

ЧАСТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ
ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО ОБРАЗОВАНИЯ
«СТАВРОПОЛЬСКИЙ МНОГОПРОФИЛЬНЫЙ КОЛЛЕДЖ»

МЕТОДИЧЕСКИЕ УКАЗАНИЯ

к практическим занятиям

по дисциплине

«Фармакология»

для обучающихся по специальности

34.02.01 Лечебное дело

Ставрополь, 2021г.

Методические указания составлены в соответствии с Федеральным Государственным образовательным стандартом среднего профессионального образования по специальности 34.02.01 «Лечебное дело» утвержденным Минобрнауки России от 1 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 № от « » января 2023 г.

Рекомендовано к использованию в учебном процессе Методическим советом СМК, протокол №4 от «27 » января 2023 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 № 8. Виды действия лекарственных препаратов. Понятие о хронофармакологии.
- Практическое занятие № 9. Ненаркотические анальгетики
- Практическая подготовка № 10. Нестероидные противовоспалительные средства
- Практическая подготовка № 11. Активность трансаминазы сыворотки крови после экспериментального токсического гепатита
- Практическая подготовка № 12. Антибиотики. Классификация.
- Практическая подготовка № 13. Антибиотики.
показания к применению, побочные действия.
- Практическая подготовка № 14. Антидепрессанты и их применение при соматической патологии.
- Практическая подготовка № 15. Антидепрессанты: нейрохимические аспекты механизма действия.
- Практическая подготовка № 16. Антидепрессанты: нейрохимические аспекты механизма действия. Показания и побочные действия.
- Практическая подготовка № 17. Антихолинэстеразные средства.
- Практическая подготовка № 18. БАДы. Из чего делают и с чем едят.
Противники и сторонники биологических активных добавок к пище.
- Практическая подготовка № 19. Бетаксолол в лечении глаукомы.
- Практическая подготовка № 20. Биофармацевтические аспекты создания мазей.
- Практическая подготовка № 21. Биоэффекты растительных полифенолов.
- Практическая подготовка № 22. Блокаторы кальциевых каналов.
- Практическая подготовка № 23. Вещества, влияющие на адренергические синапсы.

Практическая подготовка № 24. Вещества влияющие угнетающие.

Практическое занятие № 25. Взаимодействие и несовместимость лекарственных средств.

Практическое занятие № 26. Влияние атропина на активность.

Практическое занятие № 27. Влияние эссенциальных фосфолипидов на структурно-функциональную организацию клеточных мембран тромбоцитов у больных ишемической болезнью сердца.

Список рекомендуемой литературы

Основная литература:

1. Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой: учебное пособие Москва: КноРус, 2019. (СПО)
<https://book.ru/book/930208>

Дополнительная литература:

1. Фармакология: учебник/ Рубан Э.Д.,2018

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;

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 принципами 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 наплаивания 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

Практической подготовке № 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.

Пилюли - 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; пилюля 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, внутриносовые, 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, апирогенность, 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.

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 P-450).

Задания к практической подготовке

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

Практической подготовке № 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 связанные 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).

Практическому занятию № 8. 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 { β -адреномиметики при длительном применении приводят к фосфорилированию β -адренорецепторов, которые не способны ответить на β -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, средне терапевтическая, ударная, токсическая и летальная).
2. Ширина 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 взаимодействие (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».

Практическому занятию № 9. Ненаркотические анальгетики.

Ненаркотические анальгетики – это препараты различного химического строения, обладающие обезболивающим, жаропонижающим и противовоспалительным действием. Механизм анальгезирующего эффекта: угнетение синтеза основных факторов воспалительной реакции (простагландинов, простаглицлинов и тромбксана), нарушение проведения афферентных болевых импульсов к коре головного мозга.

Производные пирозолона.

Среди препаратов этой группы известны бутадиион (Butadinum), анальгин (Analginum), амидопирин (Amidopyrinum), антипирин (Antipyrinum), кетазон (Cetazon) и тандедрил (Tandedril). Механизм действия: снижение энергообеспечения воспаления, угнетение активности протеолитических ферментов, уменьшение проницаемости капилляров и торможение воспалительной инфильтрации.

Анальгин (Analginum).

Обладает жаропонижающим, анальгезирующим и противовоспалительным действием. Анальгин входит в состав некоторых комбинированных препаратов: бенальгина (Benalginum), беллалгина (Bellalginum), темпальгина (Tempalginum), анапирина (Anapyrinum), пенталгина (Pentalginum).

Бутадиион (Butadionum).

Применение: как у анальгина. Принимают внутрь по 0,15 г 4–6 раз в сутки после еды. Мазь наносят тонким слоем, не втирая, на поверхность кожи 2–3 раза в сутки.

Побочные действия: тошнота, боль в области желудка, болезни печени и почек, аритмия, недостаточность кровообращения.

Форма выпуска: таблетки по 0,05 № 10; мазь – 20 г в тубе.

Производные парааминофенола.

К ним относятся препараты фенацетин (Phenacetinum) и парацетамол (Paracetamolum).

Широко применяется парацетамол. Фенацетин в чистом виде практически не используется, а в смеси с другими средствами это – препараты седальгин, цитрамон.

Вопросы к практическому занятию.

1. Показания к применению препарата анальгин.
2. Дать характеристику ненаркотическим анальгетикам.
3. Показания к применению препарата парацетамол. Формы выпуска.

Практическая подготовка № 10. Нестероидные противовоспалительные средства.

Теоретическая часть

Нестероидные противовоспалительные средства

Механизм действия: оказывают нормализующее влияние на повышенную проницаемость капилляров и на процессы микроциркуляции, таким образом уменьшая энергетическое обеспечение биохимических процессов, играющих роль в воспалении.

К этой группе относятся салициламид, ацетилсалициловая кислота (аспирин) – Acidum acetylsalicylicum (Aspirinum).

Фармакологическое действие и показания такие же, как у других анальгетиков, но еще обладает антиагрегатным действием, поэтому используется и для профилактики тромбозов и эмболий.

Применение: Принимают по 0,5–1,0 3–4 раза в день после еды, для профилактики тромбозов – 125–300 мг в день.

Побочные действия: тошнота, снижение аппетита, боли в области желудка, анемия.

Вопросы к практической подготовке

1. Основное фармакологическое действие нестероидных противовоспалительных средств.
2. Показания к применению нестероидных противовоспалительных средств.
3. Побочные действия и противопоказания нестероидных противовоспалительных средств.

Практической подготовке № 11. Активность трансаминазы сыворотки крови после экспериментального токсического действия.

Теоретическая часть.

Спектр клинических проявлений заболеваний печени, вызванных лекарствами, может быть чрезвычайно разнообразным, однако наиболее часто встречаются острые поражения по типу гепатита (приблизительно в 80% случаев). Хроническое ЛПП может быть самостоятельным заболеванием (например, при многолетнем приеме метилдофы), но обычно развивается как исход острого патологического процесса (при длительном поступлении лекарств или их комбинации). Тяжесть течения лекарственно-индуцированных заболеваний печени варьирует от бессимптомного повышения уровня трансаминаз до развития фульминантной печеночной недостаточности (ФПН). Помимо симптомов, характерных для заболеваний печени (желтуха, кожный зуд, «печеночные знаки», кровоточивость, увеличение печени и болезненность при ее пальпации), часто наблюдаются проявления общего характера (тошнота, абдоминальный дискомфорт, снижение аппетита, общая слабость, понижение трудоспособности). Хотя возможно развитие острой печеночной недостаточности, тем не менее в большинстве случаев лекарственные реакции – транзиторные и разрешаются самопроизвольно. Чаще, в 2/3 случаев, встречается гепатоцеллюлярный тип повреждения. Повышение активности АЛТ до 5 раз по сравнению с верхней границей нормы рассматривается как умеренная гиперферментемия; в 6–10 раз – как гиперферментемия средней степени, более чем в 10 раз – как высокая. При лекарственно-индуцированных заболеваниях печени повышение уровня АЛТ является наиболее чувствительным тестом ранней диагностики. При митохондриальных гепатоцитопатиях значительно повышается активность

аспартатаминотрансферазы (АСТ). В зависимости от основного типа поражения печени клинические симптомы и изменения биохимических показателей могут варьировать в широких пределах.

Вопросы к практической подготовке:

1. Влияние лекарственных препаратов на активность трансаминазы.
2. Симптомы повышения уровня трансаминазы.

Практическая подготовка № 12. Антибиотики.

Классификация.

Теоретическая часть

Антибактериальные химиотерапевтические средства. Антибиотики.

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. (β-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 (фунги-, 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	Бактериостатический «

	Линкозамиды Левомецетин Аминогликозиды	« « Бактерицидный
Нарушение синтеза РНК	Рифампицин	Бактерицидный

Вопросы к практическому заданию.

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

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

Вопросы к практической подготовке

1. Какие группы антибиотиков Вы знаете по химическому строению.
2. Дать характеристику препарату левомецетин. Показания к применению.
3. Дать характеристику антибиотиков группы макролидов.
4. Дать определение.

Задания к практической подготовке

1. Сделать конспект классификации лекарственных веществ группы антибиотиков.

Практическая подготовка № 14. Антибиотики разных химических групп. Показания к применению, побочные действия.

Теоретическая часть

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: синтеза клеточной стенки микроорганизмов;

проницаемости цитоплазматической мембраны микробной клетки;

внутриклеточного синтеза белка в микробной клетке;

синтеза РНК в микроорганизмах.

Бактериостатическое действие характерно для антибиотиков, нарушающих внутриклеточный синтез белка.

По спектру антимикробного действия антибиотики можно условно разделить на препараты широкого спектра действия (действующие на грамположительную и грамотрицательную микрофлору: тетрациклины, левомицетин, аминогликозиды, цефалоспорины, полусинтетические пенициллины) и препараты сравнительно узкого спектра действия. Вторую группу в свою очередь можно разделить на антибиотики, действующие преимущественно на грамположительную микрофлору (биосинтетические пенициллины, макролиды) и антибиотики, действующие преимущественно на грамотрицательную микрофлору (полимиксины). Кроме того, различают противогрибковые и противоопухолевые антибиотики.

По клиническому применению выделяют основные антибиотики, с которых начинают лечение до определения чувствительности к ним микроорганизмов, вызвавших заболевание, и резервные, которые применяют при устойчивости микроорганизмов к основным антибиотикам или при непереносимости последних.

В процессе применения антибиотиков к ним может развиваться устойчивость (резистентность) микроорганизмов, т.е. способность микроорганизмов размножаться в присутствии терапевтической дозы антибиотика. Резистентность микроорганизмов к антибиотикам может быть природной и приобретенной.

Природная устойчивость связана с отсутствием у микроорганизмов «мишени» для действия антибиотика или недоступности «мишени» вследствие низкой проницаемости клеточной стенки, а также ферментативной инактивации антибиотика. При наличии у бактерий природной устойчивости антибиотики клинически неэффективны.

Под приобретенной устойчивостью понимают свойство отдельных штаммов бактерий сохранять жизнеспособность при тех концентрациях антибиотиков, которые подавляют основную часть микробной популяции. Приобретенная устойчивость является либо результатом спонтанных мутаций в генотипе бактериальной клетки, либо связана с передачей плазмид от естественно-устойчивых бактерий к чувствительным видам.

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

Вопросы к практической подготовке

1. На какие группы можно разделить антибиотики по спектру антимикробного действия.
2. Дать характеристику антимикробного действия антибиотиков.
3. С чем связана устойчивость бактерий к действию антибиотиков.
4. Дать определение резистентности.

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

Практическая подготовка № 14. Антидепрессанты и их применение при соматической патологии. Трициклические и тетрациклические антидепрессанты.

Теоретическая часть

Антидепрессанты

Это лекарственные вещества, устраняющие симптомы депрессии у нервно-психических и соматических больных. В большинстве случаев лекарственное взаимодействие происходит на уровне синаптической нейротрансмиссии. Причем

одни антидепрессанты блокируют метаболические пути разрушения нейромедиаторов (норадреналина, серотонина, дофамина), а другие – их обратный захват пресинаптической мембраной. Подразделяются антидепрессанты на следующие группы: ингибиторы моноаминоксидазы, трициклические антидепрессанты, тетрациклические, селективные ингибиторы обратного захвата серотонина, комбинированные и переходные антидепрессанты и нормотимические средства.

Имизин (Imizinum).

Синоним: Melipramin. Основной представитель этой группы. Тормозит обратный нейрональный захват моноаминов – нейромедиаторов.

Применение: депрессивные состояния различной этиологии, нейтрогенный энурез у детей. Назначают внутрь начиная с 0,075—0,1 г в день (после еды), постепенно повышая дозу до 0,2–0,25 г в день. Курс лечения – 4–6 недель. 0,025 г 1–4 раза в день – поддерживающая терапия. В условиях стационара при тяжелой депрессии вводят в/м по 2 мл 1,25 %-ного раствора, 1–3 раза в сутки. В. Р. Д. внутрь – 0,1, В. С. Д. – 0,3 г, в/м разовая – 0,05, суточная – 0,2 г.

Побочные действия: головные боли, потливость, головокружение, сердцебиение, сухость во рту, нарушение аккомодации, задержка мочеиспускания, бред, галлюцинации.

Противопоказания: ингибиторы моноаминоксидазы, препараты щитовидной железы, острые заболевания печени, почек, кроветворных органов, глаукома, расстройства мозгового кровообращения, инфекционные заболевания, аденома предстательной железы, атония мочевого пузыря. Требуется осторожного применения при эпилепсии, в I триместре беременности.

Вопросы к практической подготовке

1. Антидепрессанты. Определение. Характеристика.
2. Показание к применению Имизина.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №15. Антидепрессанты: нейрохимические аспекты механизма действия.

Теоретическая часть

Это лекарственные вещества, устраняющие симптомы депрессии у нервно-психических и соматических больных. В большинстве случаев лекарственное взаимодействие происходит на уровне синаптической нейротрансмиссии. Причем одни антидепрессанты блокируют метаболические пути разрушения нейромедиаторов (норадреналина, серотонина, дофамина), а другие – их обратный захват пресинаптической мембраной.

.

Задания к практической подготовке

1. Каким действием обладают антидепрессанты на нейромедиаторы?
2. При каких заболеваниях назначают антидепрессанты.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка № 15. Антидепрессанты: нейрохимические аспекты механизма действия. Показания и побочные действия.

Теоретическая часть.

Другие препараты из группы антидепрессантов

Ингибиторы моноаминооксидазы.

Действие проявляется в угнетающем влиянии на деаминацию моноаминов. Различают ингибиторы необратимого и обратимого действия, причем последние бывают неизбирательного и избирательного действия (типа А).

Аурорикс (Aurorix).

Антидепрессант, обратимый ингибитор типа А.

Применение: депрессивные синдромы. Принимают внутрь по 150 мг 2 раза в сутки после еды, при необходимости – до 600 мг в сутки.

Побочные действия: головокружение, нарушения сна и другие, свойственные антидепрессантам.

Противопоказания: детский возраст, острые случаи спутанности сознания.

Форма выпуска: таблетки по 150 и 300 мг, покрытые оболочкой, № 30.

Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина.

Флуоксетин (Fluoxetine).

Применение: депрессии различного генеза, навязчивые мысли. Принимают внутрь по 1 капсуле (20 мг в сутки в первой половине дня). М. С. Д. – не более 80 мг.

Побочное действие и противопоказания: такие же, как у других антидепрессантов.

Форма выпуска: капсулы, таблетки по 20 мг № 14 и 28.

Комбинированные и переходные антидепрессанты.

Гептрал (Heptral).

Антидепрессант и гепатопротектор.

Применение: депрессивные состояния, болезни печени, абстинентный синдром.

Средние дозы – 1200–1600 мг в сутки; в/в капельно или в/м 200–400 мг.

Курс лечения – 2–3 недели.

Побочные действия: неприятные ощущения в эпигастральной области, нарушение сна.

Форма выпуска: таблетки № 20. Лиофилизированное сухое вещество для инъекций во флаконе в комплекте с растворителем по 5 штук в упаковке.

Вопросы к практической подготовке

1. Показания к применению препарата флуоксетин.
2. Показания к применению препарата гептрал.
3. Побочные действия, возникающие при приеме препарата гептрал.

Задания к практической подготовке

1. Дать характеристику препарата флуоксетин.
2. Антидепрессанты. Определение и характеристика.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №17. Антихолинэстеразные средства. Теоретическая часть.

Антихолинэстеразные средства

Различают антихолинэстеразные средства обратимого действия (физостигмин, прозерин, оксазил, галантамин, калимин, убретид) и необратимого действия (фосфакол, армин), причем вторые более токсичные. К этой группе относятся некоторые инсекцитиды (хлорофос, карбофос) и боевые отравляющие вещества (табун, зарин, зоман).

Прозерин (Prozerinum).

Обладает выраженной антихолинэстеразной активностью.

Показания: миастения, парезы, параличи, глаукома, атония кишечника, желудка, мочевого пузыря, как антагонист миорелаксантов.

Способ применения: принимают внутрь по 0,015 г 2–3 раза в день; вводят п/к по 1 мл 0,05 %-ного раствора (1–2 мл раствора в день), в офтальмологии – по 1–2 капли 0,5 %-ного раствора 1–4 раза в день.

Побочные действия: брадикардия, гипотония, слабость, гиперсаливация, бронхорея, тошнота, рвота, повышение тонуса скелетной мускулатуры.

Противопоказания: эпилепсия, бронхиальная астма, органические заболевания сердца.

Форма выпуска: таблетки по 0,015 г № 20, ампулы по 1 мл 0,05 %-ного раствора № 10.

Калимин (Kalumin).

Менее активен, чем прозерин, но действует более продолжительно.

Применение: миастения, нарушения двигательной активности после травмы, паралича, энцефалит, полиомиелит.

Способ применения: назначают внутрь по 0,06 г 1–3 раза в день, вводят в/м – по 1–2 мл 0,5 %-ного раствора.

Побочные действия: гиперсаливация, миоз, диспептические явления, учащение мочеиспускания, повышение тонуса скелетных мышц.

Противопоказания: эпилепсия, гиперкинезы, бронхиальная астма, органические заболевания сердца.

Форма выпуска: драже по 0,06 г № 100, 0,5 %-ный раствор в ампулах по 1 мл № 10.

Вопросы к практической подготовке

1. Антихолинэстеразные средства. Показания к применению.
2. Показания к применению препарата прозерин. Побочные действия, противопоказания.
3. Форма выпуска калимина. Показания к применению.

Задания к практической подготовке

1. Дать характеристику антихолинэстеражным средствам.
2. Противопоказания к применению препарата калимин.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №18. БАДы. Из чего делают и с чем едят. Противники и сторонники биологических активных добавок к пище.

Теоретическая часть.

Биологически активные добавки (БАД) - композиции натуральных или идентичных натуральным биологически активных веществ, предназначенных для непосредственного приема с пищей, с целью обогащения рациона отдельными пищевыми или биологически активными веществами и их комплексами. Биологически активные добавки к пище (БАД) получают из растительного, животного или минерального сырья, химическими или биотехнологическими способами. Биологически активные добавки к пище нельзя отождествлять с пищевыми добавками, представляющими собой группу веществ природного или искусственного происхождения, используемых для усовершенствования технологии, сохранения или придания пищевым продуктам необходимых свойств, повышения стабильности или улучшения органолептических свойств. Пищевые добавки в отличие от БАД не обладают биологической активностью. БАД подразделяют на три группы: нутрицевтики, парафармацевтики, эубиотики.

Нутрицевтики - биологически активные добавки к пище, применяемые для коррекции химического состава пищи человека (дополнительные источники нутриентов: белка, аминокислот, жиров, углеводов, витаминов, минеральных веществ, пищевых волокон). Конечной целью использования нутрицевтиков является улучшение пищевого статуса человека, укрепление здоровья и профилактика ряда заболеваний.

Парафармацевтики - биологически активные добавки к пище, применяемые для профилактики, вспомогательной терапии и поддержки в физиологических границах функциональной активности органов и систем.

Эубиотики - биологически активные добавки к пище, в состав которых входят живые микроорганизмы и (или) их метаболиты, оказывающие нормализующее воздействие на состав и биологическую активность микрофлоры и моторику пищеварительного тракта; эубиотики подчас включают в себя и субстрат, способствующий росту дружественной флоры, но не усваиваемый человеческим организмом.

По происхождению основных компонентов БАД делят на:

- растительные экстракты, цельные части растений;
- продукты пчеловодства;
- морепродукты
- животные вытяжки;
- минеральные компоненты;
- продукты ферментации;
- продукты биотехнологии;

- синтетические аналоги природных пищевых веществ.

Для чего же нужны биологически активные добавки к пище?

- для восполнения недостаточного поступления с рационом белка и отдельных незаменимых аминокислот, липидов и отдельных жирных кислот (в частности, полиненасыщенных высших жирных кислот), углеводов и сахаров, витаминов и витаминоподобных веществ, макро- и микроэлементов, пищевых волокон, органических кислот, эфирных масел, экстрактивных веществ и др.;
- для уменьшения калорийности рациона, регулирования (снижения или повышения) аппетита и массы тела;
- для повышения не специфической резистентности организма, снижения риска развития заболеваний и обменных нарушений;
- для осуществления в физиологических границах регуляции функций организма;
- для связывания в желудочно-кишечном тракте и выведения чужеродных веществ;
- для поддержания нормального состава и функциональной активности кишечной микрофлоры.

БАД используется как дополнительный источник пищевых и биологически активных веществ, для оптимизации углеродного, жирового, белкового, витаминного и других видов обмена веществ при различных функциональных состояниях, для нормализации и/или улучшения функционального состояния органов и систем организма человека, в том числе продуктов, оказывающих общеукрепляющее, мягкое мочегонное, тонизирующие, успокаивающее и иные виды действия при различных функциональных состояниях, для снижения риска заболеваний, а так же для нормализации микрофлоры желудочно-кишечного тракта, в качестве энтеросорбентов.

Вопросы к практической подготовке

1. Понятие БАД.
2. Нутрицевтики, показания к применению.
3. Как делятся БАД по происхождению.
4. Эубиотики и их влияние на организм.

Задание к практической подготовке

1. Дать определение БАД.

2. Для каких целей используется БАД.

3. Что такое парафармацевтика?

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практической подготовке №19. Бетаксолол в лечении глаукомы.

Теоретическая часть.

Глаукома — это большая группа заболеваний, при которых повышается внутриглазное давление (постоянно или периодически) Она представляет собой опасное прогрессирующее состояние, которое при отсутствии лечения неминуемо приведёт к слепоте.

Различают две основных формы глаукомы, имеющие свои особенности: Открытоугольная – встречается в 90% случаев и характеризуется открытым (широким) радужно-роговичным углом, но с расстройством его функционирования.

Закрытоугольная – встречается редко, преимущественно у людей, страдающих дальнозоркостью после 35 лет.

Бетаксолол - это селективный бета1-адреноблокатор без собственной симпатомиметической активности. Практически не обладает мембраностабилизирующим (местноанестезирующим) действием. Селективное воздействие бетаксолола на бета1-адренорецепторы не является абсолютным, так как при применении его в высоких дозах возможно воздействие бетаксолола на бета2-адренорецепторы, расположенные, главным образом, в гладкой мускулатуре бронхов и сосудов. Блокада бета-адренорецепторов в бронхах и бронхиолах повышает сопротивляемость дыхательных путей, обусловленную отсутствием антагонизма к парасимпатомиметической активности. Такой эффект у пациентов с бронхиальной астмой или иными бронхоспастическими состояниями может представлять потенциальную опасность. Блокада бета-адренорецепторов снижает сердечный выброс как у здоровых субъектов, так и пациентов с заболеваниями сердца. У пациентов с тяжелым нарушением функции миокарда блокада бета-адренорецепторов может ослаблять стимулирующее влияние симпатической нервной системы, необходимое для поддержания адекватной функции сердца. Бетаксолол оказывает менее выраженное влияние на сердечно-сосудистую и дыхательные системы в сравнении с

другими бета-адреноблокаторами. Применение в виде глазных капель сопровождается снижением внутриглазного давления за счет уменьшения продукции внутриглазной жидкости. Гипотензивное действие бетаксолола реализуется как в отношении повышенного, так и нормального внутриглазного давления. Бетаксолол улучшает глазное кровообращение (перфузию). Бетаксолол не вызывает миоза, спазма аккомодации, гемералопии, эффекта "пелены" перед глазами (в отличие от миотиков).

Показания

Для системного применения: артериальная гипертензия. Для местного применения в офтальмологии: хроническая открытоугольная глаукома, повышение внутриглазного давления, состояние после лазерной трабекулопластики.

Вопросы к практической подготовке.

- 1.Глаукома, разновидности заболевания.
- 2.Показания к применению бетаксола. Форма выпуска.
- 3.К какой группе лек. препаратов относится бетаксол.

Задания к практической подготовке.

- 1.Механизм действия препарата бетаксол?

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №20. Биофармацевтические аспекты создания мазей.

Теоретическая часть.

Независимо от цели назначения мазь должна соответствовать общим требованиям:

- легко и полностью высвобождать введенные в нее лекарственные вещества. Вещества из мази общего (резорбтивного) действия должны активно и глубоко проникать в кожу и подкожную клетчатку, достигать кровяного русла и лимфы. Лекарственные вещества из мази, предназначенной для поверхностного действия, наоборот, не должны всасываться, что достигается подбором вспомогательных веществ с определенными свойствами;
- сохранять стабильность на протяжении всего срока хранения, предусмотренного сертификатом;
- быть однородной (составные компоненты должны равномерно распределяться в основе). Размеры частиц лекарственных веществ в суспензионной мази не должен превышать норм, указанных в частных статьях;
- иметь необходимые структурно-механические свойства (легко выдавливаться из тубы и намазываться, равномерно распределяться и хорошо фиксироваться на поверхности);
- отвечать требованиям по обсеменению микроорганизмами;
- не оказывать раздражающего и сенсибилизирующего действия;
- иметь рН, близкое к поверхности, на которую наносится (влияет на степень болезненности при нанесении мази, скорость и полноту высвобождения из нее лекарственных веществ, стабильность системы, сохранность защитного барьера кожи);
- хорошо фиксироваться и удаляться с поверхности.

Мазевые основы должны:

- быть мягкой консистенции;
- быть индифферентными и не иметь раздражающего действия;
- быть стойкими, не изменяться под действием внешних факторов, лекарственных средств и не иметь плохого запаха;
- смешиваться с разными лекарственными средствами и с водными растворами разных веществ эмульгированием последних
- проникать в глубокие слои кожи, внося с собой лекарственные вещества, или образовывать только покров кожи и легко удаляться с кожи
- быть адекватными коже, то есть они должны быть сходны с веществами, которые просачиваются через кожу и удаляются из нее.

Идеальной мазевой основы нет, поэтому необходимо пытаться исправлять недостатки отдельных основ, смешивая их в разных соотношениях для получения необходимого качества основы.

Наиболее существенными биофармацевтическими факторами, влияющими на фармакокинетическую активность мазей, являются:

- физико-химические состояния лекарственных веществ (активность оснований и солей, полиморфизм, степень измельчения и т.п.);
- природа носителя лекарственных препаратов в мазях.

Современный подход к проблеме разработки технологии получения устойчивых при хранении лекарственных форм предполагает всестороннее исследование физических, химических, структурно-реологических свойств как вспомогательных, так и лекарственных форм, приготовленных с их помощью

Распределение лекарственного вещества между двумя сложными системами, мазевой основой и кожей, рассматривают в связи с процессами диффузии, скорость которой обратно пропорциональна вязкости среды. Структурно-механические свойства мазевых основ, в частности вязкость и предельное напряжение сдвига, как установлено экспериментально, являются факторами. Влияющими на скорость диффузии лекарственного вещества, то есть на биодоступность

Вопросы к практической подготовке.

1. Требования, предъявляемые к мазям.
2. Основные требования к мазевым основам.

Задание к практической подготовке.

1. Дать характеристику мазевым основам.
2. Какие факторы влияют на скорость диффузии лекарственного вещества?

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №21. Биоэффекты растительных полифенолов.

Теоретическая часть.

Полифенолы - органические соединения ароматического ряда, Флавоноидами называется группа фенольных соединений с двумя ароматическими кольцами, объединенных общим структурным составом С₆-С₃-С₆. Первое бензольное кольцо, конденсированное в большинстве классов с кислородосодержащим гетероциклом С или непосредственно прилежащее к карбонильной группе пропанового фрагмента, как в халконах, обозначают буквой А, а боковой фенильный заместитель - буквой В латинского алфавита. Исходя из такого обозначения, порядок нумерации в гетероциклических флавоноидах начинается с гетероатома с переходом на кольцо А, а в кольце В порядок нумерации автономный и начинается с углерода, связанного с остальной частью молекулы.

К флавоноидам относятся производные халкона, катехины, антоцианидины, ауруны. Катехины относятся к полифенолам, входят в состав конденсированных дубильных веществ. Катехины представляют собой наиболее восстановленные флавоноидные соединения. Многие красные и синие окраски цветков с различными оттенками обусловлены присутствием антоцианидинов. В зависимости от рН среды окраска цветков меняется. В кислотной среде они образуют розовую, красную окраску, в щелочной среде - от голубой до синей с разными оттенками. Ауруны имеют разнообразную структуру. Они встречаются в растениях семейства астровых. В растениях присутствуют в форме гликозидов.

Характерной для флавоноидов является особенность блокирования транспортных систем в организме, которые переносят токсические соединения, уменьшая их отрицательное влияние на человека. Еще одно свойство флавоноидов (в частности, силибинина) - угнетать синтез ацетальдегида, промежуточного продукта метаболизма этилового спирта. Характерным является мембраностабилизирующее действие флавоноидов. Мембранам принадлежит ведущая роль в биотрансформации и обезвреживании эндогенных токсинов и ксенобиотиков, в том числе побочного действия лекарств. Флавоноиды способствуют стабилизации и нормализации функции мембран путем непосредственного биохимического взаимодействия с ними, а также угнетают активность

фосфодиэстеразы, что способствует накоплению в клетке циклического аденозинмонофосфата.

Флавоноиды обладают высокой биологической активностью проявляя антиоксидантные, цитопротекторные, мембраностабилизирующие свойства

Доказан благоприятный фармакологический эффект флавоноидов при токсическом поражении печени тетрахлорметаном заключенный в предотвращении дезинтеграции ферментных систем, нарушении антитоксической функции поврежденного органа, существенных дегенеративных изменениях ткани печени. При использовании биофлавоноидов пятилистника кустарникового на фоне хронического токсического гепатита наблюдается повышение резервов антиоксидантов за счет увеличения содержания а-токоферола в микросомальной фракции печени и церулоплазмينا в плазме крови. Экстракт солянки холмовой и карсил при гепатозе в значительной степени уменьшают диффузию в кровь цитолитических ферментов, снижают явления холестаза, восстанавливают синтетическую функцию и структуру печени.

Вопросы к практической подготовке.

1. Какое влияние на организм оказывают флавоноиды?
2. Какие соединения называются полифенолами?
3. Каким действием обладает препарат карсил?

Задания к практической подготовке.

1. Дать характеристику полифенолам.
2. Классификация полифенолов.
3. Активность флавоноидов.
4. Тетрациклин. Лекарственная форма, фармакологические свойства, показания к применению, способ применения и дозы, побочное действие.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №22. Блокаторы кальциевых каналов.

Теоретическая часть.

Ионы кальция играют важную роль в регуляции различных процессов жизнедеятельности организма. Проникая в клетки, они активируют биоэнергетические процессы (превращение АТФ в цАМФ, фосфорилирование белков и др.), обеспечивающие реализацию физиологических функций клеток.

В повышенной концентрации (в т.ч. при ишемии, гипоксии и других патологических состояниях) они могут чрезмерно усиливать процессы клеточного метаболизма, увеличивать потребность тканей в кислороде и вызывать различные деструктивные изменения.

Трансмембранный перенос ионов кальция осуществляется через специальные, т.н. кальциевые каналы. Каналы для ионов Ca^{2+} достаточно разнообразны и сложны.

Они расположены в синоатриальных, атриовентрикулярных путях, волокнах Пуркинье, миофибриллах миокарда, гладкомышечных клетках сосудов, скелетных мышцах и др.

Классификация антагонистов кальция:

Существует много классификаций БКК — в зависимости от химического строения, тканевой специфичности, продолжительности действия и др.

Наиболее широко используется классификация, отражающая химическую гетерогенность антагонистов кальция.

Исходя из химической структуры обычно антагонисты кальция L-типа подразделяют на следующие группы:

- фенилалкиламины (верапамил, галлопамил и др.);
- 1,4-дигидропиридины (нифедипин, нитрендипин, нимодипин, амлодипин, лацидипин, фелодипин, никардипин, исрадипин и др.);
- бензотиазепины (дилтиазем, клентиазем и др.);
- дифенилпиперазины (циннаризин, флунаризин);
- диариламинопропиламины (бепридил).

С практической точки зрения в зависимости от влияния на тонус симпатической нервной системы и ЧСС, антагонисты кальция делят на две подгруппы — рефлекторно увеличивающие (производные дигидропиридина) и уменьшающие (верапамил и дилтиазем, по действию во многом сходны с бета-адреноблокаторами) ЧСС.

В отличие от дигидропиридинов (обладающих незначительным отрицательным инотропным эффектом) фенилалкиламины и бензотиазепины обладают отрицательным инотропным (снижение сократительной способности миокарда) и отрицательным хронотропным (замедление ритма сердца) действием.

Первое поколение:

- а) верапамил (Изоптин, Финоптин) — производные фенилалкиламина;
- б) нифедипин (Фенигидин, Адалат, Коринфар, Кордафен, Кордипин) — производные дигидропиридина;
- в) дилтиазем (Диазем, Дилтиазем) — производные бензотиазепина.

Второе поколение:

- а) группа верапамила: галлопамил, анипамил, фалипамил;

б) группа нифедипина: исрадипин (Ломир), амлодипин (Норваск), фелодипин (Плендил), нитрендипин (Октидипин), нимодипин (Нимотоп), никардипин, лацидипин (Лаципил), риодипин (Форидон);

в) группа дилтиазема: клентиазем.

По сравнению с БКК первого поколения, БКК второго поколения имеют бóльшую продолжительность действия, более высокую тканевую специфичность и меньше побочных эффектов.

Верапамил

40 мг верапамила, таблетки №30

Показания:

-Лечение и профилактика ИБС: хроническая стабильная стенокардия (стенокардия напряжения), нестабильная стенокардия, вазоспастичекая стенокардия (стенокардия Принцметала/вариантная стенокардия).

-Лечение и профилактика нарушений сердечного ритма: пароксизмальная наджелудочковая тахикардия, хроническая форма трепетания и мерцания предсердий (тахикардический вариант), наджелудочковая экстрасистолия.

-Артериальная гипертензия. Гипертонический криз.

-Гипертрофическая кардиомиопатия.

Противопоказания:

- повышенная чувствительность к верапамилу,
- инфаркт миокарда, осложненный брадикардией,
- синдром слабости синусового узла,
- кардиогенный шок,
- атриовентрикулярная-блокада II и III степени,
- синдром WPW,
- выраженная артериальная гипотензия или левожелудочковая недостаточность,
- хроническая сердечная недостаточность ПБ-III стадии,
- острая сердечная недостаточность,
- брадикардия менее 50 уд/мин,
- гипотензия – АД систолическое менее 90 мм.рт.ст.;
- одновременное внутривенное введение бета-блокаторов.

Вопросы к практической подготовке.

- 1.Классификация антагонистов кальция.
- 2.Показание к применению препарата верапамил.

Задания к практической подготовке.

- 1.Дать сравнительную характеристику препаратам первого и второго поколения антагонистов кальция.
2. Напишите на какие группы по химическому строению делятся препараты группы антагонистов кальция?

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №23. Вещества, влияющие на адренергические синапсы.

Теоретическая часть.

Блокирование передачи нервного возбуждения в области адренорецепторов может осуществляться разными путями:

- 1) блокированием адренорецепторов (фармакологические вещества, обладающие такими свойствами, называют адреноблокаторами, или адренолитиками);
- 2) нарушением накопления и высвобождения медиатора нервными окончаниями. Такой эффект осуществляется симпатолитическими веществами или симпатолитиками;
- 3) нарушением процесса образования медиатора.

В отличие от ганглиблокаторов антиадренергические вещества прерывают проведение эфферентного нервного возбуждения, действуя на постганглионарные синапсы, не влияя на передачу возбуждения в ганглиях. Адреноблокирующие вещества в зависимости от преобладания их влияния на α - или β -адренорецепторы делят на две группы:

1. α -адреноблокаторы;
2. β -адреноблокаторы.

В свою очередь, α -адреноблокаторы подразделяются на блокаторы α_1 , к которым относятся фентоламин, тропафен, пирроксан и другие, блокаторы α_2 -адренорецепторов (йохимбин).

β -адреноблокаторы делят в зависимости от наличия у них так называемой симпатомиметической активности на:

- 1) β -адреноблокаторы без внутренней симпатомиметической активности (пропранолол, атенолол, тимолол и др.), значительно уменьшающие сердечный выброс и частоту сердечных сокращений;

2) β -адреноблокаторы с умеренной внутренней симпатомиметической активностью (окспренолол, алпренолол, ацебуталол), незначительно уменьшающие сердечный выброс и частоту сердечных сокращений;

3) β -адреноблокаторы с выраженной внутренней симпатомиметической активностью (пиндолол или вискен), мало влияющие на сердечный выброс и частоту сердечных сокращений. Блокаторы α - и β -адренорецепторов – лабетолол. Блокаторы β -адренорецепторов: анаприлин, (обзидан), окспренолол, талинолол (корданум), метапролол. Кроме того, в этой группе существуют так называемые кардиоселективные β_1 -адреноблокаторы, проявляющие избирательное действие на сердце (атенолол, метопролол, практолол), применяющиеся при тахикардии, стенокардии, гипертонии. Блокаторы β_2 -адренорецепторов (тимолол) уменьшают продукцию внутриглазной жидкости, эффективны при глаукоме, при некоторых видах тремора; оказывают сосудорасширяющее действие, опосредованное через β_2 -адренорецепторы.

4. α -адреноблокаторы

Эти лекарственные препараты блокируют передачу возбуждения на α_1 - и α_2 -адренорецепторы. Препараты этой группы применяются при заболеваниях, протекающих на фоне гиперadreналиемии: феохромоцитоме, мигрени, нарушении мозгового кровообращения, эндартериите, болезни Рейно, акроцианозе, начальных стадиях атеросклеротической гангрены, трофических язвах конечностей, пролежнях, вяло заживающих ранах, гипертонической болезни, гипертонических кризах.

Анаприлин (Anaprillinum).

Синонимы: Obsidan, Inderal, Propranolol.

Угнетает β_1 - и β_2 -адренорецепторы, обладает антиангинальным, антиаритмическим и гипотензивным действием.

Применение: артериальная гипертония, стенокардия, синусовая аритмия, тахикардия, тиреотоксический криз. Назначают внутрь по 10 мг 3 раза в день, постепенно увеличивая дозу до 20–40 мг 3–4 раза в день (иногда до 200 мг в сутки).

Побочные действия: слабость, брадикардия, гипотония, бронхоспазм, тошнота, понос, нарушение сна, возбуждение, депрессия.

Противопоказания: инфаркт миокарда, гипотония, бронхиальная астма, нарушение проводимости, болезнь Рейно и другие облитерирующие заболевания сосудов.

Форма выпуска: таблетки по 0,01 и 0,04 г № 50, ампулы по 5 мл 0,25 %-ного раствора № 10.

Вопросы к практической подготовке.

- 1.β-адреноблокаторы классификация.
- 2.Анаприлин. Показания к применению. Механизм действия.

Задания к практической подготовке.

- 1.Объяснить какими путями происходит блокировка нервного возбуждения?
- 2.Привести примеры заболеваний при которых применяют α-адреноблокаторы.

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическая подготовка №24. Вещества оказывающие угнетающее действие на ЦНС. Средства для наркоза.

Теоретическая часть.

Средства для наркоза в терапевтических дозах вызывают обратимое угнетение спинномозговых рефлексов, утрату сознания, всех видов чувствительности, снижение тонуса скелетной мускулатуры с сохранением деятельности дыхательного и сосудодвигательного центров. Основа действия наркотических средств – процессы, приводящие к нарушению межнейронной синаптической передачи. В зависимости от глубины различают четыре уровня хирургического наркоза.

Первый уровень – легкий наркоз: сознание и восприятие боли отсутствуют, но сильные болевые раздражения могут вызвать ответные двигательные и вегетативные реакции, мышечный тонус снижен, но не утрачен полностью. Этот уровень наркоза не пригоден для крупных хирургических операций, без применения дополнительных средств.

Второй уровень – выраженный наркоз: глоточный, гортанный, роговичный и конъюнктивальный рефлексы отсутствуют, глазные яблоки неподвижны, конъюнктивы влажная, но слезотечения нет, зрачки сужены, реагируют на свет, рефлексы с брюшины сохранены, мышечный тонус резко снижен,

дыхание ровное и глубокое, пульс и артериальное давление близки к норме. Этот наркоз можно использовать для большинства хирургических операций.

Третий уровень – глубокий наркоз: тонус скелетной мускулатуры отсутствует, дыхание приобретает брюшной тип, зрачки слегка расширены и постепенно перестают реагировать на свет, рефлекс с брюшины отсутствуют, роговица сухая, пульс частый, правильный, артериальное давление несколько снижено. На этом уровне наркоза можно проводить любые операции, но его поддержание требует большого опыта и внимания.

Средства для неингаляционного наркоза

Тиопентал-натрий (Thiopentalum-natrium).

Оказывает снотворное, а в больших дозах наркотическое действие. Применяют для вводного наркоза, при эндоскопических исследованиях, небольших по объему хирургических процедурах.

Способ применения: вводится внутривенно в виде 2–2,5 %-ного раствора (детям, ослабленным больным – 1 %-ный раствор).

Побочные действия: ларингоспазм, гипотония, угнетение дыхания и сердечной деятельности.

Противопоказания: заболевания печени и почек, бронхиальная астма, гипотония, гиповолемия, лихорадочные состояния, воспалительные заболевания носоглотки.

Форма выпуска: во флаконах по 1 г, в упаковке № 10.

Средства для ингаляционного наркоза.

Азота закись (Nitrogenium oxydulatum).

Глубокого наркоза не вызывает.

Применение: обезболивание родов. Малые хирургические вмешательства. Способ применения: вдыхание азота закиси производится с помощью маски или интубации в смеси с кислородом (азота закиси 70–50 % и кислорода соответственно 30–50 %).

Побочные действия: незначительное отрицательное воздействие на дыхательную и сердечно-сосудистую системы, печень, почки. Редко – тошнота и рвота.

Противопоказания: заболевания нервной системы, хронический алкоголизм, острое алкогольное опьянение.

Форма выпуска: металлические баллоны емкостью 1,0 под давлением 50 атм. Хранение при комнатной температуре, вдали от огня.

Вопросы к практической подготовке.

- 1. Каким действием на ЦНС обладают средства для наркоза?**
- 2. Форма выпуска и показания к применению тиопентала-натрия.**
- 3. Виды наркоза.**

Задания к практической подготовке.

- 1. Дать определение каждому виду наркоза.**
- 2. Характеристика препаратов для наркоза.**
- 3. Показания к применению закиси азота.**

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическое занятие №25. Взаимодействие и несовместимость лекарственных веществ.

Теоретическая часть.

Фармацевтическое взаимодействие возникает до введения лекарственных средств в организм, т.е. на стадии приготовления, хранения или введения препаратов в одном шприце.

Фармацевтическое взаимодействие, приводящее к невозможности дальнейшего использования препаратов, называется фармацевтической несовместимостью. Причинами такой несовместимости могут быть химическое взаимодействие лекарственных веществ с образованием неактивных или

токсических соединений, ухудшение растворимости лекарственных веществ, коагуляция коллоидных систем, расслоение эмульсий, отсыревание и расплавление порошков, адсорбция одного лекарственного вещества на поверхности другого и др. В результате таких явлений образуются осадки, изменяются цвет, запах, консистенция лекарства. Подобные нерациональные рецептурные прописи известны провизорам. Поэтому такие прописи либо не изготавливаются, либо осуществляется их фармацевтическая коррекция, в результате чего больной получает качественно приготовленное лекарство.

Фармакологическое взаимодействие лекарственных веществ происходит после введения их в организм больного. В результате такого взаимодействия могут измениться фармакологические эффекты препаратов, введенных одновременно.

Различают два вида фармакологического взаимодействия — фармакокинетический и фармакодинамический.

а) Фармакокинетический вид взаимодействия проявляется на этапах всасывания, распределения, метаболизма и выведения лекарственных веществ. При этом могут изменяться один или несколько фармакокинетических параметров. В результате фармакокинетического взаимодействия чаще всего изменяется концентрация активной формы лекарственного вещества в крови и тканях, и как следствие этого — конечный фармакологический эффект.

б) Фармакодинамический вид взаимодействия лекарственных веществ проявляется в процессе реализации их фармакологических эффектов. Чаще всего такое взаимодействие наблюдается при одновременном применении агонистов и антагонистов в отношении соответствующих рецепторов. Например, блокаторы адренорецепторов (фентоламин, пропранолол) снижают или полностью устраняют действие стимуляторов адренорецепторов (норадреналина, изадрина соответственно).

Вопросы к практическому занятию.

- 1. Фармацевтическое взаимодействие. Как проявляется?**
- 2. Виды фармакологического взаимодействия.**
- 3. Когда проявляется фармакодинамический вид фармацевтического взаимодействия?**

Задания к практическому занятию.

- 1. Дать определение фармакологическому виду взаимодействия.**

2.Привести пример фармацевтического взаимодействия.

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

Практическое занятие №26. Влияние атропина на М-холинорецепторы.

Теоретическая часть.

Препараты этой группы блокируют передачу возбуждения в м-холинорецепторах, делая их нечувствительными к медиатору ацетилхолину, в результате чего возникают эффекты, противоположные действию парасимпатической иннервации и м-холиномиметиков.

М-холиноблокаторы (препараты группы атропина) подавляют секрецию слюнных, потовых, бронхиальных, желудочных и кишечных желез. Выделение желудочного сока уменьшается, но продукция соляной кислоты, секреция желчи и ферментов поджелудочной железы снижаются незначительно. Они расширяют бронхи, снижают тонус и перистальтику кишечника, расслабляют желчевыводящие пути, снижают тонус и вызывают расслабление мочеточников, особенно при их спазме. При действии м-холиноблокаторов на сердечно-сосудистую систему возникают тахикардия, усиление сердечных сокращений, увеличение минутного объема сердца, улучшение проводимости и автоматизма, незначительное повышение артериального давления. При внесении в полость конъюнктивы вызывают расширение зрачка (мудра), повышение внутриглазного давления, паралич аккомодации и сухость роговицы. По химическому строению м-холиноблокаторы подразделяются на третичные и четвертичные аммониевые соединения. Четвертичные амины (матацин, хлорозил, пропантелин бромид, фубромеган, ипратропиум бромид, тровентол) плохо проникают через гематоэнцефалический барьер и проявляют только периферическое холинолитическое действие.

Атропина сульфат (Atropini sulfas).

Обладает м-холинолитической активностью. Блокирует м-холинореактивные системы организма.

Применение: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, спазмы сосудов внутренних органов, бронхиальная астма, в офтальмологии – для расширения зрачка.

Способ применения: назначают внутрь по 0,00025—0,001 г 2–3 раза в день, п/к по 0,25—1 мл 0,1 %-ного раствора, в офтальмологии – 1–2 капли 1 %-ного раствора. В. Р. Д. – 0,001, В. С. Д. – 0,003.

Побочные действия: сухость во рту, тахикардия, нарушение зрения, атония кишечника, затруднение мочеиспускания.

Противопоказания: глаукома.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл 0,1 %-ного раствора № 10, глазные капли (1 %-ный раствор) по 5 мл, порошок. Список А.

Вопросы к практическому занятию.

- 1. Механизм действия м-холиноблокаторов.**
- 2. Показания к применению глазных капель атропина сульфата. Форма выпуска, противопоказания.**

Задания к практическому занятию.

- 1. Объяснить действие атропина на м-холинорецепторы.**
- 2. Дать характеристику препарату атропин при применении в глазной практике.**

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

Практическое занятие №27. Влияние эссенциальных фосфолипидов на структурно-функциональную организацию клеточных мембран тромбоцитов у больных ишемической болезнью сердца.

Теоретическая часть.

Своим открытие фосфолипиды обязаны соевым бобам. Именно из этого продукта в 1939 году впервые была получена фракция фосфолипидов, насыщенная линоленовой и линолевой жирными кислотами.

Фосфолипиды принадлежат к числу тех полезных веществ, от которых здоровье всего организма. Они составляют основу липидного бислоя биологических мембран и очень редко встречаются в составе запасных отложений жиров. Преимущественное участие фосфолипидов в формировании клеточных мембран объясняется их способностью выступать в роли поверхностно-активных веществ и образовывать молекулярные комплексы с белками-хиломикроны, липопроотеины. В результате межмолекулярных взаимодействий образуется внутренний гидрофобный слой мембраны, а полярные фрагменты, расположенные на внешней поверхности мембраны, образуют гидрофильный слой. Благодаря полярности молекул фосфолипидов обеспечивается односторонняя проницаемость клеточных мембран. В связи с этим фосфолипиды широко распространены в растительных и животных тканях, особенно в сердце, мозге, печени, а также в клетках нервной системы человека и позвоночных животных. В микроорганизмах они являются преобладающей формой липидов.

Фосфосодержащие жиры принадлежат к незаменимым для человека соединениям, которые организм не способен вырабатывать самостоятельно и функционировать без них также не сможет. Фосфолипиды необходимы человеку, поскольку: обеспечивают лабильность клеточных мембран; восстанавливают поврежденные мембраны клеток; играют роль клеточных барьеров; участвуют в обмене холестерина; предотвращают сердечно-сосудистые заболевания (особенно атеросклероз); обладают тромбопластической активностью, участвуют в процессе свертывания крови; являются медиаторами нервной системы; обеспечивают передачу сигналов от нервных клеток к головному мозгу и обратно; благотворно влияют на работу органов пищеварения; очищают печень от токсинов; нормализуют состояние кожи» повышают чувствительность к инсулину; нормализует функции печени; улучшает циркуляцию крови по мышечным тканям; образуют кластеры, которые транспортируют витамины, питательные вещества, жиросодержащие молекулы в клетки организма; повышают работоспособность.

Тромбоциты выполняют основополагающие функции в обеспечении гемостаза. Кроме основной функции тромбообразования, кровяные пластинки

реализуют ангиотрофическую, иммунную, транспортную функции, участвуют в активации гемостаза в плазме крови, в ретракции кровяного сгустка, фиксируют циркулирующие иммунные комплексы.

Особое значение в метаболизме липидов в тромбоцитах имеет состав липидов в цитоплазматической мембране пластинок; она соответствует постулатам классической жидкостно-мозаичной модели строения мембран эукариотов, тем не менее, имеются и характерные черты. Так, особенностью строения цитолеммы кровяных пластинок является ассиметричное расположение молекул глицеро- и сфингофосфолипидов в наружном и внутренних слоях у тромбоцитов в покое. Для этого состояния характерна преимущественная локализация фосфатидилсерина и фосфатидилинозитола во внутреннем слое плазмолеммы; это регулирует прокоагулянтную активность кровяных пластинок. Во внешнем слое бислойной мембраны расположены, главным образом, молекулы фосфатидилхолинов и сфингомиелинов. Можно с уверенностью сказать, что транслоказы обеспечивают необходимый состав фосфолипидов как на внешней стороне цитолеммы, так и во внутренней ее части, что критично в момент активации тромбоцита и последующей реорганизации фосфолипидных молекул в масштабах плазмалеммы.

Вопросы к практическому занятию.

- 1.Что собой представляют фосфолипиды?**
- 2.В каких процессах организма участвуют фосфолипиды?**
- 3. Какое значение в метаболизме тромбоцитов имеет состав липидов?**

Задания к практическому занятию.

- 1.Перечислите продукты питания в которых содержатся фосфолипиды.**
- 2.Перечислите функции, которые тромбоциты выполняют в организме.**

Астафьев, В.А. Основы фармакологии с рецептурой

