

ЧАСТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ
ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО ОБРАЗОВАНИЯ
«СТАВРОПОЛЬСКИЙ МНОГОПРОФИЛЬНЫЙ КОЛЛЕДЖ»

МЕТОДИЧЕСКИЕ УКАЗАНИЯ
к практическим занятиям и практической подготовке
по дисциплине
«Фармакология»
для обучающихся по специальности
34.02.01 Лечебное дело

Ставрополь, 2022 г.

Методические указания составлены в соответствии с Федеральным Государственным образовательным стандартом среднего профессионального образования по специальности 34.02.01 «Лечебное дело» утвержденным Минобрнауки России от 12 мая 2014 г. N 514 и программой дисциплины «Фармакология».

Составитель: Вологодина Т.А.

Рассмотрено на заседании методического объединения укрупненных групп специальностей 31.00.00 Клиническая медицина Протокол № 7 от «26» мая 2022 г.

Рекомендовано к использованию в учебном процессе Методическим советом СМК, протокол № 6 от 26.05.2022 г

СОДЕРЖАНИЕ

ВВЕДЕНИЕ

- Практическая подготовка № 1. Общая рецептура
- Практическая подготовка № 2. Твердые лекарственные формы.
- Практическая подготовка № 3. Жидкие лекарственные формы.
- Практическая подготовка № 4. Мягкие лекарственные формы.
- Практическая подготовка № 5. Общая фармакология.
- Практическая подготовка № 6. Пути введения лекарственных веществ в организм
- Практическая подготовка № 7. Пути выведения лекарственных веществ из организма
- Практическое занятие № 1. Виды действия лекарственных препаратов. Понятие о хронофармакологии.
- Практическая подготовка № 8. Противомикробные препараты. Антисептики и дезинфицирующие средства.
- Практическое занятие № 2. Противомикробные средства.
- Практическая подготовка № 9. Нейротропные средства. Вещества, влияющие на периферический отдел нервной системы.
- Практическая подготовка № 10. Средства, влияющие на функции исполнительных органов.
- Практическая подготовка № 11. Вещества с преимущественным влиянием на процессы тканевого обмена.
- Практическая подготовка № 12. Седативные средства.
- Практическая подготовка № 13. Транквилизаторы. Спирты. Средства, применяемые для лечения алкоголизма.
- Практическое подготовка № 14. Наркотические анальгетики.
- Практическое подготовка № 15. Ненаркотические анальгетики.
- Практическое занятие № 3. Нестероидные противовоспалительные средства.
- Практическое занятие № 4. Витамины
- Практическое занятие № 5. Антигистаминные средства

ВВЕДЕНИЕ

Целями освоения дисциплины «Фармакология» являются освоение общих принципов оформления рецептов и составления рецептурных прописей; умение выписывать в рецептах различные лекарственные формы; ознакомление студентов с общими закономерностями фармакокинетики и фармакодинамики лекарственных средств; умение анализировать действие лекарственных средств по совокупности их фармакологических эффектов, механизмов и локализации действия, фармакокинетики; умение оценивать возможности использования лекарственных средств для целей фармакотерапии на основе представлений об их свойствах; умение выписывать лекарственные средства в рецептах при определенных патологических состояниях, исходя их особенностей фармакодинамики и фармакокинетики препаратов.

В результате освоения дисциплины обучающийся должен

Знать:

- лекарственные формы, пути введения лекарственных средств, виды их действия и взаимодействия;
- основные лекарственные группы и фармакотерапевтические действия лекарств по группам;
- побочные эффекты, виды реакций и осложнений лекарственной терапии;
- правила заполнения рецептурных бланков

Уметь:

- выписывать лекарственные формы в виде рецепта с использованием справочной литературы;
- находить сведения о лекарственных препаратах в доступных базах данных;
- ориентироваться в номенклатуре лекарственных средств;
- применять лекарственные средства по назначению врача;
- давать рекомендации пациенту по применению различных лекарственных средств;

— ЛР 1	Осознающий себя гражданином и защитником великой страны
ЛР 2	Проявляющий активную гражданскую позицию, демонстрирующий приверженность принципам честности, порядочности, открытости,
ЛР 3	Соблюдающий нормы правопорядка, следующий идеалам гражданского общества, обеспечения безопасности, прав и свобод граждан России.
ЛР 4	Проявляющий и демонстрирующий уважение к людям труда, осознающий ценность собственного труда. Стремящийся к формированию
ЛР 5	Демонстрирующий приверженность к родной культуре, исторической памяти на основе любви к Родине, родному народу, малой родине,

ЛР 6	Проявляющий уважение к людям старшего поколения и готовность к участию в социальной поддержке и волонтерских движениях
ЛР 7	Осознающий приоритетную ценность личности человека; уважающий собственную и чужую уникальность в различных ситуациях, во всех
ЛР 8	Проявляющий и демонстрирующий уважение к представителям различных этнокультурных, социальных, конфессиональных и иных
ЛР 9	Соблюдающий и пропагандирующий правила здорового и безопасного образа жизни, спорта; предупреждающий либо преодолевающий
ЛР 10	Заботящийся о защите окружающей среды, собственной и чужой безопасности, в том числе цифровой
ЛР 11	Проявляющий уважение к эстетическим ценностям, обладающий основами эстетической культуры
ЛР 12	Принимающий семейные ценности, готовый к созданию семьи и воспитанию детей; демонстрирующий неприятие насилия в семье, ухода
ЛР 13	Способный при взаимодействии с другими людьми достигать поставленных целей, стремящийся к формированию в строительной
ЛР 14	Способный ставить перед собой цели под для решения возникающих профессиональных задач, подбирать способы решения и средства
ЛР 15	Содействующий формированию положительного образа и поддержанию престижа своей профессии
ЛР 16	Способный искать и находить необходимую информацию используя разнообразные технологии ее поиска, для решения возникающих в
ЛР 17	Способный выдвигать альтернативные варианты действий с целью выработки новых оптимальных алгоритмов; позиционирующий себя в
ЛР 20	Освоивший психологию профессионального общения
ЛР 28	Участвующий в исследовательской деятельности, в приумножении знаний в своей профессии
ЛР 30	Осознающий социальную значимость труда, стремящийся добросовестно и ответственно работать, бережно относиться к результатам труда

Практическая подготовка № 1. Общая рецептура

Теоретическая часть

Общая рецептура - это раздел фармакологии о правилах выписывания в рецептах лекарственных форм.

Под лекарственными формами подразумевают удобные для практического применения формы, придаваемые лекарственным средствам для получения необходимого лечебного или профилактического эффекта. Лекарственные формы в зависимости от консистенции делят на жидкие (растворы, настои, отвары, настойки, экстракты, слизи, эмульсии, суспензии, микстуры, линименты), мягкие (мази, пасты, суппозитории, пластыри) и твердые (таблетки, драже, порошки). Одно и то же лекарственное средство может быть назначено в различных лекарственных формах (например, в растворе, мази, таблетках и т.п.).

Лекарственное средство (лекарство) включает одно или несколько лекарственных веществ, применяемых для лечения или профилактики различных заболеваний и патологических состояний. Лекарственным веществом называют индивидуальное химическое соединение, используемое в качестве лекарственного средства. Лекарственное средство, приготовленное в виде определенной лекарственной формы, называют лекарственным препаратом.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой. стр. 13-25

Вопросы к практической подготовке

1. Основные понятия, классификация лекарственных форм
2. Государственная фармакопея
3. Основы законодательства РФ в сфере обращения лекарственных средств и рецептурного документооборота
4. Формы рецептурных бланков
5. Общие принципы оформления рецептов и составления рецептурных прописей различных лекарственных форм
6. Общепринятые сокращения и обозначения в рецептах, употребление латинского языка, правила хранения и использования лекарственных средств

Задания к практической подготовке

1. Изучите государственный реестр лекарственных средств
2. Выпишите препарат адреналин в рецепте в виде раствора в ампулах, используя допустимые сокращения, пользуясь справочником лекарственных средств М.Д. Машковского.

Практическая подготовка № 2. Твердые лекарственные формы

Теоретическая часть

Лекарственная форма - придаваемое лекарственному препарату состояние, соответствующее пути его введения и способу применения и обеспечивающее достижение необходимого лечебного эффекта.

Общие требования, предъявляемые к лекарственным формам

1. Соответствие лечебному назначению, биодоступность лекарственного вещества в данной лекарственной форме и соответствующая фармакокинетика.

2. Равномерность распределения лекарственных веществ в массе вспомогательных ингредиентов и отсюда точность дозирования.

3. Стабильность в течение срока годности.

4. Соответствие нормам микробной контаминации, удобство приема, возможность корригирования неприятного вкуса; компактность.

5. Соответствие специфическим требованиям, отраженным в ГФ или других нормативных документах.

Виды классификации лекарственных форм

Классификация помогает характеризовать отдельные явления, факты; в зависимости от принадлежности к той или иной группе классификации позволяет предвидеть еще неизвестные или неизученные явления и предметы.

Задачей технологии лекарственных форм является создание разнообразных продуктов, применяемых в качестве лекарственных препаратов. Свойства, природа и пути создания их весьма разнообразны и требуют целесообразной классификации. В технологических отраслях правильная классификация позволяет заранее определить оптимальную схему изготовления того или иного продукта. В учебном курсе она облегчает изучение материала. Однако следует иметь в виду, что всякая классификация условна, поэтому возможно ее дальнейшее совершенствование. Провизоры (фармацевты) должны быть знакомы со всеми видами классификаций лекарственных форм.

В настоящее время существует несколько систем классификации лекарственных форм, основанных на разных принципах. Каждая классификация в той или иной мере придает предмету определенную стройность.

Наиболее часто в фармации применяют 4 вида классификации лекарственных форм:

- по агрегатному состоянию;
- в зависимости от способа применения или метода дозирования;
- в зависимости от способа введения в организм;

- дисперсологическая.

Классификация лекарственных форм по агрегатному состоянию

Все лекарственные формы по агрегатному состоянию делят на 4 группы: твердые, жидкие, мягкие, газообразные.

Твердые лекарственные формы

Таблетки - дозированная лекарственная форма, получаемая путем прессования или формирования лекарственного средства, лекарственных смесей и вспомогательных веществ.

Драже - дозированная лекарственная форма шарообразной формы, получаемая путем многократного наслаивания лекарственных средств и вспомогательных веществ на гранулы.

Гранулы - однородные частицы (крупинки, зернышки) лекарственных средств округлой, цилиндрической или неправильной формы размером 0,2-0,3 мм.

Порошки - лекарственные формы, обладающие сыпучестью; различают:

- порошки простые (однокомпонентные) и сложные (из 2 и более компонентов);

- разделенные на отдельные дозы и неразделенные.

Сборы - смесь нескольких видов изрезанного, истолченного в крупный порошок или цельного лекарственного сырья растений, иногда с добавлением других лекарственных средств.

Капсулы - дозированные порошкообразные, гранулированные, иногда жидкие лекарственные средства, заключенные в оболочку из желатина, крахмала, иного биополимера.

Спансулы - капсулы, в которых содержимым является определенное количество гранул или микрокапсул.

Карандаши лекарственные (медицинские) - цилиндрические палочки толщиной 4-8 мм и длиной до 10 см с заостренным или закругленным концом.

Пленки лекарственные - лекарственная форма в виде полимерной пленки.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 25-32

Вопросы к практической подготовке

1. Таблетки.
2. Драже.
3. Порошки.
4. Капсулы.
5. Правила выписывания рецептов на твердые лекарственные формы.

Задания к практической подготовке

1. Выпишите препарат анаприлин в рецепте в виде таблеток, используя допустимые сокращения, пользуясь справочником лекарственных средств М.Д. Машковского.

Практическая подготовка № 3. Жидкие лекарственные формы.

Теоретическая часть

Растворы - лекарственные формы, полученные путем растворения одного или нескольких лекарственных средств.

Суспензии (взвеси) - системы, в которых твердое вещество взвешено в жидком и размер частиц колеблется от 0,1 до 10 мкм.

Эмульсии - лекарственные формы, образованные нерастворимыми друг в друге жидкостями.

Настои и отвары - водные вытяжки из лекарственного растительного сырья или водные растворы стандартизированных экстрактов.

Слизи - лекарственные формы высокой вязкости, а также приготовленные с применением крахмала или его содержащего растительного сырья.

Линименты - густые жидкости или студнеобразные массы.

Пластыри жидкие - лекарственные формы, оставляющие эластичную пленку при нанесении на кожу.

Сиропы лекарственные - раствор лекарственного вещества в густом растворе сахара.

Настойки - спиртовые, водно-спиртовые или спирто-эфирные прозрачные извлечения из лекарственного растительного сырья, полученные без нагревания и удаления экстрагентов.

Экстракты - концентрированные извлечения из лекарственного растительного сырья; различают жидкие, густые, сухие виды экстрактов.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 32-36

Вопросы к практической подготовке

1. Жидкие лекарственные формы.
2. Определение понятия раствора.
3. Виды растворов.
4. Способы прописывания и дозирования растворов.
5. Лекарственные формы для инъекций.
6. Выписывание рецептов.
7. Настои и отвары.

8. Приготовление, дозирование и прописывание рецептов.
9. Понятия о настойках и экстрактах.
10. Виды экстрактов.
11. Рецепты, дозирование.
12. Новогаленовые препараты.
13. Правила прописывания рецептов.
14. Суспензии.
15. Способы прописывания рецептов.
16. Микстуры.
17. Правила прописывания рецептов.

Задания к практической подготовке

1. Выпишите препарат метилэргометрин в рецепте в виде раствора для инъекций в ампулах, используя допустимые сокращения, пользуясь справочником лекарственных средств М.Д. Машковского.
2. Выпишите препарат простенон в рецепте в виде спиртового раствора в ампулах, используя допустимые сокращения, пользуясь справочником лекарственных

Практическая подготовка № 4. Мягкие лекарственные формы.

Теоретическая часть

Мази - лекарственные формы мягкой консистенции для наружного применения; при содержании в мази порошкообразного вещества свыше 25% мази называют пастами.

Пластыри - лекарственная форма для наружного применения в виде пластичной массы, обладающей способностью после размягчения при температуре тела прилипать к коже; пластыри наносятся на плоскую поверхность тела.

Суппозитории (свечи) - твердые при комнатной температуре и расплавляющиеся при температуре тела дозированные лекарственные формы, предназначенные для введения в полости тела (ректальные, вагинальные свечи); суппозитории могут иметь форму шарика, конуса, цилиндра, сигары и т.д.

Пилули - дозированная лекарственная форма в виде шарика весом от 0,1 до 0,5 г, приготовленная из однородной пластической массы, содержащей лекарственные средства и вспомогательные вещества; пилуля весом более 0,5 г называется болюсом.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 36-39

Вопросы к практической подготовке

1. Мягкие лекарственные формы.
2. Определения, понятия, способы прописывания.
3. Мази.
4. Пасты.
5. Правила прописывания рецептов.
6. Суппозитории.
7. Суппозитории ректальные и вагинальные. Состав. Правила выписывания.

Задания к практической подготовке

1. Выпишите препарат в виде мази, используя допустимые сокращения, пользуясь справочником лекарственных средств М.Д. Машковского.

Практическая подготовка № 5. Общая фармакология

Теоретическая часть

В общей фармакологии приводятся общие закономерности фармакокинетики и фармакодинамики лекарственных средств. Фармакокинетика - это раздел фармакологии о всасывании, распределении в организме, депонировании, метаболизме и выведении веществ (рис.

Основное содержание фармакодинамики² - это биологические эффекты веществ, а также локализация и механизм их действия.

Эффекты лекарственных средств являются результатом их взаимодействия с организмом. В связи с этим специально рассматриваются не только основные свойства веществ, определяющие их физиологическую активность, но также зависимость эффекта от условий применения данных веществ и состояния организма, на который направлено их действие .

Кроме того, обсуждаются наиболее важные виды фармакотерапии, а также общие закономерности побочного и токсического влияния лекарственных средств.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 40-65

Вопросы к практической подготовке

1. Фармакология как наука (цели, задачи, предмет изучения и методы исследования).
2. История отечественной фармакологии.
3. Понятие о фармакодинамике и фармакокинетики.

Задания к практической подготовке

1. Определите основные этапы развития фармакологии.

Практическая подготовка № 6. Пути введения лекарственных веществ в организм

Теоретическая часть

Классификация лекарственных форм в зависимости от способа и пути введения в организм

Данная классификация, основанная на способе применения лекарственных форм, является более совершенной и позволяет предвидеть биофармацевтические факторы, влияющие на эффективность применения. Все лекарственные формы делят на 2 класса.

Энтеральные формы - вводимые в организм через желудочно-кишечный тракт. Парентеральные формы - вводимые, минуя желудочно-кишечный тракт:

- путем нанесения на кожу и слизистые оболочки организма;
- путем инъекций в сосудистое русло (артерию, вену), под кожу или мышцу;
- путем вдыхания, ингаляций.

К энтеральным относятся следующие пути введения: через рот, под язык, через прямую кишку. Наиболее старый и распространенный способ - пероральный (от лат. *per* - через, *oris* - рот). Это наиболее простой и удобный способ; через рот удобно принимать и твердые, и жидкие лекарственные формы.

Для некоторых веществ пероральный путь введения неэффективен, так как вещества разрушаются или под влиянием ферментов кишечника, или в кислой среде желудка, например, панкреатин, инсулин и др. Кроме того, при этом способе введения лекарственное вещество обнаруживается в кровяном русле не ранее чем через 30 мин, поэтому оральный путь введения не может быть использован для оказания быстрой лечебной помощи.

Модификацией данного способа является сублингвальное введение (под язык). Лекарственные вещества довольно быстро всасываются через слизистую оболочку ротовой полости, поступают в систему кровообращения, минуя желудочно-кишечный тракт и печень, где возможна инактивация лекарственных веществ. Сублингвально назначаются вещества с высокой активностью и способностью к инаktivации кислотой желудка или ферментами кишечника (половые гормоны, валидол, нитроглицерин).

Ректальный путь введения - через прямую кишку - удобен в детской практике, а также больным в бессознательном состоянии. Всасывание лекарственных веществ наступает через 7-10 мин, при этом они поступают в общий кровоток, минуя печень. Лекарственные вещества не подвергаются воздействию ферментов пищеварительного тракта.

К парентеральному (от лат. *parentheron* - мимо кишечника) способу введения относятся нанесение на кожу, легкодоступные слизистые оболочки, инъекционные и ингаляционные пути введения.

Для воздействия на кожу применяются многие лекарственные формы (присыпки, мази, пасты, линименты). Действие лекарственных веществ может быть общим и местным. Горчичники, положенные на грудь, вызывают расширение кровеносных сосудов нижних конечностей. Через кожу хорошо всасываются фенол, камфора, йод, лекарства в виде эмульсий.

Широко применяется нанесение лекарственных средств на слизистые оболочки: глазные, внутриносые, ушные. Слизистые оболочки обладают хорошей всасывающей функцией ввиду наличия большого количества капиллярных кровеносных сосудов. Слизистые оболочки лишены жирной основы, поэтому хорошо всасывают водные растворы лекарственных веществ.

Особое место среди парентеральных ЛФ занимают ингаляционные (от лат. *inhabare* - вдыхать). С их помощью вводят лекарственные вещества через дыхательные пути, например газы (кислород, закись азота, аммиак), легколетучие жидкости (эфир, хлороформ). Малолетучие жидкости вводятся при помощи ингаляторов. Интенсивность ингаляционного всасывания лекарственных веществ объясняется огромной поверхностью легочных альвеол (50-80 м²) и обильной сетью кровеносных сосудов легких человека. Отмечается быстрое действие лекарственных веществ, так как происходит их прямое проникновение в кровоток.

К числу парентеральных ЛФ относятся инъекционные ЛФ, вводимые при помощи шприца. Лекарственные вещества быстро проникают в кровь и оказывают действие через 1-2 мин и ранее. Инъекционные лекарственные формы необходимы при оказании срочной помощи, удобны при бессознательном состоянии и для введения ЛС, разрушающихся в желудочно-кишечном тракте. В связи со способом введения инъекционных ЛФ к ним предъявляются особые требования: стерильность, апиrogenность, отсутствие механических включений.

Классификация ЛФ по путям введения имеет главным образом значение для врача. Она более совершенна, чем классификация по агрегатному состоянию; имеет технологическое значение, так как в зависимости от способа введения к лекарственным формам предъявляются определенные требования,

выполнение которых должно быть обеспечено технологическим процессом. Однако недостатком классификации является то, что разные ЛФ, отличающиеся друг от друга по виду, технологии, относятся к единой группе, например порошки и микстуры (перорально).

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 40-45

Вопросы к практической подготовке

1. Основные механизмы всасывания лекарств (пассивная диффузия, фильтрация, активный транспорт, пиноцитоз).
2. Распространение лекарственных средств в организме.
3. Понятие о биологических барьерах (гематоэнцефалический, плацентарный).
4. Факторы, влияющие на распределение лекарств (биологические мембраны, сродство к тканям, интенсивность кровообращения и др.).
5. Биодоступность.
6. Биотрансформация.
7. Виды превращения лекарственных препаратов (метаболическая трансформация, конъюгация).
8. Роль микросомальных ферментов печени (цитохром Р-450).

Задания к практической подготовке

1. Составить таблицу «Пути введения лекарственных веществ в организм: преимущества и недостатки энтерального и парентерального путей введения лекарств».

Практическая подготовка № 7. Пути выведения лекарственных веществ из организма

Теоретическая часть

Процесс экскреции, наряду с метаболизмом и распределением в тканях, определяет продолжительность действия и скорость элиминации ЛС. Почки, гепатобилиарная система, лёгкие и кишечник - основные органы, участвующие в процессе выведения ЛС.

Почечная экскреция ЛС определяется тремя основными процессами, происходящими на уровне нефрона: клубочковой фильтрацией, канальцевой секрецией и реабсорбцией (в основном, путём пассивной диффузии).

Клубочковая фильтрация

Процесс клубочковой фильтрации носит избирательный характер; это предотвращает фильтрацию белков плазмы (в том числе альбумина) и способствует поддержанию осмотического градиента плазмы. Форму и размер молекулы, а также её электрический заряд относят к факторам,

ограничивающим клубочковую фильтрацию. Приблизительно 130 мл плазмы ежеминутно подвергается клубочковой фильтрации (190 л в день); это и определяет основополагающую роль почек в процессе выведения ЛС. Любые лекарственные вещества, не свя-

занные с белками плазмы или форменными элементами, подвергаются клубочковой фильтрации. Молекулы с радиусом более 20 ангстрем (А) могут иметь ограничения в процессе ультрафильтрации, крупные молекулы с радиусом более 42 А не будут фильтроваться клубочками (Bennett P.N., 1988). Скорость клубочковой фильтрации заряженных молекул обычно ниже, чем нейтральных, даже при сопоставимой молекулярной массе. Наибольшие ограничения в процессе фильтрации имеют отрицательно заряженные молекулы (анионы); это, возможно, обусловлено электростатическим взаимодействием между молекулами фильтрата и отрицательно заряженными стенками клубочковых капилляров (Grantham J.J. and Chonko A.M., 1991).

Преимущественно за счёт клубочковой фильтрации происходит удаление из организма таких лекарственных веществ, как дигоксин, гентамицин, прокаинамид (новокаинамид*) и метотрексат. Скорость клубочковой фильтрации оценивают по величине клиренса креатинина.

Основные пути выведения лекарственных средств из организма

Пути выведения	Механизмы выведения	Лекарственные средства
С мочой	Клубочковая фильтрация, активная канальцевая секреция	Большинство лекарственных средств в свободной форме
С жёлчью	Активный транспорт, пассивная диффузия, пиноцитоз	Дигитоксин, пенициллины, тетрациклины, стрептомицин, хинин, стрихнин, четвертичные аммониевые соединения
Через кишечник	Пассивная диффузия, жёлчная секреция без рециклирования	Доксициклин, ионизированные органические кислоты
Со слюной	Пассивная диффузия и активный транспорт	Пенициллины, сульфаниламиды, салицилаты, бензодиазепины, этанол
Через лёгкие	Пассивная диффузия	Средства для ингаляционного наркоза, иодиды, камфора, этанол, эфирные масла
С потом	Пассивная диффузия	Некоторые сульфаниламиды
С молоком	Пассивная диффузия и активный транспорт	Непрямые антикоагулянты, антибиотики, тиамазол (мерказолил*), соли лития, карбамазепин

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 40-45

Вопросы к практической подготовке

1. Пути выведения лекарственных веществ из организма (с мочой, с желчью, слюнными, слезными и молочными железами).

Практическое занятие № 1. Виды действия лекарственных препаратов. Понятие о хронофармакологии

Теоретическая часть

1. Местное действие – действие вещества, возникающее на месте его приложения (анестетик – на слизистую оболочку)

2. Резорбтивное (системное) действие – действие вещества, развивающееся после его всасывания, поступления в общий кровоток, а затем в ткани. Зависит от путей введения ЛС и их способности проникать через биологические барьеры.

Как при местном, так и резорбтивном действии лекарственные средства могут оказывать либо Прямое, либо Рефлекторное влияние:

А) прямое влияние - непосредственный контакт с органом-мишенью (адреналин на сердце).

Б) рефлекторное – изменение функции органов или нервных центров путем влияния на экстеро - и интерорецепторы (горчичники при патологии органов дыхания рефлекторно улучшают их трофику)

Изменения действия ЛС при их повторном введении:

1. Кумуляция – увеличение эффекта вследствие накопления в организме ЛС:

а) материальная кумуляция - накопление действующего вещества в организме {сердечные гликозиды}

б) функциональная кумуляция – нарастающие изменения функции систем организма {изменения функции ЦНС при хроническом алкоголизме}.

2. Толерантность (привыкание) - Снижение ответной реакции организма на повторные введения ЛС; для того, чтобы восстановить реакцию на ЛС, его приходится вводить во все бóльших бóльших дозах {диазепам}:

А) истинная толерантность – наблюдается как при энтеральном, так и при парентеральном введении ЛС, не зависит от степени его всасывания в кровоток. В ее основе - фармакодинамические механизмы привыкания:

1) десенситизация – снижение чувствительности рецептора к лекарственному средству {b-адреномиметики при длительном применении приводят к фосфорилированию b-адренорецепторов, которые не способны ответить на b-адреномиметики}

2) Down-регуляция – снижение числа рецепторов к лекарственному средству {при повторных введениях наркотических анальгетиков количество опиоидных рецепторов снижается и требуются все бóльшие и бóльшие дозы лекарства, чтобы вызвать желаемый ответ} . Если ЛС

блокирует рецепторы, то механизм толерантности к нему может быть связан с up-регуляцией – увеличением числа рецепторов к лекарственному средству (b-адреноблокаторы)

3) включение компенсаторных механизмов регуляции (при повторных введениях гипотензивных препаратов коллапс возникает значительно реже, чем при первом введении за счет адаптации барорецепторов)

Б) относительная толерантность (псевдотолерантность) - развивается только при введении ЛС внутрь и связан со снижением скорости и полноты всасывания лекарства

3. Тахифилаксия – состояние, при котором частое введение ЛС вызывает развитие толерантности уже через несколько часов, но при достаточно редких введениях ЛС его эффект сохраняется в полной мере. Развитие толерантности связано обычно с истощением эффекторных систем.

4. Лекарственная зависимость – непреодолимое стремление к приему вещества, вводимого ранее. Выделяют психическую (кокаин) и физическую (морфин) лекарственную зависимости.

5. Гиперчувствительность – аллергическая или другая иммунологическая реакция на ЛС при повторном введении.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 55-58

Вопросы к практическому занятию

1. Понятия о дозах (разовая, суточная, курсовая, пороговая, среднетерапевтическая, ударная, токсическая и летальная).
2. Широта терапевтического действия.
3. Виды лекарственной терапии.
4. Явления, возникающие при повторном введении лекарств (кумуляция, толерантность, тахифилаксия, лекарственная зависимость).
5. Взаимодействие лекарственных средств.
6. Фармакологическое взаимодействие (фармакокинетический и фармакодинамический типы).
7. Физико-химическое (фармацевтическое взаимодействие).
8. Факторы, влияющие на выраженность эффекта лекарственных средств (возраст, пол, состояние организма, генетические факторы).

Задания к практическому занятию

1. Составить таблицу «Виды действия лекарственных препаратов».

Практической подготовке № 8. Противомикробные препараты.

Антисептики и дезинфицирующие средства.

Теоретическая часть

Лекарственные средства, обладающие противомикробными свойствами, подразделяют на две группы.

Первая группа включает препараты, не обладающие избирательностью противомикробного эффекта. Они губительно влияют на большинство микроорганизмов. К ним относятся антисептики и дезинфицирующие вещества.

Антисептики обычно наносят наружно на покровные ткани (кожу, слизистые оболочки). Отдельные антисептики используют для воздействия на микроорганизмы, локализующиеся в желудочно-кишечном тракте и мочевыводящих

От греч anti - против, septicus - гнилостный.

От лат. de - устранение, греч. infectio - заражение.

путях. В зависимости от концентрации они оказывают бактериостатическое или бактерицидное действие.

Дезинфицирующие средства служат для обеззараживания медицинских инструментов, аппаратуры, помещений, посуды, выделений больных. Эффект их развивается быстро. Применяются они, как правило, в бактерицидных концентрациях и используются для предупреждения распространения инфекций.

Провести резкую границу между антисептиками и дезинфицирующими средствами не всегда возможно, так как многие вещества в определенных концентрациях используют как антисептики, а в более высоких - с целью дезинфекции.

Вторая группа веществ включает противомикробные средства избирательного действия, которые относят к так называемым химиотерапевтическим средствам¹. Типичным для препаратов этой группы является влияние на определенные виды микроорганизмов. К важным их характеристикам относится также большая широта терапевтического действия. О последней судят по диапазону между бактериостатическими (бактерицидными) концентрациями и концентрациями, токсичными для макроорганизма. Применяют химиотерапевтические препараты для лечения и профилактики инфекций, а также для санации носителей инфекции.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 66-97

Вопросы к практической подготовке

1. Понятие об антисептическом и дезинфицирующем действии.

Классификация антисептических и дезинфицирующих средств.

2. Неорганические антисептические средства. Фармакологические свойства, механизм действия, применение. Окислители, галогеносодержащие соединения, соли тяжелых металлов, кислоты и щелочи.

3. Органические антисептические средства. Фармакологические свойства. Механизм противомикробного действия и применение. Производные фенола, красители, альдегиды, спирты, детергенты.

4. Возможные осложнения при применении антисептических и дезинфицирующих средств. Меры помощи при отравлении.

Практическое занятие № 2. Противомикробные средства

Теоретическая часть

Антибиотики — это химиотерапевтические вещества биологического происхождения, избирательно угнетающие жизнедеятельность микроорганизмов.

При классификации антибиотиков используют различные принципы.

В зависимости от источников получения, антибиотики разделяются на две группы: природные (биосинтетические), продуцируемые микроорганизмами и низшими грибами, и полусинтетические, получаемые в результате модификации структуры природных антибиотиков.

По химическому строению выделяют следующие группы антибиотиков:

1. (3-лактамы антибиотики (пенициллины, цефалоспорины, карбапенемы, монобактамы).

2. Макролиды и близкие к ним антибиотики.

3. Аминогликозиды.

4. Тетрациклины.

5. Полимиксины.

6. Полиены (противогрибковые антибиотики).

7. Препараты хлорамфеникола (левомицетина).

8. Гликопептидные антибиотики.

9. Антибиотики разных химических групп.

Характер (тип) действия антибиотиков может быть бактерицидным (фунги-или протозоацидным, в зависимости от возбудителя), под которым понимается полное разрушение клетки инфекционного агента, и бактериостатическим (фун-ги-, протозоастатическим), которое проявляется прекращением роста и деления его клеток.

Бактерицидный или бактериостатический характер влияния антибиотиков на микрофлору во многом определяется особенностями механизма их действия. Установлено, что противомикробное действие антибиотиков развивается, в основном, как следствие нарушения:

- 1) синтеза клеточной стенки микроорганизмов;
- 2) проницаемости цитоплазматической мембраны микробной клетки;
- 3) внутриклеточного синтеза белка в микробной клетке;
- 4) синтеза РНК в микроорганизмах.

Механизм и характер антимикробного действия антибиотиков

Механизм действия	Антибиотики	Преимущественный характер антимикробного действия
Нарушение синтеза клеточной стенки	β-лактамы Гликопептидные антибиотики Циклосерин Бацитрацин	Бактерицидный
Нарушение проницаемости цитоплазматической мембраны	Полимиксины Полиеновые антибиотики	Бактерицидный
Нарушение внутриклеточного синтеза белка	Макролиды Тетрациклины Линкозамиды Левомецетин Аминогликозиды	Бактериостатический Бактерицидный
Нарушение синтеза РНК	Рифампицин	Бактерицидный

Вопросы к практическому заданию.

1. бета-лактамы
2. пенициллины
3. цефалоспорины
4. карбапенемы
5. монобактамы
6. макролиды и близкие к ним антибиотики
7. линкосамиды
8. аминогликозиды
9. тетрациклины

Задания к практическому заданию.

1. Назовите препарат Цефалоспорины III поколения.

2. Основная особенность цефалоспоринов.
3. Показания к применению амоксициллина. Форма выпуска, дозировка.
4. Меропенем- группа препаратов. Показание к применению.
5. Тетрациклин. Лекарственная форма, фармакологические свойства, показания к применению, способ применения и дозы, побочное действие.

**Практическая подготовка № 9. Нейротропные средства.
Вещества, влияющие на периферический отдел нервной системы.
Теоретическая часть**

Значительный раздел частной фармакологии посвящен лекарственным средствам, влияющим на нервную регуляцию функций организма. С помощью таких веществ можно воздействовать на передачу возбуждения на разных уровнях ЦНС, а также в афферентных и эфферентных путях периферической иннервации.

Классификация нейротропных средств основывается на локализации их действия. Имеется в виду их влияние на периферическую или центральную нервную систему.

Известно значительное число веществ, с помощью которых можно управлять многими функциями ЦНС. К ним относятся разнообразные химические соединения, влияющие на психическое состояние и эмоции, уменьшающие восприятие болевых ощущений, способствующие развитию сна, вызывающие наркоз и др.

Основой действия большинства нейротропных средств на ЦНС является их способность изменять процесс межнейронной (синаптической) передачи возбуждения. В зависимости от направленности возникающих при этом эффектов различают вещества угнетающего и стимулирующего типа. В свою очередь каждую из этих групп можно подразделить на вещества общего и избирательного действия (табл.).

Отличительным свойством веществ общего действия является отсутствие у них избирательного влияния на определенные центры или функции. Они вмешиваются в деятельность ЦНС практически на всех ее уровнях. Типичным примером подобных веществ являются средства для наркоза. Они оказывают выраженное угнетающее влияние на передачу возбуждения в центральных звеньях рефлексов, замыкающихся в головном, спинном и продолговатом мозге. Это приводит к выключению сознания, подавлению чувствительности и большинства рефлексов.

Вещества, влияющие на центральную нервную систему

Группа веществ	Угнетающего типа действия	Стимулирующего типа действия
Общего действия	Средства для наркоза Спирт этиловый Снотворные средства (наркотического типа)	Аналептики
Избирательного (преимущественного) действия	Болеутоляющие средства (анальгетики) Противоэпилептические средства Антипсихотические средства Анксиолитики Седативные средства	Антидепрессанты Психостимуляторы

Вещества с так называемым избирательным действием влияют преимущественно на определенные центры или на функциональные системы, не нарушая деятельность ЦНС в целом. К таким препаратам относятся болеутоляющие (например, опиоиды), противопаркинсонические средства, анксиолитики и др. Указанные группы веществ отличаются разной степенью избирательности действия на определенные центры и функции ЦНС.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой. 201-223; 274-383

Вопросы к практической подготовке

1. Фармакологические свойства органических и неорганических вяжущих средств. Механизм действия. Показания к применению.
2. Обволакивающие и адсорбирующие вещества. Принцип фармакологического действия. Применение.
3. Раздражающие вещества. Фармакологические свойства. Показания к назначению.
4. Вещества, влияющие на эфферентный отдел периферической нервной системы. М - и Н – холинергические вещества. Антихолинэстеразные средства.
5. М-холинергические вещества. Н-холинергические вещества.
6. Средства, воздействующие на адренергические процессы.
7. Нейротропные средства. Вещества, влияющие преимущественно на центральную нервную систему.
8. Ингаляционные и неингаляционные наркотические средства. Снотворные средства. Спирт этиловый.
9. Наркотические анальгетики. Противоэпилептические и противопаркинсонические средства.
10. Психотропные средства. Нейролептики. Анксиолитики (транквилизаторы). Седативные средства.

11. Психостимулирующие вещества. Антидепрессанты. Средства, стимулирующие витальные функции центральной нервной системы.

Задания к практической подготовке

1. Сделать конспект классификации лекарственных веществ, действующих на афферентный отдел периферической нервной системы.

Практическая подготовка № 10. Средства, влияющие на функции исполнительных органов.

Теоретическая часть

Лекарственные средства, влияющие на функции органов дыхания
Классификация.

1. Стимуляторы дыхания.
2. Противокашлевые средства.
3. Отхаркивающие средства.
4. Средства, применяемые при бронхиальной астме.
5. Средства, применяемые при отеке легких.

Вещества, нормализующие кровообращение, часто используют в практической медицине при нарушении деятельности сердца и патологических изменениях сосудистого тонуса. Исходя из клинического применения этих препаратов, можно выделить следующие группы.

I. Средства, применяемые при нарушениях деятельности сердца:

- а) при сердечной недостаточности;
- б) при нарушениях ритма сердечных сокращений;
- в) при недостаточности кровоснабжения миокарда.

II. Средства, применяемые при патологических состояниях, сопровождающихся изменениями артериального давления:

- а) при артериальной гипертензии;
- б) при гипотензивных состояниях.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 483-514

Вопросы к практической подготовке

1. Средства, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Сердечные гликозиды. Противоаритмические средства.

2. Растения, содержащие сердечные гликозиды. История изучения. Строение сердечных гликозидов. Роль гликона и агликона в их действии. Понятие о биологической стандартизации сердечных гликозидов. Классификация сердечных гликозидов.

3. Механизм действия сердечных гликозидов: систолическое действие (положительное инотропное действие); диастолическое действие

(отрицательное хронотропное действие); влияние на проводящую систему сердца (отрицательное дромотропное действие).

4. Противоаритмические средства. Классификация, механизм действия и фармакологическая характеристика.

5. Средства для лечения коронарной недостаточности (антиангинальные средства).

6. Нейротропные средства: психодепримирующие вещества, средства, обладающие центральной β -адреномиметической активностью, вещества рефлекторного действия.

7. Миотропные вещества: ингибиторы фосфодиэстеразы, ингибиторы аденозиндезаминазы.

8. Гипертензивные и антигипертензивные вещества.

9. Диуретические средства.

10. Средства, влияющие на тонус и сократительную активность миомерия.

11. Средства, влияющие на систему крови.

12. Средства, влияющие на функции органов дыхания.

13. Средства, влияющие на функции органов пищеварения.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр.

Практическая подготовка № 11. Вещества с преимущественным влиянием на процессы тканевого обмена.

Теоретическая часть

Гормоны - это биологически активные вещества, вырабатываемые эндокринными железами и специальными группами клеток в различных тканях. Они играют важнейшую роль в гуморальной регуляции разнообразных функций организма. Кроме того, отдельные гормоны являются нейромодуляторами.

От греч. *hormao* - возбуждаю.

Гормонами называют биологически активные вещества, которые секретируются эндокринными клетками непосредственно в кровь. Они действуют на ткани и органы, удаленные от эндокринных желез. Кроме того, выделяют так называемую паракринную секрецию. В этом случае клетки продуцируют так называемые локальные гормоны (или аутокоиды), воздействующие на близлежащие клетки (например, гистамин, выделяемый тучными клетками). Предложен также термин «аутокринная секреция», при которой продуцируются активные вещества, воздействующие на ту же клетку, где осуществляется их биосинтез (это типично для многих цитокинов). Однако такое подразделение не является абсолютным. Нередко вещества относятся не

только к одной группе (например, NO может вызывать как аутокринный, так и паракринный эффект).

В данной главе будут рассмотрены только гормоны, вырабатываемые эндокринными железами.

Значение гормонов особенно наглядно проявляется при гипофункции той или иной эндокринной железы. Например, при недостаточности островкового аппарата поджелудочной железы развивается сахарный диабет, при недостаточности паращитовидных желез - гипокальциемия, сопровождающаяся судорогами, при недостаточности антидиуретического гормона задней доли гипофиза - несахарный диабет. Вместе с тем известны заболевания, связанные с повышенной продукцией гормонов. Так, при гиперфункции щитовидной железы развивается гипертиреоз (базедова болезнь), при образовании избыточных количеств соматотропного гормона передней доли гипофиза - гигантизм, акромегалия.

При недостаточности желез внутренней секреции обычно назначают гормональные препараты. В данном случае требуется так называемая заместительная терапия, при которой длительность применения этих препаратов определяется продолжительностью гипофункции соответствующей железы. Кроме того, используют средства, стимулирующие выработку гормонов.

Получают гормональные препараты синтетическим путем, а также из органов и мочи животных (в последнем случае активность ряда препаратов определяется путем биологической стандартизации и выражается в единицах действия - ЕД). В настоящее время для получения гормонов широко используется метод генной инженерии. Кроме того, синтезировано значительное число производных естественных гормонов и их синтетических заменителей, отличающихся по строению от естественных гормонов.

Получены и антагонисты ряда гормонов, блокирующие действие последних на уровне соответствующих рецепторов (например, антагонисты половых гормонов).

По химическому строению гормональные препараты относятся к следующим группам:

1) вещества белкового и пептидного строения - препараты гормонов гипоталамуса, гипофиза, паращитовидной и поджелудочной желез, кальцитонин;

2) производные аминокислот - препараты гормонов щитовидной железы, препараты гормонов эпифиза;

3) стероидные соединения - препараты гормонов коры надпочечников и половых желез.

При гиперфункции эндокринных желез используют антагонисты гормонов, блокирующие соответствующие рецепторы или ингибирующие синтез гормонов.

Первичное действие гормонов локализуется на уровне цитоплазматических мембран или внутриклеточно. Одни гормоны (из группы белков и пептидов) взаимодействуют со специфическими рецепторами, расположенными на наружной поверхности клеточных мембран. Многие из этих рецепторов связаны с аденилатциклазой, изменение активности которой в значительной степени определяет содержание внутри клетки цАМФ. Чаще всего гормоны стимулируют аденилатциклазу и повышают содержание цАМФ. Содержание цАМФ можно повысить также за счет угнетения фосфодиэстеразы. Однако из гормонов так действует лишь трийодтиронин, да и то в очень высоких концентрациях. В свою очередь цАМФ активирует протеинкиназы, что влияет на течение различных интрацеллюлярных процессов (рис. 20.1). Таким путем действуют кортикотропин, тиротропин, гонадотропные гормоны гипофиза, меланоцитстимулирующие гормоны, паратгормон, кальцитонин, глюкагон.

Гормоны могут влиять на захват, высвобождение и внутриклеточное распределение ионов кальция, который также может выступать в качестве «посредника»

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой стр. 543-562

Вопросы к практической подготовке

1. Классификация витаминных препаратов. Механизм действия, фармакологическая характеристика, участие в обменных процессах, показания и способы применения препаратов водорастворимых витаминов.
2. Никотиновая кислота, рутин. Участие в тканевом дыхании и метаболических процессах, в поддержании нормальной функции ЦНС. Влияние на сосуды.
3. Гормональные препараты белковой структуры
4. Гормональные препараты стероидной структуры.
5. Нестероидные противовоспалительные средства. Гистамин. Антигистаминные препараты.

Задания к практической подготовке

1. Изучить механизм действия, препаратов жирорастворимых витаминов.
2. Составить схему сочетанное применение витаминов.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка № 12. Седативные средства.

Теоретическая часть

Седативные средства (от лат. *sedatio* — успокоение) усиливают процессы торможения в ЦНС, применяются, главным образом, при вегетососудистых дистониях и неврозах.

Согласно теории нервизма И.П. Павлова, нормальное течение психических процессов обусловлено равновесием между возбуждательными и тормозными процессами в ЦНС, а также их достаточной для адекватного реагирования на внешние раздражители лабильностью. При наличии чрезмерных внешних раздражений возможен срыв нервной деятельности, сопровождающийся преобладанием возбуждательных процессов в ЦНС. В таких ситуациях показано назначение седативных препаратов. Механизм действия седативных средств заключается в усилении тормозных процессов в ЦНС и таким образом в приведении их в соответствие с патологически увеличенными возбуждательными процессами. Среди седативных средств выделяют препараты брома и препараты растительного происхождения.

Препараты брома представлены солями брома: калия бромидом и натрия бромидом. Препараты обладают умеренным седативным действием, хорошо всасываются из ЖКТ и медленно выводятся из организма ($t_{1/2}$ равен 10-12 дням), в основном почками, но также кишечником, потовыми и молочными железами. Препараты брома применяют при неврастении и других неврозах, повышенной раздражительности.

Бромиды при длительном применении кумулируют в организме. Побочные эффекты бромидов, в особенности при длительном применении могут проявляться комплексом патологических реакций, называемых бромизмом. Проявлениями бромизма являются общая заторможенность, сонливость, нарушение памяти, кожные высыпания. Препарат может также оказывать раздражающее действие на слизистые оболочки, вызывая понос, кашель, конъюнктивит. Для ускорения выведения бромидов из организма назначают большие количества натрия хлорида (до 10—20 г в сутки) и обильное питье.

Более безопасными в применении являются седативные средства растительного происхождения: препараты валерианы лекарственной, пиона, пустырника и др. Они обладают большим терапевтическим действием и практически не вызывают серьезных побочных эффектов.

Наиболее широко применяют препараты валерианы лекарственной: настой корневища с корнями валерианы, настойку валерианы, экстракт валерианы густой. Препараты валерианы оказывают выраженное седативное действие, усиливают действие снотворных средств, оказывают спазмолитическое действие. Применяют препараты валерианы при неврозах,

спазмах гладких мышц внутренних органов.

В качестве седативных средств используют также комбинированные препараты, содержащие фенобарбитал. Наиболее часто применяют препарат валокордину состав которого входят фенобарбитал, этиловый эфир α -бромизовалериановой кислоты, масло мяты перечной, масло хмеля, этиловый спирт. Валокордин оказывает седативное, умеренное сосудорасширяющее и спазмолитическое действие. Корвалол близок по составу и аналогичен валокордину по действию. Кроме валокордина и корвалола применяются близкие по составу и действию комплексные препараты: валосердин, новопассит и др.

Задания к практической подготовке

1. Комбинированные седативные средства. Изучить и дать обоснование преимущества по сравнению с препаратами солей брома.
2. Изучить классификацию седативных средств. Составить таблицу.

Вопросы к практической подготовке

1. Седативные средства, определение.
 2. Классификация седативных средств.
 3. Проявление бромизма. Причины.
- Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №13. Транквилизаторы. Спирты. Средства, применяемые для лечения алкоголизма.

Теоретическая часть

Транквилизаторы -анксиолитические средства (от лат. *tranqu-illare* — спокойствие, покой) — лекарственные средства, устраняющие чувство страха, тревогу, внутреннюю эмоциональную напряженность. Это обстоятельство послужило причиной того, что всем препаратам, обладающим способностью устранять страх, тревогу, напряжение было дано название анксиолитики или анксиолитические средства (от лат. *anxius* — тревожный, находящийся в страхе, и *lysis* — растворение, устранение).

Д и а з е п а м (Сибазон, Седуксен, Валиум, Реланиум), феназепам, хлордиазепоксид (Элениум), медазепам (Мазепам, Рудотель), являются производными бензодиазепина.

Бензодиазепины оказывают анксиолитическое (транквилизирующее), седативное, снотворное, противосудорожное и миорелаксирующее действие.

Противосудорожное действие бензодиазепинов связано с подавлением эпи-лептогенной активности, что также объясняют усилением тормозных ГАМК-ер-гических процессов в ЦНС. Некоторые препараты этой группы применяются в качестве противоэпилептических средств.

Бензодиазепины в небольших дозах оказывают седативное, а при увеличении доз — снотворное действие, потенцируют угнетающее действие на ЦНС средств для наркоза, наркотических анальгетиков, алкоголя в больших дозах могут вызвать антероград-ную амнезию.

Бензодиазепины применяют при невротических и неврозоподобных состояниях, которые сопровождаются страхом, тревогой, а также как седативные (успокаивающие) и снотворные средства при бессоннице. Бензодиазепины широко используются для премедикации перед хирургическими операциями и введения в наркоз, в качестве противоэпилептических средств и при заболеваниях, сопровождающихся повышенным мышечным тонусом.

Бензодиазепины вызывают эйфорию (приятное состояние, повышенное настроение, ощущение душевного комфорта) — такое изменение эмоционального статуса, которое некоторые пациенты стремятся получить вновь, злоупотребляя препаратами этой группы. При систематическом применении бензодиазепинов формируется лекарственная зависимость. Поэтому при неврозах и бессоннице бензодиазепины следует принимать не более 3—4 нед. Кроме того, применение бензодиазепинов вызывает привыкание, вследствие чего для достижения того же терапевтического эффекта дозу препарата приходится постоянно увеличивать.

После прекращения приема препарата может возникнуть синдром отмены.

Тревога, депрессия, бессонница, тошнота, расстройство восприятия могут отмечаться продолжительное время. Для предупреждения синдрома отмены дозы препарата следует снижать постепенно.

Бензодиазепины различают по продолжительности действия: препараты длительного действия ($t_{1/2}$ - 24—48 ч — диазепам, феназепам, хлордиазепоксид), средней ($t_{1/2}$ - 6-24 ч - алпразолам, оксазепам) и короткой продолжительности действия ($t_{1/2}$ менее 6ч- мидазолам). Продолжительность действия длительно действующих препаратов (диазепама, хлордиазепоксида) связана с образованием активных метаболитов.

Диазепам и феназепам оказывают наиболее сильное анксиолитическое и снотворное действие.

Медазепам является «дневным» транквилизатором (седативный и снотворный эффекты, а также миорелаксирующее действие выражены в минимальной степени).

Побочные эффекты при приеме бензодиазепинов проявляются в виде сонливости, головной боли, нарушении памяти, внимания, координации движений, особенно у пожилых людей. При употреблении бензодиазепинов

не рекомендуется заниматься деятельностью, требующей повышенного внимания (например, вождением автомобиля).

Производные азаспиродекандиона

Буспирон отличается от других анксиолитиков по механизму действия. Точкой его приложения является серотонинергическая система мозга. Буспирон является анксиолитиком без седативной активности. Кроме того, он не обладает противосудорожной и миорелаксирующей активностью. Недостатком препарата является то обстоятельство, что его анксиолитический эффект проявляется только через 2 нед от начала приема. Препарат практически не вызывает лекарственную зависимость, развитие привыкания к препарату также выражено слабо.

Производные других химических групп

Бензоклидина гидрохлорид (Оксилидин), мебикар Бензоклидин в отличие от других транквилизаторов не обладает центральными миорелаксирующими свойствами. Второе отличие и особенность препарата является его способность умеренно блокировать ганглии и адренорецепторы и вызывать гипотензивное действие. Поэтому он может рассматриваться в качестве препарата выбора у больных гипертонической болезнью и с расстройствами мозгового кровообращения.

Особенностью мебикара является умеренная транквилизирующая активность; он не вызывает центрального миорелаксирующего действия и применяется как «дневной» транквилизатор.

Применение этилового спирта как медицинского препарата. Он оказывает местное (антимикробное и раздражающее) и резорбтивное (общенаркотическое) действие. Этиловый спирт входит в состав настоек, экстрактов и растворов для наружного применения. К сожалению, приходится рассматривать и отрицательное влияние регулярного употребления спирта или спиртосодержащих напитков, приводящее к хроническому отравлению и развитию зависимости. Профилактика и лечение алкоголизма являются серьезной медицинской и социальной проблемой.

Препараты для снятия зависимости

Препараты, снимающие зависимость, вызывают отвращение к этиловому спирту и снимают тягу к алкогольным напиткам. Лекарства выпускаются в форме таблеток для приема внутрь или подкожных инъекций. Препараты назначаются врачом и продаются по рецепту из-за противопоказаний и побочных эффектов.

Дисульфирам. Таблетки имплантируются под кожу, вызывают отвращение к алкоголю и ослабляют тягу больных к спиртным напиткам. Врач составляет индивидуальную дозировку. При лечении пациенту запрещен

алкоголь. В противном случае развиваются негативные побочные эффекты (отек мозга, инфаркт, инсульт)

Налтреаксон. При лечении налтреаксоном формируется рефлекторное отвращение к спиртному. Таблетки применяются при комплексном восстановлении организма при алкоголизме. Дозировка – 1 таблетка в день (курс приема – 3 месяца). Противопоказания – гепатит, печеночная недостаточность, абстиненция. Лекарство рекомендуется принимать под надзором медицинских работников из-за возможных побочных эффектов (нарушения дыхания, опорно-двигательной и половой систем)

Метронидазол. Препарат назначают при лечении хронического алкоголизма. Антибиотик снижает тягу к алкогольным напиткам и уровень опьянения при приеме этилового спирта. Дозировка – 250-750 мг 3-4 раза в сутки. Лекарство противопоказано при беременности, поражениях ЦНС, болезнях крови. Побочные эффекты – головные боли, тошнота, бессонница, раздражительность. Прием медикамента вместе с алкоголем усиливает негативные побочные эффекты.

Тетурам. Лекарство создает неприятные ощущения при приеме алкоголя, вырабатывается отрицательный эффект – организм отторгает спиртосодержащие напитки. Тетурам используют для лечения хронического алкоголизма и профилактики запоев. Таблетки принимаются внутрь или имплантируются под кожу. Дозировка составляется индивидуально (корректируется и снижается врачом в ходе восстановления организма). Побочные эффекты – головные боли, аритмия, отек мозга, гастрит, психозы. Употребление алкоголя при лечении усиливает негативные побочные эффекты

Фуразолидон. Препарат несовместим с алкоголем (усиливает интоксикацию, усиливает чувствительность организма к этанолу, провоцирует тошноту и рвоту). Прием таблеток в течении 10 дней вызывает реакцию, схожую с действием Дисульфирама – отвращение к алкоголю. Дозировка – 200 мг 4 раза в сутки (курс – 10 дней и более). Препарат противопоказан при беременности и почечной недостаточности.

Капли для лечения алкоголизма – составляющие комплексной терапии.

Капли Колме. Препарат воздействует на нервную систему пациента и блокирует удовольствие от принятия этилового спирта. Дозировка – 10-25 капель в день. Помимо легкой сонливости, побочных явлений нет

Мидзо. Аналог препарата Колме. Замедляет метаболизм этилового спирта в организме, вызывая отвращение к алкоголю. Дозировка – 12-25 капель 2 раза в день. Противопоказания - патологии почек, печени, сердечно-сосудистые болезни, беременность). Побочных эффектов нет, кроме

сонливости и усталости. Препарат несовместим с алкоголем (побочные эффекты – слабость, тошнота, головные боли)

Вопросы к практической подготовке

1. Транквилизаторы.
2. Характеристика анксиолитических лекарственных средств.
3. Фармакодинамика, показания к применению транквилизаторов.
4. Побочное действие анксиолитических лекарственных средств.
5. Основные лекарственные препараты из группы транквилизаторов.
6. Особенности применения препаратов для лечения алкогольной зависимости.

Задания к практической подготовке

1. Дать определение анксиолитических препаратов.
2. Что такое синдром отмены и в чем он проявляется?
3. Особенность препарата мебикар.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка № 14. Наркотические анальгетики.

Теоретическая часть.

Опиоидные (наркотические) анальгетики

Эти вещества являются агонистами опиоидных рецепторов антиноцицептивной системы и оказывают обезболивающее действие без утраты сознания или погружения в сон и угнетения других видов чувствительности.

Основным механизмом анальгетического действия опиоидных анальгетиков является: 1) угнетение проведения болевых импульсов в афферентных путях ЦНС (нарушение передачи импульсов с окончаний первичных афферентов на вставочные нейроны спинного мозга); 2) усиление тормозного влияния нисходящей антиноцицептивной системы на проведение болевых импульсов в афферентных путях ЦНС; 3) изменение эмоциональной оценки боли.

Среди веществ, стимулирующих опиоидные рецепторы, выделяют полные агонисты опиоидных рецепторов (вещества, которые способны вызвать максимальный для данной системы эффект), частичные агонисты опиоидных рецепторов (вещества, которые всегда вызывают эффект, меньший максимального) и агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов (стимулируют рецепторы одного подтипа и блокируют рецепторы другого подтипа).

А. Полные агонисты опиоидных рецепторов

а) Природные наркотические анальгетики (опиаты)

Морфин (Долтард, Морфилонг), омнопон (Пантопон), кодеин

б) Синтетические наркотические анальгетики

Тримеперидин (Промедол), фентанил, метадон

2. Частичные агонисты и агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов

Пентазоцин (Фортрал), буторфанол (Бефорал, Стадол), налбу-фин (Нубаин), бупренорфин

Полные агонисты опиоидных рецепторов

Природные наркотические анальгетики (опиаты)

Источником получения морфина и других природных наркотических анальгетиков является опий — высохший на воздухе млечный сок, который получают из надрезов на незрелых коробочках мака снотворного

Морфин — производное фенантрена, основной алкалоид опия (10% концентрации). Морфин был выделен из опия в 1806 г. немецким ученым Сертюрнером, который назвал его по имени бога сна Морфея .

Действие морфина на организм связано с возбуждением опиоидных рецепторов, расположенных как в центральной нервной системе, так и в периферических тканях.

Стимуляцией центральных опиоидных рецепторов определяются следующие фармакологические эффекты морфина:

-Анальгезия

-Эйфория — возникновение приятных ощущений и немотивированное состояние свободы от тревог и проблем. При этом возникает чувство комфорта и устраняются чувства голода, жажды и т.п. Это является причиной развития лекарственной зависимости - непреодолимого желания повторного приема морфина (морфинизм). У некоторых больных и здоровых людей, не испытывающих боли, может развиться ощущение беспокойства и разбитости, плохое самочувствие (дисфория).

-Седативный эффект — состояние покоя, сонливость, нарушение способности к рассуждению (без утраты памяти) и поверхностный сон

-Противокашлевое действие вследствие угнетения кашлевого центра (к эффекту быстро развивается привыкание).

-Угнетение дыхания связано в основном со снижением чувствительности дыхательного центра к двуокиси углерода и зависит от дозы. Дыхание становится редким и глубоким при введении даже терапевтических доз морфина. В токсических дозах развивается очень редкое поверхностное дыхание, вплоть до полной его остановки (при отравлении морфином смерть наступает от паралича дыхательного центра). Для восстановления дыхания используются антагонисты опиоидных рецепторов.

-Миоз — сужение зрачков, являющееся характерным диагностическим

признаком приема морфина. Возникает в результате возбуждения центра глазодвигательного нерва. Привыкание в отношении миоза развивается медленно.

-Брадикардия вследствие повышения тонуса центра блуждающих нервов.

-Тошнота и рвота, усиливающиеся при движении.

-Влияние на продукцию гормонов. Повышение продукции пролактина, антидиуретического гормона (вазопрессина), гормона роста, что связано со стимуляцией гипоталамических центров. Усиление выделения вазопрессина приводит к уменьшению диуреза. Снижение секреции гонадотропных гормонов, АКТГ. Снижается также секреция тестостерона и гидрокортизона.

-Снижение температуры тела ниже нормы (вне зависимости от исходного уровня). Эффект связан с угнетением центра терморегуляции в гипоталамусе и снижением теплопродукции. Гипотермия отчетливо проявляется при применении больших доз морфина.

-Повышение тонуса скелетных мышц (преимущественно мышц-сгибателей и дыхательных мышц). Эффект реализуется на уровне спинного мозга.

-Лекарственная зависимость (психическая и физическая) развивается при повторных приемах морфина. Желание повторного приема морфина сначала связано с вызываемой морфином эйфорией. Затем развивается физическая зависимость, которая проявляется абстинентным синдромом.

Эффекты, вызванные возбуждением периферических опиоидных рецепторов:

-Стимуляция выделения гистамина приводит к расширению сосудов кожи и конъюнктивы глаз, крапивнице. У больных бронхиальной астмой морфин может вызвать бронхоспазм (повышение тонуса бронхов связано также с действием на опиоидные рецепторы бронхиальных мышц).

-Снижение пропульсивной моторики желудка и кишечника, повышение тонуса сфинктеров кишечника, уменьшение секреции поджелудочной железы и выделения желчи (вследствие повышения тонуса сфинктера Одди и желчных протоков) нарушают продвижение содержимого по кишечнику и приводят к развитию обстипации (запора). Вследствие повышения тонуса гладких мышц желчевыводящих путей могут возникнуть спастические боли (колики).

-Повышение под действием морфина тонуса мочеточников может вызвать приступ почечной колики, а повышение тонуса сфинктеров уретры может вызвать задержку мочеиспускания.

Применяют морфин как болеутоляющее средство при выраженных болях, связанных с тяжелыми травмами, ожогами, такими заболеваниями как

злокачественные опухоли, инфаркт миокарда. Морфин применяют в анестезиологии для подготовки больных к операции (премедикации), а также при послеоперационных болях. Снимая сильные боли, морфин препятствует развитию болевого шока.

Морфин вводят парентерально (внутривенно, подкожно) и внутрь в виде таблеток. Но поскольку морфин всасывается из желудочно-кишечного тракта недостаточно хорошо, а также в значительной степени метаболизируется при первом прохождении через печень, для достижения быстрого и выраженного действия его вводят парентерально.

Действие морфина развивается через 10-15 мин после введения под кожу и через 20-30 мин после приема внутрь (максимальная концентрация в плазме крови достигается через 10—30 мин после подкожного введения морфина и через 1—2 ч после приема внутрь). Действие однократной дозы продолжается 3—6 ч.

Побочные эффекты морфина: тошнота, рвота, спазм гладких мышц, обстипация, брадикардия, гипотония, урежение дыхания; при повторном применении -привыкание, лекарственная зависимость.

Морфин противопоказан при артериальной гипотензии, дыхательной недостаточности, паралитических, спастических и обструктивных заболеваниях ЖКТ, гипертрофии простаты, при повышенном внутричерепном давлении, при беременности. Морфин не рекомендуют применять для обезболивания родов (возможно угнетение дыхательного центра у плода), у детей до 2 лет и лиц старше 60 лет, не назначают его кормящим матерям.

При остром отравлении морфином развивается коматозное состояние, редкое поверхностное дыхание, брадикардия, резко суживаются зрачки (диагностический признак интоксикации опиоидами), однако при асфиксии зрачки расширяются. Тяжелое отравление приводит к смертельному исходу вследствие остановки дыхания.

Синтетические наркотические анальгетики

Тримеперидин — синтетический наркотический анальгетик, оригинальный отечественный препарат (М.Д. Машковский, В.И. Ищенко).

Тримеперидин по анальгетической активности в 2-4 раза уступает морфину, но в отличие от морфина в меньшей степени угнетает дыхательный центр (поэтому может быть использован при беременности, для обезболивания родов и у детей), несколько повышает тонус и сократительную активность миометрия. В отличие от морфина тримеперидин оказывает спазмолитический эффект (на мочеточники, бронхи) или менее выраженное спазмогенное действие (на кишечник, желчевыводящие пути), в связи с чем может использоваться при почечных и печеночных коликах.

Фармакокинетические параметры тримеперидина аналогичны морфину.

Показания: выраженный болевой синдром (травмы, злокачественные новообразования, послеоперационный период и др.), подготовка к операции, обезболивание родов, почечная, кишечная и печеночная колики.

Побочные действия: тошнота, рвота, слабость, головокружение. Возможно развитие лекарственной зависимости. Противопоказания: дыхательная недостаточность.

Фентанил - производное фенил пиперидина. Вследствие высокой липофильности фентанил быстро проникает в ткани мозга, но затем перераспределяется и накапливается в жировой ткани, где подвергается медленному метаболизму. Фентанил по сравнению с другими наркотическими анальгетиками ока-

зывает очень быстрое (эффект наступает через 1-3 мин после внутривенного введения) и кратковременное (20-30 мин) обезболивающее действие. Препарат применяют парентерально (внутривенно, внутримышечно) главным образом для быстрого обезболивания перед и во время хирургических операций.

Противопоказания и побочные эффекты фентанила соответствуют таковым морфина. Фентанил сильнее, чем морфин угнетает дыхательный центр, кроме того, после его применения возможна кратковременная ригидность (повышение тонуса) мышц грудной клетки.

Метадон — производное фенилгептиламина, сходное по эффектам с морфином, оказывает более слабое, но более продолжительное действие. Назначают внутрь.

Привыкание и физическая зависимость развиваются значительно медленнее, чем при применении морфина. Абстиненция после прекращения приема метадо-на менее выражена (мягкая абстиненция), но более продолжительна, чем при отмене морфина. Эти свойства метадона позволяют использовать его в ряде стран для детоксикации и поддерживающего лечения лекарственной зависимости к опиоидам, в частности к героину.

Частичные агонисты и агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов

Бупренорфин относится к частичным агонистам μ -опиоидных рецепторов. По анальгетической активности в 20-30 раз превышает морфин и действует дольше (6-8 ч). По эффективности сравним с морфином. Вводят парентерально и сублингвально. При сублингвальном применении бупренорфина действие наступает через 25-35 мин и продолжается 8-12 ч (применяют для неотложной помощи при массовых травматических поражениях — оказывает противошоковое действие, облегчает транспортировку пострадавших).

Пентазоцин — производное бензоморфана, синтетический наркотический анальгетик. По анальгетической активности уступает морфину, но в меньшей степени угнетает дыхание. Так как пентазоцин не вызывает эйфорию (связана со стимуляцией μ -рецепторов), а может вызывать дисфорию, при его применении меньше риск возникновения лекарственной зависимости.

Препарат вводят парентерально (внутривенно, внутримышечно, подкожно) и внутрь. Хорошо всасывается при всех путях введения.

Пентазоцин вызывает повышение давления в легочной артерии, при этом увеличивается преднагрузка на сердце, повышается работа сердца. Поэтому препарат не рекомендуют применять при инфаркте миокарда. Для пентазоцина характерны дисфория, галлюцинации, тахикардия, повышение артериального давления.

Препарат противопоказан при бронхиальной астме, черепно-мозговой травме, эпилепсии, желчно- и мочекаменной болезни, недостаточности печени и почек. Ограничения к применению: беременность, грудное вскармливание, детский возраст (до 1 год

Вопросы к практической подготовке

- 1.Опиоидные анальгетики.
- 2.Определение наркотических анальгетиков анальгетиков;
- 3.Классификация наркотических анальгетиков
- 4.Характеристика алкалоидов опия.
- 5.Характеристика синтетических наркотических анальгетиков

Задания к практической подготовке

- 1.Анальгезирующие(болеутоляющие) средства, классификация.
- 2.Опиоидные анальгетики. Дать определение наркотических анальгетиков.
- 3.Классификация наркотических анальгетиков, составить таблицу.
- 4.Характеристика алкалоидов опия.
- 5.Характеристика синтетических наркотических анальгетиков.

Практическая подготовка № 15. Ненаркотические анальгетики.

Теоретическая часть

Неопиоидные препараты с анальгетической активностью

Препараты различных фармакологических групп с анальгетическим компонентом действия.

Ацетаминофен (Парацетамол, Панадол, Тайленол, Эффералган) — ненаркотический анальгетик, производное пара-аминофенола, активный метаболит фенаcetина. Обладает болеутоляющим и жаропонижающим действием. Противовоспалительная активность отсутствует. Анальгетическое действие связано с ингибированием циклооксигеназы в ЦНС.

Используют препарат при головной боли, для снижения температуры при лихорадке, миалгии, невралгии, суставных болях. В терапевтических дозах редко вызывает побочные эффекты. Однако токсическая доза ацетаминофена лишь в 3 раза превышает терапевтическую.

Клонидин (Клофелин) — α_2 -адреномиметик, используемый как антигипер-тензивное средство. Обладает выраженным анальгетическим действием, которое объясняют усилением нисходящих тормозных влияний (опосредуемых α_2 -адре-норецепторами) на проведение болевых импульсов в афферентных путях спинного мозга. Препятствует развитию вегетативных нарушений, вызванных болью. Как анальгетик используется для уменьшения боли при оперативных вмешательствах, в послеоперационном периоде, при инфаркте миокарда, злокачественных опухолях.

Амитриптилин и имипрамин (Имизин) - трициклические антидепрессанты. За счет угнетения обратного нейронального захвата норадреналина и сёротонина активируют нисходящую антиноцицептивную систему, угнетающую передачу болевых импульсов на уровне спинного мозга. Эффективны главным образом при хронических болях. Используются при невралгии различной этиологии, фантомных болях.

Карбамазепин (Тегретол, Финлепсин) и фенитоин (Дифенин) - блокаторы натриевых каналов, применяемые как противоэпилептические средства. Как анальгетики эффективны при невралгии тройничного нерва, сопровождающейся приступами сильных болей.

Габапентин также применяется как противоэпилептическое средство. Как анальгетик применяют при мигрени, нейропатических болях.

Баклофен — агонист ГАМКв-рецепторов, применяется при болезненных мышечных спазмах, спастичности.

Кетамин (Кеталар) - производное фенциклидина, является неконкурентным антагонистом NMDA-рецепторов, обладает выраженным анальгетическим действием

Азота закись применяется ингаляционно обладает выраженными анальгетическими свойствами, применяется для уменьшения болей при инфаркте миокарда, для обезболивания родов, в послеоперационном периоде.

Анальгетики со смешанным механизмом действия

Трамадол (Трамал). Анальгетический эффект дополнительно опосредуется за счет влияния на адренергическую и серотонинергическую передачу (нарушается нейрональный захват норадреналина и серотонина) в нисходящих антиноцицептивных путях, в результате чего усиливаются нисходящие тормозные влияния на проведение болевых импульсов на уровне спинного мозга. Трамадол по активности уступает морфину. Анальгетическое действие практически не сопровождается угнетением дыхания, снижением моторики желудочно-кишечного тракта, повышением тонуса мочевыводящих путей. В сравнении с морфином препарат обладает незначительным наркотическим потенциалом (меньше риск лекарственной зависимости), не входит в перечень наркотиков. Применяют препарат при послеоперационных болях и других болевых синдромах (при инфаркте миокарда, злокачественных опухолях, травмах). Назначают парентерально, внутрь и ректально.

Вопросы к практическому заданию

1. Ненаркотические анальгетики.
2. Характеристика действия ненаркотических анальгетиков.
3. Анальгетики со смешанным механизмом действия.

Задания к практическому заданию

1. Дать характеристику ненаркотическим анальгетикам.
2. Трамадол. Классификация, применение в качестве анальгетического средства. Побочные действия.

Практическое задание №3. Нестероидные противовоспалительные средства

Теоретическая часть.

Анальгезирующие средства преимущественно периферического действия (нестероидные противовоспалительные средства)

Нестероидные противовоспалительные средства (НПВС) - большая группа соединений, обладающих противовоспалительным, анальгезирующим и жаропонижающим свойствами. Эти свойства НПВС связаны с их способностью нарушать образование простагландинов E_2 и I_2 , которые являясь медиаторами воспаления, вызывают следующие эффекты:

- расширяют артериолы, а также усиливают действие других медиаторов воспаления гистамина и брадикинина на проницаемость сосудов, это приводит к экстравазации плазмы, инфильтрации и отеку тканей;

- повышают чувствительность болевых рецепторов (ноцицепторов) к брадикинину, гистамину и некоторым другим веществам, которые являются медиаторами боли;

- простагландин E_2 оказывает стимулирующее действие на центр

теплорегуляции в гипоталамусе и повышает температуру тела.

Простагландины E_2 и I_2 образуются из арахидоновой кислоты. Происходит это следующим образом: сначала из арахидоновой кислоты под действием циклооксигеназы (ЦОГ), синтезируются циклические эндопероксиды, а из нестабильных циклических эндопероксидов далее образуются простагландины E_2 , I_2 , другие простагландины и тромбоксан (рис. 14.2). НПВС ингибируют ЦОГ и таким образом нарушают образование простагландинов E_2 и I_2 , что и определяет их основные фармакологические эффекты: противовоспалительный, анальгезирующий и жаропонижающий.

В качестве противовоспалительных и болеутоляющих средств при артритах, миозитах, невритах используют разные НПВС, в том числе ацетилсалициловую кислоту (Аспирин), ибупрофен (Бруфен), диклофенак (Вольтарен). При этом используется противовоспалительное и анальгетическое свойства этих препаратов. Кроме того, как болеутоляющие средства НПВС (ацетилсалициловую кислоту) применяют при головных болях, эффективны НПВС также при болях, связанных с менструациями.

В основном только как болеутоляющие средства используют метамизол-натрий и кеторолак.

Метамизол-натрий (Анальгин) применяется при болях, связанных с воспалительными процессами: миалгиях, невралгиях, артралгиях, при головной боли, болях, вызванных менструациями, вводят внутрь и парентерально. Препарат применяется при болях, связанных со спазмом гладких мышц (почечная, печеночная, кишечная колика), вводят внутривенно или внутримышечно. При систематическом применении метамизол может вызвать лейкопению, возможен агранулоцитоз, в связи с чем его применение ограничено, препарат не рекомендуется принимать длительно.

Кеторолак (Кетанов) обладает выраженной анальгетической активностью, но оказывает меньшее по сравнению с другими НПВС противовоспалительное действие. Кеторолак хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта, при введении внутрь биодоступность составляет 80—100%. Применяют кеторолак внутрь и парентерально для купирования послеоперационных болей (в качестве альтернативы опиоидным анальгетикам), а также при болях, вызванных травмами, при опухолевых заболеваниях и др. Показан при невралгии тройничного нерва.

Кеторолак при длительном применении вызывает побочные эффекты, характерные для других НПВС: изъязвление слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки.

Вопросы к практическому заданию

1. Нестероидные противовоспалительные средства.

2. Понятие о нестероидных противовоспалительных средствах (НПВС).
3. Побочные эффекты НПВС.
4. Показания к применению Нестероидных лекарственных средств.

Задание к практическому занятию

1. Дать характеристику НПВС.
2. В какую группу препаратов входит метамизол натрия.
3. Приведите примеры НПВС и область применения препаратов.
4. Какое общее побочное действие у нестероидных лекарственных средств?

Практическое занятие № 4. Витамины.

Теоретическая часть

Витамины - это биологически активные органические соединения, необходимые для протекания обменных процессов в организме. Биохимическая роль витаминов состоит в том, что они являются коферментами или их-составной частью. Большинство витаминов не синтезируется в организме человека и поступает с пищей. При недостаточном содержании витаминов в пище развивается гиповитаминоз или авитаминоз. В этих случаях назначают витаминные препараты.

Витамины имеют различную химическую структуру и относятся к разным классам соединений.

Витамины классифицируются в зависимости от их растворимости. Различают жиро- и водорастворимые витамины. Специфические эффекты и источники содержания жиро- и водорастворимых витаминов представлены в табл. 32.1 и 32.2.

В группу витаминов входят также близкие им по свойствам вещества, которые выделены значительно позже и обозначаются как «витаминоподобные», они имеют такие же буквенные обозначения, как и витамины (U, H, F, N и др.).

Вопросы к практическому занятию

1. жирорастворимые витамины
2. водорастворимые витамины
3. препараты жирорастворимых витаминов
4. препараты водорастворимых витаминов
5. витаминоподобные вещества
6. растительные витаминные препараты
7. витаминные препараты животного происхождения
8. поливитаминные препараты

Задания к практическому занятию

1. Витамин А.
Специфические эффекты. Источники содержания.
2. Витамин Е.
Специфические эффекты. Источники содержания.
3. Витамин С.
Специфические эффекты. Источники содержания.
4. Витамины группы В. Составить таблицу. Показания к применению, форма выпуска, источники содержания.
5. Витамин А, дефицит. Влияние на организм. Источники содержания.

Практическое задание №5. Антигистаминные средства

Теоретическая часть

Гистамин является биогенным амином (образуется в организме путем декарбоксилирования аминокислоты гистидина). Содержится гистамин в тучных клетках, базофилах, лейкоцитах.

Гистамин является естественным лигандом специфических гистаминовых (H) рецепторов, локализованных в различных органах и тканях. Выделяют 3 подтипа гистаминовых рецепторов: H₁-, H₂-, H₃-рецепторы.

В обычных условиях гистамин находится в организме в неактивном (связанном) состоянии, но при различных патологических состояниях (аллергические реакции, ожоги, обморожения) количество свободного гистамина резко увеличивается.

При этом гистамин вызывает спазм гладких мышц (включая мышцы бронхов), расширение кровеносных сосудов и снижение артериального давления, увеличение проницаемости капилляров и, вследствие этого, отек тканей. При внутрикожном и подкожном введении гистамина через несколько секунд на месте инъекции развиваются покраснение, местный отек, появляется чувство боли и зуда. В основе этих симптомов лежат местное расширение капилляров, увеличение сосудистой проницаемости и раздражение чувствительных нервных окончаний. Эти эффекты связаны в основном с возбуждением гистаминовых H-рецепторов.

Антигистаминные средства, блокирующие H-рецепторы, применяются при аллергических реакциях немедленного типа: крапивнице, кожном зуде, аллергическом конъюнктивите, ангионевротическом отеке (отеке Квинке), аллергическом рините и др.

Антигистаминные препараты подразделяются на 3 поколения. Препараты 1-го поколения наряду с антигистаминным действием обладают

выраженным седативным эффектом и относительно небольшой продолжительностью действия (исключение составляет мекгидролин). Препараты 2-го и 3-го поколения оказывают более избирательное действие на гистаминовые рецепторы действуют продолжительно и в более низких дозах; они отличаются меньшей липофильностью, в меньшей степени проникают через гематоэнцефалический барьер и практически не угнетают ЦНС (не оказывают седативного эффекта).

Необходимо учитывать, что медиаторами аллергии и воспаления являются и другие физиологически активные вещества (лейкотриены, брадикинин, простагландины и др.), в связи с чем антигистаминные препараты могут быть недостаточно эффективны. Антигистаминные препараты устраняют, в основном, острые проявления аллергических реакций, вызванных гистамином, и часто применяются в комплексе с другими лекарственными средствами.

Помимо антиаллергической активности антигистаминные препараты обладают рядом других свойств. В связи с этим их иногда используют в качестве седативных, снотворных средств.

Вопросы к практическому занятию

1. Антигистаминные средства
2. Средства, препятствующие дегрануляции тучных клеток
3. Глюкокортикоиды
4. Симптоматические противоаллергические средства

Задания к практическому занятию

1. Антигистаминные препараты первого поколения. Принципы назначения.

2. Сравнительная характеристика препаратов 1-го, 2-го и 3-го поколения антигистаминных препаратов. Таблица.