной недостаточности и при бронхиальной астме.

Тимолол – применяют в каплях при глаукоме для уменьшения продукции внутриглазной жидкости.

Кардиоселективныебета – адреноблокаторы

B_1 - адреноблокаторы:

талинолол [корданум], ***атенолол,метопролол***, ***бетаксолол***, ***небивалол***, ***пиндолол***. Применяют при нарушениях сердечного ритма, артериальной гипертензии

α -, β - адреноблокаторы:

карведилол, ***лабеталол*** – обладают низкой селективностью к бета-1-, 2-адренорецепторам, но с сочетанной блокадой альфа – адренорецепторов.

Применяют при стенокардии, нарушениях сердечного ритма, гипертонической болезни.

Симпатолитики

Ограничивают выход медиатора из окончаний симпатических нервов, вызывает постепенное истощение запасов медиатора норадреналина в окончаниях симпатических нервов. Это приводит к снижению тонуса симпатической нервной системы.

Резерпин – алкалоид раувольфии. Хорошо проникает через гематоэнцефалический барьер. Уменьшает содержание норадреналина в ЦНС, что ведёт к понижению возбудимости в ЦНС. Применяют как успокаивающее (транквилизирующее) и нейролептическое средство, при гипертонической болезни.

Гуанетидин (октадин) –действие то же. Выпускаются в таблетках.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и 12 п. кишки, выраженный атеросклероз, недостаточность функции почек.

Раунатин - действие то же.

Орнид (бретилий) – чаще применяется при аритмиях, реже при гипертоническом кризе. Выпускают раствор в концентрации 50мг/мл в ампулах по 1мл.

Дофаминэргические средства

Дофамин является предшественником норэпинефрина (смотри схему).Существует два типа дофаминовых рецепторов: Д-1 и Д-2 . Они расположены в эндокринных железах, сосудах почек, чревной области, коронарных сосудах, сосудах конечностей и т.д.

Допамин (дофамин) - повышает силу сердечных сокращений и уровень АД, увеличивает сердечный выброс, увеличивает в почках кровоток, увеличивает диурез.

Показания – шок различной этиологии, острая сердечно-сосудистая недостаточность, операции на сердце .Выпускают растворы в ампулах для внутривенного введения.

Метилдофа – выпускается в таблетках по 0,25. Применяется при гипертонической болезни.

Бромокриптин (парлодел) – полусинтетическое производное алкалоида спорыньи- эргокриптина.Применяют в акушерстве для подавления послеродовой лактации, при лечении акромегалии, болезни Иценко – Кушинга и паркинсонизма. Выпускается в таблетках.

Метоклопрамид (церукал) – противорвотное средство центрального действия. Он также регулирует функцию ЖКТ и способствует заживлению язвы желудка и 12 п. кишки. Выпускается в таблетках для приема внутрь и в растворе для внутривенного введения.

Домперидон – регулирует функцию ЖКТ.

Лекция № 14. Тема: Вещества, влияющие на ЦНС

Нервная система – это совокупность многочисленных нервных клеток – нейронов. Контакты между окончаниями нервных волокон и клетками называются синапсами. Роль медиаторов в синапсах ЦНС выполняет ацетилхолин, норадреналин, дофамин, серотонин, ГАМК (гамма аминомасляная кислота), пептиды и т.д. Важную роль играет ретикулярная формация, которая состоит из большого количества нервных клеток в стволе головного мозга. Ретикулярная формация, возбуждая кору головного мозга, поддерживает состояние бодрствования человека, а при ослаблении этого воздействия развивается выраженное торможение коры головного мозга – сон. Все лекарственные вещества делятся на 3 группы:

1. Вещества, угнетающие функции ЦНС (средства для наркоза, наркотические анальгетики, снотворные, противосудорожные, нейролептики, транквилизаторы, седативные);

2. Вещества, возбуждающие функции ЦНС (аналептики, психостимуляторы);

3. Промежуточное положение занимают антидепрессанты и соли лития.

Средства для наркоза.

Под наркозом подразумевают обратимое угнетение функций ЦНС, при котором у человека выключается сознание и наступает потеря чувствительности и способности двигаться. В тоже время сохраняется нормальной функция дыхания и сердечнососудистой системы. Используется для проведения хирургических операций. После выхода из состояния наркоза функции ЦНС полностью восстанавливаются. Высокой чувствительностью к наркотикам обладают синапсы ретикулярной формации и коры головного мозга. Наименее чувствительны синапсы продолговатого мозга, где расположены дыхательный и сосудодвигательный центры.

Различают средства для ингаляционного и неингаляционного наркоза.

Средства для ингаляционного наркоза

Сюда относятся летучие жидкости (эфир для наркоза, галотан, хлорэтил, азота закись). Их вводят в организм при помощи специального наркозного аппарата, позволяющего точно дозировать ингаляционные вещества. Это позволяет проводить наркоз в любых условиях.

Диэтиловый эфир – это жидкое летучее средство для наркоза. Вызывает выраженную анальгезию и миорелаксацию. Из отрицательных свойств:

может вызвать ларингоспазм, рефлекторную брадикардию, рвоту. В настоящее время для наркоза применяется редко.

Стадии эфирного наркоза:

1-я стадия - стадия оглушения .Наблюдается некоторое угнетение сознания, уменьшение болевой чувствительности. Мышечный тонус и рефлексы сохранены.В этой стадии проводят несложные поверхностные операции – вскрытие гнойников.

2-я стадия – стадия возбуждения. Появляются двигательное беспокойство, речевое возбуждение. Отмечается нарушение ритма дыхания, учащение пульса, повышение АД. Мышечный тонус усиливается.

3–я стадия – стадия хирургического наркоза. Усиливается угнетение головного мозга и распространяется на спинной мозг. Явления возбуждения стихают, снижается мышечный тонус, дыхание становится ровным, нормализуется АД, угнетаются безусловные рефлексы (роговичный). В этой стадии проводятся хирургические операции.

4 –я стадия – стадия пробуждения – наступает после прекращения введения наркотического средства.

Галотан (фторотан) – летучая негорючая жидкость. Стадия возбуждения кратковременная. Обладает достаточной наркотической широтой действия. Пробуждение наступает быстрее, чем после эфирного наркоза.

Изофлуран – менее токсичен, чем галотан.

Севофлуран – новое средство для ингаляционного наркоза. Обладает низкой токсичностью.

Газообразные средства для наркоза

Динитрогена оксид (***азота закись***)– газ с малой наркотической активностью. Побочные эффекты отсутствуют. В связи с малой наркотической активностью динитрогена оксид комбинируют с более активными средствами для наркоза, например, с галотаном. Выпускается в баллонах.

Ксенон – инертный газ, используется для наркоза. Не оказывает токсического и побочного действия.

Средства для неингаляционного наркоза.

Препараты данной группы вводят чаще внутривенно. При этом наркоз развивается в первые минуты после введения без выраженной стадии возбуждения.

Тиопентал натрия – Выпускают во флаконах в виде сухого вещества, которое растворяют перед внутривенным введением. После введения наркоз развивается через 1-2 минуты и продолжается 15-20 минут. Используют для вводного наркоза.

Пропофол – вводят внутривенно дробно или капельно. Действие наступает через 30 секунд и быстро прекращается после окончания инфузии.

Кетамин – применяют для кратковременного обезболивания. При внутривенном обезболивании длительность действия составляет 5-10 минут, при внутримышечном введении – 15-25 минут.

Спирт этиловый – по характеру действия на ЦНС может быть отнесен к средствам для наркоза. Вызывает анальгезию, выраженную стадию возбуждения, а в дозах, вызывающих наркоз, угнетает центр дыхания. Поэтому для хирургического наркоза не пригоден. Для обезболивания при травмах, ранениях возможно внутривенное введение 5% раствора этанола. В концентрации 40% (для детей 20%) используют для постановки компрессов, 96% этанол применяют для обработки хирургических инструментов, 70% этанол используют для обработки рук хирурга и операционного поля. В быту при употреблении этанола в составе алкогольных напитков быстро развивается стадия возбуждения (опьянения), при этом снижается критическое отношение к собственным поступкам, расстройство мышления и памяти. Расширяются сосуды, при этом усиливается теплоотдача и снижается температура тела. Тяжёлые отравления этанолом могут приводить к смерти вследствие паралича дыхательного и сосудодвигательного центров. Первая помощь при остром отравлении алкоголем заключается в промывании желудка через зонд, внутривенном введении раствора декстрозы (глюкозы) в концентрации 200 мг/мл, а для коррекции метаболического ацидоза – раствор натрия гидрокарбоната в концентрации 40 мг/мл. При необходимости применяют гемодиализ. При длительном применении этанола внутрь к нему развивается лекарственная зависимость. Лечение алкоголизма проводят в стационаре.

Препарат

Дисульфирам (тетурам, антабус) – Назначают в таблетках в сочетании с небольшим количеством спирта. При этом появляются головная боль, головокружение, сердцебиение, затруднение дыхания, тошноту, рвоту. Так же входит в состав таблеток “Эспераль”, для имплантации в ткани.

Вещества с анальгетической активностью

Боль - субъективная реакция, которая возникает при раздражении болевых рецепторов. Она служит сигналом опасности, предохраняющим организм от повреждающих факторов. Длительная интенсивная боль может привести к болевому шоку. Анальгетики – это ЛВ, которые избирательно подавляют только болевую чувствительность и не нарушают сознания. Их назначают при травмах, ожогах, опухолях.

Классификация препаратов с анальгетической активностью:

1. Вещества центрального действия:

а) опиоидные (наркотические) анальгетики
- природные: морфин, омнопон, кодеин

- синтетические: фентанил, промедол

б) препараты смешанного действия(трамал);

2. Преимущественно периферического действия - ненаркотические средства с анальгетической активностью (нестероидные противовоспалительные средства, ненаркотические анальгетики);

Наркотические анальгетики – к этой группе относят алкалоиды опия и ряд синтетических веществ. ***Опий*** – это высушенный на воздухе млечный сок недозрелых коробочек мака. Из опия выделено свыше 25 алкалоидов, среди которых в медицине используются ***морфин*** (который составляет около 10% опия), ***кодеин*** и ***папаверин***. По структуре алкалоиды делятся на производные фенантрена (морфин, кодеин, тебаин и др.) .Тебаин высокотоксичный и в терапевтических дозах не используется, но из него синтезируют бупренорфин, дипренорфин, налоксон, налтресон) и производные изохинолина (папаверин). Первые (производные фенантрена) действуют преимущественно на ЦНС, вторые (производные изохинолина) действуют на гладкие мышцы кишечника, бронхов, сосудов и других органов(оказывает спазмолитическое действие).

Кодеин обладает выраженным противокашлевым действием и слабым болеутоляющим действием. Угнетает кашлевой рефлекс в кашлевом центре продолговатого мозга.

Папаверин – относится к спазмолитическим средствам.

Морфин – подавляя чувство боли, не вызывает потери сознания. Угнетает дыхательный и кашлевой центры. Может вызвать тошноту или рвоту. Повышает тонус сфинктеров ЖКТ (вызывает запор), мочевого пузыря, усиливает сокращение мускулатуры бронхов, матки, желчевыводящих и мочевыводящих путей. При спазмах гладких мышц морфин используют в комбинации со спазмолитическимим средствами – атропином, дротаверином (но-шпа), папаверином. Морфин применяют при остром отёке лёгких.

Острое отравление морфином – характеризуется спутанностью сознания, затем идет потеря сознания, угнетение дыхания, резкое сужение зрачков, гипотония, понижение температуры тела. Смерть наступает от остановки дыхания.

Помощь – промыть желудок 0,02% р-ром калия перманганата и ввести вещества, возбуждающие дыхательный центр – налоксон или налтрексон.

При систематическом приеме морфина наступает хроническое отравление – морфинизм.

Препарат противопоказан при угнетенном дыхании, детям до 2-х лет, кормящим женщинам. Выпускается в таблетках, в виде раствора в ампулах для подкожного и перидурального введения.

Омнопон - новогаленовый препарат опия, содержащий кодеин, морфин, наркотин, папаверин, тебаин. Не вызывает спазм гладких мышц. Применяют при почечной и печёночной колике.

Выпускается в порошках, в виде раствора в ампулах для подкожного введения.

Синтетические наркотические анальгетики.

Тримеперидин (промедол) - обладает умеренным спазмолитическим действием на гладкую мускулатуру внутренних органов. Усиливает ритмические сокращения мускулатуры тела матки и несколько расслабляет шейку матки. Применяют при инфаркте миокарда, травмах, злокачественных опухолях, печёночной и почечной колике.

Фентанил – обезболивающее действие сильнее, чем у морфина и промедола. Выпускают раствор в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения. В сочетании с нейролептиком дроперидолом применяют для нейролептанальгезии (метод обезболивания с сохранённым сознанием при хирургических операциях), для устранения болей при инфаркте миокарда, травмах.

Бупренорфин – обезболивающий эффект меньше, чем у морфина, меньше вызывает лекарственную зависимость.

Буторфанол, налбуфин – меньше угнетают дыхание, чем морфин, меньше вызывают лекарственную зависимость.

Препараты смешанного действия

Трамадол (трамал) – не вызывает угнетения дыхания и нарушений сердечно-сосудистой системы. Выпускают в капсулах, каплях для приема внутрь, в суппозиториях, раствор в ампулах для внутримышечного, внутривенного введения при инфаркте миокарда, травмах, невралгиях, злокачественных опухолях.

Ненаркотические анальгетики

Препараты этой группы обладают обезболивающим, жаропонижающим и противовоспалительным действием.

<u>Группа салицилатов:</u>

Ацетилсалициловая кислота– производное салициловой кислоты. Оказывает обезболивающее, жаропонижающее и антиагрегантное действие. Применяется при артритах, артрозах, невралгии, миозитах, для профилактики тромбозов и эмболий. Выпускают в порошках и таблетках.

Метамизол – натрий (анальгин)– обладает выраженным болеутоляющим, жаропонижающим и противовоспалительным действием. Входит в состав препаратов “ Андипал”, “Темпалгин”, “ Баралгин”, “Пенталгин”.

При длительном применении угнетает кроветворение.

Амидопирин – действие и применение как у анальгина.

Баралгин (спазган)– комбинированный препарат. Выпускают в таблетках, в виде раствора в ампулах по 5 мл для внутримышечного, внутривенного введения.

Парацетамол – выпускают в виде сиропа и суспензии для приема внутрь, в свечах. Входит в состав таблеток «Колдрекс», « Фервекс».

Индометацин – является высоким эффективным противовоспалительным средством, но обладает высокой токсичностью.

Диклофенак (ортофен, вольтарен) - в таблетках, капсулах, свечах, в растворах в ампулах для внутримышечного введения, эмульгель, мазь.

Кеторолак(кеторол, кетанов)- выпускают в таблетках для приёма внутрь, раствор в ампулах для внутримышечного, внутривенного введения.

Нимесулид (найз, нимесил) - выпускается в таблетках, гранулах, суспензия перорально.

Пироксикам, мелоксикам – противовоспалителные средства длительного действия. Назначают один раз в день.

Побочные эффекты: при длительном применении отрицательно действуют на ЖКТ, вызывая эрозии, язвы, кровотечения; нарушают фильтрацию в почечных клубочках; провоцируют бронхоспазм; угнетают сперматогенез.

Снотворные средства

Это фармакологические вещества, вызывающие у человека состояние, близкое к естественному (физиологическому) сну. Механизм действия: ослабляют активирующее влияние ретикулярной формации на кору головного мозга. В малых дозах снотворные оказывают седативное (успокаивающее) действие.

Фенобарбитал, циклобарбитал – выпускается в порошках и таблетках. Обладает снотворным эффектом..

Флунитразепам, диазепам (седуксен) – относятся к транквилизаторам, но могут применяться при расстройстве сна.

Нитразепам – обладает снотворным, миорелаксирующим, седативным, противосудорожным эффектом.

Хлоралгидрат – выпускается в виде порошка, применяется внутрь или в клизме с обволакивающим веществом для прекращения психомоторного возбуждения.

Лекция № 15. Тема: Вещества, влияющие на ЦНС

Средства, оказывающие влияние на психические функции, эмоциональное состояние и поведение называются психотропными средствами.

Среди психотропных средств выделяют:
1. нейролептики;
2. антидепрессанты;
3. соли лития;
4. анксиолитики (транквилизаторы)
5. седативные средства;
6.психостимуляторы;
7.ноотропные средства;

Нейролептики

Устраняют или ослабляют главные симптомы психических заболеваний: бред, галлюцинации, удлиняют действие средств для наркоза, снотворных, анальгетиков и анестетиков. Могут вызывать симптомы лекарственного паркинсонизма.

Хлоропромазин – (аминазин) – обладает
1.антипсихотическим эффектом: устраняет бред и галлюцинации у больных шизофренией;
2.оказывает выраженное успокаивающее действие при эмоциональном, психическом и двигательном возбуждении у психических больных, устраняет агрессию, беспокойство, страх у этих больных;
3.снижает тонус скелетных мышц;
4.оказывает противорвотное действие;
5.снижает температуру тела, что используется при операциях на сердце;
6.расширяет кровеносные сосуды и снижает артериальное давление;
7.блокирует М – холинорецепторы, что ведёт к уменьшению секреции бронхов, пищеварительных желез, ослаблять моторику ЖКТ;
Противопоказан при заболеваниях печени, почек, язвенной болезни желудка и 12 п. кишки, при гипотонии и декомпенсации сердечной деятельности.

Трифтазин – обладает большей антипсихотической активностью, чем хлорпромазин, более выраженным лекарственным паркинсонизмом, менее выраженным седативным действием.

Тиоридазин (сонапакс) – менее активен, чем хлорпромазин и трифтазин.

Галоперидол – усиливает действие средств для наркоза, снотворных и наркотических анальгетиков. Противорвотное действие сильнее, чем у хлорпромазина. Применения и противопоказания как у хлорпромазина.

Дроперидол – обладает более быстрым и сильным, но непродолжительным действием. Применяют с фентанилом для нейролептанальгезии.
Сульпирид, оланзапин, рисперидон, арипипразол – обладают антипсихотическим и противорвотным действием. Не вызывают явлений паркинсонизма.
Транквилизаторы(анксиолитики, успокаивающие) это лекарственные средства, обладающие успокаивающим действием. Они подавляют чувство тревоги, страха, эмоционального напряжения. Обладают противосудорожным действием, усиливают действие снотворных средств, алкоголя, наркотических анальгетиков, средств для наркоза. Но они не устраняют бредовых идей, галлюцинаций. Наиболее широко используются ***диазепам (седуксен, реланиум)***, ***элениум (хлордиазепоксид)***, ***оксазепам***, ***алпразолам, флумазенил, буспирон***. Они показаны при различных невротических состояниях, сопровождающихся возбуждением, тревогой, бессонницей. При бесконтрольном и необоснованном их применении может развиться лекарственная зависимость, аллергические реакции, нарушения функции печени и почек. Их нельзя назначать водителям транспорта до и во время работы. В период лечения транквилизаторами нельзя употреблять спиртные напитки.

Седативные средства

понижая возбудимость ЦНС, оказывают на организм умеренное успокаивающее действие. К этой группе относят: соли брома (***натрия бромид, калия бромид, бромкамфора***), препараты растений: (***настойка валерианы, настойка пустырника, настойка пиона, пассифлоры***).
Ионы брома усиливают процессы торможения, особенно в коре головного мозга. Бромиды используются для лечения неврастении, истерии. Они медленно выводятся из организма и при длительном их употреблении могут накапливаться. При этом развивается хроническое отравление – **бромизм**. Оно проявляется сонливостью, ослаблением памяти, апатией. Появляются также кожная сыпь, насморк, кашель.
Корень валерианы применяют в виде настоя и настойки. Трава пустырника применяется в виде спиртовой настойки. Оказывает успокаивающее действие аминокислота – глицин. Применяется под язык.

Противоэпилептические средства

Эпилепсия – это хроническое заболевание ЦНС, при котором происходят периодические припадки. Идет изменение психики, поведения, характера.

Различают 4 вида эпилептических припадков:
1.большие судорожные припадки с потерей сознания и характерными тоническими и клоническими судорогами.

2.малые припадки – больной теряет сознание на несколько секунд, судороги отсутствуют.
3.психомоторные припадки во время которых больной может совершить ряд поступков, о которых ничего не помнит.

4.миоклонус – эпилепсия, которая проявляется кратковременными судорожными подергиваниями отдельных групп мышц без потери сознания.

Вначале использовали фенобарбитал, но он обладает снотворным эффектом. Позже появились дифенин, клоназепам, диазепам, габапентин, карбамазепин (финлепсин), фенитоин, препараты вальпроевой кислоты, ламотриджин.

Средства для лечения паркинсонизма

Болезнь Паркинсона (дрожательный паралич) и сходные с ней состояния (паркинсонизм) характеризуются резко повышенным тонусом скелетных мышц, затруднением нормальных движений, дрожанием рук, характерной семенящей походкой и т.д. Заболевание связано с повреждением одного из подкорковых образований – черной субстанции. В норме нейроны черной субстанции с помощью медиатора дофамина оказывают тормозное влияние на некоторые подкорковые образования. При болезни Паркинсона и паркинсонизме тормозное влияние дофамина уменьшается и начинает преобладать возбуждающее влияние холинергических нейронов.

Для усиления дофаминергических влияний используют предшественники дофамина – диоксифенилаланин (ДОФА), который в организме превращается в дофамин. Левовращающий изомер ДОФА **– *Леводопа*** – назначают внутрь. Комбинированный препарат леводопы с карбидопой имеет название ***Наком***, а с бенсеразидом – ***Мадопар.***
Тригексифенидил (***Циклодол***) – М-,Н – холиноблокатор.
Имеются так же препараты: ***Селегинил***, ***Энтакапон***, ***Амантадин*** (***Мидантан***), ***Бромокриптин*** (***Парлодел***).

Препараты лития

Лития карбонат – купирует острое маниакальное возбуждение у психических больных.
Побочное действие: тремор пальцев, атаксия (пошатывание), сонливость, диспептические явления, нарушения ритма сердца.
Противопоказания: беременность, нарушение функции почек, сердечно – сосудистые заболевания.

Антидепрессанты

Это вещества, способные устранять явления психической депрессии (отрицательные эмоции, чувство тоски, подавленности, безнадежности). Широко используются в психиатрии.
Ниаламид - стимулирует ЦНС.

Противопоказан при нарушениях функции почек, печени, декомпенсации сердечной деятельности.
Препараты: ***Имипрамин*** (***Имизин***), ***флуоксетин*** (***Прозак***), ***Мапротилин*** (***Людиомил***), ***Моклобемид***,
Амитриптиллин – назначают при депрессивных состояниях различной этиологии.

Психостимулирующие средства

Они повышают настроение, уменьшают чувство усталости, повышают физическую и умственную работоспособность, временно снижают потребность в сне.
Кофеин – алкалоид из листьев чая, кофейных зерен, орехов кола, получен так же синтетическим путем. Уменьшает чувство усталости, сонливости, повышает умственную и физическую работоспособность. Но при длительном применении может привести к истощению нервных клеток и появлению бессонницы, раздражительности. Кофеин стимулирует сердечную деятельность, повышает АД, возбуждает дыхательный центр, что проявляется учащением и углублением дыхания. Применяют кофеин для стимуляции психической деятельности, при утомлении, мигренях, гипотонии, при отравлении алкоголем, наркотическими средствами, снотворными, при коллапсе, шоке.
Противопоказан при гипертонии, атеросклерозе, бессоннице, при повышенной психической возбудимости.
Амфетамин (Фенамин) – усиливает выделение норадреналина, и, как следствие, вызывает тахикардию, повышение артериального давления.
Мезокарб (***Сиднокарб***) – действуют как кофеин, а так же уменьшают чувство голода и потребности в сне, ослабляют действие снотворных и наркотических средств. У них мало побочных явлений, реже развивается лекарственная зависимость.

Ноотропные средства

улучшают память и умственную деятельность мозга. Применяют при острых и хронических нарушениях мозгового кровообращения, астенических состояниях, снижении умственной работоспособности мозга. Ноотропы по своей структуре сходны с гаммааминомасляной кислотой (ГАМК). Первый созданный препарат-
Пирацетам – (ноотропил) выпускается в таблетках, капсулах, гранулах, р-р в ампулах для в-м и в-в введения.
Новые препараты: ***ГАМК***, ***Аминалон***, ***Пантогам***, ***Фенибут***, ***Пикамилон***, ***Пиритинол*** (***Энцефабол***)

Аналептики

Это вещества, которые возбуждают центры продолговатого мозга – сосудодвигательный и дыхательный. Различают стимуляторы прямого, рефлекторного и смешанного действия.

Стимуляторы прямого действия – оказывают прямое возбуждающее действие на центр дыхания. Препараты:

Кофеин – читай свойства кофеина. Применяют кофеин в комбинации с ненаркотическими анальгетиками. Препараты ***Кофетамин***, ***Пенталгин - Н***.

Препарат кофеин – выпускается в порошках, таблетках, раствор в ампулах для подкожного введения.

Камфора – возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры, оказывая прямое стимулирующее действие на сердце. Используется в виде масляного раствора для подкожных инъекций. ***Сульфокамфокаин***– водный раствор камфоры –выпускается в виде раствора в ампулах для подкожных, внутримышечных, внутривенных введений.

Кордиамин (Никетамид)– выпускается в каплях для приема внутрь в виде раствора для подожного введения.

Средства, стимулирующие дыхание рефлекторно

Цититон *и* ***лобелин***(н-холиномиметики) –возбуждают Н холинорецепторы синокаротидной зоны, откуда афферентные импульсы поступают в продолговатый мозг и повышают активность дыхательного центра.

Средства смешанного типа действия

Карбоген– сочетание $CO_2$5-7% и O_2 93%-95%, т.к. углекислый газ является физиологическим стимулятором дыхательного центра.

Общетонизирующие средства

Препараты из растений: женьшеня, золотого корня, элеутерококка, китайского лимонника, левзеи, заманихи, аралии и т.д.

Из органопрепаратов: пантокрин, витамины группы В.

Биогенные стимуляторы: солкосерил, прополис. Общетонизирующие средства не вызывают пристрастия и привыкания. Их широко используют для лечения функциональных расстройств нервной системы, при общей слабости, переутомлении, гипотонии.

Лекция № 16. Тема: Вещества, влияющие на функцию дыхания

Сюда относят стимуляторы дыхания, *противокашлевые средства, отхаркивающие средства* и средства, применяемые при бронхиальной астме и отеке лёгких.

<u>Стимуляторы дыхания</u>– *аналептики*.

Дыхание регулируется дыхательным центром, расположенным в продолговатом мозге. Углекислый газ, находящийся в крови, стимулирует дыхательный центр прямо и рефлекторно, возбуждая рецепторы синокаротидной зоны. При остановке дыхания назначают стимуляторы дыхания, которые возбуждают дыхательный центр. При этом дыхание учащается и становится более глубоким. ***Вещества, оказывающие прямоестимулирующее действие: кофеин, бемегрид, никетамид(кордиамин), сульфокамфокаин.*** Их вводят подкожно.

Вещества, оказывающие рефлекторное действие: лобелин и цитизин. Их вводят внутривенно.

(смотри ***аналептики*** лекция №15).

Противокашлевые средства

Кашель является защитной рефлекторной реакцией в ответ на раздражение дыхательных путей. Он часто возникает при воспалении дыхательных путей и легких (бронхит, туберкулез легких и т.д.). При этих заболеваниях кашель часто нарушает сон и изнуряет больных. Повышение давления в легких при кашле в течение длительного периода может привести к растяжению легочной ткани, т.е. к явлениям эмфиземы и нарушению кровообращения. Кашлевой рефлекс осуществляется при участии кашлевого центра, расположенного в продолговатом мозге.

Кодеин, этилморфин – угнетают кашлевой центр, влияя на опиоидные рецепторы. Могут угнетать дыхательный центр, вызывать лекарственную зависимость.

Либексин – анестезирует слизистую оболочку верхних дыхательных путей, обладает незначительным бронхолитическим свойством. На ЦНС он не влияет. Лекарственная зависимость к нему не развивается.

Препараты ***окселадин(тусупрекс), глауцин*** так же не вызываю т пристрастия и не угнетают дыхательный центр.

Отхаркивающие средства

Способствуют уменьшению кашля путем увеличения секреции желез слизистой оболочки бронхов, а также путем разжижения секрета.

По механизму действия они делятся на группы:

1) стимулирующие секрецию бронхиальных желез:

- Отхаркивающие средства рефлекторного действия;
- Отхаркивающие средства прямого действия;

2) муколитические средства;

Отхаркивающие средства рефлекторного действия – назначают внутрь. Они раздражают рецепторы желудка, что ведёт к стимуляции секреции бронхиальных желез, мокрота при этом становится менее вязкой; повышается активность мерцательного эпителия; усиливается сокращение мышц бронхов. Препараты***: настой травы термопсиса, экстракт термопсиса сухой, настой и экстракт*** алтейного корня, ***мукалтин*** (экстракт травы алтея лекарственного), препараты корня солодки(лакричный корень), корня ипекакуаны, плодов аниса(капли нашатырно-анисовые).

Отхаркивающие средства прямого действия – принятые внутрь, они выделяются бронхиальными железами, уменьшают вязкость мокроты и способствуют ее удалению. Препараты: ***натрия йодид***, ***калия йодид***, ***ацетилцистеин*** (АЦЦ), ***карбоцистеин***, ***бромгексин*** и т.д.

Муколитические средства – делают мокроту более жидкой, менее вязкой, тем самым способствуют более лёгкому её отделению.

Ацетилцистеин – применяют при воспалительных заболеваниях дыхательных путей с вязкой трудноотделяемой мокротой (хронические бронхиты, трахеобронхиты). Назначают внутрь и ингаляционно. В тяжёлых случаях вводят внутривенно.

Карбоцистеин – обладает сходными свойствами. Назначают внутрь.

Бромгексин – назначают внутрь в виде таблеток или растворов. В тяжёлых случаях вводят внутривенно.

Амброксол – назначают внутрь.

Кроме того протеолитические ферменты трипсин, химитрипсин, дезоксирибонуклеазу применяют при бронхоэктатической болезни ингаляционно.

Средства, применяемые при бронхиальной астме.

Бронхиальная астма – это заболевание, которое проявляется приступами удушья, возникающими в результате спазма бронхов. ***Для купирования приступов*** бронхиальной астмы применяют ингаляционно β_2-адреномиметики короткого действия (около 6 часов) ***сальбутамол*** и ***фенотерол***; ***эпинефрин (адреналин)*** и ***эфедрин***, которые вводят подкожно; М-холиноблокаторы: ***ипратропия бромид*** (***вводят*** ингаляционно), тиотропия бромид.

Из спазмолитиков миотропного действия применяют ***аминофиллин (эуфиллин)***, который вводят внутримышечно и внутривенно.

Для профилактики приступов бронхиальной астмы применяют

β_2-адреномиметики длительного действия (около 12 часов) – ***кленбутерол***, ***салметерол***, ***формотерол***; спазмолитики миотропного действия - ***аминофиллин*** в таблетках и М-холиноблокаторы (ипратропия бромид).

Стабилизаторы тучных клеток:

Кислота кромоглициевая, недокромил - стабилизирует мембраны тучных клеток. Выпускают ингаляционные формы при бронхиальной астме, капсулы при пищевой аллергии, назальный спрей при аллергическом рините, глазные капли при аллергическом конъюнктивите.

Кетотифен (задитен) – стабилизирует мембраны тучных клеток. Обладает слабым противогистаминным свойством, оказывает прямое действие на стенки бронхов. Выпускается в капсулах и таблетках.
Для систематической профилактики приступов бронхиальной астмы внутрь назначают ***блокаторы лейкотриеновых рецепторов*** – ***зафирлукаст*** и ***монтелукаст***. Используют также препараты ***зилеутон*** и ***омализумаб***.

Противогистаминные ЛВ

I. Противогистаминные средства

II. Средства, препятствующие высвобождению БАВ из тучных клеток

III. Иммунодепрессивные средства

IV. Противовоспалительные средства стероидной и нестероидной структуры

I. При аллергической реакции гистамин стимулирует H1 гистаминовые рецепторы .Это вызывает сокращение гладких мышц кишечника, бронхов, матки. Противогистаминные средства блокируют гистаминовые рецепторы. Это вызывает расслабление гладких мышц бронхов, кишечника, матки.

Противогистаминные средства первого поколения

Дифенгидрамин(димедрол) побочное действие: седативное, снотворное . Выпускают в порошках, таблетках, свечах, раствор в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения.

Клемастин (тавегил) – отличается от дифенгидрамина более продолжительным действием (более 12 часов).

Прометазин (дипразин, пипольфен) – оказывает противоаллергическое, седативное, противорвотное действие. Выпускают в драже, таблетках, раствор в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения.

Хлоропирамин (супрастин) – обладает противоаллергическим, спазмолитическим действием. Оказывает умеренное угнетающее действие на ЦНС.Он также обладают седативным действием.

Мебгидролин (диазолин) - выпускают в драже для приёма внутрь.

Противогистаминные средства второго поколения

Фенистил (акривастин), ***астемизол***, ***лоратадин*** (кларитин), ***терфенадин***, ***эриус*** – не вызывают снотворного эффекта.

Противогистаминные средства третьего поколения

Цетиризин, ***фексофенадин*** – не вызывают снотворного эффекта

Противогистаминовым и противосеротониновым эффектом обладают

Бикарфен, димебон, ***перитол*** . Они снижают проявления аллергии. Применять осторожно при заболевании печени и почек.

При лечении аллергической бронхиальной астмы применяют препараты первого поколения.

II.***Средства, препятствующие высвобождению БАВ из тучных клеток.***

Эти препараты препятствуют высвобождению из тучных клеток гистамина,серотонина, брадикинина, тем самым предупреждают приступ бронхиальной астмы.

Кислота кромоглициевая (кромолин-натрий, интал) – применяют в аэрозоле «Дитэк», в виде назального спрея, раствора для ингаляций, глазных капель, в виде капсул для приёма внутрь.

Недокромил – применяют ингаляционно в виде дозированного аэрозоля

Кетотифен (задитен) – в капсулах и таблетках, сироп чайными ложками внутрь.

При анафилактических реакциях применяют ***эпинефрин, бронхолитикимиотропного действия*** (аминофиллин) и ***противоаллергические препараты***.

Лекция № 17. Тема: Вещества, влияющие на сердечнососудистую систему. Сердечные гликозиды. Противоаритмические средства.

Все лекарственные средства, влияющие на сердечно-сосудистую систему делят на 4 группы:

1. Средства, действующие преимущественно на функции сердца (кардиотонические и противоаритмические)

2. Средства, влияющие на артериальное давление (гипотензивные и гипертензивные).

3. Средства, применяемые при ишемической болезни сердца и нарушениях мозгового кровообращения.

4. Гипохолистеринемические средства.

Кардиотонические средства

ПРИЗНАКИ СЕРДЕЧНОЙ НЕДОСТАТОЧНОСТИ появляются, когда сердце не в состоянии поддерживать нормальное кровообращение. При этом падает АД, происходит застой крови в венозной системе, повышается венозное давления. Венозный застой в конечностях, особенно внижних ведет к появлению отеков и скоплению жидкости в брюшной полости (асцит). Нарушается функция лёгких и почек. Появляется одышка, синюшность кожных покровов и слизистых оболочек, особенно губ.

При сердечной недостаточности для лечения применяют сердечные гликозиды. Сердечные гликозиды - это вещества растительного происхождения, которые повышают работоспособность миокарда. Они содержатся в растениях: наперстянке, строфанте, ландыше, горицвете, их применяют при сердечной недостаточности.

Сердечные гликозиды, действуя на мышцу сердца, вызывают следующие явления:

1) усиливают сокращения (систолу)

2) урежают сокращения

3) удлиняют диастолу

4) затрудняют атриовентрикулярную (предсердно-желудочковую) проводимость;

4)повышают автоматизм волокон Пуркинье;

Различают:

1. Гликозиды длительного действия. Они обладают выраженными кумулятивными свойствами, т.е. обладают способностью накапливаться в миокарде. Это препараты наперстянки. Особенно ***дигитоксин***.

2. Гликозиды средней продолжительности действия. Обладают умеренными кумулятивными свойствами (***дигоксин***, ***ланатозид-С***, ***гликозиды горицвета***).

3. Гликозиды быстрого, но непродолжительного действия со слабовыраженными кумулятивными свойствами (***строфантин***, ***коргликон***, ***конвалятоксин***).

По длительности действия и способности кумулировать гликозиды ***наперстянки*** и ***строфантин*** располагаются в следующем порядке: ***дигитоксин>дигоксин>ланатозид-С>строфантин***. Очень хорошо всасываются в ЖКТ ***дигитоксин*** и ***дигоксин***, хорошо - ***целанид***. Их назначают энтерально (через рот), внутрь принимают также препараты горицвета (***адонизид***, ***настой травы горицвета***).

Способность гликозидов усиливать систолу и удлиннять диастолуявляется главным благотворным действием при сердечно-сосудистой недостаточности. В случаях острой сердечной недостаточности (инфаркт миокарда, кардиогенный шок, отек легких) вводят внутривенно гликозиды быстрого, сильного и короткого действия: ***строфантин***, ***коргликон***, ***конвалятоксин***. При хронической сердечной недостаточности показаны препараты длительного действия с постепенно нарастающим эффектом - ***дигоксин***, ***ланатозид - С***, ***дигитоксин***. Отравление сердечными гликозидами наблюдается при передозировке и ***кумуляции***.

Клиническая картина: резко замедляется пульс (брадикардия), появляются тошнота, рвота, головная боль, аритмия, падает АД. Смерть наступает от остановки сердца. Для оказания помощи назначают калия хлорид, калия и магния аспарагинат (панангин, аспаркам); препараты, связывающие ионы кальция (ЭДТА), противоаритмические средства, унитиол и т.д. Рассмотрим препараты:

Дигитоксин–выпускают в таблетках. Назначают внутрь при хронической сердечной недостаточности. Действует через 2-3 часа.

Дигоксин – в 1,5 раза активнее дигитоксина. Получают из наперстянки шерстистой выпускают в таблетках для приема внутрь и раствор в ампулах

для в/в введения. Применяют при хронической сердечной недостаточности и суправентрикулярных аритмиях.

Строфантин-К (уабаин) получен из строфанта, применяют при острой сердечной недостаточности. Вводят внутривенно медленно по 0,5-1мл раствора в концентрации 0,5мг/мл, растворив в 20 мл раствора NaC1 в концентрации 9мг/мл.

Коргликон получен из ландыша, вводят внутривенно раствор по 0,5-1 мл (0,6мг/мл) + 20 мл раствора NaC1 (9мг/мл) медленно. Применяют при острой сердечной недостаточности.

Негликозидные вещества, стимулирующие β_1- адренорецепторы сердца:

Добутамин – β_1- адреномиметик – усиливает и в меньшей степени учащает сокращения сердца. Применяют при острой сердечной недостаточности. Вводят внутривенно.

Дофамин – влияет на дофаминовые рецепторы, расширяет периферические сосуды (сосуды почек), повышает АД.

Эпинефрин (адреналин) – усиливает работу сердца, повышает АД. Но при этом значительно повышает потребление сердцем кислорода.

Левосимендан – также относится к негликозидным кардиотоникам.

ПРОТИВОАРИТМИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Это лекарственные средства, которые применяются при нарушениях сердечного ритма (аритмиях).

Классификация противоаритмических средств:

1. Блокаторы натриевых каналов (хинидин, прокаинамид, лидокаин, аймалин, дизопирамид [ритмилен]);

2. ß – адреноблокаторы: пропранолол (анаприлин), метапролол;

3. Блокаторы калиевых каналов: амиодарон, нибентан, соталол;

4.Блокаторы кальциевых каналов: верапамил, дилтиазем, нифедипин, амлодипин;

Препараты других групп:

5. М – холиноблокаторы, адреномиметики и адреноблокаторы.

6. Сердечные гликозиды.

Существуют различные виды нарушения ритма: экстрасистолии, тахиаритмии (пароксизмальная тахикардия, мерцательная аритмия), блокады сердца.

<u>Препараты, применяемые при тахиаритмиях и экстрасистолии</u>

Блокторы натриевых каналов:

Хинидин – блокирует натриевые и калиевые каналы волокон Пуркинье (волокон проводящей системы в желудочках сердца), угнетает атриовентрикулярную проводимость, ослабляет сокращения миокарда, расширяет периферические сосуды и умеренно снижает артериальное давление.

Побочные явления: головная боль, нарушение зрения, звон в ушах, тошнота, рвота.

<u>Прокаинамид</u> (новокаинамид) - по действию сходен с хинидином.

Лучше переносится больными. Назначают внутрь, внутримышечно и внутривенно.

Лидокаин (ксикаин) – оказывает быстрое, но непродолжительное

действие, применяется при экстрасистолах и тахикардии, а также оказываетместноанестезирующее действие. Вводится внутривенно капельно.

Фенитоин (дифенин) – противоэпилептическое средство, обладающее противоаритмическим действием

Пропафенон – высокоэффективен при желудочковых экстрасистолиях, а также при желудочковых и наджелудочковых тахиаритмиях.

В– адреноблокаторы: неселективные(пропранолол и др.), кардио-селективные β – адреноблокаторы (метопролол, атенолол и др.). Они снижают автоматизм синоатриального узла, автоматизм и проводимость атриовентрикулярного узла, автоматизм волокон Пуркинье. Нельзя применять при бронхиальной астме и склонности к бронхоспазмам.

Блокаторы калиевых каналов:

Амиодарон(кардарон) – высокоэффективен при всех формах аритмий. Уменьшает потребность сердца в кислороде, расширяет коронарные сосуды. Высокоэффективен при стенокардии.

Соталол – это β – адреноблокатор.

Бретилия тозилат (орнид) – применяют при желудочковых тахиаритмиях

Нибентан – вводится внутривенно для купирования пароксизмов наджелудочковых аритмий.

Блокаторы кальциевых каналов:

Верапамил, дилтиазем, нифедипин, амлодипин, фелодипин, лацидипин, циннаризин – урежают сердечные сокращения, артериальное давление снижается.

Препараты калия:

Применяют при тахиаритмиях и экстрасистолии, связанных с недостатком калия (при действии мочегонных средств, сердечных гликозидов).

Растворы ***калия хлорида*** вводят внутривенно. ***Калия и магния аспарагинат (панангин, аспаркам)*** назначают внутрь и внутривенно.

Сердечные гликозиды – затрудняют атриовентрикулярную проводимость, и поступление импульсов от предсердий к желудочкам уменьшается.

Дигоксин – применяют при наджелудочковых тахиаритмиях (мерцательной аритмии, пароксизмальной тахикардии).

Аденозин – вводят внутривенно. Затрудняет атриовентрикулярную проводимость.

Препараты, применяемые при брадиаритмиях.

Брадикардии можно устранить путем стимуляции адренергических или блокадыхолинергических воздействий на сердце.

Эпинефрин – α и β адреномиметик.

Изопреналин β адреномиметик.

Эфедрин - адреномиметик непрямого действия.

М-холиноблокаторы

Атропин, платифиллин

Лекция № 18. Тема: Лекарственные вещества, влияющие на сердечно - сосудистую систему: антиангиналъные лекарственные средства.

Сосуды, питающие сердечную мышцу, называют коронарными. При их спазмах или закрытии их просвета тромбом, кровоснабжение соответствующего участка сердечной мышцы уменьшается и развивается ишемическая болезнь сердца. Недостаточность кровоснабжения сердца сопровождается болями за грудиной. Это состояние называют стенокардией. При длительном нарушении кровоснабжения сердца возникает инфаркт миокарда.

Основные группы антиангинальных средств:

1 . Органические нитраты;

2. β – адреноблокаторы;

3. Блокаторы медленных кальциевых каналов (БМКК);

Различают 3 группы органических нитратов:

1. Группа нитроглицерина
2. Группа изосорбида динитрата
3. Группа изосорбида мононитрата

1. Группа нитроглицерина

Нитроглицерин - оказывает спазмолитическое действие на мышцы сосудистой стенки, снижает АД и уменьшает приток венозной крови к сердцу. Препараты нитроглицерина высокоэффективны при любых формах стенокардии.

Лекарственные формы нитроглицерина:

а) ***Для купирования приступов стенокардии применяют:***

капсулы с масляным раствором в концентрации 10мг/мл (содержат 0,0005 или 0,001нитроглицерина);1% спиртовой раствор нитроглицерина по 1-2 капли на кусочек сахара; таблетки нитроглицерина по 0,0005; дозированный спрей (1 доза – 0,0004 нитроглицерина). Все препараты принимаются сублингвально в положении сидя, так как при приёме нитроглицерина лёжа эффективность его уменьшается, при вставании может вызвать ортостатическую гипотензию, в положении стоя может вызвать головокружение.

б) ***Для предупреждения приступов стенокардии применяют*** таблетки с более высоким содержанием нитроглицерина: сустак форте, нитронг форте. Часть таблетки быстро всасывается и дает эффект примерно через 10 мин; другая часть таблетки всасывается медленно и действует в течение нескольких часов (5-6 часов).

Специальный пластырь, который наклеивают в область сердца на 10-12 часов. Он начинает действовать через 30 минут. Реже применяют 2% мазь нитроглицерина.

в) ***Для купирования и профилактики приступов стенокардии*** применяют ***тринитролонг –*** полимерные пластинки, которые наклеивают на десну. Действие начинается через 2 минуты и длится около 4 часов.

Механизм действия нитроглицерина: расширяет венозные сосуды, при этом снижает приток венозной крови к сердцу (это ведёт к уменьшению перенагрузки на сердце); расширяет артериальные сосуды, что ведёт к снижению постнагрузки на сердце; уменьшается работа сердца, снижается потребность сердца в кислороде; расширяет крупные коронарные сосуды и улучшает коллатеральное кровообращение (открываются резервные сосуды). Это увеличивает доставку кислорода.

Побочные эффекты: покраснение лица, ощущение жара, головная боль, иногда очень сильная, снижение АД, шум в ушах. При передозировке возможны сосудистый коллапс и обморок.

Нельзя резко прекращать приём нитроглицерина, так как может развиться синдром отмены – приступы стенокардии, инфаркт миокарда.

2.Группа изосорбида динитрата:

- для сублингвального приема **- *изо Мак***

- для жевания***Изо Мак***

- для приема внутрь - ***нитросорбид, изокет, кардикет***

Пролонгированного действия:***изокет- ретард или кардикет-ретард*** в таблетках дляпредупреждения приступов стенокардии.

Изосорбида динитрат (нитросорбид) – выпускается в таблетках по

0,005; 0,01 и 0,02 – для предупреждения приступов стенокардии.

3. Группа изосорбида мононитрата:

мономак, моночинкве и т.д.

Показания к применению: предупреждение приступов стенокардии.

II. β - адреноблокаторы:

<u>Пропранолол</u> ***(анаприлин)***, - β1 и β2 - адреноблокатор. Значительно понижает потребление сердцем кислорода. Больным, склонным к бронхоспазмам, вместо***пропранолола*** назначают ***метопролол*** или ***талинолол***, которые избирательноблокируют β1 адренорецепторы.

Амиодарон (кардарон) – α и β- адреноблокатор, блокатор калиевых каналов (см.лекцию № 9).

III. Блокаторы медленных кальциевых каналов

<u>Верапамил</u>, нифедипин - блокирует кальциевые каналы мембран мышечных клеток, что приводит к уменьшению работы сердца и расширению сосудов. Обладает также антиаритмическим действием, снижает АД.

Лекарственные вещества, обладающие миотропным действием (коронарорасширяющим действием)

Их применяют редко. К этой группе относятся: дипиридамол, карбокромен, валидол.

Дипиридамол (курантил) - тормозит агрегацию (склеивание) тромбоцитов. Это препятствует образованию тромбов. Применяют как антиагрегантное средство.

Карбокромен (интеркордин), но-шпа и папаверин - обладают слабым коронарорасширяющим действием, применяют редко.

Валидол – содержит ментол. Применяют для предупреждения и купирования приступовстенокардии в виде таблеток под язык или 4 – 5 капель раствора на кусочек сахара дополного рассасывания.

Лекарственные средства, применяемые при инфаркте миокарда

При инфаркте миокарда возникают очень сильные боли в области сердца, ослабление сердечной деятельности, аритмии, снижается АД, может наступить кардиогенный шок. Поэтому при инфаркте миокарда применяют следующие группы препаратов:

1. Обезболивающие средства ***(морфин, промедол, омнопон, фентанил,азота закись)***, чтобы предупредить кардиогенный шок.

2. Коронарорасширяющие средства:

Нитроглицерин - в/в капельно (действие - см. лекцию)

3.Противоаритмические средства ***(лидокаин)***;

4. Средства, нормализующие гемодинамику:

Допамин – в / в капельно, усиливает сердечные сокращения, увеличивает сердечныйвыброс и коронарный кровоток;

Добутамин - вызывает расширение коронарных сосудов

Норэпинефрин – сужает сосуды, повышает АД, приводит к снижению сердечноговыброса, что ведет к ухудшению состояния больного. Является препаратом выбора.

Эпинефринпротивопоказан, т.к. повышает потребление кислорода сердцем и можетухудшить явления коронарной недостаточности.

5. Диуретические средства – ***фуросемид***

6. Противосвертывающие и фибринолитические средства - ***гепарин*** и ***фибринолизин*** для профилактики образования тромбов. С этой целью используют также ***стрептокиназу***, ***алтеплазу***. Их вводят внутривенно капельно в периферические вены. Затем назначают ***ацетилсалициловую кислоту*** в дозе 250 мг (0,25). При её непереносимости - ***клопидогрел***.

Средства, применяемые при отеке легких

Отек легких – это опасное для жизни состояние. Протекает тяжело. Это состояние может возникнуть при сердечной левожелудочковой недостаточности при различных патологиях легких. Скопившаяся в легких жидкость при дыхании очень легко вспенивается. Эта пена полностью заполняет альвеолы, бронхи и верхние дыхательные пути. Если не принять срочных мер, то больной может погибнуть от удушения. В связи с этим больному вводят:

- противовспенивающие средства (пеногасители) – 30% - 90% этиловый спирт в виде ингаляции, который пропускают через кислород;

- наркотические анальгетики :морфин, промедол. Они угнетают дыхательный центр, снимают тахикардию, уменьшают приток венозной крови, снижают артериальное давление, уменьшают тревогу и страх смерти;

- мочегонные средства – фуросемид, кислота этакриновая;

- гипотензивные средства – снижают артериальное и венозное давление. Эти препараты уменьшают кровенаполнение ткани легких и, соответственно уменьшают переход плазмы крови в просвет легочных альвеол.

- нитроглицерин – облегчает отток крови от легких;

- сердечные гликозиды (строфантин, коргликон) – если отек связан с сердечной недостаточностью;

Лекция № 19. Тема: Лекарственные вещества, влияющие на сердечно – сосудистую систему: гипотензивные, гипертензивные средства.

Артериальная гипертензия является симптомом многих заболеваний. Различают первичную артериальную гипертензию (гипертоническую болезнь) и вторичные гипертензии (симптоматические), которые появляются при заболеваниях почек, феохромоцитоме (опухоли надпочечников), гиперальдостеронизме и других заболеваниях.

Гипертоническая болезнь (первичная артериальная гипертензия) - это хроническое заболевание с периодическими кризами, т.е. резким повышением АД и нарушением мозгового кровообращения. Если не снижать АД, то гипертонический криз может закончиться кровоизлиянием в мозг (инсульт). Частой причиной гипертонической болезни является:

1) повышение возбудимости сосудодвигательного центра продолговатого мозга,регулирующего тонус кровеносных сосудов;

2) при стрессах надпочечники усиливают секрецию адреналина, которыйповышает АД;

3) при заболевании почек в крови может увеличиваться концентрация ангиотензина - очень сильного сосудосуживающего вещества;

4) почки регулируют водно-солевой обмен и концентрацию в крови ионов Na. Избыток ионов Na приводит к повышению тонуса сосудов.

Гипотензивные (антигипертензивные) средства - это лекарственные вещества, которые снижают повышенное АД.

По механизму действия они делятся на 4 группы:

1. Препараты, влияющие на ЦНС (нейротропные вещества).

2. Лекарственные средства, влияющие на ренин-ангиотензивную систему;

3. Лекарственные средства, влияющие непосредственно на гладкие мышцы сосудов (миотропные);

4. Лекарственные средства, регулирующие водно-солевой обмен;

Каждая из указанных групп делится на подгруппы.

I. Препараты, влияющие на ЦНС (нейротропные лекарственные средства) в свою очередь делятся на две группы:

1). Нейротропные ЛС центрального действия: ***клонидин (клофелин), метилдофа, гуанфацин, моксонидин***

Клонидин – применяют для быстрого снижения АД при гипертонических кризах. Назначают внутрь. При резком прекращении приёма препарата развивается синдром отмены – резко повышается артериальное давление, возможен гипертонический криз. Клонидин усиливает и удлиняет действие этанола. Поэтому одновременное употребление спиртных напитков не рекомендуется.

Гуанфацин (эстулик) – назначают внутрь для лечения артериальной гипертензии. Синдром отмены выражен меньше, чем у ***клонидина***.

Метилдопа (допегит) – назначают внутрь для лечения артериальной гипертензии.

Моксонидин (цинт) - назначают внутрь для систематического лечения артериальной гипертензии.

2). ЛВ, блокирующие периферическую симпатическую иннервацию:

Ганглиоблокаторы: ***гексаметония бензосульфонат*** (бензогексоний),***азаметония бромид*** (пентамин); блокируют передачу импульсов в вегетативных ганглиях. Используют для лечения гипертонических кризов.

Симпатолитики: ***резерпин***, ***октадин (гуанетидин)***; тормозят передачу импульсов непосредственно с окончаний симпатических нервов на гладкие мышцы сосудов, обладают седативным действием, что полезно при лечении гипертонической болезни.

Адреноблокаторы:

А) α - адреноблокаторы: ***фентоламин***, ***празозин***, ***доксазозин***, ***теразозин***; блокируют адренорецепторы гладких мышц стенок сосудов. Используются при нарушении периферического кровообращения.

Б) β - адреноблокаторы: ***пропранолол, метопролол***, ***атенолол***, ***талинолол***; уменьшают сократительную силу сердечной мышцы, снижают активность сосудодвигательного центра, обладают противоаритмическими свойствами. Назначают при стенокардии и гипертонической болезни. Противопоказаны больным с бронхиальной астмой и со склонностью к бронхоспазмам.

В) α и β - адреноблокаторы: ***карведилол***, применяются для систематического лечения артериальной гипертензии.

II. Антагонисты ренин-ангиотензивной системы

В почках вырабатывается фермент ренин. Он участвует в образовании ангиотензина I (неактивное вещество), который под влиянием АПФ превращается в ангиотензин II, который суживает сосуды и повышает продукцию альдостерона. Фермент альдостерон задерживает в организме ионы натрия и воду и способствует выделению из организма калия. Кроме того, АПФ тормозит синтез брадикинина, который способствует расширению сосудов. Значит, если уменьшить выброс АПФ, будет снижаться АД.

1. Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (и АПФ): ***Каптоприл*** (капотен)- назначают для лечения артериальной гипертензии. Побочные эффекты: нарушения вкуса, сухой кашель, гиперкалиемия, кожные высыпания и т.д.

Эналаприл, ***лизиноприл***, ***рамиприл***, ***трандолаприл*** применяют для лечения артериальной гипертензии. Побочные эффекты: нарушения вкуса, сухой кашель, гиперкалиемия, кожные высыпания.

2. Блокаторы ангиотензивных рецепторов: ***лозартан (козаар)***, ***вальсартан*** препятствуют действию ангиотензина II на ангиотензиновые рецепторы стенок сосудов.

3.Блокаторы кальциевых каналов (БМКК) – блокируют кальциевые каналы сердца и сосудов, расширяют сосуды и снижают артериальное давление, оказывают бронхолитическое, антиагрегантное, противоатеросклеротическое действие:

Верапамил (производное фенилалкиламина) – ослабляет и урежает сердечные сокращения, умеренно расширяет артериальные сосуды.

Нифедипин, ***амлодипин***, ***нитрендипин, фелодипин,лацидипин*** (дигидропиридиновые производные) – расширяют артериальные сосуды и снижают артериальное давление, вызывают рефлекторную тахикардию.

III. Миотропные средства

Оказывают прямое расслабляющее действие на гладкие мышцы сосудов, что приводит к снижению АД.

1).Дигидропиридиновые блокаторы кальциевых каналов: ***амлодипин***, ***нифедипин***, ***фелодипин***, ***лацидипин***;

2). Активаторы калиевых каналов: ***миноксидил***, ***никорандил***;

3).Разные миотропные средства:

Гидралазин, ***дигидралазин*** – применяют в комбинации с β - адреноблокаторами и резерпином;

Нитропруссид натрия – применяют при гипертензивных кризах, вводят внутривенно капельно.

Бендазол (дибазол) – спазмолитик миотропного действия, умеренно снижает артериальное давление. Вводят внутривенно при гипертензивных **кризах.**

Магния сульфат **-** обладает гипотензивным действием. Вводится внутримышечно и внутривенно.

IV. Диуретики

Повышение концентрации Na в стенках сосудов приводит к усилению сокращения гладких мышц сосудов. А задержка Na увеличивает содержание воды в организме и объём циркулирующей крови, что способствует повышению АД.

Усиленное выведение из организма ионов Na и воды способствует понижению АД.

Препараты: ***Гидрохлоротиазид (гипотиазид, дихлотиазид), фуросемид (лазикс), спиронолактон (альдактон, верошпирон), хлорталидон (оксодолин), индапамид.***

ГИПЕРТЕНЗИВНЫЕ СРЕДСТВА

Различают острую и хроническую артериальную гипотензию. Причиной острой гипотензии может быть острая сердечная недостаточность или обильное кровотечение. При этом применяют ***строфантин***, ***переливание крови*** и ***кровезаменителей***. Для быстрого повышения АД используют ***эпинефрин***, ***норэпинефрин***, ***мезатон***, ***эфедрин***, ***дофамин***.

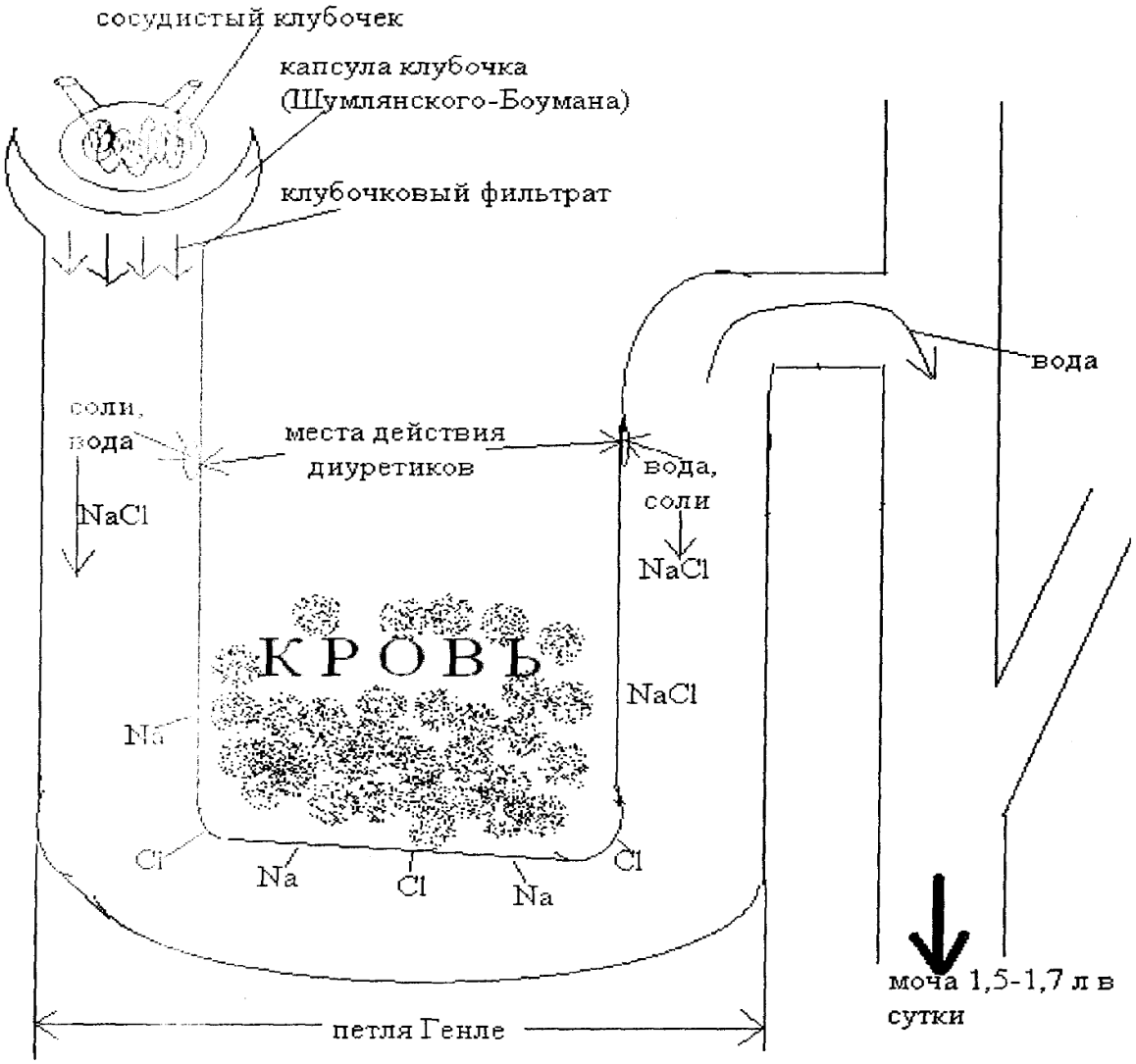
При хронической артериальной гипотензии используют общетонизирующие средства преимущественно растительного происхождения (***препараты лимонника, женьшеня*** т.д.).

Лекция № 20. Тема: Лекарственные вещества, влияющие на водно-солевой обмен. Противоподагрические и противохолистеринемические лекарственные средства

Мочегонными (или диуретическими) средствами называют лекарственные препараты, усиливающие выделение почками солей и воды. Так как диуретики в первую очередь выводят соли, их часто называют салуретиками. Их применяют в основном для уменьшения отёков, для снижения артериального давления при артериальной гипертензии, для выведения токсических веществ из организма.

Для уменьшения отёков и снижения артериального давления нужно прежде всего выводить из организма избыток натрия, так как он задерживает воду и способствует появлению отёков и артериальной гипертензии. Почки выводят из организма различные вещества, в том числе и токсичные. Чтобы быстрее удалить эти вещества применяют метод форсированного диуреза. Смысл его заключается в том, что внутривенно вводят 1-2 литра изотонического раствора натрия хлорида, а затем также внутривенно вводят высокоэффективный диуретик. При этом вместе с жидкостью из организма удаляется токсическое вещество.

Почка состоит из структурно-функциональных единиц - нефронов. В каждой почке около 1 миллиона нефронов. Каждый нефрон содержит сосудистый клубочек, который связан с канальцевым аппаратом посредством капсулы Шумлянского-Боумана. Через стенки капилляров сосудистого клубочка в капсулу происходит фильтрация плазмы крови за исключением крупномолекулярных белков. За сутки через нефрон проходит 150-170 л фильтрата (первичная моча). Образовавшийся фильтрат поступает в канальцы, где подвергается значительному обратному всасыванию в кровь (реабсорбции). От общего объема фильтрата после реабсорбции в канальцах остается 1% жидкости, что составляет за сутки 1,5-1,7л мочи (нормальный суточный диурез).



Реабсорбция - обратное всасывание. Активной реабсорбции подвергаются ионы Na^+, $C1^-$, K^+ в проксимальных канальцах, петле Генле и дистальных канальцах. Вода реабсорбируется пассивно (в проксимальных и дистальных канальцах).

Канальцевая реабсорбция фильтрата является сложным процессом. В нём принимают участие различные ферменты (карбоангидраза, сукциндегидрогеназа), гормоны (альдостерон, вазопрессин) (см. антагонисты ренин-ангиотензивной системы).

Классификация диуретиков

Диуретики делятся на 3 группы:

1. Диуретики, оказывающие прямое влияние на почечные канальцы:

а) препараты тиазидной структуры: гидрохлортиазид, циклометиазид

б) препараты разной структуры: фуросемид, кислота этакриновая, ацетазоламид (диакарб), триамтерен (птерофен), оксодимен, клопамид.

2. Антагонисты альдостерона: спиронолактон

3. Осмотические диуретики: маннитол, мочевина.

1). К первой группе относятся:

Гидрохлоротиазид (гипотиазид, дихлотиазид). Эффект начинается через 30-60 мин после приема внутрь и длится 8-12 часов. При этом выделяется больше воды, Na, C1, K. Несколько снижает АД. Недостаток препарата заключается в том, что он вызывает гипокалиемию. Она проявляется мышечной слабостью, потерей аппетита, нарушением сердечной деятельности. Для предупреждения гипокалиемии рекомендуется диета с обильным содержанием солей калия: печеный картофель с кожурой, изюм, курага или назначают препараты калия: панангин (аспаркам).

Циклометиазид (циклопентазид) - аналог гидрохлоротиазида, примерно в 50 раз активнее его.

Побочные действия: могут усиливаться явления подагры, т.к. задерживают выделение почками мочевой кислоты.

Хлорталидон–длительность действия до трёх суток.

Фуросемид (лазикс) диуретик быстрого и короткого действия вводится в виде раствора внутримышечно, внутривенно и таблетки внутрь.. При внутривенном введении эффект наступает через 10-15 минут и длится 2-3 часа.

Буметанид – сходен по действию с фуросемидом, но более активный. Назначают в меньших дозах.

Кислота этакриновая (урегит) - действие несколько продолжительнее, чем у фуросемида. Вызывает умеренное снижение АД.

Индапамид **–** обладает наряду с диуретическим собственно гипотензивным действием. Побочные эффекты: гипокалиемия, ортостатическая гипотензия.

Ацетазоламид (диакарб) - применяют в таблетках чаще при глаукоме и эпилепсии. Он снижает продукцию внутриглазной и спинномозговой жидкости.

Триамтерен (птерофен) - применяется в таблетках для лечения отёков,

вызванных сердечной недостаточностью.Уменьшает токсичность сердечных гликозидов. Механизм действия - уменьшает реабсорбцию солей калия на протяжении всего почечного канальца.

Является калий сберегающим диуретиком.

2. Вторая группа - антагонисты альдостерона

Спиронолактон (альдактон, верошпирон) альдостерон задерживает Na и воду, а спиронолактон усиливает выделение с мочой Na, но задерживает в

организме К. Поэтому не вызывает гипокалиемию. Выпускается в таблетках и капсулах для приёма внутрь. Является калийсберегающим диуретиком.

3. **Третья группа - осмотические диуретики**

Маннитол (манит) - вводятся внутривенно.

Механизм действия – повышает осмотическое давление в почечных канальцах. При этом происходит значительная реабсорбция воды и небольшая реабсорбция ионов Na. Применяют при олигурии (пониженном мочеотделении), связанной с кровопотерей, травмами, ожогами, при отёке мозга и лёгких, при тяжёлых приступах глаукомы.

Противоподагрические средства

При нарушении обмена мочевой кислоты она может откладываться в виде кристаллов в суставных хрящах (особенно рук и ног). Вокруг этих отложений развивается воспалительная реакция, суставы деформируются, появляются резкие боли. Такое заболевание называют подагрой.

Этамид - способствует выведению мочевой кислоты с мочой. Выпускается в таблетках, назначают внутрь.

Аллопуринол - выпускается в таблетках, назначают внутрь.

При мочекаменной болезни применяются растительные препараты: ***цистенал***, ***фитолизин***, ***ависан*** и др. Они обладают антибактериальным, противовоспалительным, мочегонным и спазмолитическим действием.

Противоатеросклеротические средства.

Атеросклероз кровеносных сосудов связывают с повышением в крови уровня холестерина и триглицеридов, а также с последующим повреждением эндотелия сосудов. Для снижения уровня холестерина и триглицеридов в крови применяют препараты:

Эзетимиб – уменьшает всасывание алиментарного (пищевого) холестерина.

Колестирамин, колестипол – связывают желчные кислоты в кишечнике.

Ловастатин, симвастатин, флувастатин, аторвастатин – наиболееэффективные гиполипидемические средства.

Никотиновая кислота – оказывает выраженное противоатеросклеротическое действие только в больших дозах – 3-6 г в сутки. Побочные эффекты: зуд, гиперемия лица, сердечные аритмии, нарушения функции печени.

Гемфиброзил, фенофибрат – гиполипидемические средства. Побочные эффекты: тошнота, анорексия (отсутствие аппетита), нарушение функций печени и т.д.

Лекция № 21. Тема: Лекарственные вещества, влияющие на функцию органов пищеварения.

Средства, влияющие на аппетит делятся на 2 группы:

1. Повышающие аппетит
2. Понижающие аппетит.

В головном мозге (гипоталамусе) имеются пищевые центры: центр голода и центр насыщения.

ЛС, повышающие аппетит применяются при потере аппетита. Это горечи: настойка полыни по 15-20 капель перед едой внутрь, настой травы золототысячника, корня одуванчика, корневища аира, листьев трилистника, горькая настойка.

Механизм действия: раздражая вкусовые рецепторы слизистой языка и ротовой полости, рефлекторно повышают возбудимость пищевого центра. Это ведет к рефлекторному усилению секреции желудочного сока и повышению аппетита.

Средства, угнетающие аппетит назначают при ожирении вследствие систематического переедания (алиментарное ожирение). Применяют флуоксетин (прозак), фенилпропаноламин, сибутрамин (мередиа), орлистат (ксеникал). Они возбуждают центр насыщения и чувство голода уменьшается.

***1.* ЛС, усиливающие секрецию желудочного сока**

назначают при недостаточности секреторной функции при гипацидных гастритах.

Гистамин очень активно усиливает выделение желудочного сока, вызываетмного побочных явлений. Поэтому его используют только в диагностике. «Гистаминная проба» - если после введения гистамина по желудочному зонду не появился желудочный сок, то это свидетельствует о полной атрофии слизистой оболочки желудка.

Разведенная хлористоводородная кислота - применяют по 10-15 капель на стакан воды во время или до еды. Входит в состав официнальных таблеток «Ацидин - пепсин».

Натуральный желудочный сок – содержит необходимые протеолитические ферменты.

Абомин– содержит протеолитические ферменты.

2. Группы ЛС угнетающие секрецию желудочного сока

Сюда входят следующие группы ЛВ

а) ЛС, избирательно блокирующие гистаминовые Н2 рецепторыслизистойжелудка

Применяют для снижения выделения соляной кислоты. Сюда относится ***фамотидин, ранитидин***. Применяются при язвенной болезни желудка и 12 перстной кишки.

б) Ингибиторы протонового насоса

Сюда относятся ***омепразол, пантопразол***, ***лансопразол***.

Омепразол (Омез). В кислой среде желудка превращается в активное вещество сульфанамид, который необратимо связывает мембранную Н+, К+ - АТФ-азу (пристеночный фермент). При этом подавляется секреция соляной кислоты. Побочные эффекты: тошнота, диарея, нарушение функции печени, активация микробной флоры ЖКТ.

в) М – холиноблокаторы

Снижают секрецию соляной кислоты.

Пирензепин (гастроцепин)- уменьшает выделение гистамина, тем самым снижается секреция соляной кислоты. Применяют для лечения язвенной болезни желудка и 12-ти перстной кишки.

Атропин – вызывает сухость во рту, расширение зрачков, паралич аккомодации, тахикардию. Поэтому в настоящее время при язвенной болезни применяется редко. Он также противопоказан при глаукоме, как сопутствующей патологии (на фоне язвенной болезни).

3. Антацидные средства

Это слабые основания, нейтрализующие соляную кислоту.

Алгедрат (Алюминия гидроокись) – нейтрализует соляную кислоту, обладает слабыми адсорбирующими свойствами. Его применяют в комбинации с магния гидрооксидом – это препараты альмагель, маалокс. Назначают при язвенной болезни желудка.

Натрия гидрокарбонат – быстро нейтрализует соляную кислоту. Для частого применения непригоден, так как при взаимодействии с соляной

кислотой образуется углекислый газ, который вызывает усиление секреции соляной кислоты. Кроме того, натрия гидрокарбонат хорошо всасывается в кишечнике и может вызвать алкалоз.

4. Гастропротекторы – вещества, защищающие стенку желудка и двенадцатиперстной кишки. Используют вяжущие средства, слизи, адсорбирующие вещества. Современные гастропротекторы делятся на 2 группы:

1. ЛС, создающие механическую защиту слизистой: ***висмута субнитрат*** (висмута нитрат основной), ***сукральфат***, ***висмута трикалиядицитрат*** (Де-нол). В кислой среде желудка образуют полимерную «пленку», которая защищает слизистую и поверхность язвы. Висмута трикалия дицитрат оказывает противомикробное действие в отношении Helicobacterpylori, которая может вызывать язвенную болезнь.

2. Препараты, повышающие защитную функцию слизистой желудка:

Мизопростол(сайтотек) – аналог простагландина E_1.

- снижает секрецию HCl;

- увеличивает секрецию слизи и гидрокарбоната, которые защищают слизистую оболочку желудка;

- расширяет кровеносные сосуды и улучшает кровоснабжение слизистой оболочки желудка;

- повышают устойчивость эпителия желудка к повреждающим факторам;

5. ЛС, усиливающие моторику желудка:

М-холиномиметики, М-,Н- холиномиметики, антихолинэстеразные средства. Для повышения тонуса желудка эти ЛС не используются, т.к. атония желудка бывает редко. Используются следующие гастрокинетики (прокинетики): ***домперидон***, ***метоклопрамид***.

Домперидон (мотилиум) – блокирует периферические дофаминовые Д-2 рецепторы. Это приводит к стимуляции моторики желудка, при этом происходит более быстрая эвакуация содержимого желудка в двенадцатиперстную кишку. Этот препарат обладает также противорвотными свойствами. Применяют при задержке эвакуации содержимого желудка, при тошноте, рвоте, рефлюкс - эзофагите.

Метоклопрамид (церукал) – блокатор дофаминовых Д-2 рецепторов. Применяют при задержке эвакуации содержимого желудка, при тошноте, рвоте, рефлюкс-эзофагите.

6. ЛС, угнетающие моторику желудка:

М - холиноблокаторы (атропин, платифиллин), ганглиоблокаторы. Используются при лечении язвенной болезни желудка и гиперацидных гастритов.

Лекция № 22. Тема: Лекарственные средства, влияющие на функцию органов пищеварения.

Рвота - это сложная рефлекторная реакция организма в ответ на раздражение слизистой оболочки ЖКТ или результат прямого возбуждения рвотного центра, расположенного в продолговатом мозге. Пусковая зона этого центра содержится в дофаминовых Д-2 рецепторах.

Рвотные средства

Апоморфин - действие наступает через несколько минут после введения подкожно 0,2 - 0,5 мл раствора в концентрации 10мг/мл. Используется при лечении алкоголизма. Противопоказан при заболеваниях ССС, лицам старческого возраста, при язвенной болезни желудка и 12-ти перстной кишки.

Противорвотные средства

1. При гастритах и язвенной болезни желудка используют обволакивающие, вяжущие средства, местные анестетики (***бензокаин***, ***прокаин***).

2. При возбуждении рвотного центра назначают нейролептики (галоперидол).

3. Для профилактики и лечения морской и воздушной болезни используются холиноблокирующие и противогистаминные препараты: таблетки **«Аэрон»**, куда входит М-холиноблокатор – ***скополамин*** или пластырь со скополамином.

4. Блокаторы дофаминовых Д-2 рецепторов рвотного центра: ***домперидон*** и ***метоклопрамид*** (церукал).

5. При болезни движения применяют ***прометазин*** (дипразин, пипольфен), ***дифенгидрамин*** (димедрол).

6. При рвоте, связанной с применением противоопухолевых средств, радиотерапии опухолей применяют ***ондасетрон***, ***трописетрон***, ***гранисетрон***, а также ***тиэтилперазин***, ***галоперидол***, ***метоклопрамид***, ***домперидон***.

ЛС, влияющие на секреторную функцию поджелудочной железы

Они делятся на 3 группы:

1. ЛС, стимулирующие секрецию ферментов;

2. ЛС заместительной терапии.

3. ЛС, подавляющие секрецию ферментов;

1). Физиологическим стимулятором секреторной функции поджелудочной железыявляется соляная кислота. Следовательно, при пониженной кислотностижелудочного сока нарушается функция не только желудка, но и поджелудочной железы. (Разведённая HCl - желудочный сок)

2). При недостаточности секреторной функции поджелудочной железы в качестве заместительной терапии назначают ферментный препарат ***панкреатин***, который получают из поджелудочных желез убойного скота. Он содержит ***трипсин*** и***амилазу***.

Панзинорм-форте - содержит трипсин, хемотрипсин, липазу, амилазу. Это обеспечивает хорошую перевариваемость жиров, белков и углеводов.

Фестал, трифермент, дигестал, ораза - комплексные препараты. Содержат компоненты поджелудочной железы и желчи. Показания те же.

3). Антиферментные препараты: ***апротинин*** (контрикал) ,***пантрипин***,

трасилол – назначают при остром панкреатите для инактивации протеолитических ферментов поджелудочной железы, главным образом трипсина, т.к. при остром панкреатите ферменты (трипсин) активируются в самой поджелудочной железе иначинают разрушать ткань железы.

Желчегонные средства

способствуют очищению желчевыделительной системы от слизи, микроорганизмов, улучшают пищеварение в кишечнике. По механизму действия делятся на 2 группы:

1. ЛС, усиливающие продукцию желчи;

2. ЛС, способствующие выведению желчи;

3.ЛС, устраняющие спазм желчевыводящих путей;

1. К первой группе относятся - препараты дегидрохолиевой кислоты - ***хологон*** и ***дегидрохолин***. Хологон - способствует как образованию, так и выведению желчи (2 действия). Противовоспалительными свойствами обладают препараты пижмы, куркумы, мяты перечной.

Таблетки «Аллохол», «Холензим» содержат сухую желчь. Растительные препараты: «Холосас», кукурузные рыльца, цветы бессмертника, шиповника,

синтетические препараты: осальмид (оксафенамид), гимекромон (одестон), цикловалон (циквалон), - способствует не только образованию, но и отделению желчи (спазмолитическое действие).

2.Ко второй группе относят ***магния сульфат***, спазмолитики (***папаверин***, ***дротаверин***, ***но-шпа***) или м-холиноблокаторы (***атропин***, ***платифиллин***) ***Магния сульфат*** - раствор в концентрации 250мг/мл назначают внутрь или вводят через дуоденальный зонд в 12 перстную кишку. Происходит рефлекторное сокращение желчного пузыря, расслабление сфинктера Одди и желчь выбрасывается в кишечник. Подобным действием обладают оливковое и подсолнечное масла.

3.При спазмах желчных протоков назначают спазмолитики миотропного действия (***папаверин***, ***дротаверин, но-шпа***) и М-холиноблокаторы (***атропин, платифиллин***). Во время приступа печеночной колики спазмолитики назначают совместно с наркотическими анальгетиками: ***морфином, промедолом, омнопоном***.

ЛС, усиливающие двигательную функцию кишечника

- применяются при атонии кишечника, например, после хирургических операций. Это М - холиномиметики (***ацеклидин***) или антихолинэстеразные препараты - ***неостигмина метилсульфат*** (прозерин). Для усиления перистальтики кишечника при запорах, для быстрейшего удаления из кишечника токсических веществ при отравлении используются слабительные средства.

Слабительные средства

раздражают рецепторы слизистой оболочки кишечника, что приводит к рефлекторному усилению его перистальтики. По происхождению они делятся на солевые, растительные и синтетические.

Солевые: ***магния сульфат и натрия сульфат***.

Растительные: ***масло касторовое, порошок корня ревеня***, ***экстракт крушины***, ***лист***ья ***сенны, регулакс***, ***гутталакс.***

Синтетические - ***фенолфталеин, бисакодил*** .

По локализации действия слабительные делят на следующие группы:

1) действующие на протяжении всего кишечника. Их применяют при острых запорах;

2) действующие на толстый кишечник – применяют при хронических запорах;

1.К первой группе относятся:

Солевые слабительные:

Магния сульфат и натрия сульфат - плохо всасываются в ЖКТ и задерживают всасывание жидкости. Объем жидкости в кишечнике увеличивается. Это приводит к разжижению содержимого кишечника, раздражению его рецепторов и рефлекторному усилению перистальтики. Назначают по 15-20 г в стакане теплой воды. Слабительный эффект наступает через 2 – 4 часа после приема препарата.

Масло касторовое (масло семян клещевины обыкновенной) – ***растительное слабительное***, которое в ***12 перстной кишке*** расщепляется с образованием рициноловой кислоты. Соли рициноловой кислоты раздражают слизистую кишечника и усиливают его перистальтику. Назначают внутрь по 15 – ЗО г. Действие наступает через 3-6 часов после приема. Применяют в детской практике при острых запорах. В акушерской практике иногда назначают по 40-50г касторового масла для рефлекторной стимуляции родовой деятельности.

2.Ко второй группе относятся:

Растительные слабительные, которые влияют преимущественно на толстый кишечник. Применяют при хронических запорах. Слабительный эффект выражен умеренно и проявляется через 8-10 часов после приема препарата. Содержат антрагликозиды, которые всасываются в тонком кишечнике и выделяются в толстом кишечнике и усиливают его перистальтику. Препараты назначают на ночь, чтобы эффект появился утром.

Сюда относятся ***порошок корня ревеня***, ***экстракт крушины***, ***лист***ья ***Сенны*** - ***Сенаде*** (глаксена), ***регулакс***, ***гутталакс***.

Некоторые препараты (***морская капуста***, ***форлакс***) вызывают слабительный эффект за счет увеличения объема кишечного содержимого

Синтетические вещества – ***фенолфталеин,бисакодил*** по характеру действия сходны с антрагликозидами и используются при хроническом запоре.

Вазелиновое масло не всасывается, размягчает каловые массы, что способствует их продвижению. Назначают по 1-2 стол, ложке при

хронических запорах. Применяют также суппозитории с ***глицеролом*** (глицерин).

Лактулоза - обладают послабляющим свойством. Действуют на толстый кишечник.

ЛС, ослабляющие двигательную функцию кишечника

Это спазмолитики миотропного действия (***папаверин***, ***дротаверин***, ***но-шпа***) и М-холиноблокаторы (***атропин***, ***платифиллин***). Их используют при спазмах кишечника (кишечные колики). При острой и хронической диарее применяют ***лоперамид*** (имодиум), который, воздействуя на опеоидные рецепторы кишечника угнетает его перистальтику. При воспалительных заболеваниях кишечника (острых и хронических колитах), которые сопровождаются спазмами и диареей, назначают ***вяжущие***, ***противовоспалительные***, ***противомикробны***е и ***адсорбирующие средства*** (активированный уголь), а также пробиотики: «***Линекс***».

Лекция № 23. Тема: ЛВ, влияющие на систему крови: лекарственные вещества, влияющие на кроветворение.

Болезни системы крови возникают в результате нарушений процессов кроветворения или свертывания крови. ЛВ, влияющие на систему крови, делятся на 2 группы:

1. ЛС, влияющие на кроветворение :

а) ЛС, влияющие на эритропоэз(образование эритроцитов): увеличивающие и угнетающие эритропоэз.

б) ЛС, влияющие на лейкопоэз (образование лейкоцитов): увеличивающие и угнетающие лейкопоэз.

2. ЛС, влияющие на свертывание крови (способствующие разжижению крови и способствующие свёртыванию крови).

Лекарственные средства, влияющие на эритропоэз

1. ***Лекарственные средства, стимулирующие эритропоэз***

К стимуляторам эритропоэза относя эпоэтины, цианокобаламин, фолиевую кислоту, препараты железа.

Железо восстановленное применяется в капсулах и таблетках. Побочные явления: тошнота, рвота из-за раздражающего действия препарата на слизистую оболочку ЖКТ.

Ферковен - вводится парентерально

Феррум Лек - в таблетках перорально и в ампулах парентерально.

Из ЖКТ лучше всасываются препараты двухвалентного (закисного) железа: Железа закисного сульфат или железа закисного лактат.

«Ферроплекс» - комплексный препарат в драже для перорального применения.

Усвоению железа способствуют небольшие количества меди и кобальта. ***Коамид*** - препарат кобальта.

Гемостимулин - комплексный препарат. Содержит сухую кровь, сульфат закиси железа и сульфат меди.

Эпоэтин - α (эпрекс) это человеческий рекомбинантный эритропоэтин, получен генной инженерией. Вводится подкожно и внутривенно.

Цианокобаламин (витамин В12) - назначают при злокачественной анемии, связанной с отсутствием в желудке внутреннего фактора Кастла, который способствует всасыванию цианокобаламина. Препарат вводят внутримышечно, подкожно, внутривенно,т.к. в ЖКТ он плохо всасывается. Он депонируется печенью и постепенно используется в процессах кроветворения.

Фолиевая кислота (витамин B_c) стимулирует процессы регенерации. Используется при макроцитарной анемии и многих других заболеваниях (заболевания печени, нервной системы).

опухолях костного мозга. В таких случаях для угнетения эритропоэза используют препарат ***радиоактивного фосфора***.

2. ***Лекарственные средства, угнетающие эритропоэз***

Избыточная продукция эритроцитов иногда наблюдается при злокачественных

Лекарственные средства, влияющие на лейкопоэз

Они делятся на 2 группы:

1) ЛС, усиливающие лейкопоэз;
2) ЛС, угнетающие лейкопоэз;

1. ***ЛС, усиливающие (стимулирующие лейкопоэз)***

Наиболее частыми причинами лейкопений являются хронические инфекции и угнетение функции костного мозга различными ядами.

Пентоксил - в порошках и таблетках для приёма внутрь.

Деринат (натрия дезоксирибонуклеат)-используется в/м и для аппликаций.

Метилурацил - применяют в таблетках внутрь, свечах, во флаконах п/к и в/в;

Молграмостим (лейкомакс) используют в виде 10% мази.

Названные препараты являются стимуляторами лейкопоэза. Они также усиливают процессы регенерации в других органах и тканях и способствуют восстановлению поврежденной ткани, печени, слизистых оболочек, заживлению ран и язв.

2. *ЛС, угнетающие лейкопоэз*

Используются для лечения злокачественных опухолей кроветворных органов -лейкозов. При лейкозах в кровь из кроветворных тканей поступает большоеколичество незрелых лейкоцитов, повышая нормальное их число в десятки раз. Длялейкозов характерно разрастание кроветворной ткани, увеличение лимфатическихузлов, селезенки, появление метастазов опухоли в печени, легких и других органах.

Течение лейкозов бывает острое и хроническое. Для лечения лейкозов используются противоопухолевые средства.

Циклофосфамид (циклофосфан) - вводят в/в. Применяют при остром лейкозе,миеломе, раке яичника и молочной железы.

Метотрексат, меркаптопурин, флуорурацил (орторурацил) – нарушают синтезнуклеиновых кислот, что приводит к задержке деления клеток.

Противоопухолевые антибиотики:***дактиномицин, рубомицин***, ***оливомицин***и другие - применяют при лейкозах и некоторых формах рака.

Растительные алкалоиды ***колхамин, винбластин, винкрастин*** - нарушают деление клеток. Применяют при опухолях лимфатических узлов.

Гормоны коры надпочечников (глюкокортикоиды) - применяют при лейкозах.

Лекция № 24. Тема:ЛВ, влияющие на систему крови: лекарственные средства, влияющие на свертывание крови.

Фазы свертывания крови

1 - из тромбоцитов освобождается тромбопластин, который активируется ионамикальция и превращается в протромбин, который синтезируется печенью. (т.е. тромбопластин + Са = протромбин)

2 – протромбин в присутствии кальция превращается в тромбин (протромбин + Са = тромбин) .

3 - под влиянием тромбина растворимый белок крови фибриноген превращается в фибрин, который выпадает в виде густого сплетения тончайших нитей. (тромбин + фибриноген = фибрин). Образовавшийся сгусток крови постепенно уплотняется и превращается в тромб.

ЛС, влияющие на свертывание крови делятся на 3 группы:

1) ЛС, влияющие на агрегацию тромбоцитов;

2) ЛС, влияющие на свертывание крови ;

3) ЛС влияющие на фибринолиз;

1). ЛС, уменьшающие агрегацию тромбоцитов (антиагреганты)

Агрегация - это прилипание тромбоцитов друг к другу или к стенкам сосудов.Процесс агрегации тромбоцитов в организме человека регулируется системой ферментов *тромбоксан - простациклин.*

Тромбоксан - синтезируется в тромбоцитах, повышает их агрегацию и вызывает сужение сосудов.

Простациклин – препятствует агрегации тромбоцитов и вызывает расширение сосудов.

Лекарственные вещества:

Кислота ацетилсалициловая (аспирин) угнетает образование тромбоксана и агрегация тромбоцитов уменьшается. При назначении небольших доз ацетилсалициловой кислоты синтез тромбоксана угнетается в большей степени. Выпускается в порошках и таблетках для приёма внутрь.

Дипиридамол (курантил) обладает коронарорасширяющим и анти-агрегатным действием. Выпускается в драже и таблетках внутрь и растворах в ампулах для в/м и в/в введения.

Тиклопедин и клопидогрел - обладают антиагрегатным действием. Назначают внутрь для профилактики инфаркта миокарда, инсульта у больных атеросклерозом.

Эптифибатид - обладает антиагрегантным действием. Вводят внутривенно. Может вызвать тромбоцитопению.

2). Лекарственные средства, влияющие на свертывание крови

ЛС, снижающие свертывание крови(антикоагулянты)

Антикоагулянты делят на 2 группы: антикоагулянты

прямого и непрямого действия (см. схему)

Непрямые антикоагулянты → печень (биосинтез протромбина)

IТромбопластин +Са ←прямые антикоагулянты – натрия цитрат

II Протромбин

↓

Тромбин ←гепарин

IIIФибриноген

↓

Фибрин

Фибринолизин ←активаторы фибринолиза

Продукты протеолиза фибрина

Для предупреждения тромбообразования при некоторых заболеваниях сосудов, сердца используют различные антикоагулянты.

Антикоагулянты прямого действия

Прямые антикоагулянты уменьшают активность тромбопластина, задерживают образование тромбина и снижают его активность. Это тормозит переход фибриногена в фибрин. Прямые антикоагулянты препятствуют также агрегации (прилипанию) тромбоцитов друг к другу и к стенке сосуда.

Гепарин - естественное противосвёртывающее средство, образуется в организме тучными клетками. Его получают из тканей животных.

Дозируют в единицах действия (ЕД).Тормозит образование тромбопластина и тромбина, активирует фибринолиз и снижает агрегацию тромбоцитов и эритроцитов. Вводится внутримышечно, внутривенно и подкожно.

При в/в введении действие начинается сразу и продолжается 3-5 часов.Разрушается в печени ферментом гепариназой.

Выпускают во флаконах по 5 мл (5000 ЕД; 10000 ЕД; 20000 ЕД в 1 мл), а также в видемази, геля. При передозировке возможны кровотечения, поэтому его вводят под контролем анализа крови ПТИ и МНО .

Низкомолекулярные гепарины: ***надропарин*** (фраксипарин), ***далтепариннатрия***, ***эноксапарин натрия*** – вводят подкожно один раз в сутки.

Эликвис (апиксабан), прадакса, ксарелто – антикоагулянты прмого действия. Применяют в таблетках. Контроль ПТИ и МНО не применяют.

Натрия цитрат образует с ионами кальция соль, которая трудно диссоциирует . В качестве антикоагулянта его в организм не вводят, т.к. резкое падение ионов Са в крови вызывает нарушение функции сердца и ЦНС. Используют только для консервирования донорской крови.

Для предупреждения кровотечений вводят в/в антагонист – ***протамина сульфат***.

Гирудин - содержится в слюнных железах медицинских пиявок и поступает в организм человека во время сосания крови.

Медицинские пиявки иногда используют при тромбоэмболических заболеваниях(гирудотерапия).

Антикоагулянты непрямого действия

Они тормозят синтез протромбина в печени.

Фениндион (*фенилин),* ***аценокумарол****(синкумар)* – выпускают в таблетках

Варфарин–применяют в таблетках внутрь.

Действие начинается через 12-24 часа после приема внутрь. При повторных приемах легко развивается кумуляция. Поэтому их назначают под контролем ПТИ и МНО, чтобы не допустить кровотечения.

Применяют для длительной профилактики и лечения тромбозов, тромбоэмболии, тромбофлебитов.

Противопоказаны при геморрагических диатезах, язвенной болезни, беременности, нарушениях функции почек, печени.

3. Лекарственные средства, влияющие на фибринолиз

а) Фибринолитические средства

Используют для растворения свежих нитей фибрина.

Препараты:

Стрептокиназа – выделена из культуры стрептококка Назначают в/в капельно. Используют при лечении тромбозов и эмболии. Возможны аллергические и пирогенные реакции.

Алтеплаза (актилизе) получена методом генной инженерии. Способствует растворению тромба.

Урокиназа - выделена из мочи. Не аллергена. Применяется при лечении тромбозов и эмболии. При передозировке фибринолитических препаратов возникают кровотечения. Для их остановки используют кислоту аминокапроновую, амбен (памба).

Противопоказаны при геморрагических диатезах, язвенной болезни, беременности, нарушениях функции почек, печени.

б)Антифибринолитические лекарственные средства

Аминокапроновая кислота и ***транексамовая кислота*** – препятствуют превращению профибринолизина в фибринолизин. Вводят внутривенно.

Апротинин (контрикал) – тормозит фибринолиз. Вводят внутривенно.

б) ЛС, повышающие свёртывание крови

Тромбин – это естественный компонент свертывающей системы крови. Парентерально вводить нельзя. Применяется только местно при капиллярных кровотечениях: гемостатические губки, тампоны, свечи, содержащие тромбин.

Фибриноген - составная часть крови. Вводят в/в капельно.

Протамина сульфат - выпускается в ампулах для в/в введения.
Менадиона натрия бисульфит (викасол) – синтетический аналог витамина К, который принимает участие в синтезе протромбина в печени. Назначают внутрь в таблетках и внутримышечно при кровотечениях.

Этамзилат (дицинон) – выпускается в таблетках внутрь и в ампулах для в/м и в/в введения, адроксон.

При хронических кровотечениях используют лист крапивы, траву тысячелистника, водяного перца, кору калины, цветы арники. Их назначают внутрь в виде экстрактов, настоев, отваров.

Лекция № 25. Тема: Препараты гормонов и их синтетические аналоги

Гормоны – это биологически активные вещества, которые вырабатываются железами внутренней секреции.

К железам внутренней секреции относят щитовидную железу, паращитовидные железы ,кору надпочечников, островки Лангерганса поджелудочной железы, половые железы (яичники у женщин и семенники у мужчин).

Гипофиз - это эндокринная железа величиной с горошину, расположенная в углублении турецкого седла. Различают переднюю, среднюю и заднюю доли гипофиза.

Передняя доля гипофиза вырабатывает ***соматотропный гормон*** (гормон роста), ***адренокортикотропный гормон*** (АКТГ) (стимулирует кору надпочечников), ***тиреотропный*** (стимулирует активность щитовидной железы) и ***гонадотропные гормоны***: ***фолликулостимулирующий***, ***лютеинизирующий*** и ***лактотропный***(стимулируют активность половых желез).

Средняя доля гипофиза синтезирует меланинстимулирующий гормон. Задняя доля гипофиза продуцирует окситоцин и вазопрессин (антидиуретический гормон).

Передняя и средняя доли объединяются под названием аденогипофиз. Задняя доля называется нейрогипофиз.

В организме существует гипоталамо – гипофизарная связь, т.е. гипоталамус воздействует своими гормонами на гипофиз, а гипофиз выделяет гормоны, действующие на организм.

Препараты гормонов гипоталамуса

Соматостатин **–** гормон гипоталамуса. Подавляет гормон роста.

Октреотид - синтетический аналог соматостатина. Действие как у соматостатина.

Ланреотид - действие как у соматостатина, но более длительное.

Бромокриптин (Парлодел) – дофаминомиметик. Угнетает избыточную продукцию гормона роста. Выпускается в таблетках для приёма внутрь.

Протирелин – гормон гипоталамуса, стимулирует высвобождение тиреотропногогормона гипофизом.

Рифатироин – синтетический аналог протирелина. Стимулирует высвобождениетиреотропного гормона гипофизом.

Гонадорелин. Он стимулирует высвобождение гонадотропных гормонов гипофизом.

Препарат: ***Гозерелин (золадекс) и трипторелин –*** синтетический препарат, стимулирует высвобождение гонадотропных гормонов гипофиза – фолликулостимулирующего и лютеинизирующего гормонов. Их применяют при раке предстательной железы.

Даназол (данол) - синтетический препарат, угнетает секрецию гонадотропных гормонов, следовательно, угнетает функцию яичников и сперматогенеза. Применяют при эндометриозе, маточных кровотечениях, гинекомастии.

Гормоны передней доли гипофиза

1. Соматотропин - гормон роста, стимулирует рост организма. При его нехватке в детстве и подростковом возрасте развивается карликовость, при избытке – развивается гигантизм. У взрослых при избытке этого гормона наступает увеличение отдельных частей тела: кистей, стоп, носа, языка.

Заболевание называется «акромегалия». В лечебной практике используются ***соматотропин*** и ***соматотрем*** – препараты гормона роста. Применяются при задержке роста. Вводятся внутримышечно.

2.Тиреотропный гормон - стимулирует продукцию гормонов щитовидной железы.Для практического применения выпускается препарат

Тиротропин – его применяют при недостаточной функции щитовидной железы и для диагностики.

3.Препараты АКТГ :

Кортикотропин – используется при функциональной недостаточности коры надпочечников. Показания как у глюкокортикоидов, но вызывает образование антител. Противопоказан при сахарном диабете (повышает сахар), ГБ, язвенной болезни желудка и 12 перстной кишки.

Тетракозактид - синтетический аналог АКТГ, почти не вызывает образование антител. Противопоказания те же.

4.Гонадотропные гормоны :Фолликулостимулирующий,лютеинизирующий – стимулируют функции мужских и женских половых желез.

Препараты:

Фоллитропин –α и ***–β*** – рекомбинантные препараты фолликулостимулирующего гормона, которые применяют при недостаточном развитии фолликулов яичника.

Гонадотропин хорионический выделен из гормона плаценты. Его получают из мочи беременных женщин. Применяются у женщин при бесплодии, у мужчин при недостаточной продукции тестостерона (гипогонадизм, крипторхизм).

Лактотропный - стимулирует секрецию молока, развитие молочных желез.

Лактин - препарат лактотропного гормона. Назначают для повышения лактации в послеродовом периоде.

Гормоны средней доли гипофиза

Меланофорный гормон **-** улучшает остроту зрения, адаптацию в темноте.

Гормоны задней доли гипофиза

Вазопрессин - суживает сосуды, повышает АД, значительно усиливает обратное всасывание воды в канальцах почек. При его недостатке резко возрастает диурез. Такое заболевание называется несахарным диабетом.

Производные вазопрессина:

Десмопрессин **–** вводится интраназально при несахарном диабете.

Окситоцин **–** гормон задней доли гипофиза. Препарат ***окситоцин*** стимулирует ритмические сокращения миометрия во время родов, повышает тонус матки, что ведёт к быстрому уменьшению размеров матки после родов и прекращению послеродового кровотечения, увеличивает лактацию.

Демокситоцин (дезаминокситоцин). Действие и применение как у окситоцина.

Препараты гормонов щитовидной железы и антитиреоидные препараты.

Щитовидная железа вырабатывает три гормона: тироксин, трийодтиронин икальцитонин. Недостаток тироксина и трийодтиронина в детском возрасте приводитк нарушению умственного и физического развития ребенка (кретинизм), у взрослых к резкому замедлению обмена веществ, отеку тканей (микседема). Недостаточность щитовидной железы также может развиться при недостатке в пище йода, благодаря которому синтезируются тироксин и трийодтиронин. При этом происходит компенсаторное увеличение щитовидной железы (образуется зоб). Заболевание называют эндемическим зобом.

Заместительные гормональные препараты

При недостаточности тироксина и трийодтиронина назначают

Левотироксин натрия (левотироксин) или ***лиотиронин*** (Трийодтиронин 50 Берлинхеми).

Противопоказаны при сахарном диабете, гиперфункции щитовидной железы.

С профилактической целью и при эндемическом зобе назначают препараты йода - «***Йодомарин***», йодированную соль, ламинарию .

Кальцитонин (тирокальцитонин) гормон щитовидной железы. Способствуетотложению Са из крови в костную ткань. Применяется при остеопорозе. Вводят подкожно и внутримышечно.

Синтетические аналоги кальцитонина: цибакальцин и миакальцик, действуют болееактивно и более продолжительно.

Антитиреоидные препараты

Используют при гиперфункции щитовидной железы (тиреотоксикоз, базедова болезнь).

Тиамазол (Мерказолил), пропилтиоурацил – тормозят синтез гормонов щитовидной железы.

Препараты гормонов паращитовидных желез

Паращитовидные железы вырабатывают гормон паратиреоидин, который регулирует кальциевый и фосфорный обмен в организме. При его нарушении появляются судороги и спазмы гладкомышечных органов, ослабление сердечных сокращений.

Паратиреоидин – вытяжка из паращитовидных желез убойного скота. Вводят п/к и в/м.

Миакальцик – применяют при остеопорозе.

Помощь при судорогах:

Кальция хлорид - раствор в концентрации 100 мг/мл внутривенно или раствор кальция глюконата в концентрации 100 мг/мл .

Кальцитонин - действие, как у паратиреоидина, только более выраженное, вводят подкожно и внутримышечно.

Лекция № 26. Тема: Препараты гормонов и их синтетические аналоги (окончание).

Гормональные препараты поджелудочной железы

Поджелудочная железа является железой внешней и внутренней секреции. В поджелудочной железе находятся островки Лангерганса, которые вырабатывают два гормона: инсулин и глюкагон. Уровень глюкозы в крови под влиянием инсулина снижается. При недостаточной продукции инсулина развивается сахарный диабет. Препарат инсулина - вытяжка из поджелудочных желез убойного скота. Доза каждому больному устанавливается индивидуально и рассчитывается на количество сахара, выделенного с мочой за сутки.

Различают инсулины:

1. Ультракороткого действия (аналоги инсулина человека)
   а) инсулин лизпро (хумалог)
   б) инсулин аспарт (ново Рапид Пенфилл)
2. Инсулины короткого действия - инсулин растворимый: актрапид, хумулин Регуляр, инсуман рапид ГТ.
3. Инсулины средней продолжительности действия: инсулина цинк, протаоран, хумулин, инсуман, базал.
4. Инсулины длительного действия: ультратард, инсулин гларгин
5. Смешанные в различных пропорциях - инсуман комб

Синтетические гипогликемические средства

1.Производные сульфонилмочевины:

Глибенкламид (манинил), ***гликлазид***, ***гликвидон***, ***глимепирид*** – повышают чувствительность инсулиновых рецепторов к действию инсулина. Выпускают в таблетках для приёма внутрь.

2.Бигуаниды:

Метформин (сиофор) – угнетает образование глюкозы в печени, снижает всасывание глюкозы в кишечнике. Выпускают в таблетках для приёма внутрь. Уменьшает аппетит, способствует снижению избыточной массы тела.

3.Тиазолидондионы:

Пиоглитазон – используют для лечения сахарного диабета в форме монотерапии, а также в комбинации с различными препаратами инсулина и с гипогликемическими средствами.

4.Ингибиторы α-глюкозидаз:

Акарбоза (глюкобай) – расщепляет крахмал и дисахариды и способствуют их всасыванию в кишечнике. Выпускается в таблетках для приёма внутрь.

Препараты, повышающие уровень сахара в крови

Глюкагон – гормон, вырабатываемый островками Лангерганса поджелудочной железы. Облегчает атриовентрикулярную проводимость. Препарат вводят подкожно, внутримышечно или внутривенно. Применяют при гипогликемии, сердечной недостаточности.

Гормоны надпочечников

Надпочечники – железы внутренней секреции, прилегающие к верхним полюсам почек.Надпочечники состоят из двух слоев – внутреннего (мозгового) и наружного (коркового). В мозговом слое вырабатывается адреналин. Корковый слой вырабатывает ряд стероидных гормонов, которые делятся на 3 группы:

1. Минералкортикоиды
2. Глюкокортикоиды
3 . Половые гормоны

Минералкортикоиды регулируют водно-солевой обмен в организме, задерживают Na и воду. При недостаточной их продукции организм теряет в большом количестве соли натрия и воду, концентрация калия при этом увеличивается. Идёт обезвоживание организма, расстройство деятельности сердца, общее истощение.

Наступает смерть. Антагонист минералкортикоидов – спиронолактон (см. лекцию).

Препарат ***Дезоксикортикостерона (дезоксикортон)*** - выпускаются в таблетках для перорального применения и раствор в ампулах.

Глюкокортикоиды – действие:

1 . Повышают уровень глюкозы в крови и гликогена в печени и мышцах;
2. Тормозят синтез белков в организме и усиливают их разрушение;
3. Угнетают развитие лимфоидной ткани и продукцию антител;
4. Оказывают противоаллергическое и десенсибилизирующее действие;
5. Обладают высокой противоревматической активностью;
6. Обладают противошоковыми свойствами;

Продукцию глюкокортикоидов стимулирует адренокортикотропный гормон (АКТГ).***Препараты природных глюкокортикоидов***: ***гидрокортизон*** - 0,1 % крем, лосьон, 1% мазь, 0,5% глазная мазь, суспензия в концентрации 25 мг/мл в ампулах по 2мл для интрасиновиального и в/м введения.

Синтетические аналоги:

Преднизолон - выпускается в таблетках, мазь, глазные капли, раствор в ампулах в/м, в/в.

Дексаметазон - раствор в ампулах в/м.

Беклометазон – выпускается в виде мази, крема, входит в состав мазей «Целистодерм В», «Дипросалик», «Тридерм».

Дезоксикортон – масляный раствор в ампулах в/м, таблетки под язык.

Флуметазон, флуоцинолона ацетонид.

Глюкокортикоиды применяются:

1. Для лечения ревматизма, ревматоидных артритов и коллагенозов в качестве противовоспалительных средств;
2. В качестве иммунодепрессантов при пересадке тканей, при некоторых аутоиммунных заболеваниях;
3. В качестве противоаллергических средств при анафилактическом шоке, при бронхиальной астме, при аллергических дерматитах, экземе.

4. При злокачественных заболеваниях кроветворных органов.
Побочные явления: обострение язвенной болезни желудка и 12 перстной кишки, развитие сахарного диабета, обострение скрытых и хронических инфекций, психиатрические расстройства, нарушение белкового и жирового обмена. Противопоказания: язвенная болезнь желудка и 12 перстной кишки, ГБ, психические болезни, сахарный диабет.

Препараты женских половых гормонов

Их делят на эстрогенные и гестагенные.

В период полового созревания эстрогены обеспечивают формирование телосложения по женскому типу. Продукция эстрогенов происходит в фолликулах
яичника под влиянием фолликулостимулирующего гормона (гипофиза), здесь же развивается яйцеклетка. Когда яйцеклетка созрела, фолликул лопается и созревшая яйцеклетка попадает в маточную трубу. На месте лопнувшего фолликула образуется желтое тело, которое вырабатывает гестагенный гормон. Он способствует прикреплению оплодотворенной яйцеклетки к слизистой оболочки матки, понижает еёчувствительность к окситоцину, способствует вынашиванию беременности.

Препараты женских половых гормонов. Их делят на***эстрогенные*** и ***гестагенные***.

Эстрогенные препараты:

Природные эстрогенные препараты: эстрадиол – получают из мочи беременных женщин или беременных животных.

Эстрадиола дипропионат–применяют в таблетках масляный раствор в концентрации 1 мг/мл в ампулах по 1 мл для внутримышечного введения.

Синтетические эстрогенные препараты:

Этинилэстрадиол – назначают внутрь.

Гексэстрол (синэстрол) применяют масляный раствор в концентрации 1 мг/мл или 2 мг/мл в ампулах по 1мл внутримышечно таблетки внутрь.

Показания к применению: отсутствие менструаций, бесплодие, слабость родовой деятельности, климактерический период.

Комбинированные препараты (эстрогены + гестагены + антиандрогены):

Клиогест, ***климен*** - применяются в климактерическом периоде.

Мужчинам эстрогены назначают при раке предстательной железы.

При длительном применении эстрогенов у женщин могут возникать маточные кровотечения.

При приеме внутрь возможна тошнота, рвота, понос. У мужчин эстрогены вызываютфеминизацию (развитие женских вторичных половых признаков), снижают либидо(половое влечение), потенцию.

Антиэстрогенные средства – применяют в случае бесплодия у женщин.

Кломифен -в таблетках для приёма внутрь.

Тамоксифен – показан при лечении рака грудной железы.

Ралоксифен – применяют при остеопорозе в постменапаузном периоде.

Гестагенные препараты:
Прогестерон - гормон жёлтого тела, влияет на эндометрий, подавляя его возбудимость,предупреждает овуляцию, способствует разрастанию ткани молочной железы.
Синтетические аналоги: ***Прогестерон*** - масляный раствор в концентрации 10 мг/мл и 25 мг/млампулах по 1мл для внутримышечного введения.
Оксипрогестерона капронат (гидроксипрогестерона капроат).
Применяют при угрожающих и начинающихся выкидышах, при нарушенияхменструального цикла.
Антигестагенное средство*: мифепристон* рекомендуется для прерыванияберемeнности.
Гормональные противозачаточные средства
Различают:
1) эстроген-гестагенные препараты;
2) гестагенные препараты;
3) посткоитальные препараты;
К первой группе относятся:
Триквилар, ригсвидон, нон-овлон, постинор, тризистон, марвелон, три-регол - применяют по схеме. Побочные действия - тошнота, рвота, головные боли, психические нарушения. Противопоказания: тромбофлебиты, нарушения функции печени.
Ко второй группе относится:
Линестренол (экслютон) - принимается в виде таблеток внутрь.
К третьей группе относится:
Левоноргестрел (постинор) – контрацептивное средство. Применяют сразу после полового акта.

Препараты мужскихполовых гормонов

Мужские половые гормоны (андрогены) вырабатываются в семенниках. Наиболее активным является тестостерон. В период полового созревания он регулирует формирование мужских половых признаков, активирует сперматогенез. Андрогеныусиливают синтез белка в печени, почках и особенно в мышцах.

Лекарственные препараты:
Метилтестостерон - в таблетках под язык
Тестостерона пропионат – масляный раствор в ампулах в концентрации 10мг/мл и 50мг/мл для внутримышечного введения.
Нандролон (ретаболил) - масляный раствор в ампулах для внутримышечного введения.
Показания: гипофункция половых желез, недостаточное половое развитие, климактерические нарушения функций нервной и сердечно-сосудистой систем, рак молочной железы.
Антагонисты андрогенов: ***ципротерон, флутамид, финастерид*** - применяют при опухоляхпредстательной железы.
Анаболические стероиды
Это соединения, сходные по химической структуре с андрогенами.

Андрогены обладают анаболическими свойствами, т.е. усиливают синтез белка. Увеличивается масса скелетных мышц, некоторых паренхиматозных органов, костной ткани.
Препараты:
Метандростенолон (неробол),***Феноболин*** (нероболил),
Метиландростенолон, ретаболил (нандролон).
Назначают при кахексии (крайнем истощении), переломах костей, заболеваниях сердца, задержке роста у детей - когда целесообразно усилить синтез белка. Побочные явления: увеличение печени, желтуха, отеки, у женщин - нарушения менструального цикла, признаки вирилизации.
Противопоказания - злокачественные опухоли, острые заболевания печени, беременность.

Лекция № 27. Тема: Плазмозамещающие и противошоковые жидкости. Средства для парентерального питания.

Трансфузионные кровезаменители

В зависимости от механизма основного действия их можно разделить на следующие группы:

1)гемодинамического действия:

а) коллоидные растворы: ***рефортан ГЭК***, ***ХАЕС-стерил***, ***Инфукол – ГЭК***,***Рео ХЕС***, ***полиглюкин***, ***реополиглюкин***, ***желатиноль***;

б) солевые (кристаллоидные растворы):

Рингера - Локка, ***изотонический раствор натрия хлорида*** в ***концентрации 9мг***/мл, ***трисоль***, ***дисоль***, ***лактосоль***, ***раствор***

глюкозы в концентрации 50мг/мл, ***сорбитол***, ***фруктоза***;

2) дезинтоксикационного действия: ***гемодез***, ***гемодез-Н***(гемодез-нео), ***полидез***, ***реамберин***;

3) средства для парентерального питания:

а) *белковые гидролизаты*:

гидролизат казеина, **аминопептид**, ***аминокровин***, ***гидролизин***;

б) *растворы аминокислот*:

полиамин, ***альвизин***; ***альбумин, протеин***

в) *жировые эмульсии*: ***интралипид***, ***липофундин***;

г) *сахара и многоатомные спирты:* ***глюкоза***, ***сорбитол;***

4*) регуляторы водно-солевого и кислотно-основного состояния (кислотно-щелочного равновесия):*

солевые растворы: ***изотонический раствор натрия хлорида***, *хлосоль*, ***лактосоль, ацесоль***, ***раствор гидрокарбоната натрия; натрия лактат***

Общее количество крови у человека составляет около 5 литров. Большая потеря крови во время кровотечения создает угрозу жизни. Для возмещения объема утраченной крови прибегают к срочному переливанию крови или кровезамещающих (плазмозамещающих) жидкостей, а также солевых растворов.

Солевые растворы – изотонический раствор NaCl в концентрации 9 мг/мл вводят внутривенно, подкожно, ректально. *Раствор глюкозы изотонический* в концентрации 50мг/мл вводится внутривенно, подкожно, ректально.*Раствор Рингера-Локка*, дисоль, трисоль, лактасол, вводят внутривенно капельно. *Регидрон* – выпускают в пакетах,1 пакетик развести в 1л кипячёной воды, принимать внутрь – используют при кровотечениях, при обширных ожогах, упорной рвоте, поносах. Недостаток солевых растворов - быстро выводятся из организма почками. Поэтому их используют часто с коллоидными веществами ***Высокомолекулярные вещества*** (коллоидные растворы): ***желатиноль, жидкость Петрова*** вводят вместе с солевыми растворами. Они дольшезадерживаются в кровяном русле и удерживают около себя воду.

Растворы гидролизатов декстрана:

Полиглюкин и реополиглюкин. Благодаря большой молекулярной массе они долгозадерживаются в кровеносном русле и задерживают кристаллоидные растворы.

Полиглюкин (декстран - 70) – повышает низкое АД. Вводится внутривенно, внутриартериально.

Применяют при шоке, кровотечении.

Реополиглюкин **-** улучшает микроциркуляцию (кровоток в капиллярах).

Гемодез, энтеродез– связывают токсические вещества и выводят их

через почки. Применяют при интоксикациях.

Раствор натрия гидрокарбоната, натрия лактата, - применяется при кровопотерях, шоке, гипоксии, т.к. возможно понижение pH крови и развитие ацидоза.

Средства для парентерального питания

Их применяют при нарушении энтерального питания.

Раствор глюкозы изотонический в концентрации 50 мг/мл, ***Раствор глюкозыгипертонический*** в концентрации 200-400мг/мл. Глюкоза является энергетическим средством, она улучшает функцию печени, повышает её барьерную роль. Для лучшего усвоения глюкозы назначают инсулин 3-4 ЕД на каждые 250 мл раствора глюкозы 50мг/мл. Гипертонические растворы глюкозы могут использоваться также для уменьшения отека мозга и легких.

Раствор гидролизина, полиамина, аминокровин - это гидролизаты белков. Применяются для нормализации белков в крови.

Кислота глутаминовая, метионин - препараты аминокислот. Применяются при дефиците белка в крови.

Глутаминовая кислота - используется при лечении эпилепсии, психозов.

Метионин – применяется при заболеваниях печени, атеросклерозе, дистрофических процессах, т.к. он участвует в синтезе адреналина, активирует действие гормонов, витаминов и ферментов.

ЛВ, влияющие на мускулатуру матки.

Они делятся на 3 группы:

I. ЛС, стимулирующие родовую деятельность матки;

II. ЛС, применяемые при маточных кровотечениях;

III. ЛС, снижающие ритмические сокращения матки и расслабляющие мускулатуру матки;

I. ***ЛС, стимулирующие родовую деятельность матки***

К этой группе относятся окситоцин и препараты простагландинов.

1. ***Окситоцин*** – гормон задней доли гипофиза, способствует началу родовой деятельности и вызывает ритмические сокращения миометрия во время родов. В начале беременности чувствительность матки к окситоцину слабо выражена, затем постепенно повышается и резко возрастает перед родами и в первые сутки после родов.

Препарат окситоцин - это синтетический аналог гормона окситоцина. Выпускается в виде раствора в ампулах. Вводится внутримышечно и внутривенно капельно для стимуляции родовой деятельности, для остановки кровотечения после отделения плаценты. Побочный эффект –тахикардия, повышение тонуса бронхов. Противопоказан при несоответствии размеров таза и плода, при поперечном или косом положении плода, при рубцах на матке после кесарева сечения.

Демокситоцин (дезаминоокситоцин) – синтетический препарат, сходный по строению с окситоцином. Применяется в виде таблеток за щеку (трансбуккально). Показания к применению как у окситоцина.

2.***Препараты простагландинов***

Простагландины – биогенные вещества из класса ненасыщенных жирных кислот. Впервые они были выделены из секрета предстательной железы. Это простагландины E_2 и $E_{2\alpha}$. Они оказывают выраженное стимулирующее влияние на миометрий.

Отличия простагландинов от окситоцина:

1) эффективны на всём протяжении беременности и концу беременности чувствительность миометрия к простагландинам повышается;

2) способствуют раскрытию шейки матки;

Препарат простагландина $E_{2\alpha}$ - ***динопрост*** и препарат простагландина E_2 – ***динопростон*** - применяют для возбуждения родовой деятельности.

II.ЛС, применяемые при маточных кровотечениях

Они повышают тонус миометрия и применяются для остановки маточных кровотечений, в частности в послеродовом периоде. Их вводят внутримышечно, внутривенно или назначают внутрь. Это препараты алкалоидов спорыньи – ***эргометрин, эрготамин, метилэргометрин.***

(Спорынья – это гриб, паразитирующий на злаковых растениях).

III. ЛС, снижающие ритмические сокращения матки и расслабляющие мускулатуру матки

Эти препараты применяются для прекращения преждевременной родовой деятельности. По этому они ещё называются токолитическими средствами. Это:

1) β_2 адреномиметики***: фенотерол*** (Партусистен), ***гексопреналин*** (Гинипрал), ***сальбутамол***;

2) ***Прогестерон*** – гормон женских половых желез. Существует синтетический аналог -прогестерон в виде масляного раствора в ампулах в концентрации 10мг/мл и 25мг/мл;

3) спазмолитики миотропного действия – ***раствор магния сульфата*** в концентрации 250мг/мл, ***но-шпа***, ***дротаверин***;

4)понижающие тонус шейки матки **–** ***атропин***. Способствует расширению шейки матки.

Лекция № 28. Тема: Препараты водорастворимых и жирорастворимые витаминов.

Витамины - это вещества, необходимые для жизнедеятельности организма. Большинство из них не синтезируется в организме человека и поступает с пищей. При недостатке витаминов может развиться состояние гиповитаминоза. При авитаминозе речь идёт о не поступлении витаминов в организм человека. Избыточное поступление витаминов в организм человека может вызвать гипервитаминоз. Все витамины делятся на две группы:

1. ***Водорастворимые витамины***
2. ***Жирорастворимые витамины***

1. Водорастворимые витамины

Тиамин (Витамин B_1) – содержится в зернах злаков, дрожжах, печени, почках и др. продуктах. В организме тиамин превращается в кокарбоксилазу, которая участвует в углеводном обмене. При его недостатке нарушается функция сердца и нервной системы, появляется одышка, тахикардия, общая слабость, головные боли,бессонница. В тяжелых случаях развивается заболевание бери-бери, которое проявляется параличами.

Лекарственные препараты: тиамина бромид, тиамина хлорид. Вводят внутримышечно и внутривенно.

Показания: заболевания нервной системы, болезни сердца, язвенная болезнь желудка и 12 перстной кишки. Нельзя вводить в одном шприце В1 и В12.

Рибофлавин (Витамин B_2) - содержится в молоке, мясе, яйцах, горохе, злаках. Стимулирует рост и регенерацию тканей и необходим для нормальной функции сетчатки глаза. Недостаток витамина В2 приводит к нарушению зрения, появлению слабости, снижению аппетита, появляются трещины в углах рта (хейлоз).

Применяют при заболеваниях сердечно-сосудистой системы, кожных заболеваниях, заболеваниях глаз (конъюнктивитах, кератитах, иритах), гепатитах, лучевой болезни. Побочные явления не наблюдаются.

Кислота никотиновая (Витамин PP, B_3) – в организме превращается в никотинамид, который участвует в окислительных процессах. Содержится в мясе, рыбе, хлебе из муки низших сортов, дрожжах. Расширяет мелкие сосуды, стимулирует эритропоэз.

Препарат никотиновой кислоты - ***Никотинамид*** - обладает теми же свойствами.

Применяют при заболеваниях сердечно-сосудистой системы, печени.

Побочные явления: покраснения лица, чувство жара, крапивница, головокружение,

они быстро проходят.

Кальция пантотенат (Витамин B_5) – содержится в печени, яичном желтке, горохе, дрожжах, а также вырабатывается микрофлорой кишечника. Принимает участие в обмене аминокислот и жировом обмене.

Применяют при токсикозах беременности, язвенной болезни желудка и 12 перстной кишки, при невралгиях, заболеваниях кожи.

Пиридоксин (Витамин B_6) – участвует в обмене аминокислот. Применяют при заболеваниях ЦНС, невритах, невралгиях, кожных заболеваниях, сахарном диабете.

Цианокобаламин (Витамин B_{12}) - ***B_{12}*** усиливает процессы регенерации в тканях, содержится в мясе, особенно в печени. При недостаточности витамина ***B_{12}*** возникает гиперхромная анемия.

Кальция пангамат (Витамин B_{15}) - участвует в липидном обмене, повышает усвое- ние кислорода.

Применяют при лечении атеросклероза, заболеваний сердечно-сосудистой системы,

легких, печени и других органов.

Кислота фолиевая (Витамин Вс) – участвует в образовании нуклеиновых кислот и некоторых белков. Содержится в свежих овощах (бобы, шпинат,томаты), частично синтезируется микрофлорой кишечника.Применяют при анемиях, лейкопениях, хронических гастритах и туберкулёзе кишечника.

Кислота аскорбиновая (Витамин С) – содержится в растительных продуктах, овощах, фруктах, ягодах, плодах шиповника. Отсутствие в пище витамина С приводит к тяжелому заболеванию – цинге.

Применяется в комплексном лечении многих заболеваний.

Рутин (Витамин Р) - содержится в листьях руты пахучей. В сочетании саскорбиновой кислотой уменьшает проницаемость и ломкость

капилляров. Препараты витамина Р (рутин, кверцетин) показаны при повышеннойпроницаемости сосудов (геморрагические диатезы, аллергические заболевания)

Метилметионинсульфония хлорид (Витамин U) содержится в томатах, капусте,сельдерее. Применяют при язвенной болезни желудка, гастритах, язвенных колитах.Стимулирует заживление слизистой ЖКТ.

Жирорастворимые витамины и препараты

Ретинол (витамин А) - содержится в печени, яичном желтке, сливочном масле.Особенно его много в печени трески, морского окуня. Предшественник витамина А - каротин, изкоторого в организме образуется витамин А, содержится в моркови, зеленом луке, красном перце. При недостатке витамина А нарушается способность различать предметы всумерках (куриная слепота).

Лечебные препараты: ретинола ацетат, рыбий жир, масло облепиховое. Применяют в глазной практике, при лечении ожогов и трофических язв.

Витамином Д называют два близких вещества - ***эргокальциферол($Д_2$)***и ***холекальциферол($Д_3$).*** С лечебной целью применяют ***эргокальциферол ($Д_2$)***.С целью профилактики применяют ***холекальциферол($Д_3$).***

Витамин Д содержится в печени рыб, дрожжах и коже человека. Его недостаточность приводит к развитию рахита у детей и остеомаляции (размягчению костей, остеопорозу) у взрослых, к нарушению срастания переломов костей.

Токоферол (витамин Е) - обладает антиоксидантными свойствами, содержится в зеленых частях растений, особенно в молодых ростках злаков, в растительных маслах (подсолнечном, хлопковом, соевом, облепиховом). При недостатке витамина Е нарушается нормальное развитие беременности, могут быть выкидыши, возможна дистрофия миокарда и скелетных мышц.

Назначают для профилактики самопроизвольных абортов, при некоторых заболеваниях сердца, сосудов и нервной системы.

Витамин К - принимает участие в синтезе протромбина и способствуетсвертыванию крови. Синтетический препарат

Викасол - назначают для устранения кровоточивости при заболеваниях печени, при передозировке антикоагулянтов непрямого действия типа неодикумарина.

Поливитаминные препараты – комбинированные витаминные препараты

«Пентовит», «Декамевит», «Гексавит», «Ундевит», «Алфавит» и другие назначают с целью профилактики гиповитаминозов.

Биологически активные добавки (БАД)

Биологически активные добавки (БАД) к пище - это композиции биологически активных веществ, предназначенных для непосредственного приема с пищей или введения в состав пищевых продуктов.

БАДы, наряду со специализрованными продуктами питания являются наиболее эффективным способом устранения дефицита витаминов, но при условии содержания биологических веществ в дозах, соответствующих физиологическим потребностям человека.

БАДы обладают выраженными физиологическими и фармакологическими влияния- ми на основные регуляторные и метаболические процессы человеческого организма. Вначале БАДы не были востребованы официальной медициной, их толкование стало двусмысленным как среди потребителей, так и среди медицинского персонала. Это зачастую приводит к серьезным заблуждениям и неправильным действиям. БАДы условно подразделяют на 3 группы:

1. Нутрицевтики – применяют для коррекции химического состава пищи (белка, аминокислот, жиров, углеводов, витаминов, минеральных веществ, пищевых волокон); цель использования: улучшение состава пищи, укрепление здоровья и профилактика ряда заболеваний.

2. Парафармацевтики - БАД, применяемые для профилактики, вспомогательной терапии и поддержки в физиологических границах активности органов и систем.

3. Пробиотики, эубиотики -БАД в состав которых входят живые микроорганизмы и (или) их метаболиты (продукты обмена)

Отличия БАД от лекарственных препаратов

1. БАД выступают как вспомогательные вещества в комплексной терапии;

2. БАД используются (рекомендуются) как источник нутриентов, некоторых

веществ и минералов; лекарственные препараты - это показания к применению;

3. ЛС содержат терапевтическую дозу действующего вещества, а БАД – физиологическую; при этом суточная доза БАД не превышает разовую терапевтическую

4. БАД применяются только перорально.

5. Употреблять БАД может любой человек, предварительно прочитавший инструкцию и ознакомившийся с противопоказаниями.

6. БАДы имеют ограничения в рекламе, предусмотренные статьёй 25 Федерального закона о рекламе.

Преимущества БАД – минимум побочных действий и противопоказаний, чем у ЛС, их свободно можно купить без рецепта врача.

Лекция № 29. Тема: Противоаллергические и противовоспалительные средства *Противоаллергические средства.*

Аллергические заболевания возникают в результате повышенной чувствительности (сенсибилизации) к различным веществам.

Различают аллергическую реакциюнемедленного типа и замедленного типа.

Аллергическая реакция немедленного типа развивается через несколько минут ипродолжается часы. Она проявляется отёком кожи и слизистых оболочек, кашлем, спазмом гладких мышц бронхов, падением АД.

Аллергические реакции замедленного типа возникают через 2-3 суток и более идлятся неделями.

Во время аллергической реакцииусиливается выделение биологически активных веществ (БАВ), таких как свободного гистамина, брадикинина, серотонина, ацетилхолина.

Для лечения используют:

I. Противогистаминные средства

II. Средства, препятствующие высвобождению БАВ из тучных клеток

III.Иммунодепрессивные средства

IV. Противовоспалительные средства стероидной и нестероидной структуры

I. При аллергической реакции гистамин стимулирует H1 гистаминовые рецепторы .Это вызывает сокращение гладких мышц кишечника, бронхов, матки. Противогистаминные средства блокируют гистаминовые рецепторы. Это вызывает расслабление гладких мышц бронхов, кишечника, матки.

Противогистаминные средства первого поколения

Дифенгидрамин(димедрол) побочное действие: седативное, снотворное . Выпускают в порошках, таблетках, свечах, раствор в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения.

Клемастин (тавегил) – отличается от дифенгидрамина более продолжительным действием (более 12 часов).

Прометазин (дипразин, пипольфен) – оказывает противоаллергическое, седативное, противорвотное действие. Выпускают в драже, таблетках, раствор в ампулах для внутримышечного и внутривенного введения.

Хлоропирамин (супрастин) – обладает противоаллергическим, спазмолитическим действием. Оказывает умеренное угнетающее действие на ЦНС.Он также обладают седативным действием.

Мебгидролин (диазолин) - выпускают в драже для приёма внутрь.

Противогистаминные средства второго поколения

Фенистил (акривастин), ***астемизол***, ***лоратадин*** (кларитин),***терфенадин***, ***эриус*** – не вызывают снотворного эффекта.

Противогистаминные средства третьего поколения

Цетиризин, ***фексофенадин*** – не вызывают снотворного эффекта

Противогистаминовым и противосеротониновым эффектом обладают

Бикарфен, димебон, ***перитол*** . Они снижают проявления аллергии. Применять осторожно при заболевании печени и почек.

При лечении аллергической бронхиальной астмы применяют препараты первого поколения.

II.***Средства, препятствующие высвобождению БАВ из тучных клеток.***

Эти препараты препятствуют высвобождению из тучных клеток гистамина,серотонина, брадикинина, тем самым предупреждают приступ бронхиальной астмы.

Кислота кромоглициевая (кромолин-натрий, интал) – применяют в аэрозоле «Дитэк», в виде назального спрея, раствора для ингаляций, глазных капель, в виде капсул для приёма внутрь.

Недокромил – применяют ингаляционно в виде дозированного аэрозоля

Кетотифен (задитен) – в капсулах и таблетках, сироп чайными ложками внутрь.

При анафилактических реакциях применяют ***эпинефрин, бронхолитикимиотропного действия*** (аминофиллин) и ***противоаллергические препараты***.

III. ***Иммунодепрессивные средства*** - это вещества, подавляющие реакции иммунитета. В ряде случаев антитела способствуют повреждению и отторжению пересаженных органов. При этом необходимо применять вещества, подавляющие выработку антител. Это глюкокортикоиды и цитостатические средства (метотрексат, циклофосфан, меркаптопурин и др.)

IV. ***Противовоспалительные средства***:

1) стероидной природы: ***глюкокортикоиды - преднизолон***, ***гидрокортизон***, ***дексаметазон*** и другие используются в качестве иммунодепрессантов и как противовоспалительные средства.

2) нестероидные противовоспалительные средства

Осложнения медикаментозной терапии.

Помощь при острых отравлениях фармакологическими средствами преследует следующие цели:

1) Предупреждение всасывания яда в кровь

2) Нейтрализация всосавшегося яда специфическим антидотом или ослабление его

действия функциональным антагонистом.

3) Ускорение выделения яда из организма

4) Симптоматическая терапия, направленная на восстановление жизненно важных функций организма.

1) Предупреждение всасывания яда в кровь. С поверхности кожи и слизистых

оболочек яд смыть большим количеством холодной воды. При попадании яда внутрь промывают желудок через зонд 10-15 л воды в первые 24 часа после отравления. Для нейтрализации яда в желудке используют перманганат калия слабо розовый раствор (1:5000). Используют так же 0,5% раствор танина. Он осаждает органические и неорганические соединения. Белки (яичный белок, молоко) реагируют с многими ядами, образуя нерастворимые соединения.

Сорбенты:***активированный уголь***, ***полифепан***, ***энтеросгель***, ***полисорб***, ***альгисорб***-тормозят всасывание яда в кровь, поэтому их назначают сразу после промывания желудка.

Солевые слабительные:натрия сульфат и ***магния сульфат*** ускоряют удаление яда из организма.

2) **Нейтрализация яда** производится путем введения в организм антидотов (противоядий). При отравлении препаратами ртути, мышьяка, висмута, солями меди, цинка назначают ***унитиол*** внутримышечно. При отравлениях соединениями ртути, мышьяка, свинца и цианидами в/в вводят ***натрия тиосульфат***. Он обладает умеренными антитоксическими свойствами. Соли ***ЭДТА*** (этилендиамин -тетрацетата) обезвреживают свинец, медь, железо,

марганец, цинк (препарат ***тетацин – кальций***). При отравлении лекарственными веществами нитритами, сульфаниламидами происходит превращение гемоглобина в метгемоглобин. ***Метиленовый синий*** (метилтиониния хлорид) превращает метгемоглобин в гемоглобин. Препарат метиленового синего ***хромосмон***. Ослабить действие ядов можно при помощи фармакологических антагонистов. Например, при

отравлении М-холиномиметиками (***мускарин, пилокарпин***) назначают М-холиноблокаторы (***атропин***), при отравлении наркотическими веществами вводят стимуляторы ЦНС (дыхательного и сосудодвигательного центров), например, ***налоксон*** и ***налтрексон***.

3). ***Ускорение выведения ядов из организма.*** Назначают обильное количество жидкости внутрь и диуретики. Если больной без сознания, то в/в капельно или струйно вводят раствор глюкозы в концентрации 50 мг/мл, солевые растворы до 3-5л в сутки, диуретики (маннитол, фуросемид). Если при тяжелых отравлениях резко нарушается выделительная функция почек, то проводят ***гемодиализ*** с помощью аппарата искусственной почки. ***Перитонеальный диализ*** – заключается в промывании брюшной полости раствором электролитов.

4). ***Симптоматическая терапия***. Она предусматривает восстановление дыхания, функции сердечно-сосудистой системы и ЦНС. Назначают аналептики, стимуляторы сердечно-сосудистой системы.

Лекция № 30 Тема: Ненаркотические и наркотические анальгетики. Спазмолитики. Лечение шоков различного генеза.

Ненаркотические анальгетики существенно отличаются от наркотических: у них отсутствует привыкание и лекарственная зависимость, обладают более слабым анальгетическим эффектом, болеутоляющее действие проявляется преимущественно при болях, связанных с воспалением (у наркотических - при болях, связанных с повреждением тканей), действуют преимущественно на периферические органы (наркотические - на ЦНС), оказывают выраженный противоспалительный и жаропонижающий эффекты, не угнетают дыхание.

Салицилаты - обладают выраженным болеутоляющим, противоспалительным и жаропонижающим действием. Салицилаты угнетают агрегацию тромбоцитов и снижают свертывание крови. Этот эффект связан с угнетением синтеза тромбоксана. Применяют при различных формах ревматизма, неревматическом артрите, подагре, артралгии, невралгии, миозитах, невритах, головной, зубной боли, при лихорадке, для снижения температуры при высокой лихорадке, которая становится опасной для организма.

Побочные явления:

При приеме больших доз возникают звон в ушах, ослабление слуха, аллергия. При отравлении салицилатами наблюдаются нарушения ЦНС, ЖКТ, Кислотно Основное Состояние, гипокалиемия, дегидратация, гипертермия.

Лечение: промывание желудка, адсорбенты, солевые слабительные, нормализация КОС (введение натрия гидрокарбоната) и водно-электролитного баланса, диуретики быстрого действия (фуросемид). В тяжелых случаях проводят переливание крови и гемодиализ.

Наиболее широко применяют ***ацетилсалициловую кислоту (аспирин***). ***Метилсалицилат*** хорошо всасывается через кожу, поэтому его применяют для втираний в болезненную область. ***Салициламид*** и ***натрия салицилат*** применяют реже. Салициловая кислота обладает кератопластическим и кератолитическим (размягчает и отторгает ороговевший слой кожи), противомикробным действием. Поэтому ее используют местно в виде мазей, паст, спиртовых растворов.

Производные пиразолона (анальгин, бутадион) - болеутоляющий и жаропонижающий эффекты более выражены у анальгина, а противовоспалительный эффект у бутадиона. Они хорошо всасываются в ЖКТ. Анальгин хорошо растворяется в воде, поэтому его можно назначать в инъекциях. Эти препараты показаны при тех же заболеваниях, что и салицилаты. Наиболее опасным побочным эффектом является угнетение кроветворения.

Производные анилина (фенацетин, парацетамол) оказывают преимущественно болеутоляющее и жаропонижающее действие и слабое противовоспалительное. Фенацетин в организме превращается в парацетамол, который и оказывает действие. Поэтому применяют преимущественно парацетамол. Побочные эффекты возникают редко.
Производное индолуксусной кислоты - индометацин (метиндол, индоцид, интебан)
обладает преимущественно противоспалительным действием (превосходит салицилаты и бутадион). В кишечнике всасывается хорошо и действует длительно. Его назначают при ревматизме, подагре. Противопоказан при психических заболеваниях, эпилепсии, паркинсонизме, заболеваниях ЖКТ, при беременности и грудном вскармливании ребенка.
Производное фенилуксусной кислоты - диклофенак-натрий(ортофен, вольтарен), обладает высокой активностью, большой широтой терапевтического действия, малой токсичностью и продолжительным эффектом. Побочные эффекты: диспептические расстройства, аллергические реакции.
Производное фенилпропионовой кислоты - Ибупрофен (бруфен) по противоспалительному эффекту равен бутадиону и превосходит салицилаты, реже вызывает ПЭ (в основном, диспептические).) –
Производное нафтилпропионовой кислоты - напроксен (напросин)уступает ортофену по противоспалительному эффекту, но превосходит по болеутоляющему и по продолжительности действия. Малотоксичен, может вызывать диспептические расстройства.

По силе противоспалительного эффекта перечисленные ЛС можно расположить в следующем порядке:
индометацин > ортофен > напроксен > ибупрофен > бутадион > мефенамовая кислота > ацетилсалициловая кислота > анальгин. Эти ЛС составляют группу нестероидных противовоспалительных средств (НПВС). Все они обладают противоспалительным, болеутоляющим и жаропонижающим действием.

Адреналин

Адреналин способствует усилению и учащению сердечных сокращений. Это возможно при быстром его введении. Кроме того, он повышает объем кровотока, а также оказывает противоаллергическое действие. Благодаря ему происходит расслабление мышц. Использовать адреналин нельзя при гиперчувствительности, артериальной гипертензии, тахиаритмии, беременности, а также в период лактации.

Эпинефрин

Является аналогом гормона мозгового вещества надпочечников - адреналина. Средство способно возбуждать абсолютно все типы адренорецепторов. Он активно увеличивают давление, а также учащают сердечный ритм.

Происходит ***расширение сосудов скелетной мускулатуры.*** Действие препарата заключается в кардиостимуляции, ***сужении центральныхсосудов***, а также повышении артериального давления. Вводится внутривенно медлено.

К адреномиметикам относится также ***фенилэфрин (мезатон).*** Его можно вводить внутривенно, внутримышечно, подкожно.

Преднизолон вводится в размере 30-90 мг внутривенно струйно или капельно. Вводить медленно.

Дексаметазон

Он часто применяется при устранении сильных аллергических реакций. Данных касательно побочных явлений не поступало. Это средство отчасти является безопасным и применяется повсеместно.

Глюкокортикоиды (преднизолон, дексаметазон)при анафилактическом шоке обладают десинсибилизирующим и мембраностабилизирующим эффектом.

Эуфиллин

Назначается средство внутрь, вводят его внутривенно или внутримышечно. Под кожу введение не производится, так как велик риск развития раздражения. Способ применения полностью зависит от конкретной ситуации. В тяжелых случаях применяют внутривенно, вводят медленно (4-6 минут).

Анафилактический шок

Анафилактический шок — это тяжелая, угрожающая жизни аллергическая реакция немедленного типа, возникающая через короткое время (2—25 минут) после попадания в организм аллергена при его повторном ведении.

В патогенезе анафилактического шока выделяют три фазы.

I Иммунологическая фаза - при ней происходит образование комплекса «антиген—антитело».

II Фаза патохимических изменений – в эту фазупод действием комплекса «антиген—антитело» из тучных клеток (тканевых базофилов) выбрасываются химически активные вещества (прежде всего, гистамин).

III Фаза патофизиологических изменений, в которую происходят патологические изменения в системах и органах под действием биологически активных веществ.

Лечение анафилактического шока

Если он возникает во время внутривенной инъекции лекарственного препарата, то введение следует немедленно прекратить, сохраняя иглу в вене.

1. Адреналин - вызывает сужение сосудов, уменьшение проницаемости их стенок, усиливает и учащает сердечные сокращения, уменьшает спазм бронхов. Адреналин вводится внутривенно струйно. При невозможности осуществить внутривенную инъекцию, адреналин также можно вводить внутрисердечно. Если пациент интубирован, то возможно его вводить вводить в трахею. Если давление не повышается более 70 мм рт. ст., то адреналин вводят параллельно капельно в дозе 1 мл в 200 мл физиологического раствора со скоростью 20 капель/мин.
2. Эпинефрин–является аналогом гормона мозгового вещества надпочечников адреналина.

Если имеет место стойкое снижение АД, то к введению адреналина можно добавить 1 мл 2 % раствора норадреналина или 1 мл 1 % раствор мезатона.

Для восстановления ОЦК применяется трансфузия кристаллоидов (солевых растворов:Рингера – Локка, дисоль, трисоль и другие) и коллоидов, (противошоковых растворов типа желатиноля и полиглюкина, РЕО ХЭС, ХАЭС стерил, инфукол ГЭКи другие).

(антигистаминные препараты — димедрол, супрастин, пипольфен в данном случае малоэффективны по сравнению с глюкокортикоидами потому, что обладают более слабым десенсибилизирующим и мембраностабилизирующим эффектом)

Для купирования бронхоспазма дополнительно вводится эуфиллин – спазмолитик миотропного действия (10 мл в концентрации 24 мг/мл раствора внутривенно струйно).

Назначаются также и кортикостероидные гормоны в больших дозах преднизолон и гидрокортизон. Гидрокортизон обладает минералокортикоидной активностью, а это способствует задержке натрия и воды в организме.