

**МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ УКРАИНЫ**  
**ЗАПОРОЖСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ**  
Кафедра фармакогнозии, фармакологии и ботаники

**ФАРМАКОЛОГИЯ СРЕДСТВ, ВЛИЯЮЩИХ НА  
НЕРВНУЮ СИСТЕМУ**

**УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ ПОСОБИЕ**

курса фармакологии  
для студентов фармацевтического факультета  
дневной и заочной форм обучения

Запорожье  
2014

*Рекомендовано в качестве учебно-методического пособия для студентов дневной, заочной формы обучения*

**Рецензенты:**

зав. кафедрой фармацевтической химии, доцент, д.фарм.н. *Кучеренко Л.И.*;  
зав. кафедрой органической и биоорганической химии, д.фарм.н. профессор  
*Коваленко С.И.*

**Составители:**

доцент *Тржецинский С.Д.*, ст. преподаватель *Гречаная Е.В.*, ассистенты:  
*Мазулин Г.В.*, *Кулинич Р.Л.*, *Носуленко И.С.*, *Панченко С.В.*, *Клеванова В.С.*

Под общей редакцией зав. кафедрой фармакогнозии, фармакологии и ботаники доцента, доктора биологических наук *Тржецинского С.Д.*

**Фармакология средств, влияющих на нервную систему** : учебно-методическое пособие курса фармакологии для студентов фармацевтического факультета дневной и заочной форм обучения / сост. С. Д. Тржецинский, Е.В. Гречаная, Г.В. Мазулин [и др.].– Запорожье : [ЗГМУ], 2014. – 325 с.

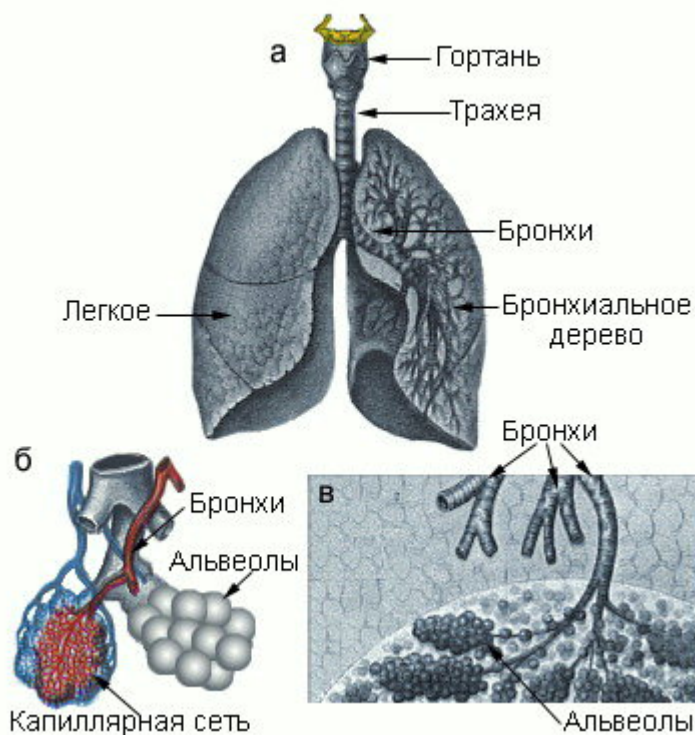
Методические рекомендации предлагаются в качестве дополнительного учебного пособия по изучению курса фармакологии для студентов фармацевтического факультета заочной формы обучения.

Методические материалы содержат разделы фармакологии, изучающей лекарственные средства, влияющие на нервную систему, которые, как правило, вызывают наибольшее затруднение у студентов при изучении курса фармакологии. В методических материалах приведены краткие сведения о лекарственных препаратах по изучаемым разделам курса, а также тестовые задания с обоснованием правильных ответов. Часть учебного материала представлена в виде схем и таблиц.

## ФАРМАКОЛОГИЯ ДЫХАНИЯ

### Общие сведения о физиологии дыхания

Дыхание — совокупность физиологических процессов, обеспечивающих непрерывное поступление кислорода к тканям (прежде всего в мозг), использование его в окислительных реакциях, а также удаление из организма образующихся в процессе метаболизма углекислого газа и частично воды. **Без атмосферного кислорода человек может прожить всего несколько минут.**



К системе органов дыхания относятся носовая полость, гортань, бронхи и легкие. Дыхание состоит из следующих основных (четырех) этапов:

1. **внешнего дыхания**, обеспечивающего газообмен между легкими и внешней средой;
2. **газообмена** между альвеолярным воздухом и притекающей к легким венозной кровью;
3. **транспорта** газов кровью;
4. **газообмена между артериальной кровью и тканями**; тканевого дыхания.

Человек в состоянии покоя вдыхает и выдыхает около **500 мл** воздуха. Этот объем воздуха называется **дыхательным**. Если после спокойного вдоха сделать усиленный дополнительный **вдох**, то в легкие может поступить еще 1500 мл воздуха. Такой объем называют **резервным объемом вдоха**. После спокойного выдоха при максимальном напряжении дыхательных мышц можно выдохнуть еще 1500 мл воздуха. Этот объем носит название **резервного объема выдоха**.

После максимального выдоха в легких остается около 1200 мл воздуха — **остаточный объем**. 250 мл составляет функциональную остаточную емкость легких (альвеолярный воздух). Жизненная емкость легких — это в сумме дыхательный объем воздуха, резервный объем вдоха и резервный объем выдоха (500 + 1500 + 1500).

**Дыхание изменяется при повышенном или пониженном атмосферном давлении.** Так, при работе под водой на глубине (водолазам, аквалангистам) необходимо

подавать дыхательную смесь, которая должна соответствовать гидростатическому давлению на данной глубине, иначе дыхание будет невозможным. При увеличении глубины на каждые 10 м давление возрастает на **1 атм** (0,1 мПа). Таким образом, на глубине 100 м человеку необходима дыхательная смесь, превышающая атмосферное давление приблизительно **в 10 раз**. Пропорционально возрастает и **плотность этой смеси**, что создает дополнительное препятствие для дыхания. Поэтому на глубине более 60—80 м в крови и тканях людей растворяется большое количество различных газов (прежде всего – азота). При быстром переходе от повышенного давления к нормальному, в организме человека выделяется большое количество азота в виде газовых пузырьков, которые закупоривают кровеносные сосуды, нарушая кровообращение (**кессонная болезнь**), что может привести к серьезным нарушениям, в некоторых случаях – к смерти человека. Для предотвращения такого негативного развития событий необходимо постепенное снижение давления (иногда в течении нескольких суток) в декомпрессионной камере, что способствует выведению азота через легкие. Для предупреждения отрицательного влияния азота на организм человека азот полностью или частично заменяют гелием, плотность которого в 7 раз меньше, чем у азота.

Нахождение человека на больших высотах сопровождается снижением парциального давления кислорода во вдыхаемом воздухе и альвеолярном газе. Так, на высоте 4000 м над уровнем моря давление атмосферное  $O_2$  и альвеолярное  $O_2$  снижается более чем в 1,5 раза в сравнении с нормой. При этом у человека может наблюдаться недостаточное обеспечение кислородом организма, особенно головного мозга, проявляющееся одышкой, нарушениями центральной нервной системы (головная боль, тошнота, бессонница) и др. Индивидуальная устойчивость организма человека в полной мере зависит от его адаптации. Однако на высоте 7000—8000 м, где атмосферное и альвеолярное давление  $O_2$  падает почти втрое, дыхание считается небезопасным для жизни без употребления газовой смеси с кислородом.

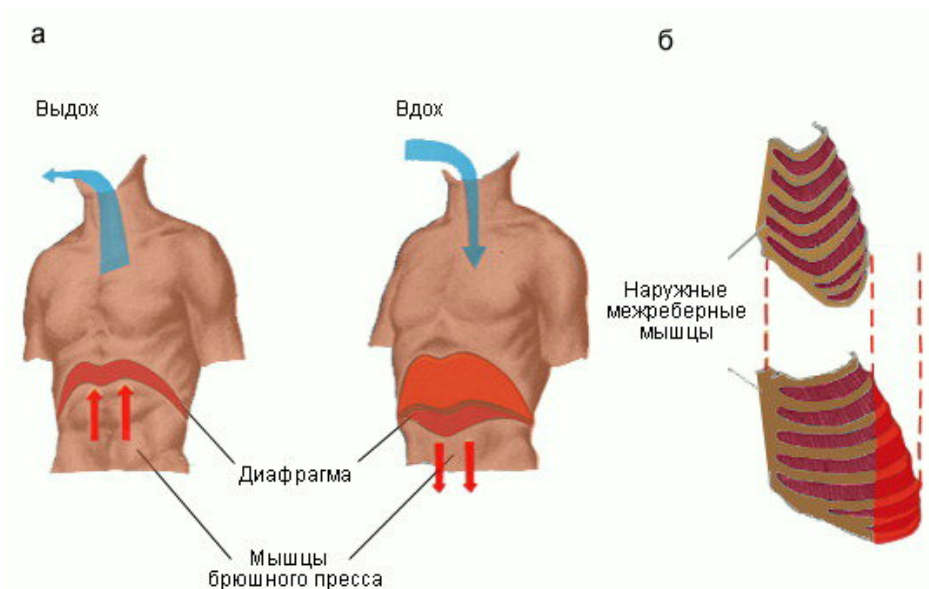
### **Вдох и выдох**

Легкие сообщаются с атмосферой через воздухоносные пути. При каждом вдохе атмосферный воздух входит в легкие, и при каждом выдохе часть альвеолярного воздуха выходит в атмосферу.

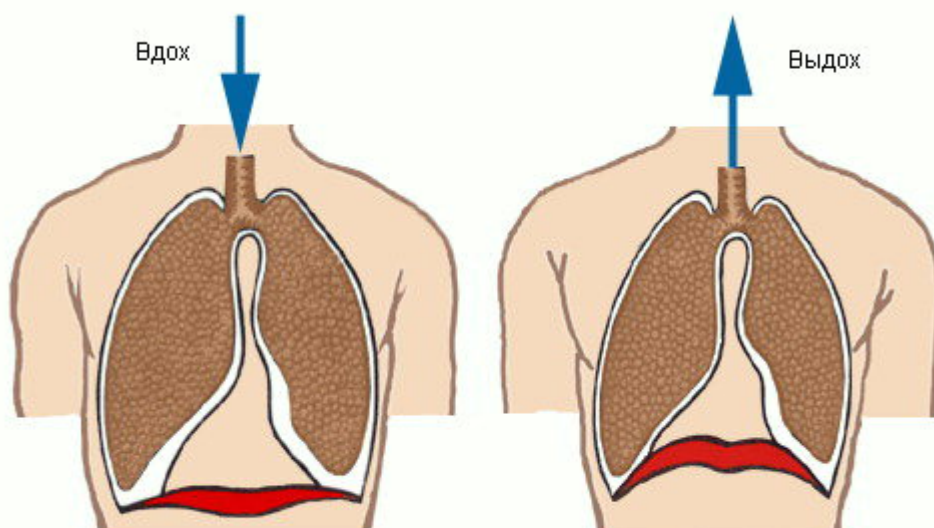
Основная причина газообмена между окружающей средой и альвеолярным воздухом, заполняющим полость легких, — это **градиент давления**. В момент вдоха давление воздуха в полости легких становится меньше атмосферного и воздух поступает в легкие. При выдохе давление воздуха в легких становится немного выше атмосферного, и воздух из легких выходит в окружающую среду.

Изменение давления воздуха в полости легких обусловлено изменением их объема при дыхании. Характеристикой смеси газов, занимающей определенный объем, служит так называемое **парциальное давление**. Если объем увеличивается — парциальное давление падает, если объем уменьшается — парциальное давление увеличивается.

В легких нет мышечной ткани и нет механизмов, позволяющих легким активно изменять свой объем. Поэтому существует аппарат вентиляции легких, состоящий из грудной клетки (ребра и грудина) и поперечно-полосатых дыхательных мышц. В процессе дыхания аппарат вентиляции вследствие сокращения основных дыхательных мышц совершает ритмические дыхательные движения. При спокойном дыхании в процессе дыхания участвуют поперечно-полосатые наружные **межреберные мышцы** и **диафрагма**, которая является главной дыхательной мышцей. При форсированном дыхании в этот процесс могут вовлекаться десятки других поперечно-полосатых мышц туловища.



Легкие окружены париетальной и висцеральной плеврой. **Париетальная плевра сращена с грудной клеткой, висцеральная плевра сращена с легкими.** Между париетальной и висцеральной плеврой имеется тонкая щель, заполненная мономолекулярным слоем серозной жидкости. Поверхностное натяжение этой жидкости прочно притягивает друг к другу оба листка плевры, так что при оттягивании одного листка плевры другой следует за ним. Эта ситуация может быть смоделирована, если прижать друг к другу два небольших стекла, капнуть между ними капельку воды и попробовать разъединить. За счет сил поверхностного натяжения воды, их связывающих, разъединить стекла не удастся. Таким образом, во время дыхания грудная клетка тянет за собой париетальную плевру, которая сращена с ней. Париетальная плевра тянет за собой висцеральную плевру, связанную с ней силами поверхностного натяжения серозной жидкости, а висцеральная плевра тянет ткань легких.



Вдох — активный процесс, который совершается именно благодаря сокращению дыхательных мышц. Сокращение наружных межреберных мышц приводит к подъему реберных дуг, грудина отходит немного вперед. Одновременно сокращаются мышечные волокна диафрагмы, ее сухожильный центр смещается книзу, оттесняя брюшные внутренности вперед и вниз. Объем грудной полости увеличивается в трех взаимно перпендикулярных плоскостях. **Смещение диафрагмы** при спокойном дыхании составляет 1-1,5 см, а при глубоком — может увеличиваться до 10 см. При смещении

диафрагмы на 1 см объем грудной полости изменяется примерно на 250-270 мл. Сокращения диафрагмы обуславливают около 50-70% глубины вдоха. Легкие пассивно следуют за всеми изменениями объема грудной полости при сокращении и расслаблении дыхательных мышц.

Атмосферное давление, действующее на легкие только со стороны воздухоносных путей, плотно прижимает их к грудной стенке. Атмосферное давление, действующее на нас снаружи, демпфируется кожей и подкожной жировой тканью, поэтому оно не достигает легких с наружной поверхности тела. Грудная полость и плевральная полость, которые окружают легкие, герметичны и с атмосферой не сообщаются.

Одностороннее атмосферное давление, действующее на легкие со стороны дыхательных путей, — главная движущая сила легких. Существуют и другие силы, обуславливающие увеличение объема легких при вдохе и уменьшение при выдохе. Увеличение объема грудной полости в момент вдоха приводит к увеличению объема легких, парциальное давление воздуха в них несколько снижается, и воздух из окружающей среды заходит в легкие.

При выдохе объем грудной клетки уменьшается за счет возврата диафрагмы в исходное состояние и расслабления межреберных мышц. Это приводит к увеличению давления внутри легких, которое превышает атмосферное. Так, попытка сделать сильный выдох, если воздухоносные пути закрыты, вызывает значительный рост давления в альвеолах. В нормальных условиях в результате плавного уменьшения легочного объема создается градиент давления, и воздух пассивно выходит из легких.

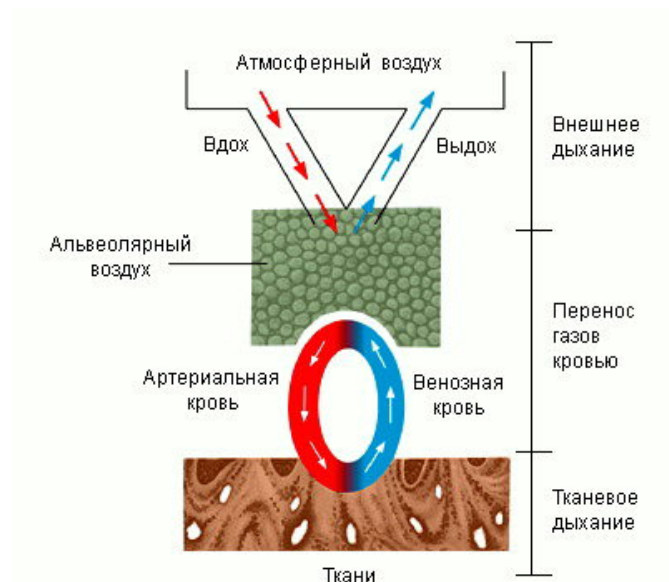
В целом, внутренняя поверхность легких связана с атмосферой, а внешняя поверхность легких за счет герметичности грудной клетки такой связи не имеет. Именно это явление позволяет осуществлять вдох и выдох. При нарушении герметичности грудной клетки (например, при ранениях) атмосферное давление начинает действовать не только на внутреннюю поверхность легких, но и на внешнюю. Это приводит к тому, что легкие спадаются (**пневмоторкс**) и акты вдоха и выдоха становятся невозможными. Двусторонний пневмоторкс, затрагивающий оба легких, если не применяется искусственное нагнетание воздуха в легкие, ведет к смерти.

### Газообмен и тканевое дыхание

Жизнедеятельность живого организма связана с поглощением им  $O_2$  и выделением  $CO_2$ . Поэтому в понятие «дыхание» входят все процессы, связанные с доставкой  $O_2$  из внешней среды внутрь клетки и выделением  $CO_2$  из клетки в окружающую среду.

Перенос  $O_2$  из альвеолярного воздуха в кровь и  $CO_2$  из крови в альвеолярный воздух происходит исключительно путем **диффузии**. Движущей силой диффузии является разница парциального давления  $O_2$  и  $CO_2$  по обеим сторонам альвеолокапиллярной мембраны. Кислород и углекислый газ диффундируют через слой тонкой пленки фосфолипидов (сурфактанта), альвеолярный эпителий, две основные мембраны, эндотелий кровеносного капилляра. Диффузионная способность легких для кислорода значительная. Это обусловлено большим количеством альвеол и их значительной газообменной поверхностью, а также небольшой толщиной (около 1 мкм) альвеолокапиллярной мембраны.

Время прохождения крови через капилляры легких составляет около 1 с, напряжение газов в артериальной крови, которая оттекает от легких, полностью соответствует парциальному давлению в альвеолярном воздухе. Если вентиляция легких недостаточная и в альвеолах увеличивается содержание  $CO_2$ , то уровень концентрации  $CO_2$  сразу же повышается в крови, что приводит к учащению дыхания.

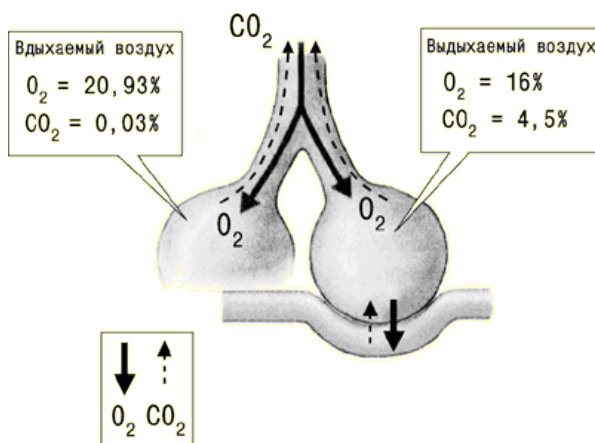


Газообмен между внешней средой и организмом (три этапа дыхания).

В легких кровь из венозной превращается в артериальную, богатую  $O_2$  и бедную  $CO_2$ . Артериальная кровь поступает в ткани, где в результате непрерывно проходящих процессов используется  $O_2$  и образуется  $CO_2$ . В тканях напряжение  $O_2$  близко к нулю, а напряжение  $CO_2$  около 60 мм рт. ст. В результате разности давления  $CO_2$ ; из ткани диффундирует в кровь, а  $O_2$  — в ткани. Кровь становится венозной и по венам поступает в легкие, где цикл обмена газов повторяется вновь.

Газы очень слабо растворяются в жидкостях. Так, только небольшая часть  $O_2$  (около 2 %) растворяется в плазме, а  $CO_2$  — 3—6%. Основная часть кислорода транспортируется в форме непрочного соединения гемоглобина, который содержится в эритроцитах. В молекулу этого дыхательного пигмента входят специфический белок — **глобин** и простетическая группа — **гем**, которая содержит двухвалентное железо. При присоединении кислорода к гемоглобину образуется **оксигемоглобин**, а при отдаче кислорода — **дезоксигемоглобин**.

Например, 1 г гемоглобина способен связать 1,36 мл газообразного  $O_2$  (при атмосферном давлении). Если учесть, что в крови человека содержится около 15 % гемоглобина, то 100 мл его крови могут перенести до 21 мл  $O_2$ . Это так называемая **кислородная емкость крови**. Оксигенация гемоглобина зависит от парциального давления  $O_2$  в среде, с которой контактирует кровь. Сродство гемоглобина с кислородом измеряется величиной парциального давления кислорода, при которой гемоглобин насыщается на 50 % (P50); У человека в норме она составляет 26,5 мм рт. ст. для артериальной крови.



Гемоглобин **особенно легко соединяется с угарным газом CO** (оксид углерода) с образованием **карбоксигемоглобина**, не способного к переносу O<sub>2</sub>. Его химическое сродство к гемоглобину **почти в 300 раз выше**, чем к O<sub>2</sub>. Так, при концентрации CO в воздухе, равной 0,1 %, около 80 % гемоглобина крови оказывается в связи не с кислородом, а с угарным газом. Вследствие этого в организме человека возникают симптомы кислородного голодания (рвота, головная боль, потеря сознания). Легкая степень отравления угарным газом является обратимым процессом: CO постепенно отщепляется от гемоглобина и выводится при дыхании свежим воздухом.

При концентрации CO, равной 1 %, через несколько секунд наступает гибель организма.

Углекислый газ обладает способностью вступать в разные химические связи, образуя, в том числе и **нестойкую угольную кислоту**. Это обратная реакция, которая зависит от парциального давления CO<sub>2</sub>. Она резко увеличивается под действием фермента **карбоангидразы**, который находится в **эритроцитах**, куда CO<sub>2</sub> быстро диффундирует из плазмы. Около 4/5 углекислого газа транспортируется в виде гидрокарбоната H<sub>2</sub>CO<sub>3</sub>. Связыванию CO<sub>2</sub> способствует снижение кислотных особенностей гемоглобина. Угольная кислота в тканевых капиллярах реагирует с ионами натрия и калия, образуя бикарбонаты (NaHCO<sub>3</sub>, KHCO<sub>3</sub>). Углекислый газ транспортируется к легким в физически растворенном виде и в непрочном химическом соединении в виде **карбогемоглобина**, угольной кислоты и бикарбонатов калия и натрия. Около 70 % его находится в плазме, а 30 % — в эритроцитах.

Координированные сокращения дыхательных мышц обусловлены ритмичной деятельностью нейронов **дыхательного центра**, который находится в продолговатом мозге.

Кроме того, к звену аппарата регуляции дыхания относятся **хеморецепторные и механорецепторные системы**, обеспечивающие нормальную работу дыхательного центра в соответствии с потребностями организма в обмене газов. К **дыхательным нейронам** относятся нервные клетки, импульсная активность которых изменяется в соответствии с фазами дыхательного цикла. Активность дыхательных нейронов зависит также от импульсов, исходящих от химо-и механорецепторов дыхательной системы.

Основным регулятором активности центрального дыхательного механизма является афферентная сигнализация о газовом составе крови, которая поступает от центральных (бульбарных) и периферических (артериальных) хеморецепторов.

Главный стимул, который управляет дыханием, — **высокое содержание CO<sub>2</sub>** (гиперкапния) в крови и в неклеточной жидкости мозга. Чем сильнее возбуждение бульбарных хемо-чувствительных структур и артериальных хеморецепторов, тем выше



происходит вентиляция. Незначительное влияние на регуляцию дыхания оказывает гипоксия. Стимулирует дыхание сочетание гиперкапнии и гипоксии; интенсификация окислительных процессов ведет не только к увеличению поглощения из крови кислорода, но и к возрастанию в ней углекислого газа и кислых продуктов обмена.

Механорецепторы дыхательной системы, во-первых, участвуют в регуляции параметров дыхательного цикла — регуляции глубины вдоха и его продолжительности; во-вторых, эти рецепторы являются рецепторами рефлексов защитного характера — кашля. К механорецепторам относятся рецепторы растяжения легких, иритантные, юктаальвеолярные, рецепторы верхних дыхательных путей и проприорецепторы дыхательных мышц.

## Лекарственные средства влияющие на функции органов дыхания

На систему органов дыхания человека способны оказывать фармакологическое действие различные группы лекарственных средств, некоторые из которых непосредственно не относятся к средствам, влияющим на органы дыхательной системы.

Эти лекарственные средства, как правило, имеют более широкий спектр фармакологического действия, но могут использоваться, в том числе и для лечения органов дыхания. К ним возможно отнести, например, лекарственные средства, применяемые для купирования приступов бронхиальной астмы ( $\beta_2$ -адреномиметики (адреналин, изадрин), М - холиноблокаторы (средства группы атропина) и др.).

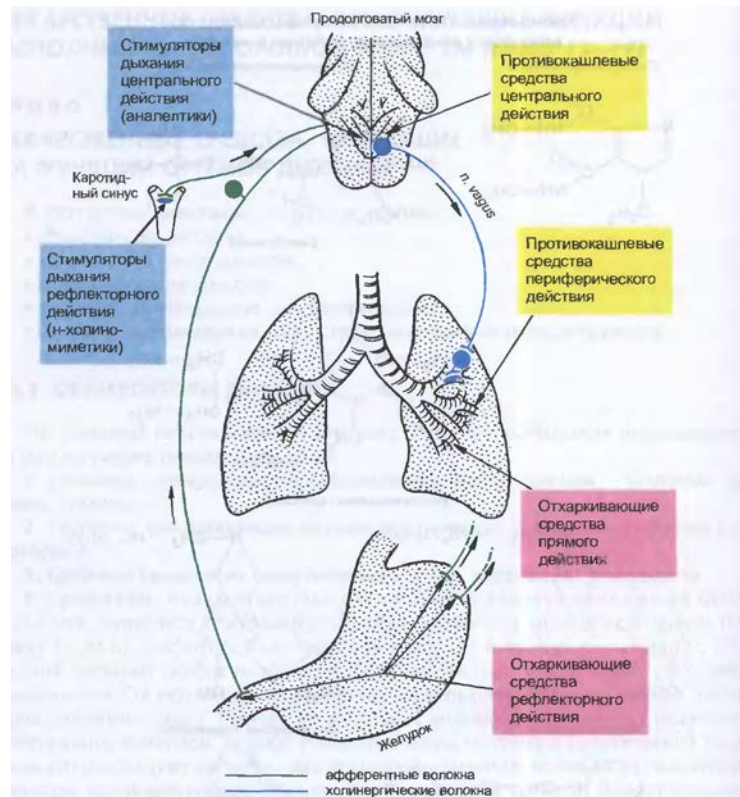
### Структура группы лекарственных средств влияющих на функции органов дыхания.



Вместе с тем, выделяют группы лекарственных средств, которые действуют преимущественно на органы дыхательной системы. К ним относятся :

- Стимуляторы дыхания;
- Противокашлевые
- Отхаркивающие средства;

- Средства применяемые для лечения и профилактики бронхиальной астмы;
- Средства применяемые при отеке легких и прочих случаях легочной недостаточности;



**Схема направленности действия фармакологических средств, влияющих на систему органов дыхания (кроме противоастматических и средств применяемых при дыхательной недостаточности).**

### Стимуляторы дыхания

Процесс дыхания регулируется дыхательным центром, который находится в продолговатом мозге. На активность дыхательного центра непосредственное стимулирующее действие оказывает содержание углекислого газа ( $\text{CO}_2$ ) в крови через систему хеморецепторов, поскольку основным регулятором активности центрального дыхательного механизма является афферентная сигнализация о газовом составе крови, которая поступает от центральных (бульбарных) и периферических (артериальных) хеморецепторов.

Остановка дыхания может произойти в результате **механической асфиксии** (механического перекрытия дыхательных путей), **угнетающего действия ядов на дыхательный центр** (паралича дыхательного центра в результате действия наркотических, снотворных, наркозных и пр. средств), передозировки миорелаксантов расслабляющих дыхательные мышцы (куратеподобных веществ).

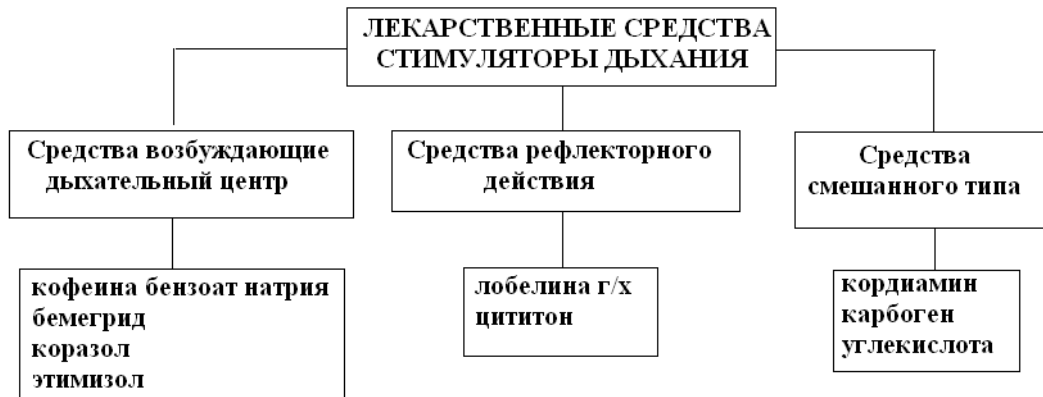
При остановке дыхания необходимо оказание неотложной медицинской помощи для его возобновления, поскольку остановка дыхания ведет к быстрой смерти человека. При остановке дыхания вследствие механической асфиксии необходимо, прежде всего устранить причину этого явления (например, удалить инородное тело из дыхательных путей).

В случае остановки дыхания, которое наступило в результате токсического действия ядов, при передозировке лекарственных препаратов или наркотических средств и пр. применяются **стимуляторы дыхания**.

Стимуляторы дыхания делятся на группы:

1. Средства, действующие (активизирующие) непосредственно дыхательный центр;
2. Стимуляторы дыхания рефлекторного действия;
3. Стимуляторы дыхания смешанного (комбинированного) действия;

### Структура средств стимуляторов дыхания



К лекарственным средствам первой группы (**непосредственно действующим на дыхательный центр**) относятся лекарственные препараты из группы «Аналептиков» (**кофеин, бемегрид, коразол и пр.**). Отличительной особенностью лекарственных препаратов данной группы является **неизбирательность** их действия, поскольку данные средства оказывают возбуждающее действие не только на дыхательный, но и на сосудодвигательный центр, ускоряя работу сердца, повышая артериальное давление, а также оказывая стимулирующее действие на ЦНС.

Аналептики, в качестве стимуляторов дыхания, эффективны при отравлении легкой и средней степени тяжести, при тяжелой степени эти препараты мало эффективны. Особое место среди лекарственных препаратов - стимуляторов дыхания занимает – аналептическое средство **этимизол**, который, в отличие от прочих аналептиков, возбуждает дыхательный центр, но оказывает угнетающее действие на кору головного мозга. В связи с чем, этот препарат применяется не только в качестве стимулятора дыхания, но и как успокаивающее средство в психиатрической практике.

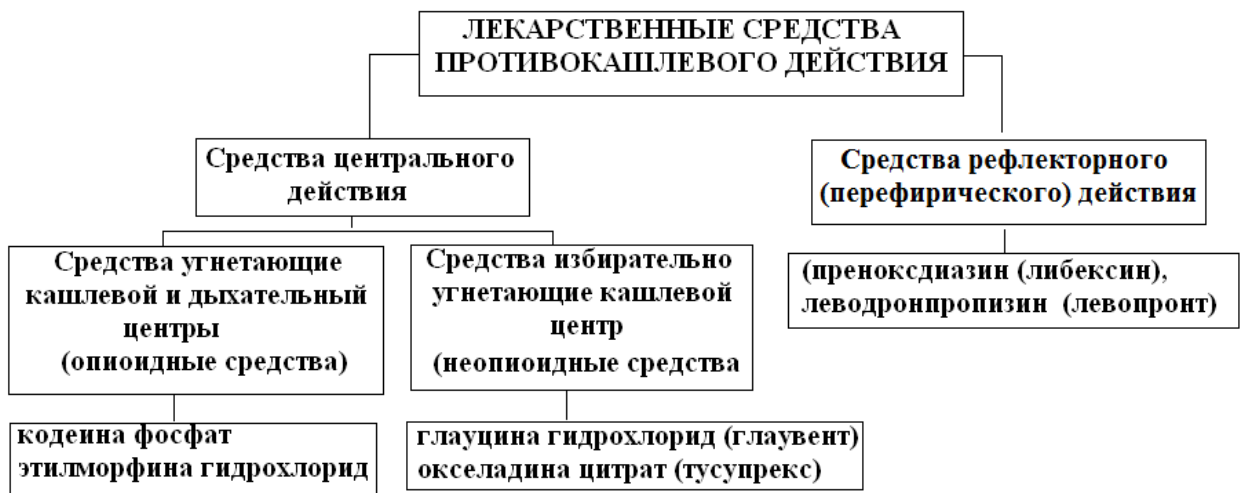
К **стимуляторам дыхания рефлекторного действия** относятся – лобелинина гидрохлорид и цититон. По механизму действия данные препараты возбуждают н-холинорецепторы **синокаротидной зоны** (расположенной на уровне верхнего щитовидного хряща или тела подъязычной кости), откуда афферентные импульсы поступают в продолговатый мозг, возбуждающе действуя на дыхательный центр. Данные препараты не эффективны при отравлениях, в качестве средства неотложной медицинской помощи, поскольку в этом случае нарушается рефлекторная возбудимость дыхательного центра и применяются при асфиксии новорожденных и отравлении угарным газом.

**Стимуляторы дыхания смешанного действия** проявляют как центральное так и рефлекторное действие (дополнительно стимулирует хеморецепторы каротидного клубочка).. Примером стимуляторов дыхания смешанного типа является газовая смесь - **карбоген**, состоящая из сочетания  $\text{CO}_2$  (5-7%) и  $\text{O}_2$  (93 – 95%). К лекарственным препаратам смешанного действия относится также углекислота и кордиамин.

## Противокашлевые средства

Кашель является защитной реакцией организма, возникающей вследствие раздражения верхних дыхательных путей, осуществляется рефлекторно, под контролем кашлевого центра тесно связанного дыхательным центром. Кашель, способствует удалению из дыхательных путей случайно попавших инородных веществ, а также мокроты и слизи, избыточное количество которых выделяется при воспалительных заболеваниях органов дыхания (ОРВИ, бронхита, пневмонии, туберкулеза легких и пр.).

### Структура средств противокашлевого действия



Однако, при воспалительных заболеваниях верхних дыхательных путей кашель может иметь постоянный, раздражающий характер, изнуряя больного, что является дополнительным раздражающим фактором способствующем дальнейшему развитию воспалительного процесса. В этом случае возникает необходимость купирования приступов кашля.

Выделяют две основные группы противокашлевых средств:

- Противокашлевые средства центрального действия;
- Противокашлевые средства рефлекторного действия;

Противокашлевые средства центрального действия – **угнетают кашлевой центр**, расположенный в продолговатом мозге, чем способствуют купированию кашлевого рефлекса.

Противокашлевые средства центрального действия, в свою очередь, делятся на подгруппы:

- Средства угнетающие как кашлевой, так и дыхательный центры (опиоидные, наркотические препараты). К ним относятся кодеин (кодеина фосфат), этилморфина гидрохлорид (дионин);
- Средства избирательно угнетающие кашлевой, но не отказывающие влияние на дыхательный центр (неопиоидные, ненаркотические препараты). К ним относятся: глауцина гидрохлорид (глаувент), окселадина цитрат (тусупрекс);

Опиоидные (наркотические) препараты (кодеин, этилморфин) относятся к **агонистам** опиоидных рецепторов, являются эффективными противокашлевыми

средствами. В небольших (терапевтически) дозах угнетение дыхательного центра проявляется незначительно. Вместе с тем, при длительном употреблении могут вызывать привыкание или болезненное пристрастие, что ограничивает их применение.

Препараты, содержащие кодеин (кодеина фосфат), этилморфин (этилморфина гидрохлорид) активизируют опиоидные рецепторы, в связи с чем оказывают ряд побочных эффектов: **расслабляют гладкие мышцы**, снижают перистальтику кишечника и спазм сфинктеров, усиливают действие анальгетиков, снотворных и седативных средств.

Данные средства входят в состав ряда многокомпонентных, комплексных лекарственных препаратов, применяемых при лечении заболеваний верхних дыхательных путей («кодтерпин»)

Еще большей противокашлевой активностью обладают лекарственные средства из группы наркотических анальгетиков (морфина гидрохлорид, омнопон и пр.).

Неопиоидные противокашлевые средства центрального действия (глауцина гидрохлорид (глауwent), окселадина цитрат (тусупрекс)) избирательно угнетают кашлевой центр, не оказывая угнетающего действия на дыхательный центр, не вызывая привыкания (пристрастия), не оказывая побочных действий свойственных опиоидным препаратам. Являясь достаточно эффективными средствами, применяются при длительном лечении заболеваний (бронхите, пневмонии и пр.).

Противокашлевые средства рефлекторного (периферического) действия (преноксдиазин (либексин), леводронпропизин (левопронт)) оказывают анестезирующее действие на слизистую оболочку верхних дыхательных путей, блокируя периферическое звено кашлевого рефлекса, чем способствуют купированию кашля. Данные средства не оказывают угнетающего влияния на кашлевой центр и ЦНС, не вызывают привыкания.

Противокашлевым действием обладают также ряд лекарственных препаратов других фармакологических групп, например, лекарственные препараты из группы отхаркивающих средств. Данные препараты, кроме прочего, оказывают рефлекторное противокашлевое действие и уменьшают воспалительные процессы при заболеваниях верхних дыхательных путей .

## **Отхаркивающие средства**

Отхаркивающие средства способствуют удалению слизи (мокроты) продуцируемой бронхиальными железами и применяются при лечении воспалительных заболеваний верхних дыхательных путей.

В зависимости от механизма действия отхаркивающие средства делят на две группы:

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

Отхаркивающие средства обладают, в том числе, умеренным противокашлевым действием, вместе с тем, часто комбинируются с противокашлевыми препаратами для получения выраженного терапевтического эффекта.

**Отхаркивающие средства прямого действия** при приеме внутрь, выделяются слизистой оболочкой дыхательных путей и, таким образом, разжижают мокроту, способствуя ее удалению.

К отхаркивающим средствам **прямого действия** относятся – калия йодид, натрия гидрокарбонат, терпингидрат, натрия бензоат, аммония хлорид, нашатырно-анисовые капли, и пр.. Сходными по механизму отхаркивающего действия являются эфирные масла. При приеме внутрь эти вещества выделяются через легкие, чем вызывают усиление секреции бронхиальных желез и, как следствие, разжижение и выведение мокроты.

Эффективным методом применения отхаркивающих средств прямого действия и эфирных масел является – ингаляции с водяным паром.

Наиболее эффективным средством, обладающим муколитическим (отхаркивающими) действием, применяемым при лечении хронических бронхитов, являются препараты содержащие йод (калия йодид). Данные лекарственные средства обладают продолжительным действием, но раздражают дыхательные пути, поэтому не рекомендуется для применения при острых воспалениях, туберкулезе, а также повышенной чувствительности больного к йоду.

### Структура средств муколитического действия



Эффективными муколитическими средствами прямого действия являются протеолитические ферменты: трипсин, химотрипсин, дезоксирибонуклеаза, которые могут применяться, в том числе, методом ингаляций.

Активными муколитическими средствами являются секретолитики и стимуляторы моторной функции (повышают выделение секрета бронхиальными железами, уменьшает вязкость мокроты) дыхательных путей: ацетицистеин, карбоцистеин, бромгексин, амброксол.

**Отхаркивающие средства рефлекторного действия** – как правило, вещества растительного происхождения. При приеме внутрь – вызывают умеренное раздражение рецепторов желудка и, рефлекторно, усиление секреции бронхиальных желез и двигательной активности мерцательного эпителия. В больших дозах эти средства проявляют рвотное действие, но в качестве рвотных средств не используются.

К отхаркивающим веществам **рефлекторного действия** относятся лекарственные препараты из травы ипеакаваны и термопсиса, содержащие алкалоиды и сапонины (в термопсисе). Наиболее активным веществом, обладающим муколитическим действием, является алкалоид ликорин (ликорины гидрохлорид), содержащийся в ряде растений семейства лилейных.

### Противоастматические средства

Бронхиальная астма – опасное заболевание дыхательных путей, которое проявляется приступами удушья в результате неожиданно возникающих спазмов верхних дыхательных путей (бронхов), которые повторяются с определенной периодичностью. Причины заболевания до конца не выяснены.

В некоторых случаях причиной является аллергическая реакция (немедленного типа). В качестве аллергенов могут выступить: пыльца растений, пыль (производственная, библиотечная, укусы насекомых (пчел, ос) и др.

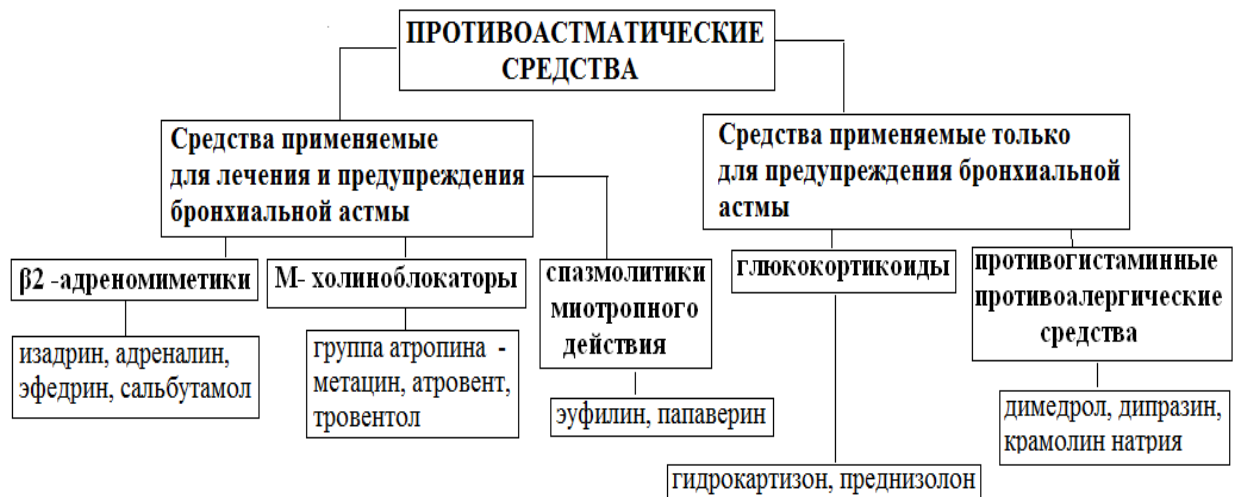
Противоастматические средства условно делятся на средства, применяемые для лечения и предупреждения бронхиальной астмы и средства, применяемые исключительно для предупреждения бронхиальной астмы.

Противоастматические средства принято делить на следующие группы:

- $\beta$  адреномиметики (изадрин, адреналин, эфедрин, сальбутамол и пр);
- М - холиноблокаторы группы атропина (метацин, атровент, тровентол);
- Спазмолитики миотропного действия (эуфилин, папаверин);
- Противогистаминные и противоаллергические средства (димедрол, дипразин, крамолин натрия);
- Глюкокортикоиды (гидрокартизон, преднизолон);

Из перечисленных групп лекарственных препаратов две последние (противогистаминные и глюкокортикоиды) применяются исключительно для предупреждения приступов бронхиальной астмы. Три первые группы – как для лечения (снятия приступов) так и для их предупреждения.

### Структура противоастматических средств



Среди перечисленных групп лекарственных препаратов наиболее часто для снятия приступов применяются препараты из группы  $\beta$  адреномиметиков (изадрин, адреналин, эфедрин, сальбутамол) в виде ингаляций. Эти препараты способны эффективно устранять бронхоспазмы (формотерол и салметерол – пролонгированного действия, продолжительностью до 12 часов).

Для снятия бронхоспазма эффективен адреналин (вводится подкожно), который действует быстро, но кратковременно. Эфедрин – уступает по скорости наступления спазмолитического эффекта, но действует более продолжительно.

М – холиноблокаторы из группы атропина (метацин, атровент, тровентол) уступают по терапевтической активности в качестве бронхолитиков препаратам группы  $\beta$  адреномиметиков (изадрину, адреналину, эфедрину, сальбутамолу и пр).;

Из группы спазмолитиков миотропного действия наиболее часто применяются: эуфиллин, теофиллин, папаверин. Эти средства также по эффективности уступают препаратам и группы  $\beta$  адреномиметиков.

## СРЕДСТВА ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ ОТЕКЕ ЛЕГКИХ

Причиной отека легких могут быть – заболевания почек, отравление ядами, химическое поражение и пр.

Для оказания эффективной медицинской помощи следует установить причину вызвавшую отек. Важное значение при этом является симптоматическое лечение (усиление работы сердца, снижение (или наоборот - повышение) артериального давления и пр.

Широко применяются при отеках (в том числе легких) мочегонные средства (фуросемид, манит, мочевины).

Для уменьшения пенообразования в альвеолах, не зависимо от причины отека, используются **пеногасители**: пары этилового спирта с кислородом, силиконовое соединение – антифомсилан, которые освобождают дыхательную поверхность альвеол. При отеках легких применяются также глюкокортикоиды (оказывают противовоспалительное действие) Во всех случаях используют оксигенотерапию, искусственную вентиляцию легких (лечение с применением кислорода до 21%).

### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

#### Этимизол (Aethimizolum)

**Групповая принадлежность:** Аналептическое средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает возбуждающее действие на центральную нервную систему и стимулирует дыхательный центр.

**Показания к применению:** В психиатрии при астенодепрессивных состояниях (слабости, подавленном состоянии), при заболеваниях, сопровождающихся чувством тревоги. Для возбуждения дыхания после наркоза и предупреждения угнетения дыхания при барбитуратовом наркозе, для профилактики пневмоний (воспаления легких) в послеоперационном периоде.

**Способ применения:** Внутрь по 0,05-0,1 г 3 раза в день, внутривенно (медленно) - по 2-3 мл, внутримышечно и подкожно - по 4-5 мл 1,5% раствора.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 г в упаковке по 50 штук; 1% и 1,5% раствор в ампулах по 3 мл в упаковке по 10 штук.

#### Кодеина фосфат (Codeiniphosphas)

**Групповая принадлежность:** Противокашлевое средство центрального действия

**Фармакологическое действие:** По характеру действия аналогичен кодеину, однако, по сравнению с ним менее токсичен.

**Показания к применению:** Как противокашлевое средство не только взрослым, но и детям, начиная с 6 месяцев.

**Способ применения:** Детям старше 6 месяцев по 0,002-0,01 г на прием в зависимости от возраста. Взрослым 0,01-0,02 г. Высшая разовая доза для взрослых - 0,1 г, суточная - 0,3 г

**Побочные действия:** Запоры; длительное применение вызывает привыкание (ослабление или отсутствие эффекта при повторном применении) и пристрастие (лекарственную зависимость - “кодеинизм”)

**Форма выпуска:** Порошок.

**Трава термопсиса** (*Thermopsis lanceolata* R. Br.) — содержит алкалоиды (1,0–2,5%) — термопсин, термопсидин, цитизин, метилцитизин и пахикарпин, главный из которых — термопсин; сапонины, эфирные масла, гликозиды и др.

**Групповая принадлежность:** лекарственное растительное сырье, из которого изготавливаются лекформы обладающие отхаркивающим действием.

**Лечебные свойства** Трава термопсиса применяется как отхаркивающее средство. В малых дозах трава термопсиса оказывает действие, которое состоит в усилении секреции слизистой оболочки дыхательных путей, возникающем в результате как прямого, так и рефлекторного возбуждения дыхательного и рвотного центров.

**Показания к применению травы термопсиса** Хронические бронхиты.

**Настой травы термопсиса** (Infusum herbae Thermopsidis). Высушенную мелкоизмельченную (размер частиц до 5 мм) траву термопсиса заливают водой комнатной температуры из расчёта 180–200 мл воды на 0,6–1,0 г порошка и нагревают на водяной бане в закрытой крышечкой сосуде (инфундирке) в течение 15 минут, охлаждают 45 минут, после чего процеживают. Готовый настой можно хранить в прохладном месте 2–3 дня.



Лечебные дозы настоя термопсиса: взрослым по 1 столовой ложке 2–4 раза в день; детям от 4 до 12 месяцев по 1 чайной ложке настоя из 0,12 г травы на 100 мл воды. Детям старшего возраста дают по 1 чайной или 1 десертной ложке настоя из 0,2 г травы на 100 мл воды 3–5 раз в день.

**Порошок травы термопсиса** назначают взрослым по 0,01–0,05 г 2–3 раза в день.

**Форма выпуска:** Резаная трава термопсиса (Herba Thermopsisidis; 10,0); Порошок травы термопсиса (Pulvis herbae Thermopsisidis; 10,0); Сухой экстракт термопсиса в стеклянных банках (10,0).

### **Сальбутамол (Salbutamol)**

**Групповая принадлежность:** адrenomиметик (прямого действия, действующий на  $\beta$  адренорецепторы)

**Фармакологическое действие:** Стимулирует бета -дренорецепторы бронхов и оказывает сильное и длительное (по 5-8 ч) бронхорасширяющее действие.

**Показания к применению:** Бронхиальная астма, хронический бронхит (воспаление бронхов).

**Способ применения:** Внутрь в качестве бронхолитического (расширяющего просвет бронхов) средства взрослым и детям старше 12 лет назначают по 2-4 мг 3-4 раза в сутки. Препараты в форме аэрозоля назначают для купирования (снятия) бронхоспазма (резкого сужения просвета бронхов) или приступа бронхиальной астмы однократно взрослым по 0,1-0,2 мг, детям - по 0,1 мг; для профилактики приступов бронхиальной астмы и бронхоспазма взрослым - по 0.2 мг 3-4 раза в сутки, детям - по 0,1 мг 3-4 раза в сутки; для профилактики приступа астмы физического напряжения перед физической нагрузкой взрослым назначают 0,2 мг, детям - 0,1 мг.

**Форма выпуска:** Таблетки по 2 и 4 мг; таблетки ретард (длительного действия) по 4 мг для детей и по 8 мг для взрослых; сироп во флаконах (5 мл - 2 мг сальбутамола); дозированный аэрозоль (1 доза - 0,1 мг сальбутамола);

### **Ацистеин (Acistein)**

**Групповая принадлежность:** Муколитическое средство

**Фармакологическое действие:** Ацетилцистеин относится к неферментным муколитикам прямого действия. Муколитический эффект, наблюдаемый в результате действия ацетилцистеина, связан с нарушением прочных связей и деполимеризацией молекул мукопротеидов, что снижает вязкость слизи и уменьшает ее адгезивность на эпителии дыхательных путей. Т.о. происходит улучшение отхождения мокроты.

**Показания к применению:** - Трахеит, ларинготрахеит; - бронхит (острое и хроническое течение); - бронхиолит; - бронхоэктатическая болезнь; - эмфизема легких; - пневмония; - риносинуситы различной этиологии; - муковисцидоз. И другие бронхо-легочные заболевания, сопровождающиеся повышенной вязкостью секрета.

**Способ применения:** Гранулы для приготовления раствора/сиропа: Возраст 2-5 лет - из расчета каждые 100мг 2-3 раза/сут. В возрастной категории после 6 лет и до 14 лет назначения идут из расчета каждые 200 мг два раза/сут. или по 100 мг три раза/сут. С 14 лет и взрослый возраст – 200 мг 2-3 приема/сут. или 600мг 1 прием/сут. Раствор для инъекций: Взрослые и подростки после 14 лет 1-2 раза за сутки, из расчета 300мг (1 амп.) в/в или в/м. 6-14 лет - один или два раза за сутки, из расчета 150мг (1/2 амп.). С 2 до 6 лет предпочтение отдается пероральным формам препарата. Назначение внутривенного раствора для инъекций детям до 2-х лет проводится специалистом, в стационарных условиях больницы. До 6 лет жизни внутривенная инфузия препарата рассчитывается соответственно весу - 10мг/кг/сутки.

**Форма выпуска:** Форма для приготовления перорального раствора: Ацистеин гранулы д/п п/о р-ра 200 мг №20; Ацистеин плюс гранулы пролонг.дейст. д/п п/о р-ра 600мг №10.

Форма для приготовления сиропа: Ацистеин для детей гранулы д/п сиропа 200мг/5мл 100мл N1. Раствор для инъекций Ацистеин 10% р-р д/ин., ампулы 300мг/3мл №10.

### **Амброксол (Ambroxolum)**

**Групповая принадлежность:** Муколитическое средство

**Фармакологическое действие:** По фармакологическим свойствам и механизму действия амброксол существенно не отличается от бромгексина. Оба являются муколитическими (разжижающими мокроту) средствами, стимулирующими образование сурфактанта (находящегося на поверхности легких поверхностноактивного вещества, регулирующего выделение бронхолегочного секрета /отделяемого/), нормализующими измененную бронхолегочную секрецию, уменьшающими ее вязкость и адгезивные (склеивающие) свойства мокроты.

**Показания к применению:** Показания к применению в основном такие же, как для бромгексина. Амброксол существенно не отличается от бромгексина.

**Способ применения:** При синдроме дыхательной недостаточности вводят из расчета 10 мг/кг в день (в 3-4 приема). Взрослым амброксол назначают внутрь по 1 таблетке (30 мг) 2-3 раза в день; при длительном лечении - по 1 таблетке 2-3 раза в день. Принимают после еды с небольшим количеством воды. Детям рекомендуется давать в виде сиропа (15 мг амброксола в 5 мл) в следующих дозах: до 2 лет - по 2,5 мл 2 раза в день, от 2 до 5 лет - по 2,5 мл 3 раза в день, старше 5 лет - по 5 мл 2-3 раза в день. В первые 2-3 дня лечения дозу можно удвоить. Взрослым назначают сироп в первые 2-3 дня по 10 мл; у детей до 5 лет - по 1-2

ингаляции в день по 2 мл. Препарат можно вводить внутримышечно или внутривенно. Взрослым вводят по 2-3 ампулы (15 мг в ампуле) 2-3 раза в день; детям до 2 лет - по 1/2 ампулы 2 раза в день, от 2 до 5 лет - по 1/2 ампулы 3 раза в день, старше 5 лет - по 1 ампуле 2-3 раза в день.

**Форма выпуска:** Таблетки по 30 мг в упаковке по 50 штук; ампулы, содержащие по 15 мг препарата; сироп, содержащий 15 мг препарата в 15 мл, в упаковке по 100 мл; раствор для ингаляций, содержащий 15 мг препарата в 2 мл, в упаковке по 100 мл.

### **Либексин (Ubehin)**

**Групповая принадлежность:** Противокашлевое средство, периферического действия

**Фармакологическое действие:** Противокашлевой препарат, по активности примерно равен кодеину. Не угнетает дыхания и не вызывает пристрастия (лекарственной зависимости).

**Показания к применению:** Острый и хронический бронхит, бронхиальная астма, грипп, эмфизема легких (повышение воздушности и снижение тонуса легочной ткани), сухой и экссудативный плеврит (воспаление оболочек легкого, сопровождающееся накоплением между ними богатой белком жидкости, выходящей из мелких сосудов), плевропневмония (сочетанное воспаление ткани легкого и его оболочек), инфаркт легкого, хирургические вмешательства на плевре.

**Способ применения:** Внутрь взрослым по 0,1 г (1 таблетка) 3-4 раза в день, в тяжелых случаях по 0,2 г 3-4 раза в день, детям в зависимости от возраста - по 0,025-0,05 г (1/4-1/2 таблетки) 3-4 раза в день. Таблетку проглатывают не разжевывая.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 г в упаковке по 20 штук.

### **Бромгексин (Bromhexin)**

**Групповая принадлежность:** Муколитическое средство

**Фармакологическое действие:** Повышает выделение секрета бронхиальными железами и уменьшает вязкость мокроты, что дает выраженный отхаркивающий эффект и облегчает выделение мокроты.

**Показания к применению:** Острые и хронические воспалительные заболевания трахеи, бронхов, легких; бронхоэктатическая болезнь (заболевание легких с образованием в легочной ткани полостей, заполненных мокротой),

**Способ применения:** Принимают бромгексин внутрь (независимо от приема пищи) в виде таблеток. Дозы для взрослых - по 0,016 г (16 мг = 2 таблетки по 0,008 мг) 3-4 раза в день; для детей от 3 до 4 лет - по 0,002 г (2 мг), от 5 до 14 лет - по 0,004 г (4 мг) 3 раза в день; детям до 3 лет препарат не назначают. Действие препарата начинает проявляться обычно через 24-48 ч после начала лечения. Курс лечения - от 4 дней до 4 нед. При ингаляционном применении раствор следует разбавить дистиллированной водой 1:1 и нагреть до температуры тела для предупреждения кашля.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,008 г, 0,016 г. Драже по 0,004 г, 0,008 г, 0,012 г. Сироп (1 мл - 0,0008 г). Микстура (1 мл - 0,0008 г). Раствор для перорального (через рот) применения (1 мл - 0,002 г). Раствор для ингаляционного применения (1 мл - 0,0002 г). Раствор для парентерального применения (1 мл - 0,002 г).

### **Тусупрек (Tusuprex)**

**Групповая принадлежность:** Противокашлевое средство центрального действия

**Фармакологическое действие:** Оказывает противокашлевое и слабое отхаркивающее действие. В отличие от кодеина не угнетает дыхание, не вызывает пристрастия (лекарственной зависимости) и привыкания (уменьшения или исчезновения реакции при длительном повторном применении препарата).

**Показания к применению:** Сухой кашель, катары верхних дыхательных путей, заболевания легких.

**Способ применения:** Внутрь: взрослым по 20 мг 3-4 раза в день, детям до 1 года - по 5 мг 3-4 раза в день; детям старше 1 года - по 5-10 мг 3-4 раза в день.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,01 г в упаковке по 30 штук; таблетки по 0,02 г в упаковке по 30 штук.

### **Эуфиллин (Euphylinum)**

**Групповая принадлежность:** Бронходилатирующее средство — фосфодиэстеразы ингибитор. (Бронходилатирующее действие, связанное с расслаблением гладкой мускулатуры бронхов или уменьшением отека слизистой оболочки, приводящее к улучшению проходимости дыхательных путей).

**Фармакологическое действие:** Действие эуфиллина обусловлено в первую очередь содержанием в нем теофиллина. Этилендиамин усиливает спазмолитическую (снимающую спазмы) активность и способствует растворению препарата.

**Показания к применению:** Применяют эуфиллин при бронхиальной астме и бронхоспазмах (резком сужении просвета бронхов) различной причины (в основном для снятия приступов), гипертонии в малом круге кровообращения (повышенном давлении в сосудах легких), а также при сердечной астме, особенно когда приступы сопровождаются бронхоспазмом и нарушениями дыхания по типу Чейна-Стокса.

**Способ применения:** Назначают эуфиллин внутрь, в мышцы, вену и в микроклизмах. Под кожу растворы эуфиллина не вводят, так как они вызывают раздражение тканей. Способ введения зависит от особенностей случая: при острых приступах бронхиальной астмы и инсультах вводят внутривенно, в менее тяжелых

случаях - внутримышечно или внутрь. Внутрь взрослые принимают по 0,15 г после еды 1-3 раза в день. Детям внутрь дают из расчета 7-10 мг/кг в сутки в 4 приема. Длительность курса лечения - от нескольких дней до нескольких месяцев.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,15 г в упаковке по 30 штук; ампулы по 10 мл 2,4% раствора и по 1 мл 24% раствора в упаковках по 10 штук.

#### **Зафирлукаст (Zafirlukast)**

**Групповая принадлежность:** антагонист лейкотриеновых рецепторов. это препараты, которые блокируют рецепторы к лейкотриенам (зафирлукаст и монтелукаст) и угнетают активность фермента 5-липооксигеназы (зилейтон), катализирующего процесс образования лейкотриенов из арахидоновой кислоты.

Препараты этой группы оказывают противовоспалительное действие, подавляя клеточные и не клеточные компоненты воспаления в бронхах, вызываемого воздействием антигенов.

**Фармакологическое действие** - противовоспалительное, противоастматическое (предупреждающее бронхоспазм). После приема внутрь всасывается медленно и недостаточно полно. Препятствует действию медиаторов воспаления, уменьшает клеточный и не клеточный компоненты воспаления, снижает проницаемость сосудов, отек, приток эозинофилов к легким, продукцию супероксидов альвеолярными макрофагами. Улучшает функцию легких.

**Показания к применению.** Применение: Бронхиальная астма (профилактика приступов и поддерживающая терапия), в т.ч. при неэффективности бета-стимуляторов.

**Дозировка и способ применения.** Способ применения и дозы: Внутрь, за 1 ч до еды или через 2 ч после еды; взрослым и детям старше 12 лет — по 20 мг 2 раза в сутки (до 80 мг в сутки в 2 приема).

Меры предосторожности: Нельзя применять для купирования бронхоспазма. Не рекомендуется назначать при нарушениях функции печени.

**Форма выпуска:** Таблетки по 20 мг.

#### **Настойка корня алтея лекарственного (Tinctura Althaea officinalis.)**

**Групповая принадлежность:** Муколитическое средство

**Показания к применению:** Применяется как отхаркивающее, обволакивающее, смягчительное, противовоспалительное, уменьшающее раздражение и воспалительный процесс. Настойка корня алтея эффективна при воспалении слизистой оболочки дыхательных органов с большим отделением слизи: бронхите, трахеите, кашле, воспалении лёгких и бронхиальной астме.

Настойка из алтея применяется при лечении тяжёлых заболеваний желудочно-кишечного тракта. Как средство **успокаивающее боли** применяется также при язве желудка и двенадцатиперстной кишки, гастритах, колитах, поносах.

Настойка из корней алтея употребляется при **воспалении мочевого пузыря, болезненном и непроизвольном мочеиспускании, при болезнях мочеполовых органов.**

**Способ применения:** Пить по 10 – 15 капель 3 раза в день до еды. При расстройствах пищеварения или проблемах с мочевыделительной системой настойка из корня алтея разводится горячей водой, а затем охлаждается — чтобы снизить концентрацию спирта (часть спирта испаряется).

Курс приема – 30 - 40 дней.

На курс лечения необходимо 2 - 3 флакона.

**Форма выпуска:** В стеклянных флаконах по 100 мл

#### **Кофеин (кофеина бензоат натрия)**

**Групповая принадлежность:** лекарственный препарат из группы аналептиков.

**Фармакологическое действие:** Кофеин бензоат натрия оказывает прямое возбуждающее действие на кору мозга, стимулирует работу дыхательного, сосудодвигательного центров продолговатого мозга, усиливает рефлексы, обеспечивает межнейрональную проводимость в спинном мозге, повышает двигательную активность, активизирует психическую деятельность, устраняет сонливость, помогает справиться с утомляемостью.

**Показания к применению:**, применяется, в том числе, в качестве стимулятора при нарушениях дыхания (периодическое дыхание, идиопатическое апноэ) в том числе у новорожденных (в т.ч. недоношенных).

**Способ применения:** Дозы кофеина-бензоата натрия подбираются индивидуально. Обычно кофеин-бензоат натрия вводят подкожно (раствор для инъекций) по 1 мл 10% или 20% раствора (детям - по 0,25–1 мл 10% раствора). Высшие дозы для взрослых: разовая — 0,4 г, суточная — 1 г. Препарат может применяться внутрь - независимо от приема пищи (таблетки). Взрослым обычно по 50–100 мг на прием 2–3 раза в день (не более 1 г в сутки), детям старше 2 лет - по 30–75 мг на прием. При мигрени (часто в сочетании с ненаркотическими анальгетиками и алкалоидами спорыньи) - по 200 мг во время приступа боли, затем — по 100 мг 2–3 раза в день.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,075 г (для детей) в упаковке по 10 штук; таблетки по 0,1 и 0,2 г в упаковке по 6 штук; ампулы 10% раствора по 1 мл и 2 мл в упаковке по 10 штук; ампулы 20% раствора по 1 и 2 мл в упаковке по 10 штук. -

**Коразол (Corazolium)**

**Групповая принадлежность:** лекарственный препарат из группы аналептиков.

**Фармакологическое действие:** Коразол стимулирует сердечно-сосудистую систему и дыхание, возбуждает головной и спинной мозг, оказывает пробуждающее действие при наркозе, прекращая или ослабляя его, применяется при отравлении снотворными препаратами.

оказывает, в том числе, стимулирующее действие на дыхательный центр (а также сердечно-сосудистую систему), возбуждает головной и спинной мозг, оказывает пробуждающее действие при наркозе, прекращая или ослабляя его, применяется при отравлении снотворными препаратами (барбитуратами), наркотиками, при коллапсе, в особенности центрального происхождения, при асфиксии.

**Показания к применению:** Коразол применяется при коллапсе, в особенности центрального происхождения, при асфиксии, при отравлении наркотиками и снотворными (барбитуратами и др.).

Назначается как тонизирующее средство при лечении хронической недостаточности сердечно-сосудистой системы.

**Способ применения:** Применяется в виде 10% раствора (в ампулах по 1 мл.), а также внутрь (при возможности по медицинским показателям), таблетки по 0,1 г..

**Форма выпуска:** таблетки по 0,1 г., ампулы 10% раствор 1 мл.

**Бемегрид (Bemegridum)**

**Групповая принадлежность:** лекарственный препарат из группы аналептиков.

**Фармакологическое действие:** Возбуждает центральную нервную систему, стимулирует дыхание и кровообращение. Антагонист (лекарственное средство, оказывающее противоположное действие) барбитуратов и снотворных средств.

**Показания к применению:** Действует возбуждающе на центральную нервную систему, стимулирует дыхание и кровообращение. Антагонист барбитуратов и прочих снотворных средств, применяется при отравлении наркотическими и наркотическими средствами, оказывает пробуждающее действие.

**Способ применения** - внутривенно медленно 1-20 мл 0,5% раствора.

**Форма выпуска:** Ампулы по 10 мл 0,5% раствора в упаковке по 10 штук.

**Этимизол (Aethimizolum)**

**Групповая принадлежность:** лекарственный препарат из группы аналептиков.

**Фармакологическое действие:** Оказывает прямое избирательное действие на дыхательный центр: возбуждает дыхательный центр в продолговатом мозге, повышает его чувствительность к гуморальным раздражителям (СО<sub>2</sub>) и нервным импульсам. Возбуждение дыхательного центра проявляется в резком, длительном углублении и учащении дыхания, увеличении объема легочной вентиляции (при этом нервные элементы дыхательного центра не истощаются).

**Показания к применению:** В психиатрии при астенодепрессивных состояниях (слабости, подавленном состоянии), при заболеваниях, сопровождающихся чувством тревоги. Для возбуждения дыхания после наркоза и предупреждения угнетения дыхания при барбитуратовом наркозе, для профилактики пневмоний (воспаления легких) в послеоперационном периоде.

**Способ применения** Применяется внутривенно (медленно), внутримышечно. Для стимуляции дыхания - 0,6-1 мг/кг 1-2 раза в день 1,5% раствора. В качестве противовоспалительного и противоаллергического лекарственного средства - внутрь (после еды), по 0,1 г 3-4 раза в сутки. Курс лечения - 20-30 дней.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 г в упаковке по 50 штук; 1% и 1,5% раствор в ампулах по 3 мл в упаковке по 10 штук.

**Цититон – (Cytitonum)**

**Групповая принадлежность:** Н-холиномиметик

**Фармакологическое действие:** Вызывает рефлекторное возбуждение дыхательного центра, стимулирует сосудодвигательный центр, симпатические ганглии и надпочечники, что приводит к повышению артериального давления.

**Показания к применению:** Применяется при асфиксии (тяжелых нарушениях дыхания, в том числе у новорожденных), шоковом состоянии, ослаблении дыхания и деятельности сердечно-сосудистой системы, коллапсе (резком падении артериального давления), остановке дыхания во время операции, травмах, наркозе, интоксикации, отравлении (удушающими отравляющими веществами - окисью углерода, морфином, синильной кислотой), при возможности применения лекарственного препарата по медицинским показателям.

**Способ применения:** Применяется внутривенно и внутримышечно по 0,5-1 мл. Высшая разовая доза - 1 мл, суточная - 3 мл. Детям до 12 мес. - 0,1-0,15 мл; 2-5 лет - 0,2-0,3 мл; 6-12 лет - 0,3-0,5 мл.

**Форма выпуска:** Выпускают 0,15% родной раствор кристаллического алкалоида цитизина в ампулах по 1 мл, в упаковке 10 ампул.

**Лобелин (лобелина гидрохлорид) – (Lobelini hydrochloridum)**

**Групповая принадлежность:** стимулятор дыхательного центра рефлекторного действия

**Фармакологическое действие:**.. Оказывает н-холиномиметическое действие на рецепторы каротидных клубочков и рефлекторно возбуждает дыхательный центр (и ряд других центров продолговатого мозга).

**Показания к применению:** Ослабление или рефлекторная остановка дыхания, асфиксия новорожденных. Никотиновая зависимость. Абстинентный синдром "курильщиков".

**Способ применения:** При внутривенном и внутримышечном введении, для взрослых разовая доза составляет 3-5 мг, для детей, в зависимости от возраста – 1-3 мг. (внутрь - в качестве средства для отвыкания от курения). Дозу устанавливают индивидуально.

**Форма выпуска:** Ампулы по 1 мл 1 % раствора.

#### Кордиамин (Cordiamin)

**Групповая принадлежность:** Аналептическое средство

**Фармакологическое действие:** Аналептическое средство смешанного типа действия (стимуляция ЦНС, прямое и рефлекторное возбуждение дыхательного и сосудодвигательного центров). Механизм действия складывается из 2 компонентов: центрального и периферического. Центральный механизм связан с непосредственным влиянием на сосудодвигательный центр продолговатого мозга, приводящим к его возбуждению и опосредованному повышению системного АД (особенно при изначальном угнетении данного центра). Периферический компонент механизма действия связан с возбуждением хеморецепторов каротидного синуса, что приводит к увеличению частоты и глубины дыхательных движений. Непосредственного влияния на ССС не оказывает. стимулятор дыхательного центра смешанного типа, действует преимущественно на дыхательный и сосудодвигательный центры в продолговатом мозге.

Препарат облегчает процесс передачи нервных импульсов между нейронами, повышая, таким образом, возбудимость и чувствительность дыхательного центра к естественным раздражителям (таким как углекислота).

**Показания к применению:** Применяется при коллапсе, асфиксии, в том числе асфиксия новорожденных, при шоковом состоянии различной этиологии, отравления снотворными, наркотическими препаратами, барбитуратами и другими веществами угнетающими центральную нервную систему (при возможности применения препарата по медицинским показателям).

**Способ применения:** Взрослым назначают по 15-40 капель 2-3 раза в день или 1-2мл подкожно/внутривенно/внутримышечно 2-3 раза в день.

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций в ампулах по 1 или 2мл, по 10 ампул в картонной коробке. Раствор для перорального приема по 30мл во флаконе, по 1 флакону в картонной упаковке.

#### Этилморфина гидрохлорид Aethylmorphini hydrochloridum

**Групповая принадлежность:** Противокашлевое средство центрального действия

**Фармакологическое действие:** Этилморфина гидрохлорид — противокашлевое и обезболивающее средство.

По своему действию этилморфин аналогичен кодеину, однако его болеутоляющие свойства выражены сильнее.

**Показания к применению** Этилморфина гидрохлорид применяют как для уменьшения явлений раздражения слизистых оболочек дыхательных путей и как противокашлевое средство при бронхите, бронхопневмонии, плеврите, ларингите, туберкулезе лёгких и др.

**Способ применения:** Этилморфина гидрохлорид назначают в порошках и растворах внутрь взрослым по 0,01-0,03 г на приём 2-3 раза в день.

**Форма выпуска** порошок (1 г); таблетки по 0,010 г и 0,015 г, в упаковках по 10 штук.

#### Глауцина гидрохлорид (глауwent) Glaucini hydrochloridum

**Групповая принадлежность:** Вазодилатирующее (сосудорасширяющее) средство

**Фармакологическое действие:** Препарат относится к группе ненаркотических противокашлевых средств. Оказывает противокашлевое действие. Избирательно угнетает кашлевой центр продолговатого мозга. Не вызывает угнетения дыхания, привыкания, лекарственной зависимости.

**Показания к применению:** Бронхит, бронхиальная астма, пневмония, плеврит, коклюш, туберкулез, трахеобронхит, сухой непродуктивный кашель.

**Способ применения:** Внутрь, после еды, взрослым - 50 мг 2-3 раза в сутки; детям в зависимости от возраста 10-30 мг 2-3 раза в сутки.

**Форма выпуска:** таблетки покрытые оболочкой 50мг

#### Леводронпрозин (левопронт) (Levopront)

**Групповая принадлежность:** Противокашлевое средство периферического действия

**Фармакологическое действие:** Противокашлевое средство периферического (преимущественно) действия. Подавляет высвобождение нейропептидов (субстанция Р и др.) и гистамина. Способствует уменьшению интенсивности и частоты кашля. Оказывает бронхолитическое действие.

**Показания к применению:** Сухой непродуктивный кашель при фарингите, ларингите, остром трахеите и трахеобронхите, гриппе, бронхопневмонии, хроническом обструктивном бронхите, бронхиальной астме,

эмфиземе легких, опухоли легких, аллергических и инфекционно-воспалительных заболеваниях дыхательных путей.

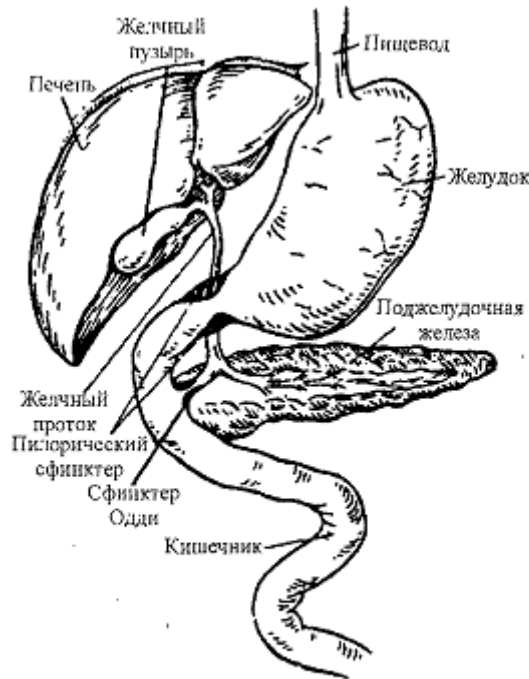
**Способ применения:** Внутрь, 10 мл сиропа (мерный стаканчик) 1–3 раза в день с промежутками не менее 6 ч; детям от 2 до 12 лет дают по 1 мг/кг (сироп) 1–3 раза в день до прекращения кашля, но не более недели.

**Форма выпуска:** сироп 60 мг/10 мл; флакон (флакончик) темного стекла 60 мл с дозировочным стаканом (стаканчиком) коробка (коробочка) 1; сироп 60 мг/10 мл; флакон (флакончик) темного стекла 120 мл с дозировочным стаканом (стаканчиком) коробка (коробочка) 1;

## ФАРМАКОЛОГИЧЕСКАЯ РЕГУЛЯЦИЯ ОРГАНОВ ЖЕЛУДОЧНО-КИШЕЧНОГО ТРАКТА

### Общие сведения о физиологии пищеварения и пищеварительной системе. Функции пищеварительной системы (ЖКТ )

**Пищеварительная система** включает в себя **пищеварительный (желудочно-кишечный) тракт**, имеющий трубчатое строение (пищевод, желудок, тонкая и толстая кишка), слюнные железы, печень и поджелудочную железу. Благодаря нервным и гуморальным механизмам регуляции функций органы пищеварения объединены в **единую систему**.



Схематичное изображение органов пищеварения

Для поддержания обмена веществ и энергии и осуществления жизнедеятельности организма необходимо поступление из внешней среды органических и неорганических веществ.

Под **пищеварением** понимается совокупность физических, химических и физиологических процессов, обеспечивающих обработку и превращение пищевых продуктов в простые химические соединения, способные усваиваться клетками организма.

Содержащиеся в пище белки, жиры, углеводы и другие сложные органические вещества не могут быть усвоены организмом человека и животных **без предварительной физико-химической обработки** в желудочно-кишечном тракте, в результате которой происходит деполимеризация молекул питательных веществ. Образующиеся под влиянием гидролитических ферментов пищеварительных соков олигомеры и мономеры, **лишенные видовой специфичности**, поступают в кровь, лимфу и тканевую жидкость и включаются в метаболизм клеток.

Нарушение нормальной функции пищеварительного тракта может приводить к различным заболеваниям и проявлениям (понос, запор, рвота, изжога, колики, гастрит, язвенная болезнь и другие).

## Физиология пищеварения

### Функции желудочно-кишечного тракта:

1. **Моторная**, или двигательная, функция осуществляется мускулатурой пищеварительного аппарата и заключается в жевании, глотании, передвижении пищи по пищеварительному тракту и удалении из организма непереваренных остатков.
2. **Секреторная** функция заключается в выработке железистыми клетками пищеварительных соков: слюны, желудочного, поджелудочного, кишечного соков и желчи.
3. **Инкреторная** функция связана с образованием в пищеварительном тракте ряда гормонов, которые оказывают специфическое воздействие на процесс пищеварения.
4. **Экскреторная** функция пищеварительного аппарата обеспечивается выделением пищеварительными железами в полость желудочно-кишечного тракта продуктов обмена (например, мочевины, аммиака, желчных пигментов), воды, солей тяжелых металлов, лекарственных веществ, которые затем удаляются из организма.
5. **Всасывательная** функция осуществляется слизистой оболочкой желудка и кишечника.

**Регуляция работы ЖКТ.** Особенностью регуляции деятельности ЖКТ, кроме регуляции извне (вегетативная нервная система: блуждающий нерв и симпатические нервные волокна), у желудочно-кишечного тракта имеется собственная, внутренняя нервная система — "**кишечный мозг**", которая работает независимо и регулирует моторную (двигательную) и секреторную (выделение биологически активных веществ) функции желудка и кишечника.

**Гормоны.** Желудочно-кишечный тракт относится к органам, наиболее подверженным гормональным влияниям. К настоящему времени в слизистой желудочно-кишечного тракта и в поджелудочной железе обнаружено **18 видов клеток**, вырабатывающих гормоны (**гастрин, секретин, холецистокинин и др.**) и пептиды. Причем выработка этих гормонов зависит не только от внешней регуляции, но и от непосредственного действия компонентов пищи с самими вырабатывающими гормоны и пептиды клетками пищеварительного тракта.

**Иммунная система.** Вместе с компонентами пищи в пищеварительный тракт попадает множество бактерий, вирусов и пищевых аллергенов (веществ, способных вызвать аллергическую реакцию). Для защиты от них в желудочно-кишечном тракте имеется своя иммунная система, состоящая из специальных клеток (**лимфоциты, плазматические клетки**) и целых их скоплений (пейеровы бляшки). В норме этот барьер обеспечивает достаточную защиту, но при инфекционных заболеваниях кишечника или под действием других вредных факторов он может разрушаться. Важное значение имеет и так называемая «полезная микрофлора» кишечника, участвующая в процессе пищеварения и иммунной защите. Ее нарушение (под действием антибиотиков) ведет к заболеванию - дисбактериозу.

**Газообразование.** В норме в желудочно-кишечном тракте содержится менее 200 мл газов. Но при употреблении большого количества целлюлозы (пищи, богатой клетчаткой) количество газов может значительно увеличиваться, так как целлюлоза расщепляется бактериями в толстом кишечнике, в норме живущими в пищеварительном тракте. При употреблении в пищу бобов количество газов может увеличиваться в 10 раз! При этом человек ощущает "вздутие" — чувство распирания

**Процесс пищеварения** происходит в полости рта, желудке, двенадцатиперстной кишке, тонком и толстом кишечнике.

## ПИЩЕВАРЕНИЕ В РОТОВОЙ ПОЛОСТИ

Начинаются эти процессы с механической обработки пищи и секреции пищеварительных соков.



**Ротовая полость.** В слизистой оболочке щек, губ, языка располагаются многочисленные чувствительные нервные окончания, представленные тактильными, температурными, болевыми, вкусовыми и осморецепторами.

**Пищеварение в полости рта** складывается из сосания (у ребенка раннего возраста), жевания, слюноотделения и глотания. Оно начинается с приема пищи, который является пусковым механизмом для функционирования желудочно-кишечного тракта.

**Жевание** — рефлекторный акт. В результате его пища измельчается. В процессе жевания происходит смешивание измельченной пищи со слюной и формирование пищевого комка. У взрослого человека пищевой комок образуется, в среднем, в течение 30 с.

Рефлекторный центр акта жевания локализуется в **продолговатом мозге** (входит в состав комплексного пищевого центра). Жевание является мощным фактором, стимулирующим секрецию слюны и отделение других пищеварительных соков.

### Слюнные железы.

Слюнные железы делятся на малые и большие. Многочисленные малые слюнные железы имеются в слизистой оболочке губ, щек, твердого и мягкого неба, языка и глотки. Большие слюнные железы находятся вне ротовой полости и связаны с ней выводными протоками. Самой крупной из слюнных желез является околоушная, которая у человека расположена спереди и несколько ниже ушной раковины. Вторыми по величине слюнными железами являются подчелюстные и затем подъязычные.

**Слюна** — **первый пищеварительный сок**. У взрослого человека за сутки ее образуется **0,5—2 л**. В слюне имеются самые различные по происхождению белки, в том числе белковое слизистое вещество — **муцин**. Пищевой комок, увлажненный слюной, благодаря муцину становится скользким и легко проходит по пищеводу.

**Пищеварительная функция:** Основными ферментами слюны являются **амилаза** (птиалин) и **мальтаза**, которые действуют **только в слабощелочной среде**. Амилаза расщепляет крахмал (полисахарид) до мальтозы (дисахарид). Мальтаза действует на мальтозу и сахарозу и расщепляет их до глюкозы. Благодаря растворению пищевых веществ слюна обеспечивает воздействие пищи на вкусовые рецепторы. Слюна **стимулирует секрецию желудочного сока**.

**Экскреторная функция слюны** заключается в том, что в составе слюны могут выделяться некоторые продукты обмена, такие как мочевина, мочевая кислота, лекарственные средства (хинин, стрихнин) и ряд других веществ, поступивших в организм (соли ртути, свинца, алкоголь).

**Защитная функция слюны** состоит в отмывании раздражающих веществ, попавших в ротовую полость; **бактерицидным действием** (предупреждает развитие кариеса) слюна обладает благодаря присутствию **лизоцима**; **кровоостанавливающим действием** в связи с наличием в слюне тромбопластических веществ.

Действие ферментов слюны продолжается некоторое время в желудке. Это становится возможным потому, что пищевой комок, попавший в желудок, пропитывается кислым желудочным соком не сразу, а **постепенно** — в течение 20—30 мин. В это время во внутренних слоях пищевого комка продолжается действие ферментов слюны и происходит расщепление углеводов.

### Влияние состава пищевых продуктов на слюноотделение.

Слюноотделение осуществляется по принципу безусловных и условных рефлексов. **Безусловно - рефлекторное слюноотделение** происходит при попадании пищи в ротовую полость. Слюноотделение может осуществляться и **условно рефлекторно**. Вид и запах пищи, звуковое раздражение, связанные с приготовлением пищи, приводят к отделению слюны. У человека и животных **условно рефлекторное слюноотделение возможно только при наличии аппетита**.

**Качество и количество отделяемой слюны** определяется **характером раздражителя**. Если в состав пищи входят продукт растительного происхождения, то в слюне увеличивается количество ферментов, обеспечивающих расщепление углеводов. Количество слюны также зависит от характера пищи. Если в пище содержится мало воды, например, при употреблении сухарей, то выделяется слюна с большим содержанием жидкости. Когда же в состав пищи включено значительное количество воды, то ее содержание в выделяющейся слюне уменьшается.

**Эфферентными (центробежными) нервами**, иннервирующими каждую слюнную железу, являются **парасимпатические и симпатические волокна**.

**Раздражение парасимпатических волокон** приводит к образованию **обильной и жидкой слюны**. **Раздражение симпатических волокон** вызывает отделение **небольшого количества густой слюны**.

**Глотание** является **безусловно рефлекторным актом**, в результате которого пищевой комок из полости рта проводится через пищевод в желудок. Твердая пища проходит по пищеводу в течение **6—8 с**, жидкая — **2—3 с**.

**Механизм открытия кардиального сфинктера**. Кардиальный сфинктер открывается рефлекторно при раздражении механорецепторов нижнего отдела пищевода.

### **ПИЩЕВАРЕНИЕ В ЖЕЛУДКЕ**

Желудок является резервуаром для пищи. Его вместимость у взрослого человека около **3 л**.

Эфферентная иннервация желудка осуществляется **вегетативной нервной системой**. *Симпатическая иннервация обеспечивается волокнами чревных, парасимпатическая — волокнами блуждающих нервов.*

#### **Функции желудка.**

**Секреторная функция** желудка обеспечивается железами, находящимися в его слизистой оболочке.

**Моторная функция** осуществляется за счет сокращения мускулатуры стенки желудка, благодаря чему происходит перемешивание пищи в желудке и продвижение ее в двенадцатиперстную кишку.

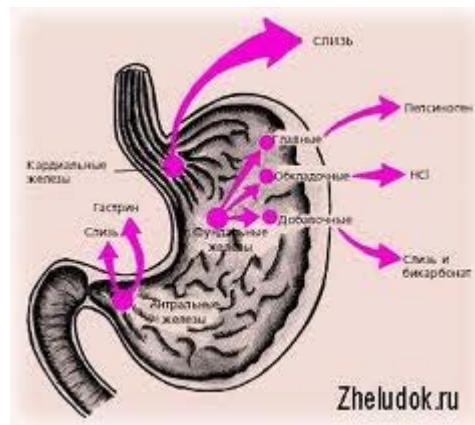
**Всасывательная функция** способствует поступлению в организм из желудка воды, минеральных солей, спирта, лекарственных веществ, продуктов расщепления белка.

**Экскреторная функция** желудка заключается в выделении с желудочным соком продуктов обмена белка (мочевина), углеводов (молочная кислота), различных лекарственных веществ (йод, хинин, морфин, мышьяк, салицилат натрия).

**Инкреторная функция** связана с тем, что в желудке образуется ряд гормонов, которые оказывают специфическое действие на процесс пищеварения. Кроме того, в желудке образуется антианемический гормон.

Желудок **регулирует температуру** принятой пищи, участвует в регуляции реакции внутренней среды организма.

**Бактерицидная функция** осуществляется за счет соляной кислоты желудочного сока, которая стерилизует содержимое желудка.



**Железы желудка.** В слизистой оболочке желудка различают **три вида желез:** кардиальные, собственные железы желудка (фундальные) и железы привратника (пилорические).

Желудочный сок малой кривизны желудка, дна и тела желудка **кислый**. В направлении к двенадцатиперстной кишке количество и размер обкладочных клеток уменьшается, и в антральной части желудка они отсутствуют. Вследствие этого и сок этой части желудка имеет **щелочную реакцию**.

#### **Состав, свойства и значение желудочного сока.**

У взрослого человека в течение суток образуется около **2—2,5 л** желудочного сока.

Желудочный сок содержит ферменты (пепсин, желатиназу, химозин и др.), хлористоводородную кислоту (0,4—0,6%), гастромукопротеин, слизь, минеральные вещества, воду.

Первостепенное значение среди **ферментов имеет пепсин**. Пепсин проявляет свое действие **только в кислой среде**. Он **расщепляет белки до альбумоз и пептонов**. Ферментативная активность **гастринина** близка к активности пепсина. **Химозин** вызывает створаживание молока.

В желудочном соке обнаружены также **непротеолитические ферменты**. Одним из таких ферментов является **лизоцим**, обеспечивающий бактерицидные свойства желудочного сока.

#### **Влияние состава пищевых продуктов на желудочную секрецию.**

Железы желудка вне процесса пищеварения выделяют только слизь и пилорический сок. После поступления пищи в ротовую полость или при виде пищи, ее запахе и действии на организм других раздражителей, связанных с едой, начинается сокоотделение в желудке. Сокоотделение начинается через **5—9 мин** после того, как человек или животное начали есть.

Продолжительность секреторного процесса, количество и качество желудочного сока находятся в строгой зависимости от характера пищи. В 1-й час количество и качество желудочного сока, выделяющегося при употреблении хлеба и мяса, не зависели от химических свойств пищи. В **последующие часы** интенсивность и продолжительность секреции желудочного сока определяется химическими свойствами пищи (составные части пищи, продукты ее переваривания, гормоны). Обнаружено также, что больше всего сока выделяется после приема мяса, наименьшее — хлеба и молока. Длительность секреции сока различна: на мясо сок выделяется в течение 7 ч, на хлеб — 10 ч, на молоко — 6ч.

#### **Регуляция желудочной секреции.**

С момента попадания пищи в ротовую полость начинается **безусловнорефлекторное отделение** желудочного сока. От рецепторов ротовой полости нервные импульсы поступают в **пищевой центр** продолговатого мозга. Возбуждение от пищевого центра по эфферентным волокнам достигает желез желудка и повышает их

секреторную активность. **Первая фаза желудочной секреции** длится 30—40 мин и имеет большое значение для пищеварения.

**Желудочная фаза секреции** наступает при соприкосновении пищи со слизистой оболочкой самого желудка. Под влиянием раздражения пищей **механорецепторов** желудка возникшее возбуждение достигает по чувствительным волокнам блуждающего нерва пищевого центра продолговатого мозга и от него по секреторным нервам нервные импульсы поступают к железам желудка.

К числу **химических веществ**, способных оказывать непосредственное влияние на секрецию желез слизистой оболочки желудка, относятся экстрактивные вещества, спирты, продукты расщепления пищи (альбумозы и пептоны). Сильное действие на желудочную секрецию оказывает **гистамин**, который содержится в пищевых веществах и слизистой оболочке желудка, а также **ацетилхолин**, освобождающийся при соприкосновении пищевых веществ со слизистой оболочкой канала привратника. В слизистой оболочке привратниковой части желудка образуется гормон **гастрин**, который, всасываясь в кровь, также стимулирует отделение желудочного сока.

Секреция желез желудка **тормозится** продуктами расщепления жира, гормонами: **гастрогастроном** и **энтерогастроном**, вырабатываемыми слизистой оболочкой желудка и верхнего отдела тонкого кишечника.

### **Моторная функция желудка.**

**Три вида** двигательных явлений в желудке: **перистальтические, систолические и тонические**. Моторная функция желудка обеспечивается работой гладкой мускулатуры. Эта функция способствует перемешиванию, размельчению и продвижению содержимого желудка в двенадцатиперстную кишку (в одном направлении).

При пустом желудке возникают периодические его сокращения (**голодная моторика**), которые сменяются состоянием (периодом) покоя. Этот вид сокращения мышц желудка связан с ощущением голода. У человека продолжительность периодов работы желудка составляет 20 - 50 мин, периоды покоя длятся 45—90 мин и более. Периодические сокращения желудка прекращаются с началом еды и пищеварения. Кроме указанных видов сокращения в желудке различают **антиперистальтику**, которая наблюдается при акте рвоты.

### **ПИЩЕВАРЕНИЕ В ТОНКОЙ КИШКЕ.**

**Кишечная фаза желудочной секреции** начинается с момента поступления пищи в кишечник. Пищевая кашица раздражает механо-, осмо-, хеморецепторы слизистой оболочки кишечника и рефлекторно изменяет интенсивность желудочной секреции.

В тонкой кишке происходят основные процессы переваривания и всасывания пищевых веществ. Особенно велика роль ее начального отдела – двенадцатиперстной кишки. В процессе пищеварения здесь участвуют **панкреатический, кишечный соки и желчь**. С помощью ферментов, входящих в состав панкреатического и кишечного соков, происходит гидролиз белков, жиров и углеводов.

### **Состав и свойства панкреатического сока**

Внешнесекреторная деятельность поджелудочной железы заключается в образовании и выделении в двенадцатиперстную кишку **1,5 - 2,0 л** панкреатического сока. В состав поджелудочного сока входят вода и сухой остаток (0,12%), который представлен неорганическими и органическими веществами. Особенно много в нем бикарбонатов, благодаря которым рН сока равна 7,8-8,5. **Ферменты поджелудочного сока активны в слабощелочной среде.**

Панкреатический сок представлен также **большим количеством ферментов** (протеолитическими, липолитическими и амилалитическими), переваривающими белки, жиры, углеводы и нуклеиновые кислоты.

**Протеолитические ферменты** секретируются в виде **проэнзимов** - трипсиногена, химотрипсиногена, прокарибоксипептидазы А и В, проэластазы. Под влиянием **энтерокиназы** двенадцатиперстной кишки трипсиноген превращается в **трипсин**. Затем сам трипсин действует **автокаталитически** на оставшееся количество трипсиногена и на другие пропептидазы, превращая их в активные ферменты.

Трипсин, химотрипсин, эластаза расщепляют преимущественно внутренние пептидные связи белков пищи, в результате чего образуются низкомолекулярные пептиды и аминокислоты.

### Регуляция секреции поджелудочной железы

**Регуляция** поджелудочной экзокринной секреции осуществляется **нервными и гуморальными механизмами**. **Блуждающий нерв усиливает** секрецию поджелудочной железы. **Симпатические нервы уменьшают** количество секрета, но усиливают синтез органических веществ (бета-адренергический эффект). **Снижение** секреции происходит также и за счет **уменьшения кровоснабжения** поджелудочной железы путем сужения кровеносных сосудов (альфа-адренергический эффект).

**Напряженная физическая и умственная работа, боль, сон вызывают торможение секреции**. Гастроинтестинальные гормоны, секретин и ХЦК-ПЗ усиливают секрецию поджелудочного сока.

Выделяют 3 фазы панкреатической секреции: сложнорефлекторную, желудочную и кишечную. На отделение сока поджелудочной железы влияет характер принятой пищи. Эти влияния опосредованы через соответствующие гастроинтестинальные гормоны.

Так, пищевые продукты, усиливающие секрецию соляной кислоты в желудке (экстрактивные вещества мяса, овощей, продукты переваривания белков), стимулируют выработку секретина, а значит, приводят к выделению поджелудочного сока, богатого бикарбонатами.

Поджелудочная железа обладает и внутрисекреторной активностью, продуцируя инсулин, глюкагон, соматостатин, панкреатический полипептид, серотонин, ВИП, гастрин, энкефалин, калликреин, липоксин и ваготонин.

### Состав и свойства кишечного сока

Кишечный сок представляет собой секрет желез, расположенных в слизистой оболочке вдоль всей тонкой кишки. У взрослого человека за сутки отделяется 2 - 3 л кишечного сока, рН от 7,2 до 9,0. Сок состоит из воды и сухого остатка, который представлен неорганическими и органическими веществами.

Из неорганических веществ в соке содержится много бикарбонатов, хлоридов, фосфатов натрия, кальция, калия. В состав органических веществ входят белки, аминокислоты, слизь. В кишечном соке находится **более 20 ферментов**, обеспечивающих конечные стадии переваривания всех пищевых веществ. **Это энтерокиназа, пептидазы, щелочная фосфатаза, нуклеаза, липаза, фосфолипаза, амилаза, лактаза, сахараза и пр..**

Встречаются наследственные и приобретенные дефициты кишечных ферментов, расщепляющих углеводы (дисахаридаз), что приводит к непереносимости соответствующих дисахаридов.

### **Регуляция кишечной секреции**

Регуляция деятельности желез тонкой кишки осуществляется местными нервно-рефлекторными механизмами, а также гуморальными влияниями и ингредиентами химуса. Механическое раздражение слизистой оболочки тонкой кишки вызывает выделение жидкого секрета с малым содержанием ферментов. Местное раздражение слизистой кишки продуктами переваривания белков, жиров, соляной кислотой, панкреатическим соком вызывает отделение кишечного сока, богатого ферментами. Усиливают кишечное сокоотделение ГИП, ВИП, мотилин. Гормоны энтерокринин и дуокринин, выделяемые слизистой оболочкой тонкой кишки, стимулируют соответственно секрецию либеркюновых и бруннеровых желез. Тормозное действие оказывает соматостатин.

### **Полостное и пристеночное пищеварение в тонкой кишке**

В тонкой кишке различают два вида пищеварения: полостное и пристеночное. Полостное пищеварение происходит с помощью ферментов пищеварительных секретов, поступающих в полость тонкой кишки (поджелудочный сок, желчь, кишечный сок). В результате полостного пищеварения крупномолекулярные вещества (полимеры) гидролизуются в основном до стадии олигомеров. Дальнейший их гидролиз идет в зоне, прилегающей к слизистой оболочке и непосредственно на ней.

Пристеночное пищеварение в широком смысле происходит в слое слизистых наложений. Слой слизистых наложений состоит из слизи, продуцируемой слизистой оболочкой тонкой кишки и слушающегося кишечного эпителия. В этом слое находится много ферментов поджелудочной железы и кишечного сока.

Питательные вещества, проходя через слой слизи, подвергаются воздействию этих ферментов. Гликокаликс адсорбирует из полости тонкой кишки ферменты пищеварительных соков, которые осуществляют промежуточные стадии гидролиза всех основных питательных веществ. Продукты гидролиза поступают на апикальные мембраны энтероцитов, в которые встроены кишечные ферменты, осуществляющие собственное мембранное пищеварение, в результате которого образуются мономеры, способные всасываться.

Благодаря близкому расположению встроенных в мембрану собственных кишечных ферментов и транспортных систем, обеспечивающих всасывание, создаются условия для сопряжения процессов конечного гидролиза питательных веществ и начала их всасывания.

## **ПИЩЕВАРЕНИЕ В ТОЛСТОЙ КИШКЕ.**

Из тонкой кишки химус через илеоцекальный сфинктер (баугиниеву заслонку) переходит в толстую кишку. Роль толстой кишки в процессе переваривания пищи небольшая, так как пища почти полностью переваривается и всасывается в тонкой кишке, за исключением растительной клетчатки. В толстой кишке происходят концентрирование химуса путем всасывания воды, формирование каловых масс и удаление их из кишечника.

Здесь также происходит всасывание электролитов, водорастворимых витаминов, жирных кислот, углеводов.

### **Секреторная функция толстой кишки**

Железы слизистой оболочки толстой кишки выделяют небольшое количество сока (рН 8,5-9,0), который содержит в основном слизь, отторгнутые эпителиальные клетки и небольшое количество ферментов (пептидазы, липаза, амилаза, щелочная фосфатаза, катепсин, нуклеаза) со значительно меньшей активностью, чем в тонкой кишке. Однако при нарушении пищеварения вышележащих отделов пищеварительного тракта толстая

кишка способна их компенсировать путем значительного повышения секреторной активности.

Регуляция сокоотделения в толстой кишке обеспечивается местными механизмами. Механическое раздражение слизистой почки кишечника усиливает секрецию в 8 -10 раз.

## Лекарственные средства влияющие на функцию органов пищеварения

Среди средств, влияющих на функции органов пищеварения выделяют следующие группы:

1. Средства влияющие на аппетит;
2. Средства влияющие на секреторную активность желудка;
3. Гастропротекторные средства;
4. Средства влияющие на моторику желудка;
5. Средства влияющие на секреторную активность поджелудочной железы;
6. Желчегонные средства;
7. Гепатопротекторные средства;
8. Средства влияющие на двигательную функцию кишечника;



### Средства влияющие на аппетит

Аппетит проявляется в виде чувства голода. Установлено, что в головном мозге человека (гипоталамусе) имеются два взаимосвязанных центра - центры голода и насыщения, непосредственно влияющие на аппетит и процесс пищеварения. Возбуждение одного из центров угнетает активность другого.

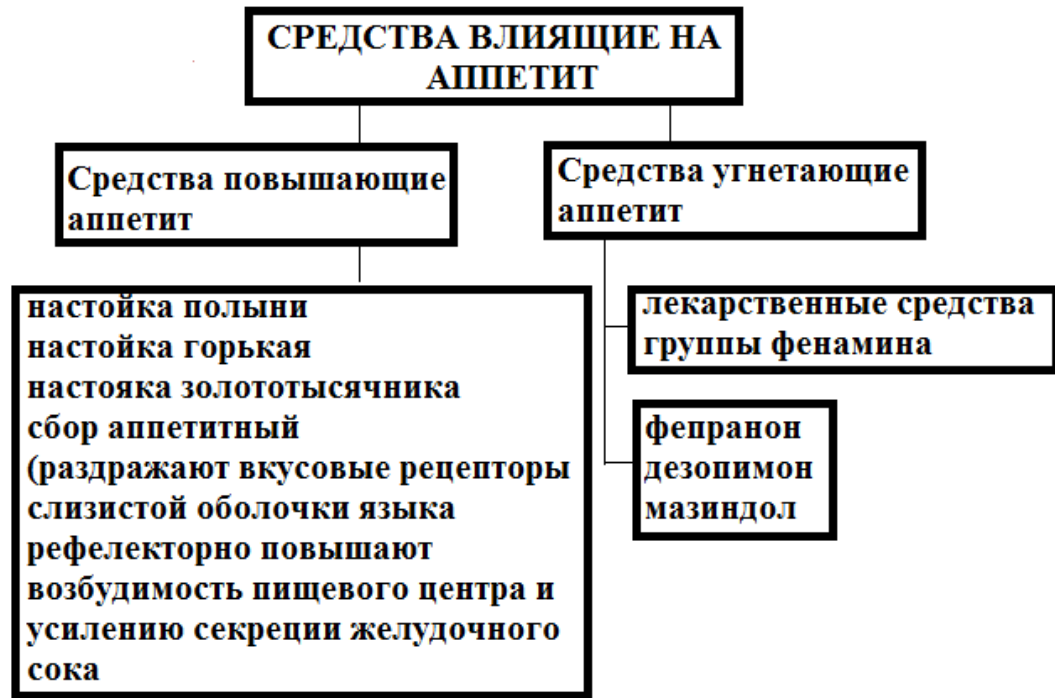
Длительная потеря аппетита является симптомом многих заболеваний, в том числе не связанных с органами пищеварения. Результатом потери аппетита может быть истощение организма – анорексию.

**Анорексия** - синдром, заключающийся в полном отсутствии аппетита при объективной потребности организма в питании, который сопровождает большинство метаболических заболеваний, инфекций, болезней пищеварительной системы, в частности паразитарных инфекций, а также возникающий по другим причинам. Анорексия может

приводить к белково-энергетической недостаточности. **Первичная анорексия** — утрата чувства голода, связанная с гормональной дисфункцией, неврологической патологией, злокачественными опухолями.

Средства, влияющие на аппетит делят на две группы:

1. Средства, повышающие аппетит;
2. Средства, понижающие аппетит;



Наиболее часто для повышения аппетита используют средства растительного происхождения – **горечи**. К ним относятся: настойка полыни, настойка горькая, настойка золототысячника и пр. Горечи раздражают вкусовые рецепторы языка и слизистой оболочки ротовой полости, что приводит к возбуждению центра голода и рефлекторному выделению желудочного сока. Как правило, горечи назначают перед едой, за 10 – 15 минут.

Ведение малоподвижного образа жизни, отсутствие физических нагрузок, систематическое переедание может стать причиной развития алиментарного ожирения. В этом случае применяются **анорексигенные** средства, или средства снижающие аппетит.

Эффективными анорексигенными средствами являются препараты группы фенамина. Однако, вещества этой группы относятся к психотропным средствам, проявляя ряд крайне нежелательных побочных эффектов, в том числе психическую лекарственную зависимость. Вследствие чего, в настоящее время вещества из группы фенамина в медицинской практике практически не применяются.

В качестве средств угнетающих аппетит применяются такие лекарственные средства, как фепранон, дезопимон, мазиндол, которые, в отличие от веществ группы фенамина, не вызывают психической зависимости. Эти препараты действуют возбуждающе на центр насыщения головного мозга, что приводит к подавлению чувства голода.

### Средства влияющие на функции желудка

Выделяют **секреторную и двигательную функции** желудка, регулируемые вегетативной нервной системой (блуждающим нервом), а также гормонами



выделяющимися стенкой желудка (гистамин, гастрин) и кишечника (секретин, холицистокинин), при этом гистамин и гастрин усиливают, а секретин и холицистокинин – угнетают секреторную активность желудка.

К наиболее широко распространенным заболеваниям, непосредственно связанным и секреторной активностью желудка относятся гастрит, а также язвенная болезнь (желудка и двенадцатиперстной кишки).

**Гастрит** - воспалительные или воспалительно-дистрофические изменения слизистой оболочки). Гастрит — собирательное понятие, используемое для обозначения различных по происхождению и течению воспалительных и дистрофических изменений слизистой оболочки желудка. Поражение слизистой может быть первичным, рассматриваемым как самостоятельное заболевание, и вторичным, обусловленным другими инфекционными и неинфекционными заболеваниями или интоксикацией. Характерными признаками гастрита являются ноющие боли в области желудка, тошнота, изжога, отсутствие аппетита и пр.

При гастрите возможно увеличение секреции желудочного сока (гипертрофический и гиперацидный гастрит) или значительное уменьшение (вплоть до полного прекращения) секреции (атрофический, гипацидный гастрит). Состояние, при котором секреция желудочного сока полностью прекращается называется ахилией.

Последствиями гипертрофического гастрита возможно развитие **язвенной болезни** желудка и двенадцатиперстной кишки, которое является - хроническим рецидивирующим заболеванием, при котором, в результате нарушений нервных и гуморальных механизмов регулирующих секреторно-трофические процессы в желудке или двенадцатиперстной кишке, образуется язва (реже две язвы и более). Язвенная болезнь связана с нарушением нервных, а затем и гуморальных механизмов, регулирующих секреторную, моторную функции желудка и двенадцатиперстной кишки, кровообращение в них и трофику слизистых оболочек. Причиной язвенной болезни также могут быть психические факторы (психические травмы, переживания), вследствие которых возможен спазмы кровеносных сосудов стенки желудка. В результате спазмов нарушается питание слизистой оболочки и развиваются язвенная болезнь.

Чрезмерное выделение желудочного сока при этом способствует развитию заболевания. Обладающий достаточной химической и биологической агрессивностью выделяющийся желудочный сок раздражает поверхность язвы, вызывая резкие боли, а также препятствует регенерации (заживлению) язвы. Усиление болевых ощущений вызывает также повышенный тонус гладкой мускулатуры желудка.

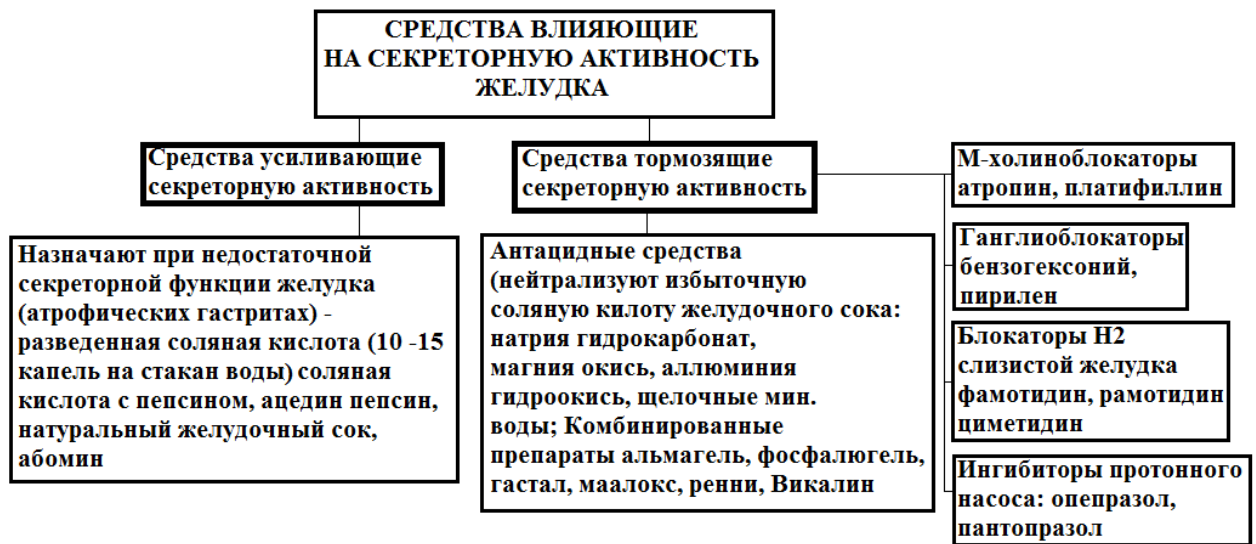
Снижение секреторной активности желудка также может стать причиной язвенной болезни, поскольку в этом случае резко ослабляются защитные (гастропротекторных) свойства желудка, создается среда благоприятная для развития патогенных микроорганизмов.

Гастрит и язвенная болезнь, как правило, имеют длительное, хроническое течение при котором периоды ремиссии сменяются рецидивами заболевания, с осложнениями опасными для жизни.

### **Средства влияющие на секреторную функцию желудка**

Средства, влияющие на секреторную функцию желудка (выделение желудочного сока) делят на две группы:

1. Средства усиливающие секреторную функцию желудка;
2. Средства угнетающие секреторную функцию желудка;



### Средства усиливающие секрецию желудочного сока

Средства, усиливающие секрецию желудочного сока, назначают при секреторной недостаточности, например при гипацидных гастритах. Наиболее физиологически активным веществом, вызывающим усиленное выделение желудочного сока является гистамин – гормон вырабатываемый стенкой желудка. Однако, гистамин вызывает множество нежелательных побочных эффектов, в связи с чем, в качестве лекарственного средства не применяется, используется исключительно в диагностических целях (гистаминовая проба) Отсутствие реакции на гистамин свидетельствует о полной атрофии слизистой оболочки желудка.

В качестве лекарственных средства, усиливающих секреторную активность желудка наиболее часто применяются горечи, минеральные воды, а также средства заместительной терапии, например разведенная соляная кислота (10 – 15 капель на стакан воды), до или вовремя еды. Соляная кислота входит в состав желудочного сока, является необходимым элементом пищеварительного процесса. Кроме того, соляная кислота повышает активность **пепсина** – фермента участвующего в расщеплении белков. Наиболее предпочтительным лекарственным средством заместительной терапии является натуральный желудочный сок. В качестве средства заместительной терапии применяется также соляная кислота с пепсином, а также «Ацидин-пепсин» (таблетки).

В качестве средства заместительной терапии применяется также лекарственное средство «Абомин». Абиомин - препарат, получаемый из слизистой оболочки желудка телят и ягнят молочного возраста. Содержит сумму протеолитических ферментов, действующих на пищевые (преимущественно молочные) белки. Улучшает процесс пищеварения при недостаточности ферментной активности желудочного сока.

### Средства угнетающие секрецию желудочного сока

Средства угнетающие секрецию желудочного сока применяют в случаях, когда необходимо снизить повышенную секреторная активность желудка. Такая потребность возникает при лечении изжоги, гиперацидного гастрита, язвенной болезни (желудка и двенадцатиперстной кишки).

Для нейтрализации избыточной соляной кислоты желудочного сока применяются **«Антацидные средства»**, такие как магния окись, алюминия гидроокись, трисиликат. Комбинированные лекарственные средства: альмагель, фосфалюгель и пр.

Широкое применение в качестве противоязвенных и противогастритных средств, обладающих антацидными средств получили так называемые ингибиторы протонного насоса (омепразол, пантопразол и пр.).

Подробно данная группа лекарственных средств рассмотрена в разделе «**Средства влияющие на афферентную иннервацию**».

Секреторная и двигательная активность желудка усиливается вследствие возбуждения парасимпатической нервной системы, поэтому м-холиноблокаторы (атропин, препараты красавки (белладонны), платифиллин), а также ганглиоблокаторы (бензогексоний) понижают секреторную активность желудка.

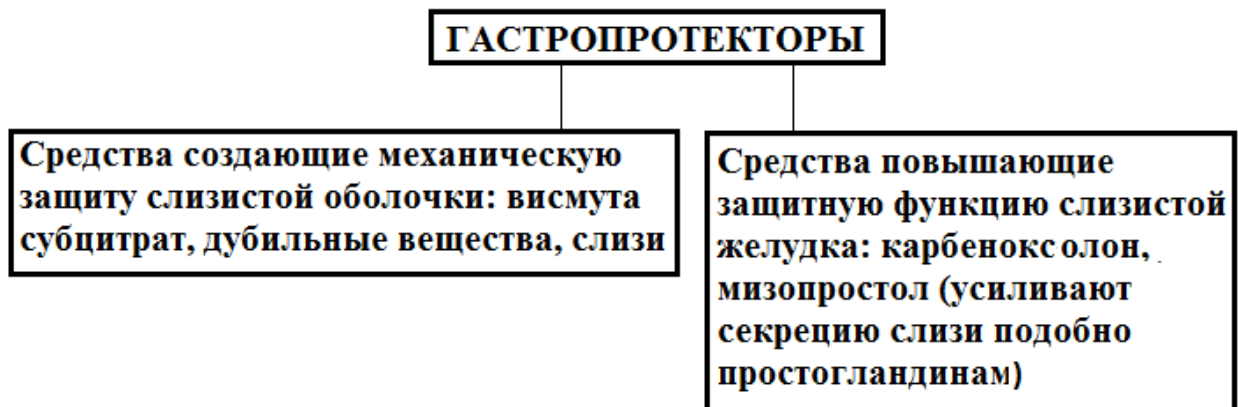
Препараты этих групп тормозят выделение желудочного сока, уменьшают двигательную активность желудка, вследствие чего уменьшается беспокоящее, раздражающее воздействие на поверхность язвы, чем опосредовано способствуют ее заживлению.

Недостатком м-холиноблокаторов и ганглиоблокаторов является их достаточно широкий спектр фармакологического действия, распространяющийся на прочие органы и системы организма, к тому же обладающие рядом негативных побочных эффектов. Так, например, применение ганглиоблокаторов способно вызвать ортостатический коллапс

Эффективными средствами снижения гиперацидной активности желудка являются средства, избирательно блокирующие гистаминовые  $H_2$  рецепторы, к которым относятся ранитидин, фатотидин, циметидин..

### **Гастропротекторные средства**

Гастропротекторные средства – лекарственные средства, защищающие слизистую оболочку желудка от повреждающего действия пепсина, хлористо-водородной (соляной) кислоты желудочного сока и различных раздражающих веществ. Применяются при гастрите, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, причиной которых во много является нарушение целостности и снижение устойчивости слизистой оболочки к различным повреждающим воздействиям в связи с нарушением способности к ее регенерации (восстановлению). .



Слизистая оболочка желудка обладает гастропротекторными свойствами, защищая стенки желудка от химических и физических повреждений. Кроме того, в стенке желудка синтезируются простагландины  $E_2$  и  $I_2$ , способствующие повышению устойчивости клеток слизистой оболочки и их способности к регенерации.

В качестве гастропротекторных средств широко применяются вяжущие, обволакивающие, антацидные, адсорбирующие средства (подробно рассмотренные ранее, в разделе «**Средства влияющие на афферентную иннервацию**»).

Гастропротекторные средства делят на две группы:

1. Средства, создающие механическую защиту слизистой оболочки: висмута субцитрат, дубильные вещества, слизи, вяжущие, адсорбирующие, антацидные;

2. Средства, повышающие защитную функцию самой слизистой оболочки желудка (карбенексолон, мизопростол), усиливающие секрецию слизи, способствующие регенерации слизистой оболочки (подобно простогландам).

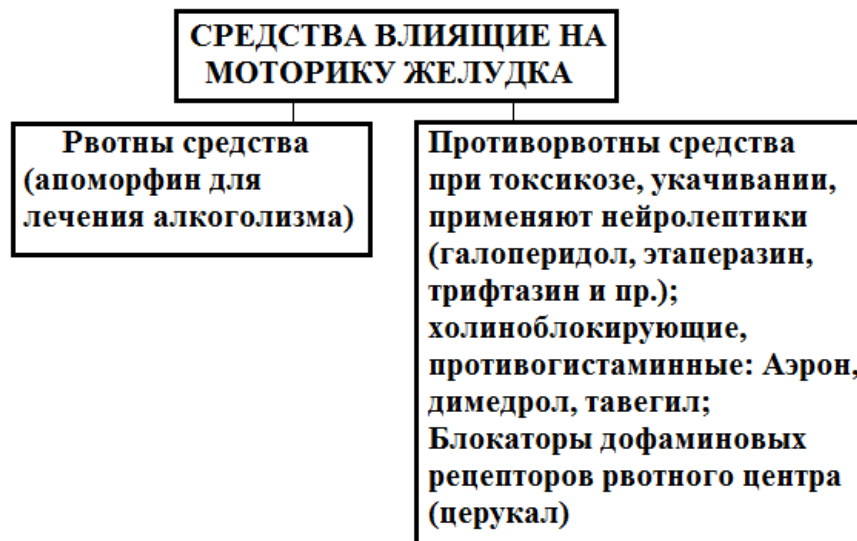
### Средства влияющие на моторику желудка

Моторика желудка связана с изменением тонуса гладких мышц и их перистальтики. Моторика желудка усиливается при возбуждении парасимпатической нервной системы, вследствие чего лекарственные средства возбуждающие парасимпатическую систему также усиливают и моторику желудка. К ним относятся м-холиномиметики, м-,н-холиномиметики, антихолинэстеразные средства, которые могут применяться при атонии желудка.

Средства противоположного действия (м-холиноблокаторы, ганглиоблокаторы) угнетают моторику желудка. Применяются при лечении гиперацидного гастрита и язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, блокируя двигательную активность гладкой мускулатуры желудочно-кишечного тракта, снимая спазмы и уменьшая таким образом болевые ощущения.

Кроме указанных, в медицинской практике применяется группа лекарственных средств, непосредственно влияющих на моторику желудка, к которым относятся:

1. Рвотные средства;
2. Противорвотные средства;



Рвота является рефлекторным процессом, ответной реакцией организма на раздражение слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта (прежде всего района глотки и желудка). Кроме того, в продолговатом мозге расположен рвотный центр, раздражение которого также приводит к проявлению рвотного рефлекса. Триггерная зона рвотного центра содержит  $D_2$  – рецепторы чувствительные, в том числе, к действию некоторых химических веществ (апоморфина).

Рвота является своеобразным рефлекторным защитным актом, позволяющим удалить из организма токсические и раздражающие вещества. Иногда, например, для удаления из желудочно-кишечного тракта ядовитых или токсических веществ рвота вызывается искусственно, однако, и в тех случаях, когда рвота не выполняет очищающей организм функции, данный процесс является нежелательным.

### Рвотные средства

В качестве рвотного средства наиболее часто используется лекарственный препарат апоморфин. Это лекарственное средство применяется при необходимости быстрого удаления из желудка ядовитых веществ, недоброкачественной пищи при пищевых отравлениях, отравлениях алкоголем и прочих подобных случаях. Действие апоморфина наступает достаточно быстро, через несколько минут после инъекционного введения препарата (вводят подкожно 0,5 мл – 1% раствора).

Рвотные средства, в том числе апоморфин, применяются для лечения алкоголизма. При этом одновременно с принятием алкоголя больному вводится рвотное средство, вызывая сильную рвоту. При многократном повторении подобной процедуры, у больного вырабатывается стойкий рефлекс отвращения к алкоголю.

### Противорвотные средства

В некоторых случаях, например при отравлениях ядохимикатами, химическими веществами и лекарственными средствами попавшими в организм парентерально, токсикозе при беременности, заболеваниях головного мозга, гипертонии, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки рвота не выполняет защитной функции и является нежелательным, раздражающим явлением.

Иногда рвота появляется вследствие укачивания или перепадов давления при полете на авиатранспорте – морская и воздушная болезни (в результате перевозбуждения лабиринтного аппарата внутреннего уха). Рвотный рефлекс может проявиться также вследствие раздражения слизистой оболочки желудка при ряде заболеваний (язвенная болезнь, гастрит). В подобных случаях рвотный рефлекс необходимо купировать с помощью противорвотных средств.

Наиболее эффективными противорвотными средствами являются лекарственные средства их группы **нейролептиков** (галоперидол, трифтазин, этаперазин). Эти лекарственные средства оказывают непосредственное воздействие на триггерную зону продолговатого мозга.

Для профилактики укачивания (при морской и воздушной болезни) применяются холиноблокирующие (аэрон, плавефина), и противогистаминные (димедрол, дипразин) лекарственные средства.

Аэрон и плавефин являются комплексными лекарственными препаратами (в состав **аэрона** входят скополамина камфорнокислого - 0,0001 г и гиосциамин камфорнокислого - 0,0004 г.; **плавейфина** - платифиллина гидротартрата — 0,005 г, папаверина гидрохлорида— 0,05 г, кофеина — 0,1 г, калия бромид — 0,15 г.). Эти препараты нормализует тонус центральной нервной системы, угнетают холинергические структуры, расширяет сосуды, успокаивает вестибулярный аппарат. Применяются для профилактики и купирования приступов морской и воздушной болезни.

В основе противорвотного действия антигистаминных средств (димедрол, дипразин) лежит их свойство оказывать седативный (успокаивающий) эффект. Недостатков противогистаминных лекарственных средств является их достаточной широкий спектр действия, способность вызывать сонливость и заторможенность.

При рвоте вызванной воспалительными заболеваниями слизистой оболочки желудка (гастрит, язвенная болезнь) эффективными противорвотными средствами являются вяжущие, обволакивающие и местно анестезирующие средства.

Достаточно эффективными противорвотными средствами являются лекарственные препараты: домперидон и церукал (метоклопрамид). Эти лекарственные средства оказывает регулирующее и нормализующее влияние на двигательную активность желудочно-кишечного тракта, блокируют дофаминовые рецепторы (D<sub>2</sub>) рвотного центра. Оказывает противорвотное действие, успокаивает икоту и устраняет в некоторых случаях тошноту.

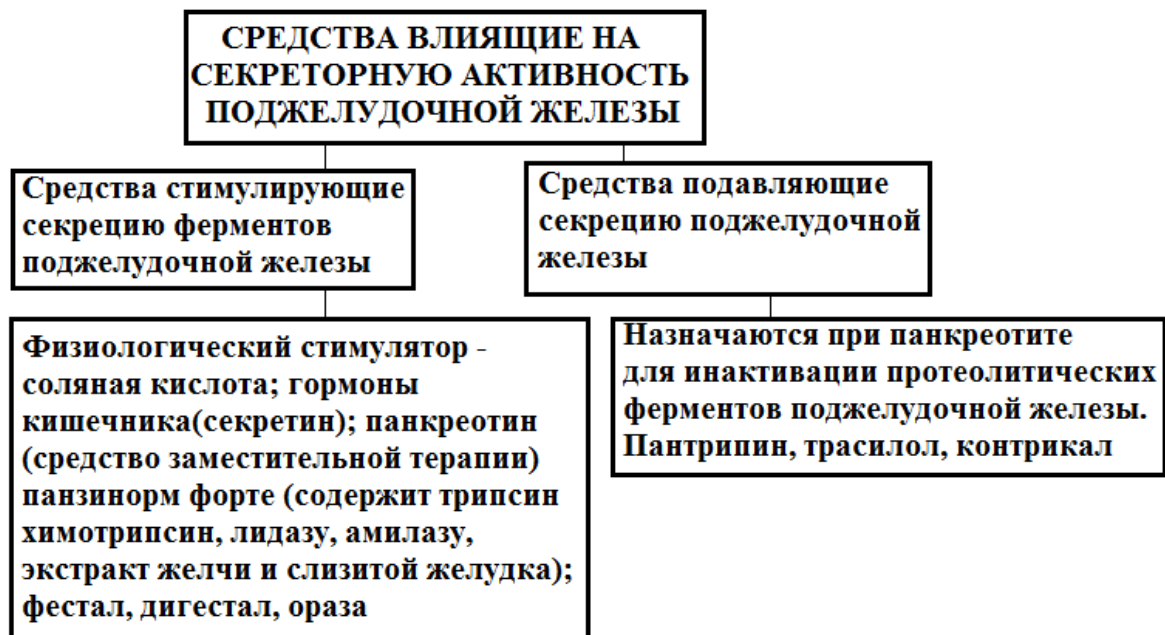
Противорвотными свойствами обладает также ряд препаратов – антагонистов серотониновых рецепторов (трописетрон, ондасетрон). Эти лекарственные средства блокируют возникновение рвотного рефлекса, проявляя антагонистическое действие в отношении серотониновых 5-НТ<sub>3</sub>-рецепторов, локализованных на нейронах периферической нервной системы, при этом не снижает психомоторной активности пациента и не вызывает седативного (успокаивающего) эффекта.

### Средства влияющие на секреторную функцию поджелудочной железы

В пищеварительном процессе, проходящем в тонком кишечнике особо важное значение имеет поджелудочная железа и выделяемые ею ферменты (трипсин, липаза, амилаза), кроме того, важную функцию в пищеварении играет желчь, вырабатываемая в печени. Поэтому, важную роль в нормализации работы желудочно-кишечного тракта играют лекарственные препараты, влияющие на секреторную активность поджелудочной железы и печени.

Лекарственные средства, влияющие на секреторную активность поджелудочной железы, делят на две группы:

1. Средства стимулирующие секрецию ферментов поджелудочной железы;
2. Средства подавляющие секрецию поджелудочной железы;



### Средства стимулирующие активность поджелудочной железы

Физиологическим стимулятором секреторной активности поджелудочной железы является соляная кислота желудочного сока. Попадающая вместе с пищей из желудка в тонкий кишечник соляная кислота способствует рефлекторному усилению секреторной активности поджелудочной железы. Поэтому, назначение больному лекарственных препаратов содержащих соляную кислоту (разведенная соляная кислота, натуральный желудочный сок и пр.) способствует усилению секреторной функции поджелудочной железы.

В случае недостаточной функциональной способности поджелудочной железы применяются средства заместительной терапии. В качестве средства заместительной терапии применяется лекарственный препарат **панкреатин** (содержит амилазу и трипсин), изготовленный из поджелудочных желез животных. Панкреатин рекомендуется принимать перед едой, запивая щелочным питьем (раствором натрия гидрокарбоната).

В настоящее время в медицине ряд применяется ругих лекарственных препаратов заместительной терапии, таких как: панзинорм форте, фестал, трифермент, мезим форте, дигестал, ораза. Эти препараты содержат основные действующие ферменты поджелудочной железы и желчи. Так, в состав препарата панзинорм форте входят: трипсин, химотрипсин, амилаза, липаза, а также экстракты слизистой оболочки желудка и желчи, что способствует улучшению процесса пищеварения.

### **Средства подавляющие секрецию поджелудочной железы**

К средствам подавляющим секрецию поджелудочной железы (антиферменные препараты) относятся: контрикал, пантрипин, трасилол и пр. Данные препараты способны инактивировать ферменты поджелудочной железы, в первую очередь – трипсина.

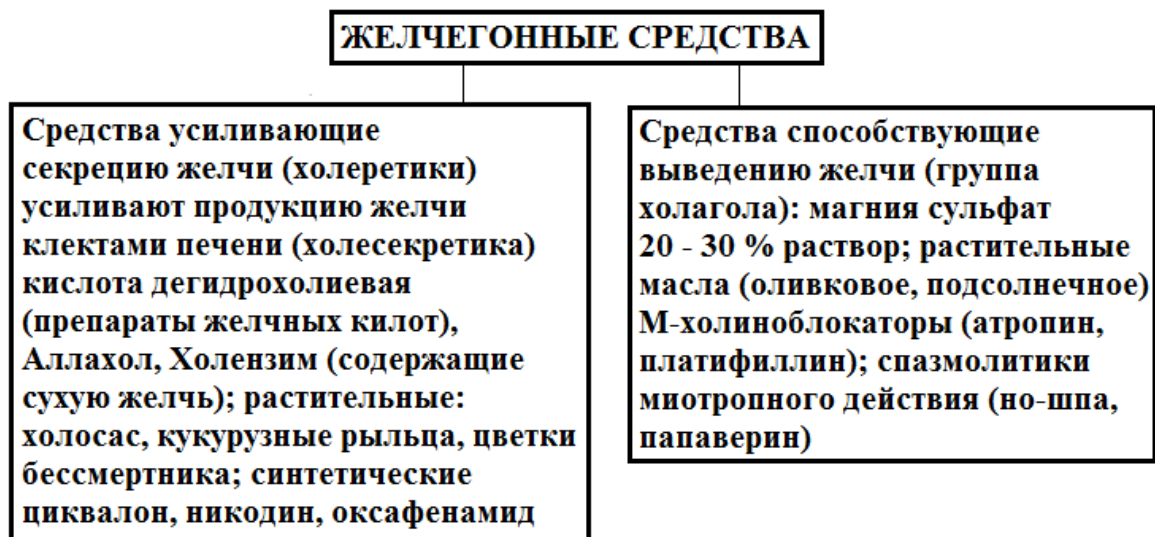
Средства, подавляющие секреторную активность поджелудочной железы применяются при остром панкреатите, при котором активация ферментов поджелудочной железы происходит не в кишечнике, а в ней самой. Вследствие чего происходит «переваривание» (разрушение целостности) поджелудочной железы, что может привести, в том числе, к смерти больного.

### **Желчегонные средства**

Вырабатываемая в печени желчь играет важную роль в процессе переваривания пищи в тонком кишечнике, особенно жиров, кроме того желчь стимулирует перистальтику кишечника. Выделение желчи нарушается при заболеваниях печени, желчного пузыря (холецистит) и желчных протоков (холангит), перекрытия желчных протоков в результате развития желчнокаменной болезни. При этом вырабатываемая желчь проникает в кровь, вызывая желтуху, а недостаток желчи в кишечнике приводит к нарушению процесса пищеварения. При спазмах желчных протоков или их закупорке возникают резкие боли в области правого подреберья.

По механизму действия желчегонные средства делят на две группы:

1. Средства, усиливающие продукцию желчи – группа холесекретика (холеретики);
2. Средства, способствующие выведению желчи в кишечник – группа холагола;



Холеретики способствуют усилению продуцирования желчи клетками печени. К этой группе относятся препараты желчных кислоты (дегидрохолиевая кислота), содержащие сухую желчь лекарственные препараты «Холензим», «Аллохол»,

лекарственные препараты растительного происхождения: холосас, цветки бессмертника, кукурузные рыльца, а также синтетические препараты никотин, циквалон, оксафенамид.

К препаратам группы холагола относятся: 20 – 30% раствор магния сульфата, который вводят через зонд непосредственно в двенадцатиперстную кишку.

Способностью вызывать расслабление желчных протоков (сфинктера Одди) обладают препараты группы спазмолитиков миотропного действия (но-шпа, папаверин) и м-холиноблокаторов (папаверин, платифиллин). Данные препараты эффективны для снятия спазмов желчных протоков, выделению желчи в кишечник.

Эффективными средствами, способствующими улучшению выведения желчи в кишечник являются растительные масла: подсолнечное, оливковое, а также препараты холагол, энатин, олиметин.

Так, энатин усиливает перистальтику и диурез, способствует отхождению мелких конкрементов (камней) при мочекаменной и желчнокаменной болезни.

Холагол – применяется в качестве желчегонного и спазмолитического (сняющее спазмы) средства при гепатохолециститах (сочетанном воспалении ткани печени и желчных протоков) и холециститах (воспалении желчного пузыря) и желчнокаменной болезни.

Олиметин - оказывает мочегонное, противовоспалительное, спазмолитическое (сняющее спазмы), желчегонное действие.

### Гепатопротекторные средства

Гепатопротекторные средства – повышают защитные свойства печени, повышают ее устойчивость к различного рода заболеваниям и повреждениям, а также усиливающие обезвреживающую функцию печени, путем повышения активности ее ферментных систем.

#### ГЕПАТОПРОТЕКТОРНЫЕ СРЕДСТВА

Лекарственные средства повышающие устойчивость печени к различным патологическим влияниям, усиливающие обезвреживающую функцию повышением активности ферментной системы

Легалон, силибор (содержат флавоноиды из расторопши пятнистой); эссенциале, лиф 52, холин, аргенин (применяются при циррозе, дистрофии)

Гепатопротекторными свойствами обладают **витамины, антиоксиданты** (антиокислители, природные или синтетические вещества, способные замедлять окисление. Наиболее известные антиоксиданты: аскорбиновая кислота (витамин С), токоферол (витамин Е), β-каротин(провитамин А) и пр); **антигипоксанты** (группа лекарственных средств, улучшающих утилизацию циркулирующего в организме кислорода и повышающих устойчивость к гипоксии (кислородной недостаточности)).

В качестве специальных гепатопротекторных средств применяют такие препараты, как: легалон, эссенциале, лив 52, силибор, катерген и пр.. Многие из этих лекарственных препаратов – растительного происхождения. Так лекарственные препараты легалон и силибор содержат сумму флавоноидов из растения расторопши.

Комплексный лекарственный препарат Лив 52 (таблетки) содержит – порошок цикория обыкновенного (*Cichorium intybus*), каперсов колючих (*Capparis spinosa*), паслена



черного (*Solanum nigrum*), терминалии арджуна (*Terminalia arjuna*), кассии западной (*Cassia occidentalis*), тысячелистника обыкновенного (*Achillea millefolium*), тамариска гальского (*Tamarix gallica*), железа оксида.

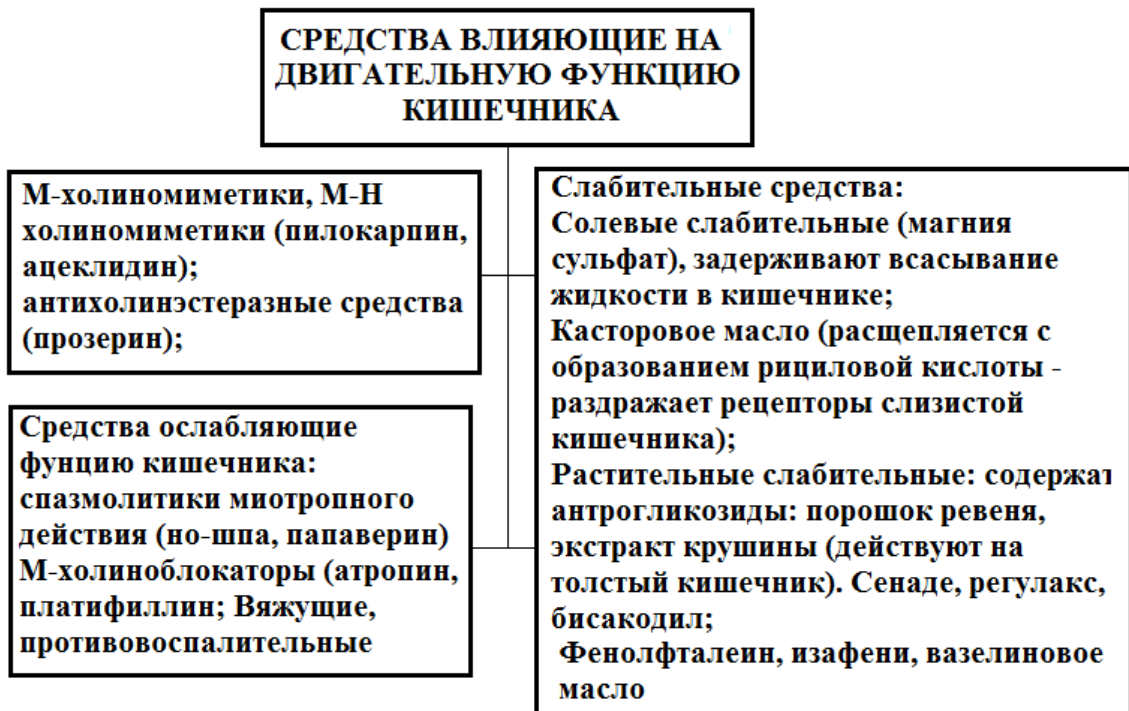
Гепатопротекторные средства также применяются при токсическом поражении и циррозе печени, способствуя восстановлению нормальному течению метаболических процессов.

### Средства влияющие на двигательную функцию кишечника

Средства влияющие на двигательную функцию кишечника условно делить на две группы:

1. Средства усиливающие двигательную функцию кишечника;
2. Средства ослабляющие двигательную функцию кишечника;

Среди средств, усиливающих двигательной функции кишечника выделяют лекарственные средства, повышающие тонус гладких мышц, применяемые при атонии кишечника, возникающей, например, после проведения хирургических операций. К ним относятся средства из группы м-холиномиметиков, м,н-холиномиметиков, антихолинэстеразные средства (рассмотренные в соответствующих разделах).



Для усиления перистальтики при запорах, быстрого удаления токсических веществ при отравлениях, применяют **слабительные средства**.

### Слабительные средства

Действие слабительных средств основано на нарушении всасываемости жидкости из кишечника (солевые слабительные) или раздражении рецепторов слизистой оболочки кишечника (растительные слабительные средства), что приводит к усилению перистальтики кишечника.

Солевые слабительные (15 – 20 г магния или натрия сульфата, разведенных в стакане теплой воды) препятствуют всасыванию жидкости, вследствие чего значительно увеличивается объем жидкости в кишечнике и раздражение его рецепторов. Слабительный эффект наступает достаточно быстро, через 2 - 4 часа.

Касторовое масло, назначают внутрь по 15- 30 г. Вызывает слабительный эффект через 3 – 6 часов. Касторовое масло расщепляется в кишечнике с образованием рицинолевой кислоты, которые действуют раздражающе на рецепторы слизистой оболочки кишечника, усиливая его перистальтику. Касторовое масло, в отличие от солевых слабительных, не препятствует всасыванию жидкости из кишечника, вследствие чего не применяется при отравлениях. Применяется в основном в детской практике, а также для рефлекторной стимуляции родовой деятельности (40 – 50 г).

Растительные слабительные, наиболее часто применяются при хронических запорах. К ним относятся: экстракт крушины, корень ревеня, а также другие лекарственные средства, содержащие экстракты из этих растений. В состав слабительных средств растительного происхождения входят антрагликозиды. Антрагликозиды всасываются в тонком биотрансформируясь в эмодин, который выделяется в толстом кишечнике оказывая раздражающее действие на его рецепторы, вследствие чего слабительный эффект проявляется достаточно медленно, через 8 – 10 часов после приема и выражен умеренно.

К лекарственным слабительным средствам относятся также такие препараты как: сеннаде, сеннадексин, регулакс (содержат экстракты листьев и плодов сены) , бисакодил и пр. Все перечисленные препараты оказывают воздействие на рецепторы толстого кишечника. Бисакодил проявляет слабительный эффект за счет увеличения секреции слизи в толстом кишечнике, и как следствие ускорения и усиления его перистальтики.

### **Средства ослабляющие двигательную функцию кишечника**

К этой группе лекарственных средств относятся спазмолитики миотропного действия (но-шпа, папаверин), м-холиноблокаторы (атропин, платифиллин, препараты красавки (беладонны)). Перечисленные лекарственные средства рассмотрены ранее в соответствующих разделах. Препараты перечисленных групп применяются при спазмах гладкой мускулатуры кишечника, которые сопровождаются сильными болями (кишечные колики).

При необходимости ослабить перистальтику кишечника (при острой и хронической диарее) применяют лекарственные средства снижающие тонус и моторику кишечника. Так, лекарственное средство лоперамид (имодиум) снижает тонус и моторику кишечника за счет ингибирования (подавления) высвобождения ацетилхолина и простагландинов, повышает тонус анального сфинктера (круговой мышцы, сжимающей заднепроходное отверстие).

В качестве противодиарейного средства могут применяться также вяжущие, противовоспалительные и противомикробные средства.

## **Краткая характеристика лекарственных препаратов**

### **Настойка полыни горькой (Tinctura Absinthii)**

**Групповая принадлежность:** Стимулятор аппетита.

**Фармакологические свойства** Препарат растительного происхождения; обладает желчегонным и сокогонным действием (стимулирует продукцию HCl в желудке). Повышает аппетит.

**Показания к применению:** Применяется для повышения аппетита и улучшения функции органов ЖКТ: гипо- и анацидный гастрит; хронический холецистит; дискинезия желчевыводящих путей.

**Способ применения:** Внутрь, 3 раза в сутки, за 15-20 мин до еды. Курс лечения - 20-25 дней. Настойка - по 15-20 кап, настоей - по 30-45 мл.

**Форма выпуска:** настойка травы полыни (1:5) на 70% спирте; в стеклянных флаконах по 25 мл.

### **Масло касторовое ( Oleum Ricini)**

**Групповая принадлежность:** Слабительное средство

**Фармакологическое действие** касторовое масло – это контактное слабительное средство, которое при попадании в кишечник расщепляется липазой с образованием рицинолевой кислоты. В свою очередь рицинолевая кислота раздражает рецепторы кишечника, нарушает транспорт электролитов, происходит задержка воды, вследствие чего усиливается перистальтика. Остаточное масло облегчает продвижение

каловых масс по кишечнику. Обычно, слабительный эффект наступает после 5-6 часов после применения препарата. После испражнения перистальтика ослабляется и возможен запор.

**Показания к применению:** касторовое масло показано при острых запорах разной этиологии, при отравлениях (исключение составляет отравление жирорастворимыми веществами), при пищевых токсических инфекциях, а также в качестве средства для очищения кишечника перед диагностическими процедурами.

**Способ применения:** касторовое масло принимают в качестве слабительного средства по 15-30 грамм внутрь. В зависимости от возраста, дети принимают касторовое масло по 5, 10 или 15 грамм. Касторовое масло применяется и для очищения кишечника перед некоторыми диагностическими процедурами. Для этих целей касторовое масло принимается за 2-6 часов перед диагностикой.

**Форма выпуска:** В стеклянных флаконах по 100 мл

### **Фепранон (Pherganone)**

**Групповая принадлежность:** Анорексигенное (угнетающее аппетит) средство

**Фармакологическое действие:** Препарат обладает анорексигенной (угнетающей аппетит) активностью. Активное вещество Фепранона оказывает на организм психостимулирующее воздействие. Механизм действия лекарства основан на угнетении центра голода и возбуждении центра насыщения. Фепранон (по отзывам медицинских специалистов), стимулируя кору головного мозга, периферическую адреностимулирующую активность практически не оказывает.

**Показанием к применению:** фепранона является главным образом алиментарное ожирение (ожирение, связанное с переданием); он также может применяться при адипозогенитальной дистрофии (ожирении, связанном с нарушением обмена веществ) - в сочетании с гормональной терапией, при гипотиреозе (заболевании щитовидной железы) - в сочетании с тиреоидином и других формах ожирения. Лечение проводят в сочетании с малокалорийной диетой, при необходимости - с разгрузочными днями.

**Способ применения:** Назначают внутрь в виде таблеток по 0,025 г (25 мг) 2-3 раза в день за полчаса или час до еды (завтрака и обеда). При хорошей переносимости и недостаточном эффекте можно увеличить дозу до 4 таблеток в день. Курс лечения - 1,5-2,5 мес. При необходимости проводят повторные курсы с перерывами 3 мес.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,025 г (25 мг) в упаковке по 50 штук

**Дезопимон. Desopimone.**

**Групповая принадлежность:** Анорексигенное (угнетающее аппетит) средство

**Действие лекарства.** Подобно фепранону дезопимон оказывает анорексигенное действие (снижает аппетит), почти не возбуждает центральную нервную систему и в малой степени повышает артериальное давление, стимулирует мобилизацию жира из жировых депо.

**Показания к применению.** Алиментарное ожирение, адипозогенитальная дистрофия (в комбинации с гормональными препаратами) и другие формы ожирения (в сочетании с диетотерапией, физкультурой и т. д.).

**Применение и дозы препарата.** Внутрь по 0,025 г 2—3 раза в день во время еды (в сочетании с малокалорийной диетой).

**Форма выпуска лекарства.** Таблетки по 0,025 г

### **Мазиндол (Mazindol)**

**Групповая принадлежность:** Анорексигенное (угнетающее аппетит) средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает анорексигенное (угнетающее аппетит) действие. Облегчает соблюдение низкокалорийной диеты. Основными факторами в механизме анорексигенного действия мазиндола являются повышение активности центра насыщения в гипоталамусе (отделе мозга) и снижение стимулов к потребности в пище, что связано с влиянием препарата на адренергические системы мозга.

**Показания к применению:** Применяют в комплексной терапии ожирения у взрослых и детей старше 12 лет. **Способ применения:** Назначают внутрь во время еды вначале по 1/1 таблетки (0,5 мг) в день (в первые 4-5 дней), потом по 1 таблетке 1 или 2 раза в день (во время завтрака и обеда). Максимальная суточная доза - 3 таблетки. Курс лечения продолжается обычно от 4 до 12 нед.

**Форма выпуска:** Таблетки по 1 мг в упаковке по 20 и 100 штук.

### **Омепразол (Omeprazole)**

**Групповая принадлежность:** Протонового насоса ингибитор.

**Фармакологическое действие:** Подавляет секрецию соляной кислоты в желудке, являясь ингибитором (подавляет функцию) "протонового насоса" (процесса обмена ионов водорода). Механизм антисекреторного действия связан с ингибированием (подавлением активности) фермента Н<sup>+</sup>-К<sup>+</sup>-АТФазы (фермента, ускоряющего обмен ионов водорода) в мембранах клеток слизистой желудка, что приводит к блокированию конечной стадии образования соляной кислоты. В результате этого снижается уровень базальной (собственной) и стимулированной секреции (выделения пищеварительных соков), независимо от природы

раздражителя. Действие препарата наступает быстро и зависит от дозы. После однократного приема 0,02 г омепразола эффект длится в течение 24 час.

**Показания к применению:** Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, пептическая язва (язва желудка, кишки или пищевода, развившаяся вследствие разрушающего действия желудочного сока на слизистую), вызванная *Helicobacter pylori* (микроорганизмами, которые при определенных условиях могут вызвать гастрит или рецидивирующую /периодически повторяющуюся/ язву желудка), рефлюксэзофагит (воспаление пищевода, обусловленное забрасыванием желудочного содержимого в пищевод), синдром Золлингера-Эллисона (сочетание язвы желудка и доброкачественной опухоли поджелудочной железы).

**Способ применения:** При обострении язвенной болезни и рефлюкс-эзофагите назначают препарат в дозе 0,02 г однократно утром (перед завтраком). Капсулы следует проглатывать целиком, запивая небольшим количеством жидкости. Продолжительность лечения при язвенной болезни двенадцатиперстной кишки составляет, как правило, 2 недели. У тех пациентов, у которых не произошло полного заживления после 2-х-недельного курса, заживление обычно происходит в течение следующего 2-х-недельного периода лечения. Больным с плохой заживляемостью язвы двенадцатиперстной кишки рекомендуется назначать омепразол в дозе 0,04 г 1 раз в сутки, что позволяет достичь заживления в течение 4 недель. Продолжительность лечения при язвенной болезни желудка составляет обычно 4 недели.

**Форма выпуска:** Капсулы по 0,01 г.

### **Ондансетрон (Ondansetron)**

**Групповая принадлежность:** Противорвотное средство-серотониновых рецепторов антагонист.

**Фармакологическое действие:** Противорвотное средство. ЛС для цитостатической химиотерапии и радиотерапии могут вызывать повышение уровня серотонина, который путем активации вагусных афферентных волокон, содержащих 5-НТЗ-рецепторы, вызывает рвотный рефлекс. Селективно блокирует серотониновые 5-НТЗ-рецепторы нейронов центральной и периферической нервной системы - окончания *n. vagus* в кишечнике и в центрах ЦНС (преимущественно дно VI желудочка), регулирующих осуществление рвотных рефлексов. Не нарушает координации движений, не вызывает седативного эффекта и снижения работоспособности. Обладает анксиолитической активностью. Не изменяет концентрацию пролактина в плазме.

**Показания к применению:** Тошнота и рвота, вызванные проведением цитотоксичной химио- или радиотерапии; послеоперационная тошнота и рвота - профилактика и лечение.

**Способ применения:** Лечение цитостатическими препаратами с риском развития рвоты и лучевая терапия: 8 мг препарата в виде внутривенной инъекции непосредственно до лечения или в виде таблетки перорально (через рот) за 1-2 ч до проведения лечения, с последующим применением ондансетрона с интервалом в 12 ч. Для обеспечения защиты от рвоты в течение первых последующих 24 ч необходимо продолжить дальнейший прием препарата в таблетках в дозе 8 мг 2 раза в сутки в течение 5 дней с момента начала лечения. Лечение цитостатическими препаратами с высоким риском развития рвоты. В течение первых 24 ч после начала химиотерапии: однократная доза 8 мг в виде медленной внутривенной инъекции непосредственно перед проведением химиотерапии;- доза 8 мг в виде медленной внутривенной инъекции непосредственно перед проведением курса химиотерапии, с последующими двумя внутривенными инъекциями в дозе 8 мг с интервалом 4 ч или постоянная внутривенная инфузия в течение 24 ч в дозе 1 мг/ч; - однократная доза 32 мг ондансетрона, разведенная в объеме 50-100 мл изотонического раствора хлорида натрия и вводимая внутривенно за 15 мин до начала химиотерапии. Доза препарата устанавливается индивидуально и зависит от степени выраженности эметогенного (рвотного) эффекта у данного пациента. Для предупреждения последующих приступов рвоты рекомендуется применять препарат в виде таблеток в дозе 8 мг 2 раза в сутки в течение 5 дней после начала химиотерапии.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,004 и 0,008 г ондансетрона дигидрата гидрохлорида в упаковке по 10 штук; раствор для инъекций в ампулах по 2 и 4 мл (в 1 мл 0,002 г активного вещества) в упаковке по 5 штук

### **Апоморфина гидрохлорид *Apomorphinum hydrochloridum*.**

**Групповая принадлежность:** Рвотное средство

**Фармакологическое действие:** Стимулирует хеморецепторы пусковой (триггерной) зоны продолговатого мозга, в результате чего возбуждается рвотный центр. Рвота наступает через 10—15 мин после подкожного введения и обычно бывает 2—3-кратной. Внутрь принимают в повышенных дозах. Перед рвотой наблюдается тошнота, усиливается выделение слюны и бронхиального секрета. Такие же явления возникают после введения в малых дозах. При угнетенном состоянии рвотного центра во время наркоза, приеме снотворных, алкоголя в больших дозах рвотное действие не проявляется.

**Показания к применению:** При отравлениях для удаления из желудка ядовитых веществ, главным образом при невозможности промывания желудка; при остром отравлении алкоголем; для выработки условнорефлекторной реакции отвращения к алкоголю при лечении больных хроническим алкоголизмом; внутрь в качестве отхаркивающего средства (редко).

**Способ применения:** Назначают подкожно по 0,2—0,5 мл 1 % раствора; для лечения хронического алкоголизма применяют по специальным схемам \*. Внутрь — по 0,001—0,005 г в микстуре 2—3 раза в день. Высшие дозы подкожно: разовая — 0,005 г, суточная — 0,01 г; внутрь: разовая — 0,01, суточная — 0,03 г.

**Форма выпуска.** Порошок, ампулы по 1 мл 1 % раствора.

### **Мизопростол (Misoprostol)**

**Групповая принадлежность:** Стимулятор родовой деятельности - синтетический аналог простагландина E1

**Фармакологическое действие:** Синтетический аналог простагландина E. Обладает антисекреторной активностью. При приеме внутрь (в виде таблеток) уменьшает секрецию (выделение) соляной кислоты, стимулирует секрецию бикарбоната и слизи, оказывает цитопротекторное (защитающее клетки) действие. Действие развивается обычно через 30 мин после приема и продолжается около 3 ч.

**Показания к применению:** Применяют главным образом для предупреждения язвенного (вызывающего язву) действия нестероидных противовоспалительных препаратов, включая ацетилсалициловую кислоту. Принимают одновременно с противовоспалительными препаратами в течение всего времени их приема.

**Способ применения:** Назначают взрослым по 0,2 мг (200 мкг) 3-4 раза в день во время еды. Последнюю дозу принимают незадолго до сна. В случае плохой переносимости уменьшают разовую дозу до 0,1 мг (100 мкг). Детям до 18 лет препарат не назначают.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,2 мг (200 мкг) в упаковке по 100 штук.

### **Фамотидин (Famotidine)**

**Групповая принадлежность:** Антагонист гистаминовых H<sub>2</sub>-рецепторов

**Фармакологическое действие:** Ингибирует (подавляет) секрецию (выделение) соляной кислоты, как базальную (собственную), так и после стимуляции гистамином, гастрином или ацетилхолином. Снижает активность пепсина (фермента, расщепляющего белки). Начало эффекта отмечается через 1 ч после однократного приема препарата. Продолжительность действия зависит от дозы и составляет от 12 до 24 ч.

**Показания к применению:** Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, рефлюксэзофагит (воспаление пищевода, обусловленное забрасыванием желудочного содержимого в пищевод), синдром Золлингера-Эллисона (сочетание язвы желудка и доброкачественной опухоли поджелудочной железы), профилактика развития язв желудка и двенадцатиперстной кишки при длительном лечении глюкокортикостероидами (гормонами коры надпочечников или их синтетическими аналогами) или нестероидными противовоспалительными средствами.

**Способ применения:** Дозы препарата подбирают индивидуально. Обычно при обострении язвенной болезни желудка или двенадцатиперстной кишки препарат назначают в дозе 0,04 г 1 раз в сутки перед сном или по 0,02 г 2 раза в сутки утром и вечером. Продолжительность лечения составляет 4-8 недель. В случае заживления язвенного дефекта прием препарата прекращают постепенно. Для профилактики обострений язвенной болезни фамотидин назначают в дозе 0,02 г 1 раз в сутки перед сном. Отмена препарата должна осуществляться постепенно. В случае комбинации препарата с невсасывающимися антацидами (лекарственными средствами, снижающими кислотность желудка) необходимо соблюдать интервал 1-2 ч между их приемом.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,02 г в упаковке по 20 штук; таблетки по 0,04 г в упаковке по 10 штук.

### **Панзинорм форте (Panzinorm forte)**

**Групповая принадлежность:** Пищеварительное ферментное средство.

**Фармакологическое действие:** Заменяет ферменты желудка и поджелудочной железы и стимулирует их выделение.

**Показания к применению:** Нарушение пищеварения различного происхождения, гипофункция (пониженная функция) поджелудочной железы, атрофический гастрит (воспаление желудка с истончением слизистой оболочки), гастродуоденит (воспаление желудка и двенадцатиперстной кишки), гепатит (воспаление ткани печени), холецистит (воспаление желчного пузыря), после операций на желудочно-кишечном тракте, поджелудочной железе и печени.

**Способ применения:** Внутрь по 1 таблетке во время еды 3 раза в день.

**Форма выпуска:** Таблетки в упаковке по 30 штук. Состав 1 таблетки: экстракта слизистой оболочки желудка - 200 мг (соответствует 200 мг пепсина), сухого экстракта желчи рогатого скота - 30 мг, панкреатина - 200 мг. Наружная оболочка таблетки содержит экстракт слизистой оболочки желудка, который освобождается в желудке; ядро таблетки, содержащее панкреатин и желчь, распадается в двенадцатиперстной кишке.

### **Платифиллин (Platyphyllin)**

**Групповая принадлежность:** М-холиноблокатор.

**Фармакологическое действие:** Блокирует м-холинорецепторы и оказывает прямое релаксирующее влияние на гладкие мышцы. Расширяет сосуды, понижает тонус гладкой мускулатуры желчных протоков и желчного пузыря, бронхов, вызывает миодриаз.

**Показания к применению:** Спазм гладкой мускулатуры внутренних органов, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, бронхиальная астма, гипертензия.

**Способ применения:** Для курсового лечения — внутрь, до еды по 0,003–0,005 г (детям 0,0002–0,003 г) 2–3 раза в день в течение — 15–20 дней. Высшие дозы: разовая 0,01 г, суточная 0,03 г.

**Форма выпуска:** Таблетки 5 мг; упаковка контурная ячейковая 10 пачка картонная 1; таблетки 5 мг; упаковка контурная ячейковая 10 пачка картонная 2; таблетки 5 мг; упаковка контурная ячейковая 10 пачка картонная 3;

### **Метоклопрамид (Metoclopramidum)**

**Групповая принадлежность:** Противорвотное средство-дофаминовых рецепторов антагонист центральный  
**Фармакологическое действие:** Метоклопрамид является специфическим блокатором дофаминовых рецепторов, а также серотониновых рецепторов. Препарат оказывает противорвотное действие, успокаивает икоту и, кроме того, оказывает регулирующее влияние на функции желудочно-кишечного тракта. Тонус и двигательная активность органов пищеварения усиливается. Секреция желудка не меняется. Имеются указания, что препарат способствует заживлению язв желудка и двенадцатиперстной кишки.

**Показания к применению:** Метоклопрамид применяют в качестве противорвотного средства при тошноте, рвоте, связанных с наркозом, лучевой терапией, побочным действием лекарств (препаратов наперстянки, цитостатиков /веществ, подавляющих деление клеток/, антибиотиков и др.), нарушениями диеты и др. На рвоту вестибулярного генеза (вызванную укачиванием) он не действует. В гастроэнтерологической практике препарат применяют также в комплексном лечении язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гастритов, дискинезий (нарушения подвижности) органов брюшной полости, послеоперационных парезов (уменьшения силы и/или амплитуды движений) кишечника, при метеоризме (скоплении газов) и других заболеваниях. Лечебный эффект связан с повышением тонуса желудка и кишечника, ускорением опорожнения желудка и привратника (суженой части желудка в месте его перехода в двенадцатиперстную кишку), уменьшением гиперацидного стаза (остановки движения пищи в желудке вследствие за кислнения).

**Способ применения:** Применяют Метоклопрамид внутрь, а в тяжелых случаях парентерально (внутримышечно или внутривенно). Внутрь дают взрослым обычно по 10 мг (1 таблетка) 3 раза в день (до еды). Внутримышечно (или внутривенно) вводят по 1 ампуле (2 мл = 10 мг препарата) 1-3 раза в день. Детям назначают в меньших дозах в соответствии с возрастом (детям старше 6 лет по 1/2-1 таблетке 3 раза в день). Таблетки проглатывают, не разжевывая, запивая небольшим количеством воды. Для рентгенологического исследования вводят взрослым по 1-2 ампулы (10-20 мг) внутривенно или дают внутрь (за 5-15 мин до начала исследования) 15-30 мг.

**Форма выпуска:** Таблетки по 10 мг в упаковке по 50 штук; в ампулах по 2 мл (10 мг в ампуле) в упаковке по 10 штук.

### **Этаперазин (Перфеназин) (Perphenazine)**

**Групповая принадлежность:** Антипсихотическое средство (нейролептик).

**Фармакологическое действие:** Антипсихотическое средство (нейролептик), производное фенотиазина; оказывает седативное, противоаллергическое, слабое антихолинергическое, противорвотное, миорелаксирующее, слабое гипотензивное и гипотермическое действие, устраняет икоту. Антипсихотическое действие обусловлено блокадой дофаминовых D2-рецепторов мезолимбической и мезокортикальной системы. Ингибирование дофаминовых рецепторов в нигростриарной зоне и тубулоинфундибулярной области может обуславливать экстрапирамидные расстройства и гиперпролактинемия.

**Показания:** Психические и эмоциональные расстройства; премедикация, **тошнота, неукротимая рвота** (различного генеза, в т.ч. при лучевой и химиотерапии злокачественных новообразований), икота, кожный зуд, хронический алкоголизм; для повышения эффективности анальгезирующей терапии, шизофрения (комплексное лечение), экзогенно-органические и инволюционные психозы, психопатия, неврозы (страх, напряжение).

**Способ применения:** Внутрь, после еды. Психотические расстройства: взрослым и подросткам старше 12 лет, ранее не лечившимся антипсихотическими ЛС, начальная доза составляет 4-16 мг 2-4 раза в день. Больным с хроническим течением заболевания при необходимости дозу увеличивают до 64 мг/сут. Длительность лечения - 1-4 мес и более. В качестве противорвотного ЛС, а также при неврозах назначают по 4-8 мг 3-4 раза в день (максимальная доза - 24 мг/сут). Пациентам пожилого возраста, истощенным и ослабленным больным обычно требуется меньшая начальная доза.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,004 г, 0,006 г и 0,01 г

### **Панкреатин (Pancreatinum)**

**Групповая принадлежность:** Пищеварительное ферментное средство

**Фармакологическое действие:** Входящие в состав препарата панкреатические ферменты (ферменты поджелудочной железы) - амилаза, липаза и протеаза облегчают переваривание углеводов, жиров и белков, что способствует их более полному всасыванию в тонком кишечнике. При заболеваниях поджелудочной железы препарат компенсирует недостаточность ее секреторной функции (выделения пищеварительного сока) и способствует улучшению процесса пищеварения

**Показания к применению:** Недостаточность секреторной функции поджелудочной железы (хронический панкреатит - воспаление поджелудочной железы, муковисцидоз - наследственное заболевание, характеризующееся закупоркой выходных протоков поджелудочной железы, желез дыхательных путей и кишечника, вязким секретом и пр.). Хронические воспалительно-дистрофические заболевания желудка, кишечника, печени, желчного пузыря; состояния после резекции (удаления части органа) или облучения этих органов, сопровождающиеся нарушениями переваривания пищи, метеоризмом (скоплением газов в кишечнике), диареей (поносом) - в составе комбинированной терапии. Состояние после панкреатэктомии (удаления поджелудочной железы). Обструкция (нарушение проходимости) протоков поджелудочной железы или желчных путей. Для улучшения переваривания пищи у пациентов с нормальной функцией желудочно-кишечного тракта в случае нарушения диеты, а также при нарушениях жевательной функции, вынужденной длительной иммобилизации (обездвиживании), малоподвижном образе жизни.

**Способ применения:** Доза препарата (в пересчете на липазу) зависит от возраста и степени недостаточности поджелудочной железы. Средняя доза для взрослых - 150 000 ЕД/сут. При полной недостаточности секреторной функции поджелудочной железы - 400 000 ЕД/сут., что соответствует суточной потребности взрослого человека в липазе. Максимальная суточная доза - 15 000-20 000 ЕД/кг массы тела. Детям в возрасте до 1,5 лет назначают 50 000 ЕД/сут.; старше 1,5 лет - 100 000 ЕД/сут. При муковисцидозе дозу препарата подбирают индивидуально. Таблетки, капсулы или драже принимают во время еды, проглатывают целиком, запивая большим количеством нещелочной жидкости (вода, фруктовые соки). Продолжительность лечения может варьировать от нескольких дней (при нарушении пищеварения вследствие погрешностей в диете) до нескольких месяцев и даже лет (при необходимости постоянной заместительной терапии).

**Форма выпуска:** Таблетки. Капсулы. Драже. Капсулы желатиновые, содержащие микропланкетки, покрытые кишечнорастворимой оболочкой, содержащие липазу по 10 000, 20 000 или 25 000 ЕД; амилазу по 9000, 18 000 или 22 500 ЕД; протеазу по 500, 1000 или 1250 ЕД.

#### **Пирензепин (Гастрозепин) Pirenzepin**

**Групповая принадлежность:** М-холиноблокатор

**Фармакологическое действие:** Блокатор М1-холинорецепторов. Тормозит секрецию желудочного сока, уменьшает секрецию гастрина, снижает продукцию HCl и пепсина. После стимуляции гистамином блокирует секрецию HCl на 25%; после приема пищи - на 53%; после введения инсулина - на 58%. В 1 ч после приема пищи пирензепин уменьшает выделение HCl на 48% и на 30% - во 2 ч. Секреция пепсина, стимулированная инсулином, снижается на 49%, гистамином - на 34%, гастрином - на 24%. Угнетает выделение гидрокарбоната из эпителия в полость желудка у больных с эрозивным поражением антрального отдела и усиливает защиту слизистой оболочки желудка; увеличивает кровоток в подслизистом слое желудка и кишечника, улучшает микроциркуляцию.

Уменьшает образование соляной кислоты в желудке. Улучшает кровообращение в ЖКТ и тем самым способствует восстановлению слизистой оболочки желудка и 12-перстной кишки.

**Показания к применению:** Острые и хронические (рецидивирующие) формы язвы желудка и 12-перстной кишки, гастрит с повышенной кислотностью (лечение и профилактика); эрозивно-язвенные поражения ЖКТ, в т.ч. вызванные противоревматическими и противовоспалительными ЛС; стрессовые язвы ЖКТ; хронический гиперацидный рефлюкс-эзофагит; синдром Золлингера-Эллисона; кровотечения из эрозий и изъязвлений в верхних отделах ЖКТ.

**Способ применения:** Препарат рекомендуется принимать курсом не менее 4 недель. Обычно гастрозепин принимают по 1-2 таблетки 2 раза в сутки, утром и вечером, за 30 мин до еды, запивая 1/2 стакана (100 мл) воды комнатной температуры.

**Формы выпуска.** Синтетический препарат. Выпускают: 1) таблетки по 0,025 и 0,05 г — в упаковке 50 шт.; 2) порошок по 0,01 г в ампуле — в упаковке 5 ампул с растворителем.

#### **Таблетки "Аэрон" (Tablettae "Aeronum")**

**Групповая принадлежность:** М-холиноблокатор (комбинированный препарат).

**Фармакологическое действие:** Комбинированный препарат, действие которого связано с особенностями фармакологических свойств его компонентов - скополамина и гиосинамина.

**Показания к применению:** Таблетки аэрон применяют для профилактики и лечения морской и воздушной болезни, а также для предотвращения и купирования (снятия приступов болезни Меньера. Иногда их используют для уменьшения слезо- и слюноотделения при пластических операциях на лице и при операциях на верхних дыхательных путях.

**Способ применения:** При воздушной и морской болезни таблетки назначают внутрь: профилактически за 30-60 мин до отъезда принимают 1-2 таблетки, а в дальнейшем, если необходимо, через 6 ч - еще одну таблетку. Если аэрон профилактически не применяли, то при первых ощущениях болезни (тошнота, головокружение, головная боль) принимают 1-2 таблетки, в дальнейшем дают по одной таблетке 2 раза в день. Высшие дозы для взрослых: разовая - 2 таблетки, суточная - 4 таблетки. В редких случаях при упорной рвоте вместо аэрона могут назначаться свечи, содержащие столько камфорнокислого скополамина и

гиосциамина, сколько их содержится в одной таблетке аэрона. При болезни Меньера назначают по 1 таблетке 2-3 раза в день. При хирургических вмешательствах на лице за 20-30 мин до операции назначают сразу 2 таблетки и после операции по 1 таблетке 2 раза в день в первые 2 сут.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,0005 г в упаковке по 10 штук. Состав: скополамина камфорнокислого - 0,0001 г и гиосциамина камфорнокислого - 0,0004 г.

**Ацидин-пепсин (Acidin-pepsinum)**

**Групповая принадлежность:** Пищеварительное ферментное средство.

**Фармакологическое действие:** Комбинированный препарат. Способствует перевариванию пищи в желудке. Показания к применению: При гипо- и ацидных гастритах (воспалении желудка, сопровождающемся снижением уровня или отсутствием соляной кислоты), ахилии (отсутствии выделения в желудке соляной кислоты и ферментов), диспепсии (расстройствах пищеварения).

**Способ применения:** Внутрь во время или после еды в 1/4-1/2 стакана воды по 1-2 таблетки 3-4 раза в день; детям (в зависимости от возраста) от 1/4 таблетки до 1 таблетки 3-4 раза в день

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковке по 50 штук. Состав: пепсина - 1 часть, бетаина гидрохлорида - 4 части.

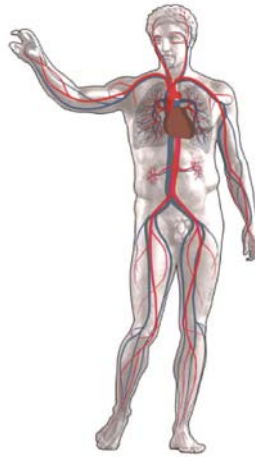
---



## Сердечные гликозиды, негликозидные кардиотоники. Антиаритмические средства.

### Общие сведения о физиологии сердечнососудистой системы

**Сердечнососудистая система** — система органов, которая обеспечивает циркуляцию крови в организме человека и животных. Благодаря циркуляции крови кислород, а также питательные вещества доставляются органам и тканям тела, а углекислый газ, другие продукты метаболизма и отходы жизнедеятельности выводятся из организма.



К сердечно-сосудистой системе относятся **сердце** — орган, который заставляет кровь двигаться, нагнетая её в **кровеносные сосуды** — полые трубки различного калибра, по которым она циркулирует.

Все **функции кровеносной системы строго** согласованы благодаря нервно-рефлекторной регуляции, что позволяет поддерживать гомеостаз в условиях постоянно изменяющихся условий внешней и внутренней среды.

**Кровеносные сосуды** — это **полые трубки**, по которым движется кровь. Сосуды, несущие кровь от сердца к органам называются артериями, а от органов к сердцу — венами. В артериях и венах не осуществляется газообмен и диффузия питательных веществ, это просто путь доставки. По мере удаления кровеносных сосудов от сердца, они становятся мельче.

Среди сосудов кровеносной системы различают **артерии, артериолы, прекапилляры, капилляры, посткапилляры, венулы, вены и артериоло-венозные анастомозы**.

Обмен веществами между кровью и интерстициальной жидкостью происходит через проницаемую стенку капилляров — мелких сосудов, соединяющих артериальную и венозную системы. За одну минуту через стенки всех капилляров человека просачивается около **60 литров жидкости**.

Между артериями и венами находится микроциркуляторное русло, формирующее периферическую часть сердечно-сосудистой системы. **Микроциркуляторное русло** представляет систему мелких сосудов, включающую артериолы, капилляры, венулы, а также артериоловенулярные анастомозы. Именно здесь происходят процессы обмена между кровью и тканями.

Хотя кровь с кислородом и питательными веществами для клеток называется артериальной, а кровь с углекислым газом и продуктами обмена клеток — венозной, совсем не обязательно артериальная кровь течет по артериям, а венозная — по венам. Это зависит от кругов кровообращения.

**Сосудистая система может быть замкнутой** — когда кровь внутри сосудов движется по кругу, **и незамкнутой** — когда просвет сосудов свободно открывается в межклеточное пространство и кровь изливается туда, смешиваясь с межклеточной жидкостью.

Сердечно-сосудистая система человека образует два круга кровообращения: **большой и малый**. Большой круг кровообращения начинается в левом желудочке и оканчивается в правом предсердии, куда впадают полые вены. Малый круг кровообращения начинается в правом желудочке, из которого выходит лёгочный ствол, и оканчивается в левом предсердии, в которое впадают лёгочные вены. Большой круг кровообращения обеспечивает кровью все органы и ткани. Малый круг кровообращения ограничен циркуляцией крови в лёгких, здесь происходит обогащение крови кислородом и выведение углекислого газа.

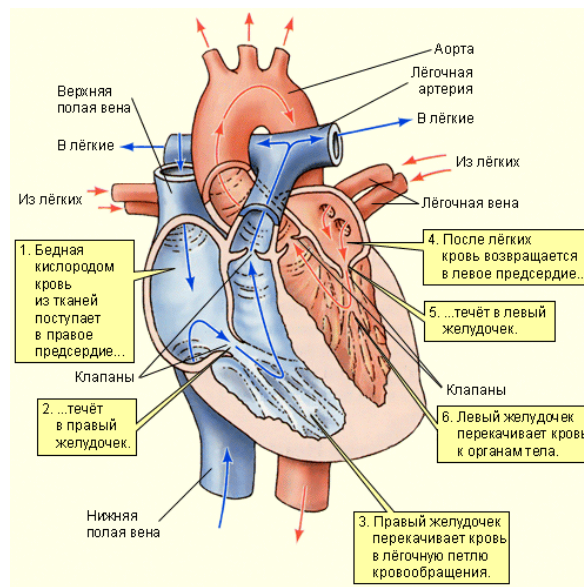
В зависимости от физиологического состояния организма, а также практической целесообразности иногда выделяют дополнительные круги кровообращения: плацентарный — существует у плода, находящегося в матке; сердечный — представляет собой часть большого круга кровообращения виллизиев — артериальное кольцо, образованное артериями бассейна позвоночных и внутренних сонных артерий, расположенное в основании головного мозга, способствует компенсации недостаточности кровоснабжения

### Строение сердца человека

Сердце человека располагается в грудной клетке, ориентировочно в центре с небольшим смещением влево. Представляет собой полый мышечный орган. Снаружи окружено оболочкой — перикардом (околосердечной сумкой). Между сердцем и околосердечной сумкой находится жидкость, увлажняющая сердце и уменьшающая трение при его сокращениях.

Сердце разделено на четыре камеры: две правые — правое предсердие и правый желудочек, и две левые — левое предсердие и левый желудочек. В норме правая и левая половины сердца между собой не сообщаются. При врожденных пороках в межпредсердной и межжелудочковой перегородках могут сохраняться отверстия, через которые кровь попадает из одной половины сердца в другую.

Предсердия и желудочки соединяются между собой отверстиями. По краям отверстий располагаются створчатые клапаны сердца: справа — трехстворчатый (правым предсердием и правым желудочком находится **трехстворчатый клапан**), слева — двустворчатый, или митральный (Левое предсердие от левый желудочек отделяет **двустворчатый клапан**). Двустворчатый и трехстворчатый клапаны обеспечивают ток крови в одном направлении — из предсердий в желудочки. Между левым желудочком и отходящей от него аортой, а также между правым желудочком и отходящей от него легочной артерией тоже имеются клапаны. Из-за формы створок они названы полулунными. Каждый полулунный клапан состоит из трех листков, напоминающих кармашки. Свободным краем кармашки обращены в просвет сосудов. Полулунные клапаны обеспечивают ток крови только в одном направлении — из желудочков в аорту и легочную артерию.



Строение сердца и сердечный цикл

Работа сердца включает две фазы: **сокращение (систола)** и **расслабление (диастола)**. Сердечный цикл состоит из сокращения предсердий, сокращения желудочков и последующего расслабления предсердий и желудочков. Сокращение предсердий длится 0,1 сек, сокращение желудочков - 0,3 сек.

Во время диастолы левое предсердие наполняется кровью, через митральное отверстие кровь перетекает в левый желудочек, во время сокращения левого желудочка кровь выталкивается через аортальный клапан, попадает в аорту и разносится по всем органам. В органах происходит передача кислорода тканям организма, для их питания. Далее кровь по венам собирается в правое предсердие, через трикуспидальный клапан попадает в правый желудочек. Во время систолы желудочков венозная кровь выталкивается в легочную артерию и попадает в сосуды легких. В легких кровь оксигенируется, то есть насыщается кислородом. Насыщенная кислородом кровь через легочные вены собирается в левое предсердие.

Ритмичное, постоянное чередование фаз систолы и диастолы, необходимое для нормальной работы, обеспечивается возникновением и проведением электрического импульса по системе особых клеток – по узлам и волокнам проводящей системы сердца. Импульсы возникают вначале в самом верхнем, так называемом, синусовом узле, который располагается в правом предсердии, далее проходят ко второму, атрио-вентрикулярному узлу, а от него – по более тонким волокнам (ножкам пучка Гиса) – к мышце правого и левого желудочков, вызывая сокращение всей их мускулатуры.

### Основные физиологические свойства сердечной мышцы.

**Возбудимость.** Сердечная мышца менее возбудима, чем скелетная. Реакция сердечной мышцы не зависит от силы наносимых раздражений. Сердечная мышца максимально сокращается и на пороговое и на более сильное по величине раздражение.

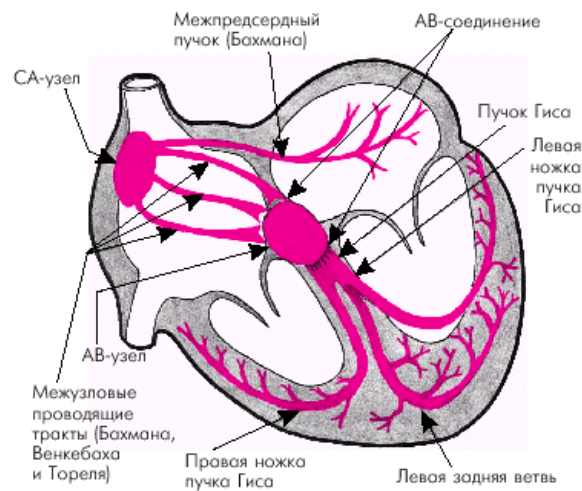
**Проводимость.** Возбуждение по волокнам сердечной мышцы распространяется с меньшей скоростью, чем по волокнам скелетной мышцы. *Возбуждение по волокнам мышц предсердий распространяется со скоростью 0,8-1,0 м/с, по волокнам мышц желудочков – 0,8-0,9 м/с, по проводящей системе сердца – 2,0-4,2 м/с.*

**Сократимость.** Сократимость сердечной мышцы имеет свои особенности. Первыми сокращаются мышцы предсердий, затем – сосочковые мышцы и субэндокардиальный слой мышц желудочков. В дальнейшем сокращение охватывает и внутренний слой желудочков, обеспечивая движение крови из полостей желудочков в аорту и легочный ствол.

К физиологическим особенностям сердечной мышцы относятся удлинённый рефрактерный период и автоматизм

**Рефрактерный период.** Сердце имеет значительно выраженный и удлинённый рефрактерный период. Он характеризуется резким снижением возбудимости ткани в период ее активности. Благодаря выраженному рефрактерному периоду, который длится дольше, чем период систолы (0,1-0,3с), сердечная мышца не способна к тетаническому (длительному) сокращению и совершает свою работу по типу одиночного мышечного сокращения.

**Автоматизм.** Вне организма при определенных условиях сердце способно сокращаться и расслабляться, сохраняя правильный ритм. Следовательно, причина сокращений изолированного сердца лежит в нем самом. Способность сердца ритмически сокращаться под влиянием импульсов, возникающих в нем самом, носит название автоматизма.



Узлы и волокна проводящей системы сердца.

В сердце различают рабочую мускулатуру, представленную поперечнополосатой мышцей, и атипическую, или специальную, ткань, в которой возникает и проводится возбуждение.

У человека атипическая ткань состоит из:

**синусно-предсердного узла**, располагающегося на задней стенке правого предсердия у места впадения верхней полой вены;

**предсердно-желудочкового узла** (атриовентрикулярный узел), находящегося в стенке правого предсердия вблизи перегородки между предсердиями и желудочками;

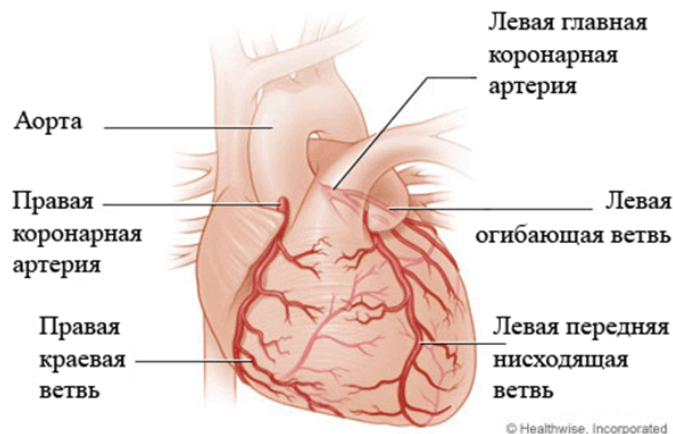
**предсердно-желудочкового пучка** (пучок Гиса), отходящего от предсердно-желудочкового узла одним стволом. Пучок Гиса, пройдя через перегородку между предсердиями и желудочками, делится на две ножки, идущие к правому и левому желудочкам. Заканчивается пучок Гиса в толще мышц волокнами Пуркинье.

**Синусно-предсердный узел является ведущим в деятельности сердца (водитель ритма), в нем возникают импульсы, определяющие частоту и ритм сокращений сердца.** В норме предсердно-желудочковый узел и пучок Гиса являются только передатчиками возбуждений из ведущего узла к сердечной мышце. Однако способность к автоматии присуща предсердно-желудочковому узлу и пучку Гиса, только выражается она в меньшей степени и проявляется лишь при патологии. *Автоматизм предсердно-желудочкового соединения проявляется лишь в тех случаях, когда к нему не поступают импульсы от синусно-предсердного узла.*

Атипическая ткань состоит из малодифференцированных мышечных волокон. К узлам атипической ткани подходят нервные волокна от блуждающих и симпатических нервов.

Самому сердцу, как и любому другому органу для питания и нормальной деятельности требуется кислород. К сердечной мышце он доставляется по собственным сосудам сердца - коронарным. Иногда эти артерии называют венечными.

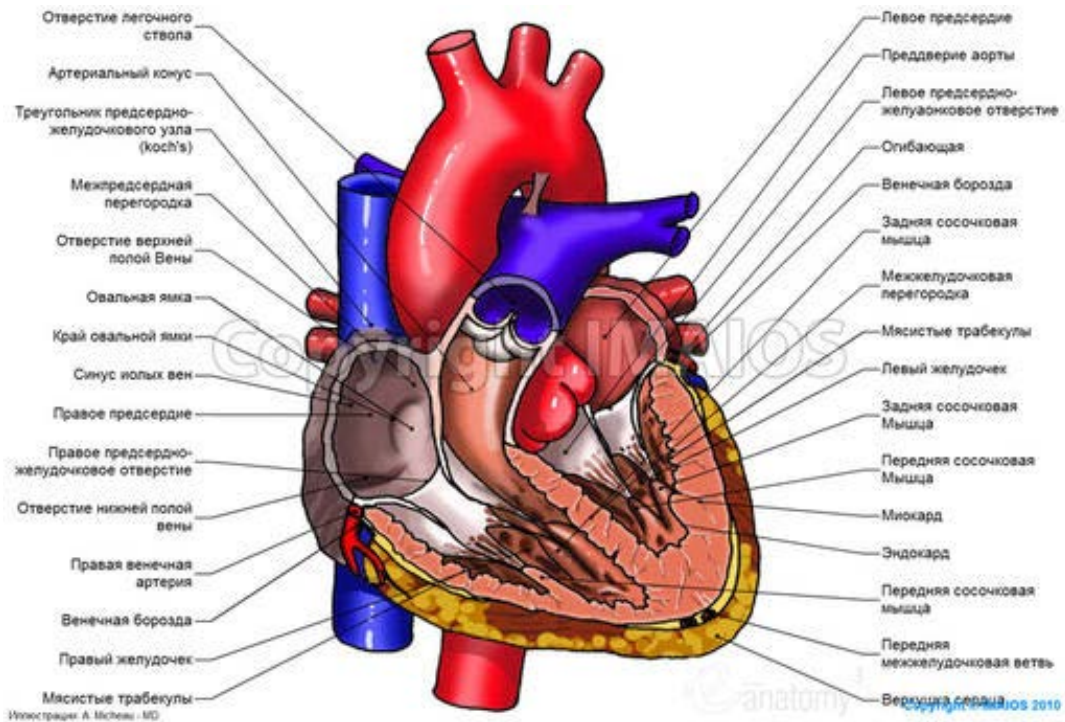
Коронарные сосуды отходят от основания аорты. Делятся на правую коронарную артерию и левую коронарную артерию. Левая коронарная артерия в свою очередь разделяется на переднюю межжелудочковую и огибающую артерии. Правая коронарная артерия кровоснабжает стенки правого предсердия и желудочка, заднюю часть межжелудочковой перегородки и заднюю стенку левого желудочка, синусовый и атриовентрикулярный узел. Левая коронарная артерия снабжает кровью переднюю часть межжелудочковой перегородки, переднюю и боковую стенки левого желудочка, левое предсердие.



Сосуды сердца.

Нормальная частота сердечных сокращений колеблется от 55 до 85 в мин. При нагрузке частота закономерно увеличивается. Определить частоту сердечных сокращений можно по пульсу. Пульс - это колебания артериальной стенки, возникающие при каждом сокращении сердца.

Движение крови по сосудам зависит от создаваемого сердцем давления в момент выброса крови и сопротивления стенок сосудов току крови. Давление в аорте в момент сокращения желудочков сердца является максимальным, и называется систолическим. Во время расслабления в левом желудочке сохраняется остаточное давление, которое называется диастолическим. На величину кровяного давления влияют просвет кровеносных сосудов, вязкость крови, количество циркулирующей в сосудах крови. По мере удаления от сердца давление крови уменьшается и становится наименьшим в венах. Разность между высоким давлением крови в аорте и низким давлением в полых венах обеспечивает непрерывный ток крови по сосудам.



Строение сердца

Стенка имеет три слоя: внутренний — эндокард (его выросты образуют клапаны), средний — миокард (сердечная мышца, сокращение происходит не произвольно, предсердия и желудочки не соединяются между собой), наружный — эпикард (покрывает поверхность сердца, служит внутренним листком околосердечной серозной оболочки — перикарда). Мышечная ткань, которая способствует перекачиванию крови, сердца млекопитающих **не имеет возможности восстанавливаться после повреждений**.

Нервные центры, регулирующие деятельность сердца, **находятся в продолговатом мозге**. В эти центры поступают импульсы, которые сигнализируют о потребностях в чём-либо тех или иных органов. В свою очередь продолговатый мозг посылает сердцу сигналы: усилить или ослабить сердечную деятельность. Потребность органов в притоке крови регистрируется двумя типами рецепторов: рецепторами растяжения (так называемые барорецепторы) и хеморецепторами.

Во время работы сердца возникают звуки — тоны:  
Систолический — низкий, продолжительный (колебание створок, захлопываются двух- и трёх- створчатые клапаны, колебание натягивают сухожильные нити).  
Диастолический — короткий, высокий (захлопывают полулунные клапаны аорты и лёгочного ствола).

Сердце сокращается ритмично в условиях покоя с частотой — 60—70 ударов в минуту. Частота ниже 60 — брадикардия, выше 90 — тахикардия. Сокращение мышц сердца — систола, расслабление — диастола. Полный цикл сердечной деятельности — 0,8 секунд. Сокращение предсердий — 0,1 секунд, сокращение желудочков — 0,3 секунд, пауза — 0,4 секунд.

Там, где сосудистая система замкнута, она образует круг кровообращения. У человека и всех позвоночных животных есть несколько кругов кровообращения, обменивающихся кровью между собой только в сердце. Круг кровообращения состоит из

двух последовательно соединённых кругов (петель), начинающихся желудочками сердца и впадающих в предсердия.

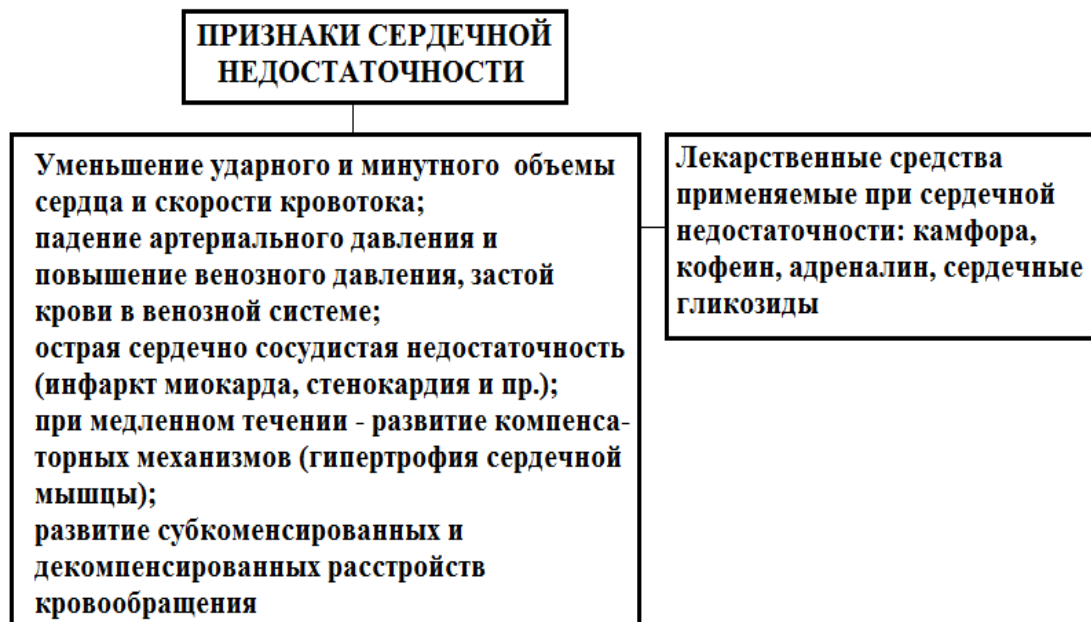
## Средства влияющие на сердечнососудистую систему

Заболевания сердечнососудистой системы являются одной из наиболее распространенных причин смертности в мире в настоящее время. Нормальная деятельность сердечнососудистой системы зависит от согласованного взаимодействия многих факторов организма: деятельности сердца, объема циркулирующей крови, состояния кровеносных сосудов, артериального давления, возврата венозной крови и пр. Нарушение любого из этих факторов ведет к расстройству в деятельности сердечнососудистой системы с крайне негативными последствиями.

Различают **местные и общие** расстройства деятельности сердечнососудистой системы. Причиной местных расстройств могут быть разрыв кровеносного сосуда (кровоизлияния), его закупорка сгустком крови (тромбоз) или воздухом (эмболия) случайно попавшим в кровеносный сосуд (например, в результате попадания воздуха в кровеносный сосуд вместе с лекарственным средством при инъекциях).

Поскольку сердечнососудистая система организма является взаимосвязанной, целостной системой организма - местные расстройства кровообращения могут спровоцировать общее расстройство сердечнососудистой системы. Общие расстройства могут возникнуть также в результате инфаркта миокарда, других нарушений сердечной деятельности или состава крови.

В результате общего расстройства деятельности сердечнососудистой системы развиваются признаки сердечной недостаточности, связанные с нарушением деятельности сердца. При этом сердце не может поддерживать кровообращение в нормальном состоянии, уменьшается его ударный и минутный объем, скорость кровотока, наблюдается падение артериального давления, застойные явления в венозной системе и повышение венозного давления, развивается отечность конечностей, нарушаются функции легких и почек, наблюдается скопление жидкости в брюшной полости (асцит), в крови повышается концентрация углекислого газа, что вызывает одышку, синюшность кожи и слизистых оболочек (в том числе губ).



Расстройства сердечнососудистой системы может развиваться и в результате первоначального нарушения сердечной деятельности, например, при инфаркте миокарда,

прочих негативных воздействий, нарушающих сердечную деятельность: шоке, острых отравлениях ядами, некоторых инфекционных заболеваниях. При этом указанные симптомы развиваются очень быстро (**острая сердечнососудистая недостаточность**).

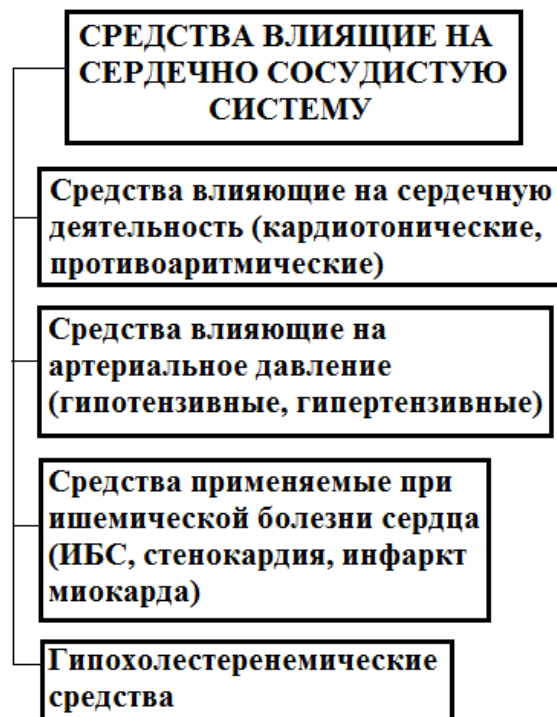
В некоторых случаях сердечная недостаточность развивается постепенно (**хроническая сердечная недостаточность**), в течение длительного времени, с периодами обострения и ремиссии (улучшения состояния), например, при гипертонической болезни, ишемической болезни сердца, пороках сердца (нарушениях в работе клапанов сердца), артериальной гипертензии, заболеваниях легких, эмфиземе (заболевании дыхательных путей, характеризующееся патологическим расширением воздушных пространств дистальных бронхиол, которое сопровождается деструктивно-морфологическими изменениями альвеолярных стенок) и пр.

При длительном течении болезни у больного постепенно развиваются компенсаторные механизмы, в результате которых происходит гипертрофия сердечной мышцы. В результате, в уже изменившемся состоянии сердечнососудистой системы, повышается сократительная функция сердца.

Различают **субкомпенсированные** расстройства кровообращения, при которых признаки сердечной недостаточности выражены не резко. Субкомпенсированные расстройства при физических или психологических нагрузках могут перейти в **декомпенсированные**, при которых больные нуждаются в медицинской помощи.

Лекарственные средства, применяемые при лечении сердечнососудистых заболеваний делятся на четыре группы:

1. Средства действующие преимущественно на функции сердца (кардиотонические, противоаритмические);
2. Средства влияющие на артериальное давление (гипотензивные, гипертензивные);
3. Средства применяемые при лечении ишемической болезни сердца и нарушений мозгового кровообращения;
4. Гипохолестеремические средства;





### Сердечные гликозиды

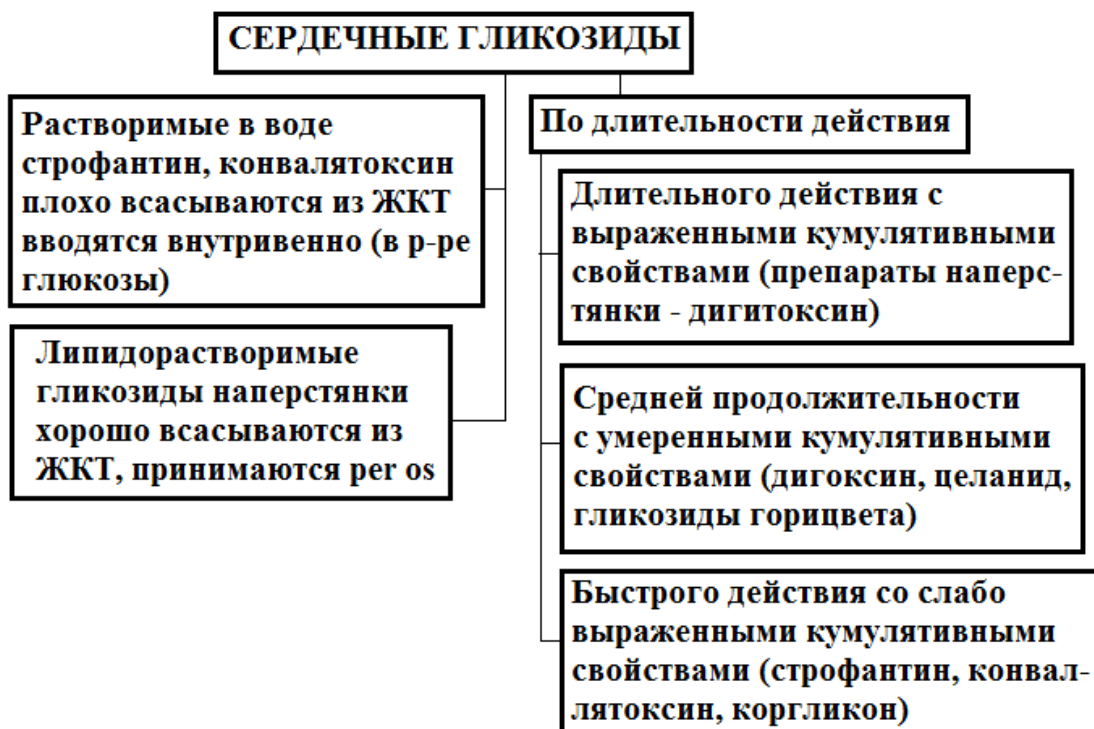
Стимуляторами сердечной деятельности, применяемыми при лечении сердечной недостаточности, являются кардиотонические средства, которые усиливают сократительную активность миокарда и нормализуют работу сердца.

Кардиотоническими средствами, стимулирующими сердечную деятельность, является адреналин (средство экстренной медицинской помощи при остановке сердца), камфора, кофеин и другие лекарственные препараты.

Ведущее место среди кардиотонических средств занимают сердечные гликозиды. Сердечные гликозиды – сложные органические соединения, растительного происхождения, содержащиеся в таких растениях, как наперстянка, ландыш, горицвет, строфант, желтушник и др., оказывают избирательное стимулирующее действие на сердце. Все сердечные гликозиды сходны между собой по строению и механизму действия, но различаются по скорости наступления эффекта, продолжительности действия, способности к кумуляции, растворимости в воде и способности всасываться при приеме внутрь.

Так, в зависимости от продолжительности их действия сердечные гликозиды подразделяют на три группы.:

1. Гликозиды длительного действия, с выраженными кумулятивными свойствами (дигитоксин, препараты наперстянки);
2. Гликозиды средней продолжительности, с умеренными кумулятивными свойствами (гликозиды горицвета, дигоксин, целанид);
3. Гликозиды короткого, быстрого, непродолжительного действия (строфантин, конваллятоксин, коргликон);



Хорошо растворимые в воде сердечные гликозиды (строфантин, конваллятоксин и пр.) плохо всасываются из желудочно-кишечного тракта (до 3%), поэтому их вводят внутривенно (с изотоническим раствором натрия хлорида или глюкозы).

Жирорастворимые (липидорастворимые) сердечные гликозиды (наперстянки) хорошо всасываются слизистой оболочкой желудка и при приеме внутрь практически полностью всасываются в кровь.

Продолжительность действия сердечных гликозидов зависит от их способности к кумуляции, скорости инактивации в печени, а также прочности соединений, образуемых с тканями организма.

Большинство липидорастворимых сердечных гликозидов относится к средствам длительного или средней продолжительности действия с выраженной или умеренной способностью к кумуляции. Водорастворимые гликозиды - средства являются средствами быстрого и непродолжительного действия со слабо выраженной способностью к кумуляции.

Сердечные гликозиды сходны между собой по механизму действия, вызывая сходные изменения сердечной деятельности. Механизм кардиотонического действия сердечных гликозидов связан с их способностью обеспечивать накопление гликогена в миокарде, а также усваивать АТФ и креатинфосфат, которые являются основными источниками энергии сокращения миокарда.

Кроме того, сердечные гликозиды способствуют уменьшению содержания ионов калия и увеличению содержания ионов кальция в клетках сердечной мышцы, что также способствует усилению сократительной активности миокарда.

#### ОСОБЕННОСТИ МЕХАНИЗМА ДЕЙСТВИЯ СЕРДЕЧНЫХ ГЛИКОЗИДОВ

**Сердечные гликозиды вызывают усиление сердечной деятельности: способствуют накоплению гликогена в миокарде; способствуют уменьшению содержания ионов К и увеличению ионов Са в клетках миокарда, что ведет к усилению сокращений миокарда; Усиление сердечной деятельности под влиянием сердечных гликозидов не ведет к увеличению потребности миокарда в кислороде; Сердечные гликозиды уменьшают частоту сердечных сокращений (за счет усиления систолы и удлинения диастолы); Повышают возбудимость и автоматизм миокарда, тормозят проведения импульсов;**

Характерное действие сердечных гликозидов связано с наличием в молекуле агликона. Сахаристая часть молекулы (гликон) оказывает непосредственное влияние на растворимость, способность проникать через клеточные мембраны, а также образовывать соединения с белками крови.

Механизм кардиотонического действия сердечных гликозидов связан с их ингибирующим действием (ингибитор— вещество, замедляющее протекание ферментативной реакции) на транспортную  $\text{Na}^+$ ,  $\text{K}^+$  АФТазу мембран клеток миокарда, что приводит к увеличению внутриклеточного содержания ионов  $\text{Na}$  и снижению ионов  $\text{K}$ .

При этом возрастает поступление в клетку ионов  $\text{Ca}$  и освобождение ионов  $\text{Ca}$  из саркоплазматической сети (саркоплазматическая сеть — структурный компонент поперечнополосатого мышечного волокна, представляющий собой систему цистерн, окружающих миофибриллы на уровне изотропного диска, и канальцев, отходящих от цистерн в продольном направлении).

Свободные ионы  $\text{Ca}$  взаимодействуют с тропониновым комплексом (тропонин — регуляторный глобулярный белок, состоящий из трех субъединиц, который участвует в

процессе мышечного сокращения. Содержится в скелетных мышцах и сердечной мышце, но не содержится в гладкой мускулатуре). В результате устраняется тормозящее влияние на сократительные белки кардиомиоцитов (**кардиомиоциты** — мышечные клетки сердца). В результате чего создаются оптимальные условия для взаимодействия актина с миозином, что проявляется быстрым и сильным сокращением миокарда (**актин** — белок, полимеризованная форма которого образует микрофиламенты — один из основных компонентов цитоскелета эукариотических клеток. Вместе с белком миозином образует основные сократительные элементы мышц — **актомиозиновые комплексы саркомеров**).

Важнейшим фактором механизма кардиотонического действия сердечных гликозидов является их **способность к усилению сердечных сокращений без существенного увеличения потребления кислорода клетками миокарда**. Этим сердечные гликозиды положительно отличаются от подавляющего большинства кардиотонических средств (например, адреналина), усиление сердечных сокращений в результате действия которых сопровождается увеличением потребности в кислороде сердечной мышцы и, как следствие, истощением ее энергетических запасов.

Еще одним важным фактором действия сердечных гликозидов является их способность **увеличивая при этом ударный и минутный выброс крови в сосудистую систему при уменьшении частоты сердечных сокращений**. Эта особенность действия сердечных гликозидов проявляется в усилении систолы (выброс крови) и удлинении диастолы (период покоя).

Эти особенности действия сердечных гликозидов ведут к улучшению работы сердца, улучшению кровообращения, уменьшению отечности, различного рода застойных явлений, одышки, улучшению работы всех органов, при уменьшении нагрузки на миокард.

#### Действие сердечных гликозидов при сердечной недостаточности

Состояние функций при сердечной недостаточности	Характер действия сердечных гликозидов
1. Ослабление систолы	Усиление
2. Уменьшенная диастола	Увеличение, удлинение
3. Пониженный тонус сердечной мышцы	Повышение
4. Уменьшенный ударный и минутный объем сердца	Увеличение
5. Чрезмерное потребление кислорода сердечной мышцей	Уменьшение до нормы
6. Замедленная скорость кровообращения	Увеличение
7. Повышенное венозное давление	Понижение
8. Нарушение функций внутренних органов	Нормализация

Кроме перечисленных особенностей действия, сердечные гликозиды также проявляют способность тормозить проведение импульсов по проводящей системе сердца и повышать автоматизм миокарда, что позволяет использовать их в качестве средства для лечения сердечных аритмий.

Вместе с тем, токсические дозы, вызванные передозировкой либо следствием кумуляции сердечных гликозидов, могут привести к полной блокаде проведения импульсов между предсердиями и желудочками, блокировке автоматизма в работе сердца, и, как следствие, повышения возбудимости сердца и развития экстрасистолии (внеочередных, бессистемных сокращений сердечной мышцы).

Лекарственные средства из группы сердечных гликозидов являются одними из основных и наиболее эффективных при лечении острой и хронической сердечной недостаточности.

При лечении острой сердечной недостаточности (при инфаркте миокарда, отеке легких и пр.) применяются гликозиды быстрого и сильного действия (строфантин, конваллятоксин, коргликон). При хронической сердечной недостаточности применяются сердечные гликозиды средней продолжительности или длительного действия (дигоксин, целанид, дигитоксин).

Отравление сердечными гликозидами может наступить вследствие передозировки, либо вследствие кумуляции (накопления) сердечных гликозидов (липидорастворимых) при их продолжительном применении.

### ОТРАВЛЕНИЕ СЕРДЕЧНЫМИ ГЛИКОЗИДАМИ

**Признаки:** брадикардия, тошнота, рвота, аритмия (экстрасистолия), падение артериального давления. Смерть наступает от остановки сердца.

**Помощь:** антидот - унитиол, вводят препараты К (калия хлорид) и препараты связывающие Са (ЭДТА этилендиамин-тетрауксусная кислота), противоаритмические средства (лидокаин)

При передозировке сердечными гликозидами пульс резко замедляется, возникают тошнота, рвота, развивается аритмия (экстрасистолия и тахикардия), резко падает артериальное давление. Смерть наступает в результате остановки сердца.

В качестве медикаментозных средств оказания помощи назначают: унитиол, калия хлорид, препараты связывающие ионы кальция, противоаритмические средства.

#### Биологическая стандартизация сердечных гликозидов

Поскольку сердечные гликозиды являются фармакологически высокоактивными природными соединениями растительного происхождения их содержание в растительном сырье может колебаться в достаточно широких пределах, что зависит от многих факторов: условий выращивания, сбора, хранения, сушки лекарственного сырья и прочих факторов. Поэтому, существует необходимость периодически проверять активность лекарственного растительного сырья, содержащего сердечные гликозиды, а также изготовленных из него лекарственных препаратов. Количественная оценка активности лекарственных препаратов, содержащих сердечные гликозиды проводится методом **биологической стандартизации**, на лягушках (реже на кошках). Метод состоит в установлении наименьшей дозы лекарственного средства, способного вызвать остановку сердца. Выявленную активность сравнивают со стандартами и выражают в ЛЕД (лягушачьих единицах действия) или КЕД (кошачьих единицах действия).

#### Кардиотонические средства «негликозидной» природы

В настоящее время известно достаточно большое количество кардиотонических средств из группы, например дофамин – кардиотоническое средство, применяемый при лечении шоковых состояний, или препараты из группы  $\beta_1$  адреномиметиков (добутамин). Однако эти препараты проявляют ряд нежелательных побочных эффектов, таких как тахикардия (учащение работы сердца), повышение артериального давления, боли в области сердца и пр. Кроме того, усиление работы сердца при действии этих препаратов вызывают увеличение потребления кислорода миокардом.

В некоторой степени данных побочных явлений лишены лекарственные препараты : амринон и милринон. Препараты оказывает положительное инотропное (усиливают силу сокращения сердца), а также сосудорасширяющее действие; у больных застойной сердечной недостаточностью увеличивает сердечный выброс, снижает давление в легочной артерии и уменьшает периферическое сосудистое сопротивление. Но предназначены только для кратковременной терапии острой сердечной недостаточности, к тому же также не лишены перечисленных побочных действий: способности вызвать тахикардию, аритмию, гипотензию.

### Противоаритмические средства

Противоаритмические средства применяются для лечения нарушения сердечного ритма (аритмий). При нормальной работе сердца импульсы зарождаются в синусовом узле, который является основным генератором импульсов и водителем сердечного ритма.

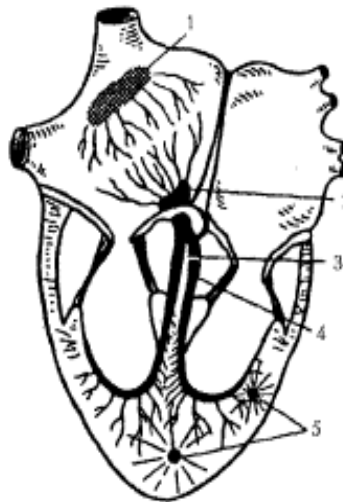


Схема проводящей системы сердца и локализация ее нарушений:  
 1 - синусовый узел; 2 - предсердно-желудочковый узел; 3 - место блокады ножки предсердно-желудочкового пучка; 4 - предсердно-желудочковый пучок; 5 - патологические очаги возбуждения, вызывающие экстрасистолию

Затем импульсы передаются к предсердно-желудочковому узлу и далее по предсердно-желудочковому пучку (пучку Гиса) на мускулатуру желудочков. Автоматизм в работе синусового узла сохраняется определенное время и при изолировании сердца.

Сердечный ритм в организме регулируется симпатической нервной системой (ускорение ритма) и парасимпатической (замедление ритма), а также гормональной системой организма.

При заболеваниях сердца (инфаркте миокарда, пороках сердца, миокардите и пр.), отравлении сердечными гликозидами и других случаях, могут наблюдаться нарушение сердечного ритма, возникать сердечные аритмии.

Различают следующие виды аритмий: мерцательная аритмия, экстрасистолия, пароксизмальная тахикардия и пр.

При мерцательной аритмии наблюдается асинхронное сокращение предсердий и желудочков сердца, вследствие чего развивается сердечная недостаточность. Смертельно опасной является мерцательная аритмия (фибрилляция или трепетание) желудочков, которая является равнозначной остановке сердца.

Для экстрасистолии характерны внеочередные сокращения желудочков сердца. Частые экстрасистолы называются приступом пароксизмальной тахикардии.

Причиной аритмий могут быть нарушения электролитного обмена вследствие развития дефицита ионов калия или избытка ионов кальция, повышения возбудимости и автоматизма сердца, кислородной недостаточности миокарда, повышение тонуса симпатических нервов и пр.

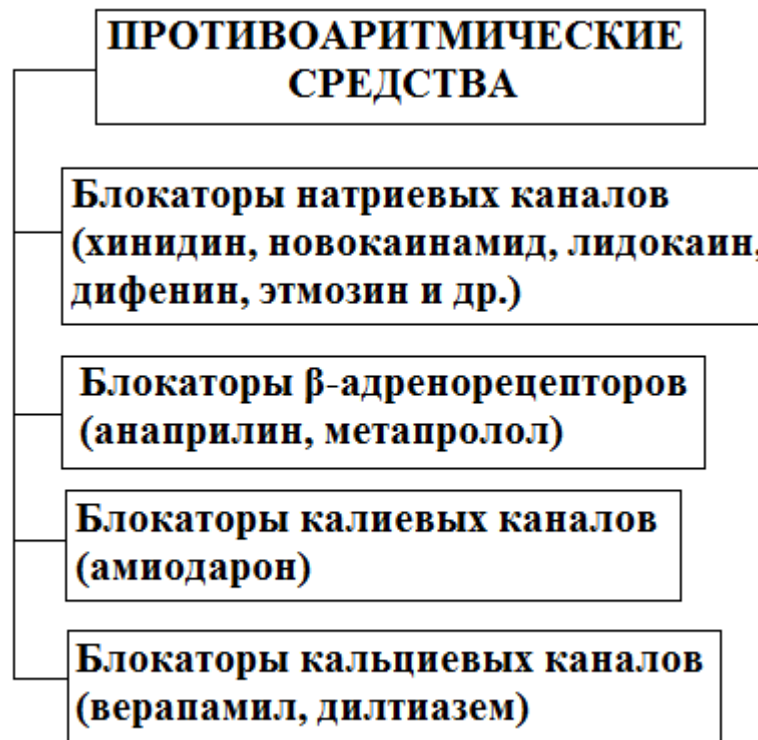
К формам аритмий относится также тахикардия (учащение сердечного ритма до 100 и более сокращений в минуту) и брадикардия (урежение сердечного ритма до 50 сокращений в минуту).

Важное значение для ритма сердечных сокращений имеют такие явления как деполяризация и реполяризация мембран, связанная с перераспределением ионов калия и натрия; эффективный рефракторный период в течении которого сердечная мышца не реагирует на дополнительные импульсы; потенциал действия указывающий на готовность сердечной мышцы к сокращению. При тахикардии указанные факторы имеют существенное значение, которые тормозятся противоаритмическими средствами.

### **Противоаритмические средства**

Противоаритмические средства, применяемые для профилактики и лечения аритмий, часто делят по симптоматическим показаниям их применения, например, на средства применяемые для лечения экстрасисталии, средства для лечения тахикардии, средства для лечения брадикардии и пр.

Кроме того, существует систематизация этих средств по направленности действия на группу средств непосредственно влияющих на сердце и групп средств влияющих на иннервацию сердца. Каждая из этих групп, в свою очередь делится на подгруппы. Однако, такое деление во много условно, поскольку у некоторых лекарственных препаратов может сочетаться оба вида действия (влияние на иннервацию и непосредственное влияние на сердце).



Часто используется классификация противоаритмических средств, при которой их подразделяют на следующие 4 группы:

1. Блокаторы натриевых каналов (мембраностабилизирующие средства): хинидин, новокаинамид, лидокаин, дизопирамид, аймалин, этмозин, этацинин;
2. Блокаторы  $\beta$ -адренорецепторов: анаприлин, метпролол;
3. Блокаторы калиевых каналов (продолжающие реполяризацию): амиодарон;
4. Блокаторы кальциевых каналов: верапамил, дилтиазем.

### Средства применяемые при тахикардиях

Хинидина сульфат – эффективный противоаритмический препарат, алкалоид коры хинного дерева, оказывает действие на все отделы миокарда и проводящей системы. Угнетает процесс возбудимости, проводимости и, как следствие, сократительной активности сердца. Стабилизирует клеточные мембраны, тормозит влияние на сердце холинергических и адренергических нервов. Вместе с тем, проявляет ряд негативных побочных действий, таких как нарушение зрения, слуха, тошнота, рвота и др.

Новокаинамид – по силе противоаритмического действия и механизму действия близок к хинидину. В меньшей степени оказывает угнетающее действие на сократительную активность миокарда. Также может проявлять множество побочных эффектов: тошноту, рвоту, судороги, а также агранулоцитоз (агранулоцитоз – патологическое состояние, при котором наблюдается снижение содержания в крови нейтрофилов, + эозинофилов и базофилов = 0, на фоне лейкопении, при котором увеличивается восприимчивость организма к бактериальным и грибковым инфекциям).

Дизопирамид – также оказывает действие, сходное с действием хинидина сульфата. Уменьшает прохождение через мембраны ионов натрия, увеличивает рефракторный период в предсердиях, замедляет проводимость в пучке Гиса. Применяется при экстрасистолиях, тахикардии.

Эффективным, противоаритмическим средством является лидокаин (ксикаин) – местно анестезирующее средство, обладающее антиаритмическим действием. Лидокаин действует достаточно быстро (в течении 10 минут), эффективен при экстрасистолиях и тахикардии.

Этмозин – эффективен при мерцательной аритмии, экстрасистолиях, тахикардии. По сравнению с хинидином сульфатом проявляет меньшее количество побочных эффектов, обладает меньшей токсичностью.

Аймалин – препарат растительного происхождения (алкалоид раувольфии), эффективен при экстрасистолии, мерцательной аритмии предсердий.

Дифенин – противоэпилептическое средство, также эффективен при тахикардии, вызванной отравлением сердечными гликозидами.

Перечисленные препараты имеют сходный механизм действия, связанный со стабилизацией клеточных мембран. При этом уменьшается скорость прохождения ионов натрия и калия, изменяется процесс деполяризации и реполяризации мембран, удлиняется рефракторный период, что приводит к подавлению процесса возбудимости, проводимости, сократимости сердечной мышцы.

Важную роль в развитии аритмий, и прежде всего тахикардии, играют ионы кальция. Одной из групп антиаритмических средств является – блокаторы кальциевых каналов (антагонисты кальция), избирательно тормозящие прохождение ионов кальция через клеточные мембраны (верапамил (изоприн), дилтиазем и др.). Данные лекарственные средства эффективны при тахикардии и экстрасистолиях.

На развитие аритмий оказывает существенное влияние дефицит ионов калия, который может возникнуть вследствие, например, применения некоторых диуретиков. В этих случаях восполнение антиаритмический эффект оказывают препараты содержащие ионы калия: калия хлорид, аспаркам и пр. Ионы калия урежают частоту сердечных сокращений, угнетают проводимость и возбудимость миокарда. При передозировке препаратов калия может возникнуть блокада предсердно-желудочковой проводимости.

Эффективным противоаритмическим действием обладаю лекарственные средства из группы сердечных гликозидов (рассмотренных выше), особенно сердечные гликозиды наперстянки. Эти средства замедляют и угнетают проводимость в предсердно-желудочковом узле, за счет чего проявляется антиаритмический эффект.

Эффективными противоаритмическими средствами являются лекарственные препараты из группы  $\beta$ - адреноблокаторов (анаприлин, окспренолол, пиндолол). Блокадой  $\beta$ - адреноблокаторов сердца подавляется активность синусового узла, а также

отдельных эктопических очагов возбуждения.  $\beta$ -адреноблокаторы могут оказывать ряд негативных побочных эффектов: тошноту, рвоту, головокружение, общую слабость. Противопоказаны применение этих препаратов при бронхиальной астме и склонности к бронхоспазмам.

Противоаритмической активностью обладает амиодарон, действие которого также обусловлено антиадренергическими свойствами (амиодарон блокирует  $\alpha$  и  $\beta$  адренорецепторы, а также является антагонистом глюкагона). Препарат снижает автоматизм, проводимость и возбудимость синусового и предсердно-желудочкового узлов сердца, улучшает коронарное кровообращение.

Все антиадренергические средства понижают артериальное давление, уменьшают нагрузку на сердечную мышцу и потребность миокарда в кислороде.

### Средства применяемые при брадикардиях

При брадикардии (замедлении сердечного ритма) применяются адреномиметики – адреналин, изадрин, эфедрин, а также м-холиноблокаторы (препараты из группы атропина), рассмотренные в предыдущих разделах

### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

#### Дигитоксин (Digitoxinum)

**Групповая принадлежность:** группа сердечных гликозидов

**Фармакологическое действие:** Оказывает сильное кардиотоническое (увеличивающее силу сердечных сокращений) действие, замедляет частоту сердечных сокращений; обладает выраженными кумулятивными свойствами (накапливается в организме), быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта.

Действие препарата начинает проявляться через 2-4 ч после приема, максимальный эффект отмечается через 8-12 ч. Обладает сильно выраженным кумулятивным эффектом (способностью накапливаться в организме).

**Показания к применению:** Хроническая сердечная недостаточность с нарушением кровообращения II и III стадии.

**Способ применения:** Принимают дигитоксин внутрь в виде таблеток, содержащих по 0,0001 г (0,1 мг) препарата. Обычно дают в первые дни по 0,6-1,2 мг в сутки (т.е. суточные дозы иногда могут превышать высшие суточные дозы, предусмотренные Фармакопеей) в 4 приема через 6 ч, причем первая доза составляет  $\frac{1}{3}$ - $\frac{1}{2}$  суточной; по достижении терапевтического эффекта ее уменьшают, подбирая индивидуальную поддерживающую дозу -обычно 0,1-0,05 мг (1- $\frac{1}{2}$  таблетки) 1-2 раза в сутки или через 1-2-3 дня.

Высшие дозы дигитоксина для взрослых внутрь: разовая - 0,0005 г (0,5 мг), суточная -0,001 г (1 мг).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 мг в упаковке по 10 штук; свечи по 0,15 мг в упаковке по 10 штук.

#### Дигоксин (Digoxin)

**Групповая принадлежность:** группа сердечных гликозидов

**Фармакологическое действие:** Препарат получают из лекарственного растения наперстянка шерстистая (*Digitalis lanata Ehrh.*). Обладает следующими действиями: инотропное, сосудорасширяющее и умеренное мочегонное.

Увеличивает ударный и систолический объемы сердца, повышает рефрактерный период, уменьшает атриовентрикулярную проводимость, снижает частоту сокращений сердечной мышцы. При передозировке способен инициировать повышение возбудимости миокарда, в результате чего наблюдаются нарушения ритма сердца.

**Показания к применению:** • Хроническая сердечно-сосудистая недостаточность (застойная);

• тахикардия (пароксизмальная наджелудочковая) – при мерцательной аритмии, мерцании предсердий, пароксизмальной тахикардии.

**Способ применения:** Дозу дигоксина подбирает врач индивидуально. Разовая доза препарата составляет 0,00025г (для взрослых) – 1 таблетка по 0,25 мг. В первый день терапии применяют 4-5 раз/сутки с промежутками, равными между собой. Суточная доза при этом составляет 1-1,25 мг. На следующий день назначают ту же разовую дозу, но 1-3 раз/сутки. Положительный эффект оценивают по данным электрокардиографии, функций дыхания, мочеиспускания. В зависимости от этого дозировку дигоксина можно или увеличивать, или снижать. После наступления терапевтического эффекта препарат назначают по схеме: 0,5-0,25-0,125 мг (утром – 2 таблетки, в обед – 1 таблетку, на ночь – половину таблетки). Для взрослых высшая доза в сутки составляет 1,5 мг (0,0015 г).

**Побочные действия:**



Сердечно-сосудистая система: изменения ритма сердца (явления передозировки).

Желудочно-кишечный тракт: рвота, тошнота, снижение аппетита, диарея.

Центральная нервная система: усталость, общая слабость, апатия, боли в голове, светобоязнь, диплопия, депрессия, мелькание мушек, психоз.

Эндокринная система: гинекомастия при продолжительном приеме препарата.

Система крови и кроветворение: петехии, тромбоцитопения.

Аллергические реакции: зуд, крапивница.

Побочные действия чаще всего являются признаками передозировки дигиталиса.

**Противопоказания:** Дигоксин противопоказан при нестабильной стенокардии, интоксикации гликозидами, тампонаде сердца, нарушениях ритма сердца (фибрилляция желудочков; выраженная брадикардия; атриовентрикулярная блокада; экстрасистолия; желудочковая тахикардия), митральном стенозе (изолированном), Вольфа-Паркинсона-Уайта синдроме (WPW), индивидуальной гиперчувствительности к препаратам дигоксина, субаортальном гипертрофическом стенозе, инфаркте миокарда в острой стадии.

Взаимодействие с другими лекарственными средствами:

Несовместим с солями металлов, кислотами, щелочами и дубильными веществами. При комбинации с мочегонными, глюкокортикостероидами, инсулином, симпатомиметиками, препаратами солей кальция повышается вероятность развития гликозидной интоксикации.

**Передозировка:** Симптомы передозировки появляются при гликозидной интоксикации. Она характеризуется появлением синусовой брадикардии, желудочковых экстрасистол по типу бигеминии, предсердной тахикардией, фибрилляцией желудочков, замедлением атриовентрикулярной проводимости, атриовентрикулярной блокадой. Среди симптомов гликозидной интоксикации есть и внесердечные: диспепсии (диарея, рвота или тошнота, анорексия), ослабление памяти, сонливость, боли в голове, слабость в мышцах, эректильная дисфункция, гинекомастия, психоз, беспокойство, эйфория, мелькание «мушек» перед глазами, ксантопсия, скотомы, снижение остроты зрения, микро- и макропсия.

В пожилом возрасте могут наблюдаться спутанность сознания, депрессии.

В случае острого отравления дигоксином назначают промывание желудка водой с добавлением угля активированного или энтеросорбентов, в дальнейшем используют эти препараты перорально. Назначают слабительные (солевые: сульфат магния, сульфат натрия - растворить 15-30,0 г солевого слабительного в 250 мл теплой воды).

В качестве антидота можно использовать унитиол.

**Форма выпуска:** Таблетки белого цвета по 0,00025 мг, в картонной пачке содержится 2 блистера по 20 таблеток каждый.

### Калия хлорид (Kalii chloridum)

**Фармакологическое действие:** Калий - основной внутриклеточный ион, играющий важную роль в регулировании функций организма.

**Показания к применению:** Нарушения сердечного ритма (мерцательная аритмия, пароксизмальная тахикардия), интоксикации (отравления) после введения сердечных гликозидов и диуретиков (мочегонных), недостаток калия в организме, в том числе при лечении кортикостероидами и др.

**Способ применения:** Внутрь в виде 10% раствора по 15-20 мл 3-4 раза в день (при необходимости разовую дозу увеличивают до 60-120 мл), внутривенно капельно до 2,5 г в 500 мл изотонического раствора натрия хлорида или в 5% растворе глюкозы.

### Коргликон (Corgliconum)

**Групповая принадлежность:** Фармакологическое действие: Коргликон относится к группе сердечных гликозидов и по специфическому эффекту препарат близок к строфантину, но оказывает более длительное действие. Механизм действия Коргликона связан с воздействием на Na<sup>+</sup>-K<sup>+</sup>-насос, транссарколемную систему обмена Na<sup>+</sup> и Ca<sup>2+</sup>, на циклический аденозинмонофосфат - вторичный медиатор, который участвует в энергетическом обеспечении сократительного процесса миофибрилл.

Эффект препарата, после введения в вену, наблюдается через 3-5 минут, достигая максимума в пределах 30 минут. Препарат не связывается с белками плазмы, не метаболизируется в организме. Экскретирует в неизменном виде, как правило, с мочой. Практически не имеет кумулятивного действия. Период полувыведения из организма (главным образом почками) превышает 28 часа.

**Показания к применению:** Коргликон назначают при острой и хронической сердечной недостаточности, сердечной декомпенсации, осложненной тахисистолической формой мерцающей аритмии, для лечения приступов пароксизмальной наджелудочковой тахикардии.

**Способ применения:** Коргликон вводят внутривенно. Введение осуществляют в течение 5-6 минут по 10-20 мл 5% раствора глюкозы 1-2 раза в сутки. Взрослым вводят в разовой дозе 0,5-1 мл, детям в возрасте от 2 до 5 лет - по 0,2-0,5 мл, от 6 до 12 лет - по 0,5-0,75 мл. При введении 2 раза в сутки интервал между инъекциями равен 8-10 часам. Высшие дозы для взрослых в вену: разовая - 1 мл, суточная - 2 мл.

**Передозировка:** При длительном применении возможны брадикардия, полные и неполные блокады проводящей системы сердца, нарушения ритма, что требует назначения препаратов калия, атропина

сульфата. В этих случаях необходимо уменьшить дозу и увеличить промежутки между отдельными инъекциями. При резком замедлении пульса инъекции отменяют. Редко наблюдается тошнота, рвота.

**Форма выпуска:** Ампулы по 1 мл 0,06% раствора в упаковке по 10 штук.

### **Настойка боярышника**

Сырье: Боярышника плоды (*Crataegi fructus*)

Боярышника настойка оказывает спазмолитическое действие. Усиливают кровообращение в коронарных сосудах сердца и в сосудах мозга, повышают чувствительность миокарда к действию сердечных гликозидов. Усиливают сокращения сердечной мышцы и уменьшают ее возбудимость. Улучшают периферическое кровообращение, оказывают антиаритмическое действие.

**Показания** Функциональные расстройства сердечной деятельности; мерцательная аритмия; пароксизмальная тахикардия (при легких формах в дополнение к лечению основными антиаритмическими препаратами).

**Способ применения и дозы:** Внутрь по 15-20 капель 3 раза в день до еды.

**Состав и форма выпуска:** во флаконе 25 мл (спирт этиловый 70%)

### **Новокаинамид (Novocainamidum)**

**Групповая принадлежность:** антиаритмическое средство

Понижает возбудимость мышцы сердца, подавляет эктопические очаги возбуждения (смещенные источники ритма сердца), а также обладает местноанестезирующим свойством. Относится к IA классу препаратов антиаритмического действия.

**Показания к применению:** Нарушения сердечного ритма (экстрасистолия, пароксизмальная тахикардия, пароксизмы мерцания предсердий и др.).

**Способ применения:** При желудочковой экстрасистолии назначают внутрь вначале в дозе 0,25-0,5-1 г (взрослым), затем по 0,25-0,5 г каждые 4-6 ч. При необходимости суточная доза может быть доведена до 3 г (иногда до 4 г). Длительность лечения зависит от эффективности и переносимости препарата.

Для купирования (снятия) пароксизмальной желудочковой тахикардии вводят препарат в вену в дозе 0,2-0,5 г (редко 1 г) со скоростью 25-50 мг в минуту. Можно также назначать новокаинамид внутримышечно по 5-10 мл 10% раствора (до 20-30 мл в сутки).

При необходимости препарат вводят внутримышечно в дозе 0,5-1 г (5-10 мл 10% раствора), а далее через интервалы 6 ч вводят в вену (медленно) по 0,2-0,5 г (редко 1 г) или вводят в вену из расчета 10-20 мг/кг в течение 40-60 мин с последующей поддерживающей инфузией из расчета 2-3 мг в минуту.

При внутривенном введении раствор новокаинамида разводят в 5% растворе глюкозы или в изотоническом растворе натрия хлорида. Скорость введения не должна превышать 50 мг в минуту. При этом необходимо постоянно следить за пульсом, артериальным давлением и электрокардиограммой. При быстром введении возможно развитие коллапса (резкого падения артериального давления), внутрисердечной блокады (нарушение проведения возбуждения по проводящей системе сердца), асистолии (прекращение сокращений сердца). Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 1 г, суточная - 4 г; внутримышечно и в вену (капельно): разовая - 1 г (10 мл 10% раствора), суточная - 3 г (30 мл 10% раствора).

**Противопоказания:** Выраженная сердечная недостаточность, нарушение проводимости, повышенная чувствительность к препарату.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г и 0,5 г в упаковке по 20 штук; ампулы по 5 мл 10% раствора в упаковке по 10 штук; 10% раствор в герметически закрытых флаконах.

### **Хинидина сульфат (Chinidinisulfas)**

**Групповая принадлежность:** антиаритмическое средство

Хинидин обладает сильной антиаритмической активностью, эффективен при различных видах аритмий, но относительно часто вызывает побочные явления.

**Показания к применению:** Назначают хинидин для купирования (снятия) приступов и особенно для профилактики рецидивов (повторного появления признаков) мерцательной аритмии, а также при пароксизмальной суправентрикулярной тахикардии, частой экстрасистолии и желудочковой тахикардии (различных нарушениях ритма сердца).

**Способ применения:** Принимают хинидина сульфат внутрь (за 30 мин до еды) в виде таблеток. Максимальный антиаритмический эффект развивается при этом через 2-3 ч, действие продолжается 4-6 ч. Предложены различные схемы применения хинидина. Ранее назначали хинидин, начиная с небольших доз (0,1 г) по несколько раз в день (6 раз) с постепенным увеличением дозы до 0,25-0,3 г также по 6 раз в день.

Однако изучение фармакокинетики (распределения в организме) хинидина показывает, что начинать надо с относительно высоких доз, чтобы достичь оптимальной концентрации препарата в крови.

**Побочные действия:** При передозировке и повышенной индивидуальной чувствительности угнетение сердечной деятельности, тошнота, рвота, понос, аллергические реакции; в отдельных случаях фибрилляция предсердий (хаотичные сокращения предсердий).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,1 и 0,2 г.

**Унитиол (Unithiolum)**

Унитиол содержит две сульфгидрильные группы. По механизму действия препарат приближается к комплексонам (органическим веществам, образующим прочные соединения с катионами /положительными ионами/ металлов). Его активные сульфгидрильные группы вступают в реакцию с тиоловыми ядами, находящимися в крови и тканях, и образуют с ними нетоксичные (невредные) комплексы, которые выводятся с мочой. Связывание ядов приводит к восстановлению функции ферментных систем организма, пораженных ядом.

**Показания к применению:** Применяют унитиол для лечения острых и хронических отравлений соединениями мышьяка, ртути, хрома, висмута и других металлов, относящихся к так называемым тиоловым ядам, т. е. веществам, способным вступать во взаимодействие с сульфгидрильными (тиоловыми) группами ферментных белков и тем самым их инактивировать (подавлять активность). Менее активен унитиол при отравлениях свинцом. Применяют унитиол при отравлениях сердечных гликозидами, а также в комплексной терапии при хроническом алкоголизме.

**Способ применения:** Для лечения острых и хронических отравлений соединениями мышьяка и ртути вводят унитиол внутримышечно или под кожу в виде 5% водного раствора в количестве 5-10 мл (из расчета 0,05 г препарата или 1 мл 5% раствора на 10 кг массы тела больного). Лечение следует начинать как возможно раньше. При отравлениях соединениями мышьяка инъекции делают в первые сутки каждые 6-8 ч (3-4 инъекции в сутки в зависимости от состояния больного), во вторые сутки 2-3 инъекции через каждые 8-12 ч, в последующие - по 1-2 инъекции в сутки. При отравлениях соединениями ртути инъекции делают по той же схеме в течение 6-7 сут. Детям препарат назначают в меньших дозах в соответствии с возрастом.

Продолжительность применения зависит от скорости выведения токсичных (вредных) соединений из организма. Лечение проводят до исчезновения признаков интоксикации (отравления). При отравлениях солями ртути вводят в течение не менее 6 сут.

При отравлениях сердечными гликозидами вводят в первые 2 дня в указанных выше дозах 3-4 раза в сутки, затем 1-2 раза в сутки до прекращения кардиотоксического действия (повреждающего воздействия на сердце).

Введение унитиола при острых отравлениях не исключает применения других лечебных мероприятий (промывание желудка, вдыхание кислорода, введение глюкозы и др.).

При гепатоцеребральной дистрофии вводят внутримышечно по 5-10 мл 5% раствора ежедневно или через день; на курс 25-30 инъекций с перерывом между курсами 3-4 мес.

При хроническом алкоголизме применяют унитиол в комплексной терапии по 3-5 мл 5% раствора 2-3 раза в неделю. Для купирования делирия (снятия бредовых состояний, являющихся следствием хронического алкоголизма) вводят однократно 4-5 мл 5% раствора унитиола.

**Форма выпуска:** 5% раствор в ампулах по 5 мл.

**Аймалин (Ajmalinum)**

Групповая принадлежность: антиаритмическое средство

**Показания к применению:** Различные нарушения ритма (предсердная и желудочковая экстрасистолия, пароксизмальная тахикардия и др.), аритмии, вызванные дигиталисной интоксикацией (отравлением сердечными гликозидами) и при остром инфаркте миокарда.

**Способ применения:** Внутримышечно 0,05-0,15 г в сутки; для купирования (снятия) острого приступа тахикардии (учащенных сердцебиений) внутривенно 2 мл 2,5% раствора в 10 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. По устранении аритмии внутрь по 0,05-0,1 г 3-4 раза в день.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 г в упаковке по 20 штук; ампулы по 2 мл 2,5% раствора в упаковке по 10 штук.

**Строфантин К (Strophantinum K)**

Групповая принадлежность: Сердечный гликозид

Строфантин К является сердечным гликозидом. Повышает силу и скорость сокращения миокарда (сердечной мышцы) (положительный инотропный эффект); понижает частоту сердечных сокращений (отрицательный хронотропный эффект).

При сердечной недостаточности увеличивает ударный (количество крови, которое сердца выбрасывает в кровеносное русло за одно сокращение) и минутный (количество крови, которое сердца выбрасывает в кровеносное русло за минуту) объем сердца, улучшает опорожнение желудочков, что приводит к уменьшению размеров сердца.

Эффект препарата проявляется через 3-10 мин после внутривенной инъекции. Максимальный эффект развивается через 30-120 мин после достижения насыщения. Продолжительность действия строфантина К составляет от одного до трех дней.

**Показания к применению:** Хроническая сердечная недостаточность 2-3 стадии; нарушения сердечного ритма: суправентрикулярная тахикардия; мерцательная аритмия.

**Способ применения:** Вводят строфантин в вену в виде 0,025% раствора обычно 0,25 мг (1 мл), реже 0,5 мг. Раствор строфантина разводят предварительно в 10-20 мл 5%, 20% или 40% раствора глюкозы или изотонического раствора натрия хлорида. Вводят медленно (в течение 5-6 мин), так как быстрое введение

может вызвать шок. Вводят один раз (редко 2 раза) в сутки. Можно вводить раствор строфантина капельно в 100 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. При капельном введении реже отмечаются токсические явления. При невозможности внутривенного введения иногда строфантин назначают внутримышечно.

Высшие дозы строфантина К для взрослых в вену: разовая -0,0005 г (0,5 мг), суточная -0,001 г (1 мг) или соответственно 2 и 4 мл 0,025% раствора.

**Побочные действия:** При передозировке строфантина могут появиться экстрасистолия, бигеминия (нарушения сердечного ритма), диссоциация ритма (изменение источника сердечного ритма); в этих случаях необходимо уменьшить при очередных введениях дозу и увеличить промежутки между отдельными введениями, назначить препараты калия. При резком замедлении пульса инъекции прекращают. Возможны тошнота и рвота.

**Противопоказания:** Резкие органические изменения сердца и сосудов, острый миокардит (воспаление мышц сердца), эндокардит (заболевание внутренних полостей сердца), выраженный кардиосклероз (деструктивные изменения в сердечной мышце). Осторожность требуется при тиреотоксикозе (заболевании щитовидной железы) и предсердной экстрасистолии (вид нарушения ритма сердца).

**Форма выпуска:** 0,025% раствор для инъекций в ампулах по 1 мл.

### **Наперстянки листья (Folia Digitalis)**

Каридотоническое (увеличивающее силу сердечных сокращений) средство.

**Показания к применению:** Хроническая сердечная недостаточность различной этиологии (причины), пароксизмальная тахикардия (нарушение ритма сердца).

**Способ применения:** Внутрь порошок листьев и экстракт (концентрат) по 0,05-0,1 г 3-4 раза в день; настоем (0,5:180,0) по столовой ложке 3-4 раза в день; детям от 0,005 до 0,06 г на прием в зависимости от возраста.

Высшая разовая доза для взрослых внутрь - 0,1 г, суточная - 0,5 г.

**Побочные действия:** Обладает кумулятивным свойством (способностью накапливаться в организме).

**Противопоказания:** Выраженная брадикардия (редкий пульс), атриоventрикулярная блокада (нарушение проведения возбуждения по проводящей системе сердца), учащенные приступы стенокардии.

**Форма выпуска:** Экстракт (концентрат) листьев сухой 1:1, листья резаные; порошок листьев наперстянки.

### **АНАПРИЛИН (Anaprilinum)**

**Групповая принадлежность:** β-адреноблокатор

**Фармакологическое действие:** Анаприлин - является β-блокатором действующим как β1- так и β2-адренорецепторы (неизбирательного действия). Анаприлин ослабляет влияние симпатической импульсации на β-рецепторы миокарда, тем самым уменьшается сила и частота сердечных сокращений, блокируется положительный хроно- и иотропный эффект кетахоламинов. При этом снижает потребность сердечной мышцы в кислороде. Под действием анаприлина снижается артериальное давление, а тонус бронхиальных мышц повышается через блокаду β2-адренорецепторов. Также повышается сократительная способность матки. Он повышает секреторную и моторную активность органов желудочно-кишечного тракта.

**Показания к применению:** Анаприлин применяется при лечении ишемической болезни сердца, артериальной гипертензии, стенокардии, нарушениях сердечного ритма (синусовая тахикардия, наджелудочковая и мерцательная тахикардия) в том числе и при тахикардии вызванной тиреотоксикозом. Также анаприлин нашел применение при инфаркте миокарда.

**Способ применения:** Анаприлин назначают внутрь за 10-30 мин до приема пищи, запивая большим количеством жидкости. Назначают анаприлин внутрь, начиная с дозы 0,1г (10 мг). При хорошей переносимости и необходимости дозу препарата постепенно увеличивают на 20 мг в сутки до общей суточной дозы 80-100 мг (в четыре приема). При слабовыраженном эффекте суточную дозу увеличивают до 160-180 мг (иногда и до 300) в 4-6 приемов. При сердечно-сосудистых заболеваниях курс лечения анаприлином составляет от 3 до 4 недель иногда и более. При передозировке анаприлина могут возникнуть выраженная гипотензия, брадикардия, сердечная недостаточность, коллапс, судороги, бронхоспазм. При возникновении подобных симптомов следует срочно отменить прием препарата и произвести промывание желудка, принять активированный уголь и срочно вызвать скорую помощь.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,01 и 0,04 г (10 и 40 мг). Разработана также инъекционная форма препарата.

### **Дифенин (Dipheninum)**

**Групповая принадлежность:** антиаритмическое средство

**Фармакологическое действие:** Изменяет трансмембранный ионный обмен, увеличивая отношение внеклеточного натрия к внутриклеточному; возможно, влияет на трансмембранный обмен кальция, изменяет вызываемый дигиталисом выход калия из миокарда (сердечной мышцы). Противодествует электрофизиологическим изменениям, вызываемым дигоксином, новокаиномидом и ишемией (несоответствием между потребностью и доставкой к сердцу кислорода). Вызывает увеличение коронарного (по сосудам сердца) кровотока. Обладает противосудорожным действием.

**Показания к применению:** Нарушения ритма сердца: суправентрикулярная и желудочковая аритмии, вызванные интоксикацией (отравлением) сердечными гликозидами, суправентрикулярная и желудочковая аритмия различной этиологии (причины), включая трепетание и мерцание предсердий, в тех случаях, когда другие антиаритмические средства неэффективны; аритмии центрального происхождения; профилактический прием перед общей анестезией, дефибрилляцией дигитализированных больных (восстановлением нормального ритма сердца посредством электрических разрядов у больных, принимающих сердечные гликозиды).

**Способ применения:** При приеме внутрь для быстрого достижения терапевтического эффекта - 1000 мг в первые сутки, затем на 2-й и 3-й день по 500-600 мг, далее поддерживающая доза 300-500 мг. В исключительных urgentных (неотложных) случаях иногда дают внутрь разовую дозу 1000 мг.

Внутривенно в urgentных случаях в первый день начинают с 200-300 мг в течение нескольких минут, далее по 50-100 мг через каждые 5 мин при скорости введения 25 мг/мин. Общая суточная доза в первый день до 1000 мг. На 2-й день внутривенно вводят 500 мг, на 3-й - до 400-500 мг и т. д. Во избежание тромбоза (закупорки сосуда сгустком крови) в месте инфузии используют катетеры, которые помещают в крупные вены и периодически промывают.

**Побочные действия:** Тремор (дрожание рук), атаксия (нарушение координации движений), дезартрия (расстройство речи), нистагм (непроизвольные движения глазных яблок), боль в глазах, повышенная раздражительность, кожные высыпания, иногда повышение температуры, желудочно-кишечные расстройства, лейкоцитоз (увеличение числа лейкоцитов в крови), мегалобластическая анемия (снижение содержания эритроцитов в крови), агранулоцитоз (резкое снижение гранулоцитов в крови), стоматиты (воспаление слизистой оболочки полости рта).

**Противопоказания:** Выраженная сердечная недостаточность, гипотензия (низкое артериальное давление), выраженная брадикардия (редкий пульс), высокая степень атриовентрикулярной блокады (нарушение проведения возбуждения по сердцу), повышенная чувствительность к препарату.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 г; ампулы по 250 мг.

## **Лекарственные средства улучшающие кровоснабжение внутренних органов (антиангинальные средства)**

### **Общие сведения о заболеваниях сердца**

Ряд заболеваний, прежде всего сердца и головного мозга, находятся в непосредственной связи с нарушением их кровоснабжения. Среди наиболее распространенных и опасных заболеваний выделяют следующие:

**Ишемическая болезнь сердца** — недостаточность кровоснабжения сердечной мышцы, вызванная атеросклерозом коронарных артерий сердца, тромбированием пораженных атеросклерозом или нормальных артерий называется ишемической болезнью сердца (ИБС). В развитых странах эта болезнь является главной причиной смерти людей трудоспособного возраста.

Ишемия в переводе с латинского языка означает недостаточность кровоснабжения. Сердце человека работает непрерывно всю жизнь. Поэтому оно постоянно нуждается в кислороде и других необходимых для работы веществах. При физической нагрузке возрастает потребность организма в кислороде и питательных веществах и сердце вынуждено работать усиленно, в свою очередь оно тоже нуждается в усиленном кровоснабжении. Более чувствителен к кислородному голоданию только мозг человека.

Для доставки кислорода к мышечным клеткам сердце имеет свою разветвленную систему сосудов. Они называются коронарными артериями. При сужении этих сосудов доставка кислорода и питательных веществ к сердцу уменьшается и сердечная мышца начинает страдать от кислородной недостаточности.

Чаще всего причиной сужения коронарных сосудов бывают так называемые атеросклеротические бляшки, которые образуются на стенках сосудов. Они приводят к уменьшению количества крови прокачиваемой через этот сосуд, к замедлению потока крови. Иногда они могут перекрыть просвет сосуда. Атеросклероз является причиной 97–98% случаев ишемической болезни сердца.

Другие причины (воспаление стенок артерий, травмы и т.д.) встречаются значительно реже. Когда просвет сосуда уменьшается, доставка крови снижается, возникает ишемия.

Особенно опасно это при физической и психоэмоциональной нагрузке, когда сердце должно работать усиленно, когда в свою очередь сердечная мышца нуждается в усиленном питании и большем количестве кислорода, а доставка его ограничена. В таких условиях возникает приступ стенокардии или инфаркт миокарда.

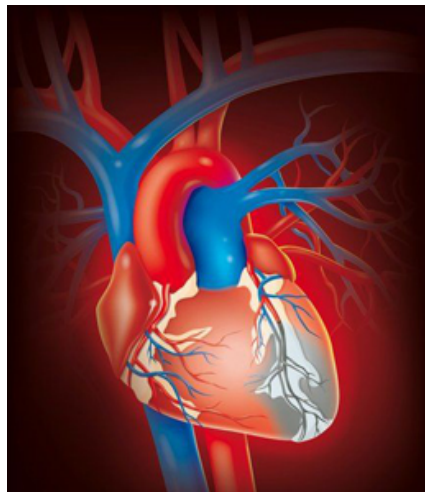
**Основными причинами изменений в сосудах, приводящих к ИБС, называют пищевые факторы:**

- высококалорийное питание, приводящее к развитию ожирения;
- избыточное потребление жиров, особенно животных, увеличивающих концентрацию холестерина в крови;
- недостаток в рационе растительных масел (полиненасыщенных жирных кислот), а также избыток мучного и сладкого;
- недостаточное поступление в организм клетчатки, пектинов и фетатов, содержащихся во фруктах и овощах и обладающих гипохолестеринемическим эффектом;
- дефицит антиоксидантов (витаминов А, Е, С, поступающих с пищей).

Течение болезни может быть различным, поэтому выделяют следующие клинические формы ишемической болезни сердца, которые могут проявляться изолированно или в сочетании друг с другом:

- стенокардия (стенокардия напряжения, стабильная стенокардия, спонтанная или вариантная стенокардия);
  - острая форма ишемической болезни сердца: инфаркт миокарда (крупноочаговый, мелкоочаговый);
  - постинфарктный кардиосклероз;
  - нарушения сердечного ритма или проводимости;
  - сердечная недостаточность;
  - немая форма ишемической болезни сердца;
  - внезапная смерть. Согласно международной классификации сюда относятся случаи внезапного прекращения сердечной деятельности возможно из-за фибрилляции желудочков или асистолии (исчезновении сердечных сокращений) при отсутствии данных, позволяющих поставить другой диагноз.
- Чаще всего причиной внезапной смерти является ишемическая болезнь сердца и при вскрытии находят поражение артерий сердца.

**Инфаркт миокарда** — заболевание сердца, вызванное недостаточностью его кровоснабжения с очагом некроза (омертвения) в сердечной мышце (миокарде); важная форма ишемической болезни сердца. К инфаркту миокарда приводит острая закупорка просвета коронарной артерии тромбом, набухшей атеросклеротической бляшкой.



**Схематическое изображение инфаркта миокарда**

### **Симптомы и течение инфаркта миокарда**

Началом инфаркта миокарда считают появление интенсивной и продолжительной (более 30 минут, нередко многочасовой) загрудинной боли (ангинозное состояние), не купирующейся повторными приемами нитроглицерина; иногда в картине приступа преобладает удушье или боль в подложечной области. Осложнения острого приступа: кардиогенный шок, острая недостаточность левого желудочка вплоть до отека легких, тяжелые аритмии со снижением артериального давления, внезапная смерть.

В остром периоде инфаркта миокарда наблюдаются артериальная гипертония, исчезающая после стихания болей, учащение пульса, повышение температуры тела (2-3 сутки) и числа лейкоцитов в крови, сменяющееся повышением СОЭ, увеличение активности ферментов креатинфосфокиназы, аспаратаминотрансферазы, лактатдегидрогеназы и др. Может возникнуть эпистенокардитический перикардит (боль в области грудины, особенно при дыхании, нередко выслушивается шум трения перикарда). К осложнениям острого периода относят, кроме вышеперечисленных: острый психоз, рецидив инфаркта, острая аневризма левого желудочка (выпячивание его истонченной

некротизированной части), разрывы — миокарда, межжелудочковой перегородки и папиллярных мышц, сердечная недостаточность, различные нарушения ритма и проводимости, кровотечения из острых язв желудка и др. При благоприятном течении процесс в сердечной мышце переходит в стадию рубцевания. Полноценный рубец в миокарде формируется к концу 6 месяца после его инфаркта.

**Диагностика инфаркта миокарда** проводится на основании анализа клинической картины, характерных изменений электрокардиограммы при динамическом наблюдении, повышения уровня кардиоспецифических ферментов. В сомнительных случаях проводится эхокардиография (выявление «неподвижных» зон миокарда) и радиоизотопное исследование сердца (сцинтиграфия миокарда).

**Лечение инфаркта миокарда.** Необходима срочная госпитализация больного. До приезда скорой помощи необходимо дать больному нитроглицерин (от одной до нескольких таблеток с интервалом 5–6 минут). Валидол в этих случаях неэффективен. В стационаре возможны попытки восстановления проходимости коронарных сосудов (расплавление тромбов с помощью стрептокиназы, стретодеказы, альвезина, фибринолизина и др., введение гепарина, срочное хирургическое вмешательство — неотложное аорто-коронарное шунтирование). Обязательны обезболивающие препараты (наркотические анальгетики, анальгин и его препараты, возможен наркоз закисью азота и др., перидуральная анестезия — введение обезболивающих веществ под оболочки спинного мозга), применяется нитроглицерин (внутривенно и внутрь), антагонисты кальциевых каналов (верапамил, нифедипин, сензит), бетаадреноблокаторы (обзидап, анаприлин), антиагреганты (аспирин), проводят лечение осложнений. Большое значение имеет реабилитация (восстановление стабильного уровня здоровья и трудоспособности больного). Активность больного в постели — с первого дня, присаживание — со 2-4 дня, вставание и ходьба — на 7-9-11 дни. Сроки и объем реабилитации подбираются строго индивидуально, после выписки больного из стационара она завершается в поликлинике или санатории.

### **Стенокардия, признаки, симптомы.**

Приступы внезапной боли в груди вследствие острого недостатка кровоснабжения сердечной мышцы это клиническая форма ишемической болезни сердца, называемая **стенокардией**. Стенокардия в большинстве случаев, как и другие формы ИБС, обусловлена атеросклерозом артерий сердца. Атеросклеротические бляшки при стенокардии сужают просвет артерий и препятствуют их рефлекторному расширению. Что в свою очередь вызывает дефицит сердечного кровоснабжения, особенно острый при физических или (и) эмоциональных перенапряжениях.

При стенокардии боль всегда отличается следующими признаками:

- носит характер приступа, т. е. имеет четко выраженное время возникновения и прекращения, затихания;
- возникает при определенных условиях, обстоятельствах;
- начинает стихать или совсем прекращается под влиянием приёма нитроглицерина.

Условия появления приступа стенокардии чаще всего — ходьба (боль при ускорении движения, при подъеме в гору, при резком встречном ветре, при ходьбе после еды или с тяжелой ношей), но также приступ стенокардии может возникнуть и при ином физическом усилии, или (и) значительном эмоциональном напряжении. Обусловленность боли физическим усилием проявляется в том, что при его продолжении или возрастании непременно возрастает и интенсивность боли, а при прекращении усилия боль стихает или исчезает в течение нескольких минут. Названные три особенности боли достаточны для постановки клинического диагноза приступа стенокардии и для отграничения его от различных болевых ощущений в области сердца и вообще в груди, не являющихся стенокардией.



Стенокардию часто можно распознать при первом же обращении больного, тогда как для отклонения диагноза стенокардии необходимы наблюдение за течением стенокардии и анализ данных неоднократных расспросов и обследований больного стенокардией. Следующие признаки дополняют клиническую характеристику стенокардии, но их отсутствие не исключает диагноз стенокардии:

- локализация боли за грудиной (наиболее типична!), отдавать она может в область шеи, в нижнюю челюсть, и зубы, в руку, как правило, левую, в надплечье и лопатку (чаще слева);
- характер боли — давящий, сжимающий, реже — жгучий (подобно изжоге) или ощущение инородного тела в груди (иногда больной может испытывать не болевое, а тягостное ощущение за грудиной и тогда он отрицает наличие собственно боли);
- одновременные с приступом стенокардии повышения АД, бледность покровов, испарина, колебания частоты пульса, появление ощущения перебоев в области сердца. Все вышеперечисленное характеризует, так называемую **стенокардию напряжения**, то есть вариант стенокардии возникающей при нагрузках.

Тщательность врачебного расспроса определяет своевременность и правильность диагностики стенокардии. Следует иметь в виду, что нередко больной стенокардией, испытывая типичные для стенокардии ощущения, не сообщает о них врачу как о «не относящихся к сердцу», или, напротив, фиксирует внимание на диагностически второстепенных ощущениях «в области сердца», что затрудняет диагностику стенокардии.

**Стенокардия покоя** в отличие от стенокардии напряжения возникает вне связи с физическим усилием, чаще по ночам, но в остальном сохраняет все черты тяжелого приступа грудной жабы и нередко сопровождается ощущением нехватки воздуха, удушьем.

Следует иметь в виду, что приступ стенокардии, может быть началом развития такой грозной формы ИБС, как инфаркт миокарда. Поэтому приступ стенокардии, затянувшийся на 20 — 30 мин, а также учащение или усиление приступов стенокардии требует электрокардиографического обследования в ближайшие часы (сутки), а так же, врачебного наблюдения за дальнейшим развитием процесса стенокардии. Чтобы обеспечить всё это, нужна непременно госпитализация пациента

**Лечение стенокардии.** Первое, что должен сделать человек во время приступа стенокардии, это принять спокойное, предпочтительно сидячее положение. Второе не менее важное условие при приступе стенокардии это приём нитроглицерина под язык (1 таблетка или 1-2 капли 1% раствора на кусочке сахара, на таблетке валидола), повторный прием препарата при отсутствии эффекта через 2-3 мин. С целью успокоения пациента показан корвалол (валокардин) — 30-40 капель внутрь. Повышение артериального давления во время лечения стенокардии не требует экстренных мер, так как его снижение наступает спонтанно у большинства больных стенокардией при прекращении приступа стенокардии.

**Профилактика стенокардии.** Общие принципы поведения пациента страдающего приступами стенокардии заключаются в необходимости: избегать нагрузок (как физических, так и эмоциональных), приводящих к приступу стенокардии, пользоваться нитроглицерином без опасений, принимать его «профилактически» в предвидении напряжения, чреватого приступом стенокардии. Важны так же лечение сопутствующих стенокардии заболеваний, особенно органов пищеварения, меры профилактики атеросклероза, сохранение и постепенное расширение пределов физической активности. Кроме приёма самого нитроглицерина, действующего непродолжительное время, важно постоянно принимать препараты длительного действия, так называемые, пролонгированные нитраты (нитромазин, нитросорбид, тринитролонг и др.). Их следует применять систематически, а по прекращению приступов стенокардии (стабилизация

течения) — лишь перед нагрузками (поездка по городу, эмоциональные напряжения и т. п.).

### **Ишемический инсульт признаки, симптомы.**

**Ишемический инсульт** - это клинический синдром, проявляющийся острым нарушением локальных функций мозга, который продолжается более 24 часов. Без оказания своевременной медикаментозной помощи ишемический инсульт может привести к смерти больного.

Ишемический инсульт, может быть вызван либо недостаточностью кровоснабжения в определенной зоне мозга в результате снижения мозгового кровотока, тромбоза, либо эмболии, связанных с заболеваниями сосудов, сердца или крови.

Среди основных этиологических факторов, приводящих к развитию ишемического инсульта (ИИ), следует отметить атеросклероз, артериальную гипертензию и их сочетание. Исключительно важна также роль факторов, способствующих повышению свертывающих свойств крови и увеличению агрегации ее форменных элементов. Риск возникновения ИИ возрастает при наличии сахарного диабета, заболеваний миокарда, особенно сопровождающихся расстройствами сердечного ритма.

Одним из важнейших патогенетических механизмов развития *нетромботического ишемического инсульта* является сужение просвета магистральных артерий головы или интракраниальных сосудов вследствие атеросклероза.

Отложение липидных комплексов в интиме артерии приводит к поражению эндотелия с последующим формированием в этой зоне атероматозной бляшки. В процессе ее эволюции размеры бляшки увеличиваются за счет оседания на ней форменных элементов, просвет сосуда при этом сужается, нередко достигая уровня критического стеноза или полной окклюзии. Наиболее часто формирование атеросклеротических бляшек наблюдается в зонах крупных сосудов, в частности сонных артерий, вблизи устья позвоночных артерий. Сужение просвета церебральных артерий наблюдается при воспалительных заболеваниях – артериитах. В значительном числе случаев наблюдаются врожденные аномалии строения сосудистой системы мозга в виде гипоплазии или аплазии сосудов, их патологической извитости. В развитии заболевания определенное значение имеет экстравазальная компрессия позвоночных артерий на фоне патологически измененных позвонков. Поражение артерий мелкого калибра и артериол наблюдается при сахарном диабете и артериальной гипертензии.

**Симптомы ишемического инсульта:** Клиническая картина ишемического инсульта представлена симптомами внезапного выпадения функции определенного отдела головного мозга. Они определяются тем отделом головного мозга, который поражен ишемией, объемом повреждения. В большинстве случаев симптомами, которые возникают у пациентов, являются нарушения речи, двигательных и чувствительных функций, зрения на одной стороне.

Слабость или неловкость движений на одной стороне тела, полные или частичные (гемипарез). Одновременное двустороннее развитие слабости в конечностях (парапарез, тетрапарез). Нарушения глотания (дисфагия). Нарушения координации (атаксия). Нарушения понимания или использования речи (афазия). Нарушения чтения (алекия) и письма (аграфия). Нарушения счета (акалькулия). Смазанность речи (дизартрия).

Соматосенсорные изменения чувствительности на одной стороне тела, полное или частичное (гемигипестезия). Зрительные - снижение зрения на один глаз, полное или частичное (преходящая монокулярная слепота). Выпадения правой или левой половины (или квадранта) поля зрения (гемианопсия, квадрантная гемианопсия). Двусторонняя слепота. Двоение перед глазами (диплопия). Ощущение вращения предметов (системное головокружение). Человеку трудно одеваться, причесываться, чистить зубы и т.д.; нарушение ориентации в пространстве; нарушения копирования рисунков, например,

часов, цветка или пересекающихся кубиков (нарушения зрительно-пространственного восприятия). Нарушения памяти (амнезия).

### **Средства применяемые при лечении ишемической болезни сердца**

Сердце, как постоянно работающий орган чрезвычайно чувствительно к недостатку кислорода и других питательных веществ. При спазме или тромбозе коронарных сосудов нарушается кровоснабжение определенных участков сердечной мышцы (миокарда). Если такое состояние развивается постепенно (хроническая сердечная недостаточность), то постепенно у больного формируется ишемическая болезнь сердца, которая на определенном этапе может не доставлять больному беспокойства, но проявиться при физических или психологических нагрузках.

При интенсивной физической работе усиливается работа сердца, и как следствие, увеличивается потребность миокарда в кислороде.

Регуляция коронарного кровотока обеспечивается нейрогенным и метаболическим влиянием. Нейрогенный механизм (действие симпатической нервной системы и адреналина) осуществляется посредством адренорецепторов. Действие на  $\alpha$ -адренорецепторы адреналина и норадреналина вызывает сужение коронарных сосудов, а действие на  $\beta$ -адренорецепторы – расширение сосудов, увеличением силы и частоты сердечных сокращений. Парасимпатическая нервная система (блуждающий нерв) не оказывает прямого влияния на коронарные сосуды, но оказывает косвенное воздействие путем уменьшения частоты сердечных сокращений и, как следствие, способствуют улучшению коронарного кровотока.

Метаболические механизмы обеспечивают ауторегуляцию коронарного кровотока (под ауторегуляцией кровотока понимают тенденцию к сохранению его величины в органических сосудах). Чем интенсивнее работает миокард, тем больше образуется коронарорасширяющих метаболитов (прежде всего аденозина – продукта обмена АТФ). Сосудорасширяющим действием обладает также углекислый газ, оксид азота, простаглицлин (простациклин - высокоактивный метаболит арахидоновой кислоты. Вместе с простагландинами и тромбоксаном А2 образуют подкласс простаноидов),

Кислородная недостаточность сердца (ишемическая болезнь сердца) возникает вследствие несоответствия потребности в кислороде сердечной мышцы, возрастающей в результате физической или психической нагрузки и реального поступления кислорода в миокард. Сердечная недостаточность особенно часто развивается при уменьшении диаметра кровеносных сосудов в результате развития атеросклероза, когда способность расширяться, в ответ на увеличение потребности в кислороде, ограничивается.

Острая стадия ишемической болезни, сопровождающаяся сильными загрудинными болями в области сердца, называется **стенокардией** (грудной жабой). Стенокардия проявляется в виде приступов, которые могут заканчиваться без серьезных осложнений, однако могут спровоцировать и более серьезные последствия, такие как инфаркт миокарда.

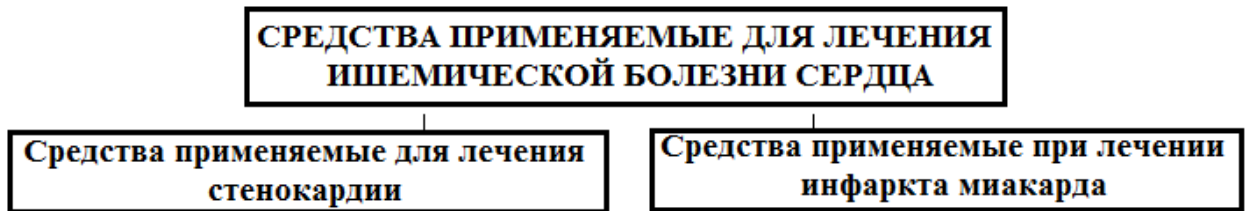
Длительное кислородное голодание сердечной мышцы (например в результате ишемической болезни или приступа стенокардии) может спровоцировать инфаркт миокарда, при котором происходят необратимые изменения на отдельных участках сердечной мышцы. При обширном очаге поражения вероятна смерть больного либо вследствие разрыва стенки сердца на участке пораженном инфарктом, либо вследствие быстро развивающейся острой сердечной недостаточности. При небольших размерах пораженного участка и оказании своевременной квалифицированной медицинской помощи, происходит постепенное заживление омертвевшего участка миокарда с образованием рубца и выздоровление больного.

### **Средства применяемые при лечении ишемической болезни сердца**

Для лечения ишемической болезни сердца существует достаточно большой перечень медикаментозных средств, которые условно делят на две группы:

1. Средства, применяемые для лечения стенокардии (антиангинальные);
2. Средства, применяемые при инфаркте миокарда;

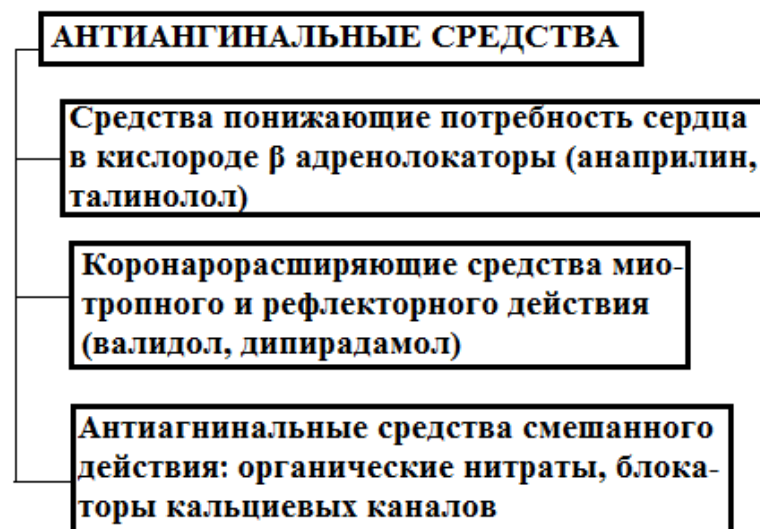
Кроме острой сердечной недостаточности, выделяют также хроническую сердечную недостаточность – вялотекущую форму заболевания, с периодическими процессами обострения и ремиссии (улучшения состояния).



Исходя из вышеприведенной классификации, антиангинальные средства условно подразделяют на три группы:

1. Средства понижающие потребность сердца в кислороде  $\beta$  адреноблокаторы (анаприлин, галинолол);
2. Коронарорасширяющие средства миотропного и рефлекторного действия: (валидол, дипирадамола);
3. Антиангинальные средства смешанного действия: органические нитраты, блокаторы кальциевых каналов;

Лекарственные средства перечисленных групп применяются как для лечения и профилактики хронической сердечной недостаточности, так и для купирования острых приступов (нитроглицерин).



#### **Средства применяемые для профилактики и лечения стенокардии**

Наиболее эффективными средствами, применяемыми при стенокардии являются коронарорасширяющие препараты. Эти средства применяются как для купирования (прекращения) приступа, так и профилактики (предупреждения).

Для купирования приступов стенокардии наиболее эффективным лекарственным средством является нитроглицерин, который принимают сублингвально (под язык) – 1 таблетка либо 1 – 2 капли (раствора) на кусочек сахара. Нитроглицерин хорошо всасывается слизистой оболочкой ротовой полости, действие его наступает быстро (в течение 1 – 2 минут, но относительно не продолжительно - 20 – 30 минут).

Нитроглицерин устраняет рефлекторные спазмы коронарных сосудов, оказывает прямое (миотропное) коронарорасширяющее действие за счет высвобождения из нитроглицерина окиси азота (NO). Нитроглицерин способствует «разгрузке» сердца за счет снижения артериального давления и уменьшения притока венозной крови к сердцу и соответственно снижению потребления кислорода сердечной мышцей. Недостатком нитроглицерина в какой то мере можно считать широкий спектр фармакологического действия, поскольку расширяются не только коронарные сосуды, но и сосуды сердца, что вызывает головную боль, шум у ушах, головокружение. Нитроглицерин противопоказан в острой стадии инфаркта миокарда.

Достаточно распространенным лекарственным средством для снятия приступов стенокардии является валидол, который принимается сублингвально (под язык) во время приступов (1 – 2 таблетки или 4 – 5 капель на кусочек сахара). Коронарорасширяющее действие наступает быстро (в течение 1 – 2 минут) и является рефлекторным вследствие раздражения ментолом слизистой оболочки ротовой полости. Валидол значительно уступает нитроглицерину по терапевтической активности

Для профилактики приступов стенокардии применяют специальные лекарственные формы нитроглицерина длительного (пролонгированного действия), такие как сустак, тринитролонг, нитронг и др. Сустак и нитронг – микрокасулированные формы нитроглицерина, одна часть таблетки лекарственных препаратов быстро всасывается и оказывает терапевтическое действие через 10 минут, вторая часть – всасывается медленно, действуя в течении нескольких часов.

Тринитолонг – полимерные пленки, содержащие 0,001 и 0,002 г нитроглицерина. Пленка накладывается на слизистую оболочку десны, продолжительность действия препарата – 3 – 4 часа. Тринитролонг применяют как для купирования, так и для профилактики приступов стенокардии.

К нитратам длительного действия относятся также эринит, натрия нитрит, нитросорбит, динитросорбилонг и др. Эти препараты принимаются внутрь, в том числе для профилактики приступов стенокардии.

Для нитратов характерно образование метгемоглобина, которое отчетливо проявляется при передозировке лекарственных средств (кровь становится шоколадного цвета). Метгемоглобин обладает способностью связывать в организме синильную кислоту и ее соли, блокирующие дыхательные ферменты. Поэтому, при отравлении цианидами вводят большие дозы нитритов (натрия нитрит, амилнитрит и др).

При лечении сердечной недостаточности было установлено, что часто более благоприятный эффект дают не коронарорасширяющие средства, а лекарственные препараты уменьшающие потребность миокарда в кислороде (антигипоксические средства), поскольку эффективность коронарорасширяющих средств резко снижается при атеросклерозе.

Наиболее эффективным антигипоксическим средством является анаприлин. Анаприлин относится к группе  $\beta$  адреноблокаторов, обладает способностью не расширяя коронарные сосуды значительно понижать потребность миокарда в кислороде. Недостатком анаприлина является его способность вызывать бронхоспазм, поэтому больным бронхиальной астмой назначают другие кардиоселективные препараты из группы  $\beta$  адреноблокаторов (метопролол, талинолол), избирательно блокирующих  $\beta_1$  адренорецепторы. Кроме того,  $\beta$  адреноблокаторы оказывают противоаритмическое и антигипертензивное действие, что также является положительным фактором при лечении сердечной недостаточности.

Антиангинальным действием обладает также лекарственный препарат амидарон (кордарон), применяемый для лечения хронической сердечной недостаточности (ишемической болезни). По механизму терапевтического действия амидарон оказывает угнетающее действие на  $\alpha$  и  $\beta$  адренорецепторы сердца. Амидарон уменьшает работу сердца, однако сердечный выброс и сократимость миокарда (сердечной мышцы) существенно не изменяет. Одновременно он увеличивает коронарный (по сосудам сердца) кровоток путем уменьшения сопротивления в коронарных артериях. Урежает частоту сердечных сокращений и вызывает снижение артериального давления, обусловленное его периферическим сосудорасширяющим действием. Это приводит к уменьшению потребления кислорода миокардом.

К препаратам одновременно уменьшающим потребность миокарда в кислороде и расширяющих коронарные сосуды относятся антагонисты кальция: верапамил, фенигидин, сензит и пр. Механизм действия лекарственных средств этой группы заключается в их способности блокировать кальциевые каналы мембран мышечных клеток, ослабляют работу сердца и расширяя кровеносные сосуды. Кроме того эти лекарственные средства обладают антиаритмическим и антигипертензивным действием.

К группе антиангинальных средств, обладающих миотропным коронарорасширяющим действием относятся такие лекарственные препараты, как но-шпа, папаверин, дипиридамол, карбокромен и др., хотя механизм действия на сосудистую систему у них различный.

Так, дипиридамол способствует накоплению аденозина в сердечной мышце, аденозин в свою очередь, обладает сильным коронарорасширяющим действием, а также способностью тормозить образование тромбоцитов (тромбоза).

Карбокромен оказывает ингибирующее (тормозящее действие на фермент фосфодиэстеразу, способствуя накоплению циклического аденозинмонофосфата в мышцах коронарных артерий и повышению их тонуса. Аденозинмонофосфат – производное АТФ, выполняющее в организме роль вторичного посредника, использующегося для внутриклеточного распространения сигналов некоторых гормонов (например, глюкагона или адреналина), которые не могут проходить через клеточную мембрану.

### **Средства применяемые при инфаркте миокарда**

При инфаркте миокарда у больного возникают чрезвычайно сильные загрудинные боли в области сердца, быстро нарастают симптомы острой сердечной недостаточности, развивается аритмия, падает артериальное давление, развивается кардиогенный шок.

Такое многообразие быстро развивающихся симптомов требует комплексного применения лекарственных средств различных фармакологических групп. Прежде всего, для предупреждения кардиогенного шока и снятия болевого синдрома применяются наиболее эффективные обезболивающие средства из группы наркотических альгетиков (морфин, промедол, омнопон, фентанил). Для предупреждения развития острой сердечной недостаточности назначают сердечные гликозиды быстрого и короткого действия (строфантин, коргликон, конваллятоксин). При развитии аритмий – противоаритмические средства (новокаиномид). Для восстановления нормального артериального давления вводят норадреналин и мезатон, повышающие тонус сосудов. Адреналин противопоказан так как создает дополнительную нагрузку на сердце, усиливая его работу и увеличивая потребность миокарда в кислороде. Поскольку причиной инфаркта часто бывает закупорка коронарных сосудов применяются могут применяться противосвертывающие и фибринолитические средства (гепарин, фибринолизин).

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов:**

### **Сустак (Sustac)**

**Групповая принадлежность:** Сосудорасширяющее (вазодилатирующее) средство пролонгированного действия.

**Фармакологическое действие:** Микрокапсулированная лекарственная форма нитроглицерина пролонгированного (длительного) действия в виде таблеток, Таблетки содержат микрокапсулы с нитроглицерином, часть которых быстро распадается при приеме внутрь и дает эффект примерно через 10 мин, а другая часть распадается постепенно и действует в течение нескольких часов.

**Показания к применению:** Применяют для предупреждения приступов стенокардии при хронической коронарной недостаточности (несоответствии кровотока по сердечным артериям потребности сердца в кислороде).

**Способ применения:** Назначают внутрь; проглатывают, не разжевывая и не разламывая таблетки; запивают небольшим количеством воды. Необходим индивидуальный подбор доз. Имеются данные, что после того, как заканчивается положительный эффект от разовой дозы, может наступить “эффект последействия” с ухудшением состояния больного. Поэтому вместо 2-разового приема сустакмита стали назначать 3-4 раза в сутки.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 25 таблеток.

### **Валидол (Validolum)**

**Групповая принадлежность:** Сосудорасширяющее (вазодилатирующее) средство.

**Фармакологическое действие:** Оказывает успокаивающее влияние на центральную нервную систему и обладает рефлекторным сосудорасширяющим действием.

**Показания к применению:** Стенокардия, невроты, истерия; морская болезнь (в качестве противорвотного средства).

**Способ применения:** Сублингвально (под язык) по 0,06 г или 4-5 капель раствора на кусочек сахара.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,06 г в упаковке по 10 штук. Во флаконах по 5 мл. Капсулы по 0,05 и 0,1 г в упаковке по 20 штук.

### **Циннаризин (Cinnarizine)**

**Групповая принадлежность:** блокатор кальциевых каналов (антагонист ионов кальция).

**Фармакологическое действие:** Фармакологические свойства циннаризина в значительной мере обусловлены его способностью блокировать мембранные кальциевые каналы (см. Антагонисты ионов кальция). Он ингибирует (подавляет) поступление в клетки ионов кальция.

Циннаризин положительно влияет на мозговое, периферическое и коронарное (сердечное) кровообращение; улучшает микроциркуляцию. Повышает способность эритроцитов к деформации (повышению пластичности) и уменьшает повышенную вязкость крови. Повышает устойчивость тканей к гипоксии (недостаточному снабжению тканей кислородом или нарушению его усвоения). Препарат оказывает непосредственное спазмолитическое (снимающее спазмы) действие на кровеносные сосуды, уменьшает их реакцию на биогенные сосудосуживающие вещества.

**Показания к применению:** Как цереброваскулярное (влияющее на сосуды мозга) средство назначают при нарушениях мозгового кровообращения, связанных со спазмом (резким сужением просвета) сосудов, атеросклерозом, перенесенными черепно-мозговыми травмами, инсультом. Препарат уменьшает церебрастенические явления (ослабление функции мозга), головную боль, шум в ушах, улучшает общее состояние. Назначают циннаризин при мигрени, болезни Меньера (болезни внутреннего уха).

**Способ применения:** Принимают циннаризин внутрь после еды: при нарушениях мозгового кровообращения - обычно по 25 мг (1 таблетка) 3 раза в день или по 75 мг (1 капсула) 1 раз в день; при нарушениях периферического кровообращения - по 50-75 мг (2-3 таблетки) 3 раза в день или по 2-3 капсулы (по 75 мг в каждой) в день. Применяют препарат относительно длительно (курсами от нескольких недель до нескольких месяцев). При вестибулярных расстройствах рекомендуется давать по 25 мг 3 раза в день. При выраженной артериальной гипотензии (пониженном артериальном давлении) препарат назначают в уменьшенных дозах (0,025 г 2 раза в день).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,025 г (25 мг) в упаковке по 50 штук; капсулы по 75 мг циннаризина (стугерон форте) в упаковке по 20 и 60 штук, а также в виде капель во флаконах по 20 мл с содержанием 75 мг циннаризина. -

### **Дипиридамол (Dipyridamol)**

**Групповая принадлежность:** Сосудорасширяющее (вазодилатирующее) и антиагрегационное средство.

**Фармакологическое действие:** Дипиридамол был первоначально предложен в качестве коронарорасширяющего (расширяющего сосуды сердца) антиангинального (противостенокардического) средства. По экспериментальным данным, препарат расширяет коронарные сосуды (сосуды сердца), увеличивает объемную скорость коронарного (сердечного) кровотока, улучшает снабжение миокарда (сердечной мышцы) кислородом. Повышает толерантность миокарда к гипоксии (устойчивость сердечной мышцы к нехватке кислорода). При нарушении кровообращения в основных коронарных сосудах препарат

способствует улучшению кровообращения в коллатеральной сосудистой сети (по сосудам, по которым происходит движение крови в обход пораженного сосуда). Под его влиянием уменьшается также общее периферическое сопротивление (общее механическое сопротивление току крови по сосудам), несколько понижается системное артериальное давление, улучшается мозговое кровообращение.

**Показания к применению:** В основном применяют как антиагрегационное (препятствующее склеиванию тромбоцитов) средство для предупреждения послеоперационных тромбозов (образования сгустка крови в сосуде), при инфаркте миокарда, нарушениях мозгового кровообращения.

**Способ применения:** Принимают внутрь в качестве антитромботического (препятствующего свертыванию крови) средства по 0,025 г (25 мг) 3 раза в сутки. Как средство для лечения стенокардии принимают внутрь (натощак за 1 ч до еды) по 0,025-0,05 г (1-2 драже по 0,025 г) 3 раза в день. В более тяжелых случаях по 0,225 г (225 мг - 3 драже по 0,075 г) в сутки в 3 приема. Курс лечения продолжается от нескольких недель до нескольких месяцев.

**Форма выпуска:** Таблетки (драже) по 0,025 и 0,075 г.; 0,5% раствор в ампулах по 2 мл (0,01 г).

### Нимодипин (Nimodipine)

**Групповая принадлежность:** блокатор кальциевых каналов (антагонист ионов кальция).

**Фармакологическое действие:** Относится к группе антагонистов ионов кальция и обладает основными свойствами, характерными для этих препаратов. Однако специфической особенностью нимодипина является его преимущественное влияние на кровоснабжение мозга, способность снижать сопротивление резистентных сосудов (артериол) мозга, улучшать мозговое кровообращение, уменьшать гипоксические (связанные с нехваткой кислорода) явления.

**Показания к применению:** Нимодипин применяют как профилактическое и лечебное средство при ишемических нарушениях мозгового кровообращения (несоответствии между потребностью тканей мозга в кислороде и его доставкой с кровью).

**Способ применения:** Нимодипин назначают сразу после наступления острой ишемии (субархноидальной геморрагии /кровоизлияния под оболочку мозга/) и продолжают лечение в течение 5-14 дней. В первые 2 ч взрослым вводят внутривенно (в виде медленной инфузии) по 0,001 г (1 мг) нимодипина (5 мл 0,02% раствора) 2 раза в час. Через 2 ч увеличивают дозу до 2 мг (10 мл) в 1 ч (около 30 мкг/кг в час), следя за гемодинамикой, чтобы избежать слишком резкого снижения артериального давления.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,03 г (30 мг) в упаковке по 20; 50 или 100 штук; 0,02% раствор во флаконах или полиэтиленовых (не поливинилхлоридных во избежание взаимодействия) упаковках по 50 мл (всего 10 мг) для инфузий.

### Эуфиллин (Euphyllinum)

**Групповая принадлежность:** Бронходилатирующее средство - фосфодиэстеразы ингибитор (Бронходилатирующее действие, связанное с расслаблением гладкой мускулатуры бронхов или уменьшением отека слизистой оболочки, приводящее к улучшению проходимости дыхательных путей).

**Фармакологическое действие:** Действие эуфиллина обусловлено в первую очередь содержанием в нем теофиллина. Этилендиамин усиливает спазмолитическую (снимающую спазмы) активность и способствует растворению препарата. Механизм действия эуфиллина в основном сходен с механизмом действия теофиллина. Препарат сильно тормозит агрегацию (склеивание) тромбоцитов.

**Показания к применению:** Применяют эуфиллин при бронхиальной астме и бронхоспазмах (резком сужении просвета бронхов) различной причины (в основном для снятия приступов), гипертензии в малом круге кровообращения (повышенном давлении в сосудах легких), а также при сердечной астме, особенно когда приступы сопровождаются бронхоспазмом и нарушениями дыхания по типу Чейна-Стокса. Рекомендуются также для купирования (снятия) церебральных сосудистых кризов (кризов мозговых сосудов) атеросклеротического происхождения и улучшения мозгового кровообращения, уменьшения внутричерепного давления и отека мозга при ишемических инсультах (остром нарушении мозгового кровообращения), а также при хронической недостаточности мозгового кровообращения. Препарат улучшает почечный кровоток и может быть использован при наличии соответствующих показаний.

**Способ применения:** Назначают эуфиллин внутрь, в мышцы, вену и в микроклизмах. Под кожу растворы эуфиллина не вводят, так как они вызывают раздражение тканей. Способ введения зависит от особенностей случая: при острых приступах бронхиальной астмы и инсультах вводят внутривенно, в менее тяжелых случаях - внутримышечно или внутрь. Внутрь взрослые принимают по 0,15 г после еды 1-3 раза в день. Детям внутрь дают из расчета 7-10 мг/кг в сутки в 4 приема. Длительность курса лечения - от нескольких дней до нескольких месяцев. В вену вводят взрослым медленно (в течение 4-6 мин) по 0,12-0,24 г (5-10 мл 2,4% раствора), которые предварительно разводят в 10-20 мл изотонического раствора натрия хлорида.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,15 г в упаковке по 30 штук; ампулы по 10 мл 2,4% раствора и по 1 мл 24% раствора в упаковках по 10 штук.

### Амлодипин (Amlodipine)

**Групповая принадлежность:** блокатор кальциевых каналов (антагонист ионов кальция).



**Фармакологическое действие:** Препарат относится к категории пролонгированных избирательных блокаторов кальциевых каналов группы производных дигидропиридина. Амлодипин способен селективно блокировать каналы L-типа, расположенные в сосудистой стенке, и в миокарде, в частности в клетках сократительных и проводящих систем сердечной мышцы. Блокируя прохождение ионов кальция через мембрану, препарат препятствует повышению внутриклеточной концентрации кальция. Вследствие чего угнетается сократительная активность клеток сосудистой стенки, снижается тонус сосудов, понижается артериальное давление.

Под действием препарата происходит расширение не только артерий и артериол, но и периферических сосудов, в том числе коронарных, таким образом, снижается интенсивность проявлений ишемии сердечной мышцы, облегчается течение стенокардии. За счет снижения тонуса сосудов без увеличения частоты сердечных сокращений снижается нагрузка на сердце, что также способствует снижению потребности сердца в кислороде. Терапевтический эффект наступает через 2-4 часа после перорального приема препарата и длится в течение суток (эффект сохраняется в состоянии покоя и в состоянии физической нагрузки).

**Показания к применению:** Препарат применяют для лечения артериальной гипертензии у взрослых (допускается как монотерапия Амлодипином, так и комбинация его с другими гипотензивными препаратами). Для лечения стенокардии напряжения, стенокардии Принцметала (вазоспастическая стенокардия), в том числе показана терапия в тех случаях когда нитраты и В-адреноблокаторы не оказывают ожидаемого эффекта. Лечение ишемической болезни сердца, в том числе хронической. Препарат можно использовать у пациентов с хронической сердечной недостаточностью и бронхиальной астмой.

**Способ применения:** При лечении неосложненной артериальной гипертензии принимают 2,5 мг препарата 1 раз в сутки. При гипертонии осложненной ишемической болезнью сердца и стенокардией принимают 5 мг препарата 1 раз в сутки. При необходимости доза препарата может быть увеличена до 10 мг.

**Форма выпуска:** Таблетки по 2,5 ; 5 или 10 мг действующего вещества по 10 шт. в блистере по 1 или 3 блистера в картонной упаковке. По 5 или 10 мг действующего вещества по 100 шт. в банке из полимерных материалов, в картонной коробке.

### **Атенолол (Atenolol)**

**Групповая принадлежность:** Гипотензивное комбинированное средство.

**Фармакологическое действие:** Препарат обладает кардиоселективной активностью относительно В-адренорецепторов, препарат не оказывает симпатомиметического действия, не блокирует выход медиатора в синаптическую щель и не снижает его количество в пресинаптической части. Не оказывает стабилизирующего действия на цитоплазматические мембраны, препарат уже в небольших дозах способен блокировать В-адренорецепторы сердца, при этом снижается уровень катехоламинов, которые в свою очередь стимулируют образование метаболитов АТФ (в частности цАМФ). За счет снижения концентраций ионов  $Ca^{2+}$  прием препарата способствует снижению сократимости миокарда, уменьшает частоту сердечных сокращений, проводимость и возбудимость в сердечной мышце. Оказывает гипотензивный эффект относительно систолического и диастолического давления, снижается минутный объем кровообращения и ударный объем крови. При длительном приеме препарата снижается частота сердечных сокращений в состоянии покоя и в периоды физических нагрузок. За счет уменьшения частоты сердечных сокращений и воздействия симпатической системы на миокард снижается потребность сердечной мышцы в кислороде. Так проявляется антиангинальный эффект препарата.

Однако одновременно с этим повышается диастолическое давление в желудочках сердца и происходит усиление напряжения на гладкую мускулатуру желудочков, таким образом, повышается потребность миокарда в кислороде, особенно сильно проявляется это свойство препарата у пациентов страдающих сердечной недостаточностью. Препарат оказывает также умеренный антиаритмический эффект, это обусловлено способностью атенолола уравнивать воздействие симпатической и парасимпатической систем на миокард, устранять тахикардию, и артериальную гипертензию, которые являются основными факторами, провоцирующими нарушение сердечного ритма.

**Показания к применению:** Применяется у взрослых для лечения таких патологий сердечно-сосудистой системы как: Ишемическая болезнь сердца; Стенокардия напряжения, стенокардия покоя, нестабильная стенокардия (кроме стенокардии Принцметала); Артериальная гипертензия, гипертоническая болезнь, в том числе гипертонический криз; Снижение тонуса мышц у митрального клапана, гиперкинетический кардиальный синдром, вызванный функциональными нарушениями в сердце; Нейроциркуляторные нарушения с гипертоническими осложнениями; Старческий тремор, тремор при абстинентном синдроме, эссенциальный тремор. Лечение и профилактика: Инфаркта миокарда, в том числе поддерживающая терапия после острых состояний; Аритмий различной этиологии (в том числе на фоне анестезии, тиреотоксикоза, инфаркте миокарда у пациентов, не страдающих сердечной недостаточностью); Наджелудочковая и желудочковая экстрасистолии, синусовая тахикардия, пароксизмальная предсердная тахикардия, другие виды аритмий; Трепетание предсердий;

**Способ применения:** Таблетки рекомендуется принимать перед приемом пищи, таблетку глотают, не разжевывая и запивая достаточным количеством воды. Дозу препарата подбирают для каждого пациента индивидуально, начальная терапевтическая доза при стенокардии составляет 50 мг однократно, при отсутствии или недостаточности эффекта дозу увеличивают, максимальная суточная доза 200 мг (при

нарушении функции почек и у пациентов пожилого возраста максимальная доза меньше). Поддерживающая доза обычно составляет 25 мг в сутки однократно, однако так же может быть увеличена лечащим врачом.

**Форма выпуска:** Таблетки по 25, 50 или 100мг действующего вещества, по 10 или 20 шт. в контурной упаковке, по 1, 2, 5 или 10 контурных упаковок в картонной коробке.

### **Нитроглицерин (Nitroglycerinum)**

**Групповая принадлежность:** Сосудорасширяющее (вазодилатирующее) средство.

**Фармакологическое действие:** Расширяет кровеносные сосуды (преимущественно коронарные /сердечные/ артерии и сосуды мозга), расслабляет гладкую мускулатуру желудочно-кишечного тракта, желчевыводящих путей и других органов. Наряду со снижением сопротивления коронарных и периферических сосудов нитроглицерин уменьшает венозный возврат крови к сердцу, способствует перераспределению кровотока в миокарде (сердечной мышце) в пользу очага ишемии и уменьшению при инфаркте миокарда очагов ишемического поражения, усиливает инотропную (сократительную) функцию миокарда. Как и другие органические нитраты, нитроглицерин улучшает метаболические процессы (обмен веществ) в миокарде, уменьшает потребность миокарда в кислороде.

**Показания к применению:** Для купирования (снятия) приступов стенокардии; иногда при дискинезии (нарушении подвижности) желчевыводящих путей и эмболии (закупорке) центральной артерии сетчатки. Применяют нитроглицерин также при левожелудочковой недостаточности, в том числе при инфаркте миокарда.

**Способ применения:** В настоящее время 1% (спиртовой) раствор нитроглицерина для сублингвального (под язык) применения используют редко. Чаще применяют таблетки или капсулы. При применении 1% раствора наносят 1-2 капли под язык или смачивают 2-3 каплями небольшой кусок сахара и держат его во рту (под языком), не проглатывая, до полного всасывания. Таблетки 0/2-1 таблетку помещают под язык и не проглатывают (держат во рту до полного всасывания). Высшие дозы 1 % раствора нитроглицерина для взрослых: разовая 4 капли, суточная 16 капель (соответственно, 1 1/2 таблетки разовая и 6 таблеток суточная) Капсулы также держат под языком до полного рассасывания, однако для ускорения эффекта можно раздавить капсулу зубами.

**Форма выпуска:** 1 % раствор нитроглицерина в спирте во флаконах по 5 мл; таблетки, содержащие по 0,0005 г (0,5 мг) нитроглицерина, в стеклянных трубках по 40 штук; 1% раствор в масле в капсулах (шарообразной формы, красного цвета) по 0,5 и мг в упаковке по 20 штук.

### **Кавинтон (Cavinton)**

**Групповая принадлежность:** Церебровасодилатирующее средство

**Фармакологическое действие:** Кавинтон расширяет сосуды мозга, усиливает кровоток, улучшает снабжение мозга кислородом, а также способствует утилизации глюкозы. Ингибируя (подавляя) фосфодиэстеразу, препарат приводит к накоплению в тканях цАМФ; уменьшает агрегацию (склеивание) тромбоцитов. Наблюдается лишь небольшое понижение системного артериального давления. Сосудорасширяющее действие кавинтона связано с прямым релаксирующим (расслабляющим) влиянием на гладкие мышцы. Препарат способствует усилению метаболизма (обмена) норадреналина и серотонина в тканях мозга, уменьшает патологически повышенную вязкость крови, способствует деформируемому<sup>TM</sup> (увеличению пластичности) эритроцитов.

**Показания к применению:** Применяют при неврологических и психических нарушениях, связанных с расстройствами мозгового кровообращения (после перенесенного инсульта, посттравматических, атеросклеротического происхождения); при расстройствах памяти, головокружении, афазии (нарушении речи) и др.; при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления), вазовегетативных симптомах (нарушении тонуса сосудов) в климактерическом периоде и др. Эффективен также при понижении слуха сосудистого или токсического (медикаментозного) происхождения и головокружении лабиринтного происхождения (связанном с расстройством вестибулярного аппарата).

**Способ применения:** Принимают внутрь в виде таблеток (по 5 мг) по 1-2 таблетки 3 раза в день. Поддерживающая доза - 1 таблетка 3 раза в день. Применяют длительно. Улучшение наблюдается обычно через 1-2 нед.; курс лечения около 2 мес. и более. Внутривенно (только капельно) применяют в неврологической практике при острых очаговых ишемических нарушениях мозгового кровообращения (несоответствии между потребностью тканей мозга в кислороде и его доставкой с кровью), в случае отсутствия геморагии (кровоизлияния в мозг). Вводят вначале 10-20 мг (1-2 ампулы) в 500-1000 мл изотонического раствора натрия хлорида (капельная инфузия).. Препарат вводят внутривенно капельно из расчета 8-10 мг/кг в сутки в 5% растворе глюкозы с переходом через 2-3 нед. на прием внутрь по 0,5-1 мг/кг в сутки.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,005 г (5 мг) в упаковке по 50 штук; 0,5% раствор в ампулах по 2 мл (10 мг).

### **Молсидомин (Molsidominum)**

**Групповая принадлежность:** Сосудорасширяющее (вазодилатирующее) средство.

**Фармакологическое действие:** Является активным периферическим вазодилататором (средством, расширяющим сосуды). Он снижает тонус периферических емкостных сосудов (венул) и уменьшает венозный приток к сердцу. Под влиянием молсидомина понижается давление в легочной артерии, уменьшаются наполнение левого желудочка сердца и напряжение стенок миокарда (мышечной стенки левого желудочка сердца), а также ударный объем. Препарат улучшает коллатеральный кровоток (в обход пораженной артерии), уменьшает агрегацию (склеивание) тромбоцитов. Вазодилаторное действие молсидомина, вероятно, в определенной мере обусловлено наличием в его молекуле группы NO, что говорит о наличии общих механизмов действия с нитратами и натрия нитропруссидом.

**Показания к применению:** Применяют молсидомин преимущественно как антиангинальное (противоишемическое) средство для профилактики приступов стенокардии. В этих случаях его принимают внутрь. Кроме того, молсидомин используют в комплексной терапии легочно-сердечной недостаточности. Для купирования (снятия) приступов стенокардии иногда назначают молсидомин сублингвально (под язык).

**Способ применения:** Внутрь принимают молсидомин по 1-2 мг (1/2-1 таблетка) 2-3-4 раза в день после еды. Сублингвально назначают по 1/2 таблетки. При сублингвальном применении эффект наступает через 5-10 мин, при приеме внутрь - через 20 мин.

Форма выпуска: Таблетки по 0,002 г (2 мг) в упаковке по 40 штук.

### **Лекоптин (верапамил) (Lecoptin)**

**Групповая принадлежность:** блокатор кальциевых каналов (антагонист ионов кальция).

**Фармакологическое действие:** Лекоптин является блокатором медленных кальциевых каналов. Блокирует проникновение ионов кальция через клеточные мембраны из межклеточного пространства в сократительные и проводящие волокна миокарда и гладкомышечные клетки кровеносных сосудов. При этом концентрация ионов кальция в крови остается на прежнем уровне. Лекоптин приводит к расширению коронарных артерий и артериол в ишемизированных и нормальных участках сердечной мышцы; улучшает кровоснабжение сердечной мышцы за счет ингибирования спазма коронарных сосудов. Уменьшает сократимость сердечной мышцы через влияние на поток кальциевых ионов. Лекоптин блокирует перенос ионов кальция через мембраны клеток, благодаря чему снижается общее периферическое сопротивление сосудов и уменьшается частота сердечных сокращений. В результате уменьшения нагрузки на сердечную мышцу происходит улучшение кровоснабжения миокарда при сниженной потребности в кислороде. Антиаритмическое действие верапамила состоит в продлении рефрактерного периода в атриовентрикулярном узле, вследствие чего замедляется атриовентрикулярная проводимость. Вследствие этого при мерцании или трепетании предсердий замедляется сократимость желудочков. Верапамил восстанавливает синусовый ритм при наджелудочковой пароксизмальной тахикардии благодаря своему воздействию на атриовентрикулярный узел. Препарат способствует уменьшению частоты приступов тахикардии.

**Показания к применению:** Для таблетированных форм Стенокардия: - комбинированная стенокардия; - стенокардия напряжения; - вариантная стенокардия (стенокардия Принцметала). Аритмия: - профилактика рецидивов наджелудочковой пароксизмальной тахикардии; - у пациентов с хроническим трепетанием и/или мерцанием предсердий контроль частоты желудочковых сокращений (совместно с дигиталисом); - легкая и умеренная эссенциальная артериальная гипертензия. Таблетки мите 40 мг удобны к использованию у пожилых пациентов и лиц молодого возраста Парентеральное введение Лекоптина: - непродолжительный контроль сократимости желудочков при трепетании и мерцании предсердий (кроме мерцания и трепетания предсердий по причине вспомогательного обходного кровообращения – WPW или LPG синдромы).

**Способ применения:** Перорально При стенокардии стандартная дозировка составляет от 80 до 120 мг в сутки в три приема. Для пациентов с возможным высоким ответом на лечение, а также для лиц пожилого возраста рекомендуемая дозировка – 40 мг в сутки в три приема. При аритмии стандартная дозировка для пациентов с хроническим трепетанием предсердий составляет 240 мг в сутки в три приема (при одновременном применении сердечных гликозидов). Парентерально Парентерально взрослым назначается в начальной дозировке 5-10 мг. Препарат вводится внутривенно медленно в течение 2 минут (минимум), пожилым пациентам – 3 минуты. При недостаточном ответе повторно можно ввести препарат через 30 минут в дозировке 10 мг. Внутривенное введение Лекоптина производится врачом под постоянным контролем артериального давления и показателей электрокардиограммы.

**Форма выпуска:** Таблетки ретард 240 мг. Таблетки 40, 80, и 120 мг. Раствор для инъекций 2 мл – 5 мг.

## Гипотензивные лекарственные средства.

### Общие сведения о классификации и течении гипертонии (ГБ)

Четкое разграничение **стадий** и клинических вариантов гипертонии, уяснение **особенностей течения**, а тем самым и тяжести заболевания, имеют важное значение для определения прогноза и проведения глубоко обоснованных и целенаправленных лечебно-профилактических мероприятий.

Важным шагом к пониманию сущности заболеваний, протекающих с повышенным артериальным давлением, явилось отграничение гипертонической болезни от многочисленных форм **симптоматических гипертоний**.

**Согласно одной из наиболее распространенных классификаций гипертонии выделяют следующие стадии и фазы развития гипертонической болезни.**

**Стадия I, фаза А** — характеризуется тенденцией к повышению артериального давления лишь под влиянием определенных воздействий (*физическая нагрузка, психоэмоциональное напряжение, прием пищи, температурные влияния, в частности холод, и др.*) и является самым начальным периодом заболевания или же гипертоническая болезнь как таковая в дальнейшем может и не возникнуть. В подобных случаях речь идет о повышенной реактивности вазомоторного аппарата. Включение в классификацию этой стадии мотивировано в основном стремлением к своевременному проведению **профилактических мероприятий**.

**Стадия I, фаза Б** — также начальный период заболевания. Сравнительно кратковременные повышения артериального давления сменяются полной его нормализацией и исчезновением каких бы то ни было симптомов заболевания. Однако в этой фазе уже могут появляться ангиоспазмы в виде гипертонических кризов или кратковременных спазмов мозговых и коронарных артерий. Лечебно-профилактические мероприятия часто оказываются весьма эффективными.

**Стадия II, фаза А** — отличается неустойчивостью уровня артериального давления, хотя зачастую оно является повышенным. Каких-либо органических изменений в различных органах, как и в I стадии, еще не обнаруживается, но уже наблюдается заметная гипертрофия левого желудочка сердца, а также характерные сосудистые изменения при офтальмологическом исследовании. В периоды обострений, сменяющие периоды ремиссии, у больных обычно отмечаются головные боли, сердцебиения, повышенная утомляемость, нередко боли в области сердца или другие субъективные ощущения. Теперь уже чаще наблюдаются мозговые и коронарные ангиоспазмы и гипертонические кризы. Комплексное лечение оказывает продолжительный эффект, а в отдельных случаях заболевание регрессирует в фазу Б I стадии.

**Стадия II, фаза Б** — характеризуется более устойчивым и более высоким артериальным давлением (чаще систолическое давление **до 200 мм рт. ст. и выше**). Как и в более ранние периоды заболевания возможны изменения функций органов чувств, нарушение проницаемости стенок сосудов и хотя могут возникнуть вторичные дистрофические изменения в тканях, грубых анатомических изменений в различных органах еще не отмечается. Можно считать характерными изменения сосудов глазного дна. Больные нередко жалуются на значительно выраженную одышку (кардиального происхождения). Сравнительно часто у многих из них наблюдаются приступы стенокардии и церебральные ангиоспастические проявления. Тяжелее протекают гипертонические кризы. Лечение, даже интенсивное, далеко не всегда бывает эффективно. В этой фазе, как подчас и в фазе А II стадии, возможны различные серьезные осложнения (нарушения зрения, расстройства мозгового кровообращения вплоть до инсульта и др.), в значительной мере ухудшающие прогноз.

**Стадия III, фаза А** — характеризуется уже выраженными дистрофическими и склеротическими изменениями во внутренних органах и различных тканях, что может в резкой степени усугубляться вторичным или сопутствующим атеросклеротическим процессом в крупных сосудах сердца, мозга, почек. Однако данная фаза все же может продолжаться на протяжении ряда лет без особо выраженной сердечной недостаточности, стойких расстройств церебральной гемодинамики, существенного нарушения функциональной способности почек.

**Стадия III, фаза Б** — отличается от предыдущей фазы резко выраженными нарушениями функций внутренних органов, в частности развитием **кардиосклероза** с тяжелым расстройством гемодинамики, коронаротромбоза и **инфаркта миокарда или пареза (паралича)**, обусловленного тромбозом мозговых сосудов, артериолосклероза почек с прогрессирующим нарушением их функций, гипертонической ретинопатии со значительными изменениями на глазном дне и резким падением зрения. **Кровяное давление обычно не достигает максимального уровня, отмечавшегося в предыдущие периоды заболевания, а нередко резко снижается, особенно после инфаркта миокарда или мозгового инсульта.**

*При клинической оценке характера развития гипертонической болезни следует помнить, что между указанными ее стадиями и фазами существуют различные переходные формы, и такое деление, как и в большинстве классификаций других заболеваний, в определенной мере условно.*

Более относительным во многих случаях является подразделение болезни на варианты по клиническому течению в связи с преимущественным поражением сердца, мозга или почек. Тем более, что почечная форма встречается довольно редко, а проявления со стороны сердца и центральной нервной системы зачастую наблюдаются одновременно и обусловлены при этом преимущественно не столько самой гипертонической болезнью, сколько сопутствующим атеросклерозом или его осложнениями.

В значительно меньшей мере приходится сталкиваться в настоящее время с одним из двух вариантов течения заболевания, а именно **со злокачественной формой**. Злокачественное течение заболевания характеризуется обычно наиболее высокими показателями артериального давления, особенно диастолического, обширностью и тяжестью почечных, церебральных, глазных и кардиальных изменений, обусловленных, в частности, развитием артериолонекрозов. Обычно наблюдаются длительные тяжелые гипертонические кризы. Нередко заболевание начинается с потери зрения, обусловленной отеком сосков зрительного нерва и сетчатки, геморрагии. **Эта форма гипертонической болезни встречается преимущественно среди лиц молодого возраста (20 — 30 лет) и весьма редко — в возрасте более 50 лет.**

Наиболее характерным в настоящее время является **доброкачественность течения** гипертонической болезни, при которой многие годы больные сохраняют достаточный жизненный тонус и профессиональную трудоспособность. В связи с увеличением продолжительности жизни советских людей все большее значение приобретает изучение течения гипертонической болезни в возрастном аспекте, тем более, что это заболевание имеет ряд характерных возрастных особенностей. Если у лиц молодого возраста гипертоническая болезнь нередко приобретает черты манифестно протекающего заболевания с яркими проявлениями как в объективном, так и в субъективном аспекте, то в пожилом и старческом возрасте заболевание обычно отличается более торпидным доброкачественным течением.

У лиц пожилого и старческого возраста появляется тип **гипертонии**, присущий только этому возрасту, — **систолическая** ("склеротическая") артериальная гипертония, во многих случаях не сопровождающаяся клиническими признаками заболевания; течение даже четко диагностированной гипертонической болезни в этом возрасте носит более

доброкачественный характер; снижение высокого артериального давления до нормы часто приводит к различным осложнениям. Кроме того, следует учитывать, что, в отличие от течения болезни в молодом и среднем возрасте, в пожилом и старческом она развивается обычно на фоне органических изменений сердечнососудистой и других систем, обусловленных как возрастом, так и наличием атеросклероза. Степень же и локализация атеросклеротических изменений могут создавать серьезные предпосылки для более легкой реализации этиологических факторов гипертонии.

Таким образом, хотя для лиц пожилого и старческого возраста более характерно торпидное течение гипертонической болезни без резких колебаний артериального давления, все же на общее состояние больных и прогноз в значительно большей степени, чем в молодом и среднем возрасте, может влиять множество таких усугубляющих факторов, как психоэмоциональное напряжение, нервно-психическое или физическое переутомление, расстройство сна, нарушение режима питания. Все это следует строго учитывать при оценке клинических проявлений болезни и проведении лечебно-профилактических мероприятий.

**При медленном доброкачественном течении гипертонической болезни у лиц молодого возраста (20 — 30 лет) наиболее часто наблюдается обратное развитие или длительные ремиссии в случаях соблюдения больными соответствующего режима и проведения необходимого лечения. В пожилом же и старческом возрасте рассчитывать на длительное улучшение состояния больных значительно труднее.**

Одним из определяющих критериев тяжести течения гипертонической болезни в подавляющем большинстве случаев является уровень артериального давления, соответствующий обычно как самочувствию больных, так и показателям функционального состояния организма, в частности гемодинамики.

Согласно статистики, наибольшее количество вызовов скорой помощи приходится на осложненные формы гипертонической болезни (ГБ), и ведущее место среди них занимают гипертонические кризы. Но прежде чем мы разберем проблему ГК, хотелось бы кратко остановиться на гипертонической болезни.

**Существует и другая классификация гипертонической болезни, согласно которой гипертоническая болезнь делится на 4 степени, связанная с уровнем артериального давления:**

I степень: 140-159 — 90-95 (мягкая) (пограничная гипертензия — это не граница между нормой и патологией, а граница между степенями риска повреждения внутренних органов самим АД).

II степень: 160-179 — 96-109 (умеренная).

III степень: 160-209 — 110-119 (тяжелая).

IV степень: свыше 210 — свыше 110 (очень тяжелая).

Для первой степени характерно отсутствие не только конкретных жалоб, но и поражения органов-мишеней.

При второй степени имеются лабораторно-инструментальные признаки поражения органов-мишеней, т.е. ЭКГ, ЭхоКГ, признаки гипертрофии ЛЖ, коронарной болезни, поражение сосудов сетчатки, микроальбуминурия, протеинурия, повышение креатинина, атеросклеротическое поражение магистральных сосудов.

При третьей степени — клинические поражения органов-мишеней: клиническая картина ИБС, аритмия, СН, нарушения коронарного и мозгового кровообращения, инсульты, инфаркты, энцефалопатия, сосудистая деменция, кровоизлияния в глаз, отек

зрительного нерва, выпадение полей зрения, ХПН, окклюзия сосудов, перемежающаяся хромота и т.д.

При наличии в клинической картине кризов следует указывать их клинический вариант: церебральный, ишемический, коронарный, ОЛЖН, сосудистый (острая аневризма), глазной (острый отек зрительного нерва).

**Различают также гипертоническую болезнь по вариантам повышения АД:**

- систолический вариант — когда диастолическое АД ниже 90;
- диастолический вариант — когда систолическое АД 140 и менее;
- систолодиастолический вариант;
- лабильную артериальную гипертонию (когда АД снижается самостоятельно).

При длительном стойком повышении АД происходят качественно новые адаптивно-структурные изменения в механизме регуляции сосудистого тонуса. Это требует медленного снижения артериального давления — не более 20-25% от исходного уровня. В противном случае возможно резкое ухудшение течения болезни вплоть до развития фатальных осложнений.

Этим обосновывается отказ от применения в лечении гипертонической болезни любых быстродействующих препаратов, например нифедипина, который используется сублингвально для купирования гипертонических кризов.

**Лекарственные средства применяемые при лечении гипертонической болезни.**

Гипотензивные (антигипертензивные) средства применяются для снижения артериального давления при гипертонических кризах, а также лечения гипертонической болезни. Нормальный уровень артериального давления зависит от многих взаимосвязанных факторов: состояния и тонуса сосудов, работы сердца и силы сердечных сокращений, объема циркулирующей крови, водно-солевого обмена и др.

Одной из причин гипертонической болезни может быть повышенная возбудимость сосудодвигательного центра головного мозга.

Повышение артериального давления может быть связано с психическими факторами. Стрессовые состояния, эмоциональное напряжение ведет к усиленной секреции адреналина (гормона коры надпочечников), который вызывает повышение артериального давления.

Повышение артериального давления может быть связано с заболеванием почек (нефрит) или печени, при которых в крови повышается концентрации ангиотензина – сильного сосудосуживающего средства. Кроме того, почки регулируют водно-солевой обмен, способны изменять объем циркулирующей крови, а также концентрацию ионов натрия, избыток которых ведет к повышению сосудистого тонуса.

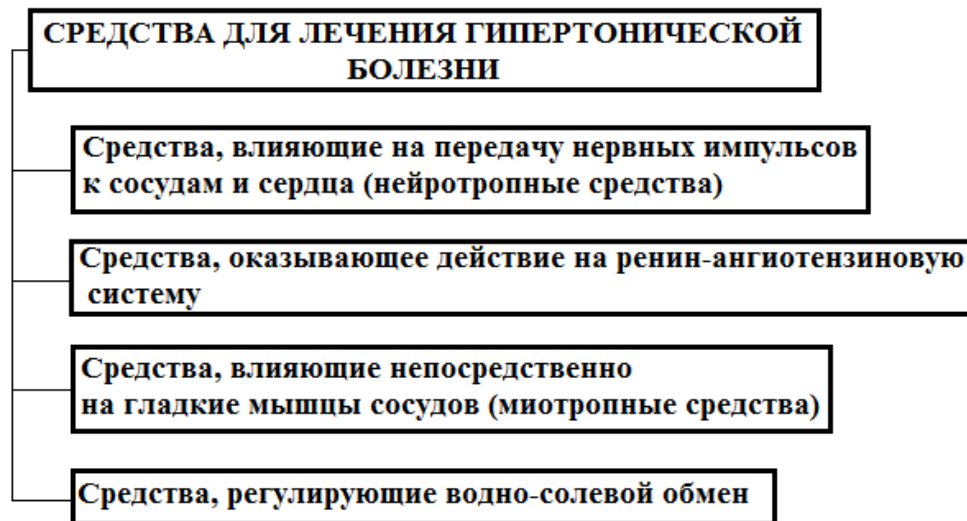
Гипертоническая болезнь – хроническое заболевание, которое может прогрессировать и давать периодические осложнения в виде гипертонических кризов, поэтому лечению гипертонической болезни требует постоянного и систематического применения гипотензивных средств, препятствующих прогрессированию болезни.

Существует значительное количество лекарственных средств, применяемых при лечении гипертонической болезни, оказывающих терапевтическое действие на различные звенья сердечнососудистой системы.

По механизму действия эти средства условно делят на четыре группы:

1. Средства, влияющие на передачу нервных импульсов к сосудам и сердцу (нейротропные средства);
2. Средства, оказывающее действие на ренин-ангиотензиновую систему;

3. Средства, влияющие непосредственно на гладкие мышцы сосудов (миотропные средства)
4. Средства, регулирующие водно-солевой обмен;



Приведенная классификация во много является условной, поскольку многие лекарственные средства, применяемые при гипертонической болезни, оказывают многостороннее действие и могут быть отнесены одновременно к нескольким группам. Основное, наиболее важное значение, среди перечисленных, имеет группа нейротропных (антиадренергических) лекарственных средств.

Каждая из приведенных групп делится на следующие подгруппы.

#### 1. Нейротропные (антиадренергические) средства:

- 1) Нейротропные средства центрального действия: клофелин, гуанфацин, метилдофа, миоксонидин и др.;
- 2) Ганглиоблокаторы: бензогексоний, пентамин, гиргоний.;
- 3) Симпатолитики: резерпин, октадин;
- 4) Адреноблокаторы:
  - а)  $\alpha$  – адреноблокаторы: фентоламин, тропафен, празозин, дигидроэрготамин;
  - б)  $\beta$  –адреноблокаторы: анаприлин, метопролол, атенолол, талинолол;
  - в)  $\alpha$  и  $\beta$  – адреноблокаторы: лабетолол;

#### 2. Антагонисты ренин-ангиотензивной системы:

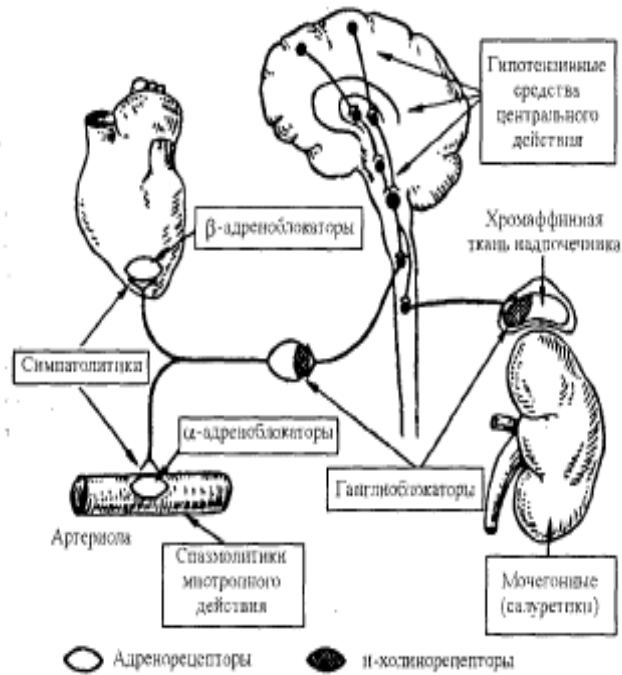
- 1) ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ): каптоприл, эналаприл;
- 2) блокаторы ангиотензиновых рецепторов: лозортан, вальзортан и др.;

#### 3. Миотропные средства:

- 1) блокаторы кальцевых каналов: верапамил, нифедипин;
- 2) активаторы калиевых каналов: миноксидил, diazoxid;
- 3) донаторы окиси азота (NO): нитропруссид натрия;
- 4) разные миотропные средства: апрессин, дибазол, папаверин;

#### 4. Диуретики: дихлотиазид, фуросемид, спиринолактон и др.





**Схематическое изображение направленности действия различных групп гипотензивных средств**

### Гипотензивные средства нейротропного (антиадренергического) действия

Гипотензивные средства нейротропного действия это лекарственные препараты оказывающее влияние на нервные механизмы регуляции сосудистого тонуса.

Препараты этой группы понижают возбудимость сосудодвигательного центра головного мозга (средства центрального действия) или тормозят проведение нервных импульсов к сосудам (средства периферического действия).



На сосудодвигательный центр головного мозга оказывают тормозящее влияние и ряд других лекарственных средств, таких как: транквилизаторы, седативные, антигистаминные средства проявляющие седативный эффект и др. Препараты этих групп действуют успокаивающе на нервную систему, ослабляют эмоциональные реакции и, таким образом, оказывают гипотензивное действие. Однако, эти лекарственные средства применяться для лечения гипертонической болезни только на начальных стадиях, в последующем их гипотензивный эффект снижается.

Наиболее эффективными из гипотензивных средств являются препараты **центрального действия**, такие как: клофелин и метилдофа. Оба эти препарата действуют непосредственно на сосудодвигательный центр продолговатого мозга и тормозят его активность. Механизм их действия связан со стимулирующим действием на α-адренорецепторы головного мозга в области солитарного тракта.

Угнетающее действие клофелина и метилдофы на ЦНС проявляется седативным эффектом и сонливостью. Кроме того, эти лекарственные препараты потенцируют действие лекарственных средств проявляющих седативный эффект: снотворных, седативных, нейролептиков, транквилизаторов, алкоголя.

Лечении клофелином не следует прекращать внезапно, дозу следует понижать постепенно, поскольку внезапная отмена препарата может привести к развитию гипертонического криза (проявляется феномен отдачи).

К лекарственным средствам, тормозящим проведение нервных импульсов к сосудам относятся: ганглиоблокаторы, симпатолитики и  $\alpha$ - адреноблокаторы.

**Ганглиоблокаторы** (бензогексоний, пирилен и др.) блокируют передачу импульсов в вегетативных ганглиях, что ведет к значительному снижению артериального давления. Однако, ганглиоблокаторы относятся к лекарственным препаратам широкого спектра действия. Под действием ганглиоблокаторов нарушается передача нервных импульсов не только в симпатических, но и парасимпатических ганглиях, что приводит к снижению моторики желудочно-кишечного тракта. Кроме, того применение ганглиоблокаторов может вызвать ортостатический коллапс (резкое падение артериального давления при переходе из горизонтального положения в вертикальное). Поэтому, в настоящее время, ганглиоблокаторы редко используют для лечение гипертонической болезни, но применяют в крайних случаях, например, для купирования гипертонических кризов.

**Симпатолитики** (октадин, резерпин) тормозят передачу импульсов непосредственно с нервных окончаний симпатических нервов на гладкие мышцы сосудов. Лекарственные средства из раувольфии (раунатин, резерпин) проявляют также центральное действие, понижая возбудимость сосудодвигательного центра. Кроме того, эти препараты обладают седативным эффектом, что является благоприятным фактором при лечении гипертонии. Симпатолитики, как и ганглиоблокаторы, могут вызывать ортостатический коллапс и снижение моторики желудочно-кишечного тракта.

**$\alpha$ - адреноблокаторы** (фентоламин, празозин, тропafen, дигидроэрготоксин, пирроксан и др.). По механизму действия  $\alpha$ - адреноблокаторы блокируют непосредственно адренорецепторы гладких мышц сосудов. При лечении гипертонии, из всех вышеперечисленных групп лекарственных средств  $\alpha$ - адреноблокаторы наименее эффективны и применяются при нарушениях периферического кровообращения. Исключение составляет препарат из этой группы - пирроксан, который хорошо проникает в мозг и действует на центральные адренергические системы. Пирроксан эффективен при купировании гипертонических кризов.

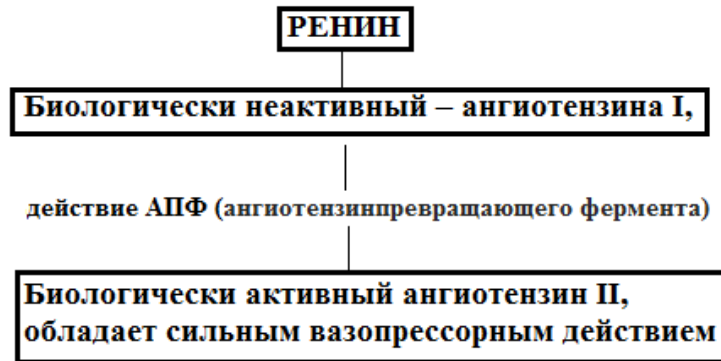
Одним из побочных эффектов большинства лекарственных средств группы  $\alpha$ -адреноблокаторов является их способность вызывать тахикардию. Блокируя  $\alpha_2$  адреноблокаторы вещества этой группы усиливают выделение норадреналина, который провоцирует развитие тахикардии. Более избирательным действием обладает лекарственное средство празозин, которое избирательно блокирует  $\alpha_1$ - адреноблокаторы и тахикардии не вызывает.

Эффективным средством при лечении гипертонической болезни является анаприлин. Анаприлин относится к группе  $\beta$ - адреноблокаторов, механизме действия которых достаточно сложен и многообразен. Так,  $\beta$ - адреноблокаторов (анаприлин) уменьшает сократительную активность сердечной мышцы, снижает активность сосудодвигательного центра в продолговатом мозге, снижает концентрацию ангиотензина в крови. Кроме того, лекарственные средства этой группы обладают антиаритмическим действием.

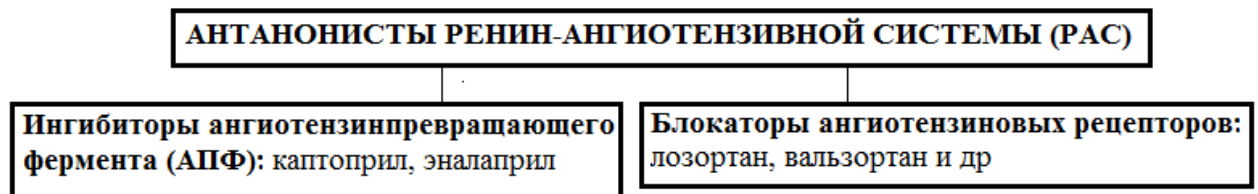
### **Антагонисты ренин-ангиотензивной системы (РАС)**

Антагонисты ренин-ангиотензивной системы применяются при лечении ишемической болезни сердца и сердечной недостаточности, вместе с тем, это достаточно эффективные средства для лечения гипертонической болезни.

Ренин-ангиотензивная система оказывает существенное влияние на сердечной сосудистую систему. В почках и других тканях организма вырабатывается фермент ренин, участвующего в образовании биологически неактивного – ангиотензина I, который, в свою очередь, под действием АПФ (ангиотензинпревращающего фермента) трансформируется в биологически активный ангиотензин II, обладающий сильным вазопрессорным действием (суживающим сосуды). Кроме того, ангиотензин II тормозит синтез брадикинина обладающего противоположным эффектом (вазодилатационным).



Лекарственных средства – антагонисты ренин-ангиотензивной системы делят на две группы: ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) и блокаторы ангиотензиновых рецепторов.



К ингибиторам ангиотензинпревращающего фермента (АПФ) относятся такие лекарственные средства, как каптоприл, эналаприл, лизиноприл и др, которые различаются между собой некоторыми особенностями механизма и продолжительностью действия.

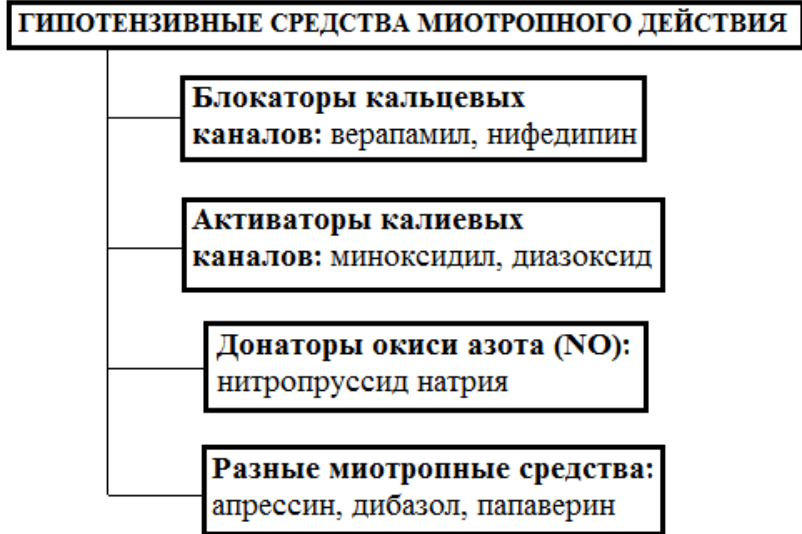
Блокаторы ангиотензиновых рецепторов отличаются от ингибиторов АПФ по механизму действия, но сходны с ними по оказываемом антигипертензивному эффекту. К препаратам этой группы относятся: лозортан, вальзортан и др. Важным положительным свойством препаратов этой группы является их способность устранять гипертрофию артерий и миокарда.

### **Гипотензивные средства миотропного действия**

Гипотензивные средства миотропного действия оказывают прямое, непосредственное расслабляющее действие на гладкие мышцы сосудов, что приводит к снижению артериального давления. К препаратам этой группы относятся: магния сульфат, дибазол, папаверин, эуфиллин, но-шпа, апрессин и др.

Магния сульфат обладает широким спектром фармакологического действия, применяется в качестве слабительного и желчегонного средства. Вместе с тем, магния сульфат оказывает и миотропное, спазмолитическое действие на гладкую мускулатуру сосудов, обладает слабыми ганглиоблокирующими свойствами, угнетает сосудодвигательный центр. Чаще всего магния сульфат используется для купирования гипертонических кризов. Для получения гипотензивного эффекта магния сульфат вводят

внутримышечно или внутривенно. Внутривенно препарат вводят медленно, поскольку магния сульфат угнетает дыхательный центр.



Апрессин (гидралазин) расширяет преимущественно мелкие артерии и артериолы, что приводит к уменьшению периферического сопротивления и снижению артериального давления. Апрессин вызывает ряд побочных эффектов: тахикардию, боли в области сердца и др.

Нитропруссид натрия является донатором окиси азота NO, понижает тонус сосудов в результате чего артериальное давление снижается., но действие препарата крайне непродолжительно (1 – 2 минуты). Применяется внутривенно или капельно при гипертонических кризах.

К активаторам калиевых каналов относятся миноксидил и diaзоксид. Diaзоксид применяется для купирования гипертонических кризов.

Средства блокирующие кальцевые каналы снимают напряжение гладкой мускулатуры. К препаратам этой группы относятся: верапамил, фенигидин и др.

#### **Диуретические средства применяемые при лечении гипертонии**

Гипертоническая болезнь часто сопровождается скоплением жидкости в организме и отечностью. Отмечается, что больные гипертонией потребляют большее количество поваренной соли (NaCl) по сравнению со здоровыми людьми, натрия хлорид, в свою очередь, усиливают сократительную активность гладких мышц (в том числе сосудов), способствуя повышению давления. К тому же натрия хлорид способствует задержки в организме жидкости. Выведение солей (NaCl) и, как следствие, воды из организма способствует снижению артериального давления. С этой целью при лечении гипертонии применяют диуретические средства: дихлотиазид, фуросемид, спиронолактон и др. Препараты этой группы рассматриваются в разделе «диуретические средства».

Вместе с тем, диуретические средства для лечение гипертонии могут применяться только в составе комплексной терапии, с другими гипотензивными средствами. Применение одних диуретиков при лечении гипертонии не является эффективным.

#### **Гипертензивные средства**

Гипотензия – пониженное артериальное давление. Различают острую и хроническую артериальную гипотензию. Причины гипотензии могут быть различны, например, значительная кровопотеря, развитие острой или хронической сердечной недостаточности, отравления, шоковое состояние и др.

Лечение гипотензии зависит от вызвавшей ее причины. Так, при значительных кровопотерях применяются переливания крови или кровезаменителей. При гипотензии

вызванной сердечной недостаточностью применяются сердечные гликозиды и другие кардиотонические средства.

Для быстрого повышения артериального давления применяются лекарственные препараты группы адреномиметиков (адреналин, норадреналин, мезатон, эфедрин, дофамин). Сильным но коротким гипертензивным действием обладает - ангиотензин II, проявляющий вазопрессорное действие, поэтому этот препарат вводится внутривенно капельно.

При хронической артериальной гипотензии применяются стимуляторы сосудодвигательного центра. Эффективными являются общетонизирующие средства растительного происхождения (настойка женьшеня, лимонника).

## Краткая характеристика лекарственных препаратов

### Эналаприл (Enalapril)

**Групповая принадлежность:** - АПФ блокатор.

**Фармакологическое действие:** Эналаприл - антигипертензивный препарат, механизм действия которого связан с угнетением активности ангиотензин-конвертируемого фермента, приводящего к уменьшению образования сосудосуживающего фактора - ангиотензина-II и одновременно к активации образования кининов и простагличина, обладающих сосудорасширяющим действием. Эналаприл относится к «пролекарствам», после гидролиза его в организме образуется эналаприлат, который и ингибирует указанный фермент. Эналаприл оказывает также некоторый диуретический эффект, связанный с умеренным угнетением синтеза альдостерона. Наряду со снижением артериального кровяного давления препарат уменьшает пред- и пост нагрузку на миокард при сердечной недостаточности, улучшает кровообращение в малом кругу и функцию дыхания, понижает сопротивление в сосудах почек, что способствует нормализации в них кровообмена. Продолжительность действия эналаприла после разового приема внутрь составляет около 24 часов.

**Показания к применению:** Эналаприл назначают при различных формах артериальной гипертензии, включая реноваскулярную гипертензию, в том числе при низкой эффективности других антигипертензивных средств. Препарат также эффективен при застойной сердечной недостаточности, ишемической болезни сердца, бронхоспастических состояниях.

**Способ применения:** Эналаприл назначают внутрь независимо от времени приема пищи. При лечении гипертонической болезни начальная доза эналаприла для взрослых составляет 0,01-0,02 г в сутки (одноразово). В дальнейшем дозу подбирают индивидуально для каждого больного (обычно это доза 0,02 г в день одноразово). При умеренной гипертензии достаточно назначать 0,01 г препарата в день. Максимальная суточная доза равна 0,04 г.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,005; 0,01 и 0,02 г (5; 10 и 20 мг).

### Фенофибрат( липантил) (Phenofibrate)

**Групповая принадлежность:** Гиполипидемическое средство.

**Фармакологическое действие:** Обладает гиполипидемическими (уменьшающими содержание липидов в крови) свойствами. По механизму действия и показаниям к применению сходен с клофибратом.

**Показания к применению:** В комплексной терапии при склерозе коронарных (сердечных) и периферических сосудов, при диабетической ангио- и ретинопатии (нарушении тонуса кровеносных сосудов и повреждении стенок сосудов сетчатки глаза, связанных с повышенным содержанием сахара в крови). Различные заболевания, сопровождающиеся гиперлипидемией (повышением уровня липидов в крови).

**Способ применения:** Назначают фенофибрат внутрь взрослым по 0,1 г (100 мг) 2 раза в день до или во время еды: 0,02 г (2 капсулы) во время завтрака и 0,01 г (1 капсула) во время ужина.

**Форма выпуска:** В капсулах по 0,1 г (100 мг) в упаковке по 50 капсул.

### Пармидин (Parmidinum)

**Групповая принадлежность:** Ангиопротекторное средство

**Фармакологическое действие:** Пармидин обладает ангиопротекторной (повышающей устойчивость сосудов) активностью, уменьшает проницаемость сосудов, способствует восстановлению нарушенной микроциркуляции при патологических процессах. В значительной мере это связано с влиянием на кининкаликкреиновую систему, особенно с уменьшением активности брадикинина. Он снижает также агрегацию (склеивание) тромбоцитов.

**Показания к применению:** Комплексная терапия атеросклероза сосудов мозга, сердца, конечностей; диабетическая ретинопатия (невоспалительное поражение сетчатки глаза, связанное с повышением уровня сахара в крови); тромбоз (нарушение проходимости) вен сетчатки; облитерирующий эндартериит

(воспаление внутренней оболочки артерий конечностей с уменьшением их просвета); трофические язвы голени (медленно заживающие дефекты кожи, вызванные нарушением питания).

**Способ применения:** Внутрь по 0,25 г 3-4 раза в день, при необходимости до 3 г в сутки. Курс лечения 2-6 мес. При нейродермите и лучевых поражениях мазь наносят тонким слоем на очаги поражения, слегка втирая, 2-3 раза в день в течение 10-15 дней. При склероатрофическом лишене применяют длительно (до 4 мес). При нейродермите и склероатрофическом лишене накладывают поверх мази повязку с вошеной бумагой. Для профилактики поражений при лучевой терапии мазь наносят тонким слоем и втирают в поля облучения за 30 мин до сеанса, а для лечения лучевых дерматитов (воспаления кожи, вызванного облучением) - 2-3 раза в день в течение 10-12 дней.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковке по 100 штук; 5% мазь по 30 г в алюминиевых тубах или в стеклянных банках, а также по 500 г в стеклянных банках. -

### **Нифедипин (Nifedipin)**

**Групповая принадлежность:** Блокаторы медленных кальциевых каналов (БМКК)

**Фармакологическое действие:** Подобно верапамилу и другим антагонистам ионов кальция нифедипин расширяет коронарные и периферические (главным образом артериальные) сосуды, оказывает отрицательное инотропное действие, уменьшает потребность миокарда в кислороде. В отличие от верапамила не оказывает угнетающего влияния на проводящую систему сердца и обладает слабой антиаритмической активностью. По сравнению с верапамилом сильнее уменьшает периферическое сосудистое сопротивление и более значительно снижает АД. Препарат быстро всасывается при приеме внутрь. Максимальная концентрация в плазме крови наблюдается через 1/2 - 1 ч после приема. Имеет короткий период полувыведения - 2 - 4 ч. Около 80 % выводится почками в виде неактивных метаболитов, около 15 % - с калом. Установлено, что при длительном приеме (2 - 3 мес) развивается толерантность (в отличие от верапамила) к действию препарата.

**Показания к применению:** Применяют нифедипин (фенигидин) в качестве антиангинального средства при ИБС с приступами стенокардии, для снижения АД при различных видах гипертензии, включая почечную гипертензию. Имеются указания, что нифедипин (и верапамил) при нефрогенной гипертензии замедляет прогрессирование почечной недостаточности. Применяют также в комплексной терапии хронической сердечной недостаточности. В последнее время установлено, что все эти препараты благодаря периферическому вазодилаторному действию улучшают функцию сердца и способствуют уменьшению его размеров при хронической сердечной недостаточности. Наблюдается также снижение давления в легочной артерии.

**Способ применения:** Принимают нифедипин внутрь (независимо от времени приема пищи) по 0,01-0,03 г (10-30 мг) 3-4 раза в день (до 120 мг в сутки). Длительность лечения 1-2 мес. и более. Для купирования (снятия) гипертонического криза (быстрого и резкого подъема артериального давления), а иногда при приступах стенокардии, применяют препарат сублингвально. Таблетку (10 мг) помещают под язык. Таблетки нифедипина, помещенные под язык неразжеванными, рассасываются в течение нескольких минут. Для ускорения эффекта таблетку разжевывают и держат, не проглатывая, под языком. При этом способе приема больные в течение 30-60 мин должны находиться в положении лежа. При необходимости через 20-30 мин повторяют прием препарата; иногда увеличивают дозу до 20-30 мг. После купирования приступов переходят на прием препарата внутрь.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, содержащие по 0,01 г (10 мг) препарата. Таблетки длительного действия нифедипин ретард по 0,02 г (20 мг). Раствор для инфузий (1 мл содержит 0,0001 г нифедипина) во флаконах по 50 мл в комплекте со шприцем "Раствор для внутрикороноарного введения (1 мл содержит 0,0001 г нифедипина) в шприцах по 2 мл в упаковке по 5 штук.

### **Лизиноприл (Lisinopril)**

**Групповая принадлежность:** АПФ блокатор

**Фармакологическое действие:** Ингибитор АПФ, уменьшает образование ангиотензина II из ангиотензина I. Снижение содержания ангиотензина II ведет к прямому уменьшению выделения альдостерона. Уменьшает деградацию брадикинина и увеличивает синтез P<sub>g</sub>. Снижает ОПСС, артериального давления, преднагрузку, давление в легочных капиллярах, вызывает увеличение МОК и повышение толерантности миокарда к нагрузкам у больных с ХСН. Расширяет артерии в большей степени, чем вены. Некоторые эффекты объясняются воздействием на тканевые ренин-ангиотензиновые системы. При длительном применении уменьшается гипертрофия миокарда и стенок артерий резистивного типа. Улучшает кровоснабжение ишемизированного миокарда.

**Показания к применению:** Различные формы артериальной гипертензии (подъем артериального давления), в том числе реноваскулярная (обусловленная заболеванием почек). Сердечная недостаточность (в составе комплексной терапии).

**Способ применения:** При артериальной гипертонии (стойком повышении артериального давления) препарат назначают в начальной дозе 10 мг 1 раз в сутки. При недостаточной выраженности гипотензивного (понижающего артериальное давление) эффекта дозу препарата увеличивают до 20-40 мг (редко - до 80 мг). При хронической сердечной недостаточности назначают в начальной дозе 2,5 мг; поддерживающая доза - 5-

20 мг. Для больных с нарушениями водно-электролитного обмена, почечной недостаточности, реноваскулярной гипертонией, а также получающим мочегонные средства начальная доза лизиноприла составляет 2,5-5 мг. Препарат принимают 1 раз в сутки независимо от приема пищи.

**Форма выпуска:** Таблетки по 2,5; 5 и 10 мг, а также по 15 таблеток в блистер (2 блистера помещают в картонную пачку вместе с инструкцией по применению). Гексагональные таблетки желтого цвета с риской на одной стороне.

### **Лозартан калия (Lozartanpotassium)**

**Групповая принадлежность:** Ангиотензина II рецепторов антагонист

**Фармакологическое действие:** Специфический антагонист рецепторов ангиотензина II (типа AT<sub>1</sub>). Не подавляет киназу II -фермент, который разрушает брадикинин. Снижает общее периферическое сопротивление сосудов (сопротивление сосудов току крови), уменьшает постнагрузку (давление крови в аорте за счет снижения периферического сосудистого сопротивления току крови), снижает артериальное давление. Снижает давление в малом (легочном) круге кровообращения. Не вызывает натрийуретический (выводящий ионы натрия с мочой) и мочегонный эффекты, снижает концентрацию альдостерона и норадреналина в крови. Максимальный гипотензивный (снижающий артериальное давление) эффект развивается через 3-6 недель

**Показания к применению:** Артериальная гипертония (стойкий подъем артериального давления).

**Способ применения:** Назначают по 0,05 г 1 раз в сутки. При необходимости суточная доза препарата может быть увеличена до 0,1 г. Больным с печеночной и/или почечной недостаточностью (в том числе, в анамнезе /истории болезни/) дозу препарата следует подбирать индивидуально.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 г.

### **Дротаверин (Drotaverine)**

**Групповая принадлежность:** Спазмолитическое средство

**Фармакологическое действие:** Дротаверина гидрохлорид – лекарственный препарат, обладающий спазмолитической активностью в отношении гладких мышц органов желудочно-кишечного тракта, желчевыводящей и урогенитальной системы, а также в отношении гладкомышечного слоя сосудов. Препарат способствует расслаблению гладких мышц, устраняет спастические боли, за счет расширения просвета сосудов улучшает поступление кислорода к тканям. Механизм действия препарата связан с его способностью изменять потенциал мембран клеток и их проницаемость. Препарат снижает активность фермента фосфодиэстеразы, способствует последовательному повышению уровня цАМФ и увеличению начального поглощения ионов кальция клетками.

**Показания к применению:** Препарат в форме таблеток и раствора для инъекций применяют для купирования спазма и устранения боли спастического характера, в том числе: Спазмы при холецистите, холелитиазе, язве желудка и/или двенадцатиперстной кишки, запоры спастической этиологии, спазмы гладкой мускулатуры кардиального и пилорического отделов желудка, спастический колит, кишечные колики, вызванные задержкой газов. Кроме того, препарат применяется для снятия спазма гладкой мускулатуры при проктите, пиелите, цистите, уретролитиазе и нефролитиазе.

**Способ применения:** Таблетки: Препарат принимают перорально, таблетку рекомендуется глотать целиком, не разжевывая и не измельчая, запивая достаточным количеством воды. Препарат принимают независимо от приема пищи. Взрослым и подросткам в возрасте старше 2 лет при болях спастического характера обычно назначают по 40-80 мг препарата (1-2 таблетки препарата Дротаверин или 1 таблетка препарата Дротаверин Форте) 2-3 раза в сутки. Максимальная суточная доза препарата составляет 240мг. Детям в возрасте младше 12 лет препарат следует давать строго по назначению врача. Детям в возрасте от 6 до 12 лет обычно назначают по 20мг препарата (1/2 таблетки препарата Дротаверин) 1-2 раза в сутки. Детям в возрасте от 2 до 6 лет обычно назначают по 10-20мг препарата (1/4-1/2 таблетки препарата Дротаверин) 1-2 раза в сутки. Раствор для инъекций: Препарат предназначен для внутримышечного введения. Пациентам с печеночной или почечной коликой допускается внутривенное медленное введение препарата. Внутривенное введение препарата допустимо только в положении пациента лежа, в связи с риском развития коллапса. Взрослым обычно назначают по 2-4мл препарата (40-80мг дротаверина) 1-3 раза в сутки внутримышечно. Пациентам с печеночной или почечной коликой обычно назначают по 2-4мл препарата (40-80мг дротаверина) внутривенно медленно предварительно растворив препарат в 5-10мл 0,9% раствора натрия хлорида.

**Форма выпуска:** Таблетки Дротаверин содержащие 40мг активного вещества по 10 штук в контурной ячейковой упаковке, по 2 контурные ячейковые упаковки в картонной пачке. Таблетки Дротаверин Форте содержащие 80мг активного вещества по 10 штук в блистере, по 2 блистера в картонной упаковке. Раствор для инъекций по 2мл в ампулах темного стекла, по 5 ампул в ячейковых упаковках, по 2 ячейковые упаковки в картонной пачке.

### **Диазоксид (Diazoxide)**

**Групповая принадлежность:** Вазодилатирующее средство

**Фармакологическое действие:** Препарат оказывает быстрое гипотензивное (понижающее артериальное давление) действие за счет периферической вазодилатации (расширения просвета сосудов).

**Показания к применению:** Гипертонические кризы (быстрый и резкий подъем артериального давления), особенно связанные с острой энцефалопатией (быстро развивающейся дистрофией мозга), острым гломерулонефритом (заболеванием почек) и эклампсией (тяжелой формой позднего токсикоза беременных).

**Способ применения:** Вводят в неразведенном виде внутривенно струйно в дозе от 1 до 3 мг/кг массы тела. Максимальная разовая доза составляет 150 мг. При отсутствии эффекта препарат вводят повторно в той же дозе через 5-15 мин.

**Форма выпуска:** Раствор в ампулах по 20 мл (0,3 г) в упаковке по 1 штуке. –

#### **Диротон (Лизиноприл) (Diroton)**

**Групповая принадлежность:** АПФ блокатор

**Фармакологическое действие:** Диротон (Лизиноприл) является ингибитором ангиотензин-превращающего фактора (АПФ). Прерывает цепочку образования ангиотензина II из ангиотензина I. Лизиноприл снижает сосудосуживающий эффект ангиотензина II, уменьшает концентрацию в плазме крови альдостерона. Снижает объем предсердного сопротивления. Не влияет на частоту сердечных сокращений, при этом повышается минутный объем крови. Почечный кровоток под влиянием лизиноприла усиливается. Максимальный эффект наблюдается через 6 ч и длится примерно сутки после применения. Длительность действия лизиноприла соответствует дозировке препарата. При длительном применении эффективность не снижается.

**Показания к применению:** Применяется в виде монотерапии или в составе комплексного лечения артериальной гипертензии. При хронической сердечной недостаточности используется в качестве дополнительной терапии в случае лечения дигиталисом и/или диуретическими средствами.

**Способ применения:** Лизиноприл при эссенциальной гипертензии принимают 10 мг/сут. (в качестве стартовой терапии). Поддерживающая дозировка – по 20 мг/сут. Максимальной суточной дозой является 40 мг. Максимальный эффект от препарата достигается через 2-4 недели постоянного применения, что следует учесть при недостаточной выраженности антигипертензивного эффекта и желании увеличить дозировку.

При отсутствии эффекта от лечения диротоном в максимальной суточной дозе необходимо использование другого препарата для снижения давления.

**Форма выпуска:** Таблетки по 5; 10; 20 мг.

#### **Бензогексоний (Benzohexonium)**

**Групповая принадлежность:** Ганглиоблокатор

**Фармакологическое действие:** Ганглиоблокатор; блокируя н-холинорецепторы вегетативных ганглиев, тормозит передачу нервного возбуждения с преганглионарных на постганглионарные волокна. Оказывает угнетающее влияние на каротидные клубочки и хромоаффинную ткань надпочечников, что способствует ослаблению рефлекторных прессорных влияний. Вызывает снижение АД, моторики ЖКТ, тонуса мочевого пузыря, секреции экзокринных желез, парез accommodation, расширяет бронхи, увеличивает ЧСС.

**Показания к применению:** Гипертонические кризы (быстрый и резкий подъем артериального давления); управляемая гипотония (искусственное контролируемое снижение артериального давления).

**Способ применения:** Внутрь по 0,1-0,2 г 2-3 раза в день (возможен и более частый прием). Для лечения гипертонического криза подкожно и внутримышечно 0,5-1,0 мл 2,5% раствора. Высшая разовая доза внутрь 0,3 г, суточная 0,9 г; подкожно разовая 0,075 г, суточная 0,3 г. Для управляемой гипотензии вводят медленно внутривенно (в течение 2 мин) 1-1,5 мл 2,5% раствора; эффект развивается через 12-15 мин; при необходимости вводят дополнительное количество препарата.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 г в упаковке по 20 штук; ампулы по 1 мл 2,5% раствора в упаковке по 10 штук.

#### **Полиспонин (Polysponinum) Диоскореи ниппонской корневищ экстракт (Dioscoreae nipponicae rhizomatis extract)**

**Групповая принадлежность:** Гиполипидемическое средство

**Действующие вещества:** Диоскореи ниппонской корневищ экстракт

**Фармакологическое действие:** Гиполипидемическое средство растительного происхождения, представляющее собой сухой экстракт из корневищ и корней диоскореи ниппонской. Содержит водорастворимые стероидные гликозиды (сапонины) в количестве не менее 17%. Сапонины оказывают умеренное гипохолестеринемическое действие. Механизм действия обусловлен торможением всасывания холестерина в кишечнике.

**Показания к применению:** Гиперхолестеринемия (легкая и умеренная).

**Способ применения:** Полиспонин принимают внутрь, по 100-200 мг 2-3 раза в день, после еды. Лечение проводят циклами по 20-30 дней с 7-10-дневными перерывами. Курс лечения - 3-4 мес.

**Форма выпуска:** таблетки таб. 100 мг: 20, 30 или 50 шт.

#### **Бендазол (Bendazol)**



**Групповая принадлежность:** Вазодилатирующее средство

**Фармакологическое действие:** спазмолитическое, сосудорасширяющее, иммуностимулирующее, адаптогенное. Бендазол непосредственно расслабляет гладкую мускулатуру внутренних органов и кровеносных сосудов (является спазмолитиком миотропного действия). Бендазол в спинном мозге облегчает синаптическую передачу. Иммуностимулирующее действие бендазола связано с регуляцией соотношения уровней цАМФ и цГМФ в иммунных клетках (увеличивает концентрацию цГМФ), это ведет к пролиферации сенсibilизированных зрелых В- и Т-лимфоцитов, выделению ими факторов взаимного регулирования, активации конечной эффекторной функции клеток и совместной реакции. Бендазол имеет умеренное и непродолжительное (2 – 3 часа) гипотензивное действие, которое хорошо переносится.

**Показания к применению:** Обострение гипертонической болезни; спазмы кровеносных сосудов (включая периферических артерий, коронарспазм); гипертонический криз; спазмы гладких мышц внутренних органов (спазмы кишечника и привратника, язвенная болезнь желудка, печеночная и почечная колики); патология нервной системы — полиневрит, периферический паралич лицевого нерва, остаточные явления полиомиелита.

**Способ применения:** Купирование гипертонического криза: в/в или в/м 30-40 мг. Обострение течения артериальной гипертензии со значительным повышением АД: в/м по 20-30 г 2-3 раза/сут, курс лечения 8-14 дней. Внутрь - по 20-50 мг 2-3 раза/сут 3-4 недели. При лечении нервных болезней - взрослым в дозе 5 мг 1 раз/сут или через день в течение 5-10 дней, через 3-4 недели курс лечения повторяют. В дальнейшем курсы проводят с перерывом 1-2 мес. Для детей в зависимости от возраста доза составляет 1-5 мг 1 раз/сут.

**Форма выпуска:** таблетки 2 мг и 20 мг №10, р-р, р-р для инъекций. 0,5% или 1% для инъекций

**Фентоламин (Phentolaminum)****Групповая принадлежность:** Альфа-адреноблокатор

**Фармакологическое действие:** Фентоламин является синтетическим соединением, одним из основных представителей современных альфа-адреноблокаторов. Препарат оказывает неизбирательное альфа-адреноблокирующее действие, влияя одновременно на постсинаптические альфа и пресинаптические альфа-адренорецепторы. Основанием к применению фентоламина, так же как и других альфа-адреноблокаторов, в качестве лекарственного вещества является блокирующее влияние на передачу адренергических сосудосуживающих импульсов, что приводит к снятию спазмов (резкого сужения просвета) сосудов и расширению периферических сосудов, особенно артериол и прекапилляров, улучшению кровоснабжения мышц, кожи, слизистых оболочек; происходит также понижение артериального давления.

**Показания к применению:** Применяют фентоламин при расстройствах периферического кровообращения (болезнь Рейно, эндартериит, акроцианоз, начальные стадии атеросклеротической гангрены), при лечении трофических язв конечностей, вяло заживающих ран, пролежней, отморожений, а также при феохромоцитоме (опухоль надпочечников). Имеются указания, что фентоламин и другие альфа-адреноблокаторы (пирроксан) усиливают секрецию (выделение) инсулина, вследствие чего они могут быть полезными у больных сахарным диабетом с повышенной секрецией адреналина.

**Способ применения:** Назначают фентоламин внутрь в виде таблеток: взрослым по 0,05 г, детям по 0,025 г 3-4 раза в день (после еды); в более тяжелых случаях дозу увеличивают до 0,1 г (взрослым) 3-5 раз в день. Курс лечения продолжается 3-4 нед

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,025 г в упаковке по 30 штук; ампулы по 1 мл, содержащие 10 мг препарата.

**Каптоприл (Captopril)****Групповая принадлежность:** АПФ блокатор

**Фармакологическое действие:** Является ингибитором ангиотензинконвертирующего фермента, препятствующего превращению физиологически неактивного ангиотензина I в ангиотензин II - основной компонент ренин-ангиотензиновой системы, обладающей выраженным вазоконстрикторным (сужающим просвет сосудов) действием. Гипотензивный (снижающий артериальное давление) эффект препарата обусловлен снижением уровня в крови ангиотензина II, уменьшением образования альдостерона и (предположительно) аккумуляцией (накоплением) вазодепрессорного (расширяющего просвет сосудов) брадикинина, в частности при низком и нормальном уровне ренина в плазме крови. Препарат снижает периферическое сосудистое сопротивление (сопротивление сосудов току крови), уменьшает постнагрузку (давление крови в аорте за счет снижения периферического сосудистого сопротивления), снижает давление в правом предсердии и малом (легочном) круге кровообращения. Понижает образование альдостерона в надпочечниках

**Показания к применению:** Эссенциальная гипертензия (стойкий подъем артериального давления неясной причины); почечные гипертензии (стойкий подъем артериального давления, обусловленный заболеванием почек), особенно реноваскулярные (обусловленные нарушением кровоснабжения почек), как средство выбора при лечении резистентной (устойчивой) к другим препаратам артериальной гипертензии.

**Способ применения:** Дозы препарата устанавливаются индивидуально для каждого больного и варьируют от 25 до 150 мг в сутки (в 3 приема). При гипертонических кризах (быстром и резком подъеме артериального давления) можно применять сублингвально (под язык) 25 мг. При реноваскулярной

гипертонии назначают по 12,5 мг. 3 раза в сутки. При хронической сердечной недостаточности назначают по 12,5-25 мг 3 раза в сутки. Максимальная суточная доза 150 мг. Для детей доза устанавливается из расчета 1-2 мг на 1 кг массы тела в сутки. Препарат принимают натощак

**Форма выпуска:** Таблетки по 25, 50 и 100 мг в упаковке по 20-30 штук.

#### **Апровель (Aprovel)**

**Групповая принадлежность:** Ангиотензина II рецепторов антагонист

**Фармакологическое действие** Апровель – антигипертензивный препарат, специфический антагонист рецепторов ангиотензина II (типа АТ1). Устраняет сосудосуживающее действие ангиотензина II и снижает концентрацию альдостерона в плазме крови. Апровель блокирует все физиологически значимые эффекты ангиотензина II, реализующиеся через рецептор типа АТ1, независимо от источника или пути синтеза ангиотензина II. Специфическое антагонистическое действие в отношении рецепторов ангиотензина II (АТ1) приводит к увеличению концентрации ренина и ангиотензина II в плазме крови и к снижению концентрации альдостерона в плазме крови. При применении рекомендованных доз Апровель концентрация иона калия в сыворотке крови существенно не меняется. Ирбесартан не ингибирует киназу II, с помощью которой происходит образование ангиотензина II и разрушение брадикинина до неактивных метаболитов.

**Показания к применению:** Артериальная гипертензия; лечение нефропатии у пациентов с артериальной гипертензией и сахарным диабетом типа 2 (в составе комбинированной гипотензивной терапии).

**Способ применения:** Апровель следует принимать внутрь, таблетку проглатывают целиком, запивая водой. Начальная и поддерживающая доза составляет 150 мг 1 раз/сут. вне зависимости от приема пищи.

**Форма выпуска:** Апровель таб. п/о плён. 150 мг или 300 мг №14 или № 28.

#### **Коринфар (Corinfar)**

**Групповая принадлежность:** Блокатор медленных кальциевых каналов (БМКК)

**Фармакологическое действие:** Коринфар – лекарственный препарат группы блокаторов кальциевых каналов, обладающий выраженным антиангинальным и гипотензивным эффектом. Механизм действия препарата связан с его способностью замедлять проникновение ионов кальция в клетки гладкомышечного слоя сосудов и сердца через медленные кальциевые каналы L-типа. Вследствие уменьшения концентрации ионов кальция в клетках миокарда и гладкомышечного слоя сосудов происходит снижение сократительной активности клеток сосудистой стенки, расширение периферических и коронарных сосудов. Эффективность препарата в терапии больных ишемической болезнью сердца основана также на его способности уменьшать потребность миокарда в кислороде за счет снижения механической работы сердца. Кроме того, вследствие расширения периферических сосудов снижается периферическое сопротивление и постнагрузка на сердце. Расширение коронарных сосудов способствует улучшению микроциркуляции и снабжения миокарда кислородом. Гипотензивное действие препарата осуществляется за счет расслабления периферических сосудов и уменьшения общего периферического сопротивления без изменения частоты сердечных сокращений.

**Показания к применению:** Препарат применяется для лечения пациентов, страдающих различными заболеваниями сердечно-сосудистой системы, в том числе: - повышение артериального давления, в том числе эссенциальная артериальная гипертензия; - ишемическая болезнь сердца, в том числе стенокардия напряжения, вариантная стенокардия и стенокардия Принцметала.

**Способ применения:** Коринфар: Взрослым обычно назначают по 1-2 таблетки препарата 2-3 раза в день, через равные промежутки времени. Таблетки глотают целиком, не разжевывая и не измельчая, запивая достаточным количеством воды. Рекомендуется принимать препарат после еды. Длительность курса лечения определяет лечащий врач в зависимости от характера заболевания.

**Форма выпуска:** Таблетки Коринфар, покрытые пленочной оболочкой, по 10 штук в блистере, по 3 блистера в картонной. упаковке. Таблетки Коринфар, покрытые пленочной оболочкой, по 50 или 100 штук во флаконе темного стекла, по 1 флакону в картонной упаковке.

#### **Лабеталол (Labetalol)**

**Групповая принадлежность:** Альфа- и бета-адреноблокатор.

**Фармакологическое действие:** Относится к “гибридным” адреноблокаторам, блокирующим одновременно бета- и альфа-адренорецепторы. Сочетание бетаадреноблокирующего и периферического вазодилаторного (расширяющего сосуды) действия обеспечивает надежный антигипертензивный (снижающий артериальное давление) эффект. Препарат существенно не влияет на величину сердечного выброса и частоту сердечных сокращений.

**Показания к применению:** Применяют лабеталол для снижения артериального давления при гипертензии (подъеме артериального давления) разной степени. В отличие от обычных бетаадреноблокаторов он оказывает быстрый антигипертензивный эффект.

**Способ применения:** Внутрь назначают в виде таблеток (во время еды) по 0,1 г (100 мг) 2-3 раза в день. При тяжелых формах гипертензии дозу увеличивают. Средняя суточная доза 600-1000 мг в 2-4 приема. Для поддерживающей терапии применяют по 1 таблетке (100 мг) 2 раза в день. При гипертонических кризах (быстром и резком подъеме артериального давления) вводят лабеталол внутривенно медленно в дозе 20 мг (2 мл 1% раствора). При необходимости повторяют инъекции с промежутками 10 мин. Предпочтительно

вводить лабеталол в виде инфузии. Для этого разводят 1% инъекционный раствор в ампулах изотоническим раствором натрия хлорида или глюкозы до концентрации 1 мг/мл. Вводят со скоростью 2 мл (2мг) в минуту. Обычно необходимая доза составляет 50-200 мг. Внутривенные введения производят в условиях стационара (больницы) при положении больного лежа (в связи с быстрым и значительным снижением артериального давления). Форма выпуска:

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 и 0,2 г (100 и 200 мг) по 30 и 100 штук в упаковке; 1% раствор для инъекций в ампулах по 5 мл (50 мг в ампуле).

### **Магния сульфат (Magniisulfas)**

**Групповая принадлежность:** Слабительное, спазмолитическое, желчегонное.

**Фармакологическое действие:** Магния сульфат оказывает многогранное влияние на организм. Препарат понижает возбудимость дыхательного центра, большие дозы препарата при парентеральном (минуя пищеварительный тракт) введении легко могут вызвать паралич дыхания. Артериальное давление несколько понижается в связи с общим успокаивающим действием препарата; этот эффект более выражен при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления). При парентеральном введении магния сульфат оказывает успокаивающее действие на центральную нервную систему. В зависимости от дозы может наблюдаться седативный (успокаивающий), снотворный или наркотический эффект. При приеме внутрь он плохо всасывается, действует как слабительное средство, подобно натрия сульфату, и оказывает также желчегонное действие, что связано с рефлексом, возникающими при раздражении нервных окончаний слизистой оболочки двенадцатиперстной кишки.

**Показания к применению:** Гипертоническая болезнь, в основном, при гипертонических кризах (быстром и резком подъеме артериального давления).

**Способ применения:** Как спазмолитическое (снимающее спазмы) и в некоторой степени антигипертензивное (снижающее артериальное давление) средство иногда применяют при лечении ранних стадий гипертонической болезни. Вводят внутримышечно по 5-10-20 мл 20% или 25% раствора магния сульфата. Курс лечения - 15-20 инъекций (ежедневно). Наряду с понижением артериального давления может наблюдаться уменьшение симптомов стенокардии. Систематический прием внутрь малых доз (1-2 г на 1/2 стакана воды натощак) также иногда способствует улучшению состояния больных и несколько тормозит развитие атеросклероза. При гипертонических кризах вводят внутримышечно или внутривенно (медленно!) 10-20 мл 20-25% раствора магния сульфата.

**Форма выпуска:** Порошок; 20% или 25% раствор в ампулах по 5; 10 и 20 мл.

### **Монсонидин (Moxonidine)**

**Групповая принадлежность:** Гипотензивное средство центрального действия

**Фармакологическое действие:** Селективный агонист имидазолиновых рецепторов, отвечающих за тонический и рефлекторный контроль над симпатической нервной системой (локализованы в вентеролатеральном отделе продолговатого мозга). Незначительно связывается с центральными альфа<sub>2</sub>-адренорецепторами, снижает АД. При длительном применении уменьшает гипертрофию миокарда ЛЖ, нивелирует признаки миокардиального фиброза, микроартериопатии, нормализует капиллярное кровоснабжение миокарда, снижает ОПСС, легочное сосудистое сопротивление. На фоне лечения снижается концентрация норэпинефрина и эпинефрина, ренина, ангиотензина II в покое и при нагрузке, предсердного натрийуретического фактора (при нагрузке) и альдостерона плазмы. Уменьшает резистентность тканей к инсулину, стимулирует высвобождение гормона роста. Не влияет на обмен глюкозы и липидов. Интервал между достижением Spax и выраженным снижением АД в покое различается в среднем на 10%, при нагрузке - на 7.7%. Продолжительность действия - более 12 ч (медленно выводится из ЦНС и на длительное время уменьшает концентрацию эпинефрина в плазме).

**Показания к применению:** Артериальная гипертензия.

**Способ применения:** Внутрь, во время или после еды, запивая жидкостью, по 0.2 мг/сут за один прием, предпочтительнее в утренние часы. При необходимости дозу увеличивают до 0.4 мг/сут за 2 приема. Максимальная суточная доза - 0.6 мг. У больных с почечной недостаточностью (КК 30-60 мл/мин) разовая доза не должна превышать 0.2 мг, суточная доза - 0.4 мг.

**Форма выпуска:** таблетки покрытые оболочкой, 1 таблетка, покрытая пленочной оболочкой, содержит 0,2 мг, 0,3 мг либо 0,4 мг моксо-нидина.

## Диуретики. Противоподагрические лекарственные средства. Утеротропные лекарственные средства.

### Лекарственные средства влияющие на функцию миометрии и почек

#### Краткие сведения о процессе мочеобразования

Диуретическими (салуретиками) или мочегонными средствами называют лекарственные средства усиливающие выведение почками из организма солей и воды.

При некоторых заболеваниях почек, сердечной недостаточности, циррозе печени отравлениях при которых нарушается деятельность почек и др. подобных состояниях, происходит задержка воды в организме с возникновением отеков, а также скопление воды в брюшной полости (асцит). Развитию отечности любого происхождения связана с задержкой в организме ионов натрия, что приводит к повышению осмотического давления в тканях и задержке воды. Поэтому, основная направленность действия диуретических средств связана с выведением из организм, прежде всего, солей (в основном натрия хлорида), в связи с чем препараты этой группы называют также «салуретиками».

Почки имеют сложное строение и состоят из многочисленных структурных единиц – «нефронов», которых насчитывается около 1 млн. Каждый нефрон содержит сосудистый клубочек, связанный с канальцевым аппаратом посредством капсулы Шумлянско-Боумана. Через стенки капилляров сосудистого клубочка в капсулы проходит фильтрация плазмы крови, за исключением крупномолекулярных белков. Процесс фильтрации проходит очень интенсивно, за сутки фильтрации подвергается 150 – 170 литров жидкости (в зависимости от скорости почечного кровотока).

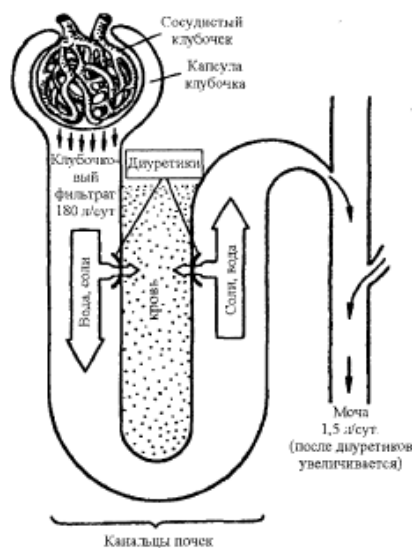


Схема нефрона и направленность действия основных диуретиков

Образовавшийся фильтрат поступает в почечные канальцы, где подавляющее его часть (до 99%) подвергается обратному всасыванию в кровь (реабсорбции). От общего объема фильтрата после реабсорбции в канальцах остается около 1% жидкости, то составляет 1,5 – 1,7 литров мочи в сутки (нормальный суточный диурез). Канальцевая реабсорбция фильтрата – сложный биохимический процесс, в котором принимают участие различные ферменты (карбоангидраза, сукциндегидрогеназа и др.), гормоны (альдростерон, вазопрессин) и др. факторы. Реабсорбция воды в канальцах тесно связана с реабсорбцией

различных ионов:  $\text{Na}^+$   $\text{K}^+$   $\text{Cl}^-$  и др. Для дистальных канальцев характерна пассивная секреция ионов калия и водорода.

Диуретические средства различаются между собой по механизму действия, но в подавляющем большинстве связано с задержкой реабсорбции ионов  $\text{Na}^+$ , которые выводятся из организма увлекая за собой воду.

Диуретические (мочегонные) средства условно делятся на несколько групп в зависимости от механизма действия:

1. Диуретики прямого действия (петлевые диуретики), непосредственно влияющие на функцию почечных канальцев. В эту группу входят:
  - а) препараты тиазиновой структуры: дихлотиазид, цикломедиазид;
  - б) препараты разлной структуры: фуросемид, амилорид, диакарб;
2. Антагонисты альдостерона: спиронолактон;
3. Осмотические диуретики: манит, мочеви́на;



#### **Диуретики непосредственно влияющие на функции почечных канальцев (петлевые диуретики)**

К диуретикам непосредственно влияющим на функции почечных канальцев (петлевым диуретикам) относятся такие препараты, как дихлотиазид (гипотиазид), циклометазид, фуросемид, этакринова кислота (урегит), оксодолин, диакарб и др. Петлевые диуретики сходны между собой по механизму действия и относятся к наиболее эффективным лекарственным препаратам, обладающих мочегонным действием.

## ПЕТЛЕВЫЕ ДИУРЕТИКИ

**Наиболее эффективные, нетоксичные (дихлотиазид, фуросемид, циклометиазид). Действие наступает через 30 - 60 мин. (при внутривенном введении фуросемида 2 - 3 мин., продолжается 8 - 12 часов (фуросемид - 3 часа). Обусловлено уменьшением реабсорбции ионов натрия и хлора, в меньшей степени калия и бикарбонатов. Снижают артериальное давление (при гипертонии). Недостаток - понижают уровень калия (гипокалиемия) что ведет к мышечной слабости, потере аппетита и нарушениям сердечной деятельности. Тиазиды - задерживают выделение уратов (усиливают подагру). Диакарб - ингибитор карбоангидразы.**

К наиболее эффективным лекарственным средствам этой группы относится дихлотиазид (гипотиазид) и его аналоги. Мочегонный проявляется через 30 – 60 минут после перорального приема и длится 8 – 12 часов. Механизм диуретического действия связан с уменьшением реабсорбции ионов натрия и хлора (в меньшей степени) в печеных канальцах. Уменьшается также реабсорбция и других ионов – калия и бикорбонатов. Артериальное давление под действием гипотиазидов снижается, особенно при гипертонии. Аналогом дихлотиазидов является – циклометиазид, По механизму действия циклометиазид на организм близок к гипотиазиду, но эффективнее последнего в 100 раз, что позволяет применять его в меньших дозах.

Существенным недостатком петлевых диуретиков, в том числе дихлотиазидов и его аналогов является их способность понижать уровень калия в крови (вызывать гипокалиемию). Уменьшение уровня калия ведет к нарушениям в работе сердца и нарастающей сердечной слабости. Для предупреждения гипокалиемии рекомендуется в этот период употреблять пищу богатую ионами калия или принимать хлорид калия в виде 5% раствора, по 1 столовой ложке 3 – 4 раза в день. Кроме того, тиазиды обладают еще рядом негативных побочных эффектов, так они задерживают выведение из почками уратов (ураты - хорошо растворимые натриевая и калиевая соли мочевой кислоты, в организме человека могут откладываться в почках и мочевом пузыре в составе камней и подагрических отложений). Также тиазиды неблагоприятно действуют на функцию поджелудочной железы.

Эффективным диуретическим средством является - фуросемид (лазикс). Мочегонное действие препарата наступает достаточно быстро, особенно при внутривенном введении (через 2 – 3 минуты) и продолжается 3 часа, поэтому фуросемид является наиболее предпочтительным диуретиком в качестве средства экстренной помощи при отравлениях (для быстрого выведения ядовитых веществ из организма), а также при отеках легких и мозга и др.

Быстродействующим диуретическим средством является также этакриновая кислота (урегит). По механизму действия этакриновая кислота сходна с фуросемидом. Назначается внутрь и внутривенно (по 0,05 г).

Некоторые из диуретических лекарственных средств этой группы обладают пролангированным действием. Так, лекарственный препарат клопамид (таблетки по 0,02 г) оказывает диуретическое действие в течении 24 часов, действие диуретика - оксодолина

начинается через 4 – 6 часов и продолжается более суток (по некоторым данным до 3 суток).

Диуретическое средство диакарб является ингибитором фермента карбоангидразы. Карбоангидраза участвует в процессе гидратации и дегидратации угольной кислоты (по химическому строению сходна с сульфаниламидами). Диакарб блокирует карбоангидразу в почечных канальцах, вследствие чего тормозится образование угольной кислоты, с последующей ее диссоциацией и освобождением ионов водорода, что, в свою очередь, способствует прекращению реабсорбции ионов натрия. Вследствие чего, ионы натрия образуют бикарбонаты и выводятся из организма, увлекая за собой воду. Диакарб, как и диуретики тиазиновой группы оказывает тоже негативное побочное - способствует выделению из организма ионов калия, вызывая гипокалиемию.

К диуретическим средствам из группы антагонистов альдостерона относятся спиронолактон (альдактон) и др. лекарственные средства. Механизм диуретического действия антагонистов альдостерона основан на их конкурентном антагонизме с гормоном коры надпочечников – альдостероном. Избыток альдостерона способствует образованию отеков. Альдостерон разрушается (инактивируется) в печени, при заболеваниях печени этот процесс нарушается, что способствует образованию избытка альдостерона и, как следствие, развитию отеков.

К калийсберегающим диуретикам – антагонистам альдостерона относятся также триамтерен (птерофен).

#### АНТАГОНИСТЫ АЛЬДОСТЕРОНА

**К ним относятся спиронолактон, триамтерен. Механизм действия основан на конкуренции с гормоном коры надпочечников - альдостероном. Уровень альдостерона - повышается при отеках, вследствие нарушения его инактивации в печени. Антагонисты - усиливают выделение ионов натрия, но задерживают ионы калия (калийсберегающие), могут комбинироваться с петлевыми диуретиками. Эффективны только при альдостеронизме, так же уменьшают токсичность сердечных гликозидов.**

Положительным свойством этой группы диуретических средств является их способность задерживать в организме ионы калия, которые, в отличие от петлевых диуретиков, не вызывают гипокалиемию, отрицательным же является их избирательная активность, которая проявляется только при альдостеронизме (отеках, вызванной избытком альдостерона).

Диуретические средства – антагонисты альдостерона часто применяют совместно с петлевыми диуретиками (вызывающими гипокалиемию), при этом сохраняется калийсберегающий эффект антагонистов альдостерона, а диуретический эффект усиливается.

К осмотическим диуретикам относятся такие лекарственные препараты, как мочевины, маннит, и др. Осмотические диуретики эффективны при лечении отеков легких и мозга.

### ОСМОТИЧЕСКИЕ ДИУРЕТИКИ

**Осмотические диуретики (мочевина, маннит).  
Применяются при отеках легких и мозга. При  
внутривенном введении (маннит 20 - 30 %, мочевина 30%) повышается осмотическое давление плазмы крови, происходит дегидратация (обезвоживание) тканей. В почках маннит и мочевина полностью выделяются с мочой увлекая воду.**

При введении гипертонических растворов этих веществ (30% раствор мочевины или 10 – 20% раствор маннита) повышается осмотическое давление плазмы крови, в связи с чем происходит дегидратация (обезвоживание) тканей (тканевые жидкости переходят в кровь). Мочевина (маннит) полностью выводятся из организма, увлекая за собой воду.

Кроме перечисленных групп диуретических средств, ряд лекарственных препаратов проявляют диуретические свойства, такие как: теобромин, теофиллин, аммония хлорид, вещества растительного происхождения (почечный чай, лист толокнянки) и др. Эти лекарственные препараты уступают по силе действия петлевым и осмотическим диуретикам и применяются в качестве вспомогательных средств.

### Противоподагрические средства

Подагра – заболевание, связанное с нарушением обмена мочевой кислоты (конечным продуктом обмена нуклеопротеидов). В норме мочевая кислота находится в растворенном состоянии и выводится из организма с мочой, при нарушении ее обмена - откладывается в тканях организма в виде кристаллов, прежде всего, в суставных хрящах рук и ног. Вокруг отложений мочевой кислоты развиваются очаги воспаления вызывая сильные болевые ощущения, воспаленные суставы деформируются.

### ПРОТИВОПОДАГРИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

**Подагра - заболевание связанное с нарушением обмена мочевой кислоты (которая выводится с мочой). При подагре - откладывается в виде кристаллов в суставах конечностей. Вокруг отложений развиваются воспалительные заболевания сопровождающиеся резкими болями. Противоподагрические средства (этамид, антуран, аллопуринол) - способствуют выведению мочевой кислоты и снижению ее содержания в крови, также обладают слабыми противовоспалительными свойствами. Противовоспалительные препараты (салицилаты, глюкокортикоиды и пр.) применяют в комплексе.**



Для лечения подагры применяют ряд лекарственных препаратов, такие как этамид, антуран, аллопуринол, которые способствуют выведению мочевой кислоты из организма.

Так, лекарственный препарат этамид способствует выведению мочевой кислоты с мочой, противоподагрическое средство антуран также способствует выведению мочевой кислоты, оказывает при этом противовоспалительное и анальгезирующее действие. Аллопуринол (милурит) отличается от вышеперечисленных препаратов по механизму действия, угнетает синтез мочевой кислоты, понижая ее содержание в крови.

При острых приступах подагры применяют противовоспалительные и обезболивающие средства (глюкокортикоиды, салицилаты др.).

Нарушение обмена мочевой кислоты может быть причиной возникновения камней в почках. Однако, возникновение камней (конкрементов) в почках может происходить как при повышенном, так и при нормальном содержании в моче кальция, соединений щавелевой кислоты (оксалатов), цистина, мочевой кислоты. Все эти вещества образуют кристаллы, которые закрепляются в структурах почки и постепенно увеличиваются в размерах, формируя камни.

В типичном случае подобный камень начинает продвигаться по мочевому тракту и выводится из организма с мочой. Но, застревав в мочевых путях и препятствуя оттоку мочи, камень может причинять боль. Крупные конкременты далеко не всегда отходят самопроизвольно, и в ряде случаев требуется хирургическое вмешательство для их удаления.

Для разрушения, растворения и выведения камней из почек применяют ряд комбинированных лекарственных средств, таких как: солуран, уродан, магурлит и др. При лечении мочекаменной болезни применяются также растительные экстракты, комплексные препараты (в том числе растительного происхождения): фитолизин, цистенал, олиметин, обладающие спазмолитическим, противовоспалительным и мочегонным действием.

### **Средства влияющие на функцию миометрии**

Средства, влияющие на функцию миометрии – это лекарственные препараты, стимулирующие сократительную активность мышц матки.

Лекарственные средства, влияющие на функцию миометрии делят на две группы:

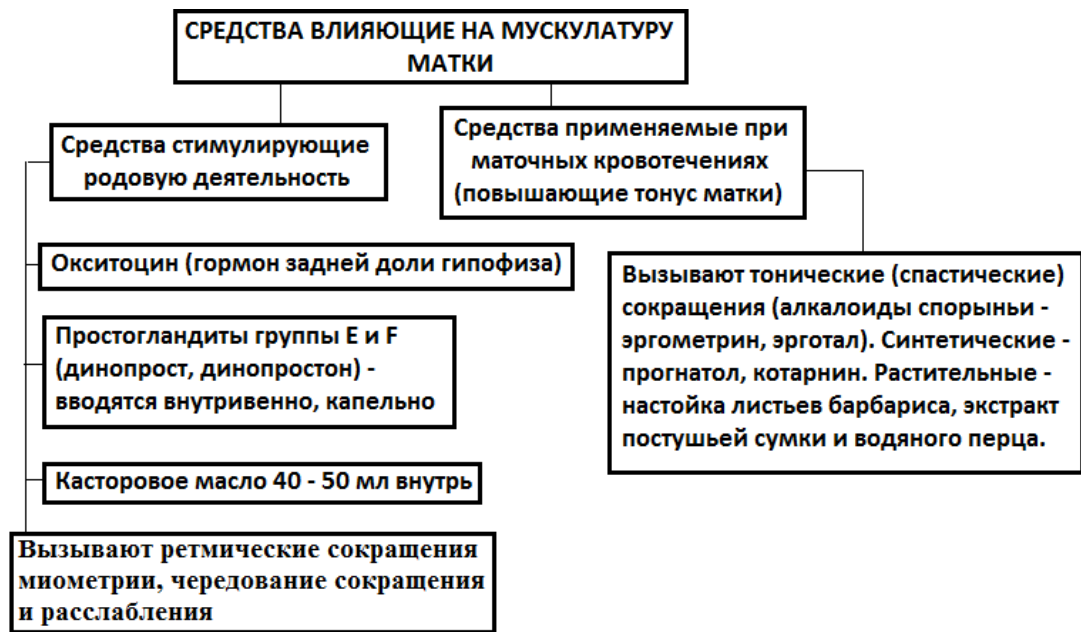
1. Средства, стимулирующие родовую деятельность;
2. Средства применяемые при маточных кровотечениях;



### **Средства стимулирующие родовую деятельность**

Средства, стимулирующие родовую деятельность это лекарственные препараты вызывающие ритмические сокращения матки и, таким образом, способствующие родовой

деятельности. К этой группе средств относятся: окситоцин, простагландины, касторовое масло и др.



Окситоцин – гормон задней доли гипофиза, способствует родовой деятельности вызывая, ритмические сокращение матки во время родов. В первые периоды беременности матка не чувствительна к окситоцину. Постепенно чувствительность повышается и перед родами резко возрастает. Препарат вводится внутривенно, капельно, предварительно растворяя в 5% растворе глюкозы.

Простагландины группы E и F (динопрост, динопростон) обладают выраженным действием на сократительную активность миометрии. В отличие от окситоцина, простагландины усиливают сократительную активность матки в любой период беременности, в связи с чем, эти препараты могут быть применяться для ее искусственного прерывания (аборта) по медицинским показателям.

Достаточно эффективным средством усиления родовой деятельности является касторовое масло (40 – 50 мл внутрь). Касторовое масло – слабительное средство, которое рефлекторно вызывает ритмические сокращения матки. Для расслабления шейки матки и облегчения прохождения плода вместе с касторовым маслом назначаю атропин.

### Средства применяемые при маточных кровотечениях

Средства, применяемые при маточных кровотечениях, вызывают тонические (спастические) сокращения матки (без стадии расслабления), что приводит к сдавливанию кровеносных сосудов и остановке кровотечения. Алкалоиды спорыньи не назначаются для стимуляции родовой деятельности.

К средствам этой группы относятся алкалоиды спорыньи (грибка, паразитирующего на злаковых растениях – пшенице и ржи). Наиболее выраженное тоническое действие на матку оказывает алкалоид эргометрин. Назначается внутрь или вводится парентерально при маточных кровотечениях.

Кроме эргометрина, применяется лекарственный препарат – эрготал, который представляет собой сумму алкалоидов спорыньи. По механизму действия аналогичен эрготамину. Препараты спорыньи применяют только по назначению врача, поскольку их применение может привести к нарушениям периферического кровообращения (прежде всего, нижних конечностей).

Для остановки маточных кровотечений применяются также синтетические аналоги алкалоидов спорыньи - прегнантон и котарнина хлорид. Прегнантол применяется в акушерской практике как заменитель препаратов спорыньи при маточных заболеваниях,

атонии и гипотонии матки в послеродовом периоде, для усиления сокращений маточной мускулатуры и уменьшения кровотечений, при маточных кровотечениях в послеродовом периоде. Котарнина хлорид назначается внутрь в виде таблеток (2–3 раза) в день или подкожно по 1 мл 2–5% раствора. Применяется по тем же показаниям, что и препараты спорыньи.

При умеренных кровотечениях применяют препараты растительного происхождения: настойку из листьев барбариса, экстракт пастушьей сумки и др.

### **Средства расслабляющие мускулатуру матки (токолитики)**

Для уменьшения сократительной активности миометрии - угрозе преждевременных родов применяют различные препаратов различных фармакологических групп: холинолитики, спазмолитики, седативные средства.

Установлено, что блокада  $\alpha$ - адренорецепторов, а также стимуляция  $\beta_2$  адренорецепторов (партусистен, ритодрин). Партусистен и ритодрин применяются в качестве токолитических (расслабляющего мускулатуру матки) средств, при угрозе преждевременного прерывания беременности. Вводятся препараты внутривенно (капельно) или перорально (в виде таблеток).

## **Краткая характеристика лекарственных препаратов**

### **Гидрохлортиазид (Hydrochlorothiazidum)**

**Групповая принадлежность:** Диуретическое средство

**Фармакологическое действие:** Гидрохлортиазид – лекарственный препарат, обладающий выраженным салуретическим действием. Гидрохлортиазид значительно снижает реабсорбцию жидкости, а также ионов хлора и натрия в дистальных канальцах. Препарат повышает выведение ионов магния, калия и бикарбоната с мочой и снижает выведение ионов кальция вследствие воздействия на дистальные канальцы. За счет уменьшения выведения кальция с мочой предотвращается образование кальциевых конкрементов в почках. Помимо диуретического эффекта, гидрохлортиазид также оказывает некоторое гипотензивное действие и уменьшает полиурию у пациентов с несахарным диабетом.

**Показания к применению:** Гидрохлортиазид применяют для терапии (в том числе комплексной) пациентов, страдающих артериальной гипертензией, а также сердечной недостаточностью, которая сопровождается отеками. Препарат назначают при циррозе печени с асцитом, а также применяют для лечения пациентов с нарушениями функции почек, в том числе нефротическим синдромом, хронической формой почечной недостаточности и острым гломерулонефритом.

**Способ применения:** Гидрохлортиазид предназначен для перорального применения. Не следует измельчать или разжевывать таблетку перед приемом. Для снижения риска развития нежелательных эффектов препарат Гидрохлортиазид следует принимать после приема пищи. Более комфортным является применение препарата в первой половине дня, однако при несахарном диабете следует назначать препарат в несколько приемов в течение дня. Если таблетка была пропущена, её следует принять как можно раньше, однако если до приема следующей дозы осталось менее 6 часов не следует удваивать дозу. Взрослым в качестве диуретического средства обычно рекомендуется назначение 1-4 таблетки препарата. При продолжительной терапии переходят на прием препарата 2-3 раза в неделю.

**Форма выпуска:** Таблетки по 20 штук в пластинке (контурной ячейковой упаковке), по 1 пластинке, помещенной в картонную пачку. Таблетки по 10 штук в пластинке (контурной ячейковой упаковке), по 2 пластинки, помещенные в картонную пачку.

### **Спиронолактон (Spironolactone)**

**Групповая принадлежность:** Диуретическое калийсберегающее средство

**Фармакологическое действие:** Препарат является калий - и магнийсберегающим диуретиком. Конкурентный антагонист альдостерона, повышает выведение  $\text{Cl}^-$ , воды и  $\text{Na}^+$ , снижает выведение мочевины и  $\text{K}^+$ , уменьшает титруемую кислотность мочи. Диурез вызывает непостоянный гипотензивный эффект, не зависящий от уровня в плазме крови ренина и не проявляющийся при нормальном АД. Проявление диуретического эффекта наступает на 2-5 день приема препарата.

**Показания к применению:** - Вторичный гиперальдостеронизм при циррозе печени, сопровождающимся асцитом и отеками, нефротическом синдроме; - отечный синдром, вызванный хронической сердечной недостаточностью (применяется как монотерапия, а также в сочетании с комбинированной терапией); - эссенциальная гипертензия (с комбинированной терапией); - гипокалиемия и гипوماгнемия (применяется как вспомогательное средство для профилактики при лечении диуретиками и невозможности применения прочих препаратов для коррекции уровня калия); - установление диагноза первичного

гиперальдостеронизма. - гиперальдостеронизм (используется на коротком предоперационном курсе лечения).

**Способ применения:** Препарат принимается внутрь. В случае эссенциальной гипертензии для взрослых однократная суточная доза составляет порядка 50-100 мг, можно увеличить ее до 200 мг. Увеличивать дозу следует 1 раз в 14 дней. Для адекватного результата терапии принимать препарат необходимо минимум 2 недели. При необходимости проводится коррекция дозы. При отечном синдроме, вызванном хронической сердечной недостаточностью, препарат назначается ежедневно по 100-200 мг на 5 дней в сочетании с тиазидным или «петлевым» диуретиком. Суточную дозу можно снизить при положительном эффекте до 25 мг. Максимальная суточная доза равна 200 мг. Поддерживающая доза устанавливается индивидуально. При отеках, которые связаны с циррозом печени, суточная доза Спиринолактона составляет для взрослых 100 мг. Поддерживающая доза устанавливается индивидуально..

**Форма выпуска:** В 1 таблетке Спиринолактона 25 мг или 100 мг, упаковка содержит 20 таблеток.

### **Динопростон (Dinoproston)**

Групповая принадлежность Родовой деятельности стимулятор-препарат ПГЕ2

**Фармакологическое действие:** Препарат простагландина E2. Оказывает стимулирующее влияние на сократительную активность и тонус миометрия (мышечного слоя матки). Применение динопростона вызывает ритмичные сокращения беременной матки в любой период беременности. Чувствительность беременной матки к препарату в начале и середине беременности ниже, чем в конце. При местном применении препарат содействует созреванию шейки матки и стимулирует сокращения гладкой мускулатуры (изменения, возникающие в период индуцированного размягчения, сглаживания и раскрытия шейки матки - вместе эти процессы называют созревaniem).

**Показания к применению:** Стимуляция родов при доношенной беременности - таблетки динопроста; индукция (стимуляция) родов у женщин с доношенной или с почти доношенной беременностью - гель вагинальный; индукция (вызывание) родов при доношенной беременности, индукция изгнания плода в случае его внутриутробной гибели, медикаментозный аборт, несостоявшийся аборт, пузырный занос (заболевание беременной женщины, в результате которого нарушается питание плода, что, как правило, приводит его к гибели) - концентрат для инфузий.

**Способ применения:** Для индукции родов при доношенной беременности дозу подбирают в соответствии с чувствительностью пациентки и поддерживают ее на возможно более низком уровне, обеспечивающим как достаточную реакцию матки, так и нормальное прогрессивное раскрытие шейки. Внутрь назначают в первой дозе 0,5 мг. В последующем дают по 0,5 мг каждый час. Если активность матки является недостаточной, то дозировку увеличивают до 1 мг в час, пока активность матки не увеличится. Не рекомендуется увеличивать дозу препарата свыше 1,5 мг в час. В случае прогрессирующего расширения шейки матки возможно уменьшение дозы вводимого препарата до 0,5 мг в час. Не рекомендуют длительное, более 2 дней, применение препарата. Для внутривенного введения применяют инфузионный раствор с концентрацией 1,5 мкг/мл.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,5 мг; стерильный раствор 10 мг/мл в ампулах по 0,5 мл; стерильный раствор для внутривенного введения 1 мг/мл в ампулах по 0,75 мл; стерильный раствор для экстраамниотического введения в ампулах по 0,5 мл в комплекте с растворителем во флаконах по 50 мл. Гель вагинальный 3 г (2,5 мл) в шприцах по 1 мг или по 2 мг динопростона.

### **Триамтерен (Triamterenum)**

Групповая принадлежность: Диуретическое калийсберегающее средство

**Фармакологическое действие:** Триамтерен уменьшает проницаемость клеточных мембран дистальных почечных канальцев (расположенных на периферии почки) для ионов натрия и усиливает их выделение с мочой без увеличения выделения ионов калия. Секретия ионов калия в дистальных канальцах понижается. Препарат способен уменьшать гипокалиемию (понижение уровня калия в крови), вызываемую гипотиазидом и циклометиазидом, и усиливать диуретический (мочегонный) эффект последних. Препарат быстро всасывается; диуретическое действие после приема внутрь отмечается через 15-20 мин, максимальный эффект - через 2-3 ч после приема и удерживается в течение 12 ч.

**Показания к применению:** Применяют при отеках, обусловленных недостаточностью кровообращения, циррозами печени, нефротическим синдромом (сочетанием отеков с нарушениями белкового обмена вследствие заболевания почек). В связи с калийсберегающим действием особенно показан для комбинированного применения одновременно с тиазидными диуретиками (мочегонными средствами), а также у больных с явлениями непереносимости гликозидов наперстянки, в основе которой лежит гипокалиемия.

**Способ применения:** Назначают внутрь самостоятельно и в комбинации с другими диуретиками. При самостоятельном применении - по 0,05-0,1-0,2 г в день (в 1-2 приема - после завтрака и обеда), при комбинированной терапии - меньшие дозы (например, 0,025 г триамтерена и 0,0125 г гипотиозида). Увеличивают дозу постепенно (во избежание слишком быстрого или про-фузного диуреза (обильного мочеотделения). Обычно принимают препарат ежедневно.

**Форма выпуска:** Капсулы по 0,05 г (50 мг) препарата.

**Клопамид (Clopamide)****Групповая принадлежность:** Диуретическое средство**Фармакологическое действие:** Диуретическое средство средней силы действия, увеличивает выведение с мочой  $\text{Na}^+$ ,  $\text{Cl}^-$ ,  $\text{K}^+$  и  $\text{Mg}^{2+}$ , снижает  $\text{Ca}^{2+}$ . Механизм действия связан с угнетением активной реабсорбции  $\text{Na}^+$  в кортикальном сегменте петли Генле. Ингибируя карбоангидразу в проксимальном отделе извитых канальцев, приводит к усилению секреции  $\text{K}^+$ , карбонатов и фосфатов. Мало влияет на КОС. Снижает исходно повышенное АД. Повышает венозный тонус. Действие развивается через 1-3 ч после приема, максимум эффекта - через 6 ч, длительность - в течение 12-24 ч.**Показания:** Отечный синдром (ХСН, беременность, нефроз, посттромботический отек, цирроз печени, асцит, предменструальный синдром, длительное применение ГКС); артериальная гипертензия (умеренной и средней тяжести).**Способ применения** Внутрь, при артериальной гипертензии назначают в начальной дозе 5-10 мг (до 20 мг) 1 раз в день, утром, после еды, в течение 7 дней. При достижении желаемого гипотензивного эффекта дозу уменьшают до 10 мг/сут. При отечном синдроме назначают в разовой дозе 20-40 мг (при необходимости - 80 мг) 1 раз в сутки, утром.**Форма выпуска:** Таблетки 0.02 г.**Этакриновая кислота (урегит) (Acidum etacrynicum)****Групповая принадлежность:** Диуретическое средство**Фармакологическое действие:** Является сильным диуретическим (мочегонным) средством. По механизму действия близок к фуросемиду, но существенно не нарушает электролитного (ионного) состава крови. Действует быстро; эффект начинается через 30-60 мин, достигает максимума через 2 ч, продолжается после однократного приема 6-9 ч.**Показания к применению:** Назначают при отеках у больных с недостаточностью кровообращения; при отеках почечного происхождения, особенно устойчивых к действию других диуретиков (мочегонных средств); при остром отеке легких; отеке головного мозга. Оказывает умеренное антигипертензивное (снижающее артериальное давление) действие; при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления) может применяться в сочетании с гипотензивными (снижающими артериальное давление) средствами.**Способ применения:** Назначают внутрь, начиная с 0,05 г (50 мг), повышая при необходимости суточную дозу препарата до 0,1-0,2 г. Обычно принимают всю дозу препарата утром (после еды). Диуретический эффект часто более выражен, если препарат принимают не ежедневно, а с перерывом в 1-2 дня. Внутривенно (0,05 г) вводят в случаях, когда требуется быстрый эффект. Лечение следует проводить на фоне диеты, богатой калием, а при необходимости назначать препараты калия.**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 г в упаковке по 20 штук; в ампулах, содержащих по 0,05 г натриевой соли этакриновой кислоты, которую растворяют изотоническим раствором натрия хлорида или глюкозы.**Дихлоротиазид (Гидрохлоротиазид)(Hydrochlorothiazide)****Групповая принадлежность:** Диуретическое средство**Фармакологическое действие:** Тиазидный диуретик средней силы. Снижает реабсорбцию  $\text{Na}^+$  на уровне кортикального сегмента петли Генле, не влияя на ее участок, проходящий в мозговом слое почки, что определяет более слабый диуретический эффект в сравнении с фуросемидом. Блокирует карбоангидразу в проксимальном отделе извитых канальцев, усиливает выведение с мочой  $\text{K}^+$  (в дистальных канальцах  $\text{Na}^+$  обменивается на  $\text{K}^+$ ), гидрокарбонатов и фосфатов. Практически не влияет на КОС ( $\text{Na}^+$  выводится либо вместе с  $\text{Cl}^-$ , либо с гидрокарбонатом, поэтому при алкалозе усиливается выведение гидрокарбонатов, при ацидозе - хлоридов). Повышает выведение  $\text{Mg}^{2+}$ ; задерживает в организме ионы  $\text{Ca}^{2+}$  и выведение уратов. Диуретический эффект развивается через 1-2 ч, достигает максимума через 4 ч, продолжается 10-12 ч.**Показания:** Артериальная гипертензия; отечный синдром различного генеза (ХСН, портальная гипертензия, нефротический синдром, ХПН, задержка жидкости при ожирении), гестоз (нефропатия, отеки, эклампсия); сахарный диабет; субкомпенсированные формы глаукомы; профилактика образования камней в мочевыводящих путях.**Способ применения и дозы:**Для снижения АД: внутрь, 25-50 мг/сут, при этом незначительный диурез и натрийурез отмечаются лишь в первый день приема (назначают длительно в комплексе с др. гипотензивными ЛС: вазодилататорами, ингибиторами АПФ, симпатолитиками, бета-адреноблокаторами). При увеличении дозы с 25 до 100 мг наблюдаются пропорциональное увеличение диуреза, натрийуреза и снижение АД. В разовой дозе свыше 100 мг - возрастание диуреза и дальнейшее снижение АД незначительны, наблюдается непропорционально возрастающая потеря электролитов, особенно  $\text{K}^+$  и  $\text{Mg}^{2+}$ . Увеличение дозы свыше 200 мг нецелесообразно, т.к. усиления диуреза не происходит. При отечном синдроме (в зависимости от состояния и реакции больного) назначают в суточной дозе 25-100 мг, принимают однократно (утром) или в 2 приема (в первой половине дня). Лицам пожилого возраста - 12.5 мг 1-2 раза в день.

**Форма выпуска:** таблетки по 0,025 и 0,1 г.

#### **Динопрост энзапрост Ф (Dinoprost)**

**Групповая принадлежность:** Родовой деятельности стимулятор-препарат ПГФ2

**Фармакологическое действие:** Оказывает выраженное стимулирующее действие на гладкую мускулатуру матки.

**Показания к применению:** Используют в акушерской практике для возбуждения и стимуляции сократительной деятельности матки в любые сроки беременности только в условиях стационара (больницы).

**Способ применения:** С целью аборта. Производят глубокую чрезбрюшную пункцию (прокалывание) плодного пузыря и удаляют не менее 1 мл амниотической жидкости (околоплодных вод), затем медленно вводят в плодный пузырь 40 мг (8 мл) препарата. Первые 5 мг (1 мл) вводят очень медленно и только при условии, что амниотическая жидкость чистая (не окрашена кровью). Если в течение 24 часов после введения первой дозы препарата аборт не начался или не завершился, можно (при не вскрывшемся плодном пузыре) ввести еще 10-40 мг (2-8 мл) препарата. Длительное (более 2 дней) введение препарата не рекомендуют. Для индукции (стимуляции) родов (в срок) и/или для изгнания содержимого полости матки в третьем триместре беременности в случае внутриутробной гибели плода, как минимум, в течение 30 минут проводят внутривенную инфузию раствора с концентрацией 15 мкг/мл со скоростью 2,5 мкг/мин. Если достигается адекватный ответ мускулатуры матки, этот темп можно сохранять; в противном случае темп введения можно повышать на 2,5 мкг/мин каждый час до тех пор, пока не будет достигнут требуемый эффект, однако не следует превышать уровень 20 мкг/мин.

**Форма выпуска:** Таблетки; стерильный раствор 5 мг/мл в ампулах по 1; 1,5; 4; 5 и 8 мл.

#### **Маннит (Mannit)**

**Групповая принадлежность:** Диуретическое средство

**Фармакологическое действие:** Маннит – лекарственный препарат группы осмотических диуретиков. Препарат обладает выраженным диуретическим действием, за счет изменения осмотического давления плазмы крови препарат способствует переходу воды из тканей в сосудистое русло. Маннитол снижает внутриглазное и внутричерепное давление, способствует повышению выведения воды и натрия почками. Препарат не оказывает значительного влияния на уровень ионов калия в плазме крови. Применение Маннита не эффективно у пациентов с нарушенной фильтрационной способностью почек, азотемией при циррозе печени и асцитом. При инфузионном введении препарата отмечается увеличение объема циркулирующей крови. Диуретический эффект маннитола развивается в течение 1-3 часов, а снижение внутриглазного и внутричерепного давления в течение 15 минут после начала инфузии. Активный компонент препарата проникает через гематоплацентарный барьер. Период полувыведения маннитола достигает 1,5-2 часов.

**Показания к применению:** Маннит назначают при отеке мозга, повышении внутриглазного и внутричерепного давления (после перенесенных травм и оперативных вмешательств), олигурии (с выраженной почечной и почечно-печеночной недостаточностью при нормальной фильтрационной способности почек). Маннит вводят при необходимости ускорения диуреза при отравлениях, в частности при отравлении лекарственными препаратами группы салицилатов и барбитуратов. Препарат используют для лечения осложнений связанных с введением несовместимой крови, а также для профилактики ишемии почек, гемолиза и гемоглобинемии во время проведения оперативных вмешательств с экстракорпоральным кровообращением.

**Способ применения:** Маннит предназначен для парентерального применения. Раствор следует вводить инфузионно капельно или медленно струйно. Раствор следует вводить предварительно согреть до температуры тела. Количество инфузионного раствора рассчитывает лечащий врач с учетом необходимой дозы маннитола и возможного объема жидкости. Рекомендованная доза для профилактики составляет 500 мг маннитола на каждый килограмм массы тела. Рекомендованная терапевтическая доза составляет 1000-1500 мг маннитола на каждый килограмм массы тела. Не рекомендуется использовать более 140-180 г маннитола в сутки

**Форма выпуска:** Инфузионный раствор по 200 или 400 мл в стеклянных флаконах. -

#### **Диакарб (Diacarb)**

**Групповая принадлежность:** Диуретическое средство

**Фармакологическое действие:** Диакарб является салуретиком, вызывающим диурез путем удаления определенных электролитов, в количественном отношении не нарушающим значительной степени электролитового равновесия в организме. Механизм этого действия заключается в торможении функции карбангидраза-энзима, играющего серьезную роль в транспорте ионов и сохранения ионного равновесия организма. В результате этого торможения происходит увеличение удаления натрия, калия и бикарбонатов, повышение диуреза и pH мочи уменьшение удаления аммиака. Диакарб из пищеварительного тракта всасывается быстро и легко. После перорального применения он обнаруживается в крови спустя 6-12 часов. Удаляется, главным образом, почками (50-70%) в неизменном виде в течение не более 24 часов.

**Показания к применению:** Диакарб может быть применен в очень многих случаях задержки в организме натрия и воды со следующими показаниями: 1) Отеки, возникшие в результате: а) недостаточности кровообращения, особенно в таких случаях, которые не требуют немедленной энергичной дегидратации; б) цирроз печени и недостаточности почек; в) легочно-сердечного синдрома (наступает улучшение условий окисления и тем самым облегчается дыхание). 2) Эмфизема легких, бронхиальная астма. 3) Первичная и вторичная глаукома, препарат уменьшает внутриглазное давление. 4) Эпилепсия (*petit mal*), предэкламптические состояния, а также болезнь Меньера. Диакарб ингибируя ангидазу соли угольной кислоты мозга, уменьшает двигательную возбудимость коры головного мозга и предупреждает появление приступов. 5) Тетания (предполагается, что постемедикаментозный ацидоз затрудняет появление приступов). 6) Состояния предменструального напряжения и подагра.

**Способ применения:** Перорально при лечении отеков применяется в среднем 0,125 - 0,25 г 1 - 2 раза в день в течение 2 дней, после чего применение прекращают. При лечении эпилепсии применяется 0,25 г 3-4 раза в день. При глаукоме сперва по 0,25 - 0,5 г, после чего по 0,25 г через каждые 6 часов постепенно уменьшая дозу до 0,25 г 2 - 3 раза в день. Лечение проводят на протяжении 4-5 дней.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковках по 24 таблеток или по 1000 таблеток.

### **Сорбит (Сорбитол) (Sorbitol)**

**Групповая принадлежность:** Диуретическое средство

**Фармакологическое действие:** Осмотически активный препарат; оказывает диуретическое, дезинтоксикационное, желчегонное, спазмолитическое и слабительное действие. Изотонический раствор сорбитола вводят для пополнения организма жидкостью. Энергетическая ценность составляет 4 ккал/г (одинаковая с растворами декстрозы и фруктозы). Не вызывает повышения гликемии, не увеличивает глюкозурию. При приеме внутрь оказывает холеретическое и холецистокинетическое действие; в высоких дозах тормозит желчеотделение и вызывает слабительный эффект.

**Показания:** Шок, гипогликемия, сахарный диабет, хронический холецистит, дискинезия желчных путей по гипокинетическому типу; хронический колит со склонностью к запорам.

**Способ применения:** В/в капельно, скорость введения 5% раствора - 60-10 кап/мин/кг; 10% раствора - 40-50 кап/мин/кг.

**Лекарственная форма:** раствор для внутривенного введения 5%, 10% и 20%

### **Котарнина гидрохлорид (Cotarnini chloridum)**

**Групповая принадлежность:** Утеротонизирующее средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает тонизирующее влияние на мускулатуру внутренних органов; особенно матки.

**Показания к применению:** Применяют при субинволюции матки после родов и аборт, меноррагиях и других маточных кровотечениях, не связанных с нарушениями менструального цикла.

**Способ применения:** Назначают внутрь по 0,05 - 0,1 г 2 - 3 раза в день. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая 0,1 г, суточная 0,3 г. Иногда применяют местно для остановки небольших кровотечений в виде 1 - 2 % водного раствора.

**Формы выпуска:** порошок; таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г.

### **Фенотерол (Fenoterolum)**

**Групповая принадлежность:** Бета2-адреномиметик селективный

**Фармакологическое действие:** Адреномиметическое средство, стимулятор бетаадренорецепторов бронхов и матки. Механизм действия связан с активацией сопряженной с рецептором аденилатциклазы, что приводит к увеличению образования циклического АМФ, который стимулирует работу кальциевого насоса, перераспределяющего ионы кальция в миоцитах (мышечных клетках), в результате чего снижается его концентрация в миофибриллах (мышечных волокнах). Фенотерол оказывает выраженное, быстро наступающее бронхолитическое (расширяющее просвет бронхов) действие. Предупреждает, а также быстро и эффективно купирует (снимает) бронхоспазмы (резкое сужение просвета бронхов) различного генеза (причины), в том числе, приступы удушья, связанные с физической нагрузкой. Фенотерол увеличивает частоту и объем дыхания. Повышает функцию мерцательного эпителия (внутреннего слоя) бронхов. В терапевтических дозах, вызывающих бронхолитический эффект, как правило, не влияет на сердечно-сосудистую систему и внутренние органы. Бронхоспазмолитическое (снимающее сужение просвет бронхов) действие длится до 8 ч.

**Показания к применению:** Лечение бронхиальной астмы (купирование и предупреждение приступов). Используют также при спастическом астмоидном бронхите (инфекционном заболевании легких с затрудненным выдохом), эмфиземе легких (повышении воздушности и снижении тонуса легочной ткани).

**Способ применения:** Дозы подбираются индивидуально. Обычно для купирования острого приступа удушья взрослым и детям старше 6 лет назначают в разовой дозе 0,2 мг (1 вдох аэрозоля с содержанием 0,2 мг в 1 дозе или 2 вдоха аэрозоля с содержанием 0,1 мг в 1 дозе). Если одна ингаляция не снимает приступа удушья, то через 5 мин ее можно повторить. Следующее назначение препарата возможно не ранее, чем через

Для профилактики приступов удушья назначают по 1 вдоху аэрозоля (с содержанием 0,2 мг в одном вдохе) взрослым 3 раза в день; детям школьного возраста - 2 раза в день. При применении аэрозоля с содержанием 0,1 мг фенотерола в одной дозе взрослым и детям назначают по 1-2 вдоха 4 раза в день через равные промежутки времени. В тяжелых случаях, если в течение 5 мин после применения препарата не наступает улучшение, можно сделать еще 1-2 вдоха. Следующую ингаляцию можно проводить не ранее, чем через 2 ч. Детям в возрасте от 4 до 6 лет назначают по 1 вдоху 4 раза в день. Кратность применения препарата у больных всех возрастов не должна превышать 4-х раз в сутки.

**Форма выпуска:** Аэрозольный баллон на 15 мл, содержащий 300 разовых доз (по 0,2 мг); таблетки по 0,005 г; ампулы по 0,5 мг для инъекций.



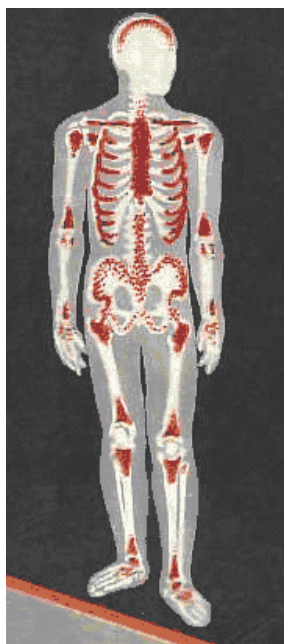
## Лекарственные средства влияющие на систему свертывания крови и систему кроветворения.

### Общие сведения о кроветворении

Считается, что кровь является жидким органом в организме. Кровь выполняет многообразны функции. Кровь не только доставляет клеткам кислород и питательные вещества, но и переносит гормоны, выделяемые железами внутренней секреции, удаляет продукты обмена, регулирует температуру тела, защищает организм от болезнетворных микробов.

Кровь состоит из плазмы — жидкости, в которой взвешены форменные элементы: **красные кровяные клетки — эритроциты, белые кровяные клетки — лейкоциты и кровяные пластинки — тромбоциты.**

Продолжительность жизни форменных элементов крови различна. Естественная их убыль непрерывно восполняется. А «следят» за этим органы кроветворения - именно в них образуется кровь. К ним относятся **красный костный мозг, селезенка и лимфатические узлы.** В период внутриутробного развития клетки крови образуются также **в печени и в соединительной ткани почки.** У новорожденного и у ребенка первых 3—4 лет жизни во всех костях содержится только красный костный мозг. У взрослых он сосредоточен **в губчатом веществе** костей. В костномозговых полостях длинных трубчатых костей красный мозг замещается желтым мозгом, который представляет собой жировую ткань.

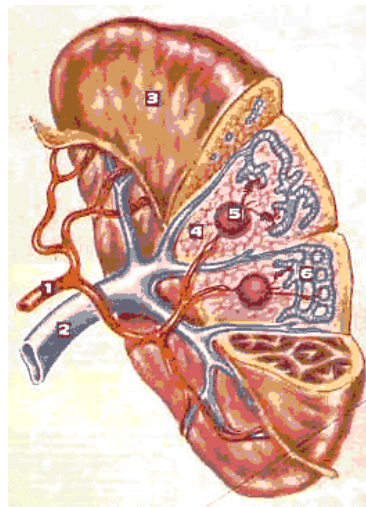


Находясь в губчатом веществе костей черепа, таза, грудины, лопаток, позвоночника, ребер, ключиц, в концах трубчатых костей, красный костный мозг надежно защищен от внешних воздействий и испрвно выполняет функцию кроветворения. **На силуэте скелета показано расположение красного костного мозга.** Основу его составляет **ретикулярная строма.** Так называют ткань организма, клетки которой имеют многочисленные отростки и составляют густую сеть. Если взглянуть на ретикулярную ткань под микроскопом, то ясно видно ее решетчато-петлистое строение. Эта ткань содержит ретикулярные и жировые клетки, ретикулиновые волокна, сплетение кровеносных сосудов. Из ретикулярных клеток стромы развиваются гемоцито-бласты.

Это, согласно современным представлениям, родоначальные, материнские клетки, которые дифференцируются в процессе развития в форменные элементы крови.

Преобразование **ретикулярных клеток в материнские клетки крови начинается в ячейках губчатого вещества кости**. Затем не вполне зрелые клетки крови **переходят в синусоиды — широкие капилляры с тонкими, проницаемыми для форменных элементов крови стенками**. Здесь незрелые клетки крови дозревают, устремляются в вены костного мозга и по ним выходят в общий кровоток.

**Селезенка** располагается в брюшной полости в левом подреберье между желудком и диафрагмой. Хотя функции селезенки не исчерпываются кроветворением, ее конструкция определяется именно этой главной «обязанностью». Длина селезенки — в среднем 12 сантиметров, ширина — около 7 сантиметров, вес — 150—200 граммов. Заключена она между листками брюшины и лежит как бы в кармане, который образован диафрагмально-кишечной связкой. Если селезенка не увеличена, ее не удастся прощупать через переднюю брюшную стенку.



На поверхности селезенки, обращенной к желудку, есть выемка. Это ворота органа — место вхождения сосудов (1, 2) и нервов.

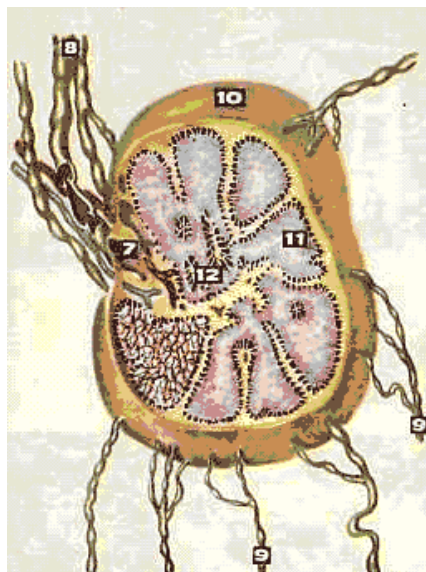
Селезенка покрыта двумя оболочками — серозной и соединительно-тканой (фиброзной), которые составляют ее капсулу (3). От эластической фиброзной оболочки в глубь органа идут перегородки, которые разделяют массу селезенки на скопления белого и красного вещества — мякоти (4). Благодаря наличию в перегородках гладких мышечных волокон селезенка может энергично сокращаться, отдавая в кровяное русло большое количество крови, которая здесь образуется и депонируется.

Мякоть селезенки состоит из нежной ретикулярной ткани, ячейки которой заполнены различными видами кровяных клеток, и из густой сети кровеносных сосудов. По ходу артерий в селезенке образуются лимфатические фолликулы (5) в виде манжеток вокруг сосудов. **Это белая мякоть. Красная мякоть** заполняет пространство между перегородками; здесь содержатся ретикулярные клетки, эритроциты.

Через стенки капилляров клетки крови попадают в синусы (6), а затем в селезеночную вену и разносятся по сосудам всего тела.

**Лимфатические узлы** — составная часть лимфатической системы организма. Это мелкие образования овальной или бобовидной формы, различные по величине (от просяного зерна до грецкого ореха). На конечностях лимфатические узлы концентрируются в подмышечных впадинах, паховых, подколенных и локтевых сгибах; их много на шее в подчелюстной и зачелюстной областях. Они располагаются по ходу воздухоносных путей, а в брюшной полости как бы гнездятся между листками брыжейки, в воротах органов, вдоль аорты. В организме человека насчитывается **460 лимфатических узлов**.

Каждый из них имеет с одной стороны вдавление — ворота (7). Здесь в узел проникают кровеносные сосуды и нервы, а также выходит выносящий лимфатический сосуд (8), отводящий лимфу от узла. Приносящие лимфатические сосуды (9) подходят к узлу с его выпуклой стороны.



Кроме участия в процессе кроветворения, лимфатические узлы выполняют и другие важные функции: в них происходит механическая фильтрация лимфы, обезвреживание ядовитых веществ и микробов, проникших в лимфатические сосуды.

В строении лимфатических узлов и селезенки много общего. Основу узлов также составляет сеть ретикулиновых волокон и ретикулярных клеток, они покрыты соединительнотканной капсулой (10), от которой тянутся перегородки. Между перегородками заключены островки плотной лимфоидной ткани, называемые фолликулами. Различают корковое вещество узла (11), состоящее из фолликулов, и мозговое вещество (12), где лимфоидная ткань собрана в виде тяжей — шнуров. В середине фолликулов находятся зародышевые центры: в них концентрируется резерв материнских клеток крови.

#### Общий анализ крови: норма

Общий анализ крови (норма)		
Показатель	Взрослые женщины	Взрослые мужчины
Гемоглобин	120—140 г/л	130—160 г/л
Эритроциты	$3,7—4,7 \times 10^{12}$	$4—5,1 \times 10^{12}$
Цветовой показатель	0,85—1,15	0,85—1,15
Ретикулоциты	0,2—1,2%	0,2—1,2%
Тромбоциты	$180—320 \times 10^9$	$180—320 \times 10^9$
СОЭ	2—15 мм/ч	1—10 мм/ч
Лейкоциты	$4—9 \times 10^9$	$4—9 \times 10^9$
Палочкоядерные	1—6%	1—6%

Сегментоядерные	47—72%	47—72%
Эозинофилы	0—5%	0—5%
Базофилы	0—1%	0—1%
Лимфоциты	18—40%	18—40%
Моноциты	2—9%	2—9%

### Основные заболевания крови:

#### Агранулоцитоз (вид лейкоцитов, наиболее многоч. 50-80%)

**Гранулоциты**, или *зернистые лейкоциты*, — подгруппа белых клеток крови, характеризующихся наличием крупного сегментированного ядра и присутствием в цитоплазме специфических гранул, выявляемых в световой микроскоп при обычном окрашивании. Гранулы представлены крупными лизосомами и пероксисомами, а также видоизменениями этих органоидов.

Гранулоциты — наиболее многочисленные представители лейкоцитов, их количество составляет 50—80 % всех белых кровяных клеток. Размеры зернистых лейкоцитов колеблются от 9 до 13 мкм. Норма содержания в крови составляет от 2 до 9 тысяч гранулоцитов в кубическом миллиметре.

Агранулоцитоз - это состояние, при котором наблюдается отсутствие гранулоцитов в периферической крови или уменьшением их количества ниже 750 в 1 мкл, повышающее восприимчивость организма к различным инфекциям. Основными симптомами агранулоцитоза являются лихорадка, а также изъязвления полости рта и горла.

#### **Анемия**

Анемия - это состояние, при котором уменьшается содержание гемоглобина (менее 130 г/л у мужчин и 120 г/л у женщин) и - в большинстве случаев - число эритроцитов в единице объёма крови. Анемия может возникнуть в любом возрасте не только при заболеваниях, но и при физиологических состояниях, например, беременности, кормлении грудью, в период усиленного роста и пр. Анемия может быть как симптомом других заболеваний, так и самостоятельным заболеванием.

#### **Гемолитическая болезнь (резус конфликт)**

Гемолитическая болезнь - это тяжелое заболевание, развивающееся при несовместимости крови матери и плода по группе крови и резус-фактору. При этом в организме ребенка происходит усиленный распад эритроцитов (гемолиз), что проявляется в зависимости от тяжести состояния анемией, желтухой, отеками.

#### **Гемофилия**

Гемофилия - это наследственное заболевание, характеризующееся нарушением механизма свертывания крови. Это обусловлено отсутствием или недостаточностью факторов свертываемости крови. В результате время свертывания крови удлиняется, и больные страдают от сильных кровотечений даже после минимальных травм.

#### **ДВС-синдром (Диссеминированного внутрисосудистого свертывания)**

ДВС-синдром - это опасное для жизни нарушение свертываемости крови вследствие выхода в кровь факторов свертывания, что ведет к образованию в крови множественных сгустков и агрегатов клеток крови, блокирующих циркуляцию крови, с последующим развитием кровоточивости в результате истощения тромбоцитов и факторов свертывания.

#### **Лейкозы**

Лейкозы (лейкемии) - это группа заболеваний, при которых кроветворные клетки замещаются злокачественными, и в крови появляется множество измененных лейкоцитов. Лейкозы различаются в зависимости от того, какие именно клетки подверглись перерождению. Опасность лейкозов в том, что в крови делается мало эритроцитов, нормальных лейкоцитов и тромбоцитов, что ведет к повышенной кровоточивости, снижению иммунитета.

### **Тромбоцитоз**

Тромбоцитоз - это состояние, характеризующееся повышением количества тромбоцитов выше нормы ( $350 \times 10^9/\text{л.}$ ). Тромбоцитоз может быть как самостоятельным заболеванием, которое называется эссенциальная тромбоцитемия, так и служить проявлением других гематологических (заболеваний крови) и негематологических заболеваний.

### **Тромбоцитопения**

Тромбоцитопения - уменьшение количества тромбоцитов (менее 200 тыс. в 1 куб.мм) в периферической крови, при котором возникают частые подкожные кровоизлияния, спонтанное появление кровоподтеков и длительные кровотечения после травм. Причиной может быть образование недостаточного количества тромбоцитов или их избыточное разрушение

## **Лекарственные средства влияющие на систему крови**

Кровь играет чрезвычайно важную роль в организме: обеспечивает единство и постоянство внутренней среды организма; доставляет в ткани кислород и питательные вещества, а также выводит из организма продукты обмена; играет важную роль в защите организма от болезнетворных микроорганизмов, участвует в гуморальной регуляции (переносит гормоны). К защитным элементам крови относится также способность к свертыванию.

Вместе с тем, система крови также подвержена различного рода заболеваниям, большинство из которых связаны с нарушением процесса кроветворения или свертывания.

Все лекарственные средства, влияющие на систему крови делят на две группы:

1. Средства, влияющие на кроветворение;
2. Средства, влияющие на систему свертывания крови;

Средства влияющие на кроветворение, также делятся на две группы:

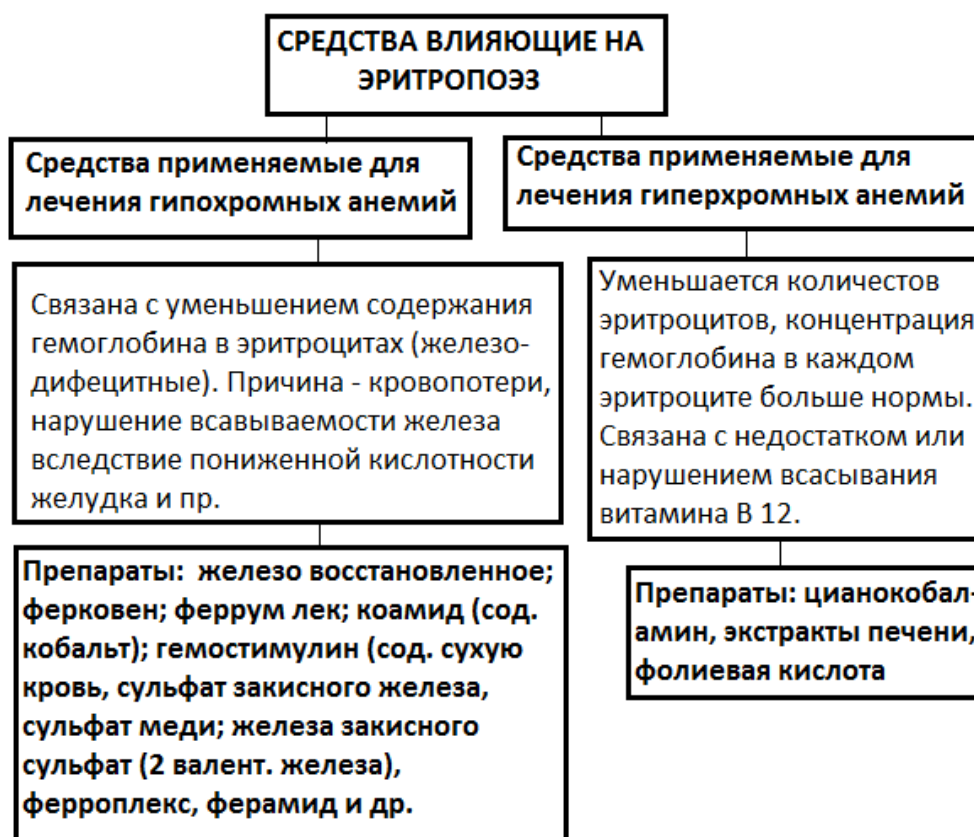
1. Средства, влияющие на эритропоэз;
2. Средства, влияющие на лейкопоэз;

Каждая из перечисленных групп, в свою очередь, делится на средства стимулирующие и средства угнетающие соответственный вид деятельности.



### Средства влияющие на эритропоэз

Выработка и созревание эритроцитов происходит в костном мозге, в течении 3 – 4 месяцев. В 1 мм<sup>3</sup> крови находится приблизительно 4 500 000 - 5 000 000 эритроцитов, ежесекундно в кровь выбрасывается до 10 000 000. Основная функция эритроцитов – транспортировка кислорода от легких к клеткам организма и выведение углекислоты.



Недостаток эритроцитов в крови или уменьшения содержание в них гемоглобина называется анемией. Причины развития анемий могут быть различными: кровотечения, недостаток железа или определенных витаминов в организме, угнетение работы костного

мозга, отравление ядовитыми веществами влияющими на систему крови, гемолиз (разрушение эритроцитов) и др. Следствием недостатка поступления кислорода в ткани организма, в результате анемии, является бледность кожи и слизистых оболочек, дистрофические процессы в головном мозге, сердце, почках.

Лекарственные средства, влияющие на эритропоэз делят на две группы:

1. Средства, применяемые при лечении гипохромных анемий;
2. Средства, применяемые при лечении гиперхромных анемий;

### **Средства применяемые при лечении гипохромных анемий**

При гипохромных анемиях уменьшается содержание гемоглобина в эритроцитах, при их общее количество не уменьшается. Гипохромные анемии, как правило, связаны с обильными кровотечениями, а также недостаточным поступлением или плохим усвоением железа в организме.

В процессе усвоения железа важную роль соляная кислота желудочного сока и транспортный белок «апоферитин» (образует с железом комплекс – ферритин). В сыворотке крови железо образует комплекс с трансферрином и депонируется в костном мозге. Усвоению железа способствуют микроэлементы кобальта и меди. Недостаток соляной кислоты желудочного сока ведет к ухудшению всасывания и усвоению железа, может стать причиной гипохромной анемии.

Для лечения гипохромных анемий назначаются препараты железа. Применяются такие препараты, как железо восстановленное (в таблетках и капсулах). Соляная кислота (желудочного сока) и витамин С способствует улучшения всасывания железа из желудочно-кишечного тракта. При применении этого лекарственного средства следует учитывать, о его побочном действии в виде тошноты, рвоты, раздражающем действии на желудочно-кишечной тракт. Меньшим побочным действие обладают лекарственные препараты: ферковен и ферум-лек, которые вводятся парентерально.

Среди препаратов содержащих двух и трехвалентное железо, лучше из желудочно-кишечного тракта всасываются препараты двухвалентного (закисного) железа (железа закисного сульфат, Ферроплекс, ферамид и пр.).

Для улучшения всасывания железа применяются препараты кобальта (коамид), а также комплексный препарат гемостимулин, содержащий сухую кровь, сульфат закисного железа, сульфат меди). Препарат тардиферон содержит сульфат железа.

### **Средства применяемые при лечении гиперхромных анемий**

В отличие от гипохромных анемий (вызванных недостатком гемоглобина) , при гиперхромных анемия падает количество эритроцитов в крови. При этом концентрация гемоглобина уменьшается в меньшей степени, поскольку в каждом эритроците его содержится больше чем в норме, а эритроциты имеют интенсивно красный цвет.

В настоящее время установлено, что одной из основных причин гиперхромной анемии (болезнь Аддисона – Бирмера) является недостаток витамина В<sub>12</sub> в организме, который может быть вызван либо его недостаточным поступлением в организм с пищей, либо нарушением всасывания витамина (витамин В<sub>12</sub> плохо всасывается из желудочно-кишечного тракта). Поступление в организм витамина В<sub>12</sub> (цианокобламина) в достаточном количестве устраняет симптомы болезни. Поскольку, одной из причин недостатка витамина в организме является нарушение всасывания из желудочно-кишечного тракта, цианокобламин назначают парентерально.

В организме витамин В<sub>12</sub> депонируется в печени и постепенно используется в процессе кроветворения, под влиянием которого усиливается созревание эритроцитов.

При лечении гиперхромной анемии применяется также фолиевая кислота. Фолиевая кислота относится к группе витаминов В. Поступает в организм с пищей (экзогенная фолиевая кислота), а так же синтезируется микрофлорой кишечника (эндогенная). И экзо-, и эндогенная фолиевая кислота в организме восстанавливается до

коэнзима (тетрагидрофолиевой кислоты). Этот коэнзим необходим для многих важных метаболических процессов: участие в образовании пуринов, пиримидинов, нуклеиновых и аминокислот. Так же является необходимой для обмена холина. В синергизме с цианокобаламином (витамин В<sub>12</sub>) стимулирует кроветворение: необходима для дифференциации и дозревания мегалобластов, частично берет участие в эритропоэзе. Недостаток фолиевой кислоты приводит к торможению фазы кроветворения из мегалобластной в нормобластную.

При некоторых заболеваниях (эритремии) имеется необходимость подавлять избыточную продукцию эритроцитов. Избыточная продукция эритроцитов встречается, например, при злокачественных опухолях костного мозга. При эритремии применяются препараты **угнетающие эритропоэз**, аналогичные применяемым при лечении злокачественных новообразований (препараты радиоактивного фосфора).

### Средства влияющие на лейкопоэз

Лейкоциты выполняют в организме защитную функцию, участвуют в выработке антител (обезвреживающих токсины), подавляют болезнетворные микроорганизмы. В 1 мкл крови содержится 6 – 10 тыс. лейкоцитов, продолжительность жизни лейкоцитов составляет 8 – 12 суток.

Лейкоциты – собирательное понятие, по структуре и функциям делятся на: лимфоциты, моноциты, нейтрофилы, базофилы, эозинофилы. Значительная часть лейкоцитов имеет форму гранул, называется гранулоцитами. **Гранулоциты**, или *зернистые лейкоциты*, — подгруппа белых клеток крови, характеризующихся наличием крупного сегментированного ядра и присутствием в цитоплазме специфических гранул, выявляемых в световой микроскоп при обычном окрашивании. Гранулы представлены крупными лизосомами и пероксисомами, а также видоизменениями этих органоидов.

Гранулоциты — наиболее многочисленные представители лейкоцитов, их количество составляет 50—80 % всех белых кровяных клеток. Размеры зернистых лейкоцитов колеблются от 9 до 13 мкм. Норма содержания в крови составляет от 2 до 9 тысяч гранулоцитов в кубическом миллиметре.

Количество лейкоцитов может изменяться в сторону уменьшения (лейкопения, агранулоцитоз) или увеличения (лейкемия, лейкоцитоз), а лекарственные средства влияющие на лейкопоэз делят на две группы:

1. Средства, усиливающие (стимулирующие) лейкопоэз;
2. Средства, угнетающие лейкопоэз;

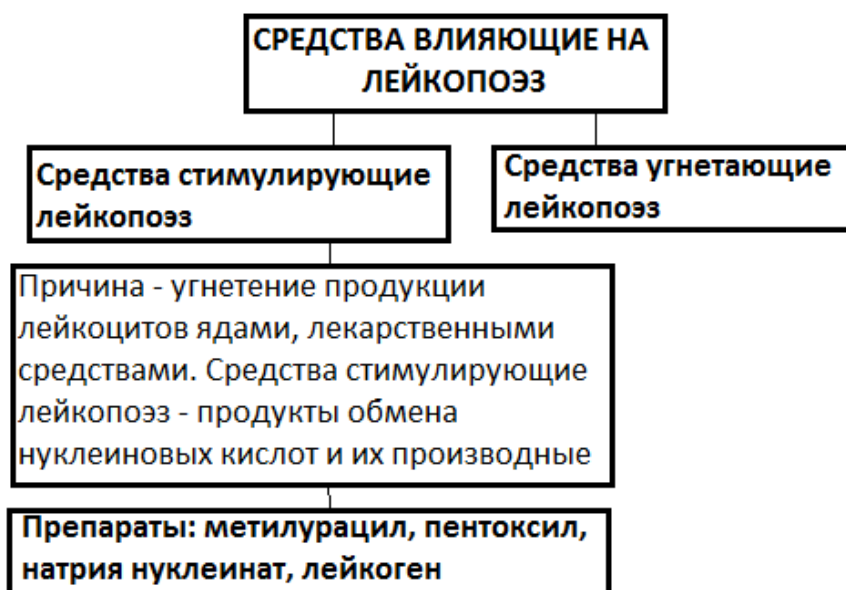




### Средства усиливающие лейкопоз

Наиболее часто причиной лейкоцитоза являются хронические инфекции, а также угнетение костного мозга вследствие воздействия различных факторов, например, отравлений. Многие лекарственные средства (некоторые сульфаниламидные средства и антибиотики, противораковые (противобластомные), производные пиразолона и др) способны вызывать лейкопению (особенно при их длительном применении). Уменьшение лейкоцитов в крови снижает иммунитет, способность организма сопротивляться инфекциям, в некоторых случаях создает угрозу жизни для человека.

В качестве средств стимулирующих лейкопоз применяются натрия нуклеинат, пентоксил, метилурацил, лейкоген и др. Большинство из этих лекарственных средств являются продуктами обмена нуклеиновых кислот или их производными, поскольку нуклеиновый обмен играет важную роль в размножении клеток.



Вещества, продукты обмена нуклеиновых кислот, усиливают не только лейкопоз, но и процессы регенерации тканей, восстанавливают поврежденную ткань слизистых оболочек, печени, желудочно-кишечного тракта, способствуют заживлению ран.

При лейкопении применяются так же лекарственные препараты молграстим и филграстим. Эти лекарственные средства являются гемопоэтическим фактором роста (стимулятором кроветворения), который регулирует продукцию и высвобождение нейтрофилов из костного мозга в периферическую кровь. По окончании терапии филграстимом количество циркулирующих нейтрофилов снижается на 50% через 1-2 дня и возвращается к нормальному уровню в течение 2-7 дней.

При ряде заболеваний существует необходимость угнетения процесса лейкопоэза, например, при лечении лейкозов (злокачественных опухолей кроветворных органов). При лейкозах (лейкемия, лейкоцитоз) в кровь поступает значительное количество незрелых лейкоцитов, многократно повышая их нормальное число, вместе с тем, «недозревшие» лейкоциты не могут выполнять возложенную на них функцию. При лейкозах наблюдается увеличение селезенки, лимфатических узлов, возможно появление метастазов в печени, легких и других внутренних органах. При лечении лейкозов применяются антибластные средства.

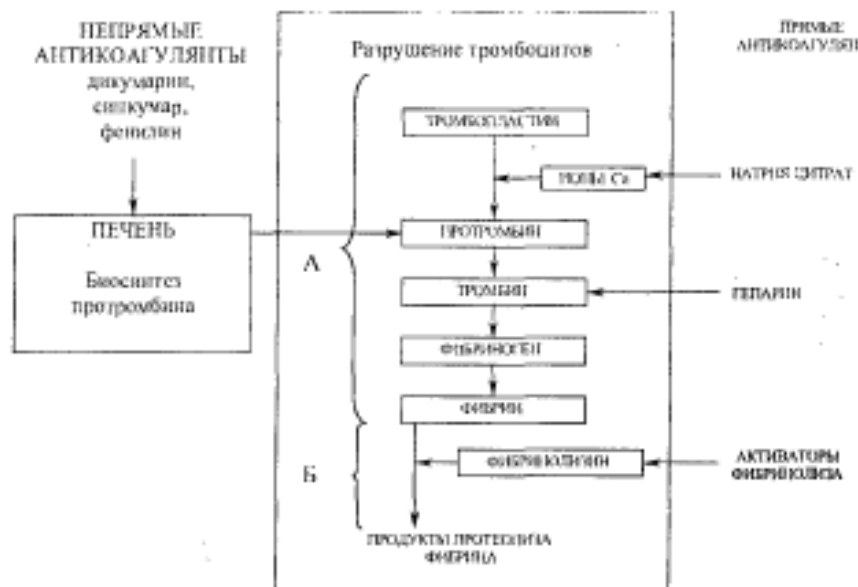
### Средства влияющие на свертывание крови

Свертывание крови – сложный ферментный процесс в котором участвуют множество взаимосвязанных факторов крови, который делится на три фазы:

Первая фаза связана с разрушением клеток тканей и тромбоцитов, при этом высвобождается фермент тромбопластин, который активизируется ионами кальция.

Во второй фазе, при непосредственном участии тромбопластина, происходит превращение протромбина (специальный белок крови, который синтезируется в печени) в тромбин. Для нормального течения этого процесса так же необходимы ионы кальция.

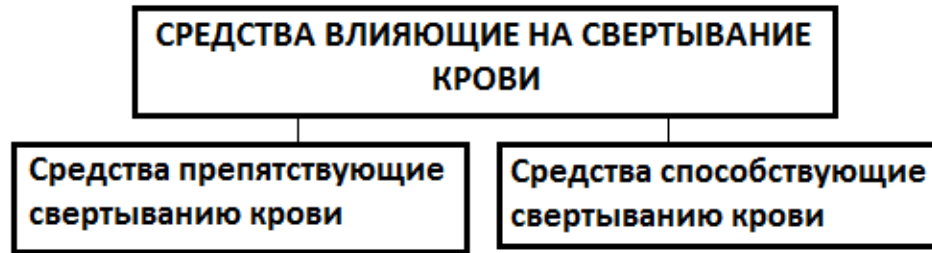
В третьей фазе, под влиянием тромбина растворимый белок крови фибриноген превращается в фибрин, который и образует сгусток крови блокирующий кровотечение, первоначально в виде густого сплетения нитей, которые постепенно уплотняются и превращаются в тромб.



Упрощенная схема действия антикоагулянтов (А) и фибринолитических средств (Б)

В крови постоянно имеются все факторы, необходимые для процесса свертывания крови, однако находятся они в неактивном состоянии. Кроме того, в организме действуют и противосвертывающие факторы, противодействующие активизации процесса свертывания крови. Основными факторами противосвертывающей системы организма являются гепарин и фибринолизин. Система свертывания и противосвертывания

находятся в организме в динамическом равновесии, при котором один из факторов уравнивается другим, а преобладание какого либо из этих факторов ведет к нарушению свертываемости крови (в сторону усиления или ослабления).



Средства, влияющие на систему свертывания крови делят на две группы:

1. Средства, препятствующие свертыванию крови (антиагреганты, антикоагулянты, фибринолитические вещества);
2. Средства, способствующие свертыванию крови (коагулянты): средства для местного применения, для системного действия, ингибиторы фибринолиза;

### Средства препятствующие свертыванию крови



### Средства уменьшающие агрегацию тромбоцитов (антиагреганты)

Агрегация (слипание, скопление) тромбоцитов, начальная стадия свертывания крови. Процесс агрегации тромбоцитов регулируется системой тромбосан – простаглицлин.

Тромбосан – синтезируется в тромбоцитах, вызывает сужение сосудов и способствует агрегации (слипанию). Тромбосан – угнетает аденилатцилазу (катализирует превращение АТФ в 3',5'-цАМФ), снижает содержание в тромбоцитах цАМФ Циклический аденозинмонофосфат (циклический АМФ, 3'5'-цАМФ, 3'5'-сАМР) — производное АТФ.

Простоциклин препятствует агрегации тромбоцитов, повышает их способность к агрегации, вызывает расширение сосудов. Синтезируется эндотелием сосудов, стимулирует аденилатцеклазу и повышает содержание цАМФ в тромбоцитах и стенке сосудов.

Среди лекарственных средств уменьшающих агрегацию тромбоцитов наиболее распространенным препаратом является ацетилсалициловая кислота. Ацетилсалициловая кислота – ингибитор циклооксигеназы – фермента принимающего участие в синтезе тромбосана и простоциклина. При назначении небольших доз ацетилсалициловой кислоты синтез тромбосана угнетается и проявляется антиагрегативный эффект.

Еще одним лекарственным препаратом, проявляющим антиагрегативные свойства, является дипиридамол. Дипиридамол ингибирует фермент фосфодиэстеразу и значительно повышает содержание в тромбоцитах цАМФ и аденозина, который тормозит агрегацию тромбоцитов.

Пармидин угнетает агрегацию тромбоцитов, снижает свертываемость крови, улучшает микроциркуляцию, препятствует липидной инфильтрации сосудов (**Инфильтрация** «процеживание») — просачивание, пропитывание ткани каким-либо веществом).

Эффективным средством, ингибитором агрегации тромбоцитов является тиклопидин. Тиклопидин препятствует склеиванию тромбоцитов, вызываемой аденозиндифосфатом, ингибирует агрегацию, вызванную коллагеном, адреналином, арахидоновой кислотой, тромбином и тромбоцитным активирующим фактором.

Еще одним препаратом, обладающим антиагрегативной активностью является клопидогрель. Действие препарата осуществляется за счет способности клопидогреля избирательно ингибировать связывание аденозиндифосфата с рецепторами тромбоцитов, вследствие чего угнетается активация комплекса гликопротеинов П<sub>в</sub>/П<sub>а</sub> и снижается способность тромбоцитов к агрегации. Препарат увеличивает время кровотечения.

### **Средства тормозящие свертывание крови (антикоагулянты)**

Антикоагулянты применяются для предупреждения тромбообразования. Причинами тромбоза могут стать атеросклероз, аневризмы артерий, варикозное расширение вен и др.

По механизму действия антикоагулянты делятся на две группы:

1. Средства прямого действия;
2. Средства непрямого действия;

#### **Антикоагулянты прямого действия**

Антикоагулянты прямого действия непосредственно инактивируют факторы свертывания крови, в результате чего их действие наступает достаточно быстро. К антикоагулянтам прямого действия относятся гепарин, цитрат натрия, гирудин.

Гепарин – естественный противосвертывающий фактор организма, тормозит образование тромбина и тромбопластина, а также полимеризацию фибрина. Кроме того, гепарин снижает агрегацию тромбоцитов и активирует фибринолиз (растворение тромбов).

Противосвертывающий эффект после внутривенного введения гепарина наступает сразу и продолжается 3 – 5 часов (время в течении которого гепарин разрушается в печени ферментом – гепариназой). Применяются (подкожно) также низкомолекулярные гепарины – фраксипарин и эноксапарин – действие которых более продолжительно.

Препараты гепарина назначают при тромбозах, тромбоэмболических состояниях, при инфаркте миокарда (в острый период). Передозировка гепарина может вызвать кровотечения. Средством медикаментозной помощи при передозировке является антагонист гепарина – протамину сульфат.

Натрия цитрат связывает ионы кальция, необходимый элемент для процесса тромбообразования, однако, в качестве лекарственного средства не применяется, поскольку вызывает резкое падение концентрации ионов калия в крови, что вызывает нарушение сердечной деятельности и центральной нервной системы. Используется натрия цитрат для консервации донорской крови (на 100 мл крови 10 мл. 4% раствора натрия цитрата).

Гирудин содержится в слюнных железах пиявок, препятствует свертыванию крови. В качестве лекарственного средства не выпускается.

### **Антикоагулянты непрямого действия**

Антикоагулянты непрямого действия – антагонисты витамина К. Витамин К необходимый элемент для синтеза протромбина в печени. К этой группе лекарственных препаратов относятся: неодикумарин, фенилин, синкумар и др.

Антикоагулянты непрямого действия тормозят синтез протромбина в печени, поэтому эффект их действия начинает проявляться только через определенное время (24 - 72 ч) и продолжается в течении нескольких суток. Назначаются только внутрь, при повторных приемах развивается кумуляция. В случае необходимости не прямые коагулянты комбинируют с прямыми усиливая эффект быстрого действия значительной продолжительностью.

Антикоагулянт, как прямого, так и непрямого действия влияют на процесс свертываемости крови, но на уже образовавшийся фибрин эти препараты оказывают незначительное действие. Для лечения тромбозов и эмболий применяются **фибринолитические вещества**, которые эффективно растворяют образующиеся нити фибрина.

В качестве фибринолитического средства наиболее эффективна – стрептокиназа (вводится внутривенно, капельно). Стрептокиназа ускоряет процесс перехода профиринолизина в фибринолизин, который, в свою очередь, растворяет фибрин.

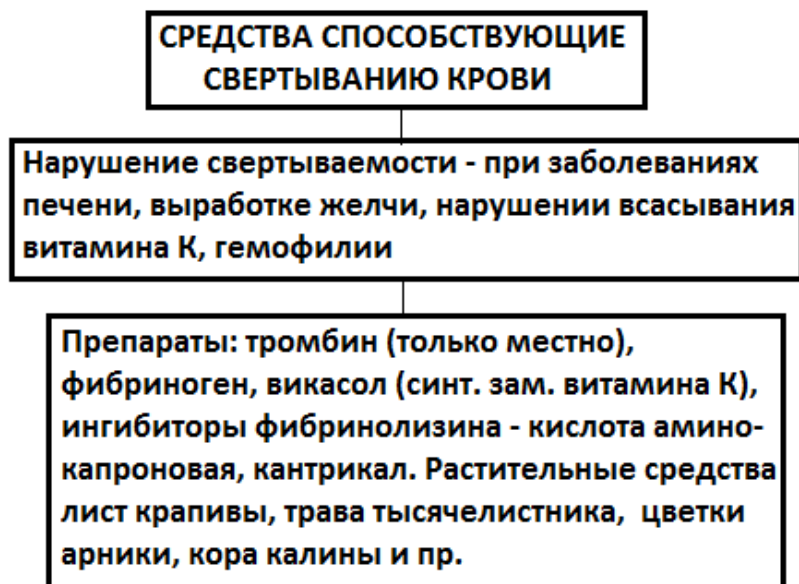
Эффективным препаратом, обладающими фибринолитической активностью является алтеплаза. Алтеплаза - рекомбинантный человеческий активатор плазминогена (белок крови, участвующий в процессе регуляции свертывания крови), входящий в состав препарата, представляет собой гликопротеин (сложный белок), который после системного введения находится в плазме в неактивной форме до момента связывания с фибрином (нерастворимым белком, образующимся в процессе свертывания крови). После активации препарат активизирует переход из плазминогена в плазмин и ведет к растворению фибринового сгустка, таким образом повышая фибринолиз (растворение сгустка крови) только в ткани тромба.

При передозировке фибринолитических средств возникают кровотечения, при этом применяют – антифибринолитические средства (кислота аминакапроновая, амбен и др.). Эти препараты угнетают фибринолиз (растворение сгустка крови) путем конкурентного торможения плазминогенактивирующего фермента (белка, принимающего участие в процессе свертывания крови) и угнетения образования плазмина (белка, разрушающего сгустки свернувшейся крови).

Назначение антикоагулянтов и фибринолитических средств требует постоянного контроля за компонентным составом крови.

### **Средства способствующие свертыванию крови**

Понижение свертываемости крови может наблюдаться при уменьшении числа тромбоцитов, заболеваниях печени, нарушении всасывания или выработки в организме витамина К, гемофилии (врожденном заболевании, связанном с нарушением свертываемости крови). При пониженной свертываемости крови наблюдается кровоизлияния в слизистые оболочки, могут возникнуть длительные кровотечения при незначительных повреждениях, появиться кровь в моче и т.д.



К лекарственным средствам, способствующим усилению свертываемости крови относятся тромбин, витамин К, антагонисты фибринолизина.

Тромбин – естественный фактор системы свертывания крови, но в качестве лекарственного средства применяется исключительно местно. Парентеральное введение тромбина недопустимо, в связи с возможным образование тромбоза.

Фибриноген также является естественным фактором системы свертывания крови. Для остановки кровотечений вводится внутривенно, капельно.

Викасол или синтетический заменитель витамина К, назначается при кровотечениях внутрь или внутримышечно. Витамин К участвует в синтезе протромбина в печени.

Ингибиторы фибринолизина – кислота аминокaproновая, кантрикал и др. оказывают тромбообразованию и остановке кровотечения при повышенной фибринолитической активности крови. Для достижения быстрого эффекта вводят до 100 мл (внутривенно, капельно) 5% раствора аминокaproновой кислоты.

При хронических кровотечениях находят применения лекарственные средства, растительного происхождения: лист крапивы, трава тысячелистника, водяного перца, кора калины и др. Назначаются внутрь в виде экстрактов и отваров, действуют растительные средства менее быстро и эффективно, по сравнению с прочими коагулянтами, но обладают меньшим количеством побочных эффектов и могут применяться в течении длительного времени.

### **Кровозамещающие и противошоковые жидкости**

В среднем у человека около 5 литров крови. При значительных кровопотерях, вследствие падения артериального давления, кислородного голодания тканей (прежде всего головного мозга и сердечной мышцы), ослабления жизненных процессов и возникает угроза жизни. Такое состояние называется геморрагическим шоком или коллапсом.

Для восполнения объема утраченной крови прибегают к переливанию крови или кровозамещающих (плазмозамещающих) жидкостей. Наиболее часто применяемыми кровозамещающими жидкостями являются изотонический раствор натрия хлорида (0,85%), раствор Рингера-Локка, раствор глюкозы 5%, дисоль, трисоль, лактосор и др.

Солевые растворы используют не только при кровотечениях, но и для восстановления водноэлектrolитного равновесия при обезвоживании (при ожогах,

поносах, рвоте и пр.). Недостатком солевых растворов является их достаточно быстрое выведение почками. Для устранения этого недостатка в солевые растворы добавляют высокомолекулярные вещества, которые задерживаются в кровяном русле и удерживают воду. К таким препаратам относятся желатиноль, жидкость Петрова и пр. Способность жидкости задерживаться в кровяном русле прямо пропорциональна ее молекулярной массе, чем выше молекулярная масса, тем выше эта способность.

В качестве кровозамещающих жидкостей применяются также растворы гидролизатов декстрина: полиглюкин и реополиглюкин. Эти растворы имеют значительную молекулярную массу (30 000 – 60 000) и способны длительно задерживаться в кровеносном русле. Плазмозамещающие растворы повышают артериальное давление, улучшают микроциркуляцию крови, коллоидные растворы способны удерживать токсические вещества и впоследствии выводить их из организма. Наиболее эффективными кровезаменителями являются: гемодез, неогемодез, энтеродез и пр.

При шоковом состоянии, кровопотерях, гипоксии возможно понижение рН крови и развитие ацидоза (**ацидоз** - смещение кислотно-щелочного баланса организма в сторону увеличения кислотности). При ацидозе нарушается обмен веществ, ослабляется сердечная деятельность. При ацидозе необходима корректировка кислотно-щелочного состояния, с этой целью могут применяться растворы натрия гидрокарбоната, натрия лактат и пр.

### **Средства для парентерального питания**

При непроходимости желудочно-кишечного тракта, некоторых инфекциях, неукротимой рвоте и др. случаях, для поддержания нормальной жизнедеятельности возникает необходимо обеспечить введение в организм питательных веществ, минуя желудочно-кишечный тракт. Наиболее часто применяемым и ценным средством для парентерального питания является глюкоза, которую вводят в виде изотонического раствора, внутривенно или подкожно (подкожные инъекции глюкозы болезненны), или гипертонического 20 – 40% раствора (только внутривенно), с добавлением небольших доз инсулина (3 – 4 ЕД на 250 мл 5% раствора). Гипертонические растворы глюкозы являются также дегидратирующим средством при отеках мозга и легких.

В качестве средств для парентерального питания применяют также растворы гидролизина, полиамина и др. препараты аминокислот: кислоту глютаминовую, метионин и пр. Метионин относится к числу незаменимых аминокислот. Метионин участвует в синтезе адреналина, активизирует деятельность гормонов, ферментов, витаминов. Со способностью метионина отдавать  $\text{CH}_3$ - группу (процесс переметилирования) связывают его способность удалять из печени избыток жира (липотропный эффект).

## **Краткая характеристика лекарственных препаратов**

### **Филграстим (Filgrastim)**

**Групповая принадлежность** Стимулятором кроветворения.

**Фармакологическое действие:** Филграстим является гемопоэтическим фактором роста (стимулятором кроветворения), который регулирует продукцию и высвобождение нейтрофилов из костного мозга в периферическую кровь. Имеет место дозозависимое увеличение количества нейтрофилов с нормальной или повышенной функциональной активностью. По окончании терапии филграстимом количество циркулирующих нейтрофилов снижается на 50% через 1-2 дня и возвращается к нормальному уровню в течение 2-7 дней. При подкожном и внутривенном введении препарата наблюдается линейная корреляция между введенной дозой и концентрацией его в сыворотке. Период полураспада составляет приблизительно 3,5 ч.

**Показания к применению:** Для сокращения продолжительности нейтропении и частоты фебрильной нейтропении у больных, получающих химиотерапию цитотоксическими средствами по поводу злокачественных заболеваний (за исключением хронического миелолейкоза и миелодиспластического синдрома), а также сокращения продолжительности нейтропении и ее клинических последствий у больных, получающих миелоаблативную терапию с последующей пересадкой костного мозга.

**Способ применения:** Филграстим вводят в вену или подкожно из расчета 5 мг/кг массы тела 1 раз в день в 16,6 мл растворителя (5% раствор глюкозы), т.е. больному с массой тела в 60 кг требуется 300 мг филграстима. Максимальная суточная доза не должна превышать 70 мг/кг. Больным, леченым цитостатиками (средствами, подавляющими деление клеток) с аутотрансплантацией (пересадкой ткани в пределах одного организма) костного мозга, рекомендуется начальная доза филграстима из расчета 20 мг/день при подкожном введении или 30 мг/кг в день при внутривенном введении с 20-50 мл 5% раствора глюкозы.

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций в ампулах по 1 мл и 1,6 мл.

#### **Ферковен (Fercovenum)**

**Групповая принадлежность:** Стимулятор кроветворения.

**Фармакологическое действие:** Препарат Fe, оказывает гемопоэтическое действие; стимулирует эритропоэз.

**Показания к применению:** Применяют при лечении гипохромных анемий (снижения содержания гемоглобина в крови) различной этиологии (причины), особенно при плохой переносимости и недостаточной всасываемости препаратов железа, принимают внутрь, а также в случаях, когда требуется быстро ликвидировать дефицит железа в организме. Наличие в препарате кобальта способствует усилению эритропоэза (процесса образования эритроцитов).

**Способ применения:** Вводят в вену 1 раз в день ежедневно в течение 10-15 дней: первые 2 инъекции - по 2 мл, затем - по 5 мл. Вводят медленно (в течение 8-10 мин). Раствор не должен попадать под кожу. Применяют только в стационаре (больнице). Дефицит железа в организме и количество препарата на курс лечения можно рассчитать по формуле: дефицит железа в мг равен: масса больного в кг \* 2,5 \* [16,5 - (1,3 \* содержание гемоглобина в крови больного в г/100 мл)]. Сверх тех количеств, которые получаются при расчете, вводить препарат не следует. Для поддержания эффекта, достигнутого введением ферковена, в дальнейшем применяют препараты железа внутрь.

**Форма выпуска:** В ампулах по 5 мл.

#### **Цианокобаламин (Cyanocobalamin)**

**Групповая принадлежность:** группа витаминов.

**Фармакологическое действие:** Эритропоэтическое, гемопоэтическое, противоязвенное, метаболическое действие. Высокая биологическая активность обеспечивает участие Цианокобаламина в липидном, углеводном и белковом обмене. Стимулирует способность тканей к регенерации, нормализует процессы кроветворения, функции нервной системы и печени, активизирует систему свертывания крови, повышает активность протромбина и тромбопластов (в высоких дозах), уменьшает уровень холестерина в крови. В организме трансформируется в кофактор – кобамид (активная форма витамина B12), который принимает участие в переносе метильных групп и прочих одноуглеродистых фрагментов и необходим для образования ДНК и дезоксирибозы, метионина, креатина, холина. Ускоряет процесс созревания эритроцитов, способствует накоплению в них соединений с сульфгидрильными группами, тем самым увеличивая их толерантность к гемолизу.

**Показания к применению:** Цианокобаламин применяется в терапии хронических анемий, протекающих с дефицитом витамина B12 (алиментарная макроцитарная анемия, болезнь Аддисона-Бирмера), в составе комплексного лечения анемий (постгеморрагической, железодефицитной, апластической), а также анемий, вызванных лекарственными препаратами или токсическими веществами. Используется в терапии хронического гепатита, цирроза печени, печеночной недостаточности; алкоголизма, длительно протекающей лихорадки; полиневрита, невралгий (включая невралгию тройничного нерва), радикулита. Витамин B12 назначается при лечении фуникулярного миелоза, гипотрофии, травм периферических нервов, детского церебрального паралича, бокового амиотрофического склероза, болезни Дауна.

**Способ применения:** Цианокобаламин применяют подкожно, внутримышечно, внутривенно и интратромбально. В терапии болезни Аддисона-Бирмера назначают по 100-200 мкг в сутки через день; при макроцитарной анемии с неврологической симптоматикой – по 500 мкг и более на одно введение (в течение первой недели ежедневно, затем с промежутками между инъекциями 5-7 суток). При анемиях постгеморрагических и железодефицитных Цианокобаламин назначают по 30-100 мкг 3 раза в неделю; при лечении апластических анемий – по 100 мкг до клинико-гематологического улучшения.

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций 0,05%; 0,02%. 1 мл раствора содержит 500 или 200 мкг Цианокобаламина, по 1 мл в ампуле, по 10 ампул в картонной упаковке.

#### **Фраксипарин (Надропарин кальция) (Nadroparin calcium)**

**Групповая принадлежность:** Антикоагулянт прямой

**Фармакологическое действие:** Надропарин кальция (действующее вещество Фраксипарина) является низкомолекулярным гепарином, полученным из стандартного гепарина методом деполимеризации в специальных условиях. Препарат характеризуется выраженной активностью в отношении фактора свертываемости крови Ха и слабой активностью в отношении фактора Па. Анти-Ха активность (т.е. антиагрегантная /препятствующая склеиванию тромбоцитов/ активность) препарата более выражена, чем



его влияние на активированное частичное тромбо-пластиновое время (показатель скорости свертывания крови), что отличает надропарин кальций от нефракционированного стандартного гепарина. Таким образом, препарат обладает антитромботической активностью (препятствующей образованию сгустка крови), оказывает быстрое и продолжительное действие.

**Показания к применению:** Профилактика тромбоэмболических осложнений (в т.ч. связанных с общей хирургией, онкологией и ортопедией, у нехирургических больных с высоким риском развития тромбоэмболии: острая дыхательная недостаточность, гнойно-септическая инфекция, острая СН), профилактика свертывания крови в ходе гемодиализа. Лечение тромбозов и тромбоэмболий, нестабильной стенокардии и инфаркта миокарда без зубца Q

**Способ применения:** Вводят в подкожную клетчатку живота, в толщу кожной складки (игла располагается перпендикулярно кожной складке). Складку поддерживать в течение всего периода введения. Профилактика тромбоэмболий в общей хирургии: 0.3 мл 1 раз в сутки. 0.3 мл вводят за 2-4 ч до хирургической операции. Курс лечения - минимум 7 дней. С лечебной целью: вводят 2 раза в сутки в течение 10 дней в дозе 225 ЕД/кг (100 МЕ/кг), что соответствует: 45-55 кг - 0.4-0.5 мл, 55-70 кг - 0.5-0.6 мл, 70-80 кг - 0.6-0.7 мл, 80-100 кг - 0.8 мл, более 100 кг - 0.9 мл.

**Форма выпуска:** По 1 предварительно наполненному шприцу в блистере, по 2 или 10 блистеров в картонной коробке.

### **Кислота аминокaproновая (Aclidum aminocarpionicum)**

**Групповая принадлежность:** Гемостатическое средство, ингибитор фибринолиза.

**Фармакологическое действие:** Оказывает специфическое кровоостанавливающее действие при кровотечениях, связанных с повышением фибринолиза (растворения сгустка крови).

**Показания к применению:** Необходимость остановки кровотечений при хирургических вмешательствах и различных патологических состояниях, сопровождающихся повышением фибринолитической активности (способности растворять сгусток крови) крови и тканей (после операций на легких, простате, поджелудочной и щитовидной железе; преждевременная отслойка нормально расположенной плаценты, заболевания печени, острые панкреатиты /воспаление поджелудочной железы/ и др.).

**Способ применения:** Внутрь из расчета 0,1 г на 1 кг массы тела больного через 4 ч. Суточная доза - 10-15 г. При острой гипофибриногемии (пониженном содержании в крови фибриногена /одного из факторов свертываемости крови/) вводят внутривенно (капельно) до 100 мл 5% раствора препарата; при необходимости шивания повторяют с промежутками в 4 ч

**Форма выпуска:** Порошок; 5% раствор препарата в изотоническом растворе натрия хлорида во флаконах по 100 мл.

### **Неодикумарин (Neodicumarinum)**

**Групповая принадлежность:** Антикоагулянт непрямого

**Фармакологическое действие:** Неодикумарин относится к антикоагулянтам (средствам, тормозящим свертывание крови) непрямого действия, которые эффективны лишь при введении в организм и не влияют на свертываемость при смешивании с кровью вне организма. По современным представлениям, они являются антагонистами (веществами с противоположным действием) витамина К, необходимого для образования в печени протромбина. Действие непрямого антикоагулянта связано с нарушением биосинтеза протромбина, проконвертина (фактора VII) и других факторов свертывания крови (IX, X). В отличие от антикоагулянтов прямого действия оказывают эффект не сразу, а медленно и продолжительно, обладают кумулятивными свойствами (способностью накапливаться в организме). Неодикумарин относительно быстро всасывается при приеме внутрь. Терапевтический эффект начинает проявляться через 2-3 ч, достигает максимума через 12-30 ч. В плазме крови неодикумарин связывается с белками (главным образом с альбуминами). Неодикумарин вызывает также снижение содержания липидов (жиров) в крови, повышает проницаемость сосудов.

**Показания к применению:** Применяют неодикумарин для снижения свертываемости крови в течение длительного времени при профилактике и лечении тромбозов (образования сгустка крови в сосуде); тромбофлебитов (воспаления стенки вен с их закупоркой); тромбоэмболических осложнений (закупорки сосудов сгустком крови) при инфаркте миокарда; эмболических инсультах (острого нарушения мозгового кровообращения в результате закупорки сосудов мозга), но не геморрагических инсультах (острого нарушения мозгового кровообращения в результате разрыва сосудов мозга); эмболических поражений (закупорки сосуда сгустком крови или другим инородным агентом) различных органов. В хирургической практике применяют также для предупреждения тромбообразования (образования сгустка крови) в послеоперационном периоде. Неодикумарин применяют также в дополнение к лечению гепарином.

**Способ применения:** Принимают внутрь. Лечение должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением с обязательным контролем за содержанием в крови протромбина и других факторов свертывания крови. Систематически производят также анализы мочи для раннего выявления гематурии (наличия крови в моче). Индекс протромбина удерживают на уровне 50-40% В 1-й день лечения обычно назначают по 0,3 г препарата 2 раза или по 0,2 г 3 раза (0,6 г) в сутки; во 2-й день по 0,15 г 3 раза, затем по 0,2-0,1 г в сутки в зависимости от содержания в крови протромбина. Высшие дозы для взрослых внутрь:

разовая - 0,3 г, суточная - 0,9 г. После снижения протромбина до 50-40% продолжают лечение малыми дозами. Прекращать лечение неодикумарином и другими аналогичными препаратами следует постепенно.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 и 0,1 г.

### **Фибриноген (Fibrinogenum)**

**Групповая принадлежность:** Гемостатическое средство

**Фармакологическое действие:** Гемостатическое средство. Естественный составной компонент крови. Переход фибриногена в фибрин, происходящий под влиянием тромбина, обеспечивает конечную стадию процесса свертывания крови - образование тромба. Получают из плазмы доноров.

**Показания к применению:** Гипо- и афибриногенемия. Кровотечения в травматологической, хирургической, онкологической, акушерской и гинекологической практике. Предоперационная подготовка больных с гипофибриногенемией.

**Способ применения:** В/в капельно, по 0.8-8 г и более. Средняя доза - 2-4 г.

**Форма выпуска:** В герметически укупоренных стеклянных флаконах емкостью 250 или 500 мл. К флакону прилагается система для вливания с фильтром.

### **Метилурацил (Methyluracilum)**

**Групповая принадлежность:** Регенерации стимулятор

**Фармакологическое действие:** Ускоряет процессы клеточной регенерации (восстановления); ускоряет заживление ран, стимулирует клеточные и гуморальные (тканевые) факторы защиты. Оказывает также противовоспалительное действие. Характерной особенностью препарата является стимуляция эритро- и особенно лейкопоэза (процесса образования эритроцитов и особенно лейкоцитов), в связи с чем его обычно относят к группе стимуляторов лейкопоэза.

**Показания к применению:** Как стимулятор лейкопоэза метилурацил назначают при рентгене- и радиотерапии и других состояниях, сопровождающихся лейкопенией (снижением уровня лейкоцитов в крови).

**Способ применения:** Принимают метилурацил внутрь во время или после еды. Взрослым дают по 0,5 г 4 раза в день (при необходимости до 6 раз в сутки); детям в возрасте от 3 до 8 лет - по 0,25 г, старше 8 лет - по 0,25-0,5 г 3 раза в день. Курс лечения при заболеваниях желудочно-кишечного тракта продолжается обычно 30-40 дней, в других случаях может быть менее продолжительным.

Местно при ранах, ожогах, трофических язвах (длительно незаживающих дефектов кожи) применяют 10% метилурациловую мазь. Для лечения проктитов, сигмоидитов, язвенных колитов (воспалении толстой кишки с образованием язв) применяют свечи, содержащие метилурацил (по 1-4 свечи в день взрослому). Могут применяться также микроклизмы (0,2-0,4 г метилурацила на крахмальном клейстере в объеме 20-25 мл).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,5 г в упаковке по 50 штук; свечи с метилурацилом по 0,5 г в упаковке по 10 свечей; мазь метилурациловая 10% в алюминиевых тубах по 25 г.

### **Натрия цитрат (Sodium citrate)**

**Групповая принадлежность:** Гемоконсервант-вспомогательное вещество

**Фармакологическое действие:** Антикоагулянтное средство, снижает свертываемость крови, повышает щелочные резервы крови, защелачивает мочу. Связывает  $Ca^{2+}$  (IV плазменный фактор свертывания крови) и делает невозможной гемокоагуляцию (in vitro). Повышает концентрацию  $Na^{+}$  в организме. Изменение реакции мочи с кислой на щелочную приводит к исчезновению дизурических явлений.

**Показания:** Консервирование крови, симптоматическое лечение цистита.

**Способ применения и дозы:** Внутрь, по 1 пакету (предварительно растворив в 1 стакане воды) 3 раза в день, в течение 2 дней.

**Форма выпуска:** субстанция-порошок; пакет (пакетик) полиэтиленовый 5,10,15 кг;

### **Феррум Лек (Ferrum Lek)**

**Групповая принадлежность:** Гемопоза стимулятор-железа препарат

**Фармакологическое действие:** Способствует быстрому восстановлению железа при недостатке его в организме.

**Показания к применению:** Железодефицитные анемии (снижение содержания гемоглобина в крови вследствие нарушения поступления, усвоения или выделения железа) различной этиологии (причины).

**Способ применения:** Глубоко внутримышечно через день по 2 мл. Максимальная суточная доза при внутримышечном введении для взрослых - 4 мл, для детей с массой тела до 5 кг - 0,5 мл, массой тела 5-10 кг - 1 мл. Внутривенно взрослым: в 1-й день - 2,5 мл (!/2 ампулы), 2-й день - 5 мл (1 ампула) и 3-й - 10 мл (2 ампулы), далее 2 раза в неделю по 10 мл.

**Форма выпуска:** Ампулы по 2 мл раствора для внутримышечного введения в упаковке по 50 штук; ампулы по 5 мл раствора для внутривенного введения в упаковке по 50 штук.

**Коамид (Coamidum)**

**Групповая принадлежность:** Гемопозза стимулятор.

**Фармакологическое действие:** Стимулятор кроветворения, способствует усвоению организмом железа и стимулирует процессы его преобразования.

**Показания к применению:** Гипохромные анемии (низкое содержание гемоглобина в крови), гипопластические анемии (снижение содержания гемоглобина в крови вследствие угнетения кроветворной функции костного мозга), железодефицитные анемии (снижение содержания гемоглобина в крови вследствие нарушения поступления, усвоения и выведения железа).

**Способ применения:** Вводят под кожу в виде 1 % водного раствора по 1 мл ежедневно. Можно также назначать внутрь по 0,1 г 3 раза в день. Продолжительность лечения зависит от характера заболевания и получаемых результатов; в среднем курс лечения продолжается 25 - 30 дней.

**Форма выпуска:** Порошок; 1 % раствор в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 ампул.

**Викасол (Vikasolum)**

**Групповая принадлежность:** Группа витаминов

**Фармакологическое действие:** Синтетический (получаемый искусственным путем) водорастворимый аналог витамина К. Участвует в образовании протромбина. Способствует нормализации свертывания крови. При недостаточности его в организме развиваются геморрагические явления (кровоточивость).

**Показания к применению:** Желтуха вследствие задержки поступления желчи в кишечник, острые гепатиты (воспаление ткани печени). Паренхиматозные (из внутренних органов) и капиллярные кровотечения (применяется при подготовке к хирургическим операциям и после них). Кровотечения при язвах желудка и двенадцатиперстной кишки. Лучевая болезнь. Тромбопеническая пурпура (множественные кровоизлияния под кожу и/или слизистые оболочки из-за снижения уровня тромбоцитов в крови). Упорные геморроидальные (из расширенных вен прямой кишки) и носовые кровотечения.

**Способ применения:** Внутрь взрослым 0,015-0,3 г в сутки; внутримышечно 0,01-0,015 г. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 0,03 г, суточная - 0,06 г; внутримышечно: разовая - 0,015 г, суточная - 0,03 г. Детям в возрасте до 1 года назначают 0,002-0,005 г, до 3 лет - 0,006 г, 3-4 лет - 0,008 г, 5-9 лет - 0,01 г, 10-14 лет - 0,015 г в сутки в 2-3 приема 3-4 дня подряд; после перерыва на 4 дня курс лечения повторяют. Перед операцией препарат назначают за 2-3 дня. Высшие дозы для взрослых: внутрь разовая - 0,03 г, суточная - 0,06 г; внутримышечно разовая - 0,015 г, суточная - 0,03 г.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,015 г в упаковке по 25 штук; ампулы по 1 мл 1 % раствора в упаковке по 10 штук.

**Фолиевая кислота (Acidum Folicum)**

**Групповая принадлежность:** Группа витаминов

**Фармакологическое действие:** Фолиевая кислота относится к группе витаминов В. Поступает в организм с пищей (экзогенная фолиевая кислота), а так же синтезируется микрофлорой кишечника (эндогенная). И экзо-, и эндогенная фолиевая кислота в организме восстанавливается до коэнзима (тетрагидрофолиевой кислоты). Этот коэнзим необходим для многих важных метаболических процессов: участие в образовании пуринов, пиримидинов, нуклеиновых и аминокислот. Так же является необходимой для обмена холина. В синергизме с цианокобаламином (витамин В12) стимулирует кровеобразование: необходима для дифференциации и созревания мегалобластов, частично берет участие в эритропоэзе. Недостаток фолиевой кислоты приводит к торможению фазы кроветворения из мегалобластной в нормобластную. При приеме фолиевой кислоты беременными наблюдается снижение риска воздействия тератогенных факторов на развитие органов и систем плода.

**Показания к применению:** Как стимулятор кроветворения: • При гиперхромных макроцитарных и мегалобластических анемиях, которые вызваны недостаточностью фолиевой кислоты; • в терапии спру в качестве средства для купирования или уменьшения симптомов заболевания, нормализации эритропоэза; • лейкопения и анемия, которые развились из-за действия ионизирующего излучения, химических (медикаментозных) веществ; • анемии после операции резекции желудка или части кишечника; • мегалобластные анемии из-за туберкулеза кишечника или гастроэнтерита (в т.ч. – для профилактики анемии при этих состояниях); • пеллагра; • пернициозная анемия. С профилактической целью: • Превентивное лечение при беременности и вскармливании грудью.

**Способ применения:** Таблетки принимать внутрь после приема пищи. С лечебными целями рекомендуется по 0,001-0,002 (1-2 таблетки) 1-3 р/сутки. Суточная доза составляет 0,005 г (5 таблеток). Продолжительность приема фолиевой кислоты – от 20 до 30 суток.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,001 г. Таблетки бледно-зеленого цвета, имеют плоскую поверхность. В упаковке 10 или 30 таблеток.

**Протамина сульфат (Protamini sulfas)**

**Групповая принадлежность:** Гемостатическое средство

**Фармакологическое действие:** Препарат является эффективным антидотом (“противоядием”) гепарина в эквивалентной дозе: 1 мг протамина сульфата нейтрализует 1 мг гепарина. Действие наступает мгновенно. Эффект продолжается приблизительно 2 ч.

**Показания к применению:** Применяют протамина сульфат главным образом при необходимости нейтрализовать действие избыточного экзогенного (добавляемого из вне) гепарина. Кровотечения вследствие передозировки гепарина; перед операцией у больных, которые принимают гепарин с лечебной целью; после операций на сердце и кровеносных сосудах с экстракорпоральным кровообращением (с использованием аппарата “искусственное сердце”); гипергепаринемия (повышенное содержание гепарина в крови).

**Способ применения:** Вводят раствор протамина сульфата внутривенно струйно или капельно под контролем свертываемости крови. Струйно вводят медленно со скоростью 1 мл 1% раствора за 2 мин. Общая доза обычно составляет 5 мл 1% раствора. При необходимости дозу можно повторить с интервалом в 15 мин. Максимальная доза не должна превышать 150 мг в течение одного часа. При спонтанных кровотечениях суточную дозу 5-8 мг/кг массы тела назначают в 2 приема с интервалом в 6 ч. Рассчитанную дозу растворить в 300-500 мл изотонического раствора натрия хлорида и вводить внутривенно медленно или капельно. Максимальный курс лечения - 3 дня.

**Форма выпуска:** Ампулы по 5 мл 1% раствора в упаковке по 5 штук.

### **Дипиридамол (Dipyridamolum)**

**Групповая принадлежность:** Вазодилатирующее средство

**Фармакологическое действие:** Дипиридамол был первоначально предложен в качестве коронарорасширяющего (расширяющего сосуды сердца) антиангинального (противостенокардического) средства. Как коронарорасширяющее средство дипиридамол имеет в настоящее время ограниченное применение. Используется иногда при хронической ишемической болезни сердца. Важной особенностью дипиридамола можно назвать его способность тормозить агрегацию (склеивание) тромбоцитов и препятствовать образованию тромбов (сгустков крови) в сосудах. Препарат стимулирует биосинтез (образование в организме) простаглицина и тормозит синтез тромбоксанов (биологически активных веществ, принимающих участие в регуляции сосудистого тонуса и свертывающей системы крови).

**Показания к применению:** В основном применяют как антиагрегационное (препятствующее склеиванию тромбоцитов) средство для предупреждения послеоперационных тромбозов (образования сгустка крови в сосуде), при инфаркте миокарда, нарушениях мозгового кровообращения. Имеются данные об улучшении под влиянием дипиридамола реологических показателей (характеристик физического состояния крови) и функции почек у больных хроническим гломерулонефритом (заболеванием почек). Дипиридамол воздействует на метаболизм (превращения в организме) арахидоновой кислоты и способствует увеличению продукции простаглицина в стенках сосудов. По антиагрегационной активности дипиридамол уступает тиклопидину, близок к ацетилсалициловой кислоте. Вместе с тем он лучше переносится, чем ацетилсалициловая кислота, не оказывает ulcerогенного (вызывающего язву желудка) действия.

**Способ применения:** Принимают внутрь в качестве антитромботического (препятствующего свертыванию крови) средства по 0,025 г (25 мг) 3 раза в сутки. Как средство для лечения стенокардии принимают внутрь (натощак за 1 ч до еды) по 0,025-0,05 г (1-2 драже по 0,025 г) 3 раза в день. В более тяжелых случаях по 0,225 г (225 мг - 3 драже по 0,075 г) в сутки в 3 приема. Курс лечения продолжается от нескольких недель до нескольких месяцев.

**Форма выпуска:** Таблетки (драже) по 0,025 и 0,075 г.; 0,5% раствор в ампулах по 2 мл (0,01 г).

### **Железа лактат (Ferri lactas)**

**Групповая принадлежность:** Гемопозза стимулятор-железа препарат

**Фармакологическое действие:** Стимулятор кроветворения. Соединение закисного железа легко всасывается в желудочно-кишечном тракте и не вызывает раздражение слизистой.

**Показания к применению:** Гипохромная анемия (низкое содержание гемоглобина в крови).

**Способ применения:** В капсулах по 1 г 3-4 раза в день.

**Форма выпуска:** Порошок.

### **Молграмостим (Molgramostim)**

**Групповая принадлежность:** Лейкопозза стимулятор

**Фармакологическое действие:** Оказывает выраженное влияние на кроветворение и функциональную активность лейкоцитов. Стимулирует пролиферацию и дифференцировку предшественников кроветворных клеток. Стимулирует рост гранулоцитов, моноцитов, Т-лимфоцитов, не влияя на рост В-лимфоцитов. Увеличивает содержание зрелых клеток и их функциональную активность - усиливает фагоцитоз, увеличивает степень выраженности "респираторного взрыва" (обеспечивающего образование 90% активных форм кислорода и являющегося одним из важнейших механизмов фагоцитоза), повышает цитотоксичность в отношении злокачественных клеток. Индуцирует формирование колониеобразующих единиц гранулоцитов и макрофагов. Способен усиливать экспрессию антигенов II класса HLA на моноцитах и увеличивать

продукцию антител. При миелодиспластических синдромах эффективно нормализует миелопоэз. Уменьшает время восстановления миелоидного кроветворения после трансплантации костного мозга у пациентов с острым лейкозом, не влияя при этом на общую выживаемость и время до развития рецидива. Устраняет лейкопению после химиотерапии, достоверно уменьшая частоту глубокой нейтропении и инфекционных осложнений, снижает потребность в антибиотикотерапии и обеспечивает возможность интенсификации химиотерапии. Увеличивает безрецидивную выживаемость больных с резистентными лимфомами. После однократного парентерального введения действие проявляется через 2-4 ч и достигает пика через 8-16 ч.

**Показания:** Нейтропения (лечение и профилактика при миелосупрессивной терапии), нейтропения (лечение при аплазии костного мозга), восстановление миелоидного кроветворения при инфекциях на фоне нейтропении, СПИД, пересадка костного мозга.

**Способ применения и дозы:** П/к, в/в. При миелодиспластических синдромах, апластической анемии - по 3 мкг/кг п/к 1 раз в день, с последующим подбором дозы, обеспечивающей число лейкоцитов 10 тыс./мкл. При СПИДе назначают в виде монотерапии или совместно с др. ЛС. Монотерапия: 1 мкг/кг п/к, 1 раз в день. Совместно с зидовудином или с комбинацией зидовудина с интерфероном альфа: 1-3 мкг/кг п/к, 1 раз в день; одновременно с ганцикловиром: 3-5 мкг/кг п/к, 1 раз в день; дозу подбирают каждые 4-5 дней, ориентируясь на число лейкоцитов. Пересадка костного мозга: 5-10 мкг/кг в день в/в, вливая в течение 4-6 ч. Для ускорения восстановления кроветворения после химиотерапии: 5-10 мкг/кг п/к, 1 раз в день.

**Форма выпуска** Молграмостим. Сухое лиофилизированное вещество для инъекций (в 1 фл. — 150 мкг, 300 мкг, 400 мкг, 700 мкг).

### **Кальция хлорид (Calcii chloridum)**

**Групповая принадлежность:** Кальциево-фосфорного обмена регулятор

**Фармакологическое действие:** Кальций играет важную роль в жизнедеятельности организма. Ионы кальция необходимы для осуществления процесса передачи нервных импульсов, сокращения скелетных и гладких мышц, деятельности мышцы сердца, формирования костной ткани, свертывания крови, а также для нормальной деятельности других органов и систем. Уменьшенное содержание кальция в плазме крови наблюдается при целом ряде патологических состояний. Выраженная гипокальциемия (пониженное содержание кальция в крови) приводит к развитию тетании (судороги). Коррекция гипокальциемии проводится при помощи препаратов кальция, а также гормональных препаратов (см. кальцитонин -стр. 543, паратиреоидин -стр. 545), эргокальциферола и др.

**Показания к применению:** При недостаточной функции парашитовидных желез, сопровождающейся тетанией или спазмофилией (заболеванием у детей, связанном с уменьшением содержания в крови ионов кальция и зашелачиванием крови). При усиленном выделении кальция из организма, что может иметь место при длительном обездвиживании больных. При аллергических заболеваниях (сывороточная болезнь, крапивница, ангионевротический отек, сенная лихорадка и др.) и аллергических осложнениях, связанных с приемом лекарств. Как средство, уменьшающее проницаемость сосудов, при геморрагическом васкулите (кровоизлиянии вследствие воспаления стенок кровеносных сосудов), явлениях лучевой болезни, воспалительных и экссудативных процессах (выделении из мелких сосудов ткани богатой белком жидкости) - пневмония (воспаление легких), плеврит (воспаление оболочки, покрывающей легкие и выстилающей стенки грудной полости), аднексит (воспаление придатков матки), эндометрит (воспаление внутренней поверхности матки) и др. При кожных заболеваниях (зуд, экзема, псориаз и др.). Применяют также как кровоостанавливающее средство при легочных, желудочно-кишечных, носовых, маточных кровотечениях; в хирургической практике иногда вводят перед оперативным вмешательством для повышения свертываемости крови.

**Способ применения:** Назначают кальция хлорид внутрь, внутривенно капельно (медленно), внутривенно струйно (очень медленно!), а также вводят методом электрофореза (чрезкожным способом введения лекарственных веществ посредством электрического тока). Внутрь принимают после еды в виде 5-10% раствора 2-3 раза в день. Взрослым назначают по 10-15 мл на прием (десертная или столовая ложка раствора); детям - по 5-10 мл (чайная или десертная ложка). В вену капельно вводят по 6 капель в минуту, разбавляя перед введением 5-10 мл 10% раствора в 100-200 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. Внутривенно струйно вводят медленно (в течение 3-5 мин) 5 мл 10% раствора. Для лечения аллергических заболеваний рекомендуется совместное применение кальция хлорида и противогистаминных препаратов.

**Форма выпуска:** Порошок в небольших хорошо закупоренных стеклянных банках с пробкой, залитой парафином; 10% раствор в ампулах по 5 и 10 мл; 5% и 10% растворы для приема внутрь.

### **Стрептокиназа (Streptokinase)**

**Групповая принадлежность:** Фибринолитическое средство

**Фармакологическое действие:** Активирует фибринолитическую (растворяющую сгусток крови) ферментную систему, расщепляет содержащийся в тромбах фибрин, в результате чего происходит тромболитический процесс (растворение сгустка крови).

**Показания к применению:** Эмболия (закупорка) легочной артерии и ее ветвей; тромбоз (образование сгустка крови в сосуде) артерий и эмболия периферических артерий при консервативном (нехирургическом) лечении; тромбоз поверхностных и глубоких вен конечностей; острый инфаркт миокарда в течение первых 12 ч; закупорка сосудов сетчатой оболочки глаза.

**Способ применения:** Вводят стрептокиназу внутривенно капельно, а в необходимых случаях внутриартериально. Внутривенно вводят обычно в начальной дозе 250 000 МЕ (ИЕ) в 50 мл изотонического раствора натрия хлорида в течение 30 мин (30 капель в минуту). Эта доза обычно вызывает начало лизиса (растворения) тромба. Затем продолжают введение стрептокиназы в дозе 100 000 МЕ в час. Общая продолжительность введения составляет, как правило, 16-18 ч. Последующее лечение проводят гепарином и антикоагулянтами непрямого действия. При обширных артериальных и венозных тромбозах иногда необходимо длительное введение стрептокиназы. Внутриартериальное введение стрептокиназы применяют в остром периоде инфаркта миокарда (начальная доза 20 000 МЕ; поддерживающая - 2000-4000 МЕ в минуту в течение 30-90 мин).

**Форма выпуска:** Во флаконах по 100 000, 250 000, 750 000 и 1 500 000 ИЕ стрептокиназы.

**Пентоксил (Pentoxylum)**

**Групповая принадлежность:** Лейкопозз стимулятор

**Фармакологическое действие:** Стимулирует лейкопозз (процесс образования лейкоцитов), повышает фагоцитарную активность лейкоцитов и ретикулоэндотелиальной системы (способность захватывать и разрушать микробы, поврежденные клетки).

**Показания к применению:** Лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови) различной этиологии (причины), алиментарная (связанная с питанием) токсическая (связанная с отравлением) алейкия (отсутствие лейкоцитов в крови), агранулоцитарная ангина (наиболее тяжелая форма ангины при отсутствии лейкоцитов в крови), некоторые лекарственные агранулоцитозы (резкое снижение числа гранулоцитов в крови вследствие длительного приема лекарственных средств), хронические отравления бензолом.

**Способ применения:** Внутрь взрослым по 0,2-0,4 г 3-4 раза в день после еды, детям в соответствии с возрастом. В среднем на курс лечения (15-20 дней) - 6-10 г препарата.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки, покрытые оболочкой, по 0,2 г, в упаковке 10 штук.

## Гормональные лекарственные средства и их антагонисты.

### Общие сведения об эндокринной системе

**Гормоны** – биологически активные вещества, вырабатываемые железами внутренней секреции (эндокринной системы) и выделяемые в кровь. Эндокринная система – совокупность эндокринных желез, обеспечивающих выработку гормонов.

У человека и животных есть два типа желез. Железы первого типа – слезные, слюнные, потовые и другие – выделяют вырабатываемый ими секрет наружу и называются **экзокринными** (от греческого *exo* – вне, снаружи, *krino* – выделять). Железы же второго типа выбрасывают синтезируемые в них вещества в омывающую их кровь. Эти железы назвали **эндокринными** (от греческого *endon* – внутри), а вещества, выбрасываемые в кровь, – гормонами.

Таким образом, гормоны (от греческого *hormaino* – приводить в движение, побуждать) – биологически активные вещества, вырабатываемые эндокринными железами или специальными клетками в тканях организма. Такие клетки имеются в сердце, желудке, кишечнике, слюнных железах, почках, печени и в других органах. Если гормоны высвобождаются в кровотоке оказывают действие на клетки органов-мишеней, находящихся на удалении – такое действие называется **дистальным**, если действие оказывается на ткани в месте выработки гормонов (местные гормоны) такое действие называется **паракринным** действие), в том случае если действие оказывается непосредственно на вырабатываемую гормон клетку такое действие называется **аутокринным**.

Гормоны вырабатываются в небольших количествах, но длительное время сохраняются в активном состоянии и с током крови разносятся по всему организму. Основные функции гормонов:

- поддержание внутренней среды организма;
- участие в обменных процессах;
- регуляция роста и развития организма.

Полный перечень гормонов и их функции представлены в таблице.

**Основные гормоны**

Гормон	Какой железой вырабатывается	Функция
Адренокортикотропный гормон	Гипофиз	Управляет секрецией гормонов коры надпочечников
Альдостерон	Надпочечники	Участвует в регуляции водно-солевого обмена: удерживает натрий и воду, выводит калий
Вазопрессин (антидиуретический гормон)	Гипофиз	Регулирует количество выделяемой мочи и вместе с альдостероном контролирует артериальное давление
Глюкагон	Поджелудочная железа	Повышает уровень глюкозы в крови
Гормон роста	Гипофиз	Управляет процессами роста и развития; стимулирует синтез белков
Инсулин	Поджелудочная железа	Понижает уровень глюкозы в крови; влияет на обмен углеводов, белков и жиров в организме
Кортикостероиды	Надпочечники	Оказывают действие на весь организм; обладают выраженными противовоспалительными свойствами; поддерживают уровень сахара в крови, артериальное давление и мышечный тонус; участвуют в регуляции водно-солевого обмена
Лютеинизирующий гормон и фолликулостимулирующий гормон	Гипофиз	Управляют детородными функциями, в том числе выработкой спермы у мужчин, созреванием яйцеклетки и менструальным циклом у женщин; ответственны за формирование мужских и женских вторичных половых признаков (распределение участков роста волос, объем мышечной массы, строение и толщина кожи, тембр голоса и, возможно, даже черты личности)
Окситоцин	Гипофиз	Вызывает сокращение мышц матки и протоков молочных желез
Паратгормон	Паращитовидные железы	Управляет формированием костей и регулирует выведение кальция и фосфора с мочой
Прогестерон	Яичники	Готовит внутреннюю оболочку матки для внедрения оплодотворенной яйцеклетки, а молочные железы – к

		выработке молока
Пролактин	Гипофиз	Вызывает и поддерживает выработку молока в молочных железах
Ренин и ангиотензин	Почки	Контролируют артериальное давление
Тиреоидные гормоны	Щитовидная железа	Регулируют процессы роста и созревания, скорость обменных процессов в организме
Тиреотропный гормон	Гипофиз	Стимулирует выработку и секрецию гормонов щитовидной железы
Эритропоэтин	Почки	Стимулирует образование эритроцитов
Эстрогены	Яичники	Управляют развитием женских половых органов и вторичных половых признаков

**Строение эндокринной системы.** изображены железы, которые вырабатывают гормоны: гипоталамус, гипофиз, щитовидная железа, паращитовидные железы, надпочечники, поджелудочная железа, яичники (у женщин) и яички (у мужчин). Все железы и клетки, выделяющие гормоны, объединены в эндокринную систему.

**Эндокринная система** работает под контролем центральной нервной системы и совместно с ней осуществляет регуляцию и координацию функций организма. Общим для нервных и эндокринных клеток является выработка регулирующих факторов.

С помощью выделения гормонов эндокринная система, вместе с нервной, обеспечивает существование организма как единого целого. Если бы не было эндокринной системы, то весь организм представлял бы собой бесконечно запутанную цепь “проводов” – нервных волокон. При этом по множеству “проводов” пришлось бы последовательно отдавать одну-единственную команду, которую можно передать в виде одной “команды”, переданной “по радио”, сразу многим клеткам.

Эндокринные клетки производят гормоны и выделяют их в кровь, а клетки нервной системы (**нейроны**) вырабатывают биологически активные вещества (**нейромедиаторы –норадреналин, ацетилхолин, серотонин** и другие), выделяющиеся в **синаптические щели**.

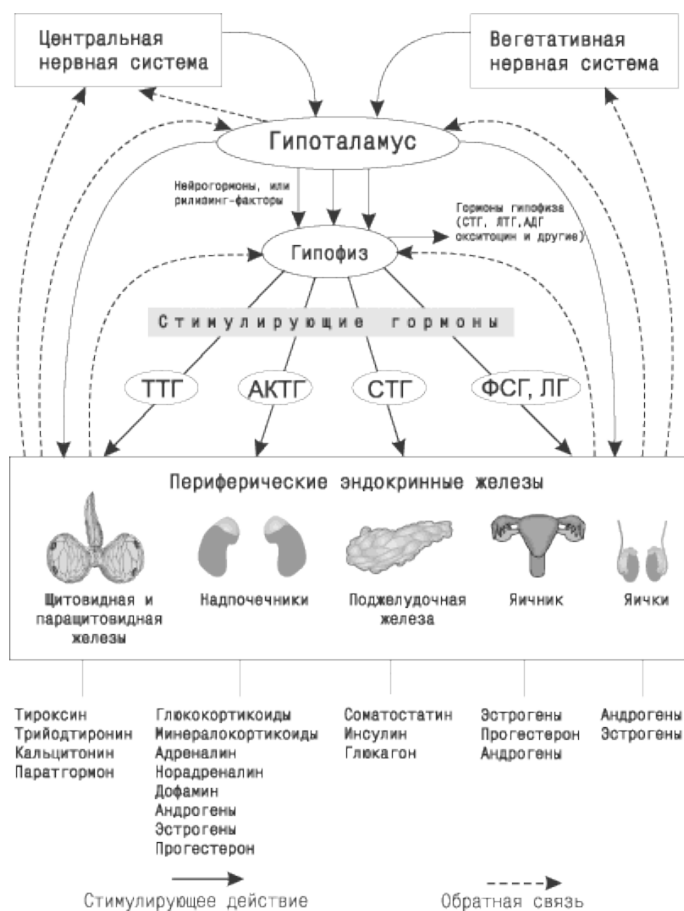
Связующим звеном между эндокринной и нервной системами служит **гипоталамус**, являющийся одновременно и нервным образованием, и эндокринной железой.



Гипоталамус – высший центр эндокринной системы. Он контролирует и объединяет эндокринные механизмы регуляции с нервными, являясь также мозговым центром **вегетативной нервной системы**. В гипоталамусе находятся нейроны, способные вырабатывать особые вещества – **нейрогормоны**, регулирующие выделение гормонов другими эндокринными железами. Центральным органом эндокринной системы является также гипофиз. Остальные эндокринные железы относят к периферическим органам эндокринной системы.

Как видно из рисунка, в ответ на информацию, поступающую от центральной и вегетативной нервной системы, гипоталамус выделяет специальные вещества – нейрогормоны, которые “дают команду” гипофизу ускорить или замедлить выработку стимулирующих гормонов.





### Гипоталамо-гипофизарная система эндокринной регуляции:

ТТГ - тиреотропный гормон; АКТГ - адренокортикотропный гормон; ФСГ - фолликулостимулирующий гормон; ЛГ - лютеинизирующий гормон; СТГ - соматотропный гормон; ЛТГ - лютеотропный гормон (пролактин); АДГ - антидиуретический гормон (вазопрессин)



Кроме того, гипоталамус может посылать сигналы непосредственно периферическим эндокринным железам без участия гипофиза.

К основным стимулирующим гормонам гипофиза относятся тиреотропный, адренокортикотропный, фолликулостимулирующий, лютеинизирующий и соматотропный.

**Тиреотропный гормон** действует на щитовидную и паращитовидные железы. Он активизирует синтез и выделение **тиреоидных гормонов (тироксина и триодтиронина)**, а также гормона **кальцитонина** (который участвует в кальциевом обмене и вызывает снижение содержания кальция в крови) щитовидной железой.

Паращитовидные железы вырабатывают **паратгормон**, который участвует в регуляции обмена кальция и фосфора.

**Адренокортикотропный гормон** стимулирует выработку **кортикостероидов (глюкокортикоидов и минералокортикоидов)** корковым веществом надпочечников. Кроме того, клетки коркового вещества надпочечника вырабатывают **андрогены, эстрогены и прогестерон** (в небольших количествах), ответственные, наряду с аналогичными гормонами половых желез, за развитие вторичных половых признаков. Клетки мозгового вещества надпочечника синтезируют **адреналин, норадреналин и дофамин**.

**Фолликулостимулирующий** и **лютеинизирующий** гормоны стимулируют половые функции и выработку гормонов половыми железами. Яичники женщин продуцируют эстрогены, прогестерон, андрогены, а яички мужчин – андрогены.

**Соматотропный гормон** стимулирует рост организма в целом и его отдельных органов (в том числе рост скелета) и выработку одного из гормонов поджелудочной железы – **соматостатина**, подавляющего выделение поджелудочной железой **инсулина**, **глюкагона** и пищеварительных ферментов. В поджелудочной железе имеются 2 вида специализированных клеток, сгруппированных в виде мельчайших островков. Это альфа-клетки, которые синтезируют гормон глюкагон, и бета-клетки, продуцирующие гормон инсулин. Инсулин и глюкагон регулируют углеводный обмен (то есть уровень глюкозы в крови).

Стимулирующие гормоны активизируют функции периферических эндокринных желез, побуждая их к выделению гормонов, участвующих в регуляции основных процессов жизнедеятельности организма.

Избыток гормонов, вырабатываемых периферическими эндокринными железами, подавляет выделение соответствующего “тропного” гормона гипофиза. Это яркая иллюстрация универсального регулирующего механизма в живых организмах, обозначаемого как **отрицательная обратная связь**.

Помимо стимулирующих гормонов, гипофиз вырабатывает также гормоны, непосредственно участвующие в контроле жизненных функций организма. К таким гормонам относятся: соматотропный гормон (о котором мы уже упоминали выше), лютеотропный гормон, антидиуретический гормон, окситоцин и другие.

**Лютеотропный гормон (пролактин)** контролирует выработку молока в молочных железах.

**Антидиуретический гормон (вазопрессин)** задерживает выведение жидкости из организма и повышает артериальное давление крови.

**Окситоцин** вызывает сокращение матки и стимулирует выделение молока молочными железами.

Недостаток гормонов гипофиза в организме компенсируют лекарственными средствами, которые восполняют их дефицит или имитируют их действие (средства заместительной терапии).

Уровень некоторых гормонов, контролируемых гипофизом, подвержен циклическим колебаниям. Так, менструальный цикл у женщин определяется месячными колебаниями уровня лютеинизирующего и фолликулостимулирующего гормонов, которые вырабатываются в гипофизе и воздействуют на яичники. Соответственно уровень гормонов яичников – эстрогенов и прогестерона – колеблется в таком же ритме. Каким образом гипоталамус и гипофиз управляют этими биоритмами – до конца не ясно.

Есть и такие гормоны, выработка которых изменяется по еще не понятным до конца причинам. Так, уровень кортикостероидов и гормона роста почему-то колеблется в течение суток: достигает максимума утром, а минимума – в полдень.

**Половые гормоны.** Существуют два вида половых гормонов – мужские (андрогены) и женские (эстрогены). В организме и у мужчин, и у женщин присутствуют оба вида. От их соотношения зависит развитие половых органов и формирование вторичных половых признаков в подростковый период (увеличение грудных желез у девочек, появление волос на лице и огрубение голоса у мальчиков и тому подобное). Вам, наверное, приходилось видеть на улице, в транспорте старушек с грубым голосом, усиками и даже бородкой. Объясняется это достаточно просто. С возрастом у женщин снижается выработка эстрогенов (женских половых гормонов), и может случиться, что мужские половые гормоны (андрогены) станут преобладать над женскими. Отсюда – и огрубение голоса, и избыточное оволосение (гирсутизм).



Как известно мужчины, больные алкоголизмом страдают выраженной феминизацией (вплоть до увеличения грудных желез) и импотенцией. Это тоже результат протекания гормональных процессов. Многократный прием алкоголя мужчинами приводит к подавлению функции яичек и снижению в крови концентрации мужского полового гормона – **тестостерона**, которому мы обязаны чувством страсти и полового влечения. Одновременно надпочечники увеличивают выработку веществ, близких по строению к тестостерону, но не оказывающих на мужскую половую систему активирующего (андрогенного) действия. Это обманывает гипофиз, и он уменьшает свое стимулирующее влияние на надпочечники. В результате выработка тестостерона еще более уменьшается. При этом введение тестостерона мало помогает, так как в

организме алкоголика печень превращает его в женский половой гормон (**эстрон**). Получается, что лечение только ухудшит результат. Так что мужчинам приходится выбирать, что для них важнее: секс или алкоголь.

Трудно переоценить роль гормонов. Их работу можно сравнить с игрой оркестра, когда любой сбой или фальшивая нота нарушают гармонию. На основе свойств гормонов создано много лекарственных препаратов, применяемых при тех или иных заболеваниях соответствующих желез.

Гормоны связываются рецепторами в клетках-мишенях, при этом активируются внутриклеточные ферменты, что приводит клетку-мишень в состояние функционального возбуждения. Избыточное количество гормона действует на вырабатывающую его железу или через вегетативную нервную систему на гипоталамус, побуждая их к снижению выработки этого гормона (отрицательная обратная связь).

Слаженная работа всех органов эндокринной системы является залогом нормальной жизнедеятельности организма.

Наоборот, любой сбой в синтезе гормонов или нарушение функций эндокринной системы приводит к неприятным для здоровья последствиям. Например, при недостатке соматотропина, выделяемого гипофизом, ребенок остается карликом.

Всемирной организацией здравоохранения установлен рост среднего человека – 160 см (у женщин) и 170 см (у мужчин). Человек ниже 140 см или выше 195 см считается уже очень низким или очень высоким. Известно, что римский император Маскимилиан имел рост 2,5 м, а египетская карлица Агибе была ростом всего 38 см.

Недостаток гормонов щитовидной железы у детей приводит к развитию умственной отсталости, а у взрослых – к замедлению обмена веществ, снижению температуры тела, появлению отеков.

Известно, что при стрессе увеличивается выработка кортикостероидов и развивается “синдром недомогания”. Возможности организма приспосабливаться (адаптироваться) к стрессу во многом зависят от способности эндокринной системы быстро отвечать снижением выработки кортикостероидов.

При недостатке инсулина, производимого поджелудочной железой, возникает тяжелое заболевание – сахарный диабет.

По мере старения (естественного угасания организма) складываются различные соотношения гормональных компонентов в организме.

Так наблюдается уменьшение образование одних гормонов и увеличение других. Уменьшение активности эндокринных органов происходит с разной скоростью: к 13-15 годам – наступает атрофия вилочковой железы, концентрация в плазме крови тестостерона у мужчин постепенно снижается уже после 18 лет, секреция эстрогенов у женщин уменьшается после 30 лет; продукция гормонов щитовидной железы ограничивается только к 60-65 годам.

## **Гормональные и антигормональные препараты**

К гормональным препаратам относятся вещества - аналоги гормонов вырабатываемых в организме человека. Гормональные препараты получают из эндокринных желез животных, но некоторую часть из них получают методом синтеза. В качестве аналогов гормональных средств могут применяться и другие вещества, действующие подобно гормонам.

Антигормональные средства это вещества, которые тормозят синтез гормонов в организме или препятствует их действию.

Эндокринные железы (железы внутренней секреции), специальные органы или группы клеток которые выделяют в организм (внутрь) биологически активные вещества – гормоны. К железам внутренней секреции относятся: гипофиз, щитовидная железа, паращитовидные железы, надпочечники, поджелудочная железа, половые железы и др.

При нарушении функций той или иной эндокринной железы может наблюдаться увеличении ее продуктивности или наоборот - снижение. Например, базедова болезнь возникает вследствие чрезмерной функции щитовидной железы, диабет – вследствие недостаточности функциональной активности поджелудочной железы.

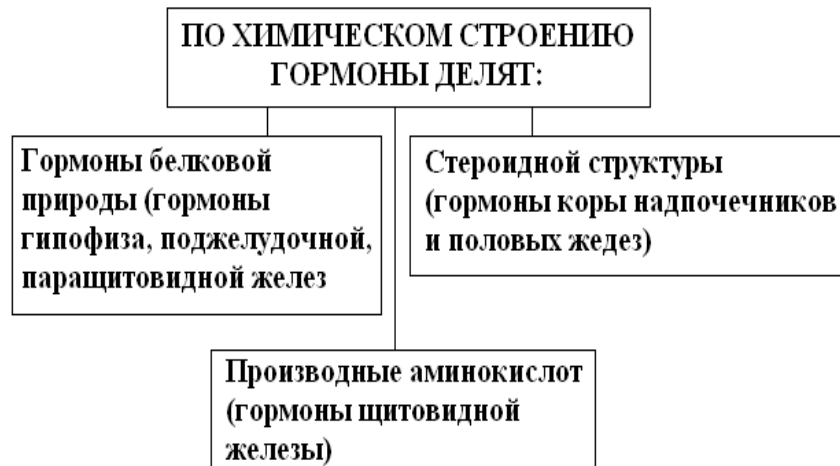
При недостаточности функциональной активности железы обычно прибегают к заместительной терапии, назначая лекарственные препараты - аналоги гормонов в которых имеется недостаток. При гиперактивности (избыточной продукции) назначается антигормональный препарат подавляющий активность соответствующий железы или действие гормона на организм.

В определенных случаях гормональный препарат может назначаться и при нормальном функционировании эндокринной железы, рассчитывая при этом на получение

определенного терапевтического эффекта, например, применение глюкокортикоидов (гормонов коры надпочечников) при лечении воспалительных заболеваний или аллергии. Такой вид терапии называется – патогенетической.

Гормоны делят **на три группы**, в зависимости от их химического строения:

1. Белковой природы (гормоны гипофиза, поджелудочной железы, паращитовидных желез);
2. Производные аминокислот (гормоны щитовидной железы);
3. Гормоны стероидной структуры (гормоны коры надпочечников и половых желез);



### **Препараты гормонов гипофиза и гипоталамуса**

Гипофиз - эндокринная железа, небольшого размера, расположенная в углублении турецкого седла черепа (у основания головного мозга). Различают **три доли гипофиза**: переднюю, среднюю и заднюю, каждая из которых вырабатывает и выбрасывает в кровь определенный вид гормонов. Выделение гормонов гипофиза регулируется гипоталамусом.

Большинства гормонов гипофиза вырабатывается передней его долей (адренокортикотропный, тиреотропный, гонадотропный и др.).

### **Гормоны передней доли гипофиза**

**Передняя доля гипофиза** вырабатывает как нейrogормоны (регулирующие выделение гормонов другими эндокринными железами), так и гормоны действующие непосредственно на организм. К последним относится гормон роста, имеющий особенно важное значение в детском и подростковом возрасте. При недостаточности этого гормона задерживается рост и физическое развитие ребенка, При дальнейшем негативном развитии этого процесса рост может полностью прекратиться. Такое заболевание называется карликовость.

При избыточной продукции этого гормона наблюдается чрезмерный рост, развивается заболевание – гигантизм, при этом рост человека может достигнуть 250 см. Если заболевание развивается у взрослого человека, когда рост тела прекращается, увеличиваются отдельные части тела (стоп, носа, кистей, языка и пр.), такое заболевание называется акромегалией. Гормон роста также способствует развитию сахарного диабета (обладает диабетогенным действием).

При гипофизной карликовости (вследствие недостаточности гормона роста) назначают лекарственный препарат соматотропин и его аналог соматрем.

Антагонистом соматотропного гормона является выделенный из гипоталамуса – соматостатин. Синтетическим аналогом соматостатина является октреотид, который

действует более продолжительное время. Еще одним аналогом самотостатина является ланреотид. Препарат обладает пролонгированным действием (до 14 суток), вводится один раз в 10 – 14 дней, применяется при лечении акромегалии.

Избыточную продукцию гормона роста подавляет также – бромкриптин (относится к группе дофаминомиметиков).



Среди нейрогормонов, вырабатываемых передней долей гипофиза выделяют тиротропный гормон (ТТГ), адренокортикотропный гормон (АКТГ), стимулирующий продукцию гормонов коры надпочечников – глюкокортикоидов.

Продуцируемый гипофизом - тиреотропный (ТТГ) гормон стимулирует продукцию гормонов щитовидной железы. Синтетическим аналогом тиреотропного гормона является лекарственное средство – рифатируин (тритирелин), стимулирующее продуцирование тиреотропного гормона гипофизом. При недостаточности функции щитовидной железы применяют средство заместительной терапии препарат тиротропин. Эти препараты используются также с диагностической целью, для выявления взаимосвязи заболевания с гипофизом, гипоталамусом или самой щитовидной железой. При недостаточности этого гормона или недостаточности функции щитовидной железы применяется аналог этого гормона (средство заместительной терапии) - тиротропин.

Препарат АКТГ – кортикотропин применяется при функциональной недостаточности коры надпочечников. Кортикотропин вызывает образование антител, поэтому чаще используется его синтетический аналог – тетракозактрин, который дает меньше побочных эффектов. Препараты АКТГ, как и большинство прочих гормональных препаратов, дают много побочных эффектов и противопоказаны при сахарном диабете, язвенной болезни, гипертонии.

Гонадотропные гормоны (фолликулостимулирующий, лютеинизирующий, лютеотропный (лактотропный) стимулируют функции мужских и женских половых

желез. Фоликулостимулирующий гормон способствует созреванию фолликулах в яичниках у женщин и сперматозоидов у мужчин. Лютенизирующий гормон стимулирует образование желтого тела у женщин, у мужчин – интерстициальных клеток семенников вырабатывающих мужские половые гормоны. Лютеотропный (лактотропный) гормон усиливает гормональную функцию желтого тела и стимулирует секрецию молока в послеродовой период.

Во время беременности в плаценте образуются вещества, близкие по действию к гонадотропным гормонам гипофиза, которые выделяются с мочой в большом количестве и из которой получают препараты гонадотропин менопаузный (близкий по действию к фолликулостимулирующему гормону) и гонадотропин хорионический (близкий по действию к лютеинизирующему гормону).

Гонадотропин менопаузный – применяется в качестве средства заместительной терапии у мужчин и женщин при нарушениях половой функции, связанной с недостатком продукции гонадотропных гормонов.

Гонадотропин хорионический применяется у женщин при нарушениях менструального цикла, бесплодии, у мужчин при половом инфантилизме (незрелости в развитии, сохранении в физическом облике или поведении черт, присущих предшествующим возрастным этапам).

Из гипоталамуса выделен также гормон – гонадорелин, стимулирующий высвобождение гонадотропных гормонов гипофиза (фолликулостимулирующего и лютеинизирующего). Синтезированы также его аналоги: леупролид, гитрелин, нафарелин и др., действие которых аналогично гонадорелину. При прерывистом применении этого гормона (или его аналогов) проявляется стимулирующий эффект, при постоянном применении и создании высокой концентрации в крови продуцирование гонадотропных гормонов гипофиза наоборот подавляется.

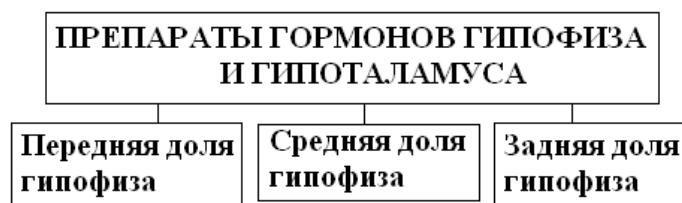
Синтетическим антигормональным препаратом – ингибитором секреции гонадотропных гормонов гипофиза является препарат даназол. Даназол угнетает функцию яичников и сперматогенез, применяется при гинекологических заболеваниях (энометриозе, маточных кровотечениях), гипокомастии у мужчин.

Лакототропный гормон – гормон гипофиза, стимулирует развитие молочных желез и лактацию, регулируется гипоталамусом. Препарат лактотропного гормона – лактин назначают для стимулирования лактации в послеродовой период.

Стимуляторы дофаминовых рецепторов головного мозга леводопа и бромкриптин угнетают секрецию лактотропного гормона, а их антагонисты – блокаторы дофаминовых рецепторов (например, метоклопрамид) – стимулируют и применяются для повышения лактации в послеродовой период.

### **Гормоны задней доли гипофиза**

**Задняя доля гипофиза** вырабатывает два гормона: вазопрессин и окситоцин. Вазопрессин играет важную роль в организме, под его действием суживаются сосуды, повышается артериальное давление, усиливается сокращение гладких мышц кишечника и мочевого пузыря. Вазопрессин также усиливает обратное всасывание (реабсорбцию) воды в почечных канальцах, поэтому имеет название – антидиуретического гормона (АДГ). При недостаточном продуцировании этого гормона развивается заболевание – несахарный диабет, при котором больные испытывают постоянную жажду, резко возрастает диурез (до 20 л жидкости в сутки). Синтетическим производным вазопрессина, превосходящим последний по антидиуретической активности является препарат – десморпрессин.



**Задняя доля содержит два гормона: вазопрессин и окситоцин.**  
**Вазопрессин - суживает сосуды, повышает АД, сокращает гладкие мышцы и мочевой пузырь.**  
**Усиливает реабсорбцию воды. При его недостатке - несахарный диабет (выд. до 10 - 20 л. в сутки).**  
**Окситоцин - вызывает ритмическое сокращение мускулатуры матки в период родов. Лек. препараты: окситацин, дезаминокситацин, питуитрин -вытяжка из задней доли гипофиза (применяется также при несахарном диабете).**

Окситоцин стимулирует ритмические сокращения мускулатуры матки во время родов. В качестве лекарственных препаратов, для стимуляции родовой деятельности, используются: окситоцин и питуитрин (вытяжка из задней доли гипофиза). Питуитрин содержит все гормоны задней доли гипофиза, поэтому эффективен и при несахарном диабете, назначается в виде порошка интраназально, хорошо всасывается через слизистую оболочку носа и оказывает антидиуретическое действие.

#### **Препараты гормонов щитовидной железы и их антагонисты**

Щитовидной железой вырабатываются три гормона: тироксин, трийодтиронин и кальцитонин. Тироксин и трийодтиронин влияют на белковый, углеводный и жировой обмен, кальцитонин – на кальциевый обмен.

Для продуцирования тироксина и трийодтиронина необходим йод, который поступает в организм из внешней среды (с водой, продуктами питания и пр.) и депонируется (накапливается) в щитовидной железе. Процесс продуцирования и выделения гормонов щитовидной железы стимулируется тиреотропным гормоном гипофиза.

Тироксин и трийодтиронин оказывают на организм многостороннее действие:

1. Усиливают окислительные процессы, в результате чего повышается образование тепла в организме;
2. Потенцируют (усиливают) действие адреналина на сосуды и сердце;
3. Повышают возбудимость центральной нервной системы;
4. Малые дозы – способствуют синтезу белка (анаболическое действие), в то время как большие дозы – усиливают распад белка;
5. Усиливают диуретическое (мочевыделительное) действие почек;

Недостаточное продуцирование гормонов щитовидной железы (тироксина и трийодтиронина) ведет к нарушению умственного и физического развития у детей (критинизм), резкому замедлению обменных процессов в организме, развитию отеков органов и тканей у взрослых.

**ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ  
ЖЕЛЕЗЫ**

**Щитовидная железа вырабатывает: тироксин, трийодтиронин (вливают на белковый и углеводный обмен, для их синтеза нужен йод) и кальцитонин (влияет на обмен кальция). Контролируется тиреотропным гормоном гипофиза**

**Тироксин и трийодтиронин: усиливают окислительные процессы; потенцируют действие адреналина; повышают возбудимость ЦНС; усиливают распад белка; усиливают диурез; Недостаток в детском возрасте - кретинизм, у взрослых - мекседема (замедленный обмен веществ). Препараты: тиреоидин, трийодтиронин, тиреокомб. Препараты йода - калия йодид, "Антиструмин"**  
**Кальцитонин - понижает уровень кальция и способствует его отложению в костях. Аналог - ципакальцин.**  
**При гиперфункции гормонов - базедова болезнь. Для лечения применяют - анти-тиротропные препараты: мерказоли, препараты йода (калия и натрия йодид), пропилтиоурацил**

Причинами недостаточности щитовидной железы могут быть врожденные патологии, недостаточность продуцирования тиреотропного гормона гипофиза, а также недостаточное поступлений йода в организм. При недостаточности йода развивается такое заболевание, как зоб (значительное увеличение щитовидной железы). Для лечения недостаточности щитовидной железы назначают заместительную терапию гормональными препаратами: тиреоидином, трийодтиронином, тироксином. Применяются также комплексные стандартизованные препараты щитовидной железы: тиреокомб, тиреотом.

Тиреоидин – порошок высушенной щитовидной железы убойного скота, назначается внутрь, действие начинается через несколько дней и длится около месяца. Трийодтиронин (синтетический препарат) по сравнению с тиреоидином обладает более быстрым и сильным действием.

При недостаточности поступления йода в организм назначают препараты йода (калия йодид и таблетки «Антиструмин»). Для профилактики дефицита йода (недостатке йода в воде, в определенной местности) выпускаются специальные продукты питания, имеющие повышенное содержание йода (например, йодированная соль).

Кальцитонин (тирокальцитонин) – гормон, выделяющийся специальными клетками щитовидной железы. Кальцитонин понижает концентрацию кальция в крови и способствует его отложению в костной ткани, применяется при остеопорозе (остеопороз - хроническом прогрессирующее системное, обменное заболевание скелета или клинический синдром, которое характеризуется снижением плотности костей).

Синтетическими аналогами кальцитонина являются ципакальцин и миакальцик, которые отличаются от кальцитонина более сильным и продолжительным действием.

При гиперфункции щитовидной железы применяются анти-тиреотропные препараты. При постоянном поступлении в кровь большого количества тиреоидных гормонов развивается базедова болезнь, которая характеризуется исхуданием, повышение



температуры тела (вследствие усиления окислительных процессов), учащенным пульсом, повышение содержания сахара в крови и моче, а также раздражительностью. Характерным признаком базедовой болезни является – пучеглазие.

Для лечения этого заболевания применяются антитироидные препараты: мерказолил, препараты йода (калия и натрия йодид), пропилтиоурацил.

Мерказолил и пропилтиоурацил подавляют функциональную активность щитовидной железы), уменьшают концентрацию тиреоидных гормонов в крови. Отрицательным фактором при применении этих препаратов является большое количество побочных эффектов. Так, мерказолил способен вызывать лейкопению, вследствие угнетения лейкопоэза. Его применение требует постоянного контроля компонентного состава крови.

Препараты йода, при лечении базедовой болезни, по эффективности значительно уступают мерказолилу и пропилтиоурацилу. При тяжелых формах базедовой болезни назначают препараты радиоактивного йода, которые частично разрушают щитовидную железу, снижая ее активность.

### **Препараты гормонов паращитовидных желез**

Паращитовидная железа вырабатывает гормон паратиреоидин, регулирующий кальциевый и фосфорный обмен в организме. Паратиреоидин способствует всасыванию кальция в кишечнике и тормозит его выведение почками из организма, а также повышает его концентрацию в крови. Избыток паратиреоидина приводит к «вымыванию» кальция из костной ткани, которая, вследствие этого, теряет прочность.

При недостатке паратиреоидина в организме уровень кальция в крови резко падает, что сопровождается ослаблением сердечных сокращений, появлению тетанических судорог, спазмов гладкой мускулатуры, повышением возбудимости центральной нервной системы. Для устранения этих явлений, вводятся кальция хлорид, а также, в качестве средства заместительной терапии, паратиреоидин (подкожно или внутривенно), который представляет собой вытяжку из паращитовидных желез убойного скота. Действие этого препарата начинается через 4 – 6 часов после введения.

#### **ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ПАРАЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ**

**Вырабатывают гормон - паратиреоидин. Регулирует кальциевый и фосфорный обмен, улучшает всасывание кальция. Избыток приводит к вымыванию кальция из костей, возбуждению ЦНС, ослаблению сердечной деятельности, судороги, спазмы гладких мышц. Препарат - "паратиреоидин" (применяется при судорогах, вводится подкожно или внутривенно).**

Эффективным средством, устраняющим явления, связанные с недостаточностью паратиреоидина и кальция в организме, является - кальция хлорид, который оказывает более быстрый эффект. Поскольку паратиреоидин начинает действовать через достаточно продолжительное время (4 – 6 часов), для быстрого устранения тетанических судорог (перед введением паратиреоидина), вводится раствор кальция хлорида.

Важную роль в кальциевом и фосфорном обмене в организме играют также витамины группы D.

### **Гормоны поджелудочной железы и синтетические гипогликемические средства**

Поджелудочная железа вырабатывает два гормона: инсулин и глюкагон, которые оказывают противоположное действие на организм. Инсулин играет решающую роль в углеводном обмене, способствует усвоению глюкозы через клеточные мембраны внутрь клетки, стимулирует превращение глюкозы в глюкагон и жир, а также синтез белков. Уровень глюкозы в крови, под действием инсулина, снижается, а при недостатке – повышается. Глюкагон – повышает содержание глюкозы в крови. Получают инсулин из поджелудочных желез убойного скота, после чего подвергают биологической очистке. Плохо очищенный препарат может вызвать нежелательные побочные реакции, прежде всего аллергию.

При недостаточности продуцирования инсулина поджелудочной железой затрудняется усвоение глюкозы клетками организма, что ведет к повышению глюкозы в крови (гипергликемия) и выведению ее с мочой (глюкозурия). Такое заболевание называется – сахарным диабетом. При сахарном диабете нарушается углеводный, жировой и белковый обмен, повышается концентрация ацетоуксусной, оксимасляной кислот и ацетона, что приводит к сдвигу pH крови в кислую сторону (ацидоз). При резко выраженном ацидозе больные могут впасть в диабетическую кому, которая, при несвоевременной медицинской помощи, может закончиться смертью больного. Единственным лекарственным средством, способным спасти больного в таком состоянии, является инсулин. Инсулин вырабатывается из поджелудочных желез убойного скота. Полученный препарат подвергается биологической стандартизации, активность инсулина выражается в единицах действия (ЕД).

#### ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ПОДЖЕЛУДОЧНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

Вырабатывается инсулин и глюкагон  
Играют важную роль в углеводном обмене. Инсулин - способствует усвоению глюкозы, понижает ее уровень в крови. Глюкагон - повышает уровень глюкозы в крови. Доза инсулина рассчитывается в ЕД индивидуально, вводится подкожно или внутривенно (при коме). Действие - через 20 - 30 мин, максимум - 2 - 3 часа, продолжительность до 6 часов.  
Инсулин пролонгированного действия: "цинк инсулин суспензия", протамин цинк инсулин, инсулин семиленте (действие до 24 часов). При коме - кусок сахара под язык или 20 - 40 % раствор внутривенно.  
Синтетические заменители - производные сульфонилмочевины: бутамид, хлорпропамид, глибенкламид. Препараты принимаются внутрь, стимулирует секрецию инсулина и тормозят его разрушение в печени. Применяются внутрь, при не тяжелых формах диабета.

Доза каждому больному устанавливается индивидуально, в зависимости от количества сахара выделяющегося с мочой за сутки (1 ЕД инсулина на 4 – 5 г глюкозы). Инсулин вводится подкожно и только при диабетической коме вводится внутривенно. Внутрь инсулин не назначается, поскольку препарат полностью разрушается в желудке. При подкожном введении действие наступает через 20 -30 минут, максимальное действие

достигается через 2 – 3 часа, продолжительность действия инсулина (не пролонгированных форм) – до 6 часов. Препарат, как правило, вводится до еды, 2 – 3 раза в день.

В медицине широко применяются также пролонгированные формы инсулина (продолжительного действия): цинк – инсулин суспензия, протамин-цинк-инсулин и др. (товарные названия инсулин-ленте, инсулин-семилинте, инсулин-ультраленте), нерастворимые в воде суспензии инсулина. Вводятся также как и инсулин, подкожно, препараты медленно рассасываются в месте введения, в связи с чем продолжительность их действия резко возрастает, достигая 24 часов.

При передозировке инсулина уровень глюкозы в крови резко падает, появляется чувство голода, возникают судороги, больной теряет сознание. Такое состояние называется инсулиновой (гипогликемической) комой. Если больной находится в сознании, рекомендуется принять сахар, конфеты, белый хлеб с маслом и пр. При потере сознания в коматозном состоянии – вводится глюкоза внутривенно от 20 до 40 мл 40% раствора. Инсулин (в небольшой дозировке - до 10 ЕЕ), печени и др. случаях, как вспомогательное средство для улучшения питания при истощении.

### Синтетические гипогликемические средства

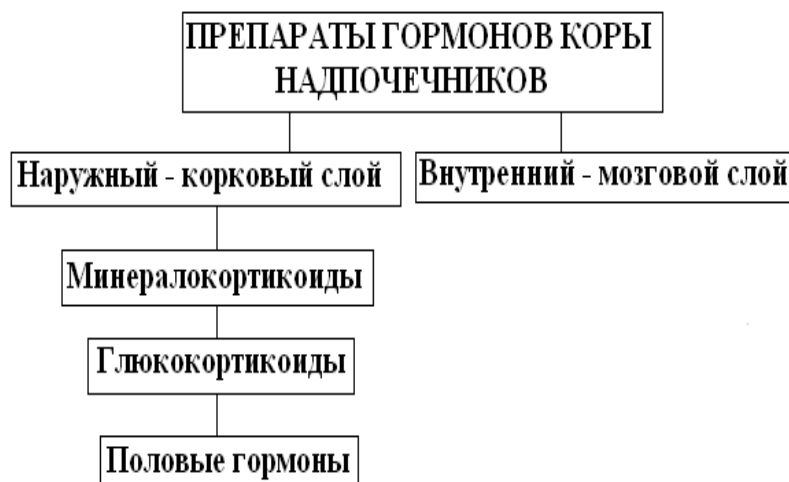
В отличие от лекарственного средства заместительной терапии – инсулина, гипогликемические средства стимулируют секрецию инсулина поджелудочной железой, тормозят разрушение инсулина в печени, а также способствуют лучшему усвоению глюкозы тканями организма. К синтетическим гликогликемическим средствам относятся такие препараты, как бутамид, хлорпропамид, глибенкламид, глинизид, буформин, метформин и др. Достоинством этих средств является также их пероральный способ приема.

Гипогликемические средства эффективны только при легких формах диабета, в этом случае они могут полностью заменить инъекции инсулина. При тяжелых формах диабета препараты этой группы не эффективны и инсулин полностью не заменяют, но в комбинации с инсулином позволяют уменьшить частоту инъекций последнего. Вместе с тем, препараты этой группы дают ряд побочных эффектов, например, лейкопедию, возможны аллергические реакции, а также боли в желудке в связи чем назначаются после еды.

### Препараты гормонов надпочечников

Надпочечники состоят из двух слоев:

1. Внутреннего (мозгового);
2. Наружного (коркового);



Во внутреннем (мозговом) слое вырабатывается адреналин. Наружный (корковый) слой вырабатывает кортикостероиды (стероидные гормоны), которые делятся на три группы:

1. Минералокортикоиды;
2. Глюкокортикоиды;
3. Половые гормоны (незначительно, по сравнению с половыми железами);

### **Минералокортикоиды**

Минералокортикоиды - гормоны, регулирующие водно-солевой обмен в организме. Наиболее активными среди минералокортикоидов являются – альдостерон и дезоксикортикостерон. Эти гормоны способствуют реабсорбции ионов натрия и выведение ионов калия с мочой.

<b>ГОРМОНЫ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ</b>
--

<p><b>Регулируют водно-солевой обмен в организме. Гормоны - альдостерон и дезоксикортикостерон. Способствуют задержке в организме ионов натрия (воды), отекам, повышению АД. При недостатке - организм теряет натрий и воду (обезвоживание), но концентрация калия увеличивается (обезвоживание), мышечная слабость, расстройства сердечной деятельности и нервной системы, окраска кожи - бронзового цвета. Для лечения применяют - дезоксикортикостерон. Препараты: дезоксикортикостерона ацетат и дезокс. триметилацетат, фторгидрокортизона ацетат (внутривенно).</b></p>
---

Избыток альдостерона в организме (альдостеронизм) ведет к образованию отеков и повышению артериального давления. При недостаточности минералокортикоидов развивается адисоновая болезнь, при которой кожа приобретает бронзовую окраску, организм теряет воду и соли натрия, а концентрация калия увеличивается, что ведет к обезвоживанию, падению артериального давления, мышечной слабости, расстройству деятельности сердца и нервной системы, истощению и смерти.

Для лечения адисоновой болезни применяется заместитель альдостерона – дезоксикортикостерон (совместно с глюкокортикоидами). Минералокортикоиды применяются также при хронической недостаточности коры надпочечников, миастении (миастения - аутоиммунное нервно-мышечное заболевание, характеризующееся патологической, быстрой утомляемостью

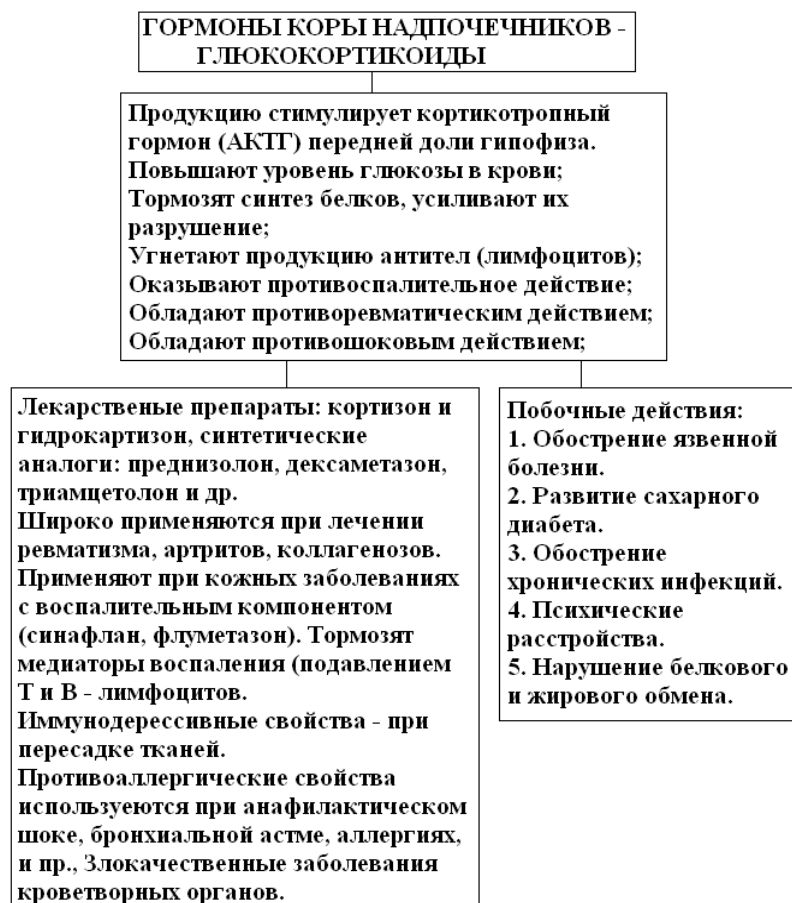
сопровождающаяся значительным уменьшением или полным прекращением двигательной активности). Лекарственными препаратами из группы минералокортикоидов являются: дезоксикортикостерона ацетат, дезоксикортикостерона триметилацетат (парентерально), фторгидрокортизона ацетат (внутривенно). Антагонистами кортикостероидов (кортикостероиды — общее собирательное название подкласса

## Глюкокортикоиды

Глюкокортикоиды – слабо влияют на водно-солевой обмен, вместе с тем оказывают разностороннее действие на организм:

1. Повышают уровень глюкозы в крови, гликогена в печени и мышцах;
2. Способствуют превращению аминокислот в глюкозу;
3. Тормозят синтез белков в организме и усиливают их разрушение;
4. Угнетают развитие лимфоидной ткани и продукцию антител (иммунодепрессивные свойства);
5. Оказывают противовоспалительное, противоаллергическое и десенсибилизирующее действие;
6. Оказывают эффективное противоревматическое действие;
7. Оказывают противошоковое действие;

Продуцирование глюкокортикоидов стимулирует кортикотропный гормон (АКТГ) передней доли гипофиза. Установлено, что при воздействии на организм экстремальных вредных факторов (состояние стресса) уровень глюкокортикоидов в крови значительно возрастает, что способствует адаптации организма к таким экстремальным условиям. При недостаточной продукции глюкокортикоидов в подобных условиях развивается шок.



Чрезмерное продуцирование, в течении продолжительного времени, глюкокортикоидов, либо длительное лечение препаратами этой группы приводит к нарушению углеводного и жирового обмена, повышению артериального давления, появлению отеков.

Лекарственными препаратами из группы глюкокортикоидов являются такие природные соединения как: кортизон и гидрокортизон, а также синтетические аналоги

глюкокортикоидов: преднизолон, дексаметазон, триамцинолон, флуметазон, беклометазон и др. Эти препараты различаются между собой по активности, силе и продолжительности действия, а также проявляемым побочным эффектам.

Глюкокортикоиды имеют широкий спектр терапевтического действия. В качестве средства заместительной терапии их применяют при болезни Аддисона. Кроме того, глюкокортикоиды являются эффективными противовоспалительными и противоаллергическими средствами и применяются для лечения ревматизма других заболеваний (коллагенозов), при которых поражается соединительная ткань, таких как: системная красная волчанка, ревматоидный артрит, склеродермия и пр.

Мази содержащие глюкокортикоиды широко применяются при лечении кожных заболеваний сопровождающихся воспалительным процессом. При применении таких мазей желательно не допускать всасывания препаратов в кровь, с этой целью в состав которых добавляют компоненты препятствующие всасыванию (например, фтор, который входит в состав мази – глюкокортизона). Противовоспалительный эффект этих средств обусловлен торможением медиаторов воспаления.

Глюкокортикоиды применяются в качестве иммунодепрессивных средств при пересадке органов и лечения аутоиммунных заболеваний (в основе аутоиммунных заболеваний лежат реакции иммунитета, направленные против собственных органов или тканей организма). Иммунодепрессивное действие глюкокортикоидов связано с их способностью подавлять активность Т и В – лимфоцитов.

Глюкокортикоиды широко применяются в качестве противоаллергических средств, при лечении аллергических дерматитов, бронхиальной астмы аллергической природы, анафилактическом шоке и др. заболеваниях вызванных аллергической реакцией организма.

Препараты этой группы проявляют способность угнетать развитие лимфоидной ткани и находят применение при лечении злокачественных заболеваний кроветворных органов (лейкозов, лимфогранулематозов и др.).

Благодаря широкому спектру действия и высокой терапевтической активности глюкокортикоиды широко применяются в медицине, вместе с тем способны вызывать множество нежелательных побочных эффектов: вызывать обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки; развитие сахарного диабета, обострение хронических заболеваний, нарушение белкового и жирового обмена, в некоторых случаях психические расстройства.

Длительное применение глюкокортикоидов угнетает секрецию АКТГ в гипофизе, что со временем может вызвать атрофию коры надпочечников, вследствие потери физиологического стимулирования.

Прекращение приема глюкокортикоидов не рекомендуется проводить внезапно, следует постепенно уменьшать дозы во избежание проявления «синдрома отмены», а также периодически назначать определенные дозы АКТГ в качестве средства стимулирующего функции надпочечников.

Противопоказаниями применения глюкокортикоидов являются: сахарный диабет, язвенные заболевания различной природы, гипертоническая болезнь, психические расстройства, болезнь Иценко-Кушинга (заболевание, обусловленное повышенной секрецией адренокортикотропного гормона (АКТГ) гипофиза с последующим повышением функции надпочечников) и др.

Антагонистами глюкокортикоидов являются такие лекарственные препараты как метирапон и митотан (уменьшают продуцирование АКТГ), а также мифепростон, который блокирует действие глюкокортикоидов на уровне рецепторов. Применяются при лечении болезни Иценко-Кушинга и др. заболевания связанных с гиперфункцией коры надпочечников.

## **Препараты половых гормонов**

Половые гормоны частично вырабатываются корой надпочечников, но в основном продуцируются половыми железами – у мужчин – семенниками, у женщин яичниками. Производство половых гормонов регулируется гонадотропными гормонами передней доли гипофиза.



### Препараты женских половых гормонов

Женские половые гормоны делятся на две группы:

1. Эстрогенные (эстрон и эстрадиол);
2. Гестагенные (прогестерон);

Интенсивная продукция женских половых гормонов начинается в 12 – 15 лет и заканчивается в климактерический период - 45 – 50 лет. В период полового созревания эстрогены обеспечивают развитие половых органов, формирование телосложения, распределение волосяного покрова и пр. В этот период повышается чувствительность матки к окситоцину, увеличивается ее объем, усиливается кровоснабжение и подготовка слизистой оболочки матки для внедрения яйцеклетки. Созревание яйцеклетки и продукция эстрогенов происходит в фолликулах яичников под действием фолликулостимулирующего гормона гипофиза. Когда яйцеклетка созревает – фолликула лопается (процесс овуляции), созревшая яйцеклетка попадает в маточную трубу и полость матки.

На месте лопнувшего фолликула образуется желтое тело, которое вырабатывает гестагенный гормон, который способствует прикреплению оплодотворенной яйцеклетки к слизистой оболочке матки (имплантации), развитию плаценты и понижению чувствительности матки к окситоцину.

В случае зачатия желтое тело функционирует до конца беременности, а ее гормоны оказывают стимулирующее влияние на течение беременности. Если оплодотворения не происходит – желтое тело атрофируется, производство гестагенов прекращается, отторгается слизистая оболочка матки которая сопровождается кровотечением (менструация). С прекращением менструации начинает созревать новая яйцеклетка и цикл повторяется.

### Эстрогенные препараты

Эстрогенные препараты применяются при недостаточной функции яичников: отсутствии менструации, бесплодии, слабости родовой деятельности, в климактерическом периоде и др.

Лекарственными препаратами этой группы являются природные эстрогены и их аналоги: эстрон (фолликулин) и эстрадиол, а также их синтетические заменители: этинилэстрадиол, местранол, синестрол, диэтилстильбэстрол и др. Различия между природными и синтетическими эстрагенами заключается в активности, силе и продолжительности действия. Применяются также комбинированные препараты

содержащие эстрагены, гестагены и антиандрогены (антиандрогены - вещества, препятствующие биосинтезу, секреции и действию эндогенного тестостерона на уровне цитоплазматических рецепторов, применяются для лечения истинного преждевременного полового созревания у детей обоего пола (постоянно и длительно) до достижения стабилизации и регресса вторичных половых признаков, прекращения менструации у девочек, особенно в возрасте до 6-7 лет). Это такие лекарственные средства, как прогестерон 21, климара и др.

Применяются также антиэстрогенные препараты, такие как кломифен цитрат, который блокирует эстрогенные рецепторы гипоталамуса – гипофиза, нарушая обратную связь и таким образом активизируя всю систему. Кломифенцитрат в соответствующих дозах применяют как средство, стимулирующее овуляцию, также применяется при лечении бесплодия у женщин.

### ЭСТРОГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

**Применяются при недостаточной функции яичников: отсутствии менструации, бесплодии, слабости родовой деятельности, в климактерическом периоде и др.**  
**Лекарственные препараты:**  
**Природные эстрогены и их аналоги: эстрон (фолликулин) и эстрадиол**  
**Синтетические заменители: этинилэстрадиол, местранол, синестрол, диэтилстильбэстрол и др.**  
**Комбинированные препараты содержащие эстрагены, гестагены и антиандрогены**

**Антиэстрогенные препараты (кломифен цитрат) блокирует эстрогенные рецепторы гипоталамуса – гипофиза, нарушая обратную связь, активизируя всю систему. Стимулируют овуляцию, применяется при лечении бесплодия у женщин. Антиэстрагенные препараты (тамоксифен, торимифен) применяются также при лечении онкологических заболеваний у женщин (рака грудной железы), а также у мужчин при опухолях предстательной железы.**

Антиэстрогенные препараты (тамоксифен, торимифен) применяются также при лечении онкологических заболеваний у женщин (рака грудной железы), а также у мужчин при опухолях предстательной железы.

### Гестагенные препараты

Гестагенные препараты применяют для сохранения беременности при угрозе или начинающихся выкидышах. Кроме того, гестагенные препараты назначаются при нарушениях менструального цикла. В медицине используются синтетические аналоги гестагенов: прогестерон, оксипрогестерона капронат (пролонгированного действия) и прегнин. Эффективным является поочередное принятие препаратов эстрагенов и гестагенов.

К синтетическим аналогам гестагенов относится, например, оксипрогестерона капронат, ацетомепрегенол и др. которые действуют аналогично натуральным гестагенным препаратам. Оксипрогестерона капронат действует более продолжительное время, применяется в виде масляного раствора 1 раз в течение 7 – 14 дней, ацетомепрегенол



применяется в виде таблеток, которые назначаются при угрозе выкидыша по 0,5-1,0 мг 2-3 раза каждый день на протяжении 5 дней. Гестогенные препараты дают ряд побочных эффектов, такие как: тошноту, бессонницу, головные боли др.

Некоторые гестагенные препараты и их синтетические аналоги применяются также в качестве гормональных противозачаточных средств (контрацептивов). К ним относятся: триквилар, ригевидон, нон-овлон, постинор и др. Препараты этой группы угнетают продукцию гонадотропных гормонов гипофиза, что вызывает задержку созревания яйцеклетки, торможение овуляции и делает невозможным зачатие. Для усиления эффекта их обычно комбинируют с небольшими дозами эстрагонных средств. Назначаются эти средства внутрь, в виде таблеток, вечером. Имеются также комбинированные контрацептивные средства: монофазные (марвелон, ригевидон и др.), двухфазные (антеовин), трехфазные (три-регол), а также гестогенные средства (простинар).

### ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

**Применяют для сохранения беременности при угрозе или начинающихся выкидышах. Назначаются при нарушениях менструального цикла.**  
**Используются синтетические аналоги гестагенов: прогестерон, оксипрогестерона капроат (пролонгированного действия) и прегни.**  
**Угнетают продукцию гонадотропных гормонов гипофиза, в связи применяются как гормональные противозачаточные средства: (триквилар, ригевидон, нон-овлон, постинор)**

**Анигестогенным средствам (мифепристон), представляет собой синтетический стероидный антигестаген, повышает сократительную способность миометрия. Препарат применяется для искусственного прерывания беременности.**

Контрацептивы, содержащие большие дозы гормонов оказывают эффект при однократном приеме в течении суток (постинор) и применяются однократно. Гормональные контрацептивы дают ряд негативных побочных эффектов: тошнота, рвота, возможны психические нарушения, противопоказаны при нарушениях функции печени, сердечнососудистых заболеваниях, беременности.

К анигестогенным средствам относится мифепристон. Препарат представляет собой синтетический стероидный антигестаген, повышает сократительную способность миометрия, стимулируя высвобождение интерлейкина-8 в хориодецидуальных клетках и повышая чувствительность миометрия к простагландинам. В результате действия препарата происходит десквамация децидуальной оболочки и выведение плодного яйца. Препарат применяется для искусственного прерывания беременности.

### **Препараты мужских половых гормонов**

Мужские половые гормоны – андрогены, вырабатываются в семенниках. К ним относится, прежде всего, тестостерон. Тестостерон начинает вырабатываться в яичках в период полового созревания и постепенно прекращается в период угасания половой функции. В период полового созревания тестостерон стимулирует формирование мужских половых признаков: развитие скелетной мускулатуры, тембр голоса, рост и распределение волос в районе гениталий и др.

Андрогены активизируют спермогенез (созревание сперматозоидов), а также оказывает анаболическое действие (усиливает синтез белка в мышцах и печени). Кроме

того, андрогены оказывают влияние на центральную нервную систему.

К лекарственным препаратам из группы андрогенов относятся метилтестостерон (таблетки, принимаются сублингвально (под язык)), тестостерона пропионат (внутримышечно, 1 раз в день), тестостерона энонат (применяется внутримышечно, 1 раз в месяц). Препараты этой группы назначаются в качестве средства заместительной терапии при гипофункции половых желез, задержке в половом развитии и др.

Препараты этой группы эффективны при лечении онкологических заболеваний у женщин (раке молочной железы). При их применении у женщин наблюдается явление «мускулизации».

### **Анаболические стероидные препараты**

Анаболические стероиды близки по своему строению к тестостерону и обладают свойствами усиливать синтез белков.

К препаратам этой группы относятся: феноболлин, ретаболил, метиландростендиол, метандростенолон и др.

Анаболические средства применяются при истощении (кахексии), язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, задержке роста у детей, переломах костей и пр.

Применение лекарственных препаратов из группы анаболических стероидов вызывает ряд нежелательных побочных эффектов, таких как мускулизация тела, нарушение менструального цикла у женщин и ряд других явлений сходных с побочными действиями при применении препаратов мужских половых гормонов.

Применение препаратов анаболических стероидов противопоказано при беременности, заболеваниях печени, онкологических заболеваниях и пр.

## Краткая характеристика лекарственных препаратов

### Инсулин (Insulin)

Групповая принадлежность: Гормональное средство, инсулин короткого действия



**Фармакологическое действие:** Инсулин является специфическим сахаропонижающим средством, обладает способностью регулировать углеводный обмен; усиливает усвоение тканями глюкозы и способствует ее превращению в гликоген, облегчает также проникновение глюкозы в клетки тканей. Помимо гипогликемического действия (понижения уровня сахара в крови), инсулин оказывает ряд других эффектов: повышает запасы гликогена в мышцах, стимулирует синтез пептидов, уменьшает расход белка и др. Воздействие инсулина сопровождается стимуляцией или ингибированием (подавлением) некоторых ферментов; стимулируются гликогенсинтаза, пируватдегидрогеназа, гексокиназа; ингибируются липаза, активизирующая жирные кислоты жировой ткани, липопротеиновая липаза, уменьшающая «помутнение» сыворотки крови после приема богатой жирами пищи. Степень биосинтеза и секреции (выделения) инсулина зависит от концентрации глюкозы в крови. При повышении ее содержания усиливается секреция инсулина поджелудочной железой; наоборот, снижение концентрации глюкозы в крови замедляет секрецию инсулина. В реализации эффектов инсулина ведущую роль играют его взаимодействие со специфическим рецептором, локализирующимся на плазматической мембране клетки, и образование инсулинрецепторного комплекса. Инсулиновый рецептор в комплексе с инсулином проникает в клетку, где оказывает влияние на процессы фосфорилирования клеточных белков; дальнейшие внутриклеточные реакции окончательно не выяснены. Инсулин является основным специфическим средством терапии сахарного диабета, так как снижает гипергликемию (повышение содержания глюкозы в крови) и гликозурию (наличие сахара в моче), пополняет депо гликогена в печени и мышцах, уменьшает образование глюкозы, смягчает диабетическую липемию (наличие жира в крови), улучшает общее состояние больного. Активность инсулина определяют биологическим путем (по способности понижать содержание глюкозы в крови у здоровых кроликов) и одним из физикохимических методов (методом электрофореза на бумаге или методом хроматографии на бумаге). За одну единицу действия (ЕД), или интернациональную единицу (ИЕ), принимают активность 0,04082 мг кристаллического инсулина.

**Показания к применению:** Основным показанием к применению инсулина является сахарный диабет I типа (инсулинозависимый), однако в определенных условиях его назначают и при сахарном диабете II типа (инсулинонезависимом).

**Способ применения:** При лечении сахарного диабета пользуются препаратами инсулина разной продолжительности действия. Инсулин короткого действия применяют также при некоторых других патологических процессах: для вызывания гипогликемических состояний (снижения уровня сахара в крови) при определенных формах шизофрении, в качестве анаболического (усиливающего синтез белка) средства при общем истощении, недостатке питания, фурункулезе (множественном гнойном воспалении кожи), тиреотоксикозе (заболеванием щитовидной железы), при заболеваниях желудка (атония /потеря тонуса/, гастроптоз /опущение желудка/), хронических гепатитах (воспалении ткани печени), начальных формах цирроза печени, а также как компонент «поляризующих» растворов, используемых для лечения острой коронарной недостаточности (несоответствия между потребностью сердца в кислороде и его доставкой).

Выбор инсулина для лечения сахарного диабета зависит от тяжести и особенностей течения заболевания, общего состояния больного, а также от скорости наступления и продолжительности сахароснижающего действия препарата. Первичное назначение инсулина и установление дозы желательно проводить в условиях стационара (больницы). Препараты инсулина короткого действия - это растворы, предназначенные для подкожного или внутримышечного введения. При необходимости их вводят также внутривенно. Они обладают быстрым и относительно непродолжительным сахаропонижающим действием. Обычно их вводят подкожно или внутримышечно за 15-20 мин до еды от одного до нескольких раз в течение суток. Эффект после подкожной инъекции наступает через 15-20 мин, достигает максимума через 2 ч; общая продолжительность действия составляет не более 6 ч. Ими пользуются в основном в стационаре для установления необходимой для больного дозы инсулина, а также в тех случаях, когда требуется добиться

быстрого изменения инсулиновой активности в организме - при диабетической коме и прекоме (полной или частичной потере сознания вследствие внезапного резкого повышения уровня сахара в крови).

**Форма выпуска:** Инсулин для введения шприцем выпускается в стеклянных флаконах, герметически закупоренных резиновыми пробками с алюминиевой обкаткой.

### Метформин (Metforminum)

**Групповая принадлежность:** Гипогликемическое средство для перорального применения группы бигуанидов.



**Фармакологическое действие:** Метформин (диметилбигуанид) – противодиабетическое средство для внутреннего применения, которое относится к классу бигуанидов. Эффективность Метформина связана со способностью активного вещества ингибировать глюконеогенез в организме. Активное вещество тормозит транспорт электронов дыхательной цепи митохондрий. Это приводит к уменьшению концентрации АТФ внутри клеток и стимулированию гликолиза, осуществляемого безкислородным путем. В результате этого увеличивается попадание глюкозы в клетки из внеклеточного пространства, увеличивается продукция лактата и пирувата в печени, кишечнике, жировых и мышечных тканях. Так же уменьшаются запасы гликогена в печеночных клетках. Не вызывает гипогликемических эффектов, поскольку не активизирует продукцию инсулина.

**Показания к применению:** Назначается взрослым при сахарном диабете 1 и 2 типа. Метформин применяется в качестве дополнения к основной терапии инсулином или другими противодиабетическими средствами, а так же в виде монотерапии (при сахарном диабете 1 типа используется только в сочетании с инсулином). Особенно рекомендуется при наличии сопутствующего ожирения в случае, когда необходимый контроль за показателями глюкозы в крови не достигается при помощи только адекватной физической активности или диеты.

**Способ применения:** Таблетки метформин глотают целиком, запивая достаточным количеством воды. Прием препарата необходимо осуществлять только после приема пищи. Если пациент испытывает трудности с глотанием таблетки (например, таблетки по 850 мг), то ее разделяют для облегчения приема по риске на 2 части. При этом принимать обе половинки необходимо сразу, одну за другой. Начальная дозировка Метформина – 1000 мг/сутки. Разделение суточной дозировки на 2 или 3 приема может приводить к значительному ослаблению побочных действий со стороны пищеварительной системы. Доза Метформина через 10–15 дней может быть постепенно увеличена. Дозу препарата подбирают с учетом данных глюкозного профиля пациента. Поддерживающая дозировка – ль 1500 до 2000 мг/сутки. Максимально допустимая доза – 3000 мг/сутки.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые пленочной оболочкой, по 500; 850 мг. В блистере – 30; 120 таблеток.

### Ретаболил, масляный раствор (Retabolil, Nandrolon)

**Групповая принадлежность:** Анаболическое стероидное средство



**Фармакологическое действие:** Нандролон деканоат (действующее вещество) медленно высвобождается с места инъекции и попадает в кровь. Ретаболил является синтетическим производным тестостерона. В отличие от тестостерона обладает более выраженным анаболическим и менее выраженным андрогенным действием. Способствует синтезу нуклеиновых кислот, белков, вызывает задержку азота, кальция, натрия, калия, хлорида и фосфата. Активирует репаративные процессы в эпителии, костной и мышечной тканях.

Ретаболил стимулирует выработку эритропоэтина и стимулирует эритропоэз, обеспечивает защиту костного мозга от угнетающего воздействия цитотоксических агентов, что при одновременном применении препаратов железа проявляется противоанемическим действием.

При соблюдении рекомендованных доз андрогенный эффект (например, вирилизация) наблюдается редко.

**Показания к применению:** реконвалесценция после тяжелых травм, интоксикаций, инфекционных заболеваний, обширных оперативных вмешательств; анемия в результате хронической почечной недостаточности (в составе комплексной терапии).

**Способ применения и дозы:** *Анемия:* еженедельно, внутримышечно - женщинам по 100 мг - мужчинам по 200 мг.

Терапевтический эффект носит индивидуальный характер. Лечение следует прекратить в случае отсутствия терапевтического эффекта после 3-6 мес. применения.

После соответствующего улучшения картины крови или нормализации её следует постепенно снизить дозу под регулярным контролем гематологических показателей. Ухудшение показателей во время снижения дозы или после окончания лечения может служить показанием к возобновлению лечения.

*Реконвалесценция:* по 50 мг каждые 3-4 недели, внутримышечно, глубоко в мышцу.

**Форма выпуска:** 1 мл масляного раствора для инъекций в бесцветной стеклянной ампуле. 1 ампула в пластмассовой форме, в картонной коробке с приложенной инструкцией по применению.

### L-тироксин (L-thyroxin)

**Групповая принадлежность:** Гормональное, тиреоидное средство



**Фармакологическое действие:** Левотироксин, входящий в состав препарата, по действию аналогичен эндогенным тиреоидным гормонам человека. В организме левотироксин метаболизируется до лиотиронина, который, попадая в клетки и ткани, способен регулировать развитие и рост клеток, влиять на обмен веществ. В частности, препарат способен влиять на окислительный обмен в митохондриях и выборочно регулировать поток катионов внутри и вне клетки. Препарат увеличивает потребность тканей в кислороде, стимулирует окислительные реакции, ускоряет расщепление и обмен белков, жиров и углеводов, активизирует функции сердечно-сосудистой системы, оказывает стимулирующее действие на центральную нервную систему. В больших дозах препарат угнетает выработку гипоталамусом тиреотропин-релизинг фактора, таким образом, снижая выработку тиреотропного гормона гипофизом. Клиническое проявление действия препарата при гипотиреозе наблюдается уже на 3-5 сутки после начала терапии. На протяжении 3-6 месяцев, при условии непрерывной терапии левотироксином, уменьшается или полностью исчезает диффузный зоб.

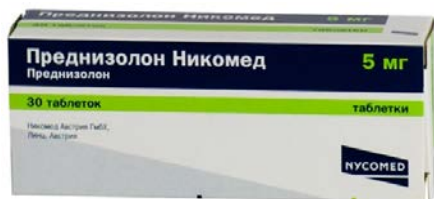
**Показания к применению:** Препарат используют для заместительной терапии при гипотиреозах различной этиологии, в том числе первичные и вторичные гипотиреозы после оперативных вмешательств на щитовидной железе и после курса терапии радиоактивным йодом. Как заместительная терапия при врожденном и приобретенном гипотиреозе. При микседеме, кретинизме, ожирении с проявлениями гипотиреоза. При церебрально-гипофизарных заболеваниях. Для профилактики при рецидивирующем узловом зобе после резекций при ненарушенной функции щитовидной железы. В монотерапии диффузного эутиреоидного зоба. При эутиреоидной гиперплазии щитовидной железы. В комбинированной терапии диффузного токсического зоба после компенсаций тиреотоксикоза тиреостатическими препаратами.

**Способ применения:** Всю дозу препарата принимают за один раз, желательно утром, натощак за 30 минут до приема пищи, запивая достаточным количеством воды. Грудным детям таблетку измельчают и растворяют в небольшом количестве воды, образовавшуюся суспензию дают за 30 минут до первого утреннего кормления, готовить суспензию необходимо непосредственно перед приемом. Дозу препарата подбирают индивидуально, учитывая вес, возраст, тяжесть и характер заболевания, лабораторные показатели, характеризующие функциональное состояние щитовидной железы. Обычно начальная доза для взрослых при гипотиреозе и эутиреоидном зобе 25-100мкг в сутки, далее дозу постепенно увеличивают каждые 2-3 недели на 25-50мкг до достижения поддерживающей дозы.

**Форма выпуска:** Таблетки по 25, 50 или 100мкг по 50 таблеток в блистере, по 1 или 2 блистера в картонной упаковке.

### Преднизолон (Prednisolonum)

**Групповая принадлежность:** Глюкокортикостероид



**Фармакологическое действие:** Преднизолон является синтетическим аналогом выделяемых корой надпочечника гормонов кортизона и гидрокортизона. Преднизолон в 4—5 раз более активен по сравнению с кортизоном и в 3—4 раза по сравнению с гидрокортизоном при применении внутрь. В отличие от кортизона и гидрокортизона преднизолон не вызывает заметной задержки натрия и воды и лишь незначительно повышает выделение калия. Препарат оказывает выраженное противовоспалительное, антиаллергическое, антиэкссудативное, противошоковое, антитоксическое действие.

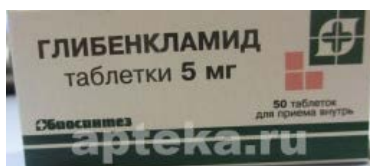
**Показания к применению:** Коллагенозы (общее название болезней, характеризующихся диффузным поражением соединительной ткани и сосудов), ревматизм, инфекционный неспецифический полиартрит (воспаление нескольких суставов), бронхиальная астма, острый лимфобластный и миелобластный лейкоз (злокачественная опухоль крови, возникшая из кроветворных клеток костного мозга), инфекционный мононуклеоз (острое инфекционное заболевание, протекающее с высоким подъемом температуры, увеличением небных лимфоузлов, печени), нейродермиты (заболевание кожи, обусловленное нарушением функции центральной нервной болезни), экзема (нейроаллергическое заболевание кожи, характеризующееся мокнущим, зудящим воспалением) и другие кожные заболевания, различные аллергические заболевания, болезнь Аддисона (снижение функции надпочечников), острая недостаточность коры надпочечников, гемолитическая анемия (снижение содержания гемоглобина в крови вследствие повышенного распада эритроцитов), гломерулонефрит (заболевание почек), острый панкреатит (воспаление поджелудочной железы); шок и коллапс (резкое падение артериального давления) при хирургических вмешательствах; для подавления реакции отторжения при гомотрансплантации (пересадке от одного человека другому) органов и тканей.

**Способ применения:** Доза устанавливается индивидуально. В острых состояниях и в качестве вводимой дозы обычно применяют 20-30 мг в сутки (4-6 таблеток). Поддерживающая доза составляет 5-10 мг в сутки (1-2 таблетки). При некоторых заболеваниях (нефрозе -заболевании почек, характеризующееся поражением почечных канальцев с развитием отеков и появлением белка в моче/, некоторых ревматических заболеваниях) назначают в более высоких дозах. Лечение прекращают медленно, постепенно снижая дозу. Если в анамнезе (истории болезни) имеются указания на психозы, в высоких дозах назначают под строгим контролем врача. Доза для детей обычно составляет 1-2 мг на кг массы тела в сутки в 4-6 приемов. При назначении преднизолона следует учитывать суточный секреторный ритм глкжокортикоидов (ритм выделения гормонов коры надпочечников): утром назначают большие дозы, днем - средние, вечером - малые. При шоке 30-90 мг преднизолона вводят внутривенно медленно или капельно. При других показаниях преднизолон назначают в дозе 30-45 мг внутривенно медленно. Если внутривенное вливание затруднено, то препарат можно вводить глубоко в мышцу. По показаниям преднизолон вводят повторно в дозе 30-60 мг, внутривенно или внутримышечно. После купирования (снятия) острого состояния назначают преднизолон внутрь в таблетках, постепенно уменьшая дозу.

**Форма выпуска:** Таблетки, содержащие 0,001; 0,005; 0,02 или 0,05 г преднизолона в упаковке по 100 шт. Ампулы по 25 и 30 мг в 1 мл в упаковке по 3 штуки. Ампулы с 1 мл суспензии для инъекций, содержащие преднизолона 25 или 50 мг, в упаковке по 5, 10, 50, 100 и 1000 штук. 0,5% мазь в тубах по 10 г. 0,5% глазная взвесь в упаковке по 10 мл.

### **Глибенкламид (Glibenclamidum)**

**Групповая принадлежность:** Гипогликемическое средство для перорального применения группы сульфонилмочевины II поколения



**Фармакологическое действие:** Подобно другим противодиабетическим производным сульфонилмочевины является стимулятором бета-клеток поджелудочной железы (клеток, вырабатывающих инсулин). По сравнению с препаратами первого поколения (бутамил, хлорпропамид и др.) отличается большей активностью (эффект наступает при значительно меньших дозах), быстрой всасываемостью, относительно

хорошей переносимостью. Максимальная концентрация в крови после однократного приема обнаруживается через 1-2 ч, длительность действия -8-12 ч. В некоторых случаях эффективен при резистентности (устойчивости) к другим препаратам этой группы. Наряду с гипогликемическим (снижающим уровень сахара в крови) эффектом глибенкламид оказывает гиполипидемическое (снижающее уровень холестерина в крови) действие и снижает тромбогенные свойства крови (способность крови к свертыванию).

**Показания к применению:** Инсулинонезависимый сахарный диабет средней тяжести без наличия выраженных микрососудистых осложнений.

**Способ применения:** Принимают внутрь после еды 1-2 раза в день. Дозу подбирают индивидуально в зависимости от течения заболевания и эффективности терапии. Начинают с 0,001-0,0025-0,005-0,01 г (2,5-5,0-10,0 мг) в день. Иногда дозу приходится увеличивать до 0,015-0,02 г в сутки. При нормализации содержания глюкозы в крови устанавливают поддерживающую дозу, обычно 0,005-0,01 г, иногда 0,0024-0,0075 г в сутки. Если суточная доза 0,015-0,02 г не дает эффекта в течение 4-6 нед., следует считать, что препарат для данного больного недостаточно эффективен; в этих случаях переходят на комбинирование глибенкламида с бигуанидами, а при малом эффекте такой комбинации - к применению инсулина.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,005 г (5 мг) в упаковке по 20 штук.

### Дексаметазон (Dexamethasonum)

**Групповая принадлежность:** Глюкокортикостероид



**Фармакологическое действие:** Глюкокортикостероидный гормон (гормон коры надпочечников, влияющий на углеводный и белковый обмен), обладающий сильным антиаллергическим и противовоспалительным свойством (в 35 раз активнее кортизона).

**Показания к применению:** Циркуляторный коллапс (резкое падение артериального давления): шок во время или после хирургической операции, травма, потеря крови, инфаркт миокарда, ожоги. Тяжелые инфекции: токсемия (наличие в крови токсинов - веществ, способных привести к заболеванию или гибели организма), сосудистый коллапс (резкое падение артериального давления) при менингококковой инфекции (менингите - гнойном воспалении оболочек мозга), септицемия (форма заражения крови микроорганизмами), дифтерия, брюшной тиф, пневмония (воспаление легких), грипп, перитонит (воспаление брюшины), эклампсия (токсикоз второй половины беременности). Экстренные аллергические состояния: астматический статус (затянувшийся приступ бронхиальной астмы, не поддающийся лечению обычно применяемыми больным лекарственными средствами), отек гортани, дерматоз (кожное заболевание), острая анафилактическая реакция (аллергическая реакция немедленного типа) на лекарственные препараты (в том числе, антибиотики), переливание сыворотки, пирогенные реакции (повышение температуры тела).

**Способ применения:** В остром периоде заболевания и в начале лечения препарат применяют в более высоких дозах. При достижении эффекта дозировка снижается с интервалом в несколько дней до достижения поддерживающей дозы или до прекращения лечения. Режим дозирования индивидуальный. В тяжелых случаях и в начале лечения применяют до 10-15 мг препарата в сутки, поддерживающая доза может составлять при этом 2-4,5 мг и более в сутки. При астматическом статусе и острых аллергических заболеваниях можно применять 2-3 мг дексаметазона в сутки в течение непродолжительного времени. При лечении небольшими дозами препарат назначают однократно утром.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,5 мг в упаковке по 50 штук; ампулы по 1 мл, содержащие 4 мг дексаметазона в упаковке по 5 штук.

### Синэстрол (synoestrolum)

**Групповая принадлежность:** Эстрогенов аналог нестероидной структуры



**Фармакологическое действие:** Синэстрол является синтетическим соединением - производным стилибена. По химическому строению отличается от стероидных эстрогенных гормонов (женских половых гормонов), но по биологическим и лечебным свойствам близок к ним. Эстрогены - женские половые гормоны, вырабатываемые яичниками и корковым слоем надпочечников, вызывают развитие женских половых органов, вторичных половых признаков, а также способствуют пролиферации (разрастанию) клеток эндометрия (внутреннего слоя матки). Синэстрол по эстрогенной активности (действию, подобному действию женских половых гормонов - эстрогенов) равноценен фолликулину: 1 мг синэстрола соответствует 10 000 ЕД.

**Показания к применению:** У женщин в основном такие же, как показания к применению фолликулина. Иногда назначают при гипертрофии (увеличении объема) и раке предстательной железы у мужчин.

**Способ применения:** Вводят внутримышечно, под кожу и внутрь; внутримышечно и под кожу - в масляных растворах, внутрь - в таблетках. При введении внутрь синэстрол быстро всасывается; не разрушается в желудочно-кишечном тракте.

При гипогенитализме (недоразвитии наружных половых органов), врожденной аменорее (отсутствии менструаций) и резко недоразвитой матке применяют по 0,001-0,002 г (1-2 мг) внутримышечно или по 0,002 г (2 мг) внутрь ежедневно в течение 4-6 нед. и более. При наличии эффекта назначают затем прогестерон (по 5 мг в день внутримышечно) или прегнин (по 10 мг 3 раза в день внутрь) в течение 6-8 дней. В случае необходимости курсы гормонотерапии проводят повторно. При вторичной аменорее (прекращении нормальных менструальных циклов на период более 6 месяцев) назначают по 1-2 мг синэстрола в день в течение 15-20 дней, затем в течение 6-8 дней - прогестерон или прегнин в указанной дозе. При гипоолигоменорее (скудных кратковременных - не более 2 дней - менструациях) препарат назначают по 1 мг внутримышечно или внутрь каждый день или через день в течение первой половины межменструального периода; при бесплодии на почве недоразвития матки - по 1 мг внутримышечно или 1-2 мг внутрь в первые 7-8 дней после менструации; при климактерических расстройствах назначают внутрь по 0,0005-0,001 г (0,5-1 мг). Продолжительность лечения индивидуализируют.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,001 г (1 мг); 0,1% (1 мг в 1 мл) и 2% (20 мг в 1 мл) масляные растворы в ампулах по 1 мл; 2% раствор применяют только для лечения больных со злокачественными новообразованиями.

### Окситоцин (Oxytocin)

**Групповая принадлежность:** Родовой деятельности стимулятор-препарат окситоцина



**Фармакологическое действие:** Обладает стимулирующим действием на гладкую мускулатуру матки, повышает сократительную активность и тонус миометрия (мышечного слоя матки), способствует сокращению миоэпителиальных клеток (специальных секреторных клеток), окружающих альвеолы (структурно-функциональные образования) молочных желез (что облегчает продвижение молока в крупные протоки и молочные синусы), обладает слабыми вазопрессиноподобными антидиуретическими свойствами (усиливает обратное всасывание воды почками, т.е. уменьшает мочеотделение).

**Показания к применению:** Индукция (стимуляция) родов по медицинским показаниям; стимуляция родовой деятельности; кесарево сечение (во время операции); атония (потеря тонуса) матки и атонические (связанные с потерей тонуса матки) кровотечения (для профилактики и лечения); недостаточная инволюция матки (обратное развитие после родов) и лохиометр (задержка послеродовых маточных выделений вследствие снижения сократительной способности матки или спазма /резкого сужения просвета/ ее шейки).



**Способ применения:** Обычно более предпочтительной является внутримышечная инъекция препарата. Если внутримышечное введение не дает результата или нужен незамедлительный эффект, то прибегают к внутривенному введению окситоцина, которое следует осуществлять медленно. Окситоцин назначают внутримышечно или внутривенно в дозе 1-3 МЕ. При кесаревом сечении вводят в мускулатуру матки в дозе 5 МЕ. По гинекологическим показаниям назначают подкожно или внутримышечно в дозе 5-10 МЕ. Перед введением окситоцина шприц, в случае хранения его в спирте, необходимо промыть в дистиллированной воде.

**Форма выпуска:** Ампулы по 1 мл и 2 мл (5 ЕД и 10 ЕД) в упаковке по 5 штук.

#### Мерказолил (Тиамазол Thiamazole)



**Групповая принадлежность:** Антитиреоидное средство

**Фармакологическое действие:** Антитиреоидный препарат; нарушает синтез гормонов щитовидной железы, блокирует фермент пероксидазу, участвующую в йодировании тиронина в щитовидной железе с образованием моноидтиронина и дийодтиронина, а затем трийод- и тетраидтиронина, снижает внутреннюю секрецию Т4. Снижает основной обмен, ускоряет выведение из щитовидной железы йодидов, повышает реципрокную активацию синтеза и выделения гипофизом ТТГ, что сопровождается некоторой гиперплазией щитовидной железы. Скорость наступления эффекта зависит от исходной концентрации Т3 и Т4, но обычно концентрация гормонов нормализуется через 7 нед постоянного назначения препарата по 30 мг или через 4 нед при использовании дозы 40 мг. Через 5 дней после отмены концентрация гормонов может снова повышаться.

**Показания:** Тиреотоксикоз (диффузная струма). Предоперационный период, для предварительного и промежуточного лечения дополнительно к радиойодтерапии, послеоперационные рецидивы тиреотоксикоза, узловой зоб.

**Способ применения и дозы:** Внутрь, после еды. При легких и средних формах тиреотоксикоза - по 5 мг 3-4 раза в день. После наступления ремиссии (через 3-6 нед) суточную дозу уменьшают через каждые 5-10 дней на 5-10 мг и постепенно подбирают минимальные дозы (5 мг 1 раз в день, через день или 1 раз в 3 дня), которые назначают до получения стойкого терапевтического эффекта. При тяжелой форме тиреотоксикоза - по 40-60 мг/сут в 3-4 приема, после улучшения состояния 5-20 мг/сут. Курс - 1-1.5 года. Вышие дозы для взрослых: разовая - 10 мг, суточная - 60 мг. Беременным - в максимально низких дозах - 2.5-10 мг; детям - 0.3-0.5 мг/кг, поддерживающие дозы для детей - 0.2-0.3 мг/кг; поддерживающие дозы - однократно, утром после завтрака.

**Форма выпуска:** Препарат Мерказолил выпускается в таблетках. Фасовки следующие: - 50 табл./банка/упаковка; - 100 табл./банка/упаковка; - 40 табл./блистерная расфасовка/упаковка.

#### Метилпреднизолон (Methylprednisolonum)

**Групповая принадлежность:** Глюкокортикостероид



**Фармакологическое действие:** Аналог преднизолона. По активности близок к преднизолону, но практически не обладает минералокортикоидной (натрий задерживающей) активностью, что обеспечивает лучшую переносимость. Он медленно всасывается при внутримышечном введении и оказывает более продолжительный эффект, чем гидрокортизон и преднизолон.

**Показания к применению:** Коллагенозы (общее название болезней, характеризующихся диффузным поражением соединительной ткани и сосудов), ревматизм, инфекционный неспецифический полиартрит (воспаление нескольких суставов), бронхиальная астма, острый лимфобластный и миелобластный лейкоз (злокачественная опухоль крови, возникшая из кроветворных клеток костного мозга), инфекционный мононуклеоз (острое вирусное заболевание, протекающее с высоким подъемом температуры, увеличением небных лимфоузлов, печени), нейродермиты (заболевания кожи, обусловленные нарушением функции

центральной нервной системы), экзема (нейроаллергическое заболевание кожи, характеризующееся мокнущим, зудящим воспалением) и другие кожные заболевания, различные аллергические заболевания, болезнь Аддисона (снижение функции надпочечников), острая недостаточность коры надпочечников, гемолитическая анемия (повышенный распад эритроцитов в крови), гломерулонефрит (заболевание почек), острый панкреатит (воспаление поджелудочной железы), шок и коллапс (резкое падение артериального давления) при хирургических вмешательствах; для подавления реакции отторжения при гомотрансплантации органов и тканей (пересадке органов или тканей одного человека другому).

**Способ применения:** При бронхиальной астме назначают внутрь, начиная с 12-40 мг в сутки; поддерживающая доза - 4-12 мг в сутки. При хронических полиартритах (воспалении нескольких суставов) назначают, начиная с 6-20 мг в сутки. При ревматизме начинают с дозы 0,8-1,5 мг/кг, затем ее постепенно снижают. В зависимости от заболевания суточная доза составляет в среднем 0,004-0,048 г метилпреднизолон. Назначение больших доз может потребоваться при рассеянном склерозе (системном заболевании оболочек нервных клеток головного и спинного мозга) - до 0,2 г/день, отеке мозга - 0,2 г/день, трансплантации (пересадке) органов - до 0,007 г/день. Если препарат применялся длительно, его отмену следует производить постепенно.

**Форма выпуска:** Выпускается в таблетках по 0,004 г (4 мг), 0,016 г (16 мг), 0,032 г (32 мг) и 0,1 г (100 мг).

### Глипизид (Glipizide)

**Групповая принадлежность:** Гипогликемическое средство для перорального применения группы сульфонилмочевины II поколения



**Фармакологическое действие:** По действию весьма близок к глибенкламиду. Хорошо всасывается. Максимальная концентрация в крови наблюдается через 1-2 ч после приема. Отличается малым периодом полураспада (временем, за которое разлагается 1/2 дозы лекарственного препарата) - 3-4 ч при 5-7 ч у глибенкламида и 30-40 ч у хлорпропамида. Быстро выводится из организма, в связи с чем уменьшена опасность кумуляции (накопления в организме).

**Показания к применению:** Такие же, как для других противодиабетических производных сульфонилмочевины (диабет II типа /инсулинонезависимый/).

**Способ применения:** Начальная доза составляет обычно 2,5-5 мг (0,2-1 таблетка) в день, в дальнейшем увеличивают дозу на 1/2-1 таблетку до достижения оптимальной поддерживающей дозы. Максимальная доза - 30 мг (6 таблеток) в день. Малые дозы принимают 1 раз в день, дозы свыше 15 мг - в 2-3 раза.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,005 г (5 мг) в упаковке по 30 штук.

### Кортикотропин (Corticotropinum)

**Групповая принадлежность:** АКТГ

**Фармакологическое действие:** Гормон, образующийся в базофильных клетках передней доли гипофиза (железы внутренней секреции, расположенной в мозге). Кортикотропин является физиологическим стимулятором коры надпочечников. Он вызывает усиление биосинтеза (образования в организме) и выделение в ток крови кортикостероидных гормонов (гормонов, вырабатываемых корковым слоем надпочечников), главным образом глюкокортикоидов, а также андрогенов (мужских половых гормонов). Одновременно уменьшается содержание в надпочечниках аскорбиновой кислоты, холестерина. Между выделением кортикотропина из передней доли гипофиза и концентрацией гормонов коры надпочечников в крови существует тесная связь. Усиление выделения кортикотропина начинается при падении концентрации (содержания) кортикостероидов в крови и тормозится, если содержание кортикостероидов повышается до определенного уровня. Лечебное действие кортикотропина сходно с действием глюкокортикостероидов (гормонов коры надпочечников, влияющих на углеводный и белковый обмен). Он оказывает антиаллергическое и противовоспалительное действие, обладает иммунодепрессивной (подавляющей защитные силы организма) активностью, вызывает атрофию (уменьшение массы с ослаблением функции в результате нарушения питания) соединительной ткани, влияет на углеводный, белковый обмен и на другие

биохимические процессы. **Показания к применению:** Ранее кортикотропин широко применяли для лечения ревматизма, инфекционных неспецифических полиартритов (воспаления нескольких суставов), бронхиальной астмы, острого лимфобластного и миелобластного лейкоза (злокачественных опухолей крови, возникших из кроветворных клеток костного мозга), нейродермита (заболевания кожи, обусловленного нарушением функции центральной нервной системы), экземы (нейроаллергического заболевания кожи, характеризующегося мокнутием, зудящим воспалением), различных аллергических и других заболеваний. В настоящее время для этих целей обычно применяют глюкокортикоиды, а также нестероидные препараты (противовоспалительные, противогистаминные и антиаллергические препараты и др.). В основном кортикотропин применяют при вторичной гипопункции (ослаблении деятельности) коры надпочечников, для предупреждения атрофии надпочечников и развития "синдрома отмены" (ухудшения самочувствия после резкого прекращения приема лекарственного средства) после длительного лечения кортикостероидными препаратами. Вместе с тем кортикотропин продолжает оставаться эффективным средством для лечения указанных заболеваний. Кортикотропин используют также для исследования функционального состояния гипоталамо-гипофизарно-надпочечниковой системы.

**Способ применения:** Вводят кортикотропин обычно в мышцы. При приеме внутрь препарат неэффективен, так как разрушается ферментами желудочно-кишечного тракта. При введении в мышцы он быстро всасывается. Действие однократной дозы длится при введении в мышцу 6-8 ч, поэтому инъекции повторяют 3-4 раза в сутки. В редких случаях для получения быстрого и более сильного эффекта допускается внутривенное капельное введение раствора кортикотропина, для чего препарат разводят в 500 мл изотонического раствора натрия хлорида. Длительное непрерывное применение кортикотропина для лечебных целей нецелесообразно, так как может привести к истощению коры надпочечников.

**Форма выпуска:** В герметически закупоренных флаконах с резиновой пробкой и металлической обкаткой, содержащих 10-20-30-40 ЕД кортикотропина. Раствор для инъекций готовят *ex tempore* (перед употреблением) растворением порошка в асептических (стерильных) условиях в стерильном изотоническом растворе натрия хлорида.

#### **Дезоксикортикостерона ацетат (Desoxycorticosteroniacetas)**

**Групповая принадлежность:** Глюкокортикостероид

**Фармакологическое действие:** Минералокортикостероид (гормон коры надпочечников, регулирующий минеральный обмен). Обладает свойствами гормона коры надпочечников: вызывает задержку в организме ионов натрия и повышает выделение калия, приводя к повышению содержания жидкости в тканях. Способствует увеличению объема плазмы и повышению артериального давления. Повышает тонус и улучшает работоспособность мышц.

**Показания к применению:** Болезнь Аддисона (недостаточная функция надпочечников) и временное понижение функции коры надпочечников (гипокортицизм); миастения (мышечная слабость), астения (повышенная утомляемость), адинамия (резкое уменьшение объема движений), гипохлоремия (пониженное содержание хлора в крови) и др.

**Способ применения:** Внутримышечно от 0,005 г 3 раза в неделю до 0,01 г ежедневно, при острой недостаточности коры надпочечников по 5-10 мг 4 раза в сутки. Высшие дозы внутримышечно для взрослых: разовая - 0,01 г, суточная - 0,025 г. При гипокортицизме сублингвально (под язык) по 2,5-5 мг ежедневно или через день.

**Форма выпуска:** Таблетки для сублингвального применения по 0,005 г в упаковке по 50 штук; ампулы по 1 мл 0,5% раствора в упаковке по 10 штук.

#### **Метилтестостерон (Methyltestosteronum)**

**Групповая принадлежность:** Андроген



**Фармакологическое действие:** Гормональный препарат, обладающий андрогенной (подобной действию мужских половых гормонов) активностью, но по эффективности несколько уступает тестостерона пропионату.

**Показания к применению:** Половое недоразвитие, функциональные нарушения в половой сфере; климактерии у мужчин (период жизни, наступающий после 50 лет, когда мужчины не в состоянии воспроизводить потомство) и связанные с ним сосудистые и нервные расстройства; дисфункциональные

маточные кровотечения (маточные кровотечения, вызванные нарушением функции яичников в предклимактерическом и климактерическом периодах у женщин); рак молочной железы и яичников.

**Способ применения:** При первичном евнухоидизме (недоразвитии или отсутствии вторичных половых органов) и гипогенитализме (недоразвитии наружных половых органов) на почве врожденного недоразвития половых желез или хирургического их удаления назначают по 0,02-0,03 г препарата (иногда больше) в день. При умеренных формах гипогенитализма достаточны дозы 0,02-0,025 г (20-25 мг) ежедневно или через день. Лечение проводят в течение длительного времени в зависимости от тяжести заболевания и эффективности лечения. Для лечения импотенции (полового бессилия) в связи с функциональной недостаточностью половых желез, переутомлением и нервным истощением назначают по 0,01-0,02 г в день. При климактерическом синдроме принимают внутрь по 0,005-0,015 г в течение 1-2 мес., при аденоме (доброкачественной опухоли) предстательной железы в начальной стадии - по 0,02-0,03 г в течение 1-2 мес.; лечение повторяют в зависимости от течения процесса. При задержке полового развития, инфантилизме (болезненном состоянии у подростков, характеризующемся задержкой физического и/или психического развития) и отставании роста у детей (мальчиков) и подростков назначают метилтестостерон по 0,005-0,01 г (5-10 мг) в день; длительность лечения зависит от получаемого эффекта. При раке молочных желез и яичников принимают по 0,05-0,1 г в день. Высшие дозы для взрослых: разовая - 0,05 г, суточная - 0,1 г.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,005 и 0,01 г в упаковке по 10 штук.

### Тиреоидин (Thyreoidinum)

**Групповая принадлежность:** Тиреоидное средство



**Фармакологическое действие:** В малых дозах дает анаболический эффект (усиливает синтез белка), в больших приводит к усилению распада белка, тормозит тиреотропную активность гипофиза (регуляцию гормонами гипофиза функции щитовидной железы) и понижает функцию щитовидной железы. Действие тиреоидина связано с наличием в нем двух гормонов: тироксина и трийодтиронина. Оба гормона оказывают сходное многогранное влияние на организм, повышают потребность тканей в кислороде, усиливают энергетические процессы, стимулируют рост и дифференцировку тканей, влияют на функциональное состояние нервной и сердечно-сосудистой систем, печени, почек и других органов и систем, усиливают всасывание глюкозы и ее утилизацию (усвоение). Эффект тиреоидных гормонов может меняться в зависимости от дозы. Так, небольшие дозы тироксина оказывают анаболический эффект, большие же дозы приводят к усиленному распаду белка. В больших дозах тиреоидные гормоны тормозят тиреотропную активность гипофиза.

**Показания к применению:** Первичный гипотиреоз (снижение функции щитовидной железы) и микседема (резкое угнетение функции щитовидной железы, сопровождающееся отеками); кретинизм (врожденная недостаточность функции щитовидной железы, характеризующаяся резким снижением умственного и физического развития); церебрально-гипофизарные заболевания (сочетанное заболевание тканей мозга и гипофиза, как правило, характеризующееся снижением выделения гипофизом гормонов) и ожирение, протекающее с гипотиреозом (снижением функции щитовидной железы); эндемический зоб (заболевание щитовидной железы, сопровождающееся ее увеличением, вследствие пониженного содержания йода в воде) и спорадический зоб (увеличение щитовидной железы, как правило, без выраженного нарушения ее функции, развивающееся у лиц вне эндемичных по зобу районов /районов с пониженным содержанием йода в воде/); рак щитовидной железы.

**Способ применения:** Назначают тиреоидин внутрь. Дозы должны тщательно индивидуализироваться с учетом возраста больного, характера и течения заболевания. Принимают внутрь в первую половину дня.

Взрослым при микседеме и гипотиреозе назначают вначале 0,05-0,2 г в сутки, затем дозу уточняют, добиваясь нормализации пульса, основного обмена, холестерина крови. При диффузном эутиреоидном спорадическом и эндемическом зобе доза составляет от 0,1 до 0,2 г в день, затем в процессе лечения при уменьшении размера железы суточную дозу снижают до 0,05-0,1. При токсическом зобе (заболевании,

характеризующемся увеличением щитовидной железы и повышением ее функции, проявляющемся экзофтальмом /смещением глазного яблока вперед с расширением глазной щели - "пучеглазостью"/, учащенными сердцебиениями, похуданием) принимают от 0,05 г через день до 0,15-0,2 г в сутки (вместе с антитиреоидными препаратами). Вышие дозы для взрослых внутрь: разовая - 0,3 г, суточная - 1 г; для детей в возрасте до 6 мес.: разовая - 0,01 г, суточная - 0,03 г; от 6 мес. до 1 года: разовая - 0,02 г, суточная - 0,06 г; в возрасте 2 лет: разовая - 0,03 г, суточная - 0,09 г; 3-4 лет: разовая - 0,05 г, суточная - 0,15 г; 5-6 лет: разовая - 0,075 г, суточная - 0,25 г; 7-9 лет: разовая - 0,1 г, суточная - 0,3 г; 10-14 лет: разовая - 0,15 г, суточная - 0,45 г. Детям в возрасте до 1 года назначают в виде гранул (смешивают с 2-3 ложками воды или киселя).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г и по 0,1 г в упаковке по 50 штук.

### Актрапид НМ (Actrapid NM)

**Групповая принадлежность:** Инсулин короткого действия



**Фармакологическое действие:** Имеет моноконпонентную структуру. Препарат короткого действия: действие препарата начинается через 30 мин. Максимум действия достигается между 2,5-5 часами после введения. Действие препарата продолжается 8 часов. Всасывается на месте введения более быстро по сравнению с актрапидом и актрапидом МС.

**Показания к применению:** Инсулинозависимые формы сахарного диабета. Учитывая быстрое наступление эффекта при применении этого препарата, актрапид НМ назначают пациентам с тяжело протекающим диабетическим кетоацидозом (закислением из-за избыточного содержания в крови кетоновых тел), при опасности возникновения комы (потери сознания), при предстоящем оперативном вмешательстве. Применяют у пациентов, имеющих аллергические реакции на другие виды инсулиновых препаратов или страдающих липодистрофией (уменьшением объема жировой ткани в подкожной клетчатке).

**Способ применения:** Доза препарата определяется врачом в каждом индивидуальном случае в соответствии с состоянием больного. При применении актрапида НМ в чистом виде он обычно назначается 3 раза в сутки (возможно до 5-6 раз). Препарат можно вводить подкожно, внутримышечно или внутривенно. В течение 30 минут после введения препарата необходимо принять пищу. При индивидуальном подборе инсулинотерапии возможно применять актрапид НМ в сочетании с длительно действующими инсулинами. Актрапид НМ можно смешивать в одном шприце с другими высокоочищенными инсулинами. При смешивании с цинковыми суспензиями инсулина, инъекцию необходимо сделать немедленно. При смешивании с длительнодействующими инсулинами актрапид НМ необходимо первым набрать в шприц. Сопутствующее применение кортикостероидов, ингибиторов МАО, гормональных противозачаточных средств, алкоголя, терапия гормонами щитовидной железы могут повлечь за собой повышение потребности в инсулине.

**Форма выпуска:** Ампулы по 10 мл.

### Синаflan (Sinaflanum)

**Групповая принадлежность:** Глюкокортикостероид для местного применения



**Фармакологическое действие:** Синафлан – препарат группы топических глюкокортикостероидов. Флуоцинолона ацетонид – вещество, полученное синтетическим путем, которое обладает фармакологической активностью аналогичной глюкокортикостероидам. Флуоцинолона ацетонид обладает высокой глюкокортикоидной активностью и практически не оказывает минералокортикоидного действия. Препарат при местном применении оказывает противовоспалительное, противоаллергическое и противовоспалительное действие, кроме того, препарат способствует местной вазодилатации. Основным механизмом действия препарата является ингибирование фосфолипазы А2. Угнетение активности этого фермента предотвращает превращение арахидоновой кислоты в фармакологически активную форму. За счет снижения активности арахидоновой кислоты происходит уменьшение количества лейкотриенов и простагландинов, являющихся основными медиаторами воспаления. Препарат за счет снижения высвобождения гистамина из тучных клеток угнетает развитие реакций гиперчувствительности. При применении препарата Синафлан уменьшается риск развития экссудативных реакций, так как активное вещество препарата способствует сужению просвета сосудов. Препарат влияет на белковый обмен, в частности, приводит к уменьшению синтеза белка и отложения коллагена.

**Показания к применению:** Препарат применяют при заболеваниях кожных покровов, которые требуют терапии глюкокортикостероидами, в том числе: - псориаз; - красный плоский лишай и дискоидная красная волчанка; - себорейные поражения кожных покровов; - экзематозные поражения различной локализации; - нейродермит; - аллергические кожные заболевания и кожный зуд различной этиологии; - ожоги первой степени, в том числе солнечные ожоги; - укусы насекомых.

**Способ применения:** Препарат применяют 1-3 раза в день. Мазь наносят тонким слоем, несколько втирая. Курс лечения препаратом 5-10 дней, при необходимости курс лечения может быть продлен до 25 дней. Не рекомендуется применять мазь Синафлан на больших участках кожи или на участках, где чувствительность кожи повышена, в том числе наносить мазь на лицо и кожные складки.

**Форма выпуска:** Мазь в тубах по 10г, по 1 тубе в картонной упаковке.

### Тамоксифен (Tamoxifenum)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, антиэстроген



**Фармакологическое действие:** Механизм антиэстрогенного (препятствующего образованию или действию женских половых гормонов) действия тамоксифена объясняется его способностью конкурентно связываться с эстрогенными рецепторами (участками клеточной оболочки, с которыми взаимодействуют женские половые гормоны) в органах-мишенях и препятствовать таким образом образованию эстрогенрецепторного комплекса с эндогенным лигандом (взаимодействующим с рецепторами биологическим веществом, вырабатываемым в организме) - 17-бета-эстрадиолом.

**Показания к применению:** Как противоопухолевое средство тамоксифен применяют при раке молочной железы у женщин в постменопаузальном периоде (состоянии организма после климактерического периода характеризующемся снижением функции женских половых желез и обратным развитием половых органов);

при раке эндометрия (внутренней оболочки матки), а также при ановуляторном бесплодии (бесплодии, обусловленном отсутствием созревания яйцеклеток в яичниках).

**Способ применения:** Назначают внутрь в виде таблеток. При раке молочной железы принимают по 20-40 мг 1-2 раза в день; при раке эндометрия - по 30-40 мг 1-2 раза в день; при ановуляторном бесплодии по 10 мг 2 раза в день в течение 4 дней подряд, начиная со 2-го дня менструации. При последующих 4-дневных циклах можно увеличивать дозы до 20-40 мг 2 раза в день.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,01 г (10 мг); 0,02 г (20 мг); 0,04 г (40 мг).

### **Ретаболил (RetaboU)**

**Групповая принадлежность:** Анаболическое стероидное средство



**Фармакологическое действие:** Оказывает сильное и длительное анаболическое (усиливающее синтез белка) действие. Обладает еще меньшим андрогенным действием, (подобным действию мужских половых гормонов) а также вирилизующим (вызывающим появление у женщин мужских черт /огрубление голоса, развитие мускулатуры и т. д./, действием чем нандролон фенилпропионат.

**Показания к применению:** Нарушение белкового обмена при астении (слабости), кахексии (крайней степени истощения) различного происхождения, после тяжелых травм, операций, ожогов; инфекционные и другие заболевания, сопровождающиеся потерей белка (инфекции, ожоги, лучевая терапия, длительное применение кортикостероидов и др.); при остеопорозе (нарушении питания костной ткани, сопровождающемся увеличением ее ломкости), в педиатрической (детской) практике при задержке роста, анорексии (отсутствии аппетита), упадке питания и т. д. В связи с длительностью действия (относительно редкие инъекции) препарат удобен для лечения детей.

**Способ применения:** Вводят внутримышечно в виде масляного раствора взрослым по 0,025-0,05 г (25-50 мг) 1 раз в 2-3 нед.; на курс - 8-10 инъекций. Детям вводят 1 раз в 3-4 нед.: при массе тела 10 кг - 0,005 г (5 мг), 10-20 кг - 0,0075 г (7,5 мг), 20-30 кг - 0,01 г (10 мг), 30-40 кг - 0,015 г (15 мг), 40-50 кг - 0,02 г (20 мг), более 50 кг - 0,025 г (25 мг). В случае выпадения в ампуле осадка ее необходимо подогреть (без вскрытия) в горячей воде до полного растворения осадка. Применять следует только совершенно прозрачный раствор.

**Форма выпуска:** 5% раствор (50 мг) и масле в ампулах по 1 мл.

## Витаминные и ферментные средства.

### Общие сведения о витаминах, антивитаминах и ферментах

**Витамины** (от лат. *vita*- «жизнь») — группа низкомолекулярных органических соединений относительно простого строения и разнообразной химической природы. Это сборная по химической природе группа органических веществ, объединённая по признаку абсолютной необходимости их для гетеротрофного организма в качестве составной части пищи. Автотрофные организмы также нуждаются в витаминах, получая их либо путем синтеза, либо получая из окружающей среды. Так, витамины входят в состав питательных сред для выращивания организмов фитопланктона. Витамины содержатся в пище (или в окружающей среде) в очень малых количествах, и поэтому относятся к микронутриентам. Витамины принимают участие в синтезе различных ферментов, регулирующих обмен веществ и функцию различных органов.

Первый витамин (тиамин) был выделен польским ученым К. Функом в 1911 г. Функ установил, что в молекуле тиамин имеет аминогруппу, поэтому предложил назвать группу веществ «жизненные амины» или «витамины». Впоследствии было установлено, что не все витамины содержат аминогруппы, но название «витамины» закрепилось за веществами, обладающими витаминной активностью.

Витамины являются веществами необходимыми для жизнедеятельности, Большинство витаминов поступает в организм человека с растительной и животной пищей. При полноценном питании, нормальном функционировании желудочно-кишечного тракта и умеренных нагрузках организм не испытывает недостатка в витаминах. Но при интенсивной физической и умственной работе, инфекционных заболеваниях, неполноценном питании, а также беременности и пр. потребность в витаминных резко возрастает.

При недостаточности витаминов возникают различные тяжелые функциональные расстройства организма. С нарушением поступления витаминов в организм связаны 3 принципиальных патологических состояния: недостаток витамина — гиповитаминоз, отсутствие витамина — авитаминоз, и избыток витамина — гипervитаминоз. Нарушения зависят от вида недостающего (или избыточного) витамина, а также степени недостаточности (избыточности) и других значимых факторов. Так, при недостаточности поступления в организм какого либо витамина с пищей (гиповитаминозе) нарушения функций организма могут не проявляться, при полном же его отсутствии (авитаминозе) возникают тяжелые функциональные изменения с опасными для здоровья и жизни последствиями, которые в значительной степени исчезают при возобновлении поступления витаминов в организм.

Наука изучающая структуру и механизмы действия витаминов, а также их применение в лечебных и профилактических целях, называется **витаминологией**.

Витамины участвуют во множестве биохимических реакций, выполняя каталитическую функцию в составе активных центров большого количества разнообразных ферментов либо выступая информационными регуляторными посредниками, выполняя сигнальные функции экзогенных прогормонов и гормонов.

Витамины не являются для организма поставщиком энергии и не имеют существенного пластического значения. Однако витаминам отводится важнейшая роль в обмене веществ.

Большинство витаминов не синтезируются в организме человека. Поэтому они должны регулярно и в достаточном количестве поступать в организм с пищей или в виде витаминно-минеральных комплексов и пищевых добавок. Исключения составляют витамин К, достаточное количество которого в норме синтезируется в толстом кишечнике человека за счёт деятельности бактерий, и витамин В<sub>3</sub>, синтезируемый бактериями кишечника из аминокислоты триптофана.

Известно около полутора десятков витаминов. Исходя из растворимости, витамины делят на жирорастворимые — А, D, Е, F, К и водорастворимые — все остальные (В, С и др.). Жирорастворимые витамины накапливаются в организме, причём их депо являются жировая ткань и печень. Водорастворимые витамины в существенных количествах не депонируются (не накапливаются) и при избытке выводятся с водой. Это объясняет то, что гиповитаминозы довольно часто встречаются относительно водорастворимых витаминов, а гипervитаминозы чаще наблюдаются относительно жирорастворимых витаминов.

Витамины отличаются от других органических пищевых веществ тем, что не включаются в структуру тканей и не используются организмом в качестве источника энергии (не обладают калорийностью).

#### Антивитамины

**Антивитамины** (греч. *Nti* — против, , лат *vita* — жизнь) — группа органических соединений, подавляющих биологическую активность витаминов.

Это соединения, близкие к витаминам по химическому строению, но обладающие противоположным биологическим действием. При попадании в организм антивитамины включаются вместо витаминов в реакции обмена веществ и тормозят или нарушают их нормальное течение. Это ведёт к витаминной недостаточности даже в тех случаях, когда соответствующий витамин поступает с пищей в достаточном количестве или образуется в самом организме. Антивитамины известны почти для всех витаминов.



Например, антивитамином витамина В1 (тиамина) является пириитамин, вызывающий явления полиневрита.

### Поливитамины

**Поливитамины** (греч. πολύ — много, лат. *Vita* — жизнь) — фармакологические препараты или естественные многокомпонентные полидисперсные вещества, содержащие в своём составе комплекс витаминов и минеральные соединения.

Единственным натуральным пищевым поливитамином является грудное молоко, в котором содержится ценный набор из многих эссенциальных витаминов. Для профилактики гиповитаминозов, в особенности у детей, рекомендуется использовать комплексные витаминные препараты. Поливитаминовые препараты применяются не только для профилактики и лечения гиповитаминозов, но и в комплексной терапии таких расстройств питания, как гипотрофия или паратрофия.

Высокий уровень метаболизма у детей, не только поддерживающий жизнедеятельность, но и обеспечивающий рост и развитие детского организма, требует достаточного и регулярного поступления не только витаминов, но и минералов.

### Необходимые нормы витаминов для человека

Буквенное обозначение витамина	Название	Растворимость Ж – жирорастворимый В – водорастворимый	Последствие авитаминоза	Верхний допустимый уровень	Суточная потребность
А <sub>1</sub> ; А <sub>2</sub>	Ретинол, дигидроретинол	Ж	Куриная слепота, ксерофтальмия	3000 мкг	900 мкг
В <sub>1</sub>	Тиамин	В	Бери - бери	-	1,5 мг
В <sub>2</sub>	Рибофлавин	В	Арибофлавиноз	-	1,8 мг
В <sub>3</sub> ; РР	Никотинамид, никотиновая кислота, ниацин	В	Пеллагра	60 мг	20 мг
В <sub>4</sub>	Холин	В	Расстройства печени	20 г	425-550 мг
В <sub>5</sub>	Пантотеновая кислота, кальция пантотенат	В	Боли в суставах, выпадение волос, судороги конечностей, параличи, ослабление зрения и памяти	-	5 мг
В <sub>6</sub>	Пиридоксин	В	Анемия, головные боли, утомляемость, дерматиты и др. кожные заболевания, кожа лимонно-жёлтого оттенка, нарушения аппетита, внимания, памяти, работы сосудов	25 мг	2 мг
В <sub>7</sub> , Н	Биотин	В	Поражения кожи, исчезновение аппетита, тошнота, отечность языка, мышечные боли, вялость, депрессия	-	50 мкг
В <sub>8</sub>	Инозит	В	Нет данных	-	500 мг
В <sub>9</sub> , В <sub>с</sub> , М	Фолиевая кислота	В	Фолиево-дефицитная анемия, нарушения в развитии	1000 мкг	400 мкг

			спинальной трубки у эмбриона		
B <sub>10</sub>	п-аминобензойная кислота, ПАБ	В	Стимулирует выработку витаминов кишечной микрофлорой. Входит в состав <u>фолиевой кислоты</u>	-	-
B <sub>11</sub> , B <sub>T</sub>	Левокарнитин	В	Нарушения метаболических процессов	-	300 мкг
B <sub>12</sub>	<u>Цианокобаламин</u>	В	Пернициозная анемия	-	3 мкг
B <sub>13</sub>	<u>Оротовая кислота</u>	В	Различные кожные заболевания (экзема, нейродермит, псориаз, ихтиоз)	-	0,5 – 1,5 мг
B <sub>15</sub>	<u>Пангамовая кислота</u>	В	B <sub>12</sub> фолиеводефицитная анемия	-	10–150 мг
С	Аскорбиновая кислота	В	Цинга	2000 мг	90 мг
D <sub>1</sub> D <sub>2</sub> D <sub>3</sub> D <sub>4</sub> D <sub>5</sub>	Ламистерол; Эргокальциферол; Холекальциферол; Дигидротахистерол; дегидротахисте-рол	Ж	Рахит, остеомалация	50 мкг	10-15 мкг
Е	α-, β-, γ-токоферолы	Ж	Нервно-мышечные нарушения: спинально-мозжечковая атаксия (атаксия Фридрейха), миопатии. анемия	300 мг	15 мг
F	Смесь триглицеридов жирных кислот Омега-3 и Омега-6	Ж	Атеросклероз, замедление развития, ускоренное старение тканей	-	-
K <sub>1</sub> , K <sub>2</sub>	<u>Филлохинон</u> <u>Фарнохинон</u>	Ж	Гипокоагуляция	-	120 мкг
N	Липоевая кислота	В	Необходима для нормального функционирования печени	-	30 мг
P	Биофлавоноиды, полифенолы	В	Ломкость капилляров	-	-
U	Метионин S-метилметионинсульфоний-хлорид	В	Противоязвенный фактор; витамин U (от лат. <i>ulcus</i> — язва)	-	-

### Ферменты

Ферменты (энзимы) — это специфические белки, играющие роль биологических катализаторов; вырабатываются клетками живых организмов.

Ферменты отличаются от обычных катализаторов своей большей специфичностью (см. ниже), а также способностью ускорять течение химических реакций в условиях нормальной жизнедеятельности организма.

Ферменты присутствуют во всех живых клетках — животных, растительных, бактериальных. Большинство ферментов находится в тканях в ничтожных концентрациях, однако известны случаи, когда

ферментативной активностью обладает белок, составляющий значительную часть клеточной плазмы, например миозин в мышечной ткани. Молекулярный вес ферментов колеблется в широких пределах: от нескольких тысяч до нескольких миллионов, причем однотипные ферменты, но выделяемые из разных источников, могут иметь различный молекулярный вес, отличаться последовательностью аминокислотного состава.

Ферменты, обладающие одинаковым каталитическим действием, но отличающиеся по своим физико-химическим свойствам, называются изоферментами (изоэнзимами). Ферменты могут быть простыми или сложными белками. Последние, кроме белка (апофермента), имеют в своем составе и небелковый компонент — остаток органической молекулы или неорганический ион. Легко отделяемый от апофермента небелковый компонент называют коферментом. Прочно связанная с ферментом небелковая часть называется простетической группой. Многие простетические группы и коферменты являются производными витаминов, пигментов и др. Ферменты обладают строгой специфичностью по отношению к субстрату (т. е. избирательно взаимодействует с теми или иными химическими веществами и соединениями). Например, лактаза (находится в кишечном соке) расщепляет только дисахарид-лактозу и производные лактозы (лактобионовую кислоту, лактоуреиды и др.) с образованием смеси глюкозы и галактазы; мальтаза расщепляет мальтозу на две молекулы глюкозы, а амилаза действует только на крахмал, гликоген и другие полисахариды.

В результате последовательного действия перечисленных, а также других ферментов углеводы пищевых продуктов превращаются в моносахариды и всасываются кишечной стенкой. Специфичность ферментов определяется тем, что они вступают во взаимодействие с определенной химической группировкой субстрата. Например, пепсин (см.) действует на белки, расщепляет связи, находящиеся внутри полипептидной цепи молекулы белка, при этом молекула белка расщепляется на полипептиды, которые затем под действием других ферментов — трипсина (см.), химотрипсина (см.) и пептидаз могут расщепляться до аминокислот.

Специфичность ферментов играет, таким образом, важную биологическую роль; благодаря ей в организме достигается последовательность течения химических реакций. Неорганические ионы активируют ряд ферментов; некоторые ферменты (металлоферменты) вообще неактивны, если отсутствует тот или иной, специфичный для данного фермента ион. Участки ферментов, ответственные за локализацию и активацию субстрата в ферментативном процессе, называют активными центрами ферментов. В образовании активного центра участвуют специфические аминокислотные остатки белковой молекулы, сульфгидрильные группы и простетические группы, если они имеются. Так, в состав ферментов, носящих групповое название флавопротеидов, в качестве простетической группы входит флавиновое производное (обычно это флавинадениндинуклеотид — ФАД). Легко окисляясь и восстанавливаясь, флавиновые простетические группы выполняют функцию биологических переносчиков водорода, например при дегидрировании аминокислот с участием кислорода или при дегидрировании с участием цитохромов в митохондриях начальных компонентов дыхательной цепи (таких, как сукцинат, холин, саркозин и др.). Аналогичные функции выполняют и другие дыхательные пигменты (гемоглобин и миоглобин — у высших животных и человека, а также гемэритрин, эритрохроокрин, гемоцианин и другие — у низших животных). Все эти ферменты объединяет наличие в составе активного центра атомов металла (железа или меди).

### Препараты витаминов

Витаминные препараты применяются при их недостатке в организме (лечении гиповитаминозов и авитаминозов), для лечения заболеваний симптомы которых сходны с признаками гипо и авитаминозов, а также в целях профилактики инфекционных заболеваний (прежде всего вирусной природы).

Все витаминные препараты классифицируются по их растворимости — на водорастворимые и жирорастворимые.

#### ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНОВ

**Препараты водорастворимых витаминов: В1 (тиамин); В2 (рибофлавин); С (аскорбиновая кислота) и др.**

**Препараты жирорастворимых витаминов: А1, А2 (ретинол, дигидроретинол); D1 (эргокальциферол); Е (токоферол) и др.**

#### Препараты водорастворимых витаминов

К группе водорастворимых относятся витамины: В<sub>1</sub> (тиамин); В<sub>2</sub> (рибофлавин); В<sub>3</sub>; РР (никотинамид, никотиновая кислота, ниацин); В<sub>4</sub> (холин); В<sub>5</sub> (пантотеновая кислота, кальция пантотенат); В<sub>6</sub> (пиридоксин); В<sub>7</sub>, Н (биотин); В<sub>8</sub> (инозит); В<sub>9</sub>, В<sub>с</sub>, М (фолиевая кислота); В<sub>10</sub> (п-аминобензойная кислота, ПАБ); В<sub>11</sub>, В<sub>т</sub> (левокарнитин); В<sub>12</sub> (цианокобаламин); В<sub>13</sub> (оротовая кислота); В<sub>15</sub> (пангамовая кислота); С (аскорбиновая кислота); Р рутин; N (липовая кислота); U (метионин, S-метилметионинсульфоний-хлорид) и др.

Витамин В<sub>1</sub> (тиамин) содержится в зерновых злаках, дрожжах, а также в продуктах животного происхождения (печени). В организме тиамин трансформируется в кокарбоксилазу, которая, в свою очередь, является необходимым компонентом в углеводном обмене. Кокарбоксилаза способствует декарбоксилированию пировиноградной кислоты, что имеет особенно важное значение в функционировании нервных тканей, а также в работе сердечной мышцы и скелетной мускулатуры.

Недостаточность витамина В<sub>1</sub> ведет к увеличению содержания молочной и пировиноградной кислот в организме, нарушению углеводного обмена, и, как следствие, нарушениям работе сердца и нервной системы (тахикардия, отдышка, бессонница, головные боли и т.д.). При гиповитоминозе витамина В<sub>1</sub> развивается заболевание под названием «бери-бери», с характерными признаками в виде расстройств желудочно-кишечного тракта и сердечной деятельности, а также нарушений нервной системы и параличей.

Лекарственными препаратами витамина В<sub>1</sub> являются: тиамин бромид, тиамин хлорид, а также кокарбоксилаза, которые назначают при заболеваниях сердечно-сосудистой системы, а также язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки.

При применении препаратов витамина В<sub>1</sub> могут проявляться аллергические реакции, особенно при совместном применении с витамином В<sub>12</sub>.

Витамин В<sub>2</sub> (рибофлавин) встречается в растительной и животной пище: злаках, горохе, молоке, мясе, яйцах и др. В организме витамин В<sub>2</sub> способствует выработки ферментов принимающих участие в окислительно-восстановительных процессах. Особенно важную роль рибофлавин играет в нормальном функционировании сетчатки глаза. Кроме того витамин В<sub>2</sub> стимулирует рост и регенерацию тканей организма. При недостаточности витамина В<sub>2</sub> нарушается зрение, атрофия сосочков языка, а также появляются трещины в углах рта.

В медицине лекарственные препараты витамина В<sub>2</sub> применяется при лечении заболеваний глаз, кожных болезней а также заболеваний сердечнососудистой системы (инфаркт миокарда и др.).

Витамин В<sub>5</sub> (кальция пантотенат) содержится во многих продуктах питания: горохе, печени, яйцах, дрожжах и пр. Витамин В<sub>5</sub> является необходимым элементом углеводного и жирового обмена.

Витамин В<sub>6</sub> (пиридоксин) содержится в продуктах питания: мясе, печени, яичном желтке, горохе, дрожжах и пр. В незначительном количестве этот витамин вырабатывается микрофлорой кишечника. Витамин В<sub>6</sub> способствует жировому обмену, а также участвует в обмене аминокислот. При недостаточности витамина В<sub>6</sub> нарушается работа центральной нервной системы, проявляются в. Кроме того, возникают воспалительные заболевания кожи и слизистых оболочек.

В качестве лекарственного средства витамин В<sub>6</sub> применяется при язвенных заболеваниях двенадцатиперстной кишки, при токсикозах, уменьшения побочного действия некоторых лекарственных препаратов. Пиридоксин и др. препараты витамина В<sub>6</sub> способны вызывать аллергические реакции.

Витамин РР, В<sub>3</sub> (кислота никотиновая), содержится во многих пищевых продуктах: мясе, рыбе, хлебе, дрожжах и пр. Аналогичные с никотиновой кислотой свойства проявляет лекарственный препарат – никотинамид. Витамин РР в организме принимает

участие в биосинтезе ферментов - необходимых компонентов различных окислительно-восстановительных процессов организма. Гиповитоминоз витамина РР приводит к тяжелому заболеванию – пеллагре, для которого характерно: расстройства желудочно-кишечного тракта (изнуряющая диарея), воспалительные заболевания кожи и слизистых оболочек, развитие дистрофии, а также деменция (ослаблении памяти). Кроме прочего, витамин РР оказывает стимулирующее влияние на эритропоэз, и расширяет периферические сосуды (на коже лица и верхней половине тела).

Никотиновая кислота применяется в качестве дополнительного средства при лечении заболеваний сердечнососудистой системы, заболеваниях печени, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, а также острых и хронических отравлений.

При гипervитоминозе никотиновая кислота вызывает покраснение лица, головокружение, чувство жара, крапивницу и пр. При отмене препарата эти явления достаточно быстро проходят.

Витамин В<sub>12</sub> (цианокобаламин), содержится в печени (особенно рыбьей), в значительно меньших количествах в мясе. В незначительной степени витамин синтезируется микрофлорой кишечника.

В организме витамин В<sub>12</sub> играет важную роль в эритропоэзе (продуцировании эритроцитов крови). При его недостатке развивается заболевание под названием «гиперхроманная анемия». Кроме того, витамин В<sub>12</sub> усиливает процессы регенерации тканей, стимулирует деятельность нервной системы и работу печени.

Витамин В<sub>15</sub> (пангамовая кислота, кальция пангамат), в организме устраняет явление гипоксии, способствуя усвоению кислорода. Применяется при лечении заболеваний сердечнососудистой системы атеросклероза и пр.

Витамин В<sub>9</sub> (кислота фолиевая) частично синтезируется микрофлорой кишечника, а также поступает в организм с пищей, содержится в томате, бобах и пр. Витамин В<sub>9</sub> принимает участие в синтезе аминокислот нуклеиновых кислот, обмене холина, а также в эритропоэзе (совместно с витамином В<sub>12</sub>). Витамин В<sub>9</sub> применяют в комплексной терапии при лечении анемий, лейкопении, туберкулезе (кишечника), гастритов.

Витамин С (аскорбиновая кислота) содержится в продуктах растительного происхождения: овощах, фруктах, ягодах. Значительное количество витамина С содержится в цитрусовых и плодах шиповника. Витамин С принимает участие в углеводном обмене, в синтезе гормонов коры надпочечников, стимулирует регенерацию тканей, способствует укреплению стенки капилляров, способствует обезвреживанию ядов и пр.

Недостаток витамина С в пище вызывает тяжелое заболевание – цингу, при которой прежде всего поражаются кровеносные сосуды, нарушается свертываемость крови сопровождающееся кровоточивостью десен и выпадением зубов, кровоизлияниями в ткани организма, а также понижению иммунитета и устойчивости к инфекциям.

Кислоту аскорбиновую назначают при гипо и авитаминозе витамина С, а также в качестве общеукрепляющего средства при лечении многих заболеваний. Избыток витамина С ведет к нарушениям функции почек и поджелудочной железы, повышению артериального давления, аллергическим реакциям.

Рутин (обладает Р витаминной активностью) – содержится во многих растениях. В сочетании с аскорбиновой кислотой (витамином С) уменьшает проницаемость и ломкость капилляров.

Метионин S-метилметионинсульфония-хлорид (витамин U) – является донором метильных групп, необходимых для процесса регенерации в тканях организма, стимулирует заживлению ран, язв, слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта.

### **Препараты жирорастворимых витаминов**

К жирорастворимым витаминам относятся: витамин А (ретинол), витамин D (эргокальциферол), витамин Е (токоферол), витамин К (филлохинон).

Витамин А (ретинол) – содержится в продуктах животного происхождения – сливочном масле, яичном желтке, печени и пр, особенно много витамина А в печени трески. В продуктах растительного происхождения (моркови, зеленом луке, красном перце и пр.) содержится предшественник витамина А – каротин, который в организме биотрансформируется в витамин А.

Витамин А способствует нормальному обмену веществ а также росту и развитию организма в детском и юношеском возрасте, обеспечивает деятельность зрительного пигмента сетчатки глаза, улучшает зрение, повышает устойчивость организма к инфекционным заболеваниям и пр. При недостатке витамина А прежде всего поражается зрение, нарушается способность различать предметы в темноте и сумерках (гемералония или куриная слепота), роговица глаза становится сухой, воспаленной с возможными изъязвлениями ( кератит, керотомалиция).

В качестве лекарственного препарата витамина А применяют ретинола ацетат, продукты содержащие большое количество этого витамина: рыбий жир, печень трески, масло облепихи, а также лекарственные препараты из группы ретиноидов: весаноид (противоопухольный препарат), третиноин (применяется при остром промиелоцитарном лейкозе) и пр. Препараты витамина А назначаются в качестве дополнительного средства при лечении трофических язв, ожогов.

---

При гипервитаминозе витамина А возможны: головная боль, тошнота, рвота, выпадение волос и пр.

Витамин D<sub>2</sub> (эргокальциферол) D<sub>3</sub> (холекальциферол) содержатся в большом количестве в печени трески, рыбьем жире, а также в сливочном масле, яичном желтке. Витамин D синтезируется в организме человека (в коже) под влиянием ультрафиолетовых лучей.

В организме витамин D регулирует кальциевый и фосфатный обмен, под влиянием витамина D увеличивается уровень кальция в организме, усиливается его отложение в костной ткани придавая ей прочность.

При недостатке витамина D в детском возрасте развивается заболевание – рахит при котором наблюдается деформирование костей (особенно костей ног в районе голени). Рыбий жир и эргокальциферол применяются для профилактики и лечения рахита, а так же при переломах костей для ускорения их сращения.

При избытке витамина D характеризуется потерей аппетита, тошнотой, рвотой, общей слабостью, нарушениями функций почек, возможно отложение солей кальция в почках, сосудах и пр..

Витамин Е (токоферол) в значительном количестве содержится в молодых ростках злаковых культур, а также в растительных маслах (подсолнечном, кукурузном, облепиховом и пр.).

Витамин Е играет важную роль в процессе созревания половых клеток, а также в регуляции обменных процессов в нервной системе и мышцах. Недостаток витамина Е в организме ведет к бесплодию, в медицинской практике токоферол назначают для профилактики самопроизвольных аборт, а также при заболеваниях сердечнососудистой и нервной системы.

Кроме того, витамин Е играет важную роль в регуляции окислительно-восстановительных процессов и относится к одной из основных антиоксидантных систем организма, токоферол тормозит окисление ненасыщенных жирных кислот.

Витамин К является противогеморрагическим витамином, участвует в синтезе протромбина, который, в свою очередь принимает участие в свертывании крови. Для эффективного всасывания витамина К в организме необходима желчь. При заболевании желчного пузыря и печени затрудняется всасывание витамина К, вследствие чего нарушается свертываемость крови, что может сопровождаться локальными кровоизлияниями в слизистые оболочки и внутренние органы.

---

В качестве лекарственного средства применяется синтетический аналог витамина К – викасол, который применяется для остановки кровотечений (раневых, маточных и пр.) и кровоточивости при различных заболеваниях, а также при передозировке антикоагулянтов (неодикумарина).

### Поливитаминовые препараты

В медицинской практике широко применяются поливитаминовые препараты, поскольку при некоторых заболеваниях целесообразно применять одновременно несколько витаминов. К таким комплексным препаратам относятся «Гексавит», «Ундевит», «Пентавит», «Аспитин», «Декамевит» и др. Кроме того, установлено, что ряд природных веществ (например, облепиховое масло) содержат большое количество витаминов и являются природными поливитаминовыми средствами.

Вместе с тем, при одновременном применении нескольких витаминов следует учитывать их возможную несовместимость, которая может привести к разрушению отдельных витаминов и ослаблению их действия, аллергическим реакциям и пр.

### Несовместимость водо- и жирорастворимых витаминов (по Я.Б. Максимовичу)

Витамины		Причины несовместимости
1	2	3
Витамин В <sub>1</sub> (тиамин)	В <sub>6</sub> , В <sub>12</sub> при введении в одном шприце	Разложение двух витаминов. Усиление алергизирующего влияния витамина В <sub>1</sub>
Витамин В <sub>2</sub> (рибофлавин)	В <sub>12</sub>	Разрушение витамина В <sub>2</sub> ионом кобальта
Витамин В <sub>2</sub> (рибофлавин)	В <sub>1</sub>	Окисление тиамин
Витамин В <sub>6</sub> (пиридоксин)	В <sub>12</sub>	Разрушение витамина В <sub>6</sub> , кумуляция ионов кобальта
В <sub>12</sub> (цианокобаламин)	Е, фолиевая кислота	Разрушение из за различия рН
В <sub>12</sub> (цианокобаламин)	С, В <sub>2</sub>	Разрушение В <sub>12</sub> (окисление)
РР (никотиновая кислота)	В <sub>12</sub>	Разрушение РР, кумуляция кобальта
С (аскорбиновая кислота)	В <sub>12</sub> , Е, фолиевая кислота	Разрушение витаминов из за различия рН
Р (витамин проницаемости)	В <sub>12</sub>	Разрушение витамина Р ионом кобальта
Витамин А (ретинол)	С	Нарушение обмена витамина С
Витамин А (ретинол)	D	Взаимное ослабление действие витаминов. D витаминная недостаточность при избытке ретинола и наоборот.
D (кальциферолы)	Е	Окисление витамина Е

### Ферментные препараты

Ферментные препараты - лекарственные вещества белковой природы, обладающие ферментной активностью. Большинство ферментных препаратов — животного происхождения, но некоторые из них могут быть выделены из растений или микроорганизмов. Ферменты, как и их заменители - ферментные препараты, улучшают течение биохимических реакций в организме.

Наиболее известная и популярная группа ферментных лекарственных средств - **пищеварительные ферменты**. Они включают в себя, как правило, полный набор ферментов, участвующих в переваривании белков, жиров, углеводов и других питательных веществ. Обычно их используют в ситуациях, когда собственные ферменты организма по той или иной причине не справляются с возложенными на них функциями. Это наблюдается при врожденных заболеваниях, сопровождающихся отсутствием какого-либо одного фермента или их группы, например, отсутствие лактазы (фермент,

расщепляющий молочный сахар). С возрастом снижается выработка пищеварительных ферментов поджелудочной железой. Человек хуже переваривает жирную пищу, что также является признаком ферментной недостаточности. Есть масса других заболеваний и состояний, требующих введения дополнительных доз ферментов.

Показаниями к самостоятельному использованию этих препаратов являются неустойчивый стул, избыточное образование газов в кишечнике, чувство тяжести и переполнения в желудке после обильной еды, непереносимость конкретных продуктов (молока, жиров).

При нарушениях функции пищеварительного тракта (ахилия, гипо-и анацидный гастриты, диспепсия) широко применяют пищеварительные ферментные препараты: пепсин, желудочный сок, панкреатин, ацидин-пепсин, абомин; иногда назначают растительный препарат, содержащий протеолитический фермент папаин, получаемый из дынного дерева. Кроме свойства улучшать пищеварительный процесс - папаин также обладает свойством переваривать кишечные гельминты, имеющие специальные механизмы, предохраняющие их от переваривающего действия животных ферментов. В связи с этим папаин эффективен в качестве антигельминтного средства (при аскаридозе).

Для облегчения эвакуации вязкого секрета, экссудата, гноя, некротических тканей применяют протеолитические ферментные препараты — трипсин, химотрипсин, дезоксирибонуклеазу, коллагеназу и др., получаемые из поджелудочной железы убойного скота. Здоровые ткани, содержащие специфические антиферментные вещества, не подвержены воздействию этих ферментов.

К протеолитическим ферментным препаратам относят стрептокиназу и стрептодорназу, получаемые из культур гемолитического стрептококка. Смесь этих ферментов применяют в хирургической практике в качестве средства, способствующего очищению раны от гнойно-некротических масс. Фибринолизин, обладающий свойством растворять нити фибрина, применяют при лечении тромбозомической болезни, тромбоза, инфаркта миокарда; препарат оказывает также сосудорасширяющее действие. Обычно фибринолизин назначают в сочетании с гепарином.

К ферментным препаратам относится также тромбин, повышающий свертываемость крови.

Важное значение имеют препараты гиалуронидазы, вызывающие увеличение проницаемости тканей и облегчающие движение жидкостей в межтканевых пространствах. К препаратам гиалуронидазы относятся лидаза и ронидаза. Лидазу применяют подкожно при гематомах, склеродермии, рубцах, артритах, тугоподвижности суставов, для ускорения всасывания лекарственных веществ; ронидазу — наружно для лечения длительно не заживающих ран, при контрактурах суставов.

Противопоказаний для использования ферментных средств практически нет

В медицинской практике применяют также вещества, обладающие антиферментной активностью, например трасилол, получаемый из околоушных слюнных желез убойного скота. Трасилол назначают при панкреатитах для инактивации трипсина с целью ограничить самопереваривание железы. К антиферментным препаратам относятся также антихолинэстеразные средства и ингибиторы моноаминоксидазы — ипразид, трансамин и др.

Ферментные средства - это лекарственные средства, содержащие ферменты — высокомолекулярные термолabile белки, которые выполняют в организме роль биологических катализаторов в реакциях обмена веществ.

Классификация ферментных средств:

1. Пептидазы: ацидин-пепсин, пепсидил, сок желудочный натуральный.
2. Протеазы: трипсин кристаллический, химотрипсин, химопсин.



3. Нуклеазы: рибонуклеаза, дезоксирибонуклеаза.
4. Фибринолитические ферменты: стрептолиаза, альте плаза (актилизе), фибринолизин.
5. Гиалуронидазы: лидаза, ронидаза, коллагеназа.
6. Полиферментные средства: панкреатин, фестал, вобензим, панзинорм, мезим форте.
7. Другие ферментные средства: аспарагиназа, пенициллиназа, цитохром С.

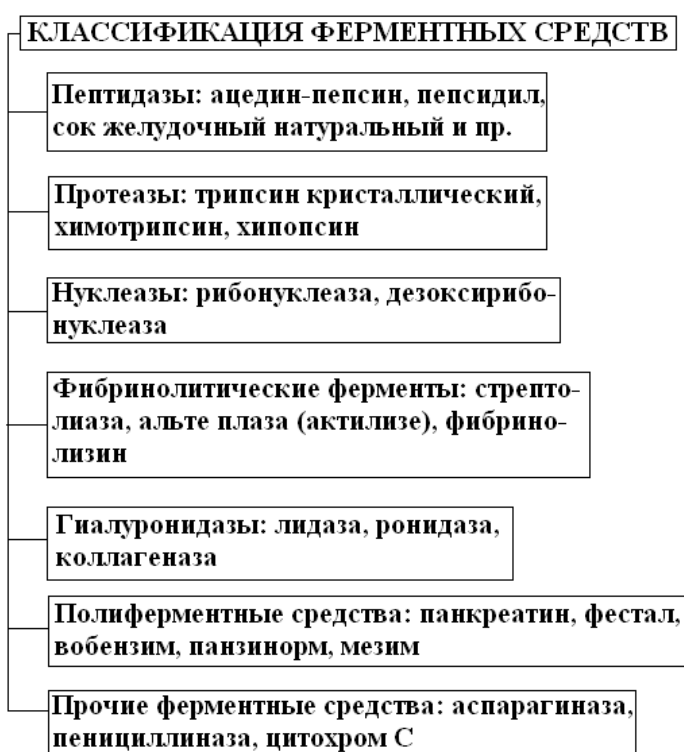
В число пептидаз относят пепсин — препарат, который содержит протеолитический фермент, получаемый из слизистой желудка свиней, и обладает способностью расщеплять белки до полипептидов.

Показаниями к применению пепсина, как и большинства ферментных препаратов из группы пептидаз, является заместительная терапия при ахилии, гипо- и анацидные гастриты, диспепсии.

Пепсин входит в состав препаратов ацидин-пепсин (содержащего также бетаин, высвобождающий кислоту хлористоводородную). Пепсин содержится также в составе сока желудочного натурального.

Панкреатин — ферментное средство из поджелудочных желез убойного скота, содержит в своем составе липазу, протеазу, амилазу. Выпускается в виде драже, которые назначают по 1—3 драже перед едой.

Также применяется в качестве средства заместительной терапии при ахилии, недостаточной функции поджелудочной железы, анацидных гастритах, диспепсии, энтероколите. Среди возможных побочных эффектов выделяют - обострение подагры.



Фестал содержит в своем составе три пищеварительных фермента (липазу, амилазу, протеазу), а также желчные кислоты, которые улучшают переваривание жиров, стимулируют желчевыделительную и желчеобразовательную функции печени, повышают проницаемость клеточных мембран. Гемичеселлюлоза, также присутствующая в препарате, улучшает моторную функцию желудка и кишечника, связывает токсические продукты



послеоперационное воспаление и отек, ревматический миозит, тендинит, воспалительно-дистрофические заболевания суставов в фазе обострения. Среди побочных эффектов отмечаются аллергические реакции, чувство переполнения желудка, метеоризм.

При высоких физических нагрузках организм требует достаточно большого притока пластического и энергетического материала извне. Пищеварительный аппарат не всегда справляется с этой задачей. Недостаточная переваривающая способность желудочно-кишечного тракта может служить фактором, лимитирующим прирост мышечной массы и работоспособности вследствие относительного белкового и витаминного дефицита. Для коррекции пищеварительных процессов применяют комбинированные средства, содержащие пищеварительные ферменты. Прием таких препаратов существенно улучшает пищеварение и способствует приросту массы тела. Пищеварительные ферменты могут приниматься как самостоятельно, так и в комплексе с анаболическими средствами.

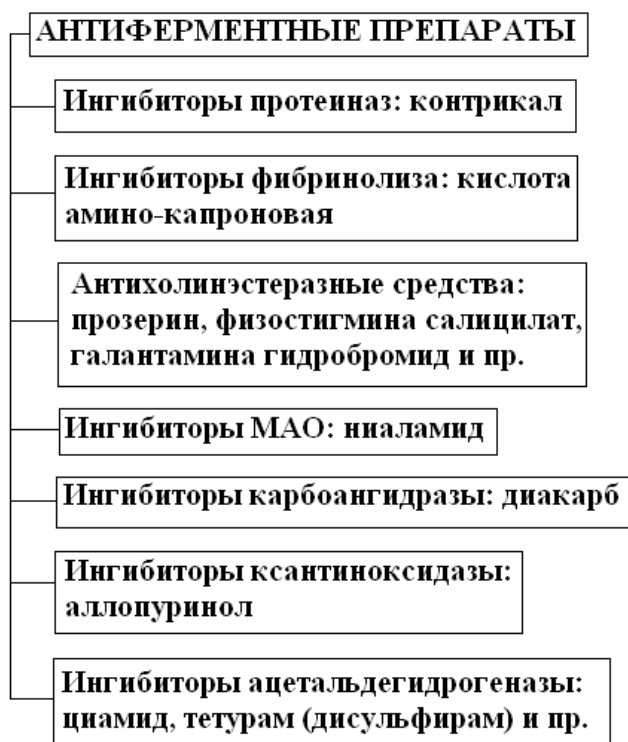
Использование препаратов системной энзимотерапии позволяет выдерживать тренировочные нагрузки повышенного объема и интенсивности, при этом прием вобензима позволяет избежать срыва адаптационных механизмов, истощения иммунной системы и дистресса. Вобензим в дозе 10 драже 3 раза в день обладает выраженным иммуностимулирующим действием. При этом, по данным контрольных тестов, существенно повышается уровень спортивной работоспособности. Применение вобензима в спорте увеличивает адаптационные резервы и освоение околопредельных стрессовых нагрузок, а также способствует более быстрому восстановлению, что подтверждается биохимическими и психофункциональными тестами. Эффект последствия после месячного курса системной энзимотерапии сохраняется в течение 10—14 дней.

Повреждения мышц относятся к числу наиболее частых в спортивной медицине травм. Особую проблему составляют микротравмы, часто недооцениваемые спортсменами и их тренерами. С учетом патоморфологических изменений, возникающих в мышцах, целесообразно использовать системную энзимотерапию как для профилактики, так и для лечения травматических повреждений мышц у спортсменов. Вобензим назначают в дозе 10 драже 3 раза в день от 10—14 дней до 4—6 нед. Прием вобензима спортсменами в таких дозах, по данным многочисленных исследований, позволяет приступить к спортивным тренировкам в среднем в 2—2,5 раза быстрее по сравнению с проведением традиционной терапии. Можно также использовать флогензим и Вобе-Мугос.

### **Ингибиторы ферментов**

Вырабатываемые в организме ферменты являются чрезвычайно биологически активными веществами. Поэтому, в некоторых случаях, в медицинской практике возникает необходимость подавления активности ферментов.

Лекарственные препараты, применяемые с целью подавления ферментной активности, называются ингибиторами ферментов.



Антиферментные препараты классифицируются на следующие группы:

1. Ингибиторы протеиназ: контрикал.
2. Ингибиторы фибринолиза: кислота аминокaproновая.
3. Антихолинэстеразные средства: прозерин, физостигмина салицилат, галантамина гидробромид и др.
4. Ингибиторы MAO: ниаламид.
5. Ингибиторы карбоангидразы: диакарб.
6. Ингибиторы ксантиноксидазы: аллопуринол.
7. Ингибиторы ацетальдегидрогеназы: циамид, тетурам (дисульфирам) и др.

Например, антиферментный препарат контрикал, ингибирующий активность трипсина, калликреина, плазмина. Действие препарата при внутривенном введении проявляется 10—15 мин. Показаниями к применению препарата являются: острый панкреатит, панкреанекроз в сочетании с гепарином в острый период инфаркта миокарда.

Прочие антиферментные препараты рассмотрены в соответствующих разделах методических рекомендаций.

### Краткая характеристика препаратов:

#### 1. Ретинола ацетат (Retinol acetat)



**Групповая принадлежность:** жирорастворимый витамин, (витамин А).

**Фармакологическое действие:** Ретинола ацетат (витамин А) – жирорастворимый витамин, принимающий участие в обмене веществ. Витамин А необходим для нормального роста и развития организма, поддерживает зрительную функцию, стимулирует процессы регенерации и эпителизации, улучшает неспецифический иммунный ответ и повышает устойчивость организма в неблагоприятных условиях внешней среды. Масляный раствор Ретинола ацетат устраняет дефицит витамина А, который вызван неполноценным питанием, заболеваниями пищеварительного тракта (при которых снижается кишечная абсорбция ретинола) и печени. Абсорбируется ретинола ацетат в верхних отделах тонкого кишечника. Пик плазменной концентрации ретинола при пероральном приеме достигается в течение 4 часов. Препарат создает высокие концентрации витамина А в сетчатке и печени, несколько меньшие концентрации отмечаются в почках, жировых депо, железах внутренней секреции.

**Показания к применению:** Ретинола ацетат предназначен для терапии пациентов, страдающих гипо- и авитаминозом А, пигментным ретинитом, ксерофтальмией, поверхностным кератитом, гемералопией, конъюнктивитом, пиодермией, поражениями роговицы и экзематозным поражением век. Раствор Ретинола ацетат используют в комплексной терапии пациентов с рахитом, острыми заболеваниями легких и бронхов, гипотрофией, коллагенозом, поражениями кожного покрова (в качестве средства стимулирующего регенерацию и эпителизацию), а также острыми респираторными заболеваниями, проходящими на фоне экссудативного диатеза. Витамин А также может быть назначен в комплексной терапии эрозивно-язвенных и воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта и цирроза печени. Ретинола ацетат назначают в качестве профилактического средства пациентам с повышенным риском образования конкрементов в мочевыводящих путях.

**Способ применения:** Препарат Ретинола ацетат предназначен для перорального и наружного применения. Перорально препарат рекомендуется принимать через 10-15 минут после приема пищи. Взрослым при авитаминозе А, как правило, назначают 1-2 капли препарата дважды или трижды в сутки перорально. Взрослым при заболеваниях кожи, как правило, назначают 5-10 капель препарата дважды в сутки (в комплексе с витамином В2 в суточной дозе 20мг) перорально.

**Побочные действия:** При продолжительной терапии витамином А (особенно при применении высоких доз) возможно развитие хронической передозировки и гипервитаминоза А, симптомами которого являются головная боль, боль в костях нижних конечностей, сонливость, раздражительность, гипертермия, чрезмерная потливость, олигурия и экзантема.

**Форма выпуска:** Раствор масляный для перорального и наружного применения по 10мл во флаконах темного стекла, в картонной коробке 1 флакон.

## 2. Тиамин (Thiaminum) (тиамина бромид, тиамина хлорид).

**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин В<sub>1</sub>).



**Фармакологическое действие:** Положительно влияет на проведение нервного возбуждения в синапсах (в местах передачи нервного возбуждения). Обладает умеренными ганглиоблокирующими свойствами. При пониженном содержании тиамина в пище у человека развивается гиповитаминоз В<sub>1</sub> (пониженное поступление витамина В<sub>1</sub> в организм), а затем авитаминоз В<sub>1</sub> (отсутствие поступления витамина В<sub>1</sub> в организм) - болезнь Бери-Бери.

**Показания к применению:** Гиповитаминоз и авитаминоз в различные формы невритов (воспаления нерва). Радикулиты, невралгии (боль, распространяющаяся по ходу нерва). Периферические парезы (уменьшение силы и/или амплитуды движений) и параличи (отсутствие произвольных движений из-за нарушения нервной регуляции мышц) различного происхождения. Болезнь Меньера (заболевание внутреннего уха, характеризующееся периодически возникающими головокружением, тошнотой, рвотой). Психоз Корсакова (хронический алкоголизм, характеризующийся расстройством памяти, заболеванием периферической нервной системы, социальными нарушениями личности). Полиомиелит (острое инфекционное заболевание, характеризующееся нарушением движения) и энцефаломиелит (сочетанное воспаление головного и спинного мозга). Болезнь Вернике (заболевание сосудов мозга, проявляющееся нарушением психики, расстройством координации движения, расстройством зрения). Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки. Атония (потеря тонуса) кишечника. Дистрофия миокарда (заболевание сердечной мышцы, связанное с нарушением ее питания). Нарушения коронарного (по сосудам сердца) кровообращения у больных стенокардией. Тиреотоксикоз (заболевание щитовидной железы). Эндартериит (воспаление внутренней оболочки артерий). Неврогенные дерматозы (заболевания кожи вследствие изменения деятельности нервной системы). Опоясывающий лишай (вирусное заболевание центральной и

периферической нервной системы с появлением пузырьков сыпи по ходу чувствительных нервов). Псориаз. Экземы. Отравления (сероуглеродом, тетраэтилсвинцом, ртутью, метиловым спиртом, мышьяком и др.).

**Способ применения:** В лечебных целях тиамин хлорид и тиамин бромид применяют внутрь (после еды) и парентерально (минуя желудочно-кишечный тракт). Дозы при приеме внутрь тиамин хлорида составляют для взрослых 0,01 г (10 мг) 1-3 (до 5) раза в день. Детям в возрасте до 3 лет назначают по 0,005 г (5 мг) через день; 3-8 лет - по 0,005 г 3 раза в день через сутки; старше 8 лет - по 0,01 г 1-3 раза в день. Курс лечения - обычно 30 дней. Тиамин бромид в связи с его большей относительной молекулярной массой (435,2) применяют в несколько больших дозах, чем тиамин хлорид (относительная молекулярная масса 337,27); 0,001 г (1 мг) тиамин хлорида соответствует по активности 0,00129 г (1,29 мг) тиамин бромида. При нарушении всасывания в кишечнике и при необходимости быстрого создания высоких концентраций тиамин В<sub>1</sub> в крови вводят тиамин хлорид или тиамин бромид парентерально. Обычно вводят внутримышечно взрослым по 0,025-0,05 г тиамин хлорида (1 мл 2,5% или 5% раствора) или 0,03-0,06 г тиамин бромида (1 мл 3% или 6% раствора) по 1 разу в день ежедневно; детям вводят по 0,0125 г (0,5 мл 2,5% раствора) тиамин хлорида или по 0,015 г (0,5 мл 3% раствора) тиамин бромида. Курс лечения - 10-30 инъекций. Суточная потребность в витамине В<sub>1</sub> составляет для взрослого около 2 мг; при тяжелом физическом труде потребность в витамине несколько повышается.

**Побочные действия:** В отдельных случаях, особенно при парентеральном введении, возможны аллергические реакции и даже анафилактический (аллергический) шок. Противопоказания: Аллергические заболевания в анамнезе (бывшие ранее).

**Форма выпуска:** Выпускается в виде тиамин бромида: порошок 1 г; драже по 0,002 г в упаковке по 50 г; таблетки с риской по 0,0129 г в упаковке по 50 штук; ампулы по 1 мл в упаковке по 10 штук 3% и 6% раствора и тиамин хлорида: ампулы по 1 мл в упаковках по 50 штук 2,5% и 5% раствора.

### 3. Никотинамид (Nicotinamidum)

**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (В<sub>3</sub>; РР).



**Фармакологическое действие:** По действию близок к никотиновой кислоте и наравне с ней рассматривается как витамин РР. В связи с нейтральной реакцией растворов никотинамид не вызывает местной реакции при инъекциях. Выраженного сосудорасширяющего действия никотинамид не оказывает, и при его применении не наблюдается покраснения кожных покровов и чувства прилива крови к голове, часто встречающихся при применении никотиновой кислоты.

**Показания к применению:** В основном такие же, как для никотиновой кислоты: пеллагра (болезнь, обусловленная недостаточностью никотиновой кислоты /витамина РР/, триптофана и рибофлавина /витамина В<sub>2</sub>/), гастриты с пониженной кислотностью (воспаление слизистой оболочки желудка, сопровождающееся пониженным выделением соляной кислоты), хронические колиты (воспаление толстой кишки), гепатиты (воспаление ткани печени), цирроз печени и др. Как сосудорасширяющее средство никотинамид, однако, не применяют.

**Способ применения:** Назначают внутрь взрослым по 0,015-0,025 г, детям по 0,005-0,01 г 1-2 раза в день. Дозы при пеллагре - 0,05-0,01 г 3-4 раза в день; для детей - 0,01-0,05 г 2-3 раза в день в течение 15-20 дней. При других заболеваниях взрослым назначают по 0,02-0,05 г в день, детям по 0,005-0,01 г 2-3 раза в день. Парентерально (внутривенно, внутримышечно и подкожно) вводят по 1-2 мл 1%, 2,5% и 5% раствора 1-2 раза в день. В отличие от никотиновой кислоты не дает сосудистой реакции.

**Противопоказания:** Тяжелая форма гипертонии (стойкий подъем артериального давления) и стенокардии.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки в упаковке по 50 штук по 0,005 г и по 0,025 г; ампулы по 1 мл 1% раствора, 2,5% раствора и по 2 мл 5% раствора в упаковке по 10 штук.

### 4. Аэровит Аэровит (Aerovitum)



**Групповая принадлежность:** Комплексный поливитаминный препарат,. Аэровит таблетки для приема внутрь:

1 таблетка содержит ретинола ацетата 0,0027 г, тиамина бромиды 0,00258 г, рибофлавина нуклеотида 0,002 г, пиридоксина гидрохлорида 0,01 г, цианокобаламина 0,000025 г, аскорбиновой кислоты 0,1 г, токоферола ацетата 0,02 г, никотинамида 0,015 г, рутина 0,05 г, фолиевой кислоты 0,0002 г и пантотената кальция 0,01 г; в стеклянной банке 30 шт.

**Фармакологическое действие:** Поливитаминное. Аэровит нормализует обмен веществ.

**Показания к применению:** Гиповитаминоз, витаминизация рациона питания лиц, подвергающихся воздействию экстремальных факторов (укачивание, вибрация, шум, низкое барометрическое давление, перегрузки, действие УВЧ).

**Способ применения:** Внутрь, по 1 табл. Аэровит в сутки, при длительной нагрузке и пониженной витаминной ценности питания — до 2 табл. в день в течение длительного времени.

**Форма выпуска:** Таблетки в пластиковом флаконе, по 30 шт.

## 5. Лидаза (Lydasum)



**Групповая принадлежность:** Ферменты и антиферменты (протеолитическое средство).

**Фармакологическое действие:** Гиалуронидаза - это фермент, специфическим субстратом которого служит гиалуроновая кислота. Последняя является мукополисахаридом, в состав которого входят ацетилглюкозамин и глюкуроновая кислота. Гиалуроновая кислота обладает высокой вязкостью; биологическое значение - "цементирующее" промежуточное вещество соединительной ткани. Эффект препарата заключается в улучшении подвижности суставов, размягчении рубцов, устранении или уменьшении контрактур, рассасывании гематом. Действие наиболее выражено в начале патологических процессов.

**Показания к применению:** Лидазу назначают при контрактурах суставов, анкилозирующем спондилоартрите, контрактуре Дюпюитрена (начальная стадия), Рубцовых изменениях кожи различного происхождения, при гематомах, длительно незаживающих язвах, склеродермии. Применяют в глазной практике, при туберкулезе легких, при травматических поражениях нервных сплетений и периферических нервов, при ревматоидном артрите.

**Способ применения:** Лидазу вводят подкожно, под рубцово измененные ткани, внутримышечно, методами электрофореза или аппликаций на слизистые оболочки (в глазной практике). В последней препарат можно вводить также субконъюнктивально, ретробульбарно. Для инъекций содержимое ампулы растворяют в 1 мл изотонического раствора натрия хлорида или в 1 мл 0,5 % раствора новокаина. При контрактурах, рубцах различного происхождения, гематомах, анкилозирующем спондилоартрите вводят под кожу рядом с местом поражения или под рубцово измененную ткань в объеме 1 мл. Инъекции ежедневные или через день. На курс лечения 6-10-15 (и более) инъекций. При продуктивном характере воспаления у больных туберкулезом легких лидазу назначают в виде инъекций и ингаляций в комплексной терапии с целью повышения в очаге поражения концентрации антибиотиков и других антибактериальных средств. Для ингаляций содержимое ампулы растворяют в 5 мл изотонического раствора натрия хлорида. Ингаляции ежедневные или через день (5 мл раствора, содержащего 64 ЕД). На курс-20-25 инъекций. Повторные курсы - по необходимости с интервалами 1,5 -2 месяца. Подкожно вводят 1 мл раствора (64 ЕД) или такое же количество - внутримышечно. Инъекции ежедневные или через день. На курс -10-20 инъекций. Для более тонкого рубцевания пораженных участков роговицы при кератитах закапывают 0,1 % раствор препарата при одновременном применении антибиотиков, сульфаниламидов. При ретинопатиях вводят также под кожу виска.

**Форма выпуска:** Лиофилизированный порошок. По 10 ампул в картонной упаковке.

## 6. Эргокальциферол (Ergocalciferolum)



**Групповая принадлежность:** Жирорастворимый витамин (D)

**Фармакологическое действие:** Регулирует обмен фосфора и кальция в организме, всасывание их в кишечнике и отложение в костях. Предохраняет от рахита (авитаминоза D - состояния, вызванного недостаточным поступлением витамина D в организм) и излечивает рахит.

**Показания к применению:** Рахит. Нарушение функции околощитовидных желез. Тетания (судороги). Остеомаляция (размягчение костей). Остеопороз (нарушение питания костной ткани, сопровождающееся увеличением ее ломкости). Туберкулез костей. Туберкулезная волчанка (туберкулезное заболевание кожи).

**Способ применения:** Для предупреждения рахита у новорожденных и грудных детей витамин D2 назначают беременной женщине и кормящей матери. На 30-32-й неделе беременности назначают витамин D2 дробными дозами в течение 10 дней, всего на курс - 400 000-600 000 МЕ. Кормящим матерям назначают по 500 МЕ ежедневно с первых дней кормления до начала применения препарата у ребенка. Доношенным детям начинают давать препарат в профилактических целях с 3-недельного возраста. Общая доза на курс профилактики составляет обычно около 300 000 МЕ. Недоношенным детям, близнецам, детям, находящимся на искусственном вскармливании, и при неблагоприятных бытовых и климатических условиях начинают давать витамин D2 со 2-й недели жизни. Общая доза на курс составляет в этих случаях до 600 000 МЕ. В качестве профилактического средства препарат можно назначать разными методами: по "дробному" методу ребенку дают ежедневно по 500-1000 МЕ в течение первого года жизни; по методу "витаминных толчков" дают по 50 000 МЕ 1 раз в неделю в течение 8 нед. По "уплотненному" методу, рекомендуемому недоношенным детям и детям с частыми сопутствующими заболеваниями, дают 300 000-400 000 МЕ за 10-12 дней. После окончания лечения витамином D2 на протяжении первого года жизни ребенка препарат вновь назначают в весеннее и осенне-зимнее время (до 2 лет). В местностях с длительной и суровой зимой поддерживающую профилактику рахита проводят до 3 лет. Для лечения рахита I степени доношенным детям дают ежедневно по 10 000-15 000 МЕ в течение 30-45 дней. На курс - 500 000-600 000 МЕ. При остро выраженном процессе дают указанную общую дозу "уплотненным" методом в течение 10 дней. При рахите II степени на курс назначают 600 000-800 000 МЕ. При подостром течении препарат принимают в течение 30-35 дней, при остром - 10-15 дней. При рахите II-III степени для предупреждения рецидивов (повторного появления признаков заболевания) рекомендуется назначить детям повторный курс лечения в общей дозе 400 000 МЕ, вводимой в течение 10 дней. При рахите III степени назначают на курс 800 000 - 1 000 000 МЕ. При подостром течении рахита это количество вводят в течение 40-60 дней, при остром - в течение 10-15 дней.

**Побочные действия:** При применении больших доз возможен гипервитаминоз D (избыточное поступление витамина D в организм), сопровождающийся потерей аппетита, тошнотой, головной болью, общей слабостью, повышением температуры, появлением в моче белка, цилиндров, лейкоцитов (форменных элементов крови), а также повышением содержания кальция в крови и выделением его с мочой, отложением кальция в почках, легких и кровеносных сосудах.

**Противопоказания:** Эргокальциферол может способствовать развитию атеросклероза. Препарат обладает способностью накапливаться в организме.

**Форма выпуска:** Драже по 500 МЕ (масса 0,5 г) в упаковке по 50 г (100 штук); спиртовой 0,5% раствор (200 000 ЕД в 1 мл) во флаконах по 5 мл; масляный 0,125% раствор (50 000 МЕ в 1 мл) во флаконах по 10 мл, масляный 0,0625% раствор (25 000 МЕ в 1 мл) во флаконах по 10 мл.

## 7. Кислота фолиевая (Acidum Folicum)





**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин В<sub>9</sub>, В<sub>с</sub>, М).

**Фармакологическое действие:** Фолиевая кислота относится к группе витаминов В. Поступает в организм с пищей (экзогенная фолиевая кислота), а так же синтезируется микрофлорой кишечника (эндогенная). И экзо-, и эндогенная фолиевая кислота в организме восстанавливается до коэнзима (тетрагидрофолиевой кислоты). Этот коэнзим необходим для многих важных метаболических процессов: участие в образовании пуринов, пиримидинов, нуклеиновых и аминокислот. Так же является необходимой для обмена холина. В синергизме с цианокобаламином (витамин В<sub>12</sub>) стимулирует кроветворение: необходима для дифференциации и созревания мегалобластов, частично берет участие в эритропоэзе. Недостаток фолиевой кислоты приводит к торможению фазы кроветворения из мегалобластной в нормобластную.

**Показания к применению:** Как стимулятор кроветворения: • При гиперхромных макроцитарных и мегалобластических анемиях, которые вызваны недостаточностью фолиевой кислоты; • в терапии спру в качестве средства для купирования или уменьшения симптомов заболевания, нормализации эритропоэза; • лейкопении и анемия, которые развились из-за действия ионизирующего излучения, химических (медикаментозных) веществ; • анемии после операции резекции желудка или части кишечника; • мегалобластные анемии из-за туберкулеза кишечника или гастроэнтерита (в т.ч. – для профилактики анемии при этих состояниях); • пеллагра; • пернициозная анемия. С профилактической целью: • Превентивное лечение при беременности и вскармливании грудью. Способ применения: Таблетки принимать внутрь после приема пищи. С лечебными целями рекомендуется по 0,001-0,002 (1-2 таблетки) 1-3 р/сутки. Суточная доза составляет 0,005 г (5 таблеток). Детям можно назначать фолиевую кислоту с 3 лет: по 0,00025 г (1/4 таблетки) в сутки (максимально – 0,002 г- 2 таблетки/сутки). Продолжительность приема фолиевой кислоты – от 20 до 30 суток.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,001 г. Таблетки бледно-зеленого цвета, имеют плоскую поверхность. В упаковке 10 или 30 таблеток.

## 8. Пиридоксина гидрохлорид (Pyridoxini hydrochloridum)



**Фармакологическое действие:** Играет большую роль в обмене веществ. В организме фосфорилируется и превращается в кофермент (органическое соединение небелковой природы, необходимое для проявления активности ферментов) пиридоксаль-6-фосфат. Входит в состав ферментов, осуществляющих декарбоксилирование и переаминирование аминокислот. Участвует в обмене липидов (жиров). Предупреждает витаминную недостаточность у беременных женщин и детей раннего возраста.

**Показания к применению:** Алимитарная (пищевая) и вторичная недостаточность пиридоксина. Токсикозы беременных. Постэнцефалитный паркинсонизм (дрожание конечностей и головы вследствие перенесенного энцефалита - воспаления мозга). Хорея (заболевание нервной системы, сопровождающееся двигательным возбуждением и некоординированными движениями). Судорожный синдром у новорожденных. Пеллагра (болезнь, обусловленная недостаточностью никотиновой кислоты /вит. РР/, триптофана /незаменимой - не синтезирующейся в организме -аминокислоты/ и рибофлавина /вит. В2/). Язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки. Гипохромная микроцитарная анемия (наследственное заболевание, сопровождающееся снижением содержания гемоглобина в крови вследствие изменения структуры эритроцитов). Заболевания периферической нервной системы. Лучевая болезнь. Острый и хронический гепатит (воспаление ткани печени). Интоксикации (отравления) при применении изониазида, фтивазида и других противотуберкулезных препаратов.

**Способ применения:** Для профилактики В6-гиповитаминоза назначают взрослым по 0,002-0,005 г в день, детям - по 0,002 г в день. Лечебные дозы при приеме внутрь составляют для взрослых 0,02-0,03 г 1-2 раза в день; для детей дозу уменьшают соответственно возрасту. Курс лечения составляет 1-2 мес. Парентерально (под кожу, внутримышечно и внутривенно) вводят взрослым по 0,05-0,1 г в сутки (в 1-2 инъекции), детям - по 0,02 г. Курс лечения для взрослых - 1 мес., для детей - 2 нед. При применении изониазида, фтивазида и других производных изоникотиновой кислоты целесообразно назначать пиридоксин по 0,005-0,01 г в день

профилактически - для предупреждения невритов (воспаления нерва) и других осложнений. Для лечения сидеробластной анемии (снижения уровня гемоглобина в крови вследствие специфического изменения структуры костного мозга и характеризующегося повышением содержания железа в крови и устойчивостью к лечению препаратами железа) назначают внутрь по 0,1 г ежедневно или по 0,1 г внутримышечно 2 раза в неделю. Целесообразно одновременно принимать фолиевую кислоту, цианокобаламин, рибофлавин. При паркинсонизме назначают по 2 мл 5% раствора в день внутримышечно. Курс состоит из 20-25 инъекций. Через 2-3 мес. курс лечения повторяют. Пиридоксин также применяют для лечения паркинсонизма путем внутримышечных инъекций 5% раствора, начиная с 50-100 мг, ежедневно увеличивая дозу на 50 мг до 300-400 мг в сутки в виде однократной инъекции. Лечение проводят короткими курсами (12-15 дней). Суточная потребность в пиридоксине составляет для взрослых около 2-2,5 мг; для детей от 6 мес. до 1 года - 0,5 мг; от 1 года до 1,5 лет - 0,9 мг; от 1,5 до 2 лет - 1 мг; от 3 до 4 лет - 1,3 мг; от 5 до 6 лет - 1,4 мг; от 7 до 10 лет - 1,7 мг; от 11 до 13 лет - 2 мг; для юношей 14-17 лет - 2,2 мг; для девушек 14-17 лет - 1,9 мг.

**Побочные действия:** Необходима осторожность при язвенной болезни и тяжелых заболеваниях печени (не более 0,025 г в день).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки с риской по 0,002 г в упаковке по 50 штук для детей; таблетки с риской по 0,01 г в упаковке по 50 штук; ампулы по 1 мл в упаковке по 10 штук 1% раствора, 2,5% раствора и 5% раствора.

### 9. Галаскорбин (Galascorbinum)

**Фармакологическое действие:** Обладает свойствами витаминов С и Р, оказывает вяжущее действие, обусловленное галлатом калия.

**Показания к применению:** При гастритах (воспалении желудка) и эзофагитах (воспалении пищевода), гиповитаминозах С и Р (пониженном поступлении витаминов С и Р в организм).

**Способ применения:** Внутрь по 0,5 г 3-4 раза в день. Наружно для лечения трещин, ожогов, лучевых поражений кожи 0,5-1% водный раствор.

**Форма выпуска:** Порошок. Условия хранения: В прохладном, защищенном от света месте. Дополнительно: Комплексное соединение солей аскорбиновой и галловой кислот.

### 10. Трипсин кристаллический (Trypsinum crystallisatum)



**Групповая принадлежность:** Протеолитическое средство для местного применения (получают из поджелудочной железы крупного рогатого скота).

**Фармакологическое действие:** При местном применении трипсин расщепляет некротизированные ткани и фибриновые образования, разжижает вязкие секреты, сгустки крови и экссудаты.

На здоровые ткани трипсин не действует, так как они содержат специфический ингибитор трипсина и неспецифические его ингибиторы. При внутримышечном введении трипсин оказывает противовоспалительное действие.

**Показания к применению:** При воспалительных заболеваниях дыхательных путей (трахеитах, бронхитах, бронхоэктатической болезни, послеоперационном ателектазе лёгких) для разжижения и облегчения удаления вязких секретов и экссудатов как вспомогательное средство в виде ингаляций. При экссудативном плеврите и эмпиеме препарат вводят внутривнутриплеврально. В глазной практике кристаллический трипсин применяют в виде ванночек и глазных капель при ирите, иридоциклите, кровоизлияниях в переднюю камеру глаза, отеках окологлазных тканей (после операций и травм). При тромбозах, тромбозах, остеомиелите, гайморите, отите, воспалительно-дистрофических формах парадонтоза производятся внутримышечные инъекции кристаллического трипсина.

**Способ применения:** Для ингаляций растворяют 0,005–0,010 г препарата в 2–3 мл 0,9% изотонического раствора хлорида натрия и ингалируют при помощи ингаляционного аппарата или вводят через бронхоскоп или эндотрахеальный зонд. К раствору трипсина можно добавлять бронхорасширяющие вещества (Изадрин) и антибиотики.

Внутриплеврально препарат вводят 1 раз в сутки по 0,010–0,020 г, растворенным в 20–50 мл изотонического раствора хлорида натрия.

Для глазных ванночек применяют 0,20% раствор, для глазных капель — 0,25% раствор (3–4 раза в день в течение 2–3 дней).

Внутримышечно трипсин вводят взрослым по 0,005 г 1–2 раза в сутки, детям — по 0,0025 г 1 раз в день. Непосредственно перед употреблением 0,005 г кристаллического трипсина растворяют в 1–2 мл стерильного изотонического раствора хлорида натрия. Инъекция производится глубоко внутримышечно в верхний наружный квадрант ягодичной мышцы.

Местное применение трипсина сочетается с внутримышечным введением препарата в связи с его общим противовоспалительным влиянием.

**Побочное действие:** После внутримышечного введения — небольшая болезненность и гиперемия в месте введения, после внутривенного и внутримышечного введения — повышение температуры, тахикардия, а также аллергические реакции, связанные со всасыванием продуктов протеолиза (ферментативного расщепления белков до пептидов и аминокислот) некротизированных тканей. После ингаляций препарата могут наблюдаться раздражение верхних дыхательных путей, охриплость.

**Противопоказания:** Сердечная декомпенсация, декомпенсированные формы туберкулёза лёгких, эмфизема лёгких с дыхательной недостаточностью, геморрагический диатез, цирроз и острая дистрофия печени, инфекционный гепатит, поражение почек, панкреатит.

Нельзя вводить трипсин внутривенно, инъектировать его непосредственно в очаги воспаления и в кровоточащие полости, накладывать трипсин на изъязвленные поверхности злокачественных опухолей.

**Особые указания:** Трипсин кристаллический допущен как для местного, так и для парентерального применения. Аморфный трипсин и смесь трипсина с химотрипсином (химопсин) допускаются только для местного применения.

**Форма выпуска:** Выпускают ампулы и герметически закрытые флаконы, содержащие по 0,005 г и 0,010 г кристаллического трипсина.

### 11. Химотрипсин кристаллический (Chymotrypsinum)



**Групповая принадлежность:** Протеолитическое средство для местного применения

**Фармакологическое действие:** При местном применении расщепляет некротизированные (омертвевшие) ткани и фибриновые образования (тромбы /сгустки кропи/); разжижает вязкие секреты (отделяемое специальных желез, например, мокроту), экссудаты (выделяемую из мелких сосудов ткани богатую белком жидкость), сгустки крови.

**Показания к применению:** Тромбофлебиты (воспаление стенки вен с их закупоркой), воспалительно-дистрофические формы пародонтоза (заболевания зубов), остеомиелит (воспаление костного мозга и прилегающей костной ткани), гайморит (воспаление верхнечелюстной пазухи), отит (воспаление полости уха), ирит (воспаление радужной оболочки глаза), иридоциклит (заболевание глаз); трахеиты (воспаление трахеи), бронхиты (воспаление бронхов), экстракция катаракты (удаление помутневшего хрусталика глаза).

**Способ применения:** Внутримышечно взрослым по 0,0025 г 1 раз в день. Для инъекции растворяют непосредственно перед применением 0,005 г химотрипсина кристаллического в 1–2 мл изотонического раствора натрия хлорида или 0,5–2% раствора новокаина. Раствор вводят глубоко в верхний наружный квадрант ягодичной мышцы. Курс – 6–15 инъекций.

**Побочные действия:** Аллергические реакции, жжение на месте применения. Кровотечение из гранулирующих (заживающих) участков. При введении в полости возможно высвобождение веществ с гистаминоподобным действием.

**Противопоказания:** Кровоточащие раны и распадающиеся злокачественные опухоли. Индивидуальная непереносимость. Препарат не пригоден для внутривенного введения.

**Форма выпуска:** Порошок в герметически закупоренных флаконах по 0,005 г и 0,01 г.

### 12. Токоферола ацетат



**Групповая принадлежность:** Жирорастворимый витамин (витамин E)

**Фармакологическое действие:** Активное противooksидлительное средство, защищающее различные вещества от окисления, в частности полиненасыщенные жирные кислоты, ретинол и др. Витамин E является природным противooksидлительным средством (антиоксидантом). Он защищает различные вещества от окислительных изменений. Участвует в биосинтезе гемоглобина (небелковой части молекулы гемоглобина - переносчика кислорода) и белков; пролиферации (процессе роста) клеток; в тканевом дыхании и других важнейших процессах клеточного метаболизма (обмена веществ). Важную роль витамин E играет в деятельности организма. У животных, лишенных витамина E, обнаруживаются дегенеративные изменения (нарушения структуры тканей) в скелетных мышцах и мышце сердца, отмечается повышение проницаемости и ломкости капилляров (мельчайших сосудов), перерождение эпителия семенных канальцев яичек (внутренней оболочки канальцев, составляющих основу структуры яичек).

**Показания к применению:** Мышечные дистрофии (уменьшение объема и силы мышц). Амиотрофический боковой склероз (заболевание центральной нервной системы, характеризующееся нарушением движений мышц лица и конечностей). Нарушения менструального цикла. Угроза прерывания беременности. Нарушения сперматогенеза (процесса образования мужских половых клеток) и потенции (половой активности). Некоторые дерматозы (кожные болезни). Псориаз. Миокардиопатии (заболевание сердечной мышцы). Спазмы (резкое сужение просвета) периферических сосудов. Заболевания печени. В педиатрии: склеродермия (системное заболевание кожи), гипотрофии (расстройство питания), гипервитаминоз D (избыточное поступление витамина D в организм). В основном токоферола ацетат применяют в качестве лекарственного средства при мышечных дистрофиях, дерматомиозитах (системном заболевании мышечной ткани и кожи, характеризующемся нарушением двигательной активности и покраснением и отеком открытых участков кожи); амиотрофическом боковом склерозе; нарушениях менструального цикла; угрозе прерывания беременности; нарушении функции половых желез у мужчин.

**Способ применения:** Внутрь при заболеваниях нервномышечной системы 50-100 мг в день. При нарушениях сперматогенеза и потенции 100-300 мг в сутки. При привычном аборте и ухудшении состояния плода 100-150 мг в сутки в первые 2-3 мес. беременности. При угрожающем аборте 100-150 мг в сутки в течение 1 мес. При атеросклерозе и заболеваниях периферических сосудов 100 мг в сутки в сочетании с ретинолом.

**Побочные действия:** Большие дозы вызывают креатинурию (наличие креатина в моче) и снижение работоспособности; понос.

**Противопоказания:** Препарат следует с осторожностью назначать при тяжелом кардиосклерозе (деструктивных изменениях в сердечной мышце), инфаркте миокарда, высоком риске тромбоэмболии (закупорки сосуда сгустком крови).

**Форма выпуска:** Во флаконах по 20 мл 5% и 10% раствора в масле; в капсулах по 0,5 г 20% раствора в упаковке по 15 штук; в ампулах по 1 мл 5%, 10% и 30% раствора в упаковке по 10 штук.

### 13. Рибофлавин (Riboflavinum)



**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин B<sub>2</sub>)

**Фармакологическое действие:** Активно участвует в процессах белкового, углеводного и жирового обмена. Участвует в зрительной функции глаз (наряду с ретинолом) и в синтезе гемоглобина. При пониженном содержании рибофлавина в пище у человека развивается гипорибофлавиноз (болезнь, развивающаяся вследствие недостаточного поступления в организм витамина B<sub>2</sub>), а затем арибофлавиноз (болезнь, связанная с отсутствием поступления в организм витамина B<sub>2</sub>).

**Показания к применению:** Гипо- и арибофлавиноз. Гемералопия (ночное ухудшение зрения /куриная слепота/) - назначают с ретинолом. Конъюнктивиты (воспаление наружной оболочки глаза), ириты (воспаление радужной оболочки глаза), кератиты (воспаление роговицы). Длительно незаживающие раны и

язвы. Лучевая болезнь. Экземы. Болезнь Боткина (инфекционное воспаление ткани печени, вызванное вирусом, проникающим в организм через рот) и другие заболевания печени. Нарушения функции желудочно-кишечного тракта. Железодефицитная анемия (снижение содержания гемоглобина в крови вследствие нарушения поступления, усвоения или выделения железа).

**Способ применения:** Внутрь взрослым 0,005-0,01 г в день. При более выраженной недостаточности рибофлавина по 0,01 г 3 раза в день в течение 1-1/2 мес; детям от 0,002-0,005 г до 0,01 г в день в зависимости от возраста; 0,01% раствор препарата используют в виде глазных капель. Суточная потребность в витамине B2 составляет для взрослого человека около 2,5 мг, при тяжелом физическом труде - около 3 мг;

**Форма выпуска:** Порошок; драже по 0,002 г в упаковке по 50 штук; таблетки по 0,01 г с риской в упаковке по 50 штук

#### 14. Никотиновая кислота (*Acidum nicotinicum*)

**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин B<sub>3</sub>; PP)

**Фармакологическое действие:** По строению никотиновая кислота близка к никотинамиду. Никотиновая кислота и никотинамид содержатся в органах животных (печени, почках, мышцах и др.), в молоке, рыбе, дрожжах, овощах, фруктах, гречневой крупе и других продуктах. Никотиновая кислота и ее амид играют существенную роль в жизнедеятельности организма: они являются простетическими группами ферментов - кодегидразы I (дифосфопиридиннуклеотида - НАД) и кодегидразы II (трифосфопиридиннуклеотида - НАДФ), являющихся переносчиками водорода и осуществляющих окислительно-восстановительные процессы. Кодегидраза II участвует также в переносе фосфата. Недостаточность витамина PP у человека приводит к развитию пеллагры (болезни, обусловленной недостаточностью никотиновой кислоты /витамина PP/, триптофана и рибофлавина /витамина B<sub>2</sub>/).

**Показания к применению:** Никотиновая кислота и ее амид являются специфическими противопеллагрическими средствами (средствами для лечения пеллагры), в связи с чем они и обозначаются как витамин PP. Их применение, особенно на ранних стадиях заболевания приводит к исчезновению явлений пеллагры. Никотиновая кислота обладает не только противопеллагрическими свойствами; она улучшает углеводный обмен, действует положительно при легких формах диабета, заболеваниях печени, сердца, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки и энтероколитах (воспалении тонкой и толстой кишки), вяло заживающих ранах и язвах. Она оказывает также сосудорасширяющее действие. Никотиновая кислота обладает липопротеемической активностью (снижает уровень липопротеидов в крови). В больших дозах (3-4 г в день) понижает содержание триглицеридов и бета-липопротеидов в крови.

**Способ применения:** Применяют никотиновую кислоту внутрь (после еды) и парентерально (минуя желудочно-кишечный тракт). Для профилактических целей назначают внутрь взрослым по 0,015-0,025 г; детям - по 0,005-0,02 г в день. При пеллагре дают взрослым внутрь по 0,1 г 2-3-4 раза в день в течение 15-20 дней; парентерально вводят 1% раствор по 1 мл 1-2 раза в день в течение 10-15 дней. Детям назначают внутрь от 0,005 до 0,05 г 2-3 раза в день. При других заболеваниях никотиновую кислоту назначают взрослым по 0,02-0,05 г (до 0,1 г); детям - по 0,005-0,03 г 2-3 раза в день. Как сосудорасширяющее средство при ишемическом инсульте (недостаточном снабжении ткани головного мозга кислородом вследствие острого нарушения мозгового кровообращения) вводят внутривенно 1 мл 1% раствора. Внутривенно вводят медленно. Подкожное и внутримышечное введения никотиновой кислоты болезненны. Во избежание раздражения можно пользоваться никотинатом натрия (натриевой солью никотиновой кислоты) или никотинамидом. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 0,1 г, суточная - 0,5 г; в вену (в виде натриевой соли): разовая - 0,1 г, суточная - 0,3 г. При приеме внутрь разовая доза может быть постепенно увеличена (при отсутствии побочных явлений) до 0,5-1 г, а суточная доза - до 3-5 г (главным образом при лечении атеросклероза и других нарушений липидного обмена). Суточная потребность в никотиновой кислоте (и в никотинамиде) составляет для взрослого около 20 мг, при тяжелом физическом труде - около 25 мг,

**Побочные действия:** Никотиновая кислота (особенно при приеме внутрь натошак и у лиц с повышенной чувствительностью) может вызвать покраснение лица и верхней половины туловища, головокружение, чувство прилива крови к голове, крапивную сыпь, парестезии (чувство онемения в конечностях). Эти явления проходят самостоятельно. При быстром внутривенном введении раствора никотиновой кислоты может произойти сильное снижение артериального давления.

**Противопоказания:** Внутривенные инъекции противопоказаны при тяжелых формах гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления) и атеросклероза. Лицам с повышенной чувствительностью к никотиновой кислоте следует назначать никотинамид, за исключением тех случаев, когда никотиновая кислота применяется как сосудорасширяющее средство. Следует учитывать, что длительное применение больших доз никотиновой кислоты может привести к развитию жировой дистрофии печени. Для предупреждения этого осложнения рекомендуется включать в диету продукты, богатые метионином - незаменимой /несинтезирующейся в организме/ аминокислоты, или назначать метионин и другие липотропные (избирательно взаимодействующий с жирами) средства.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,05 г (в лечебных целях); 1,7% раствор натрия никотината (соответствует 0,1% раствору никотиновой кислоты) в ампулах по 1 мл; рН раствора для инъекций 5,0-7,0.

### 15. Аскорутин (Ascorutinum)



**Групповая принадлежность:** Поливитаминный препарат, действующее вещество: аскорбиновая кислота, рутин, в 1 таблетке содержится 50 мг рутина и 50 мг аскорбиновой кислоты. Вспомогательные вещества: сахар, стеарат кальция, тальк, картофельный крахмал.

**Фармакологическое действие:** капилляропротекторный препарат. Аскорутин снижает уровень проницаемости капилляров через блокаду фермента гиалуронидазы. Препарат оказывает заметное антиоксидантное действие, препятствуя окислению липидов в клеточных мембранах.

**Показания к применению:** Аскорутин применяется при дефиците рутина и аскорбиновой кислоты. Применяется в комплексной терапии заболеваний, которые сопровождаются ломкостью сосудов. Также препарат применяется для профилактики простудных заболеваний, повышения иммунитета и уменьшения симптомов гриппа.

**Способ применения:** обычно принимается по 1 таблетке 2-3 раза в сутки.

**Побочные действия:** при длительном использовании аскорутин возможны раздражения слизистой оболочки пищеварительного тракта, повреждение гломерулярного аппарата почек и образование оксалатных камней; аллергические реакции; нарушения сна, повышенная возбудимость; дистрофия миокарда.

**Противопоказания:** повышенная чувствительность к компонентам препарата; повышенный уровень сворачиваемости крови, гипокалиемия, оксалатурия, гиперкальциемия; склонность к тромбозам, тромбозам; цистинурия, мочекаменная болезнь, подагра; сахарный диабет, непереносимость фруктозы и тяжелые заболевания почек.

**Передозировка:** боль в области эпигастрия, тошнота, рвота, диарея, зуд, возможна кожная сыпь, повышенная возбудимость нервной системы, повышение артериального давления, головная боль, гипервитаминоз витамина С, тромбообразование. При длительном использовании возможны нарушения функции почек и инсулинового аппарата поджелудочной железы.

**Форма выпуска:** таблетки по 10 шт. в блистерах.

### 16. Викасол (Vikasolum)



**Групповая принадлежность:** Витамин К аналог синтетический (жирорастворимый витамин).

**Фармакологическое действие:** Синтетический (получаемый искусственным путем) водорастворимый аналог витамина К. Участвует в образовании протромбина. Способствует нормализации свертывания крови. При недостаточности его в организме развиваются геморрагические явления (кровоточивость).

**Показания к применению:** Желтуха вследствие задержки поступления желчи в кишечник, острые гепатиты (воспаление ткани печени). Паренхиматозные (из внутренних органов) и капиллярные кровотечения (применяется при подготовке к хирургическим операциям и после них). Кровотечения при язвах желудка и двенадцатиперстной кишки. Лучевая болезнь. Тромбопеническая пурпура (множественные кровоизлияния под кожу и/или слизистые оболочки из-за снижения уровня тромбоцитов в крови). Упорные геморроидальные (из расширенных вен прямой кишки) и носовые кровотечения. Последние месяцы беременности (для предупреждения кровоточивости у новорожденных). Геморрагическая болезнь (повышенная кровоточивость) у новорожденных. Продолжительные маточные ювенильные и пременопаузальные кровотечения (дисфункциональные маточные кровотечения до наступления полового созревания и в предменопаузальном периоде). Кровотечения при туберкулезе легких, септических заболеваниях (заболеваниях, связанных с наличием в крови микробов), сильной гипопротромбинемии (снижении содержания в крови протромбина - фактора свертываемости крови), при применении антикоагулянтов (средств, тормозящих свертывание крови) - антагонистов '(средств с противоположным

действием) витамина К: фенилина, неодикумарина и др. При гемофилии (наследственном заболевании, сопровождающемся пониженной свертываемостью крови) и болезни Верльгофа (множественных кровоизлияниях под кожу и слизистые из-за снижения уровня тромбоцитов в крови) викасол неэффективен.

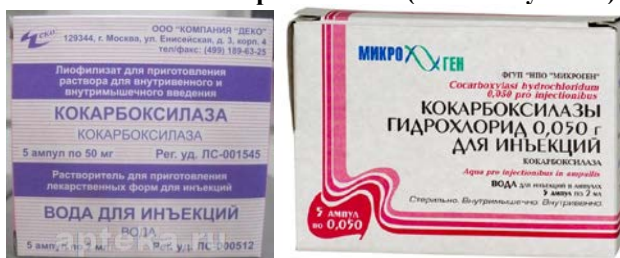
**Способ применения:** Внутрь взрослым 0,015-0,3 г в сутки; внутримышечно 0,01-0,015 г. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 0,03 г, суточная - 0,06 г; внутримышечно: разовая - 0,015 г, суточная - 0,03 г. Детям в возрасте до 1 года назначают 0,002-0,005 г, до 3 лет - 0,006 г, 3-4 лет - 0,008 г, 5-9 лет - 0,01 г, 10-14 лет - 0,015 г в сутки в 2-3 приема 3-4 дня подряд; после перерыва на 4 дня курс лечения повторяют. Перед операцией препарат назначают за 2-3 дня. Роженицам дают суточную дозу сразу после прибытия в родильный дом, а затем, если роды не наступили, через 12 ч и через 24 ч. Доза для новорожденных - не выше 0,004 г. Высшие дозы для взрослых: внутрь разовая - 0,03 г, суточная - 0,06 г; внутримышечно разовая - 0,015 г, суточная - 0,03 г.

**Побочные действия:** При передозировке в редких случаях возникает гипервитаминоз К, проявляющийся гиперпротромбинемией и гипертромбинемией (повышенным содержанием в крови протромбина и тромбина - факторов свертываемости крови), гипербилирубинемией (повышенным содержанием в крови пигмента билирубина); в единичных случаях у детей развивается токсикоз (отравление), проявляющийся судорогами.

**Противопоказания:** Повышенная свертываемость крови. Тромбоэмболии (закупорка сосудов сгустком крови).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,015 г в упаковке по 25 штук; ампулы по 1 мл 1 % раствора в упаковке по 10 штук.

### 17. Кокарбоксилаза (Cocarboxylasum)



**Групповая принадлежность:** Метаболическое средство.

**Фармакологическое действие:** Кофермент (органическое соединение небелковой природы, необходимое для проявления активности ферментов) тиамин (витамина В<sub>1</sub>). Входит в состав фермента карбоксилазы, катализирующего карбоксилирование и декарбоксилирование альфа-кетокислот. В медицинской практике применяется кокарбоксилазы гидрохлорид.

**Показания к применению:** Ацидоз (закисление) и прекоматозное состояние (неполная потеря сознания - начальная стадия развития комы, характеризующаяся сохранением болевых и рефлекторных реакций) при сахарном диабете. Нарушения сердечно-сосудистой деятельности (изменение сердечного ритма, экстрасистолия /нарушение ритма сердца/, бигеминия /нарушение ритма сердца, характеризующееся чередованием нормального и патологического сокращения/), пароксизмальная тахикардия /резкое учащение пульса неясного происхождения/ и коронарного (по сосудам сердца) кровообращения. Инфаркт миокарда.

**Способ применения:** Внутримышечно и внутривенно. При сердечно-сосудистых заболеваниях разовая доза для взрослых - 0,05-0,1 г, суточная - 0,05-0,2 г. Курс лечения - 15-30 дней. При сахарном диабете суточная доза для взрослых - 0,075-1 г. Курс лечения - 5-10 дней.

**Форма выпуска:** В ампулах вместимостью 3 мл, содержащих 0,05 г препарата, в упаковке по 5 или 10 ампул в комплекте с 5 или 10 ампулами растворителя.

### 18. Цианокобаламин (Cyanocobalamin)



**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин В<sub>12</sub>)

**Фармакологическое действие:** Эритропоэтическое, гемопоэтическое, противоанемическое, метаболическое действие. Высокая биологическая активность обеспечивает участие Цианокобаламина в липидном, углеводном и белковом обмене. Стимулирует способность тканей к регенерации, нормализует процессы кроветворения, функции нервной системы и печени, активизирует систему свертывания крови, повышает активность протромбина и тромбопластов (в высоких дозах), уменьшает уровень холестерина в крови. В организме трансформируется в кофактор - кобамид (активная форма витамина В<sub>12</sub>), который принимает

участие в переносе метильных групп и прочих одноуглеродистых фрагментов и необходим для образования ДНК и дезоксирибозы, метионина, креатина, холина. Ускоряет процесс созревания эритроцитов, способствует накоплению в них соединений с сульфгидрильными группами, тем самым увеличивая их толерантность к гемолизу. Всасывается Цианокобаламин в тонком (отчасти в толстом) кишечнике, соединяясь с внутренним фактором, становится защищенным от микрофлоры кишечника.

**Показания к применению:** Цианокобаламин применяется в терапии хронических анемий, протекающих с дефицитом витамина В<sub>12</sub> (алиментарная макроцитарная анемия, болезнь Аддисона-Бирмера), в составе комплексного лечения анемий (постгеморрагической, железодефицитной, апластической), а также анемий, вызванных лекарственными препаратами или токсическими веществами. Используется в терапии хронического гепатита, цирроза печени, печеночной недостаточности; алкоголизма, длительно протекающей лихорадки; полиневрита, невралгий (включая невралгию тройничного нерва), радикулита. Витамин В<sub>12</sub> назначается при лечении фуникулярного миелоза, гипотрофии, травм периферических нервов, детского церебрального паралича, бокового амиотрофического склероза, болезни Дауна. Цианокобаламин показан при кожных заболеваниях: псориазе, герпетическом дерматите, фотодерматите, атопическом дерматите.

**Способ применения:** Цианокобаламин применяют подкожно, внутримышечно, внутривенно и интратебно. В терапии болезни Аддисона-Бирмера назначают по 100-200 мкг в сутки через день; при макроцитарной анемии с неврологической симптоматикой – по 500 мкг и более на одно введение (в течение первой недели ежедневно, затем с промежутками между инъекциями 5-7 суток). При анемиях постгеморрагических и железодефицитных Цианокобаламин назначают по 30-100 мкг 3 раза в неделю; при лечении апластических анемий – по 100 мкг до клинико-гематологического улучшения. В терапии алиментарной анемии у недоношенных детей и детей младшего возраста назначают витамин В<sub>12</sub> по 30 мкг в сутки на протяжении 15 дней. При неврологических заболеваниях и патологии ЦНС вводят по 200-500 мкг на одну инъекцию, с постепенным наращиванием доз, при улучшении состояния – снижают дозу до 100 мкг в сутки. Курс терапии 2 недели. При травматическом поражении периферических нервов Цианокобаламин применяют по 200-400 мкг через день на протяжении 45 суток. При циррозах печени и гепатитах – 30-60 мкг ежедневно или 100 мкг через день. Терапия рассчитана на 25-40 суток.

**Побочные действия:** При применении Цианокобаламина возможны аллергические реакции (чаще в виде крапивницы), кардиалгия, тахикардия, головокружение, головная боль, возбуждение. При использовании в высоких дозировках нечасто отмечается гиперкоагуляция и нарушение пуринового обмена.

**Противопоказания:** Цианокобаламин противопоказан к применению при гиперчувствительности к препарату, эритремии, эритроцитозе, тромбоэмболии, беременности, кормлении грудью. С осторожностью применяют при стенокардии, доброкачественных и злокачественных новообразованиях, которые сопровождаются недостаточностью витамина В<sub>12</sub> и мегалобластной анемией.

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций 0,05%; 0,02%. 1 мл раствора содержит 500 или 200 мкг Цианокобаламина, по 1 мл в ампуле, по 10 ампул в картонной упаковке.

## 19. Кислота аскорбиновая (Acidum ascorbinicum)



**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин С)

**Фармакологическое действие:** Имеет важное значение для жизнедеятельности организма. Участвует в регуляции окислительно-восстановительных процессов, углеводного обмена, свертывания крови, нормальной проницаемости капилляров (мельчайших сосудов), образования стероидных гормонов, синтеза коллагена и проколлагена. Повышает устойчивость организма к инфекциям.

**Показания к применению:** Профилактика и лечение авитаминоза и гиповитаминоза С (отсутствия поступления и пониженного поступления витамина С в организм). Геморрагические диатезы (повышенная кровоточивость). Кровотечения (носовые, легочные, печеночные, маточные и др.). Инфекционные заболевания. Интоксикации (отравления). Заболевания желудочно-кишечного тракта (ахилия /отсутствие выделения в желудке соляной кислоты и ферментов/, язвенная болезнь, энтероколиты /воспаление тонкой и толстой кишки/). Повышенная физическая и умственная нагрузка.

**Способ применения:** Для профилактики внутрь 0,05-1 г раз в сутки взрослым. Для лечения взрослым 0,05-0,1 г 3-5 раз в день. Парентерально (минуя желудочно-кишечный тракт) вводится в виде аскорбината натрия по 1-3 мл 5% раствора. Разовая доза - не выше 0,2 г, суточная - 0,5 г. Детям назначают внутрь для



профилактики по 0,02-0,03 г в сутки; для лечения по 0,05-0,1 г 1-2 раза в день, парентерально 1-2 мл 5% раствора в день в течение 2-3 нед.

**Побочные действия:** Угнетение инсулярного аппарата поджелудочной железы (клеток поджелудочной железы, вырабатывающих инсулин), глюкозурия (наличие сахара в моче), угнетение синтеза гликогена.

**Противопоказания:** Тромбофлебиты (воспаление стенки вен с их закупоркой). Наклонность к тромбозам (образованию сгустка крови в сосуде).

**Форма выпуска:** Порошок; драже по 0,05 г в упаковке по 50 г; таблетки для витаминизации пищи по 0,5 г и по 2,5 г; таблетки аскорбиновой кислоты по 0,025 г с глюкозой весом по 3 г в упаковке по 10 штук для детей; таблетки аскорбиновой кислоты по 0,1 г и глюкозы по 0,877 г в упаковке по 12 штук; ампулы 5% раствора в упаковке по 10 штук по 1 мл, по 2 мл и по 5 мл; ампулы 10% раствора в упаковке по 10 штук по 1 мл, 2 мл, 5 мл; комбинированные таблетки (0,1 г аскорбиновой кислоты и 0,005 г фолиевой кислоты) в упаковке по 50 штук.

## 20. Кальция пантотинат (Calcii pantothenas)



**Групповая принадлежность:** Водорастворимый витамин (витамин В<sub>5</sub>)

**Фармакологическое действие:** Входит в состав кофермента А (органического соединения небелковой природы, необходимого для проявления активности ферментов). Играет важную роль в процессах ацетилирования и окисления. Участвует в углеводном и жировом обмене и в синтезе ацетилхолина.

**Показания к применению:** Полиневриты (множественное воспаление периферических нервов), невралгии (боль, распространяющаяся по ходу нерва), парестезии (чувство онемения в конечностях), фотодерматозы (заболевания, связанные с повышенной чувствительностью кожи к солнечному свету), экземы, красная волчанка. Аллергические реакции (дерматиты -воспаление кожи, сенная лихорадка). Трофически язвы (медленно заживающие дефекты кожи), ожоги. Токсикозы беременных. Катары верхних дыхательных путей, бронхит (воспаление бронхов), бронхиальная астма. Послеоперационная атония (потеря тонуса) кишечника. Интоксикация (отравление) стрептомицином.

**Способ применения:** Внутрь взрослым по 0,1-0,2 г 2-4 раза в день. Детям в возрасте от 1 года до 3 лет по 0,05-0,1 г на прием, от 3 до 14 лет по 0,1-0,2 г на прием 2 раза в день. Суточная доза для взрослых - 0,4-0,8 г, для детей - 0,1-0,4 г. При атонии кишечника назначают по 0,25 г каждые 6 ч. Парентерально (минуя желудочно-кишечный тракт) вводят взрослым по 0,2-0,4 г (2-4 мл 10% раствора или 1-2 мл 20% раствора) 1-2 раза в день, детям до 3 лет вводят в разовой дозе 0,05-0,1 г (0,5-1,0 мл 10% раствора), от 3 до 14 лет - по 0,1-0,2 г (1-2 мл 10% раствора) 1-2 раза в день. Курс лечения - 3-4 мес. В дерматологической практике (при лечении кожных болезней) применяют в больших дозах: у взрослых - по 1,5 г в сутки, у детей - по 0,1-0,3 г 2-3 раза в день. Для коррекции побочного действия противотуберкулезных препаратов таблетки и растворы кальция панто-тената назначают в течение всего курса лечения. При абстинентном синдроме (состоянии, возникающем у алкоголиков в результате внезапного прекращения приема алкоголя) препарат назначают внутривенно или внутримышечно (в зависимости от тяжести состояния) по 0,5 г в день (5 мл 10% раствора), при алкогольном делирии (остром алкогольном психозе) - по 1 г (10 мл 10% раствора) в течение 10 дней. При заболеваниях верхних дыхательных путей и бронхов используют в виде аэрозолей: применяют 4% раствор (0,2 г в 5 мл воды), который вдыхают по 10-15 мин ежедневно в течение 7-8 дней.

**Побочные действия:** Возможны тошнота, рвота, азотемия (избыточное содержание в крови азотсодержащих продуктов).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,1 г в упаковке по 50 штук; ампулы по 2 и 5 мл 10% раствора; ампулы по 2 мл 20% раствора в упаковке по 10 штук.

## Антибактериальные средства

Антибактериальные средства применяются при лечении заболеваний бактериальной природы – так называемых системных инфекций.

Для большинства антибактериальных средств характерно:

1. Определенный спектр антибактериального действия, который может быть либо избирательным (действие на строго определенные группы бактерий), либо широким (действие на все или подавляющее большинство бактерий);
2. Относительно низкая токсичность;

Выделяют два вида действия антибактериальных средств:

1. **Бактерицидное** (в результате разрушается микробная клетка);
2. **Бактериостатическое** (при котором блокируется процесс размножения микробных клеток);

При лечении антибактериальными средствами применяют **пероральный и парэнтеральный пути введения**, реже эти средства применяются – **местно** (в виде мазей). Выбор правильного пути введения антибактериальных средств является крайне важным фактором, поскольку при неправильном пути введения терапевтический эффект будет либо заниженным либо вообще отсутствовать. Так, большинство антибиотиков из группы пенициллинов полностью разрушаются в желудочно-кишечном тракте и при введении их через ЖКТ никакого терапевтического действия не окажут и пр.

Для правильного выбора лекарственных средств и их эффективного применения важна правильная диагностика заболевания, а именно – установление **возбудителя** инфекции. В том случае, если возбудитель установлен – подбираются наиболее активные вещества. Если установить возбудитель не представляется возможным – применяются препараты **широкого спектра действия** или **комбинация** из (предположительно) наиболее активных веществ.

Лечение антибактериальными средствами следует начинать как можно раньше в **достаточных дозах** (иногда применяются **ударные дозы**). Заниженные дозы могут привести к постепенной выработке «иммунитета» у микробной клетки к данному лекарственному средству, с последующей потерей терапевтической эффективности такого лекарственного средства. По этой же причине **продолжительность** лечения антибактериальными средствами должна быть – **оптимальной** (препарат не должен отменяться слишком рано, но лечение не должно продолжаться длительнее необходимого). При этом иногда целесообразно проведение **повторных курсов** лечения.

При лечении бактериальных инфекций важным является правильное сочетание лекарственных препаратов при котором исключалась бы возможность как их антагонизма, так и потенцирования эффектов.

Антибактериальные средства (например, антибиотики), которые являются наиболее эффективными при лечении данной инфекции, называются препаратами выбора (основным). Вместе с тем, наряду с препаратами выбора определяются также резервные препараты, которые применяются в случае неэффективности основного лекарственного средства либо проявления нежелательных побочных эффектов при их применении.

## АНТИБИОТИКИ

**Антибиотики** – вещества микробного, растительного или животного происхождения (биологической природы), способные подавлять жизнедеятельность микроорганизмов. В основе антимикробного действия лежит явление антагонизма (антибиоза) между различными видами микробов в природе.

Это явление было известно науке с давних времен, но первые лекарственные препараты из группы антибиотиков были получены только в 1943 г. (стрептомицин). В настоящее время в медицине применяются более 30 лекарственных препаратов из различных группы антибиотиков (в различных лекарственных формах).

Природным источником (продуцентами) антибиотиков являются грибы (плесневые, лучистые) а также некоторые бактерии. В настоящее время широко применяются синтетические аналоги природных антибиотиков.

Избирательность действия антибиотиков на микробные клетки и их малая токсичность в отношении организма в целом, связана с отличием в строении микробной клетки (именно, в клеточной мембране) в которой содержится мукопептид муреина, отсутствующий в клетках макроорганизма (человека или животного).

В настоящее время существуют несколько видов классификации антибиотиков, основанных на их различных признаках и свойствах.

Так, **по общему спектру действия** антибиотики делят на:

1. Противобактериальные;
2. Противогрибковые;
3. Противоопухолевые;

**По механизму антибактериального действия** делят на :

1. Антибиотики, оказывающие бактерицидное действие;
2. Антибиотики, оказывающие преимущественно бактериостатическое действие;

**Которые в свою очередь делят на антибиотики:**

1. Действующие на грамположительные микроорганизмы (пенициллины, эритромицин, олеандромицин, ристомицин, линкомицин и пр.);
2. Антибиотики широкого спектра действия (как грамположительные, так и грамотрицательные) (тетрациклины, левомицетин, стрептомицин);
3. Антибиотики подавляющие патогенные грибы (нистатин, гризеофульвин и пр.);

Бактерицидный эффект антибиотиков проявляется за счет нарушения целостности оболочки либо синтеза клеточной стенки микробной клетки или нарушения проницаемости цитоплазматической мембраны. Бактерицидное действие оказывают антибиотики из группы пенициллинов, цефалоспоринов, противогрибковые антибиотики и пр.

Бактериостатический эффект проявляется вследствие нарушения синтеза белков или РНК внутри микробной клетки, чем тормозится ее рост, развитие и деление. Бактериостатическое действие постепенно переходит в бактерицидное. К антибиотикам оказывающим преимущественно бактериостатическое действие относятся тетрациклины, левомицетин, эритромицин, олеандромицин и др.

**- Бактерицидный эффект проявляется за счет нарушения синтеза оболочки микробной клетки или изменения ее проницаемости (пенициллины, цефалоспорины и пр.)  
Стенка бактерий содержит мукопептид - муреин.**

**- Бактериостатический эффект: (тетрациклины, левомицетин, эритромицин) нарушают синтез белков внутри микробной клетки и тормозит их развитие.  
При увеличении дозы - бактериостатический эффект переходит в бактерицидный.**

Основная классификация антибиотиков связана с их химическим строением, в зависимости от которого эти вещества подразделяют на следующие группы:

1. Имеющие в структуре  $\beta$  лактамное кольцо (пенициллины, цефалоспорины);
2. Макролиды (эритромицин) и азалиды (азитромицин) – включают макроциклическое кольцо;
3. Группа тетрациклинов (содержат четыре шестичленных цикла).
4. Группа левомицетина;
5. Аминогликозиды (содержащие аминсахара – стрептомицин, гентамицин).
6. Группа циклических полипептидов (полимиксины);
7. Линкозамиды (линокмицин, клиндамицин);
8. Гликопротеиды (ванкомицин);
9. Разных химических групп (фузафкнжин, фузидиевая кислота).



## Пенициллины

**Пенициллины** – одна из основных и наиболее применимых в медицине групп антибиотиков.

Различают природные и полусинтетические пенициллины. Источником природного пенициллина (бензилпенициллин) является природная зеленая плесень (*Penicillum*). Пенициллины подавляют жизнедеятельность стрептококков, стафилококков, пневмококков, гонококков, возбудителей сибирской язвы, газовой гангрены, а также бледной спирохеты.

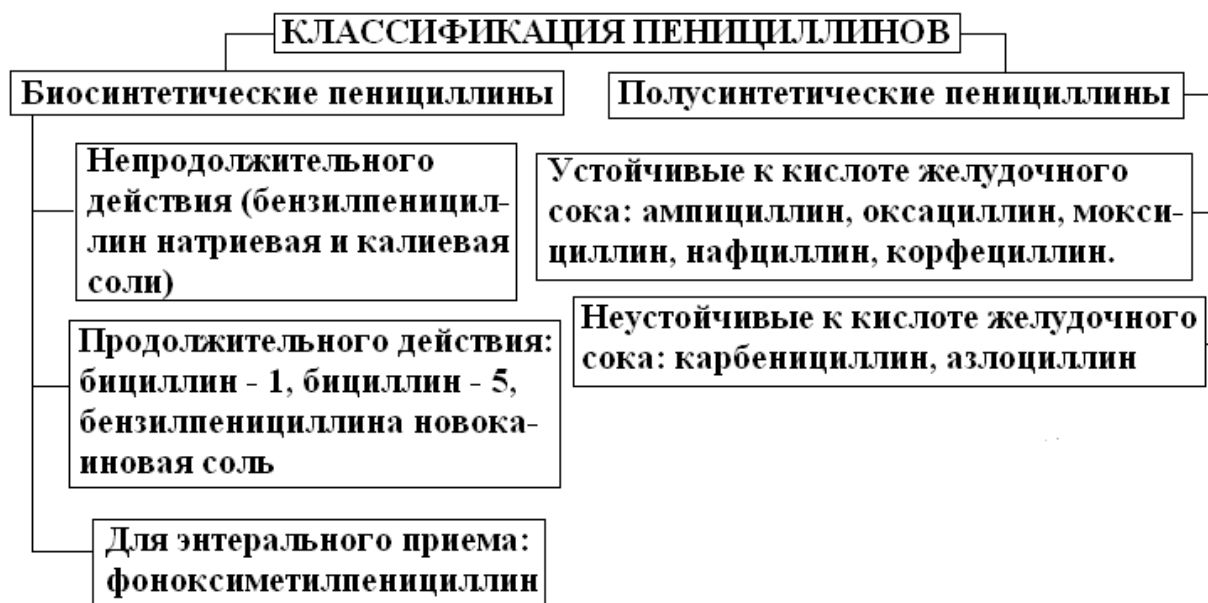
Бензилпенициллин эффективен при введении только **парентерально** (преимущественно внутримышечно). При введении перорально (через рот) полностью разрушается желудочным соком и пищеварительными ферментами.

Антибиотики из группы пенициллинов классифицируют на следующие группы:

1. **Биосинтетические (природные)** пенициллины, которые в свою очередь делят на вещества:
  - а) непродолжительного действия (как правило растворимые в воде) – бензилпенициллина натриевая и калиевая соль.
  - б) продолжительного действия (нерастворимые в воде суспензии) – бензилпенициллина новокаиновая соль, бициллин – 1; бициллин – 5.
  - в) биосинтетические пенициллины для энтерального приема – фоноксимелилпенициллин;

## 2. Полусинтетические пенициллины:

- а) устойчивые к действию кислоты желудочного сока пригодные для перорального приема – ампициллин, оксациллин, нафциллин и пр.
- б) не устойчивые к действию кислоты желудочного сока не пригодные для перорального приема – карбенициллин, азлоциллин;



Среди природных (биосинтетических) антибиотиков наиболее широкое применение имеют лекарственные препараты – бензилпенициллина натриевая или калиевая соль. Эти лекарственные препараты хорошо растворимы в воде, быстро всасываются (максимальная концентрация в крови – через 30 мин.), но быстро выводятся из организма, оказывая непродолжительное действие. Для поддержания необходимой концентрации в крови препарат необходимо вводить через каждые 3 – 4 часа.

При лечении осложнений или хронических заболеваний применяются пенициллины пролонгированного (продленного) действия. Эти препараты – являются суспензиями, не растворимы в воде и вводятся исключительно внутримышечно. Вследствие медленного рассасывания в месте введения создается необходимая концентрация препарата, которая поддерживается длительное время. К нерастворимым в воде препаратам пролонгированного действия из группы пенициллинов относятся: бензилпенициллина новокаиновая соль, бициллин 1, а также комбинация – бициллин 5.

Среди пенициллинов выделяют группу препаратов обладающих свойством кислотоустойчивости к кислоте желудочного сока, пригодные для перорального применения. К ним относится феноксиметилпенициллин,

который хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, при этом не разрушается пищеварительными ферментами кислотой желудочного сока.

Все препараты группы пенициллинов обладают высокой антибактериальной активностью, вместе с тем у бактерий достаточно быстро вырабатывается «иммунитет» к действию пенициллина, особенно при его применении в небольших дозах. Бактериальные клетки вырабатывают фермент «пенициллиназу», который разрушает пенициллин, в связи с чем пенициллин оказывается неэффективным при дальнейшем его применении.

Высокую устойчивость к действию бактериальной пенициллиназы проявляют препараты из группы полусинтетических пенициллинов (метициллин, оксациллин), «привыкание» к которым у бактериальных клеток не вырабатывается. Препараты из группы полусинтетических пенициллинов проявляют высокую активность в отношении бактерий, устойчивых к действию природного пенициллина.

Мелициллин аналогичен бензилпенициллину, но устойчив к пенициллиназе. Устойчивостью к бактериальной пенициллиназе обладает также оксациллин, который к тому же устойчив к действию кислоты желудочного сока и может применяться перорально. Лекарственный препарат этой группы - диклксициллин превосходит метациллин и оксациллин по антибактериальной активности.

Некоторые препараты из группы полусинтетических пенициллинов, такие как ампициллин, амоксициллин, карбенициллин и др., не обладают устойчивостью к действию бактериальной пенициллиназы. Вместе с тем, эти лекарственные препараты обладают широким спектром действия, подавляя как грамположительные, так и грамотрицательные бактерии, а ампициллин обладает также устойчивостью к кислоте желудочного сока.

Препараты группы пенициллина не токсичны, но могут вызывать аллергические реакции (как правило, немедленного типа). Аллергическая реакция проявляется в виде сыпи на коже, отеков, болях в суставах, крайне редко встречаются случаи анафилактического шока.

### **Цефалоспорины**

Антибиотики из группы **цефалоспоринов**, так же как и пенициллины содержат лактомное кольцо и сходны по строению с пенициллинами. (отличие цефалоспоринов от пенициллинов по строению заключается в том, что цефалоспорины содержат дигидротиазиновое кольцо, пенициллины – тиазолидиновое). К цефалоспорином относятся такие лекарственные препараты, как цефазолин, цефаклор, цефотаксим, цефалотин и пр.

Антибиотики из группы цефалоспоринов обладают устойчивостью к пенициллиназе, оказывают бактерицидное действие, обладают широким спектром действия и по антибактериальной активности близки к ампициллину.

Цефалоспорины, используют в качестве резервных антибиотиков поскольку проявляют ряд негативных побочных эффектов, такие как аллергию, поражение почек, диспептические явления и пр. Применяют, как

правило, при устойчивости бактерий к антибиотикам других групп (пенициллинам).

### ЦЕФАЛОСПОРИНЫ

**По строению сходны с пенициллином, содержат лактомное кольцо (дигидротиазиновое). К ним относятся цефазолин, цефаклор, цефокасин, цефалотин и др. Устойчивы к пенициллиназе, по силе действия близки к амициллину, оказывают бактерицидное действие. Некоторые применяются энтерально, но в качестве резервных антибиотиков (обладают рядом побочных эффектов: поражают почки, вызывают диспептические нарушения.**

#### **Карбапенемы, монобактамы**

Карбапенемы и монобактамы обладают широким спектром действия (эффективны в отношении аэробных и анаэробных бактерий). К препаратам этой группы относятся тиенам, имипенем, азтроенам.

#### **Макролиды азолиды**

К антибиотикам этой группы относятся такие лекарственные препараты, как эритромицин, олеандромицин, рокситромицин, кларитромицин (макролиды); азитромицин (азолиды). Препараты этой группы содержат в своем составе макроциклическое лактомное кольцо.

Макролиды оказывают бактериостатическое действие (угнетают синтез белков в микробной клетке). По спектру анимикробного действия близки к антибиотикам группы пенициллина (наиболее активны в отношении грамположительных бактерии и спирохет) и способны подавлять бактерии выработавшим устойчивость к пенициллинам.

Кроме того, макролиды и азолиды эффективны в отношении микоплазм и хламидий, вызывающий «атипичную» пневмонию.

Вместе с тем к самим антибиотикам этой группы бактериальные клетки достаточно быстро вырабатывают устойчивость, поэтому применяются в основном в качестве резервных.

Макролиды, как правило, хорошо переносятся не оказывают побочных эффектов (аллергических реакций). Азолиды сходны по основным характеристикам и свойствам с макролидами, но отличаются от последних по химическому строению. Олеандомицин выпускается в виде комплексного



препарата с антибиотиками групп тетрациклина (олететрин, тетраолеан и пр.).

#### МАКРОЛИДЫ И АЗОЛИДЫ

**К ним относятся: эритромицин, олеандромицин, рокситромицин (макролиды), азитромицин (азолиды).**  
**Содержат макроциклическое лактонное кольцо.**  
**Угнетают синтез белка - оказывают бактериостатическое действие**

**Спектр антимикробного действия близок к пенициллину. Наиболее чувствительны - грамположительные и патогенные спирохеты, подавляют устойчивые к пенициллину микроорганизмы.**  
**Бактерии быстро приобретают устойчивость к макролидам, поэтому эти антибиотики являются резервными.**  
**Азолиды сходны по действию с макролидами, но отличаются по хим. строению. Эффективны также в отношении хламидий, микроплазм (вызывают атипичные пневмонии).**

### Тетрациклины

Антибиотики группы тетрациклинов имеют в своем строении четыре конденсированных шестичленных цикла.

Некоторые препараты из этой группы (тетрациклин, окситетрациклина дигидрат, демеклоциклин и пр.) являются биосинтетическими (природным). Часть антибиотиков группы тетрациклина относятся к полусинтетическим (метациклина гидрохлорид, доксициклина гидрохлорид и пр.).

Тетрациклины относятся к антибиотикам широкого спектра действия (подавляют как грамположительные, так и грамотрицательные бактерии), обладают чрезвычайно высокой антибактериальной активностью. Антибиотики этой группы эффективны в отношении возбудителей газовой гангрены, дизентерии, брюшного тифа, холеры, чумы, дифтерийной палочки, сибирской язвы, различных кокков, а также простейших (трихомонадов и амёб). Тетрациклины активны в отношении бактерий, проявляющих устойчивость к другим группам антибиотиков.

Антибиотики из группы тетрациклинов оказывают бактериостатическое действие (угнетают синтез белка рибосомами бактерий). Кроме того, препараты этой группы связывают микроэлементы микробной клетки, ингибируя ферментные системы.

Тетрациклины не разрушаются под действием пищеварительных ферментов и кислоты желудочного сока и быстро всасываются в кровь из ЖКТ, поэтому применяются перорально. Вместе с тем, имеются лекарственные формы для парентерального применения (растворимые в воде соли тетрациклинов – тетрациклина гидрохлорид, окситетрациклина

гидрохлорид и пр.), а также мази для наружного применения (1% мазь тетрациклина).

Вместе с тем, антибиотики из группы тетрациклинов проявляют ряд негативных побочных эффектов, осложняющих их применение. Так, тетрациклины обладают свойством кумуляции, накапливаясь в печени, костной ткани, зубах, слизистой оболочке желудочно-кишечного тракта, что может привести к нарушению работы печени, желудочно-кишечного тракта, пожелтению и разрушению зубов.

Осложнением при лечении антибиотиками группы тетрациклинов являются так называемые «суперинфекции». Обладая широким спектром действия тетрациклины подавляют не только болезнетворные, но и полезную (сопрофитную) микрофлору кишечника, способствуя развитию в кишечнике дрожжевых грибов (кандидомикоз), а также развитию инфекций другими бактериями, не чувствительными к тетрациклинам, особенно опасны при этом пневмония и стафилококковый энтероколит. Для предупреждения развития суперинфекций антибиотики группы тетрациклинов комбинируют с антибиотиками других групп, а также с противогрибковыми средствами.

Осложнением при применении тетрациклинов является развитие кандидамикоза. (Кандидамикоз (*candidamycosis*; синоним кандидоз) — инфекционное заболевание кожи, слизистых оболочек и внутренних органов, вызываемое дрожжеподобными грибами рода *Candida*). Также резко повышается чувствительность кожи к солнечным лучам.

Тетрациклины оказывают тератогенное действие на плод, которое осложняется способностью антибиотиков этой групп к кумуляции (действие антибиотиков сохраняется длительное время после прекращения их приема), поэтому при беременности препараты этой группы категорически противопоказаны. Противопоказаниями являются также заболевания печени, почек, лейкопения, грибковые заболевания кожи и пр.

## ТЕТРАЦИКЛИНЫ

**Структурная основа - четыре конденсированных шестичленных цикла.**

**Представители: тетрациклин, окситетрациклина дигидрат, демеклоциклин. Полусинтетические: метациклина гидрохлорид, доксициклина гидрохлорид.**

**Антибиотики широкого спектра действия: грамположительные, грамотрицательные, кокки, дифтерийная палочка, сибирская язва, столбняк, брюшковой тиф, холера, чума и пр. Активны к микроорганизмам устойчивым к другим антибиотикам.**

**Основной путь введения - энтеральный (возможно парентеральное или в виде мазей 1%).**

**Механизм действия связан с синтеза белка рибосомами бактерий (бактериостатическое действие). Кроме того, тетрациклины связывают микроэлементы (соли кальция, магния), ингибируя ферментные системы микробной клетки.**

**Тетрациклины обладают кумулятивным действием, накапливаются в тканях, костях, зубах, проявляют тератогенное действие. Способны вызывать суперинфекции (вызывая кандидомикоз).**

### Левомецетин

Левомецетин является одним из наиболее распространенных антибиотиков, применяемых в медицинской практике, который в настоящее время получают синтетическим путем

Левомецетин относится к антибиотикам широкого спектра, сходным по своим показателям с антибиотиками группы тетрациклина, вместе с тем, левомецетин более эффективен при лечении кишечных инфекций (таких как, брюшной тиф, паратифы и пр).

Сам левомецетин хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, для лечения кишечных инфекций применяется левомецетина стеарат, который в ЖКТ всасывается плохо, в результате чего создается высокая концентрация препарата в кишечнике, а также длительность терапевтического действия препарата. Для парентерального применения используется левомецетина сукцинат растворимый.

Левомецетин может применяться в мазях и линиментах (линимент синтомицина 1%, 5 или 10 %). Действующим веществом синтомицина является левомецетин. Линимент синтомицина эффективен при гнойничковых поражениях кожи, а также при лечении ожогов, трахом и пр. Синтомицин токсичнее левомецетина и не применяется внутрь.

Левомецетин вызывает ряд негативных побочных эффектов, таких как, аллергию, лейкопению, при его применении возможны нарушения психики и пр., поэтому, несмотря на широкий спектр антимикробного действия левомецетин применяется исключительно для лечения кишечных инфекций. В других случаях используется в качестве резервного антибиотика.

Левомецетин противопоказана при псориазе, нарушениях функций кроветворения, заболеваниях печени.

### **Линкозамиды**

В группу антибиотиков из группы линкозамидов входят лекарственные препараты линкомицин (линкомицина гидрохлорид) и клиндамицин. Антибиотики этой группы оказывают бактериостатическое действие (нарушают синтез белка микробной клетки). Эффективны в отношении стафилококков, стрептококков и анаэробных бактерий. Могут применяться как парентерально, так и перорально, в основном при кишечных инфекциях, пневмонии и пр.

Лекарственные препараты из группы линкозамидов, как правило, применяются при тяжелых септических состояниях, когда антибиотики прочих групп являются не эффективными.

Линкозамиды вызывают нежелательные побочные эффекты, возможны диарея, колит (дификация с кровавыми выделениями), лейкопения, а также аллергические реакции. Препараты этой группы противопоказаны при заболеваниях печени, почек, беременности.

### **Аминогликозиды**

Представителями антибиотиков группы аминогликозидов являются стрептомицин, неомицин, мономицин, канамицин, гентамицин и пр.

Аминогликозиды оказывают бактериостатический и бактерицидный эффект, угнетая синтез белка в рибосомах микробной клетки.

Наиболее широкое распространение среди антибиотиков этой группы получил лекарственный препарат – стрептомицин, получаемый из культуральной жидкости лучистого грибка.

Стрептомицин относится к антибиотикам широкого спектра действия угнетая рост стрептококков, стафилококков, возбудителей туляремии, бруцеллеза, чумы. Особенно ценным свойством стрептомицина является его способность угнетать жизнедеятельность туберкулезной палочки, в связи с чем стрептомицин находит широкое применение в качестве противотуберкулезного средства.

Стрептомицин применяется парентерально, поскольку плохо всасывается из желудочно-кишечного тракта, но для лечения кишечных инфекций может применяться и перорально. Стрептомицин не способен преодолеть гематоэнцефалический барьер, поэтому при необходимости создания необходимых концентраций в спинномозговой жидкости должен вводиться в спинномозговой канал, в головном мозге при менингите – вводится под оболочки мозга (для этих целей применяется стрептомицина хлоркальциевый комплекс).

Обычно же стрептомицин применяется в основном внутримышечно, 1 -2 раза в сутки (лекарственный препарат – стрептомицина сульфат).

Стрептомицин дает ряд крайне негативных побочных эффектов и тяжелых осложнений. Так, при применении стрептомицина отмечаются нарушение равновесия и значительное ухудшение слуха (ортотоксический эффект), особенно у детей раннего возраста, а также поражаются почки

(нефротоксический эффект). Применение стрептомицина при беременности оказывает тератогенное действие на плод, при этом отмечается нарушение слуха или полной глухоты у родившегося ребенка. Кроме того, стрептомицин способен вызывать аллергические реакции в виде зуда, сыпи, отеков.

Прочие лекарственные средства из группы аминогликозидов (мономицин, канамицин, гентамицин и пр.) также относятся к антибиотикам широкого спектра действия. Все лекарственные средства этой группы, при их парентеральном введении, обладают аналогичным со стрептомицином побочным действием – способны поражать органы слуха и почки (ототоксический и нефротоксический эффекты). Поэтому аминогликозиды редко применяются парентерально, но могут применяться перорально, поскольку плохо всасываясь из желудочно-кишечного тракта, создают высокие концентрации лекарственных веществ в ЖКТ, способствуя эффективному лечению инфекционных заболеваний кишечника.

Некоторые из аминогликозидов (неомицин) применяются наружно, в виде мази, при лечении инфицированных ран, гнойных заболеваний кожи и пр.

#### АМИНОГЛИКОЗИДЫ - СТРЕПТОМИЦИН

**Представители: стрептомицин, неомицин, мономицин, канамицин, гентамицин, сизомицин и пр.**

**Стрептомицин - имеет наибольшее распространение. Подавляет жизнедеятельность туберкулезной палочки, стрепто и стафилококков, возбудителя туляримии, бруцеллеза, чумы и пр.**

**Плохо всасывается из ЖКТ (вводится внутримышечно) плохо преодолевает гематоэнцефалический барьер (вводится под оболочки мозга при менингите - стрептомицина хлоркальциевый комплекс), либо в спинно мозговой канал. При приеме внутрь создается высокие концентрации в ЖКТ.**

**Вызывает тяжелые осложнения, среди которых - нарушение равновесия и слуха (ототоксическое действие), применение при беременности ведет к глухоте ребенка.**

**Прочие аминогликозиды сходны по действию и побочным эффектам, антибиотики широкого спектра действия, назначаются непродолжительно**

#### Антибиотика различных групп

Ристомицина сульфат эффективен при тяжелых септических состояниях. Препарат вводят внутривенно – капельно, применяется в случаях устойчивости бактериальной инфекции к антибиотикам других групп.

Фузидин натрия эффективен при стафилококковом сепсисе, пневмонии, отите и пр. Применяется перорально.

Полимиксин эффективен в отношении грамотрицательных бактерий, особенно - синегнойной палочки. Плохо всасывается из желудочно-кишечного тракта и может применяться при лечении кишечных инфекций.

Чаще полимиксин применяется наружно, при лечении гнойных заболеваний кожи, глаз, ушей.

При парентеральном введении полимиксин проявляет ряд негативных побочных эффектов, среди которых отмечают нарушение центральной нервной системы и функции почек (нефротоксический эффект).

### **Комбинированное применение антибиотиков. Осложнения при лечении антибиотиками**

При одновременном применении нескольких антибиотиков между ними возможно возникновение явлений антагонизма или синергизма.

Уменьшение терапевтического эффекта при взаимном антагонизме антибиотиков является характерным явлением их при одновременном применении. Особенно это свойственно для лекарственных препаратов проявляющих бактерицидное и бактериостатическое действия, поскольку бактерицидное действие в этом случае практически не проявляется.

Явление синергизма (усиление действия лекарственных средств при их одновременном применении) способствует усилению антибактериального эффекта, однако это явление крайне нежелательно при воздействии на организм человека, поскольку при этом усиливаются не только антимикробные свойства веществ, но возможно также потенцирование нежелательных побочных эффектов.

Осложнения при применении антибиотиков проявляются в виде общих (неспецифических) реакций, например, аллергии (различного вида и тяжести). Особенно часто аллергические реакции на действие антибиотиков проявляются у детей (например, при употреблении лекарственных средств из группы пенициллинов) и у лиц страдающих аллергическими заболеваниями.

При длительном применении антибиотиков (например, тетрациклинов) в кишечнике подавляются не только болезнетворные бактерии, но и вся прочая микрофлора, в том числе – нормальная (полезная). Кроме того, нарушается синтез витаминов, продуцируемых в кишечнике. При подавлении нормальной микрофлоры в кишечнике начинают развиваться инородные микроорганизмы и патогенные грибы, устойчивые к действию антибиотика (суперинфекции). Например, дрожжеподобные грибы *Candida*, стафилококковые инфекции и пр.

Нарушение баланса нормальной микрофлоры кишечника называется – дисбактериозом. Вследствие дисбактериоза в кишечнике, прежде всего, начинают активно развиваться грибковые заболевания (кандидомикоз), подавляемые в обычных условиях нормальной кишечной микрофлорой, поскольку при дисбактериозе грибы имеющиеся в кишечнике из сапрофитов биотрансформируются в паразитов, приобретая патогенные свойства (Сапрофиты — микроорганизмы, использующие в качестве источников питания субстраты из неживых объектов, в противоположность микробам-паразитам, способным жить за счет продуктов обмена в тканях живых организмов).

Противомикробная эффективность сочетаний двух химиопрепаратов

Препараты	Пенициллин	Эритромицин	Оксациллин	Ристомицин	Стрептомицин	Мономицин	Канамидин	Неомицин	Тетрациклин	Левомипетин	Нитрофураны	Сульфаниламиды	Нистатин, леворин
Пенициллин		++	++	++	++	++	++	++	++	++	++	++	++
Эритромицин	++		++	+	+	+	+	+	++	++	++	+	+
Оксациллин	++	++		+	+	+	+	+	++	++	++	+	+
Ристомицин	++	+	+		+	+	+	+	+	+	+	+	+
Стрептомицин	+++	+	+	+		+	+	+	+	+	+	+	+
Мономицин	++	+	+	+	+		+	+	+	+	+	+	++
Канамидин	++	+	+	+	+	+		+	+	+	+	+	++
Неомицин	+	+	+	+	+	+	+		+	+	+	+	++
Тетрациклин	±	+++	+++	+	+	+	+	+		+	+	+	+++
Левомипетин	±	++	++	+	+	+	+	+	+		+	+	+++
Нитрофураны	++	++	++	++	+	+	+	+	++	++		++	+
Сульфаниламиды	++	+	+	+	+	+	+	+	+	+	+		+
Нистатин, леворин	++	+	+	+	+	+	+	++	++	+++	+	+	

Примечание. (+++) наиболее рациональная комбинация; (++) рациональная, (+) — иррациональная, ( ) — недопустимая комбинация.

### Краткая характеристика препаратов:

#### 1. Доксициклин (Doxycyclinum)



Групповая принадлежность: Антибиотик (группа тетрациклина)

**Фармакологическое действие:** Полусинтетический антибиотик группы тетрациклина широкого спектра действия. Оказывает бактериостатическое действие. Активен в отношении грамположительных микроорганизмов: Аэробных кокков - *Staphylococcus* spp. (в том числе продуцирующих пенициллиназу), *Streptococcus* spp., в том числе *Streptococcus pneumoniae*. Аэробных спорообразующих бактерий - *Bacillus anthracis*; аэробных неспорообразующих бактерий - *Listeria monocytogenes*; анаэробных спорообразующих бактерий - *Clostridium* spp. Препарат активен так же в отношении грамотрицательных микроорганизмов: Аэробных кокков - *Neisseria gonorrhoeae*. Аэробных бактерий - *Escherichia coli*, *Shigella* spp., *Salmonella* spp., *Enterobacter* spp., *Klebsiella* spp., *Bordetella pertussis*. Препарат активен также в отношении *Rickettsia* spp., *Treponema* spp., *Mycoplasma* spp. и *Chlamydia* spp.

Максимальная концентрация доксициклина в плазме крови определяется через 2 ч после приема внутрь. Связывание с белками плазмы - 80-95%. Период полувыведения составляет от 15 до 25 ч.

**Показания к применению:** Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами, в том числе внутриклеточными патогенами: • Инфекции нижних отделов дыхательных путей (острый бронхит, обострения хронического бронхита, пневмония, плеврит, эмпиема плевры); • Инфекции ЛОР-органов (ангина - тонзиллит, синусит, отит); • Инфекции ЖКТ (холецистит, холангит, перитонит, проктит, периодонтит); • Инфекции мочевых путей - пиелонефрит, уретрит; • Воспалительные заболевания органов малого таза у женщин (эндометрит); • Острый и хронический простатит, эпидидимит; • Гнойные инфекции мягких тканей, угревая сыпь, включая *acne vulgaris* и *acne conglobata*; • Инфекционные язвенные кератиты;

**Способ применения:** Внутрь: После еды. Больной должен запивать лекарство достаточным количеством жидкости, чтобы таким образом уменьшилась возможность раздражения пищевода. Суточную дозу следует принимать сразу или разделено в 2 приема, каждые 12 часов: Для большинства инфекций рекомендуется в 1-й день лечения доза 200 мг препарата. В последующие дни - по 100-200 мг/сут в зависимости от тяжести течения заболевания. Инфекции, вызванные хламидией, микоплазмой и уреоплазмой, эффективно лечат стандартной дозой доксициклина в течение 10-14 дней.

**Побочные действия:** Возможно: тошнота, рвота, анорексия, боли в животе, диарея, аллергические реакции в виде отека, зуда, кожной сыпи (в сиропе могут содержаться сульфиты, которые могут вызывать аллергические реакции вплоть до анафилаксии и тяжелых приступов бронхиальной астмы), головокружение, потливость. Редко: отек Квинке, фотосенсибилизация, эозинофилия.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к доксициклину и тетрациклинам; Беременность (вторая половина); Кормление грудью (на период лечения следует воздержаться от грудного вскармливания); Детский возраст до 9 лет (период развития зубов); Порфирия; Тяжелая печеночная недостаточность; Лейкопения.

**Особые указания и меры предосторожности:** Применение доксициклина в период формирования зубов может стать причиной необратимого изменения их цвета. Лечение инфекций, вызванных стрепто- и стафилококками, эшерихиями, шигеллами, акинетобактером, возможно только после определения чувствительности микроорганизмов к доксициклину. Для профилактики изъязвлений пищевода следует принимать с большим количеством жидкости. Во время лечения и в течение 4-5 дней после него противопоказано прямое облучение солнечным светом или УФ лучами (фотосенсибилизация). Повышает частоту кровотечений на фоне эстрогенсодержащих пероральных контрацептивов. Потенцирует эффект непрямых антикоагулянтов.

**Форма выпуска:** Юнидокс Солютаб: Таблетки - 10 штук - упаковки безъячейковые контурные - пачки картонные. Таблетки - 10 штук - упаковки ячейковые контурные - пачки картонные. Доксициклин: Капсулы - 5 штук - упаковки ячейковые контурные (2) - пачки картонные.

## 2. Тобрамицин (Tobramycin)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа аминогликозидов)

**Фармакологическое действие:** Антибиотик широкого спектра действия из группы аминогликозидов. Действует бактерицидно (уничтожает бактерии). Высоко активен в отношении грамотрицательных микроорганизмов (синегной и кишечной палочек, клебсиеллы, серрации, провиденсии, энтеробактера, протей, сальмонеллы, шигеллы), а также некоторых грамположительных микроорганизмов (стафилококков).



**Показания к применению:** Инфекционные заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами: инфекции дыхательных путей - бронхит, бронхолит (воспаление стенок наиболее мелких структур бронхов - бронхиол), пневмония; инфекции кожи и мягких тканей, в том числе инфицированные ожоги; инфекции костной ткани; инфекции мочеполовой сферы - пиелит (воспаление почечной лоханки), пиелонефрит (воспаление ткани почки и почечной лоханки), эпидидимит (воспаление придатков яичка), простатит (воспаление предстательной железы), аднексит (воспаление придатков матки), эндометрит (воспаление внутренней оболочки матки); абдоминальные инфекции (инфекции брюшной полости), в том числе, перитонит (воспаление брюшины); менингит (воспаление оболочек мозга); сепсис (заражение крови микробами из очага гнойного воспаления); эндокардит (воспалительное заболевание внутренних полостей сердца).

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Дозы устанавливают индивидуально, с учетом тяжести течения и локализации инфекции, чувствительности возбудителя. Перед терапией тобрамицином необходимо провести микробиологическое исследование, а также определить чувствительность возбудителя к препарату, однако, в экстренных случаях можно начать проведение терапии препаратом и без указанных исследований. Препарат вводят внутримышечно или внутривенно капельно (для внутривенной инфузии разовую дозу препарата разводят в 100-200 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы). При инфекциях средней тяжести суточная доза составляет 0,002-0,003 г/кг массы тела; кратность применения - 3 раза в сутки. При инфекциях тяжелого течения суточная доза может быть увеличена до 0,004-0,005 г/кг массы тела; кратность применения - 3 раза в сутки.

**Побочные действия:** Головная боль, вялость, лихорадка (резкое повышение температуры тела); сыпь, крапивница; анемия (снижение содержания гемоглобина в крови), лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови); ототоксические проявления (повреждающее воздействие на органы слуха): вестибулярные расстройства - головокружения, шум или звон в ушах; нарушения слуха (обычно возникают при приеме высоких доз или при длительном приеме препарата).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препарату. Беременным женщинам препарат назначают только в тех случаях, когда, по мнению врача, ожидаемый положительный эффект тобрамицина превышает возможное негативное влияние препарата на плод. В процессе терапии тобрамицином может наблюдаться усиленное размножение нечувствительных к препарату микроорганизмов. Препарат следует с осторожностью назначать больным с указанием на аллергические реакции в анамнезе (истории болезни).

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций в ампулах по 1 и 2 мл в упаковке по 10 штук.

### 3. Рифампицин (Rifampicinum)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (полусинтетическое производное природного рифамицина, ансамицин)

**Фармакологическое действие:** Рифампицин является антибиотиком широкого спектра действия. Он активен в отношении микобактерий туберкулеза и лепры, действует на грамположительные (особенно стафилококки) и грамотрицательные (менингококки, гонококки) кокки, менее активен в отношении грамотрицательных бактерий. Рифампицин хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в крови достигается через 2-2½ ч после приема внутрь. При внутривенном капельном введении максимальная концентрация рифампицина наблюдается к концу инфузии (вливания). На терапевтическом уровне концентрация препарата при приеме внутрь и внутривенном введении поддерживается в течение 8-12 ч, в отношении высокочувствительных возбудителей - в течение 24 ч. Устойчивость к рифампицину развивается быстро. Перекрестной устойчивости с другими антибиотиками не наблюдается (за исключением рифамицина).

**Показания к применению:** Основным показанием к применению является туберкулез легких и других органов. Кроме того, препарат применяют при различных формах лепры и воспалительных заболеваниях легких и дыхательных путей: бронхите (воспалении бронхов), пневмонии (воспалении легких), - вызываемых полирезистентными (устойчивыми к большинству антибиотиков) стафилококками; при остеомиелите (воспалении костного мозга и прилегающей костной ткани); инфекциях моче- и желчевыводящих путей; острой гонорее и других заболеваниях, вызванных чувствительными к

рифампицину возбудителями. В связи с быстрым развитием устойчивости микроорганизмов рифампицин назначают при нетуберкулезных заболеваниях только в тех случаях, если неэффективны другие антибиотики.

**Способ применения:** Рифампицин принимают внутрь натощак (за 1/2-1 ч до еды) или вводят внутривенно капельно (только взрослым). Для приготовления раствора разводят 0,15 г рифампицина в 2,5 мл стерильной воды для инъекций, энергично встряхивают ампулы с порошком до полного растворения, полученный раствор разводят в 125 мл 5% раствора глюкозы. Вводят со скоростью 60-80 капель в минуту. При лечении туберкулеза средняя суточная доза для взрослых внутрь 0,45 г 1 раз в день. У больных (особенно в период обострения) с массой тела выше 50 кг суточная доза может быть увеличена до 0,6 г. Средняя суточная доза для детей старше 3 лет - 10 мг/кг (но не более 0,45 г в сутки) 1 раз в день. При плохой переносимости рифампицина суточная доза может быть разделена на 2 приема. Внутривенное введение рифампицина рекомендуется при остро прогрессирующих и распространенных формах деструктивного туберкулеза легких (туберкулеза легких, протекающего с нарушением структуры легочной ткани), тяжелых гнойно-септических процессах (микробном заражении крови с последующим образованием гнойников в тканях), когда необходимо быстро создать высокую концентрацию препарата в крови и если прием препарата внутрь затруднен или плохо переносится больным. При внутривенном введении суточная доза для взрослых составляет 0,45 г, при тяжелых быстро прогрессирующих (развивающихся) формах - 0,6 г и вводится в 1 прием. Препарат внутривенно вводят в течение 1 мес. и более с последующим переходом на прием внутрь в зависимости от переносимости препарата. Общая продолжительность применения рифампицина при туберкулезе определяется эффективностью лечения и может достигать 1 года.

**Побочные действия:** Лечение рифампицином должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением. Возможны аллергические реакции (разной степени тяжести), хотя наблюдаются они относительно редко; кроме того, диспепсические явления (расстройства пищеварения), дисфункция (нарушение функции) печени и поджелудочной железы. При длительном приеме препарата необходимо периодически исследовать функцию печени и проводить анализы крови (в связи с возможностью развития лейкопении /снижения уровня лейкоцитов в крови/). При быстром внутривенном введении может снизиться артериальное давление, а при длительном введении - развиться флебит (воспаление вены). Препарат уменьшает активность непрямых антикоагулянтов (средств, тормозящих свертывание крови), пероральных гипогликемических средств (принимаемых через рот лекарственных средств, понижающих уровень сахара в крови), препаратов наперстянки.

**Противопоказания:** Рифампицин противопоказан детям грудного возраста, беременным, при желтухе, заболеваниях почек со снижением выделительной функции, гепатите (воспалении ткани печени) и повышенной чувствительности к препарату. Внутривенное введение противопоказано при легочно-сердечной недостаточности (недостаточном снабжении тканей организма кислородом вследствие заболевания сердца и легких) и флебите.

**Форма выпуска:** В капсулах по 0,05 и 0,15 г в упаковке по 10-20 или 30 капсул; в ампулах по 0,15 г в виде пористой массы в упаковке по 10 ампул.

#### 4. Бензилпенициллина натриевая соль (Benzylpenicillinum Natrium)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа пенициллина)

**Фармакологическое действие:** Бензилпенициллин активен в отношении грамположительных микроорганизмов (стафилококков, стрептококков, пневмококков, возбудителя дифтерии, анаэробных /способных существовать в отсутствии кислорода/ спорообразующих палочек, палочек сибирской язвы), грамотрицательных кокков (гонококков, менингококков), а также в отношении спирохет, некоторых актиномицетов и других микроорганизмов. Препарат неэффективен в отношении большинства грамотрицательных бактерий, риккетсий, вирусов, простейших, грибов. Бензилпенициллин при внутримышечном введении быстро всасывается в кровь и обнаруживается в жидкостях и тканях организма; в спинномозговую жидкость проникает в незначительных количествах. Максимальная концентрация в крови наблюдается после внутримышечного введения через 30-60 мин. При подкожном введении скорость всасывания менее постоянна, обычно максимальная концентрация в крови отмечается через 60 мин. Через 3-4 ч после однократной внутримышечной или подкожной инъекции в крови обнаруживаются лишь следы

антибиотика. Чтобы поддержать концентрацию на достаточно высоком для терапевтического эффекта уровне, надо производить инъекции через каждые 3-4 ч. При внутривенном введении концентрация пенициллина в крови быстро снижается. При приеме внутрь препарат плохо всасывается и разрушается желудочным соком и пенициллиназой (ферментом), продуцируемой микрофлорой кишечника.

**Показания к применению:** Применяют при заболеваниях, вызванных чувствительными к бензилпенициллину микроорганизмами: крупозной и очаговой пневмонии (воспалении легких), острым и подострым септическом (связанном с наличием в крови микробов) эндокардитах (воспалении внутренних полостей сердца), раневых инфекциях, гнойных инфекциях кожи, мягких тканей и слизистых оболочек, гнойном плеврите (гнойном воспалении оболочек легкого), перитоните (воспалении брюшины), цистите (воспалении мочевого пузыря), септицемии (форме заражения крови микроорганизмами) и пиемии (форме течения сепсиса, при которой микробы током крови заносятся во внутренние органы, где развиваются вторичные абсцессы - полости, заполненные гноем), острым и хроническом остеомиелите (воспалении костного мозга и прилегающей костной ткани), разных формах ангин, дифтерии, рожистом воспалении, гнойно-воспалительных заболеваниях в акушерско-гинекологической и оториноларингологической практике (лечении заболеваний уха, горла, носа); при воспалительных заболеваниях глаза, менингите (воспалении оболочек мозга), скарлатине, гонорее, бленнорее (остром гнойном воспалении наружной оболочки глаза), сифилисе, сибирской язве, актиномикозе (грибковом заболевании) и других инфекционных заболеваниях.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Вводят бензилпенициллин внутримышечно обычно глубоко в мышцы. Внутривенно (струйно или капельно) вводят бензилпенициллина натриевую соль при тяжелых заболеваниях (сепсис /заражение крови микробами из очага гнойного воспаления/, менингит и др.). При внутримышечном и внутривенном введении бензилпенициллина натриевой соли разовые дозы при среднетяжелом течении инфекции (заболевания моче- и желчевыводящих путей, инфекция мягких тканей и др.) составляет обычно 250 000-500 000 ЕД; суточные - 1 000 000-2 000 000 ЕД. При тяжелых инфекциях (сепсис, септический эндокардит, менингит и др.) вводят до 10 000 000-20 000 000 ЕД в сутки; при газовой гангрене - до 40 000 000-60 000 000 ЕД в сутки.

**Побочные действия:** Бензилпенициллина натриевая соль и другие препараты пенициллина могут вызывать различные побочные явления. У некоторых больных, особенно с повышенной чувствительностью, наблюдается головная боль, повышение температуры тела, крапивница, сыпь на коже и слизистых оболочках, боли в суставах, эозинофилия (увеличение числа эозинофилов в крови), ангионевротический (аллергический) отек и другие аллергические реакции; описаны случаи анафилактического шока (аллергической реакции немедленного типа) со смертельным исходом.

**Противопоказания:** Бензилпенициллин и все другие препараты пенициллина противопоказаны больным с повышенной чувствительностью к пенициллину, страдающим бронхиальной астмой, крапивницей, сенной лихорадкой и другими аллергическими заболеваниями, а также лицам с повышенной чувствительностью и необычными реакциями при приеме других антибиотиков и других лекарственных препаратов. Противопоказанием к эндолумбальному введению служит также эпилепсия.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 125 000 ЕД, 250 000 ЕД, 500 000 ЕД, 1 000 000 ЕД. Мазь (в 1 г 10000 ЕД) по 15 г в

## 5. Эритромицин (Erythromycinum)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа макролидов)

**Фармакологическое действие:** По спектру антимикробного действия эритромицин близок к пенициллинам. Он активен в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов (стафилококки, пневмококки, стрептококки, гонококки, менингококки). Действует также на ряд грамположительных бактерий, бруцелл, риккетсий, возбудителей трахомы (инфекционного заболевания глаз, которое может привести к слепоте) и сифилиса. Слабо или совсем не действует на большинство грамотрицательных бактерий, микобактерий, мелкие и средние вирусы, грибы. В терапевтических дозах эритромицин действует бактериостатически (препятствует размножению бактерий). Устойчивость к антибиотику развивается быстро, причем с другими антибиотиками группы макролидов (олеандомиин) наблюдается перекрестная устойчивость.

**Показания к применению:** Применяют эритромицин при пневмонии (воспалении легких), пневмоплевритах (сочетанном воспалении ткани легкого и его оболочек), бронхоэктатической болезни (заболевании бронхов, связанном с расширением их просвета) в стадии обострения и при других инфекционных заболеваниях легких, вызванных чувствительными к антибиотику микроорганизмами; при септических состояниях (заболеваниях, связанных с наличием в крови микробов), рожистом воспалении, мастите (воспалении молоковыносящих протоков молочной железы), остеомиелите (воспалении костного мозга и прилегающей костной ткани), перитоните (воспалении брюшины), гнойном отите (воспалении полости уха) и других гнойновоспалительных процессах. Его назначают также больным сифилисом при непереносимости антибиотиков группы пенициллина. Через гематоэнцефалический барьер (барьер между кровью и тканью мозга) эритромицин не проникает, поэтому при менингите (воспалении оболочек мозга) его не назначают. Местно (в виде мази) применяют эритромицин при гнойничковых поражениях кожи, инфицированных ранах, пролежнях (омертвении тканей, вызванном длительным давлением на них вследствие лежания) и т. п., а также при конъюнктивите (воспалении наружной оболочки глаза), блефарите (воспалении краев век), трахоме. При тяжелых формах инфекционных заболеваний, когда прием препарата внутрь малоэффективен или невозможен, прибегают к внутривенному введению растворимой формы эритромицина - эритромицина фосфата.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Для приема внутрь эритромицин назначают в виде таблеток или в капсулах. Разовая доза для взрослого 0,25 г, при тяжелых заболеваниях - 0,5 г. Принимают через каждые 4 - 6 ч за 1 - 1,5 ч до еды. Высшая разовая доза для взрослых: внутрь 0,5 г, суточная 2 г. Детям до 14 лет назначают в суточной дозе 20-40 мг/кг (в 4 приема), старше 14 лет - в дозе для взрослых. Эритромицин повышает концентрацию в плазме крови карбамазепина, теофиллина и усиливает их токсический эффект (тошноту, рвоту и др.).

**Побочные действия:** Побочные явления при лечении эритромицином наблюдаются относительно редко (тошнота, рвота, понос). При длительном применении возможны нарушения функции печени (желтуха). В отдельных случаях может наблюдаться повышенная чувствительность к препарату с появлением аллергических реакций. При длительном применении эритромицина возможно развитие устойчивости к нему микроорганизмов.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при индивидуальной повышенной чувствительности к нему и при тяжелых нарушениях функции печени. Препарат следует с осторожностью назначать больным с указанием на аллергические реакции в анамнезе (истории болезни).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 и 0,25 г; таблетки по 0,1 и 0,25 г с кишечнорастворимым покрытием; мазь 1 %.

## 6. Цефазолин (Cefazolin)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (из группы цефалоспоринов)

**Фармакологическое действие:** Цефазолин имеет широкий спектр антимикробного (бактерицидного) действия. Активен по отношению к грамположительным микроорганизмам (*Staphylococcus* spp., образующим и не образующим пенициллиназу, большинству штаммов *Streptococcus* spp., в том числе пневмококкам, *Corinebacterium diphtheriae*), грамотрицательным микроорганизмам (*Escherichia coli*, *Salmonella* spp., *Shigella* spp., *Proteus mirabilis*, *Klebsiella* spp., *Haemophilus influenzae*, *Enterobacter aerogenes*, *Neisseria gonorrhoeae*). Как и пенициллины, угнетает синтез клеточной стенки бактерий.

**Показания к применению:** Лечение инфекционных болезней, вызванных чувствительными к нему грамположительными и грамотрицательными микроорганизмами: - пневмонии, абсцесса легких, эмпиемы плевры; - перитонита, септицемии, эндокардита, остеомиелита раневых, ожоговых инфекций; - инфекций мочевыводящих путей; - инфекций кожи и мягких тканей; - инфекций костно-суставного аппарата.

**Способ применения:** Цефазолин вводят внутримышечно и внутривенно (струйно или капельно). Для внутримышечного введения раствор препарата готовят ex tempore, разводят содержимое флакона в 4-5 мл изотонического раствора натрия хлорида или стерильной воды для инъекции и вводят глубоко в мышцу. Для внутривенного струйного введения разовую дозу препарата разводят в 10 мл изотонического раствора

натрия хлорида и вводят медленно в течение 3-5 минут. При внутривенном капельном введении препарат (0,5 - 1,0 г) разводят в 100-250 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы; инъекцию проводят в течение 20-30 минут (скорость введения 60-80 капель в 1 минуту). Суточная доза препарата составляет для взрослых от 1 г до 4 г (иногда более) и зависит от тяжести инфекции, вида возбудителя и его чувствительности к антибиотику. Разовая доза препарата для взрослых при инфекциях, вызванных грамположительными микроорганизмами, составляет 0,25-0,5 г каждые 8 часов.

**Побочные действия:** Возможны аллергические реакции (воспаления и кожный зуд, эозинофилия), транзиторное повышение уровня аминотрансфераз печени. У больных с предшествующими нарушениями функции почек при лечении большими дозами препарата Цефазолин (6 г) возможны проявления нефротоксичности (повышение содержания азота мочи и креатина в сыворотке крови).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность больного к препаратам группы цефалоспоринов, беременность, не назначают недоношенным детям и детям в возрасте до одного месяца.

**Форма выпуска:** Порошок для приготовления раствора для инъекции по 0,5, 1 или 2 г во флаконах. 10 флаконов в пачке.

## 7. Микроцид (Microcidum)



**Групповая принадлежность:** Дезинфицирующее, антимикробное средство

**Фармакологическое действие:** Микроцид, является продуктом жизнедеятельности (культуральной питательной средой) грибов *Penicillium vitale* Bilai et Pidoplitschko. В процессе роста колоний, питательная среда, за счет окисления глюкозы, с участием энзимов грибов, накапливает d-лактон глюконовой кислоты и перекись водорода. Эти вещества обладают способностью подавлять рост многих штаммов грамотрицательных и грамположительных бактерий, проявляя антибиотическую активность. Микроцид применяется местно и не всасывается в кровь.

**Показания к применению:** Микроцид применяют для наружного лечения воспалительных процессов кожи, слизистых оболочек, глубоких ран. Его используют при стоматитах, цистите (орошение полости пузыря), бактериальном вагините, ларингите, эрозии шейки матки, отитах, ожоговых ранах, вскрывшихся флегмонах, абсцессах, панарициях, паронихиях и других наружных бактериальных воспалениях.

**Способ применения:** Для лечения большинства воспалительных процессов Микроцид применяют наружно при перевязках, орошая пораженные участки препаратом и оставляя в ране смоченные Микроцидом тампоны. Глубокие раневые карманы промывают Микроцидом под давлением, используя шприц. Перевязки проводят ежедневно. Для лечения эрозии шейки матки и вагинитов, в связи с возможной активизацией грибковой микрофлоры, Микроцид разводят 1:6 кипяченой или дистиллированной водой. Интравагинально Микроцид применяют в виде спринцеваний или тампонов.

**Побочные действия:** Возможно появление устойчивых к Микроциду штаммов бактерий, при продолжительной терапии, с последующим развитием суперинфекции. При интравагинальном применении возможна активизация грибковой микрофлоры. Возможны различные проявления кожных аллергических реакций.

**Противопоказания:** Микроцид противопоказан при аллергии к компонентам препарата. Следует поставить в известность врача при наличии сопутствующих грибковых заболеваний. Беременность: Микроцид не абсорбируется в кровь и поэтому, может применяться в период беременности и кормления грудью.

**Форма выпуска:** Флаконы по 100 мл.

## 8. Клиндамицин (Clindamycin)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (из группы линкозамидов)

**Фармакологическое действие:** По химической структуре, механизму действия и антимикробному спектру близок к линкомицину, но в отношении некоторых видов микроорганизмов более активен (в 2-10 раз). Препарат хорошо проникает в жидкости и ткани организма в том числе и в костную ткань. Через гистогематические барьеры (барьер между кровью и тканью мозга) проходит плохо, но при воспалении мозговых оболочек концентрация в спинномозговой жидкости значительно возрастает. Показания к применению:

**Показания к применению** в основном такие же, как и для линкомицина: инфекции дыхательных путей, кожи и мягких тканей, костей и суставов, органов брюшной полости, септицемии (форма заражения крови микроорганизмами) и др.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Дозы препарата зависят от тяжести заболевания, состояния больного и чувствительности возбудителя инфекции к препарату. Взрослым при инфекционных заболеваниях брюшной полости, как и при других осложненных или тяжелых инфекциях, препарат обычно назначают в виде инъекций в дозе 2,4-2,7 г в сутки, разделенных на 2-3-4 введения. При более легких формах инфекции лечебный эффект достигается при назначении меньших доз препарата - 1,2-1,8 г/сут. (в 3-4 введения). С успехом применяются дозы до 4,8 г/сут. Не рекомендуется назначать более 600 мг препарата внутримышечно одномоментно. При аднексите (воспалении придатков матки) и пельвиоперитоните (воспалении брюшины, локализованном в области малого таза) вводят внутривенно капельно в дозе 0,9 г каждые 8 ч (при одновременном назначении антибиотиков, активных в отношении грамотрицательных возбудителей). Внутривенное введение лекарств проводится в течение, по крайней мере, 4 дней и затем в течение 48 часов после наступления улучшения состояния пациентки. После достижения клинического эффекта лечение можно продолжить пероральными формами (для приема внутрь) препарата по 450 мг каждые 6 часов до завершения 10-14-дневного курса терапии. Внутрь препарат также применяется для лечения инфекционно-воспалительных заболеваний легкой и средней степени тяжести. Взрослым назначают по 150-450 мг каждые 6 ч. Длительность курса лечения устанавливается индивидуально, но при инфекциях, вызванных бета-гемолитическим стрептококком, его следует продолжать не менее 10 дней.

**Форма выпуска:** В капсулах, содержащих по 0,3 г, 0,15 г и 0,075 г клиндамицина гидрохлорида (75 мг - для детей); 15% раствор клиндамицина фосфата (по 150 мг в 1 мл); в ампулах по 2; 4 и 6 мл; ароматизированные гранулы (для детей) для приготовления сиропа, содержащего по 75 мг клиндамицина гидрохлорида пальмитата в 5 мл, во флаконах по 80 мл; крем вагинальный 2% в тубах по 40 г с приложением 7 разовых аппликаторов.

## 9. Бициллин 3 (Bicillinum-III)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа пенициллина)

**Фармакологическое действие:** Комплексный бактерицидный препарат, в состав которого входят 3 соли бензилпенициллина. Угнетает синтез клеточной мембраны бактерий, проявляет активность в отношении

грамположительных микроорганизмов: Streptococcus spp., Streptococcus pneumoniae., Staphylococcus spp., Clostridium spp., Actinomyces israelii., Bacillus anthracis; а также в отношении грамотрицательных возбудителей: Neisseria meningitidis, Treponema spp., Neisseria gonorrhoeae. К препарату относительно устойчивы штаммы Staphylococcus spp, синтезирующие пенициллиназу.

**Показания к применению:** Инфекции, вызываемые чувствительными к препарату микроорганизмами (если есть необходимость создать высокую концентрацию препарата в крови и длительно поддерживать эту концентрацию на период лечения): скарлатина, сифилис, раневые инфекции, тонзиллит, рожистое воспаление; профилактика ревматизма после перенесенной ангины.

**Способ применения:** Вводят глубоко внутримышечно в дозировке 300 000 ЕД., повторные инъекции производят через 4 суток. В дозировке 600 000 ЕД. вводят с интервалом в 6 дней. При лечении сифилиса однократная доза составляет 1 800 000 ЕД. (7 инъекций на курс лечения).

**Побочные действия:** Аллергические реакции – ангионевротический отёк, крапивница, мультиформная экссудативная эритема, реже – анафилактический шок; стоматит, вагинальный кандидоз, глоссит, лихорадка, артралгии, эксфолиативный дерматит, анемия, тромбоцитопения, лейкопения, гипокоагуляция.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препаратам пенициллинового ряда, б-лактамам антибиотикам. С особой осторожностью следует применять при сенной лихорадке, бронхиальной астме и других заболеваниях аллергической этиологии.

**Беременность:** Не применяется.

**Форма выпуска:** 1 флакон, содержащий белый порошок для приготовления инъекционного раствора (в коробке 50 флаконов).

## 10. Стрептомицин. Стрептомицина сульфат (Streptomycin! sulfas)



**Групповая принадлежность:** Антибиотин (группа аминогликозидов)

**Фармакологическое действие:** Стрептомицина сульфат обладает широким спектром антимикробного действия. Антибиотик активен в отношении микобактерий туберкулеза, а также большинства грамотрицательных (кишечная палочка, палочка Фридендера, палочка инфлюэнцы, возбудители чумы, туляремии, бруцеллеза) и некоторых грамположительных (стафилококки) микроорганизмов; менее активен в отношении стрептококков, пневмококков. Не действует на анаэробы (бактерии, способные существовать в отсутствии кислорода), риккетсии (род микроорганизмов, вызывающих ряд инфекционных заболеваний) и вирусы. Действует стрептомицин бактерицидно (уничтожает бактерии). Эффект связан с подавлением синтеза белка на уровне рибосом (структурных образований клетки) в микробной клетке. Максимальная концентрация в плазме крови наблюдается через 1-2 ч. После однократного введения терапевтической дозы сохраняется в крови в течение 6-8 ч.

**Показания к применению:** Стрептомицина сульфат применяют в качестве основного противотуберкулезного препарата для лечения главным образом впервые выявленного туберкулеза легких и туберкулезных поражений других органов. Назначают также стрептомицина сульфат при гнойно-воспалительных процессах различной локализации, вызванных грамположительными и грамотрицательными микроорганизмами, чувствительными к препарату: при пневмонии (воспалении легких), вызванной клебсиеллами (видом бактерий) - в комбинации с левомицетином; при чуме и туляремии - в комбинации с тетрациклином; бруцеллезе (инфекционном заболевании, передающемся человеку, как правило, от сельскохозяйственных животных) и эндокардите (воспалении внутренней оболочки сердца) - в сочетании с другими антибиотиками.

**Способ применения:** Применяют стрептомицина сульфат внутримышечно, а также в виде аэрозолей, интратрахеально (в полость трахеи), внутрикавернозно (в полость, образовавшуюся вследствие омертвления ткани) - у взрослых. При внутримышечном введении разовая доза для взрослых 0,5-1,0 г, суточная - 1 г. Высшая суточная доза - 2г. Больным с массой тела менее 50 кг и лицам старше 60 лет вводят обычно не более 0,75 г в сутки. Суточная доза для детей и подростков 15-20 мг на 1 кг массы тела, но не более 0,5 г в сутки детям и 1 г - подросткам. При лечении туберкулеза суточную дозу обычно вводят однократно, при плохой переносимости ее можно разделить на 2 введения. Длительность лечения зависит от формы и фазы заболевания (3 мес. и более). При лечении туберкулеза назначают стрептомицина сульфат в комбинации с

рифампицином, изониазидом и другими противотуберкулезными препаратами, за исключением канамицина и флоримицина.

**Побочные действия:** При лечении стрептомицином (и его производными) могут наблюдаться различные токсические и аллергические реакции: лекарственная лихорадка (резкое повышение температуры тела), дерматит (воспаление кожи) и другие аллергические явления, головокружение, головная боль, сердцебиение, альбуминурия (белок в моче), гематурия (кровь в моче), в связи с подавлением микрофлоры кишечника может появиться понос. Наиболее серьезными осложнениями являются поражение VIII пары черепных нервов и связанные с этим вестибулярные расстройства и нарушения слуха (ототоксичность). При длительном применении больших доз может развиться глухота.

**Противопоказания:** Заболевания слухового и вестибулярного аппаратов, связанные с воспалением VIII пары черепных нервов и развившиеся после перенесенного отоневрита (заболевания внутреннего уха); тяжелые формы сердечно-сосудистой недостаточности (III стадия) и почечной недостаточности; нарушения мозгового кровообращения; облитерирующий эндартериит (воспаление внутренней оболочки артерий конечностей с уменьшением их просвета); повышенная чувствительность к стрептомицину; миастения. Стрептомицина сульфат нельзя принимать одновременно с антибиотиками, оказывающими ототоксическое действие (повреждающее воздействие на органы слуха) такими, как канамицин, флоримицин, ристомицин, гентамицин, мономицин, - а также с фуросемидом и курареподобными (расслабляющими скелетные мышцы) препаратами. Недопустимо смешивание стрептомицина сульфата в одном шприце с антибиотиками пенициллинового ряда и цефалоспорины.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 0,25; 0,5 и 1 г.

## 11. Гентамицин (Gentamycinisulfas)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа аминогликозидов)

**Фармакологическое действие:** Обладает широким спектром антимикробного действия, подавляя рост большинства грамотрицательных и грамположительных микроорганизмов. Высокоактивен в отношении синегнойной палочки. Быстро всасывается. Проникает через гематоэнцефалический барьер (барьер между кровью и тканью мозга). Максимальная концентрация в сыворотке крови отмечается через час после инъекции. При повторном введении в дозе 0,4-0,8 мг/кг с интервалом 8 ч наблюдается кумуляция препарата (накопление препарата в организме). Выделяется из организма почками.

**Показания к применению:** Инфекции мочевыводящих путей: пиелонефрит (воспаление ткани почки и почечной лоханки), цистит (воспаление мочевого пузыря), уретрит (воспаление мочеиспускательного канала); дыхательного тракта: пневмония (воспаление легких), плеврит (воспаление оболочек легкого), эмпиема (скопление гноя в легких), абсцесс (гнойник) легкого; хирургические инфекции: хирургический сепсис (заражение крови микробами из очага гнойного воспаления), перитонит (воспаление брюшины); инфекции кожи: фурункулез (множественное гнойное воспаление кожи), дерматит (воспаление кожи), трофические язвы (медленно заживающие дефекты кожи), ожоги - вызванные возбудителями, устойчивыми к другим антибиотикам широкого спектра действия.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. При инфекциях мочевыводящих путей разовая доза для взрослых и детей старше 14 лет составляет 0,4 мг/кг, суточная 0,8-1,2 мг/кг. Больным с тяжелым течением инфекционного заболевания суточная доза может быть увеличена до 3 мг/кг. При сепсисе и других тяжелых инфекциях (перитонит, абсцесс легких и др.) разовая доза для взрослых и детей старше 14 лет составляет 0,8-1 мг/кг, суточная - 2,4-3,2 мг/кг. Максимальная суточная доза - 5 мг/кг. Детям раннего возраста препарат назначают только по жизненным показаниям при тяжелых инфекциях. Суточная доза для новорожденных и детей грудного возраста равна 2-5 мг/кг, 1-5 лет - 1,5-3,0 мг/кг, 6-14 лет - 3 мг/кг. Максимальная суточная доза для детей всех возрастов - 5 мг/кг. Суточную дозу вводят в 2-3 приема. Средняя продолжительность лечения - 7-10 дней. Внутривенные инъекции производят в течение 2-3 дней, а затем переходят на внутримышечное введение.

**Побочные действия:** Может вызывать ототоксический и, относительно реже, нефротоксический эффект (может оказывать повреждающее воздействие на органы слуха и почки).



**Противопоказания:** Неврит (воспаление) слухового нерва. Уремия (заболевание почек, характеризующееся накоплением в крови азотистых шлаков). Нарушение функции печени и почек. Не следует назначать препарат новорожденным и беременным, а также в сочетании с канамицином, неомицином, мономицином, стрептомицином. Препарат следует с осторожностью назначать больным с указанием на аллергические реакции в анамнезе (истории болезни).

**Форма выпуска:** Порошок (пористая масса) по 0,08 г во флаконах; 4% раствор в ампулах по 1 и 2 мл (40 или 80 мг в ампуле); 0,1% мазь в тубах (по 10 или 15 г); 0,3% раствор (глазные капли) в тубиках-капельницах.

## 12. Олететрин (Oletetrin)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (комбинированный)

**Фармакологическое действие:** Олететрин – комбинированный противомикробный препарат, содержащий тетрациклин и олеандомицин. Олететрин обладает выраженной бактериостатической активностью. Тетрациклин и олеандомицин – антибиотики, имеющие широкий спектр действия. Механизм действия активных компонентов препарата Олететрин основан на их способности угнетать синтез белка в микробных клетках вследствие влияния на рибосомы (при применении тетрациклина и олеандомицина отмечается нарушение образования пептидных связей и роста полипептидных цепей). К препарату Олететрин чувствительны штаммы *Staphylococcus* spp., *Bacillus anthracis*, *Corynebacterium diphtheriae*, *Streptococcus* spp., *Brucella* spp., *Neisseria gonorrhoeae*, *Bordetella pertussis*, *Legionella* spp., *Haemophilus influenzae*, *Klebsiella* spp. и *Enterobacter* spp., а также *Clostridium* spp., *Chlamydia* spp., *Ureaplasma urealyticum*, *Rickettsia* spp., *Mycoplasma* spp. и *Spirochaetaeaceae*. Развитие резистентности к препарату Олететрин происходит значительно медленнее, чем к его активным веществам, применяемым в качестве монотерапии.

**Показания к применению:** Олететрин применяют в качестве антибактериальной терапии у пациентов с инфекционно-воспалительными заболеваниями различной локализации. В частности Олететрин применяют при фарингите, ларингите, тонзиллите, синусите, бронхите, бронхоэктатической болезни, среднем отите, пневмонии и ангине. Олететрин назначают при заболеваниях мочеполовой системы, включая простатит, гонорею, эндометрит, пиелонефрит и цистит, а также заболеваниях пищеварительного тракта, включая панкреатит и холецистит. Препарат Олететрин применяют у пациентов с менингитом, бруцеллезом, туляремией и риккетсиозом, а также остеомиелитом и заболеваниями кожи и мягких тканей инфекционной этиологии. Препарат Олететрин может быть назначен в качестве профилактического средства после проведения оперативных вмешательств при высоком риске инфицирования.

**Способ применения:** Олететрин предназначен для приема перорально. Для достижения максимального эффекта препарат Олететрин следует принимать за 30 минут до приема пищи, запивая 150-200 мл питьевой воды. Капсулы рекомендуется глотать, не нарушая целостность желатиновой оболочки. Продолжительность курса лечения и дозы препарата Олететрин определяет врач, учитывая личные особенности пациента, сопутствующую терапию, переносимость препарата и динамику заболевания. Взрослым пациентам и подросткам обычно рекомендуется прием 1 капсулы препарата Олететрин четырежды в сутки. Желательно принимать препарат Олететрин через равные промежутки времени (каждые 6 часов). При тяжелых формах заболевания дозу препарата Олететрин можно увеличивать по решению врача. Максимальная суточная доза составляет 8 капсул препарата Олететрин. Средняя длительность курса лечения составляет 5-10 дней.

**Побочные действия:** В терапевтических дозах Олететрин обычно неплохо переносится пациентами. В некоторых случаях при приеме препарата Олететрин возможно развитие побочных эффектов, в частности нельзя исключать такое нежелательное влияние тетрациклина и олеандомицина: На желудочно-кишечный тракт: снижение аппетита, рвота, тошнота, боль в эпигастрии, нарушения стула, глоссит, дисфагия, эзофагит. Кроме того, возможно развитие снижения функции печени и транзиторного повышения активности печеночных ферментов (включая щелочную фосфатазу, билирубин, АСТ/АЛТ). На центральную нервную систему: повышенная утомляемость, головная боль, головокружение. На систему крови:

тромбоцитопения, нейтропения, гемолитическая анемия, эозинофилия. Аллергические реакции: фотосенсибилизация, отек Квинке, кожный зуд, крапивница.

**Противопоказания:** Олететрин противопоказан пациентам с непереносимостью тетрациклина, олеандомицина, а также других антибиотиков групп тетрациклинов и макролидов. Капсулы Олететрин не следует назначать пациентам с выраженными нарушениями функций почек и печени, а также пациентам с лейкопенией. В педиатрии Олететрин применяют только для лечения детей достигших 12-летнего возраста (применение у детей препарата Олететрин может привести к необратимому потемнению зубной эмали). Следует соблюдать особую осторожность, назначая препарат Олететрин пациентам с дефицитом витаминов К и В, а также высоким риском развития дефицита данных витаминов (необходимо дополнительно назначать витамины группы В и витамин К таким пациентам). Пациентам с сердечно-сосудистой недостаточностью препарат Олететрин следует назначать с осторожностью. При применении препарата Олететрин возможно развитие головокружения, что необходимо учитывать пациентам, чья деятельность требует высокой скорости психомоторных реакций и концентрации внимания. Беременность: Олететрин не следует применять в период беременности. Тетрациклин, входящий в состав капсул Олететрин, может оказывать негативное влияние на плод, в частности тетрациклин замедляет рост скелетных костей и может приводить к жировой инфильтрации печени. Перед назначением препарата Олететрин женщинам детородного возраста необходимо исключить беременность, не следует планировать беременность во время терапии препаратом Олететрин. В период грудного вскармливания прием препарата Олететрин не рекомендован. Если избежать приема тетрациклина и олеандомицина в период лактации нельзя, следует решить вопрос о завершении кормления ребенка грудью.

**Форма выпуска:** Капсулы Олететрин по 10 штук в блистерных упаковках, в картонной пачке вложены 2 блистерные упаковки.

### 13. Ампициллин (Ampicilinum)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (пенициллин полусинтетический)

**Фармакологическое действие:** Ампициллин - полусинтетический антибиотик, получаемый путем ацилирования 6-аминопенициллановой кислоты остатком аминокислоты фенилуксусной кислоты. Препарат не разрушается в кислой среде желудка, хорошо всасывается при приеме внутрь. Активен в отношении грамположительных микроорганизмов, на которые действует бензилпенициллин. Кроме того, он действует на ряд грамотрицательных микроорганизмов (сальмонеллы, шигеллы, протей, кишечная палочка, клебсиелла пневмонии /палочка Фридендера/, палочка Пфейффера /палочка инфлюэнцы/) и поэтому рассматривается как антибиотик широкого спектра действия и применяется при заболеваниях, вызванных смешанной инфекцией. На пенициллиназообразующие (образующие пеницилиназу - фермент, разрушающий пенициллины) стафилококки, устойчивые к бензилпенициллину, ампициллин не действует, так как разрушается пеницилиназой.

**Показания к применению:** Применяют ампициллин для лечения больных пневмониями (воспалением легких), бронхопневмониями (сочетанном воспалением бронхов и легких), с абсцессами (гнойниками) легких, ангиной, перитонитом (воспалением брюшины), холециститом (воспалением желчного пузыря), сепсисом (заражением крови микробами из очага гнойного воспаления), кишечными инфекциями, при послеоперационных инфекциях мягких тканей и при других инфекциях, вызванных чувствительными к нему микроорганизмами. Препарат обладает высокой эффективностью при инфекциях мочевых путей, вызванных кишечной палочкой, протеем, энтерококками или смешанной инфекцией, так как он выделяется в неизменном виде с мочой в высоких концентрациях. В больших количествах ампициллин поступает также в желчь. Препарат эффективен при лечении гонореи.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Назначают ампициллин внутрь (независимо от приема пищи). Разовая доза для взрослых 0,5 г, суточная - 2-3 г. Детям назначают из расчета 100 мг/кг. Суточную дозу делят на 4-6 приемов. Продолжительность лечения зависит от тяжести болезни и эффективности терапии (от 5-10 дней до 2-3 нед. и более).

**Побочные действия:** При лечении ампициллином могут наблюдаться аллергические реакции в виде кожной сыпи, крапивницы, отека Квинке и др., в редких случаях - анафилактический шок (главным образом при введении натриевой соли ампициллина). В случае возникновения аллергических реакций необходимо прекратить введение препарата и провести десенсибилизирующую (предупреждающую или тормозящую

аллергические реакции) терапию. При появлении признаков анафилактического шока должны быть приняты срочные меры для выведения больного из этого состояния. При длительном лечении ампициллином у ослабленных больных возможно развитие суперинфекции (тяжелых, стремительно развивающихся форм инфекционного заболевания, вызванного устойчивыми к препарату микроорганизмами, ранее находившимися в организме, но себя не проявляющими), вызванной устойчивыми к препарату микроорганизмами (дрожжеподобные грибы, грамотрицательные микроорганизмы). Этим больным целесообразно одновременно назначать витамины группы В и витамин С, при необходимости - нистатин или леворин.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при повышенной чувствительности к пенициллину. При печеночной недостаточности применяют под контролем функции печени; при бронхиальной астме, сенной лихорадке и других аллергических заболеваниях только в случае крайней необходимости. При этом одновременно назначают десенсибилизирующие средства. Ампициллин усиливает действие пероральных антикоагулянтов (принимаемых через рот лекарственных препаратов, препятствующих свертыванию крови).

**Форма выпуска:** Таблетки и капсулы по 0,25 г в упаковке по 10 или 20 штук. Порошок для приготовления суспензии (взвеси) в банках оранжевого стекла по 60 г (5 г активного вещества). Порошок белого цвета с желтоватым оттенком (сладкий на вкус), со специфическим запахом (содержит сахар, ванилин и другие наполнители). Принимают внутрь в той же дозе, что ампициллин из расчета на содержание активного вещества. Смешивают порошок с водой или запивают водой.

#### 14. Ристомидин, Ристомидина сульфат (Ristomycinisulfas)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик

**Фармакологическое действие:** Активен в отношении грамположительных кокков (стафилококк, стрептококк, пневмококк, энтерококк), бактерий дифтерии, споровых грамположительных бактерий, многих анаэробов (бактерий, способных существовать в отсутствие кислорода) и кислотоустойчивых бактерий. Проникает и обнаруживается в высоких концентрациях в различных органах и тканях: почках, селезенке, легких и др. При менингитах (воспалении оболочек мозга) обнаруживается в ликворе (в спинномозговой жидкости) в терапевтических концентрациях. Выводится из организма в основном почками и в незначительных количествах с желчью.

**Показания к применению:** Тяжелые инфекции, вызванные устойчивыми к другим антибиотикам стафилококками и энтерококками: сепсис (заражение крови микробами из очага гнойного воспаления), эндокардит (воспаление внутренней оболочки сердца вследствие наличия в крови микробов), пневмония (воспаление легких), абсцесс (гнойник) легкого, эмпиема плевры (скопление гноя между оболочками легких), остеомиелит (воспаление костного мозга и прилегающей костной ткани), энтероколит (воспаление тонкой и толстой кишки), менингит (воспаление оболочек мозга) и др.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Внутривенно капельно 1 000 000-1 500 000 ЕД в 2 приема с интервалом 12 ч; детям - из расчета 20 000-30 000 ЕД/кг в сутки. Растворяют в стерильном изотоническом растворе хлорида натрия из расчета 250 000 ЕД в 125 мл.

**Побочные действия:** Аллергические реакции с эозинофилией (увеличением числа эозинофилов в крови). При длительном применении возможны флебиты (воспаление вены) на месте введения.

**Противопоказания:** Тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови).

**Форма выпуска:** Флаконы по 100 000 ЕД и 500 000 ЕД.

#### 15. Феноксиметилпенициллин (Phenoxymethylpenicillinum)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа пенициллина)

**Фармакологическое действие:** По антимикробному действию аналогичен другим препаратам бензилпенициллина. Хорошо всасывается при приеме внутрь и не разрушается в желудке. Кумулятивными свойствами (способностью накапливаться в организме) не обладает. Малотоксичен.

**Показания к применению:** Заболевания, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами (пневмония /воспаление легких/, бронхит /воспаление бронхов/, ангина, инфекции мягких тканей, скарлатина, рожистое воспаление, гонорея и др.).

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Дозы устанавливаются индивидуально в зависимости от тяжести течения, локализации инфекции и чувствительности возбудителя. При среднетяжелом течении инфекции взрослым и детям старше 10 лет назначают в суточной дозе 3 млн. ЕД в 3 приема. При тяжелом течении инфекции дозу увеличивают до 6-9 млн. ЕД в сутки. Взрослым назначают по 1,5-2 прилагаемой мерной ложки 3-4 раза в сутки. Детям младше 3 лет предпочтительно назначать препарат в виде раствора. Разовые дозы зависят от возраста и массы тела: 1-3 месяца (6-8 кг) - 25-30 капель; 3-12 мес. (8-10 кг) -30-35 капель; 1-3 года (10-15 кг) - 40-50 капель; кратность назначения - 3 раза в сутки. Средняя продолжительность курса лечения составляет не менее 5-7 дней. При лечении инфекций, вызванных бета-гемолитическим стрептококком - не менее 7-10 дней. Для профилактики ревматической лихорадки (резкого повышения температуры тела у больных ревматизмом) препарат применяют 2 раза в день длительно.

**Побочные действия:** Раздражение слизистой оболочки полости рта (стоматиты /воспаление слизистой оболочки полости рта/, фарингиты /воспаление глотки/) и желудочно-кишечного тракта.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препаратам пенициллина и заболевания, сопровождающиеся нарушением всасывания из желудочно-кишечного тракта. Препарат следует с осторожностью назначать больным с указанием на аллергические реакции в анамнезе (истории болезни).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1 и 0,25 г; драже по 0,1 г; порошок для приготовления суспензии (взвеси) во флаконах, содержащих по 1,2; 0,6 и 0,3 г феноксиметилпенициллина в смеси с лимонной кислотой, натрия бензоатом, малиновой эссенцией, сахаром. Порошок белого цвета, сладкий на вкус, с запахом малины. Вместе с наполнителями в каждой банке (оранжевого стекла) содержится по 80; 40 и 20 г порошка.

## 16. Линкомицин (Lincomycin)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (группа линкозамидов)

**Фармакологическое действие:** Противомикробный препарат, относящийся к группе линкозамидов. Оказывает бактериостатическое действие относительно широкого спектра микроорганизмов, при повышении дозы линкомицин оказывает бактерицидное действие. Противомикробный механизм действия линкомицина заключается в ингибировании синтеза белков в клетках микроорганизмов. Препарат активен относительно грамположительных аэробных и анаэробных микроорганизмов, в том числе Staphylococcus spp., Streptococcus spp., Bacillus anthracis, Corynebacterium diphtheriae, Actinomyces spp., Bacteroides spp., Clostridium spp., Peptococcus spp., Peptostreptococcus spp., Mycoplasma spp. К действию препарата устойчивы штаммы Enterococcus faecalis, грибы, вирусы, простейшие и большинство грамотрицательных микроорганизмов. Резистентность к препарату развивается медленно. Для линкомицина характерна перекрестная резистентность с клиндамицином. После перорального приема линкомицина гидрохлорид хорошо абсорбируется из желудочно-кишечного тракта. В системный кровоток абсорбируется до 50% от принятой дозы. Связывание с белками плазмы достигает 75%, максимальная концентрация линкомицина в плазме определяется через 2-4 часа после перорального приема.

**Показания к применению:** Препарат применяют у пациентов при таких состояниях: - инфекционные заболевания костей и суставов, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами, в том числе септический артрит и остеомиелит; - инфекционные заболевания дыхательных путей и ЛОР-органов, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами, в том числе отит, синусит, фарингит, трахеит, бронхит, пневмония, абсцесс легкого; - инфекционные заболевания мягких тканей и кожи, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами, в том числе инфицированные гнойные раны, абсцесс, фурункулез, мастит, панариции, рожа.

**Способ применения:** Дозы и курс лечения устанавливает лечащий врач для каждого пациента индивидуально в зависимости от возраста, характера и тяжести заболевания. Рекомендуется принимать препарат за 30-60 минут до или через 2 часа после приема пищи. Капсулы не делят и не разжевывают, глотают целиком, запивая большим количеством жидкости. Детям в возрасте от 6 до 14 лет и массой тела более 25 кг обычно рассчитывают суточную дозу по формуле 30 мг/кг массы тела. Суточную дозу делят на несколько приемов и принимают через равные промежутки времени. При тяжелых инфекционных заболеваниях суточная доза может быть увеличена до 60мг/кг массы тела. Взрослым обычно назначают по 500 мг 3 раза в сутки через равные промежутки времени. При тяжелых инфекционных заболеваниях дозу увеличивают до 500 мг 4 раза в сутки. Курс лечения обычно составляет 1-2 недели.

**Побочные действия:** При приеме препарата у пациентов могут наблюдаться такие побочные эффекты: Со стороны желудочно-кишечного тракта: тошнота, рвота, боли в эпигастральной области, нарушения стула, повышение активности печеночных ферментов, гипербилирубинемия, эзофагит. Со стороны системы кроветворения: нейтропения, тромбоцитопения, агранулоцитоз, панцитопения. Аллергические реакции: кожный зуд, сыпь, крапивница, ангионевротический отек, анафилактический шок, мультиформная эритема. Другие побочные эффекты: мышечная слабость, головная боль, головокружение, артериальная гипертензия. При появлении каких-либо побочных эффектов необходимо обратиться к врачу.

**Противопоказания:** Повышенная индивидуальная чувствительность к антибиотикам группы линкозамидов. Тяжелые нарушения функции печени и/или почек. Детский возраст до 6 лет. Беременность: Не рекомендуется применять препарат в период беременности и лактации. Во втором и третьем триместре беременности возможно назначение препарата только по жизненным показаниям. При необходимости применения препарата в период лактации необходимо решить вопрос о прекращении грудного вскармливания.

**Форма выпуска:** Капсулы по 250 мг действующего вещества по 10 штук в блистере, по 2 или 3 блистера в картонной упаковке.

## 17. Левомецетин (Levomecetinum)



**Групповая принадлежность:** Антибиотик

**Фармакологическое действие:** Левомецетин – противомикробный препарат эффективный в отношении широкого спектра грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов. Обладает выраженным бактериостатическим действием, в высоких концентрациях в отношении некоторых штаммов проявляет бактерицидное действие. Механизм действия основан на способности связываться с 50S субъединицей бактериальных рибосом и ингибировать синтез белков в клетках бактерий. К действию Левомецетина чувствительны штаммы *Escherichia coli*, *Shigella* spp. (в том числе *Shigella dysenteriae*), *Salmonella* spp., *Streptococcus* spp. (в том числе *Streptococcus pneumoniae*), *Neisseria* spp., *Proteus* spp., *Rickettsia* spp., *Treponema* spp. и *Chlamydia trachomatis*. Кроме того, препарат эффективен при заболеваниях вызванных некоторыми штаммами *Pseudomonas aeruginosa*. Действие препарата не распространяется на грибы, простейшие и штаммы *Mycobacterium tuberculosis*. Устойчивость микроорганизмов к левомецетину развивается медленно.

**Показания к применению:** Применяют для терапии пациентов с инфекционными заболеваниями, вызванными микроорганизмами чувствительными к действию левомецетина. Препарат назначают в случае неэффективности или невозможности применения других противомикробных средств при таких заболеваниях: Инфекционные заболевания дыхательных путей: пневмония, абсцесс легкого. Инфекционные заболевания органов брюшной полости: брюшной тиф, паратиф, шигеллез, сальмонеллез, перитонит. Кроме

того, препарат назначают пациентам с менингитом, хламидиозом, трахомой и туляремией. Способ применения: Таблетки: Препарат предназначен для перорального применения. Таблетку левомицетина следует глотать целиком, не разжевывая и не измельчая, запивая достаточным количеством жидкости. Рекомендуется принимать за 30 минут до приема пищи. Пациентам, у которых прием данного лекарственного средства вызывает развитие тошноты, таблетку следует принимать спустя 60 минут после приема пищи. Препарат следует принимать через равные промежутки времени. Длительность курса лечения и дозы определяет лечащий врач индивидуально для каждого пациента. Взрослым обычно назначают по 250-500 мг препарата 3-4 раза в день. Взрослым при тяжелых инфекционных заболеваниях обычно назначают по 500-1000 мг препарата 3-4 раза в день.

**Побочные действия:** При применении Левомицетина у пациентов отмечалось развитие таких побочных эффектов: Со стороны желудочно-кишечного тракта и печени: тошнота, рвота, нарушение пищеварения, нарушение стула, стоматит, глоссит, нарушение микрофлоры кишечника, энтероколит. При длительном применении препарата у пациентов возможно развитие псевдомембранозного колита, которое требует отмены препарата. При применении высоких доз возможно развитие гепатотоксического действия. Со стороны сердечно-сосудистой системы и системы кроветворения: гранулоцитопения, панцитопения, эритроцитопения, анемия, в том числе апластическая, агранулоцитоз, тромбоцитопения, лейкопения, изменение артериального давления, коллапс. Со стороны центральной и периферической нервной системы: головная боль, головокружение, эмоциональная лабильность, энцефалопатия, спутанность сознания, повышенная утомляемость, галлюцинации, нарушения зрения, слуха и вкусовых ощущений. Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, дерматозы, отек Квинке. Другие: кардиоваскулярный коллапс, повышение температуры тела, суперинфекция, дерматит, реакция Яриша-Геркстеймера.

**Противопоказания:** Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата, а также тиамфениколу и азидамфениколу. Левомицетин противопоказан пациентам, страдающим нарушением функции кроветворения, тяжелыми заболеваниями печени и/или почек и дефицитом глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы. Препарат не назначают пациентам с грибковыми заболеваниями кожи, псориазом, экземой, порфирией, а также острыми респираторными заболеваниями, в том числе ангиной. Препарат не применяют для предупреждения инфекционных осложнений при оперативных вмешательствах. Левомицетин не следует назначать для терапии женщин в период беременности и грудного вскармливания, а также для лечения детей в возрасте младше 3 лет. Следует с осторожностью назначать пациентам пожилого возраста, а также пациентам с заболеваниями сердечно-сосудистой системы. Пациенты, имеющие склонность к развитию аллергических реакций должны принимать препарат под тщательным наблюдением лечащего врача. Следует соблюдать осторожность при назначении Левомицетина пациентам, работа которых связана с управлением потенциально опасными механизмами и вождением автомобиля.

**Беременность:** Противопоказано применение Левомицетина в период беременности.

**Форма выпуска:** Таблетки по 10 штук в контурной ячейковой упаковке, по 1 или 2 контурных ячейковых упаковок в картонной коробке. Порошок для приготовления раствора для инъекций по 0,5 или 1 г во флаконе. По 1 или 10 флаконов в картонной упаковке.

## 18. Цефуроксим (Cefuroxim)



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Полусинтетический цефалоспориновый антибиотик второго поколения. Обладает бактерицидным действием к большинству грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, но в отличие от цефазолина и цефалексина резистентен к  $\beta$ -лактамазам грамотрицательных бактерий. Действует на штаммы нечувствительные к ампициллину и амоксициллину. Угнетает синтез пептидогликана клеточной мембраны бактерий. Максимальная концентрация после внутривенного и внутримышечного введения в плазме крови наблюдается через 15-45 минут.

**Показания к применению:** Назначают цефуроксим при инфекциях вызванных чувствительными к нему микроорганизмами: - заболевания верхних дыхательных путей (бронхит, пневмония, эмпиема); - ЛОР-заболевания (тонзиллит, фарингит, отит, синусит, гайморит); - заболевания мочеполовой системы (цистит, пиелонефрит, аднексит, гонорея, эндометрит); - заболевания костей и суставов (артрит, бурсит, остеомиелит, тендовагинит); - заболевания кожи и мягких тканей (стрептодермия, фурункулёз, пиодермия, рожистое воспаление, импетиго, эризипелоид); - заболевания органов брюшной полости и желчевыводящих путей, желудочно-кишечного тракта; - профилактика инфекционных заболеваний при операционных вмешательствах.

**Способ применения:** Цефуроксим используют для парентерального (внутривенного и внутримышечного) введения. Для взрослых обычная доза для внутривенного и внутримышечного введения составляет 750 мг (до 1,5 мг) каждые восемь часов. В случае необходимости интервал между введениями сокращают до 6 часов, суточная доза при этом повышается до 3-6 г. Особенности разведения препарата Для приготовления раствора для внутримышечного введения необходимо добавить 3 мл изотонического раствора натрия хлорида или воды для инъекций во флакон и взболтать до образования однородной суспензии. Для приготовления раствора для внутривенного введения необходимо не менее 6 или 15 мл изотонического раствора натрия хлорида, воды для инъекций или 5% глюкозы добавить во флаконы с 750 и 1500 мг цефуроксима соответственно и взболтать до образования однородной суспензии. Раствор используется немедленно и хранению не подлежит.

**Побочные действия:** Побочные эффекты при приеме цефуроксима встречаются редко и имеют легкий и обратимый характер. Со стороны кровеносной и лимфатической системы: нейтропения, эозинофилия, лейкопения, снижение уровня гемоглобина, положительный тест Кумбса, очень редко - гемолитическая анемия и тромбоцитопения. Со стороны желудочно-кишечного тракта: транзиторное повышение билирубина, тошнота, диарея, рвота. Со стороны мочевыделительной системы и почек: повышение уровня креатинина, азота и мочевины в сыворотке крови и снижение клиренса креатинина. Очень редко интерстициальный цистит. Со стороны нервной системы: головные боли, головокружение, очень редко - повышенная возбудимость. Со стороны ЛОР-органов: иногда у детей, которых лечили от менингита наблюдалось снижение слуха. Местные реакции: при внутривенном введении возможно возникновение флебита и тромбоза. При внутримышечном введении – болезненность в месте инъекции. Аллергические реакции: кожные высыпания, анафилактические реакции. При длительном приеме препарата возможен интенсивный рост нечувствительных к цефуроксиму микроорганизмов, например, рода *Candida*, который требует соответствующей терапии.

**Противопоказания:** Противопоказан прием цефуроксима при повышенной индивидуальной чувствительности к антибиотикам цефалоспоринового или пенициллинового ряда. Беременность: Данных о тератогенном и эмбриотоксичном действии цефуроксима нет, однако, применение его во время беременности не желательно и допустимо, только если польза от лечения превышает риск для плода. Цефуроксим проникает в грудное молоко, поэтому назначать его в период кормления грудью следует с осторожностью.

**Форма выпуска:** Порошок для приготовления раствора для инъекций во флаконах по 250, 750 и 1500 мг во флаконах №1, №5.

## СИНТЕТИЧЕСКИЕ ПРОТИВОМИКРОБНЫЕ СРЕДСТВА

### СУЛЬФАНИЛАМИДНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

Группа сульфаниламидных препаратов, как и антибиотики относятся к антибактериальным средствам. Сульфаниламидные средства – предшественники антибиотиков, были открыты за 8 лет до появления первого антибиотика стрептомицина, в 1935 году. В настоящее время синтезировано более 6000 веществ этой группы, но в медицине нашли применение не более 40 соединений.

Большинство сульфаниламидные препаратов имеют сходный между собой механизм антибактериального действия, но отличаются по продолжительности, спектру и силе противомикробного действия.

Сульфаниламидные препараты эффективно подавляют развитие стрептококка, пневмококка, гонококка, менингококка и пр, а также дизентерийной палочки, сибирской язвы, чумы, холерного вибриона, вируса трахомы (заболевание глаз).

Сульфаниламидные средств оказывают бактериостатическое действие подавляя рост и размножение микробных клеток. Механизм химиотерапевтического действия препаратов этой группы заключается в блокировании процесса усвоения парааминобензойной кислоты (ПАБК) микробными клетками. Парааминобензойная кислота является необходимым элементом, обеспечивающим рост, жизнедеятельность и деление бактерий, поскольку участвует в синтезе фолиевой кислоты и метионина, которые, в свою очередь, обеспечивают рост (является фактором роста), микробной клетки. Сульфаниламидные средства по своему химическому строению близки к ПАБК, но имеют и отличия. Между ПАБК и сульфаниламидами возникает конкурентный антагонизм, за счет сходства в строении сульфаниламидные средства задерживают синтез факторов роста, что приводит к нарушению развития и деления бактерий.

Для эффективности антимикробного действия сульфаниламидных препаратов, необходимо, что бы количество сульфаниламидов в инфицированной среде значительно превышали концентрацию ПАБК. Если в этой среде концентрация ПАБК или фолиевой кислоты превышает концентрацию сульфаниламидного препарата (например, при наличии гноя, продуктов распада тканей, а также новокаина), противомикробная активность препарата значительно снижается. Поэтому, для эффективного лечения сульфаниламидными препаратами в крови больного создаются высокие концентрации препарата.

Лечение начинают с повышенной (ударной) дозы, после чего поддерживают концентрацию повторными введениями меньших доз препарата (приблизительно равными количеству выводимого из организма), в течении всего периода лечения.

Применение недостаточных дозы сульфаниламидных препаратов могут привести к «привыканию» бактериальных клеток к препарату, утере им



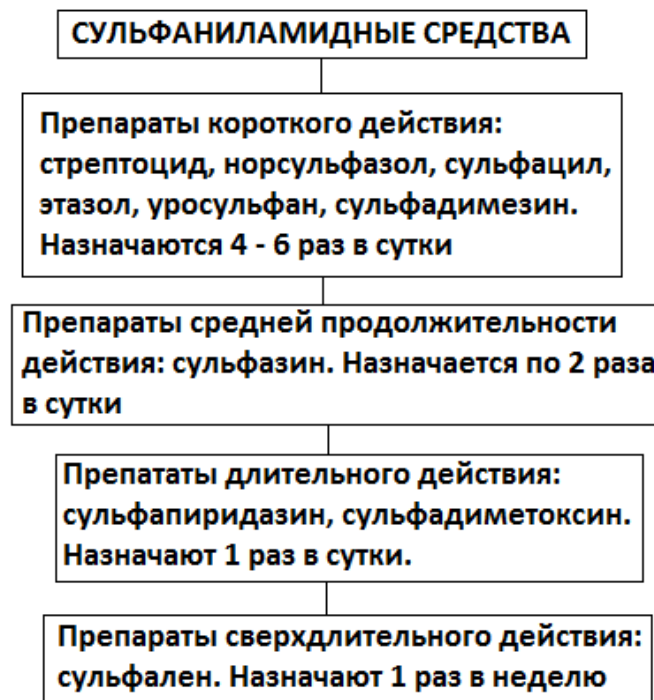
антибактериальной активности и возникновению штаммов микроорганизмов устойчивых к этому лекарственному препарату. Для получения лучшего терапевтического эффекта сульфаниламидные средства часто сочетают с антибиотиками и другими противомикробными препаратами

Поскольку сульфаниламидные средства применяют в значительных (ударных) дозах, побочным эффектом применения этих средств с высокой вероятностью могут быть аллергических реакций (зуд, сыпь, крапивница). Возможна лейкопения. Сульфаниламидные препараты противопоказаны при заболеваниях кроветворных органов, аллергиях, а также при беременности.

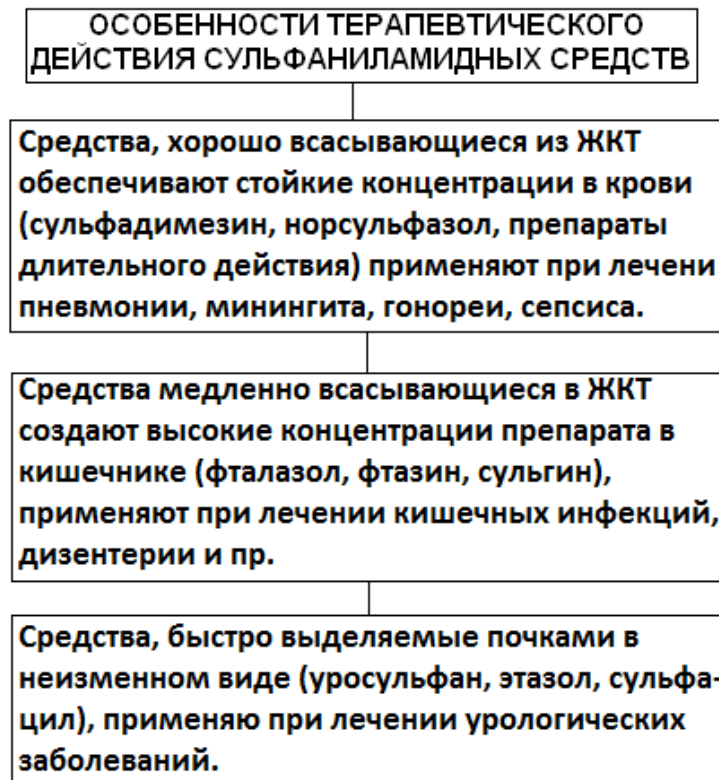
Еще одним негативным эффектом применения сульфаниламидных средств является из возможность выпадения в осадок в кислой среде, что может спровоцировать закупорку мочевыводящих путей, поэтому при назначении этих средств следует одновременно назначать обильное щелочное питье для профилактики осложнений заболеваний почек и мочевыводящих путей.

Сульфаниламидные средства классифицируются на три группы по продолжительности действия:

1. Препараты кратковременного действия (стрептоцид, норсульфазол, сульфацил, этазол, уросульфан, сульфадимезин и пр.). Эти средства назначаются 4 – 6 раз в сутки;
2. Препараты средней продолжительности действия (сульфазин и пр.). Назначаются 2 раза в сутки;
3. Препараты длительного действия (сульфапиридазин, сульфадиметоксин и пр.). Назначают 1 раз в сутки;
4. Препараты сверхдлительного действия (сульфален и пр.). Назначают 1 раз в неделю;



Некоторые сульфаниламидные препараты, хорошо всасываются из желудочно-кишечного тракта (сульфадимезин, норсульфазол, пр.), достаточно быстро создают высокие концентрации препаратов в крови. Такие средства эффективны при лечении пневмонии, гонорей, менингита, сепсиса и др. заболеваний бактериальной природы.



Сульфаниламидные средства плохо всасывающиеся из желудочно-кишечного тракта (фталазол, фтазин, сульгин и пр.), способны таким образом создавать высокие концентрации препарата в ЖКТ. Эффективны для лечения кишечных инфекций: дизентерии, энтероколита и пр.

Сульфаниламидные средства выделяемые почками в неизменном виде (уросульфан, этазол, сульфацил и пр.) и показаны при лечении урологических заболеваний.

Применение сульфаниламидов часто сочетают с антимикробными лекарственными средствами других фармакологических групп. Кроме того, выпускаются комплексные антимикробные препараты содержащие сульфаниламиды, например, бактрим (бисептол), содержащий сульфаметоксазол (сульфаниламидный препарат) и триметоприм (антибактериальное средство из группы ингибиторов синтеза фолиевой кислоты). Два этих препарата обладают одинаковой скоростью элиминации, что обеспечивает эффективность их комплексного действия и широкий спектр противомикробного действия. Каждое из этих средств обладает бактериостатической активностью, а их сочетание обеспечивает эффективное бактерицидное действие (в отношении грамположительных и

граммотрицательных бактерий), в том числе устойчивых к сульфаниламидным средствам.

#### ОСОБЕННОСТИ ПРИМЕНЕНИЯ СУЛЬФАНИЛАМИДОВ

**Совместно с препаратами назначают обильное щелочное питье во избежание закупорки мочевыводящих путей (при кислой реакции мочи).**

**Противопоказано назначении при тяжелых заболеваниях кроветворных органов, аллергии, повышенной чувствительности, беременности (оказывают тератогенное действие).**

**Сульфаниламиды применяют в комплексе с антибиотиками (триметопримом). Сочетание триметоприма с сульфаметоксазолом - бактрим (бисептол), активен в отношении грамположительных и грамотрицательных микробов, в том числе устойчивых к антибиотиками и сульфаниламидным средствам.**

**Сульфатон - сочетание сульфамонетоксина и триметоприма.**

Бактрим эффективен при инфекциях дыхательных путей, а также при лечении урологических заболеваний, желудочно-кишечного тракта и пр. заболеваний бактериальной природы.

Другим комплексным лекарственным препаратом содержащим сульфаниламидное средство является сульфатон. В состав сульфатона входят сульфамонетоксин и триметприм. По антибактериальной активности, механизму действия и спектру антимикробного действия сульфатон близок к бактриму (бисептолу).

Комплексные лекарственные средства, содержащие сульфаниламиды, обладают теми же побочными эффектами, что и сульфаниламидные препараты: способны вызывать аллергические реакции, лейкопению, агранулоцитоз, диарею, тошноту, рвоту и пр. Эти препараты также противопоказаны при заболеваниях кроветворной системы, беременности, нарушении работы почек и печени.

### Производные хинолона и нитрофурана

К лекарственным средствам производным хинолона относится кислота налидиксовая, а так же лекарственные средства содержащие это средство (невиграон и неграм). Производные хинолона эффективны в отношении грамотрицательных микробов. Применяется при лечении урологических заболеваний, а также энтероколитов, холециститах и др. заболеваниях

бактериальной природы. Препараты назначают 3 – 4 раза в день, внутрь в дозе до 1 гр.

Вместе с тем, лекарственные средства группы хинолона дают ряд нежелательных побочных эффектов, таких как аллергические реакции, диарея, тошнота, рвота, головные боли и др. Препарат не применяется при нарушениях функции почек и печени, беременности и у детей в возрасте до 2 лет.

#### ПРОИЗВОДНЫЕ ХИНОЛОНА, НИТРОФУРАНА

**Производные хинолона: кислота налидисовая (невиграмон, ниграм). Эффективно действуют на грамотрицательные микроорганизмы. Применяют при инфекции мочевыводящих путей: холициститах, энтероколитах. Назначают внутрь по 0,5 - 1 г 3 - 4 раза в день. Противопоказаны при заболеваниях печени, почек.**

**Производные нитрофурана: фурацилин, фурадонин, фуразолидон. Большинство (кроме фурацилина) назначают внутрь при инфекциях мочевыводящих путей (фурадонин, фурагин) и кишечных инфекций (фуразолидон), в том числе вызванных простейшими (лямблий, трихомонад).**

Производными нитрофурана являются лекарственные препараты фурацилин, фурадонин, фуразолидон и др.

Фурацилин – относится к антимикробным средствам широкого спектра действия, подавляя как грамположительные, так и грамотрицательные бактерии. Препарат применяется в основном наружно в виде раствором (0,02%) и мазях (0,2%) для лечения ран, отягченных гнойно-воспалительными процессами: промывания ран, язв, ожогов, а также в офтальмологии. При приеме внутрь фурацилин раздражает слизистые оболочки ЖКТ, вызывает тошноту, рвоту, аллергические реакции и пр.

Для перорального приема при бактериальных инфекциях применяют другие препараты из группы нитрофуранов – фурагин, фурадонин и др. Эти препараты оказывают бактерицидное и бактериостатическое действие, применяются в основном для лечения урологических заболеваний. Достаточно быстро всасываясь в ЖКТ, биотрансформации подвергаются в незначительной степени, выделяются почками в значительном количестве создавая высокие концентрации вещества.

Фуразолидон менее токсичен по сравнению с фурацилином и более активен в отношении возбудителей кишечных инфекций: дизентерии, брюшного тифа, пищевых токсикоинфекций, кишечной палочки и пр. Фуразолидон активен и в отношении некоторых простейших (лямблий и

трихомонад). Применяется препарат в основном для лечения инфекций желудочно-кишечного тракта, лямблиозных холециститов и трихомониаза.

К производным нитроимидазола относятся такие лекарственные препараты, как метронидазол (трихопол) и тинидазол. Препараты этой группы наиболее активны в отношении простейших, так метронидазол применяется для лечения трихомоноза, лямблиоза, амебиоза и пр., назначается перорально и в виде свечей. Препарат может вызывать ряд побочных явлений, таких как тошнота, рвота, диарея и пр. Препарат несовместим с алкоголем, противопоказан при беременности и нарушении функции кроветворения. Тинидазол по своей химической структуре и показаниям близок к метронидазолу.

### ПРОИЗВОДНЫЕ НИТРОИМИДАЗОЛА

**Представители: метронидазол, тинидазол.**  
**Применяются для лечения трихомоноза, лямблиоза, амебиоза и других заболеваний вызываемых простейшими. Назначаются внутрь, парентерально и в виде свечей.**  
**Несовместимы с алкоголем, противопоказаны при беременности и нарушениях кроветворения.**

Производные 8-оксихинолина обладают антибактериальной, противопаразитарной и противогрибковой активностью. К препаратам этой группы относятся нитроксолин (5-НОК), интестопан, хиниофон, мексаформ и пр.

Нитроксолин (5 – НОК) обладает широким спектром действия, подавляя грамположительные и грамотрицательные бактерии, а также патогенные грибы. Препарат быстро всасывается из ЖКТ и выделяется почками практически в неизменном виде, применяется для лечения инфекций в урологии.

Интестопан также обладает широким спектром действия в отношении бактерий и некоторых простейших, применяется для лечения острого и хронического энтероколита, бактериальной и амёбной дизентерии.

Хинофан применяется для лечения амёбной дизентерии, а также в качестве противоревматического средства.

## ПРОИЗВОДНЫЕ 8-ОКСИХИНОЛИНА

**Обладают противомикробной, противопаразитарной, противогрибковой активностью. Представители: 5-НОК, интесотопан, хиниофон.**

**5-НОК обладает широким спектром действия на грамположительные, грамотрицательные бактерии и некоторые грибы. Выделяется в неизменном виде почками, применяется при инфекции мочевыводящих путей.**

**Интесоппан - при амёбной бациллярно дизентерии.**

**Хиниофон - при амёбной дизентерии.**

### Краткая характеристика препаратов.

#### 1. Фталазол (Phthalazolium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Фталазол медленно всасывается из желудочно-кишечного тракта. Основная масса препарата при введении внутрь задерживается в кишечнике, где постепенно происходит отщепление активной (сульфаниламидной) части молекулы. Создающейся при этом высокой концентрацией сульфаниламида в кишечнике в сочетании с активностью препарата в отношении кишечной флоры объясняют его большую эффективность при кишечных инфекциях.

**Показания к применению:** Дизентерия (заболевание кишечника, вызванное простейшими), колиты (воспаление толстой кишки), гастроэнтериты (воспаление слизистых оболочек желудка и тонкой кишки), операции на кишечнике.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. При острой форме дизентерии взрослым больным назначают внутрь в 1-2-й день по 6 г в сутки (каждые 4 ч по 1 г), в 3-4-й день - по 4 г в сутки (каждые 6 ч по 1 г), в 5-6-й день - по 3 г в сутки (каждые 8 ч по 1 г). На курс лечения всего 25-30 г. После первого цикла лечения (через 5-6 дней) проводят второй цикл: 1-2-й день - по 1 г через 4 ч (ночью через 8 ч), всего 5 г в сутки; 3-4-й день - по 1 г через 4 ч (ночью не дают), всего 4 г в сутки; 5-й день - по 1 г через 4 ч (ночью не дают), всего 3 г в сутки. В течение второго цикла общая доза 21 г; при легком течении болезни доза на второй цикл может быть уменьшена до 18г. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 2 г, суточная - 7г.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки По 0,5 г в упаковке по 10 штук.

#### 2. Сульфацил натрия (Sulfacylum-natrium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Препарат эффективен при стрептококковых, гонококковых, пневмококковых и колибациллярных инфекциях.

**Показания к применению:** Гнойные язвы роговицы (прозрачной оболочки глаза), конъюнктивиты (воспаление наружной оболочки глаза), блефариты (воспаление краев век), гонорейные заболевания глаз, инфицированные раны, инфекции, вызванные кишечной палочкой.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Наружно в виде глазных капель (10%, 20%, 30% водные растворы), мазей (10%, 20%, 30%) и присыпок; внутрь взрослым 0,5-1 г 3-5 раз в день, детям - по 0,1-0,5 г 3-5 раз в день. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 2 г, суточная - 7г. Для инъекций применяют сульфацил-натрий при пневмониях, гнойных трахеобронхитах (сочетанном гнойном воспалении трахеи и бронхов), инфекциях мочеполовых путей и других инфекционных заболеваниях. Вводят внутривенно медленно (в течение не менее 5 мин) 3-5 мл 30% раствора 2 раза в день с промежутком 12 ч. Для профилактики бленнореи (острого гнойного воспаления наружной оболочки глаза) у новорожденных закапывают в глаза по 2 капли 30% раствора непосредственно после рождения и по 2 капли через 2 ч.

**Побочные действия:** Возможно раздражение тканей; при приеме внутрь аллергические реакции, диспепсические нарушения (расстройства пищеварения).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к сульфаниламидным препаратам.

**Форма выпуска:** Порошок; 30% раствор для инъекций в ампулах по 5 мл; 30% раствор во флаконах по 5 и 10 мл; 20% раствор (глазные капли) в тубике-капельнице по 1,5 мл в упаковке по 2 штуки; 10% раствор сульфацила растворимого с метилцеллюлозой; мазь 30% в упаковке по 10 г.

### 3. Нитроксалин (Nitroxolinum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство ( группа оксихинолина).

**Фармакологическое действие:** Оказывает антибактериальное действие на грамположительные и грамотрицательные бактерии; эффективен также в отношении некоторых грибов (рода Candida и др.). В отличие от других производных 8-оксихинолина нитроксалин быстро всасывается из желудочно-кишечного тракта и выделяется в неизменном виде почками, в связи с чем отмечается высокая концентрация препарата в моче.

**Показания к применению:** Применяют при инфекциях мочеполовых путей: пиелонефрит (воспаление ткани почки и почечной лоханки), цистит (воспаление мочевого пузыря), уретрит (воспаление мочеиспускательного канала), простатит (воспаление предстательной железы) и др. Для профилактики инфекций после операций на почках и мочевых путях, а также при других заболеваниях, вызванных чувствительными к этому препарату микроорганизмами. Часто эффективен при устойчивости микрофлоры к другим антибактериальным средствам.

**Способ применения:** Назначают внутрь. Принимают во время или после еды. Средняя суточная доза для взрослых 0,4 г (по 0,1 г 4 раза в день). Доза может быть увеличена вдвое. Длительность лечения зависит от характера и тяжести заболевания. В большинстве случаев курс лечения 2-3 нед. При необходимости проводят повторные курсы с двухнедельным перерывом. В тяжелых случаях суточную дозу увеличивают до 0,15-0,2 г 4 раза в день. Высшая суточная доза для взрослых - 0,8 г. Средняя суточная доза для детей старше 5 лет 0,2-0,4 г (по 0,05-0,1 г 4 раза в день), до 5 лет - 0,2 г в сутки. Длительность курса лечения - 2-3 нед. При хронических инфекциях мочевых путей препарат можно назначать повторно по 2 нед. с 2-недельным перерывом. Для профилактики инфекций при операциях на почках и мочевых путях назначают по 0,1 г на прием 4 раза в день в течение 2-3 нед.

**Побочные действия:** Препарат обычно хорошо переносится. Иногда отмечаются диспепсические явления (тошнота), поэтому его рекомендуется принимать во время еды. Возможна аллергическая сыпь. При почечной недостаточности следует проявлять осторожность из-за возможной кумуляции (накопления в организме) препарата. Моча при лечении препаратом окрашивается в шафраново-желтый цвет.

**Противопоказания:** При повышенной чувствительности к производным 8-оксихинолина препарат противопоказан.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г (50 мг) в упаковке по 50 штук.

#### 4. Энтеросептол (Enteroseptol);



**Групповая принадлежность:** Противодиарейное средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает антибактериальное (приводящее к гибели бактерий) и антипротозойное (направленное на подавление жизнедеятельности простейших организмов) действие. Препарат практически не всасывается из желудочно-кишечного тракта, не оказывает системного действия и рассматривается как местнодействующее (главным образом в кишечнике) антибактериальное средство.

**Показания к применению:** Применяют при ферментативной и гнилостной диспепсии (расстройстве пищеварения), диарее (поносе), энтероколитах (воспалении тонкой и толстой кишки), амёбной и бациллярной дизентерии, протозойных колитах (воспалении толстой кишки, вызываемом простейшими), для лечения амёбоносителей (пациентов, у которых выявляется амёба *Entamoebahistolytica*, но не страдающих амёбиазом; потенциально опасны для окружающих как источник заражения). При бациллярной дизентерии энтеросептол должен назначаться в комплексе с другими средствами лечения. Препарат можно применять в случаях непереносимости антибиотиков. Его можно назначать в комбинации с сульфаниламидными препаратами. При амёбиазе (инфекционном заболевании, вызываемом амёбой *Entamoebahistolytica*, характеризующемся хроническим воспалением толстой кишки с образованием язв) и трихомонадных колитах (воспалении толстой кишки, вызываемом трихомонадами /паразитическими простейшими/) энтеросептол может быть использован в комплексе с другими средствами лечения. В остром периоде амёбной дизентерии энтеросептол уступает эметину, однако он может применяться после приема эметина в случаях остаточных явлений амёбиаза. Назначение энтеросептола возможно также в комплексном лечении хронических язвенных колитов (неспецифических).

**Способ применения:** Принимают энтеросептол внутрь. Доза (для взрослых) 1-2 таблетки 3 раза в день после еды. При упорном течении заболевания дозу повышают до 3 таблеток 3 раза в день. После прекращения острых явлений дозу уменьшают до 1 таблетки 2-3 раза в день. Обычно курс лечения продолжается 10-12 дней. При необходимости проводят повторный курс с промежутками 5-10 дней. Если требуется, в промежутках назначают эметин или антибиотики группы тетрациклина. Лечение энтеросептолом должно проводиться только по назначению врача, причем курс приема препарата не должен превышать 4 нед.

**Побочные действия:** При приеме препарата могут наблюдаться диспепсические явления (расстройства пищеварения), кожные высыпания, боли в суставах. В редких случаях отмечаются явления йодизма (неинфекционное воспаление слизистых оболочек в местах выделения йода при передозировке или индивидуальной непереносимости препаратов йода): насморк, кашель. Эти побочные явления проходят при уменьшении дозы или после отмены препарата. Необходимо учитывать, что энтеросептол и содержащие его комбинированные препараты (мексаформ, мексаза) могут, особенно при длительном применении, вызывать периферические невриты (воспаление нерва), миелопатию (невоспалительные заболевания спинного мозга), поражение зрительного нерва. В настоящее время используется редко.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан больным с заболеваниями зрительного нерва и с поражениями периферической нервной системы, при нарушениях функции печени и почек, при аллергии к йоду.

**Форма выпуска:** Таблетки в упаковке по 20 штук.

#### 5. Офлоксацин (Ofloxacinum);





**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство (группа фторхинолона).

**Фармакологическое действие:** Как и другие фторхинолоны, офлоксацин обладает широким антибактериальным спектром действия. Влияет преимущественно на грамотрицательные бактерии. Эффективен в отношении микроорганизмов, устойчивых к большинству антибиотиков и сульфаниламидам. Оказывает бактерицидное (уничтожающее бактерии) действие. Эффективен при приеме внутрь. Быстро и почти полностью (свыше 95%) всасывается из желудочно-кишечного тракта, поступает в высокой концентрации в органы и ткани, а также в мокроту, слюну, желчь, кожу, ткань и секрет предстательной железы.

**Показания к применению:** Применяют офлоксацин при инфекциях дыхательных путей, уха, горла, носа, кожи, мягких тканей, остеомиелите (воспалении костного мозга и прилегающей костной ткани), инфекционных заболеваниях органов брюшной полости, почек, мочевыводящих путей, простатите (воспалении предстательной железы), инфекционных гинекологических заболеваниях, гонорее. Имеются данные об активности офлоксацина в отношении микобактерий туберкулеза и целесообразности его применения в комплексной терапии туберкулеза.

**Способ применения:** Назначают взрослым внутрь. При инфекциях дыхательных путей, кожи и мягких тканей: ранах, фурункулах (гнойном воспалении волосяного мешка кожи, распространившемся на окружающие ткани), карбункулах (остром разлитом гнойно-некротическом воспалении нескольких расположенных рядом сальных желез и волосяных луковиц), флегмоне (остром, четко не отграниченном гнойном воспалении) и др.; инфекционных заболеваниях органов брюшной полости, верхних мочевых путей - по 0,2 г (1 таблетка) 2 раза в день; при инфекциях костей и суставов - по 0,2-0,4 г (1-2 таблетки) 2 раза в день; при уретрите (воспалении мочеиспускательного канала) и простатите (воспалении предстательной железы) - по 0,3-0,4 г 2 раза в день. При тяжелых инфекциях дыхательных путей и других тяжелых инфекциях дозу увеличивают до 0,3-0,4 г в день. Принимают таблетки офлоксацина не разжевывая, с небольшим количеством воды, до или после еды. Лечение, как и при применении других химиотерапевтических препаратов, проводят до исчезновения признаков заболевания и в последующие 2-3 дня или более. Обычно курс лечения 7-10 дней. В неосложненных случаях курс лечения может быть менее продолжительным. Нельзя принимать препарат свыше 4 нед.

**Побочные действия:** Препарат обычно хорошо переносится. В отдельных случаях наблюдаются аллергические реакции (кожный зуд, сыпь); возможны развитие отека лица, голосовых связок; анорексия (отсутствие аппетита), боль в животе, тошнота, рвота, понос; нарушения сна, головная боль, чувство беспокойства, общее угнетение; изменения картины крови: лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), агранулоцитоз (резкое снижение числа гранулоцитов в крови), тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови). В редких случаях нарушается восприятие запаха и вкуса. При применении офлоксацина, так же как и других фторхинолонов, не следует подвергаться действию ультрафиолетовых лучей из-за возможной фотосенсибилизации (повышения чувствительности к солнечному свету) кожи.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к хинолонам, эпилепсия. Нельзя назначать препарат беременным, кормящим женщинам, детям и подросткам с незавершенным формированием скелета (до 15 лет). При нарушениях функции почек сначала дают обычные дозы, а затем их уменьшают с учетом клиренса креатинина (скорости очищения крови от конечного продукта азотистого обмена - креатинина). Не следует принимать офлоксацины одновременно с антацидными (снижающими кислотность желудка) средствами (в том числе со щелочными водами) во избежание снижения эффективности.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,2 г в упаковке по 10 штук.

## 6. Сульфадиметоксин (Sulfadimethoxinum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Противомикробное бактериостатическое средство, сульфаниламид длительного действия. Механизм действия обусловлен конкурентным антагонизмом с парааминобензойной кислотой, угнетением дигидроптероатсинтетазы, нарушением синтеза тетрагидрофолиевой кислоты, необходимой для синтеза пуринов и пиримидинов. Активен в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов: *Staphylococcus* spp., *Streptococcus* spp., в том числе *Streptococcus pneumoniae*, палочки Фридендера, *Escherichia coli*, *Shigella* spp., *Chlamydia trachomatis*.

**Показания к применению:** Инфекционно-воспалительные заболевания, вызванные чувствительной микрофлорой: тонзиллит, бронхит, пневмония, гайморит, отит, дизентерия, воспалительные заболевания желчных и мочевыводящих путей, рожа, раневая инфекция, трахома.

**Способ применения:** Внутрь, 1 раз в сутки, в 1 день - 1-2 г, затем - по 0,5-1 г/сут. Детям (с 2 лет) в 1-й день - 25 мг/кг/сут, затем - 12,5 мг/кг/сут. Курс лечения - 7-10 дней.

**Противопоказания:** Гиперчувствительность, угнетение костномозгового кроветворения, почечная/печеночная недостаточность, хроническая сердечная недостаточность, врожденный дефицит глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы, порфирия, азотемия, беременность. Данная лекарственная форма не предназначена для применения у детей до 2 лет.

**Особые указания:** Во время терапии рекомендуется обильное щелочное питье, контроль показателей крови и мочи.

**Форма выпуска:** Сульфодиметоксин таблетки 0,2 г и 0,5 г по 10 таблеток в контурной ячейковой упаковке. Две контурные ячейковые упаковки вместе с инструкцией по медицинскому применению в картонной пачке.

## 7. Бактрим суспензия (Bactrim);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное комбинированное средство

**Фармакологическое действие:** Комбинированный препарат. Сочетание сульфаметоксазола и триметоприма обеспечивает высокую эффективность в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, в том числе устойчивых к сульфаниламидным препаратам. Бактрим быстро всасывается при приеме внутрь. Максимальная концентрация в крови отмечается через 1-3 ч и сохраняется в течение 7 ч.

**Показания к применению:** Септицемия (форма заражения крови микроорганизмами), инфекции дыхательных, мочевыводящих путей и желудочно-кишечного тракта, вызванные чувствительными к препарату микроорганизмами и др.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Назначают внутрь после еды (утром и вечером). Дозы устанавливают в зависимости от возраста ребенка: от 6 нед. до 5 мес. - по 1/2 чайной ложки 2 раза в день; от 6 мес. до 5 лет - по 1 чайной ложке 2 раза в день; от 5 до 12 лет - по 2 чайные ложки 2 раза в день.

**Побочные действия:** Тошнота, рвота, аллергические реакции, лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови) и агранулоцитоз (резкое снижение числа гранулоцитов в крови). Лечение проводят под контролем картины крови.

**Форма выпуска:** Суспензия (сироп) во флаконах по 100 мл.

## 8. Фурацилин (Furacium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство (группа нитрофурана)

**Фармакологическое действие:** Обладает противомикробной активностью в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий.

**Показания к применению:** Гнойно-воспалительные процессы, раневая инфекция, бактериальная дизентерия.

**Способ применения:** При гнойно-воспалительных процессах наружно в виде водного раствора (1:5000), спиртового раствора (1:1500) и 0,2% мази. При острой бактериальной дизентерии назначают внутрь после еды по 0,1 г 4-5 раз в сутки в течение 5-6 дней. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 0,1 г, суточная - 0,5 г.

**Побочные действия:** В отдельных случаях дерматиты (воспаление кожи). Иногда при приеме внутрь потеря аппетита, тошнота, рвота, головокружение, аллергические сыпи; длительное применение может вызвать невриты (воспаление нерва).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к производным нитрофурана. Внутрь назначают с осторожностью при нарушении функции почек.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,02 г в упаковке по 10 штук для наружного применения; таблетки по 0,1 г в упаковке по 12 штук для приема внутрь.

#### 9. Салазопиридазин (Salazopyridazinum);



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламилный препарат. Оказывает противовоспалительное и иммунодепрессивное (подавляющее защитные силы организма) действие.

**Показания к применению:** Неспецифический язвенный колит (хроническое воспаление толстой кишки с образованием язв, вызванное неясными причинами), а также при заболеваниях, протекающих с аутоиммунными нарушениями (нарушениями, в основе которых лежат аллергические реакции на собственные ткани или продукты жизнедеятельности организма), в том числе в качестве базисного средства в терапии ревматоидного артрита (инфекционно-аллергической болезни из группы коллагенозов, характеризующейся хроническим прогрессирующим воспалением суставов).

**Способ применения:** При неспецифическом язвенном колите назначают салазопиридазин взрослым внутрь (после еды) в таблетках по 0,5 г 4 раза в день в течение 3-4 нед. Если за этот период проявляется терапевтический эффект, суточную дозу понижают до 1,0-1,5 г (0,5 г 2-3 раза в день) и продолжают лечение в течение еще 2-3 нед. При отсутствии эффекта прием препарата прекращают. Больным с легкими формами болезни назначают препарат сначала в суточной дозе 1,5 г, а при отсутствии эффекта увеличивают дозу до 2 г в сутки. Детям в возрасте от 3 до 5 лет салазопиридазин назначают, начиная с дозы 0,5 г в сутки (2-3 приема). При отсутствии эффекта в течение 2 нед. препарат отменяют, а при наличии терапевтического

эффекта продолжают лечение в этой дозе в течение 5-7 дней, затем дозу уменьшают в 2 раза и продолжают лечение еще 2 нед. В случае клинической ремиссии (временного ослабления или исчезновения проявлений болезни) суточную дозу вновь уменьшают вдвое и назначают ее до 40-50-го дня, считая от начала лечения. Детям в возрасте от 5 до 7 лет назначают препарат, начиная с 0,75-1,0 г в сутки; от 7 до 15 лет - с дозы 1,0-1,2-1,5 г в сутки. Лечение и снижение доз проводят по той же схеме, что и у детей от 3 до 5 лет. Применение салазопиридазина сочетают с общими методами лечения и диетой, рекомендуемыми при неспецифическом язвенном колите.

**Побочные действия:** При приеме таблеток салазопиридазина внутрь возможны те же побочные реакции, что при применении сульфаниламидов и салицилатов: аллергические явления, лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), диспепсические расстройства (расстройства пищеварения), иногда незначительное снижение уровня гемоглобина (функциональной структуры эритроцита, обеспечивающей его взаимодействие с кислородом). В подобных случаях следует уменьшить дозу или отменить препарат. После введения суспензии могут появиться чувство жжения в прямой кишке и позывы на дефекацию (опорожнение кишечника), особенно при быстром введении. При использовании салазопиридазина в свечах возможно ощущение жжения и болезненности в прямой кишке, иногда учащение стула. В случае выраженной болезненности при ректальном введении салазопиридазина в свечах рекомендуется назначить препарат ректально в виде 5% суспензии и внутрь в таблетках.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при наличии в анамнезе (истории болезни) данных о токсико-аллергических реакциях при лечении сульфаниламидами и салицилатами.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,5 г в упаковке по 50 штук; 5% суспензия во флаконах по 250 мл (препарат после взбалтывания представляет собой взвесь оранжевого цвета, которая затем оседает); свечи (коричневого цвета) по 0,5 г в упаковке по 10 штук.

## 10. Диоксидин (Dioxynum);



### Групповая принадлежность:

**Фармакологическое действие:** Диоксидин является антибактериальным препаратом широкого спектра действия. Эффективен при инфекциях, вызванных вульгарным протеом (видом микроорганизмов, которые в определенных условиях могут вызывать инфекционные заболевания тонкого кишечника и желудка), синегнойной палочкой, палочкой дизентерии и палочкой клебсиеллы (Фридлендера - бактериями-возбудителями воспаления легких и местных гнойных процессов), сальмонеллами, стафилококками, стрептококками, патогенными анаэробами (способными существовать в отсутствие кислорода бактериями, вызывающими заболевания человека), в том числе возбудителями газовой гангрены. Действует на штаммы бактерий, устойчивые к другим химиотерапевтическим препаратам, включая антибиотики.

**Показания к применению:** Применяют для лечения тяжелых гнойно-воспалительных процессов различной локализации: гнойных плевритов (воспаления оболочек легкого), эмпиемы плевры (скопления гноя между оболочками легких), абсцесса (гнойника) легкого, перитонитов (воспаления брюшины), циститов (воспаления мочевого пузыря), ран с наличием глубоких полостей: абсцессов мягких тканей, флегмон (острого, четко не отграниченного гнойного воспаления), послеоперационных ран моче- и желчевыводящих путей и др., а также для профилактики инфекционных осложнений после катетеризации (введения трубки или медицинского инструмента трубчатой формы) мочевого пузыря.

**Способ применения:** Назначают только взрослым. Перед началом курса лечения проводят пробу на переносимость препарата, для чего вводят в полости 10 мл 1% раствора. При отсутствии в течение 3-6 ч побочных явлений (головокружение, озноб, повышение температуры тела) начинают курсовое лечение. В противном случае препарат не назначают. Вводят раствор в полости через дренажную трубку (трубку, введенную в полость для оттока крови, гноя и т. д.), катетер или шприц - обычно от 10 до 50 мл 1% раствора (0,1-0,5 г). Максимальная суточная доза - 70 мл 1% раствора (0,7 г). Применяют обычно 1 или 2 раза в сутки (не превышая суточной дозы 70 мл 1% раствора). Длительность лечения зависит от тяжести заболевания, эффективности терапии и переносимости. При хорошей переносимости вводят в течение 3 нед. и более. При необходимости курс лечения повторяют через 1-1,5 мес.

**Побочные действия:** При введении диоксидина в вену или полости возможны головная боль, озноб, повышение температуры тела, диспепсические явления (расстройства пищеварения), судорожные

подергивания мышцы. Для предупреждения побочных реакций рекомендуется назначение противогистаминных препаратов и препаратов кальция. При появлении побочных реакции следует уменьшить дозу, назначить антигистаминные средства, а при необходимости - прекратить прием диоксилина.

**Противопоказания:** Индивидуальная непереносимость и наличие в анамнезе (истории болезни) сведений о недостаточности функции надпочечников. В условиях эксперимента выявлено тератогенное и эмбриотоксическое действие (влияющее на развитие и повреждающее плод действие) диоксилина, в связи с чем он противопоказан при беременности. Препарат оказывает также мутагенное влияние может вызывать изменения наследственности). В связи с этими явлениями диоксидин назначают только при тяжелых формах инфекционных заболеваний или при неэффективности других антибактериальных препаратов. Не допускается бесконтрольное применение диоксилина и содержащих его лекарственных форм. При недостаточной функции почек доза диоксилина должна быть уменьшена.

**Форма выпуска:** 1% раствор в ампулах по 10 мл (в упаковке по 10 ампул) для внутримышечного и местного применения; 0,5% раствор в ампулах по 10 и 20 мл для внутривенного, внутримышечного и местного применения; 5% мазь в тубах по 25 и 50 г.

#### 11. Сульфален (Sulfalenum);



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат, обладающий противомикробной активностью в отношении многих бактерий. Отличается пролонгированным (длительным) действием.

**Показания к применению:** Инфекционные заболевания, вызванные чувствительными к сульфаниламидным препаратам микроорганизмами: бронхит (воспаление бронхов), пневмония (воспаление легких), холецистит (воспаление желчного пузыря), холангит (воспаление желчных протоков), пиелит (воспаление почечной лоханки), цистит (воспаление мочевого пузыря), гнойная инфекция различной локализации, остеомиелит (воспаление костного мозга и прилегающей костной ткани), отит (воспаление полости уха) и др. При дизентерии неэффективен, так как быстро всасывается из тонкого кишечника.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. При острых и быстропотекающих инфекциях назначают внутрь в 1-й день 1 г, затем по 0,2 г в день за 30 мин до еды. При хронических инфекциях и для длительной профилактики (ревматоидные заболевания, хронический бронхит и др.) применяют 1 раз в неделю по 2 г в течение 1-1,5 мес.

**Побочные действия:** Тошнота, аллергические реакции, головная боль, лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови).

**Противопоказания:** Наличие в анамнезе (истории болезни) аллергических реакций на сульфаниламидные препараты, азотемия (избыточное содержание в крови азотсодержащих продуктов), беременность.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,2 г в упаковке по 10 штук.

#### 12. Фуразолидон (Furazolidonum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное и противопаразитарное средство (из группы нитрофурана)

**Фармакологическое действие:** Фуразолидон – антибактериальное лекарственное средство группы нитрофуранов. Фуразолидон синтетическое производное 5-нитрофурфурола, обладающее выраженной противомикробной активностью в отношении грамотрицательных аэробных микроорганизмов, в меньшей степени чувствительны к действию препарата грамположительные аэробные микроорганизмы, некоторые простейшие и грибы (в частности грибы рода *Candida*). Фармакологическое действие препарата напрямую зависит от дозы, при применении невысоких доз фуразолидон оказывает бактериостатический эффект, при увеличении дозы отмечается выраженная бактерицидная активность. Кроме того, препарат оказывает некоторое иммуностимулирующее действие. Фуразолидон повышает чувствительность организма к этиловому спирту, что может приводить к развитию тошноты и рвоты при одновременном употреблении алкоголя и фуразолидона. Препарат эффективен в терапии инфекционных заболеваний, вызванных штаммами микроорганизмов, чувствительных к действию фуразолидона, в том числе: Грамположительные и грамотрицательные аэробные бактерии: *Streptococcus* spp., *Staphylococcus* spp., *Shigella* spp. (в том числе *Shigella dysenteriae*, *Shigella boydii*, *Shigella sonnei*), *Salmonella typhi*, *Salmonella paratyphi*, *Escherichia coli*, *Proteus* spp, *Klebsiella* spp, и бактерии рода *Enterobacter*. Препарат также эффективен в отношении простейших, в том числе *Trichomonas* spp., *Lambliia* spp. Кроме того, препарат эффективен в отношении грибов рода *Candida*, однако перед назначением фуразолидона для терапии кандидоза следует проводить тесты чувствительности. **Показания к применению:** Препарат применяют для лечения пациентов с инфекционными заболеваниями органов желудочно-кишечного тракта, мочеполовой системы, а также кожных покровов, в частности: Бациллярная дизентерия, тиф, паратиф, энтероколит, лямблиоз, диарея инфекционной этиологии. Препарат также применяют для лечения пищевых отравлений. Трихомонадная инфекция, в том числе трихомонадных кольпит, а также вагинит, уретрит, цистит и пиелит. Препарат применяется для лечения пациентов с инфицированными ранами и ожогами.

**Способ применения:** Препарат принимают перорально. Таблетку рекомендуется глотать целиком, не разжевывая и не измельчая, запивая большим количеством воды. Препарат следует принимать после приема пищи. Длительность курса лечения и дозы препарата определяет лечащий врач индивидуально для каждого пациента в зависимости от характера заболевания и личных особенностей пациента. Взрослым для лечения дизентерии, паратифа и пищевых токсикоинфекций обычно назначают по 0,1-0,15г (2-3 таблетки) препарата 4 раза в день. Длительность курса лечения в зависимости от тяжести заболевания от 5 до 10 дней. Препарат также можно принимать циклами по 0,1-0,15г 4 раза в день в течение 3-6 дней, после чего делают перерыв 3-4 дня и возобновляют прием препарата по той же схеме. Взрослым для лечения лямблиоза обычно назначают по 0,1г (2 таблетки) препарата 4 раза в сутки. Взрослым для лечения трихомонадного уретрита обычно назначают по 0,1г (2 таблетки) препарата 4 раза в сутки. Длительность курса лечения 3 дня.

**Побочные действия:** Препарат малотоксичен, однако, в некоторых случаях возможно развитие побочных эффектов на фоне терапии фуразолидоном, в том числе: Со стороны желудочно-кишечного тракта: анорексия, тошнота, рвота, боли в эпигастральной области. Аллергические реакции: кожная сыпь, зуд, крапивница, отек Квинке. Для уменьшения выраженности побочных эффектов рекомендуется запивать препарат большим количеством воды, а также принимать витамины группы В и антигистаминные средства. При ярко выраженных побочных эффектах прием препарата следует прекратить и обратиться к лечащему врачу. При длительном применении препарата возможно развитие гемолитической анемии и метгемоглобинемии (преимущественно у новорожденных и грудных детей), а также одышки, кашля, гипертермии и нейротоксических реакций.

**Противопоказания:** Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата. Препарат противопоказан пациентам с терминальной стадией хронической почечной недостаточности. Препарат не применяют для лечения детей в возрасте младше 1 месяца. В связи с тем, что препарат содержит молочный сахар (лактозу) его не следует назначать пациентам с дефицитом глюкозо-6-фосфотдегидрогеназы и лактазной недостаточностью. Препарат следует с осторожностью назначать женщинам в период беременности и лактации, а также пациентам с нарушениями функции почек. Препарат с осторожностью назначают пациентам, страдающим заболеваниями печени и нервной системы. Препарат не следует назначать пациентам, работа которых связана с управлением автомобилем и потенциально опасными механизмами.

**Форма выпуска:** Таблетки по 10 штук в контурной безъячейковой упаковке. Таблетки по 10 штук в контурной ячейковой упаковке, по 2 контурные ячейковые упаковки в картонной коробке.

### 13. Уросульфам (*Urosulfanum*);

**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Наиболее активен в отношении стафилококков и кишечной палочки. Хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. В крови создается высокая концентрация препарата. Выделяется из организма преимущественно почками. Высокая концентрация в моче способствует антибактериальному действию на возбудителей инфекции мочевых путей. Малотоксичен. Отложения препарата в мочевых путях не наблюдается.

**Показания к применению:** Гнойные инфекции мочевыводящих путей: циститы (воспаление мочевого пузыря), пиелиты (воспаление почечной лоханки), цистопиелиты (сочетанное воспаление мочевого пузыря и

почечной лоханки), пиелонефрит (воспаление ткани почки и почечной лоханки), инфицированные гидронефрозы (заболевание почек, характеризующееся значительным расширением их лоханок и чашечек, осложненное пиелонефритом - воспалительным поражением тканей почек).

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Внутрь по 0,5-1 г 3-5 раз в день. Курс лечения - 6-14 дней. Суточная доза для детей - 1-2,5 г (в 4-5 приемов). Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 2 г, суточная - 7г.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,5 г в упаковке по 12 штук.

#### 14. Кислота налидиксовая (Acidum nalidixicum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство ( группа, хинолона)

**Фармакологическое действие:** Является синтетическим антибактериальным препаратом. Эффективна при инфекциях, вызванных грамотрицательными бактериями, кишечной, дизентерийной и брюшнотифозной палочками, протеем (видом микроорганизмов, которые в определенных условиях могут вызывать инфекционные заболевания тонкого кишечника и желудка), палочкой клебсиеллы (Фридлендера - бактерий-возбудителей воспаления легких и местных гнойных процессов). Действует бактериостатически и бактерицидно (препятствует размножению и уничтожает бактерии). Эффективна в отношении штаммов, устойчивых к антибиотикам и сульфаниламидам. Малоэффективна в отношении грамположительных кокков (стафилококки, стрептококки, пневмококки) и патогенных анаэробов (способных существовать в отсутствии кислорода бактерий, вызывающих заболевания человека). Препарат хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Около 80% выделяется с мочой в неизменном виде.

**Показания к применению:** Применяют главным образом при инфекциях мочевых путей: цистите (воспалении мочевого пузыря), пиелите (воспалении почечной лоханки), пиелонефрите (воспалении ткани почки и почечной лоханки), - вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами. Наиболее эффективен при острых инфекциях. Назначают также для профилактики инфекций при операциях на почках и мочевом пузыре. Рекомендуются при энтероколитах (воспалении тонкой и толстой кишки), холециститах (воспалении желчного пузыря), воспалении среднего уха и других заболеваниях, вызванных чувствительными к препарату микроорганизмами, в том числе устойчивыми к другим антибактериальным средствам.

**Способ применения:** Взрослые принимают внутрь по 0,5 г (1 капсула или 1 таблетка), а при более тяжелых инфекциях - по 1 г 4 раза в день. Курс лечения не менее 7 дней. При длительном лечении применяют по 0,5 г 4 раза в день. Детям назначают из расчета 60 мг/кг, распределив суточную дозу на 4 равные части.

**Побочные действия:** Обычно налидиксовая кислота хорошо переносится; однако возможны тошнота, рвота, понос, головная боль, головокружение. Могут возникать аллергические реакции (дерматиты /воспаление кожи/, повышение температуры тела, эозинофилия /увеличение числа эозинофилов в крови/), а также повышаться чувствительность кожи к солнечному свету (фотодерматозы). У больных с нарушением мозгового кровообращения, паркинсонизмом, эпилепсией могут появиться судороги. В связи с возможностью судорожных реакций следует остерегаться передозировки препарата у детей. Выраженные побочные реакции требуют временной или полной отмены препарата.

**Противопоказания:** Нарушение функции печени, угнетение дыхательного центра. Большая осторожность необходима при недостаточной функции почек. Нельзя назначать женщинам в первые 3 мес. беременности и детям до 2 лет. Не следует применять препарат одновременно с нитрофуранами, так как при этом уменьшается антибактериальный эффект. Форма выпуска: В капсулах или таблетках по 0,5 г.

#### 15. Бисептол (Biseptol)



**Групповая принадлежность:** Противомикробное комбинированное средство

**Фармакологическое действие:** Сочетание этих двух препаратов, каждый из которых оказывает бактериостатическое (препятствующее размножение бактерий) действие, обеспечивает высокую бактерицидную (уничтожающую бактерии) активность в отношении грамположительных и грамотрицательных микроорганизмов, в том числе бактерий, устойчивых к сульфаниламидным препаратам. Бактерицидный эффект связан с двойным блокирующим действием бактрима на метаболизм (обмен веществ) бактерий. Сульфаметоксазол нарушает биосинтез дигидрофолиевой кислоты, а триметоприм блокирует следующую стадию метаболизма - восстановление дигидрофолиевой кислоты в необходимую для развития микроорганизмов тетрагидрофолиевую кислоту. Препарат эффективен в отношении стрептококков, стафилококков, пневмококков, палочки дизентерии, брюшного тифа, кишечной палочки, протей; неэффективен в отношении микобактерий туберкулеза, спирохет, синегнойной палочки.

**Показания к применению:** Бисептол применяют при инфекциях дыхательных путей: острые и хронические бронхиты (воспаление бронхов), эмпиема плевры (скопление гноя между оболочками легких), бронхоэктатическая болезнь (заболевание бронхов, связанное с расширением их просвета), абсцесс (гнойник) легкого, пневмония (воспаление легких); мочевыводящих путей: уретриты (воспаление мочеиспускательного канала), циститы (воспаление мочевого пузыря), пиелиты (воспаление почечной лоханки), хронический пиелонефрит (воспаление ткани почки и почечной лоханки), простатит (воспаление предстательной железы), гонококковый уретрит. Применяют также при инфекциях желудочно-кишечного тракта, хирургической инфекции и других инфекционных заболеваниях. Препарат эффективен также при септицемии (форме заражения крови микроорганизмами), вызванной чувствительными к препарату бактериями. Установлена высокая эффективность препарата при неосложненной гонорее.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Взрослым и детям старше 12 лет обычно назначают в суточной дозе 4 таблетки (или 2 таблетки форте, или 8 мерных ложек сиропа). Минимальная суточная доза для длительной терапии (более 14 дней) - 2 таблетки (или 1 таблетка форте, или 4 мерные ложки сиропа). Максимальная суточная доза (для лечения особо тяжелых случаев) - 6 таблеток (или 3 таблетки форте, или 12 мерных ложек сиропа). Суточная доза делится на 2 приема (утром и вечером). Препарат принимают после еды с достаточным количеством жидкости. При острых инфекциях лечение препаратом проводят в течение 5 дней или до тех пор, пока у больного в течение 2-х дней не будут отсутствовать симптомы инфекционного заболевания. При гонорее препарат назначают в течение одного дня в суточной дозе 10 таблеток (5 таблеток форте, или 20 мерных ложек сиропа), разделенной на 2 приема (утром и вечером). При острых неосложненных инфекциях мочевыводящих путей у женщин рекомендуется назначать однократно 2-3 таблетки форте. Желательно принимать таблетки вечером после еды или перед отходом ко сну.

**Побочные действия:** Возможны тошнота, рвота, диарея (понос), аллергические реакции, нефропатия (общее название некоторых заболеваний почек). Могут развиваться лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови) и агранулоцитоз (резкое снижение числа гранулоцитов в крови).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к сульфаниламидам, заболевания кроветворной системы, нарушения функции печени и почек, беременность. Препарат не следует назначать недоношенным детям и новорожденным. С осторожностью следует применять бисептол у детей раннего возраста. При лечении препаратом необходимо тщательно следить за картиной крови.

**Форма выпуска:** Таблетки в упаковке по 20 штук. Препарат выпускается в таблетках в двух дозировках: для взрослых с содержанием в одной таблетке 0,4 г (400 мг) сульфаметоксазола и 0,08 г (80 мг) триметоприма; для детей с содержанием в одной таблетке 100 мг сульфаметоксазола и 20 мг триметоприма. Для взрослых выпускаются также таблетки "бактрим форте", содержащие по 800 мг сульфаметоксазола и 160 мг триметоприма, а для детей - сироп, в 1 мл которого содержится 40 мг сульфаметоксазола и 8 мг триметоприма (суспензия белого с желтоватым оттенком цвета во флаконах по 100 мл).

## 16. Ципрофлоксацин (Ciprofloxacinum);





**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство ( группа фторхинолона)

**Фармакологическое действие:** По антибактериальному спектру действия ципрофлоксацин в основном сходен с другими фторхинолонами, но он обладает относительно высокой активностью; примерно в 3-8 раз более активен, чем норфлоксацин. Препарат эффективен при введении внутрь и парентерально (минуя пищеварительный тракт). При приеме внутрь, особенно натощак, он хорошо всасывается. Пик концентрации в плазме крови наблюдается через 1-2 ч после приема внутрь и через 30 мин после внутривенного введения.

**Показания к применению:** в основном такие же, как и для офлоксацина, пефлоксацина и других фторхинолонов (инфекции дыхательных путей, кожи и мягких тканей, костей и суставов, желудочно-кишечного тракта, в том числе инфекции, вызванные сальмонеллой, шигеллой, кампилобактериями и другими возбудителями; гонококковые инфекции, менингит/воспаление оболочек мозга/, послеоперационные инфекционные осложнения, сепсис /заражение крови микробами из очага гнойного воспаления/ и другие гнойно-воспалительные процессы). Препарат высокоэффективен при инфекциях мочевых путей; при приеме внутрь он быстро проникает в почки, длительно выделяется, оказывает бактерицидное (уничтожающее бактерии) действие на *Pseudomonasaeruginosa*(доминирующий патогенный возбудитель при осложненных инфекциях мочевых путей). Препарат показан при лечении инфекций у онкологических больных.

**Способ применения:** Назначают ципрофлоксацин взрослым внутрь при неосложненных инфекциях мочевых путей по 0,125-0,5 г 2 раза в день, при осложненных инфекциях мочевых путей и инфекциях дыхательных путей - по 0,25-0,5 г 2 раза в день; в более тяжелых случаях - до 0,75 г 2 раза в день (если не проводится парентерального лечения). Курс лечения - обычно 5-15 дней. При особо тяжелых инфекционных заболеваниях и невозможности приема таблеток внутрь начинают с внутривенного введения препарата предпочтительно в виде кратковременной инфузии (около 30 мин). Готовый раствор (во флаконах) можно вводить без разведения или развести в изотоническом растворе натрия хлорида или 5% растворе глюкозы. Концентрат инфузионного раствора (в ампулах по 10 мл 1% раствора) необходимо перед введением развести. При острой гонорее и неосложненном цистите (воспалении мочевого пузыря) у женщин назначают ципрофлоксацин внутрь в разовой дозе 0,25 г и внутривенно в дозе 0,1 г. Дозы для внутривенного введения при неосложненных инфекциях мочевых путей по 0,1 г 2 раза в день, в других случаях - по 0,2 г 2 раза в день. Если состояние больного улучшается, переходят на прием препарата внутрь.

**Побочные действия:** Препарат обычно хорошо переносится. В отдельных случаях наблюдаются аллергические реакции (кожный зуд, сыпь); возможны развитие отека лица, голосовых связок; анорексия (отсутствие аппетита), боль в животе, тошнота, рвота, понос; нарушения сна, головная боль, чувство беспокойства, общее угнетение; изменения картины крови: лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), агранулоцитоз (резкое снижение числа гранулоцитов в крови), тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови). В редких случаях нарушается восприятие запаха и вкуса. При применении ципрофлоксацина, так же как и других фторхинолонов, не следует подвергаться действию ультрафиолетовых лучей из-за возможной фотосенсибилизации (повышения чувствительности к солнечному свету) кожи.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к хинолонам, эпилепсия. Нельзя назначать препарат беременным, кормящим женщинам, детям и подросткам с незавершенным формированием скелета (до 15 лет). При нарушениях функции почек сначала дают обычные дозы, а затем их уменьшают с учетом клиренса креатинина (скорости очищения крови от конечного продукта азотистого обмена - креатинина). Не следует принимать ципрофлоксацин одновременно с антагонистами (снижающими кислотность желудка) средствами (в том числе со щелочными водами) во избежание снижения эффективности.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,25; 0,5 и 0,75 г; 0,2% раствор во флаконах для инфузий по 50 и 100 мл (100 или 200 мг); 1% раствор в ампулах по 10 мл (концентрат, подлежащий разведению).

### 17. Сульгин (Sulginum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Сульгин очень медленно всасывается. Основное количество препарата, принятого внутрь, задерживается в кишечнике и выделяется с калом. Является эффективным средством для лечения кишечных инфекций. По действию сходен с фталазолом.

**Показания к применению:** Бактериальная дизентерия, колит (воспаление толстой кишки) и энтероколит (воспаление тонкой и толстой кишки) с поносом, носительство шигелл и палочек брюшного тифа, подготовка к операции на кишечнике.

**Способ применения:** Внутрь по 1-2 г 6-5-4-3 раза в сутки (в первый день - 6 раз; во 2 и 3 - 5; в 4 - 4, а в 5 - 3 раза в сутки). Детям до 3 лет - 0,2 г/кг в сутки в 3 приема в течение 7 дней; детям старше 3 лет - по 0,4-0,75 г (в зависимости от возраста) 4 раза в сутки. Для профилактики послеоперационных осложнений на кишечнике по 0,05 г/кг каждые 8 ч в течение 5 дней до операции и 7 дней после операции. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая 2 г, суточная 7 г.

**Побочные действия:** Возможны тошнота, рвота, кристаллурия (наличие кристаллов солей в моче).

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к сульфаниламидам, нарушение функции почек.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,5 г в упаковке по 10 штук.

### 18. Стрептоцид (Streptocidum);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Оказывает противомикробное действие по отношению к стрептококкам, менингококкам, гонококкам, пневмококкам, кишечной палочки и некоторым другим бактериям.

**Показания к применению:** Рожистое воспаление, ангина, эпидемический цереброспинальный менингит (гнойное воспаление оболочек мозга), цистит (воспаление мочевого пузыря), пиелит (воспаление почечной лоханки), колит (воспаление толстой кишки), раневая инфекция.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Внутрь по 0,5-1 г 5-6 раз в день. Детям дозы уменьшают соответственно возрасту. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 2 г, суточная - 7 г. Местно вводят в рану 5-15 г стерильного порошка; наружно в виде 5% линимента или 10% мази.

**Побочные действия:** Головная боль, головокружение, тошнота, рвота, цианоз (посинение кожи и слизистых оболочек), аллергические реакции, лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), агранулоцитоз (резкое снижение числа гранулоцитов в крови), парестезии (чувство онемения в конечностях), тахикардия (учащенные сердцебиения).

**Противопоказания:** Заболевания кроветворной системы, почек, базедова болезнь (заболевание щитовидной железы), повышенная чувствительность к сульфаниламидам.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки в упаковке по 10 штук по 0,3 г и по 0,5 г; 5% линимент в упаковке по 50 г; мазь 10% в упаковке по 30 г.

**19. Норсульфазол (Norsulfazolum);**



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство, сульфаниламид

**Фармакологическое действие:** Сульфаниламидный препарат. Эффективен при инфекциях, вызванных гемолитическим стрептококком, пневмококком, гонококком, стафилококком, а также кишечной палочкой. Показания к применению: Пневмония (воспаление легких), церебральный менингит (гнойное воспаление оболочек мозга), гонорея, стафилококковый и стрептококковый сепсис (заражение крови микробами /стрептококками/ из очага гнойного воспаления), дизентерия и др.

**Способ применения:** Перед назначением пациенту препарата желательно определить чувствительность к нему микрофлоры, вызвавшей заболевание у данного больного. Принимают внутрь. При пневмонии и менингите на первый прием 2 г, затем по 1 г каждые 4-6 г (курсовая доза 20-30 г); при стафилококковых инфекциях на первый прием 3-4 г, затем по 1 г 4 раза в день в течение 3-6 дней. При лечении дизентерии по 6-4-3 г в сутки по специальной схеме. Детям норсульфазол назначают каждые 4-6-8 ч в следующих разовых дозах: в возрасте от 4 мес. до 2 лет - по 0,1-0,25 г, от 2 до 5 лет - по 0,3-0,4 г, от 6 до 12 лет - по 0,4-0,5 г. На первый прием дают двойную дозу. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 2 г, суточная - 7г.

**Побочные действия:** Возможны диспепсические расстройства (расстройства пищеварения), аллергические реакции, лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), невриты (воспаление нерва), нарушение функции почек (кристаллурия - наличие кристаллов солей в моче). Противопоказания: Повышенная чувствительность к сульфаниламидным препаратам.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки в упаковках по 10 штук по 0,25 г и по 0,5 г с риской.

**20. Фурагин (Furagin);**



**Групповая принадлежность:** Противомикробное средство ( из группы нитрофурана)

**Фармакологическое действие:** Фурагин – противомикробное средство, принадлежащее к группе нитрофурана (действующее вещество препарата имеет в структуре ароматическую нитрогруппу). Механизм действия обусловлен влиянием на ферменты микробных клеток, которые переносят молекулу водорода. Это обеспечивает хороший бактериостатический эффект Фурагина. Действует как на грамотрицательные, так и на грамположительные микроорганизмы (*Staphylococcus aureus*, *Staphylococcus faecalis*, *Enterobacteriaceae*, *Staphylococcus epidermidis*, *Klebsiella pneumoniae*, *Escherichia coli*). Не обнаружено чувствительности к препарату у *Pseudomonas aeruginosa*. Наименьшая бактериостатическая концентрация препарата является в 10-20 раз меньшей (1 мкг/мл), чем у других представителей нитрофуранов. Фурагин наиболее хорошо действует при кислой pH мочи (в пределах 5,5). В щелочной среде действие Фурагина ограничено.

**Показания к применению:** • Терапия инфекционно-воспалительных заболеваний (в острой или хронической формах) мочевыводящей системы, а также предстательной железы; • при рецидивирующих заболеваниях - в качестве превентивной меры (например, при необходимости длительной катетеризации мочевого пузыря, в педиатрии – при врожденных аномалиях мочевыводящих путей).

**Способ применения:** Таблетки принимать внутрь, во время еды. Рекомендуется употребление богатой белками пищи (для подкисления мочи). В режиме лечения назначают по 2 таблетки (100 мг) 4 раза в сутки в первый день, затем – по 2 таблетки (100 мг) 3 раза в сутки. В педиатрии назначают, исходя из дозы 5-7 мг/кг/сутки. Если детям планируется продолжительное лечение, то дозировку уменьшают до 1-2 мг/кг/сутки. Курс лечения составляет от 7 до 8 дней. Через 10-15 дней после приема последней таблетки

курс лечения повторяют при необходимости. В профилактическом режиме рекомендуется доза препарата для взрослых – 1 таблетка в день в вечернее время (50 мг).

**Побочные действия:** Со стороны центральной и периферической нервных систем: сонливость, головокружение, ухудшение зрения; полиневропатия (редко). Со стороны пищеварительной системы: диспептические явления, диарея, запор, боли в животе, рвота. Аллергические (гиперергические) реакции: сыпь, зуд кожи. В редких случаях регистрировали реакции со стороны легких, которые обусловлены повышенной чувствительностью к препаратам группы нитрофурана. Другие: озноб, повышение температуры тела, недомогание.

**Противопоказания:** - Полиневропатия любого генеза; - почечная недостаточность; - врожденная недостаточность энзима глюкозо-6-фосфатдегидрогеназы; - период вскармливания грудью; - беременность; - в педиатрии - возраст ребенка до 7 суток жизни; - аллергические реакции в анамнезе на препараты группы нитрофурана.

**Форма выпуска:** Таблетки по 50 мг в ячейковой контурной упаковке. В коробке 30 таблеток.

## ПРОТИВОТУБЕРКУЛЕЗНЫЕ И ПРОТИВОСПИРОХЕТНЫЕ СРЕДСТВА

### Краткая характеристика заболевания «туберкулез»

Хроническое инфекционное заболевание «туберкулез» (от лат. *tuberculum* «бугорок») или «чахотка» (от названия «фтизиатрия» (греч. “*phthisis*” — чахотка)) известно человечеству с глубокой древности. Описание этой болезни встречается еще во II тысячелетии до н.э. в Древнем Вавилоне.

Гиппократ подробно описал классические признаки легочного туберкулеза, однако, в связи со слабым развитием медицины причину заболевания определил неверно, считая, что туберкулез — наследственное заболевание. Восточный врач и философ Авиценна определил, что туберкулез передается от человека к человеку и отметил, что на развитие болезни влияет внешняя среда.

Туберкулез — инфекционное заболевание, вызываемое микобактерией туберкулеза (*Mycobacterium tuberculosis*, другое название — *бацилла Коха*), характеризующееся образованием одного или множества очагов воспаления в различных органах, но чаще всего в легочной ткани. Инфекционная природа туберкулеза была доказана немцем Робертом Кохом в 1882 году. Именно он открыл микобактерию, вызывающую болезнь.

В отличие от других микробов, микобактерия туберкулеза чрезвычайно живуча: не чувствительна к перепаду температур, выдерживает кипячение, устойчива при длительном нахождении в земле, и в снегу, а также к воздействию спирта и кислот. Погибнуть она может под длительным воздействием прямых солнечных лучей, высоких температур и хлорсодержащих веществ.

Туберкулез может поражать различные органы и ткани человека: глаза, кости, кожу, мочеполовую систему, кишечник, мозговые оболочки и т.д. Тогда туберкулез называется внелегочным, но чаще всего (83-88 %) встречается туберкулез легких.

Различают открытую и закрытую формы туберкулеза. При открытой форме в мокроте или в других естественных выделениях больного — моче, свищевом отделяемом, кале (как правило при туберкулезе пищеварительного тракта, редко при туберкулезе лёгочной ткани) обнаруживаются микобактерии туберкулеза. Открытой формой считаются также те виды туберкулеза органов дыхания, при которых, даже в отсутствие бактериовыделения, имеются явные признаки сообщения очага поражения с внешней средой: каверна (распад) в лёгком, туберкулёз бронха (особенно язвенная форма), бронхиальный или торакальный свищ, туберкулёз верхних дыхательных путей. Если больной не соблюдает гигиенических мер предосторожности, он может стать заразным для окружающих. При «закрытой» форме туберкулеза микобактерии в мокроте доступными методами не обнаруживаются, больные такой формой эпидемиологически не опасны или малоопасны для окружающих.



Не во всех случаях попадая в организм человека микобактерии туберкулеза одинаковы по способности вызывать заболевание. Большинство людей, особенно в детском или подростковом возрасте «получают» микобактерии, но к развитию туберкулеза это не приводит. Напротив, «слабые» бациллы, неспособные вызвать болезнь, постоянно стимулируют противотуберкулезный иммунитет. С целью иммунизации в организм специально вводят ослабленные микобактерии, известные под названием БЦЖ, или бациллы Кальмета-Герена (*BCG, bacillo de Calmette-Guerin*, по имени открывших ее ученых).

Заражение «агрессивными» бактериями как правило происходит от больного активной формой туберкулеза человека, который, разговаривая, чихая или кашляя, распространяет вокруг себя большое количество палочек Коха. Реже заражение происходит при употреблении в пищу молочных продуктов от больных туберкулезом животных. Развитию заболевания при этом способствуют следующие факторы:

- неблагоприятные социальные и экологические условия жизни;
- неполноценное питание;
- курение
- алкоголизм и другие наркомании (приводят к снижению иммунитета);
- стрессовые ситуации;

- наличие сопутствующих заболеваний (диабета, язвенной болезни желудка или 12-перстной кишки, заболеваний легких).

В других случаях заражение туберкулезом происходит в результате развития очага первичного туберкулеза в результате ослабления иммунной системы организма, в результате неблагоприятных условий существования или их ухудшения.

Туберкулез называют «социально зависимой» болезнью, тесно связанной с условиями жизни человека, при ухудшении условий жизни, плохом питании, неблагоприятных условиях существования риск развития туберкулеза резко возрастает. Показатель заболеваемости туберкулезом населения является своеобразным показателем «социального» благополучия общества, уровня жизни населения, уровня развития медицины и медицинской профилактики.

Согласно статистическим данным *M. tuberculosis* инфицирована примерно треть населения Земли, и примерно каждую секунду возникает новый случай инфекции. Доля людей, которые заболевают туберкулезом каждый год во всем мире, не изменяется или снижается, однако из-за роста численности населения абсолютное число новых случаев продолжает расти. В 2007 году насчитывалось 13,7 миллионов зарегистрированных случаев хронического активного туберкулеза, 9,3 миллиона новых случаев заболевания и 1,8 миллиона случаев смерти, главным образом в развивающихся странах. Кроме того, всё больше людей в развитых странах заражаются туберкулезом, потому что их иммунная система ослабевает из-за приёма иммуносупрессивных препаратов, злоупотребления психоактивными веществами и особенно при ВИЧ-инфекции.

Палочка Коха попадает в человеческий организм и приводит к изменению состояния иммунной системы. В легких и лимфатических узлах образуются мелкие очаги воспаления — так называемый первичный туберкулез. Со временем эти очаги заживают, обызвествляются (очаг внедрения бактерий пропитываются солями кальция), покрываются плотной капсулой (инкапсулируется) или рубцуются. Однако бактерии в них не всегда погибают, чаще они переходят в «дремлющее» состояние.

При «благоприятных» для бактерий условиях они «просыпаются», вызывают повторное воспаление, расплавляют защитную капсулу вокруг застарелого очага и выходят из него. При активной форме туберкулеза палочка Коха быстро размножается в легких больного и питается человеческими тканями, разрушая легкие и отравляя организм человека продуктами своей жизнедеятельности. Вместе с кровью и лимфой она может распространяться по всему организму. Так возникает вторичный туберкулез. В некоторых случаях то же самое происходит при повторном заражении извне.

Классические симптомы туберкулеза лёгких — длительный кашель с мокротой, иногда с кровохарканьем, появляющимся на более поздних стадиях, лихорадка, слабость, ночная потливость и значительное похудение.

В случае незаживления первичного туберкулезного очага или активизации и развития инкапсулированного — инфекция начинает распространяться на другие ткани организма, через кровяную и лимфатическую систему постепенно происходит заражение всего организма (возможно развитие туберкулеза костей, почек и др. органов).

При туберкулезе легких (наиболее распространенной форме туберкулеза) — воспаляются лимфатические узлы в области корня легких (лимфаденит). В туберкулезных очагах происходит постепенный некроз легочных тканей, образуются полости (коверны), которые заполняются гноем. У больного повышается температура, возникает сильный кашель, легочные кровотечения, наступает общее истощение организма, которое может закончиться смертью.

При внелегочном развитии болезни наиболее часто поражаются кости, а также почки, слизистая оболочка кишечника, кожа. Наиболее тяжелая форма туберкулеза — туберкулез мозга (туберкулезный менингит), при котором поражаются оболочки головного мозга.

Диагностика туберкулеза основана на флюорографии, рентгенографии и компьютерной томографии поражённых органов и систем, микробиологическом исследовании различного биологического материала, кожной туберкулиновой пробе (реакции Манту), а также методе молекулярно-генетического анализа (метод ПЦР) и др. Лечение сложное и длительное, требующее приёма препаратов в течение минимум шести месяцев. Лица, контактировавшие с больным, обследуют рентгенологически или с помощью реакции Манту, с возможностью назначения профилактического лечения противотуберкулёзными препаратами.

Заметные сложности в лечении туберкулеза возникают при наличии устойчивости возбудителя к противотуберкулёзным препаратам основного и, реже, резервного ряда, которая может быть выявлена только при микробиологическом исследовании. Устойчивость к изониазиду и рифампицину также может быть установлена методом ПЦР. Профилактика туберкулеза основана на скрининговых программах, профосмотрах, а также на вакцинации детей вакциной БЦЖ или БЦЖ-М.

## Противотуберкулёзные средства

Для лечения туберкулеза в настоящее время применяют вещества синтетического происхождения, а также некоторые антибиотики – активные в отношении туберкулезной палочки.

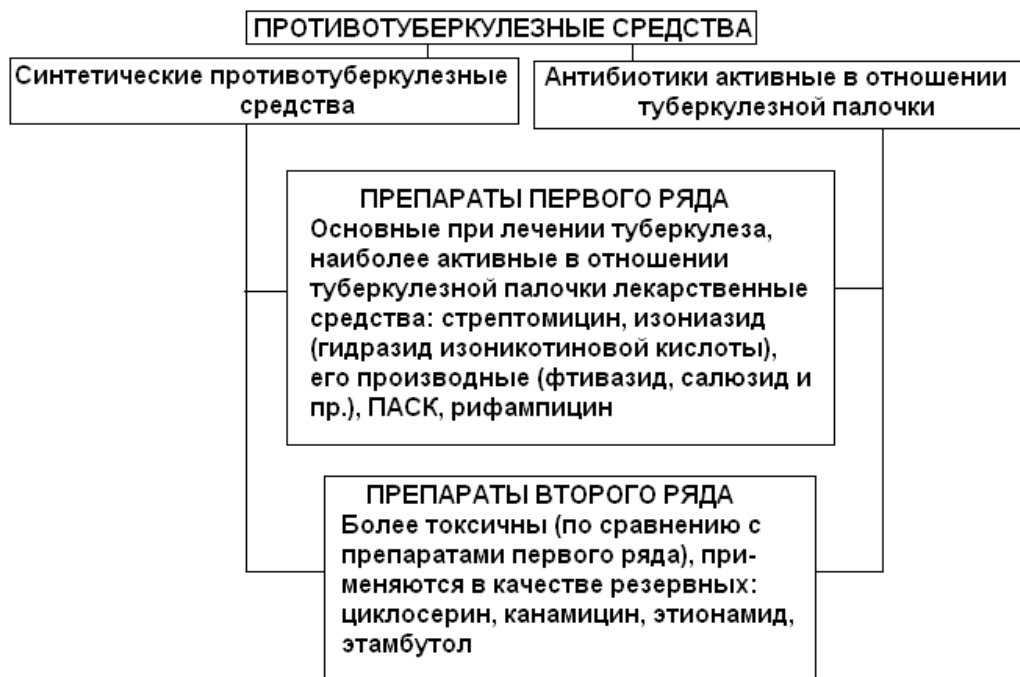
При применении противотуберкулезных препаратов у больных улучшается самочувствие, нормализуется температура, уменьшается кашель, туберкулезная интоксикация и др. симптомы болезни.

Наиболее эффективны эти препараты при ранних формах болезни, при хроническом течении туберкулеза медикаментозное лечение – менее эффективно.

Противотуберкулезные препараты делят на две группы: препараты первого и второго ряда.

Препараты первого ряда – основные при лечении туберкулеза. К ним относятся: стрептомицин, гидразид изоникотиновой кислоты (изониазид), его производные (фтивазид, салюзид и пр.), ПАСК, рифампицин и пр.

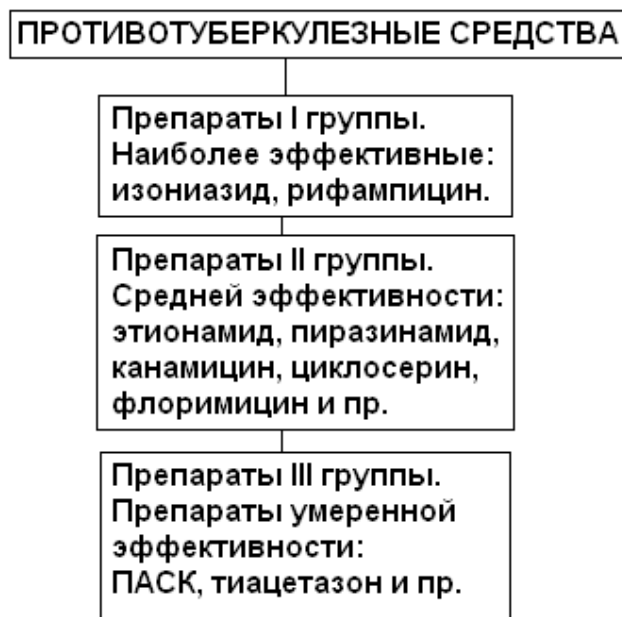
В случае неэффективности препаратов первого ряда вследствие образования штаммов устойчивых к действию препаратов, применяют препараты второго ряда. К ним относятся такие препараты, как циклосерин, канамицин, этионамид, этамбутол и пр. По сравнению с препаратами первого ряда эти средства более токсичны, менее эффективны и обычно являются резервными.



Лечение туберкулеза является, как правило, длительным, поэтому у бактериальных клеток постепенно может вырабатываться резистентность к используемым при лечении отдельным лекарственным средствам. Поэтому, для эффективного лечения рекомендуется периодически заменять лекарственные средства, достаточно часто противотуберкулезные средства часто комбинируют между собой (например, препараты первого и второго ряда).

Существует и другая классификация противотуберкулезных средств, основанная на их эффективности. По этой классификации препараты делят на три группы:

- препараты I группы. К ним относятся наиболее эффективные лекарственные средства (изониазид, рифампицин и пр.);
- препараты II группы. Препараты средней эффективности (стрептомицин, этионамид, пиразинамид, канамицин, циклосерин, флоримицин и пр.);
- препараты III группы. Препараты с меньшей эффективностью (ПАСК, тиациетазон);



Большинство противотуберкулезных средств обладает достаточно высокой избирательностью, но различаются между собой по механизму действия и пр. свойствам.

К наиболее эффективным противотуберкулезным средствам относится лекарственный препарат рифампицин. Препарат активен в отношении бактерий устойчивых к действию других противотуберкулезных средств (изониазиду). Рифампицин часто комбинируют с другими противотуберкулезными средствами, такими как ПАСК, фтивазид и пр.

Изониазид (гидразид изоникотиновой кислоты) и ее производные (фтивазид, салюзид) – обладают высокой эффективностью в отношении туберкулезной палочки. Изониазид является одним из основных и наиболее эффективных средств при лечении туберкулеза. Препарат хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, назначается при всех формах туберкулеза, иногда в сочетании с другими противотуберкулезными средствами. Изониазид подавляет ферментные системы и разрушает ДНК туберкулезной палочки.



Однако, изониазид обладает рядом негативных побочных действий. Так, изониазид действует возбуждающе на центральную нервную систему, способен вызывать состояние эйфории, а также бессонницу и головную боль. Для предупреждения нервных расстройств препарат обычно назначают совместно с витаминами группы В. Кроме того, длительное применение изониазида может вызвать аллергическую реакцию и пр.

Стрептомицин – антибиотик, эффективный при всех формах туберкулеза. Однако, как к большинству антибиотиков, к рифампицину достаточно быстро развивается устойчивость со стороны туберкулезной палочки, вследствие чего его эффективность резко падает.

Циклосерин – относится к веществам широкого спектра действия, эффективным, в том числе, против бактерий туберкулеза, оказывая бактериостатическое действие (задерживает рост микробных клеток). Циклосерин относится к лекарственным средствам второго ряда, «резервным» средствам. Препарат может вызвать аллергическую реакцию, головную боль, бессонницу (иногда наоборот – сонливость), а также расстройства психики.

ПАСК (парааминосалициловая кислота, натриевая соль). Действует исключительно на бактерии туберкулеза, оказывая при этом бактериостатическое действие. Механизм бактериостатического действия ПАСК связан с конкуренцией лекарственного препарата с парааминобензойной кислотой – необходимым элементом жизнедеятельности бактерий туберкулеза. Парааминобензойная кислота необходима микробной клетке для синтеза фолиевой кислоты, являющейся для нее своеобразным витамином роста. Но для эффективного терапевтического действия ПАСК необходимо создать высокие концентрации препарата в крови, для чего применяются ударные дозы (превышающие терапевтические), до 10 г в сутки. Как правило, ПАСК применяют в комплексе с другими противотуберкулезными средствами (стрептомицином, изониазидом, фтивазидом и пр.).

ПАСК хорошо всасывается в желудочно-кишечном тракте, но быстро выводится из организма. В некоторых случаях препарат вводят внутривенно (в виде 3% раствора). ПАСК обладает рядом негативных побочных эффектов, вызывает тошноту, рвоту, боли в области ЖКТ, аллергические реакции вплоть до развития анафилактического шока.

## **Противоспирохетные средства**

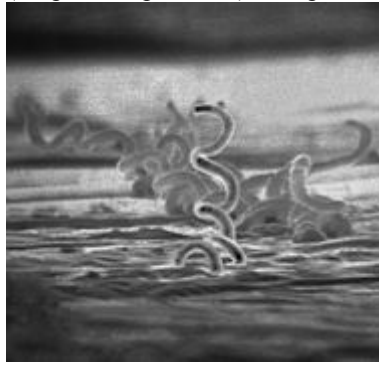
### **Краткая характеристика заболевания**

К заболеваниям вызываемым спирохетами относятся: сифилис, возвратный тиф и пр.

Сифилис относят к вереническим заболеваниям, преимущественно передающимся половым путем, однако может передаваться и бытовым путем через предметы гигиены, посуду и пр. Возбудитель сифилиса – бледная трепонема (спирохета) (*Treponema pallidum*). Сифилис характеризуется медленным прогрессирующим течением. При отсутствии лечения, на поздних стадиях развития, заболевание может приводить к очень тяжелым поражениям нервной системы и внутренних органов.

В большинстве случаев заражение сифилисом происходит при половых контактах во влагалище, рот или прямую кишку. Наиболее заразны больные первичным сифилисом (с язвами на половых органах, во рту или в прямой кишке). Кроме того, возможна передача инфекции от больной матери плоду во время беременности, а также заражение при переливании крови.

Бытовое заражение встречается относительно редко. Большинство случаев, которые связывают с бытовым заражением, на самом деле являются недоказанными случаями полового заражения. Это обусловлено тем, что бледная трепонема (*Treponema pallidum*) быстро погибает вне организма человека.



**Бледная трепонема (*Treponema pallidum*), вызывающая сифилис**

По статистическим данным вероятность заражения при однократном половом контакте с больным сифилисом составляет около 30%.

Инкубационный период сифилиса обычно составляет 3-4 нед (от 2 до 6 нед). Симптомы сифилиса разнообразны и меняются в зависимости от стадии заболевания. Выделяют три стадии сифилиса:

Первичный сифилис возникает после окончания инкубационного периода. В месте проникновения возбудителя в организм (половые органы, слизистая рта или прямой кишки) возникает безболезненная язва с плотным основанием (твердый шанкр). Через 1-2 нед после возникновения язвы увеличиваются ближайшие лимфатические узлы (при локализации язвы во рту увеличиваются подчелюстные, при поражении половых органов – паховые). Язва (твердый шанкр) самостоятельно заживает в течение 3-6 нед. после возникновения.



**Шанкр на верхнем веке**

Вторичный сифилис начинается через 4-10 нед после появления язвы (2-4 мес. после заражения). Он характеризуется симметричной бледной сыпью по всему телу, включая ладони и подошвы. Сыпь может периодически исчезать, но затем возникает вновь. Возникновение сыпи нередко сопровождается головной болью, недомоганием, повышением температуры тела (как при гриппе). Увеличиваются лимфатические узлы по всему телу. Вторичный сифилис протекает в виде чередования обострений и ремиссий (бессимптомных периодов). При этом возможно выпадение волос на голове, а также появление разрастаний телесного цвета на половых органах и в области заднего прохода (широкие кондиломы).

Третичный сифилис возникает в отсутствие лечения через несколько лет (2 – 3 года) после заражения. При этом поражается нервная система (включая головной и спинной мозг), кости и внутренние органы (включая сердце, печень и т. д.). При заражении во время беременности у ребенка возможен врожденный сифилис.

По результатам научных исследований установлено, в отсутствие лечения примерно у трети больных развивается третичный сифилис. Примерно четверть больных из-за него погибает.

Диагностика основана на анализах крови на сифилис. Существует множество видов анализов крови на сифилис. Их делят на две группы – нетрепонемные (RPR, RW с кардиолипидным антигеном) и трепонемные (РИФ, РИБТ, RW с трепонемным антигеном).

Для массовых обследований (в больницах, поликлиниках) используют нетрепонемные анализы крови. В ряде случаев они могут быть ложноположительными, то есть быть положительными в отсутствие сифилиса. Поэтому положительный результат нетрепонемных анализов крови обязательно подтверждают трепонемными анализами крови.

Для оценки эффективности лечения применяют нетрепонемные анализы крови в количественном исполнении (например, RW с кардиолипидным антигеном). Трепонемные анализы крови остаются положительными после перенесенного сифилиса пожизненно. Поэтому для оценки эффективности лечения трепонемные анализы крови (такие как РИФ, РИБТ, РПГА) НЕ применяют.

Лечение сифилиса должно быть комплексным и индивидуальным. Основу лечения сифилиса составляют антибиотики. В ряде случаев назначают лечение, дополняющее антибиотики (иммунотерапия, общеукрепляющие препараты, физиотерапия и т. д.).

К бледной трепонеме в организме у человека не вырабатывается иммунитета, поэтому после излечения при новом контакте с больным человеком возможно повторное заражение .

### **Возвратный тиф**

Возвратный тиф – острое инфекционное заболевание. Переносчиками возвратного тифа являются вши (эпидемический возвратный тиф) или клещи (эндемический возвратный тиф). Протекает заболевание с чередованием приступов лихорадки и периодов ремиссии. Заболевание возвратным тифом распространено во всех регионах мира, за исключением Австралии.

Наибольшая вероятность заболеть тифом, причем в самых тяжелых его формах – в Африке. Так, в Судане после Первой мировой войны за десять лет от этой болезни умерло около 100 тысяч человек. Распространен возвратный тиф и в Индии, на территории Европы и в странах Балканского полуострова.

В странах Европы, Азии, Африки, Южной Америки переносчиком возвратного тифа являются вши рода *Pediculus*, паразитирующие на человеке. В странах Европы, Азии, Африки, Северной и Центральной Америки встречается клещевой возвратный тиф. Переносчиком возвратного тифа являются клещи рода *Ornithodoros*.

К возбудителям возвратного тифа относятся спирохеты рода *Borrelia*. Эпидемическим возвратным тифом могут болеть только люди. Боррелии при попадании в организм человека внедряются в клетки лимфоидно-макрофагальной системы, где начинают размножаться и уже в значительно большем количестве поступают в кровь.

Под воздействием бактерицидных свойств крови они начинают частично разрушаться с высвобождением эндотоксина, который поражает центральную нервную и кровеносную систему. Поражение систем сопровождается лихорадкой, а в печени и селезенке возникают очаги некроза. Боррелии, задерживаясь в капиллярах внутренних органов, нарушают местное кровоснабжение, вследствие чего развивается геморрагический инфаркт.

Первый период болезни, сопровождающийся лихорадкой, завершается выработкой организмом антител к боррелиям первой генерации. В результате большая часть боррелий погибает, что клинически выражается в наступлении периода ремиссии. Однако часть боррелий меняет свои антигенные свойства и становится устойчивой к антителам. Они снова начинают размножаться, и при попадании в кровь вызывают новый приступ лихорадки.

Антитела, образующиеся против второй генерации боррелий, также уничтожают большинство из них, но не все. Это снова провоцирует рецидив заболевания. Полное выздоровление наступает только в том случае, когда в крови появляется полный спектр антител, уничтожающих все мутации боррелий. При этом после выздоровления стойкого иммунитета к данному заболеванию не возникает, так как антитела сохраняются в организме непродолжительное время.

Первый приступ возвратного тифа начинается внезапно. Пациент ощущает кратковременный озноб, который сменяется повышением температуры. Появляется головная боль, боль в мышцах и суставах, рвота, тошнота. Температура быстро поднимается, кожа становится сухой, пульс учащается, возникает делирий. Пик приступа сопровождается появлением высыпаний на коже, развитием желтухи и увеличением печени и селезенки. Во время лихорадки может развиваться пневмония или бронхит, отмечаются признаки поражения сердца. Первый приступ длится 2-6 дней. После чего наступает период ремиссии, самочувствие пациента улучшается.

Через несколько суток развивается второй приступ болезни, имеющий схожие симптомы. Для эпидемического возвратного тифа характерны несколько подобных приступов, которые, как правило, заканчиваются полным выздоровлением и наступлением временного иммунитета к болезни. Для клещевого возвратного тифа характерно четыре и даже более подобных приступов, которые, правда, имеют более

легкую симптоматику и продолжают меньше. Но, случается, что второй приступ протекает гораздо более тяжело, чем первый. Возвратный тиф чреват развитием осложнений: увеиты, менингиты, синовиты, разрыв селезенки, иридоциклиты, ириты.

Диагностика заболевания опирается на эпидемиологические данные и клинические проявления. Важное значение в диагностике возвратного тифа играет исследование периферической крови. Во время приступа в крови больного довольно легко обнаружить возбудитель. Лечение возвратного тифа. Лечение эпидемического возвратного тифа заключается в применении антибиотиков (левомицетин, пенициллин, хлортетрациклин), а также препаратов мышьяка (новарсенол). Для лечения эндемического возвратного тифа используют антибиотики тетрациклиновой группы, ампициллин, левомицетин.

Профилактика заболевания сводится к борьбе с возбудителями. Следует избегать контакта с завшивленными больными. В настоящее время в нашей стране и в ряде других стран эпидемический тиф является довольно редким заболеванием. Профилактика эндемического возвратного тифа заключается в защите людей от контакта с клещами, а также в уничтожении грызунов и других переносчиков в природных очагах.

## **Противоспирохетозные средства**

В настоящее время для лечения сифилиса и других заболеваний вызываемых спирохетами имеется достаточно большое количество эффективных лекарственных препаратов. При своевременном лечении эти заболевания полностью вылечиваются.

Наиболее эффективными лекарственными средствами для лечения сифилиса в настоящее время являются антибиотики, прежде всего, группы пенициллина: бензилпенициллина натриевая соль, бициллины, макролиды, цефалоспорины и пр.

Кроме пенициллина для лечения сифилиса применяются препараты висмута (бийохинол, бисмоверол), блокирующие сульфгидрильные группы в ферментных системах спирохет.

Препараты висмута – взвеси органических соединений висмута в персиковом масле, вводятся исключительно внутримышечно, иногда в комбинации с пенициллинами. Наиболее эффективны препараты висмута при нейросифилисе.

Лечение препараты группы висмута может дать многочисленные осложнения, такие как: общая слабость, лихорадка, появление темной каймы на деснах и слизистых оболочках щек, нарушение функции почек, лейкопения и пр. явления, указывающие на интоксикацию висмутом.

Антидотом при отравлении препаратами висмута является – унитиол.

### **Мышьяк и препараты мышьяка**

Мышьяк (Arsenicum) — As — металл, химический элемент V группы периодической системы Д. И. Менделеева, атомный номер 33, атомная масса 74,9216.

Терапевтическое и токсическое действие соединений мышьяка обусловлено торможением ими окислительных процессов в тканях вследствие блокады сульфгидрильных групп тканевых ферментных систем, ответственных за ряд реакций клеточного обмена. Выделяется мышьяк медленно (дни) почками и желудочно-кишечным трактом.

Мышьяк и его неорганические соединения находят применение в практической медицине как лекарственные вещества местного (раздражающее, прижигающее, некротизирующее) и общего действия (регуляторы обмена веществ, кроветворения).

Органические препараты мышьяка применяются как химиотерапевтические средства при спирохетозах и некоторых заболеваниях, вызываемых простейшими. Длительное время препараты мышьяка являлись основными при лечении сифилиса и других инфекций вызываемых спирохетами.

Растворимые соли мышьяка быстро всасываются, поступают в кровь и откладываются в тканях, преимущественно в печени, селезенке, почках, лёгких, слизистой кишечника.

Ограниченное применение препаратов мышьяка в медицине связано с из чрезвычайно высокой токсичностью, в хозяйственной деятельности могут использоваться в качестве пестицидов и дератизационных средств (средств для борьбы с грызунами). Неорганические и органические соединения мышьяка чрезвычайно ядовиты.

При лечении препаратами мышьяка (арсенотерапии) возможны побочные явления: тошнота, рвота, жидкий стул, требующие отмены их применения. Противопоказаниями к арсенотерапии являются поражения почек, невриты являются противопоказанием к применению препаратов мышьяка.

Среди лекарственных средств, изготовленных на основе мышьяка находят применение следующие:

Аминарсон — антипротозойное средство, применяется для лечения балантидиаза, амёбиоза, трихомонадных вагинитов.

Новарсенол — сложное органическое соединение мышьяка. Препарат обладает антибактериальным действием, специфическим химиотерапевтическим эффектом в отношении спирохетозов и заболеваний, вызываемых простейшими (трипаномы, спириллы).

Миарсенол содержит 18,2–19,2% мышьяка, вводится внутримышечно для лечения сифилиса, возвратного тифа, малярии, ангины Симановского–Венсана.

Мышьяковистый ангидрид применяется наружно как некротизирующее средство при лечении некоторых кожных болезней. В стоматологической практике мышьяк используется в виде пасты для девитализации пульпы.

Мышьяковистая кислота применяется наружно как некротизирующее средство.

Натрия арсенат применяется обычно для подкожных инъекций в виде ампулированного раствора натрия арсената, назначается внутрь по тем же показаниям, что и мышьяковистый ангидрид.

Осарсол оказывает антипротозойное действие в отношении трихомонад, дизентерийной амёбы. Эффективен при спирохетозах.

Фаулеров раствор — раствор калия арсенита, прозрачная бесцветная жидкость камфорного запаха, содержит 1% мышьяковистого ангидрида и назначается внутрь по тем же показаниям.

### Отравление мышьяком

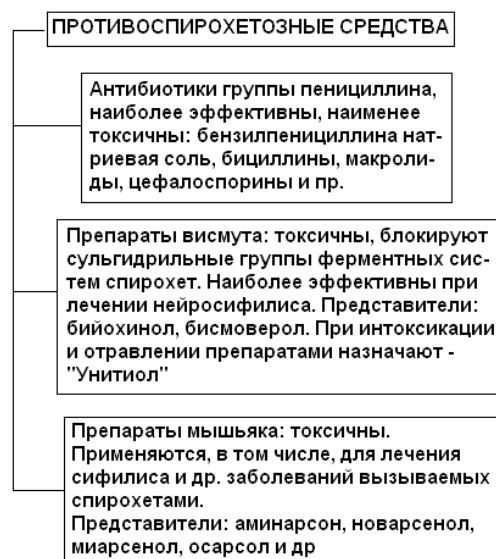
Сам мышьяк в воде нерастворим, поэтому не ядовит, но легко окисляется и образует ядовитые окислы — ангидриды.

Резорбтивное действие соединений мышьяка как капиллярных ядов проявляется прежде всего параличом сосудов, расширением капилляров органов брюшной полости, что ведёт к быстрому падению кровяного давления. Происходит выпотевание жидкости в кишечнике, что ведёт к поносу (испражнения в виде «рисового отвара»). В других органах (в сердце, в мозге) малокровие, отсюда — потеря сознания, коллапс.

Отравление мышьяком может проявляться в двух формах: желудочно-кишечной (холероподобной) и паралитической (цереброспинальной или нервной). Смертельная доза мышьяковистого ангидрида — 0,1–0,2 г.

Мышьяк долго сохраняется в трупe, особенно в печени, в костях, а при хроническом отравлении — в волосах. У оставшихся в живых появляется желтуха, высыпания на коже, на ногтях — беловатые поперечные полоски (полосы Месса).

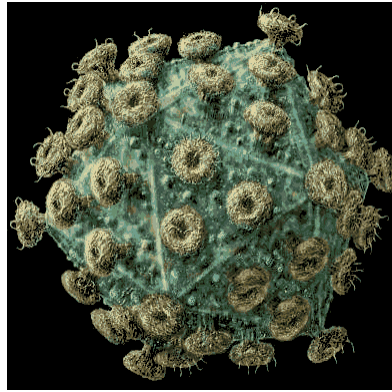
В качестве противоядия при отравлении препаратами мышьяка применяют «Унитиол».



## Противовирусные средства

### Краткая характеристика вирусных заболеваний

Вирусные заболевания - это заболевания человека, возникающие вследствие проникновения в клетки человеческого организма и развития в них различных вирусов (неклеточных структур), за счет клеток, в которые вирус внедрился. Вирусы представляют собой мельчайшие формы жизни, состоящие из молекулы нуклеиновой кислоты, являющиеся носителем генетической информации. Снаружи вирус окружен защитной оболочкой из белков.



Компьютерное изображение вируса.

Вирус размножается, питаясь содержимым клетки, в результате чего клетка разрушается и погибает. По эпидемиологическим характеристикам, вирусные заболевания делят на **антропонозные** вирусные заболевания, то есть те, которыми болеет только человек (например полиомиелит) и **зооантропонозные** вирусные заболевания – которые передаются от животных человеку (например бешенство).



Клетки, разрушенные в результате действия вирусов

По характеру распространения, вирусные заболевания могут передаваться воздушно-капельным путем, при контактах, в том числе и половых связях (ЗППП), реже через предметы общего пользования, еду и т.п.

Вирусы могут поражать клетки самых различных органов человека, поэтому различают вирусные заболевания кожи, половой сферы (венерические заболевания), дыхательных путей и органов дыхания (заболевания легких), вирусные заболевания кишечника, печени, заболевания слизистой оболочки полости рта (герпес), глаз и др.

Заболевание печени вирусным гепатитом приводит к некрозу печеночных клеток, и вызывается различными вирусами гепатита А, В и С, причем два последних являются серьезными заболеваниями, передающимися половым путем. Вирусные заболевания кожи – это различные шелушения кожи, лишай, экземы и вирусные поражения ногтей и волос.

Инфекционные и вирусные заболевания половой сферы - это, например, женский бактериальный вагиноз (гарднереллез), который характеризуется замещением доминирующих в микрофлоре влагалища микроорганизмов рода *Lactobacillus* ассоциацией различных бактерий и вирусов, в том числе *Gardnerella vaginalis*, анаэробов (*Bacteroides*, *Prevotella*, *Porphyromonas*, *Peptostreptococcus*, *Mobiluncus*), а так же микроплазмоз, цитомегаловирус и уреаплазмоз.

После перенесения заболевания, к некоторым вирусным заболеваниям у человека появляется устойчивый иммунитет, который может быть пожизненным или со временем пройти. Так, переболев в детстве краснухой или корью, человек больше ими не болеет. Также надо отметить, что эти вирусные заболевания в детском возрасте переносятся гораздо легче и имеют меньше негативных последствий.

Некоторые вирусные заболевания неизлечимы на сегодняшний день, как, например СПИД или ВИЧ, вызывающие поражение иммунной системы человека. Современная медицина может сильно замедлить развитие вируса иммунодефицита человека, но само вирусное заболевание является неизлечимым.

Наиболее часто встречаются острые вирусные заболевания, которые протекают с выраженными симптомами локального (поражение слизистой оболочки дыхательных путей, поражение тканей печени, поражение различных зон головного мозга) и общего характера – повышение температуры тела, слабость, боли в суставах и мышцах, изменение состава крови и пр. Это так называемые ОРЗ или ОРВЗ (острые респираторные вирусные заболевания), такие как грипп, насморк и т.п.

Респираторные вирусные заболевания - это острые заразные болезни, сопровождающиеся чиханием, заложенным носом, насморком, воспалением носоглотки и кашлем. Респираторные вирусные заболевания имеют острое течение (внезапное начало, малую продолжительность, выраженную симптоматику), начинаясь обычно с ощущения сухости и раздражения в носу и царапания в горле.

Общеизвестно, что грипп и острые респираторные вирусные заболевания (ОРВЗ), часто воспринимаемые как простудные заболевания, занимают первое место в мире по массовости поражения людей. Поэтому для предотвращения эпидемий, применяют профилактику вирусных заболеваний, одним из мер которой является вакцинация.

### **Медикаментозная профилактика вирусных инфекций**

Противовирусные препараты используются для предупреждения развития (профилактики) и лечения вирусных заболеваний. В отношении респираторных вирусов профилактика требуется в эпидемический период, когда они проявляют наибольшую активность, либо в любой период года при наличии снижения иммунитета. В остальных случаях предупреждение вирусных инфекций, как правило, необходимо при наличии каких-либо провоцирующих и способствующих развитию заболеваний факторов. К примеру, для предупреждения инфицирования возбудителями герпеса, цитомегаловирусной и папилломавирусной инфекций, гепатита С и многих других вирусных инфекций требуется профилактика противовирусными препаратами. Действие медикаментозной профилактики в данном случае направлено на предотвращение проникновения вирусов в клетки.

Существует и другой вид профилактики – специфическая профилактика или вакцинация, которая защищает от развития заболевания при целом ряде вирусных инфекций, например: гриппе, гепатитах А и В, кори, полиомиелите и многих других. После проведения прививки вырабатывается стойкий иммунитет к определенному вирусу. Профилактические мероприятия также нужны для предупреждения рецидивов уже имеющихся хронических персистирующих вирусных инфекций. Для этих целей используются противовирусные препараты, которые подавляют активность, тормозят рост и размножение вирусов.

Выбор противовирусных препаратов зависит от вида возбудителя, который вызвал заболевание, а также от клинических проявлений вирусной инфекции, наличия сопутствующей хронической патологии и пр. При выборе противовирусных препаратов необходимо учитывать особенности влияния того или иного вируса на организм.

В любом случае противовирусные препараты следует выбирать, исходя из двух главных принципов: наибольшего терапевтического воздействия на вирусы и минимального вреда для организма, поскольку некоторые противовирусные средства отличаются рядом нежелательных побочных эффектов. Из-за этих побочных эффектов большинство противовирусных препаратов запрещены к применению у маленьких детей и беременных женщин, а также имеют противопоказания при многих хронических и тяжело протекающих заболеваниях.

### **Лечение вирусных инфекций**

Наиболее высокая эффективность лечения вирусной инфекции достигается применением комплексных методов, которые включают противовирусные препараты, средства симптоматической терапии и вспомогательные процедуры. Механизм действия противовирусных препаратов заключается в предотвращении воспроизводства вирусов, и направлен на уничтожение их генетических структур.

Попавшие в организм вирусы, первыми распознаются интерферонами, при этом они же запускают механизмы неспецифической защиты.

Интерфероны – это белки-информаторы, которые выделяются клетками, пораженными вирусами. Они как бы сообщают другим клеткам об инфекции

и требующейся инактивации вируса. Альфа интерфероны вырабатывают лимфоциты, бета – фибробласты.

Поэтому препараты интерферонов являются важными и необходимыми противовирусными средствами. Среди этой группы выделяют альфа-2b интерферон, полученный генно-инженерным путем.

Эффективность лечения вирусной инфекции во многом зависит от состояния иммунитета. Вирусные инфекции могут развиваться на фоне снижения общей сопротивляемости организма. Кроме того, вирусы обладают способностью ослаблять защитные силы. Поэтому в терапии вирусных инфекций целесообразно использовать противовирусные средства с иммуномодулирующим действием. Коррекция иммунитета при вирусных заболеваниях требуется также в целях предотвращения развития бактериальных осложнений, которые могут присоединиться по причине нарушенных защитных функций.

Для лечения инфекционных и вирусных заболеваний половой сферы, которые сопровождаются заражением одновременно несколькими различными вирусами, используют различные комбинированные схемы применения лекарственных препаратов - антибиотиков и препаратов для повышения иммунитета с учетом взаимодействия лекарств друг с другом для усиления эффекта.

Лечение вирусных заболеваний детей затрудняется невозможностью использования сильных антибиотиков. Поэтому для детей важное место занимает профилактика вирусных заболеваний.

Медикаментозные противовирусные средства условно разделяются на следующие группы:

1. Вакцины (стимулирующие выработку антител до заражения вирусом);
2. Иммуностимуляторы (препараты, кратковременно усиливающие неспецифический иммунитет, способствующие выработке интерферонов);
3. Противовирусные препараты (средства, оказывающие влияние на нейраминидазу (вирусный фермент), подавляющие размножение вируса: осельтамивир, занамивир и блокаторы M2-каналов: амантадин, ремантадин);





### Иммуностимуляторы и противовирусные средства

Иммуностимуляторы показывают активизацию иммунных реакций на биохимическом уровне, но их применение имеет множество негативных побочных эффектов, которые на настоящее время недостаточно хорошо изучены.

Группа препаратов	Действие	Название ЛС
Препараты интерферона	Блокада трансляции вирусных мРНК	Рекомбинатные альфа/гамма интерфероны
Этиотропные средства	Специфический шаперон ГА	Арбидол
	Ингибиторы нейраминидазы	Реленза; Тамифлю; Перамивир;
	Ингибиторы NP белка	Ингавирин
	Блокаторы ионного канала	Римантадин (ремантадин; орвирем)
Индукторы интерферонов	Включение синтеза эндогенных интерферонов	Кагоцел; Циклоферон; Лавомакс (амиксин; тилорон); Цикловир 3

Такое состояние как гиперактивация иммунной системы, так же как и иммунодефицитное, является крайне опасным, человеческий организм нормально функционирует лишь при балансе иммунной системы. И если человек чрезмерно будет стимулировать («повышать себе иммунитет»), то при наличии предрасполагающих факторов это может закончиться патологическим воспалением, запуском иммунной агрессии на здоровые ткани, гиперактивацией иммунной системы и пр.

Интерфероны могут быть эффективны только при парентеральном (внутривенном) введении. Как правило

Наиболее приемлемое лекарственное средство симптоматической терапии для снижения температуры при вирусной инфекции – парацетамол. Прием аспирина (ацетилсалициловой кислоты) при гриппе и ОРВИ, особенно детям до 12 лет противопоказан, он может стать причиной тяжелого поражения ЦНС и печени.

Среди противовирусных препаратов выделяют следующие:

Цитовир 3, комплексный иммуностимулирующий, противовирусный препарат, обладает интерферогенным действием.



В составе лекарства — Тимоген натрия, аскорбиновая кислота, бендазол. Тимоген синтетически полученный дипептид, он усиливает неспецифическую резистентность организма. Аскорбиновая кислота нормализует проницаемость капилляров, снижая активность

воспалительного процесса. Бендазол стимулирует выработку эндогенного интерферона в организме.

Препарат обладает рядом побочных эффектов, так может вызывать снижение артериального давления. Противопоказания: при беременности, детям до 1 года, при тромбфлебите, выраженной гипотензии, сахарном диабете, язвенной болезни желудка, мочекаменной болезни. Улучшение самочувствия наблюдается на второй- третий день.

Кагоцел, индуктор синтеза интерферона, обладает противовирусным, иммуномодулирующим эффектом. В составе препарата: натриевая соль сополимера, которая вызывает образование позднего интерферона, обладающего высокой противовирусной активностью.

Наибольший эффект наступает, если начинать лечение в течении первых 24 часов заболевания, но не позже 4-го дня после начала острой инфекции. В целях профилактики возможно принимать в любые сроки, лучше сразу после контакта с больным орви или гриппом.



В качестве профилактики орви возможно применение детям старше 6 лет.

Тилорон (Амиксин, Лавомакс) Действующее вещество - тилорон, обладает противовирусным и иммуномодулирующим действием, это синтетический индуктор интерферона, стимулирующий образование интерферонов альфа, бета, гамма. Детям до 7 лет применять категорически запрещено.



Ингавирин. Действующее вещество «имидазолилэтанамид пентандиовой кислоты». Проявляет активность в отношении аденовирусной инфекции, гриппа А, В, респираторно-синцитиальной инфекции, парагриппа. Является иммуномодулятором, влияющим на функциональную активность системы интерферона.



Противопоказан: детям до 18 лет. Препарат способствует снижению тяжести заболеваний (грипп, ОРВИ), побочных действий не выявлено.

Арбидол. Противовирусное средство, обладает способностью подавлять вирусы гриппа А и В, ТОРС — тяжелого острого респираторного синдрома, ассоциированного коронавируса. Используется Арбидол и в комплексной терапии острых ротавирусных кишечных инфекций.

Действующее вещество – «Метилфенилтиометил-диметиламинометил-гидроксидрокарбонил карбоновой кислоты этиловый эфир». Применение детям до 3 лет запрещено.



Арбидол внесен в стандарты лечения и профилактики гриппа и ОРВИ у детей и взрослых.



Аналог Арбидола, и производитель зарегистрировал его в России, это препарат – Арпетол.

### Препараты интерферона

К препаратам этой группы относятся: виферон, интрон, реаферон, кипферон.

Виферон - свечи с разным содержанием действующего вещества. Виферон -1 (150000 МЕ) рассчитан на малышей от рождения до 7 лет. Его применяют при ОРВИ, герпетической инфекции, в качестве дополнительного средства при затяжных пневмониях или сепсисе, в том числе, у недоношенных при внутриутробных инфекциях.



Препарат назначается курсом на 5 дней. Детям до 7 лет рекомендуется 1 свечка 2 раза в сутки. При необходимости после пятидневного перерыва курс может быть повторен еще на 5 дней.

Препарат в форме мази предназначен для терапии герпеса на коже и слизистых у взрослых и детей старше года.

Для взрослых в лечении ОРВИ препарат имеет ограниченное применение из-за ректальной формы введения и наличия альтернативных препаратов.

Кипферон применяется при тяжелых формах дисбактериоза кишечника у детей первых двух лет жизни.



Препарат обладает высоким молекулярным весом, который препятствует нормальному всасыванию, добавление в препарат компонентов донорской крови способны вызывать лихорадку и аллергию.

Циклоферон разрешен к применению у взрослых и детей старше четырех лет. Выпускается в растворе для инъекций, таблетках, линименте. Относится к иммуномодулирующим препаратам, является индуктором интерферона, усиливая его выработку и проявляя противовирусные, противовоспалительные и иммуностимулирующие свойства.



Используется при лечении ОРВИ, гриппа, вирусных гепатитов, герпетической инфекции, вирусов папилломы человека и других урологических и гинекологических патологий (например, кандидоза, хламидиоза).

В настоящее, основным методом лечения многих вирусных инфекций, прежде всего гриппа и ОРВИ, является меры профилактики, прежде всего лекарственной, поскольку многие противовирусные средства не проявляют достаточной эффективности при лечении вирусной инфекции. Причиной этого является «изменчивость» вирусов, их способность достаточно быстро вырабатывать устойчивость к применяемым лекарственным средствам, что приводит к появлению резистентных к препаратам вирусов и конкретных штаммов, быстрой выработке устойчивости вирусов к конкретным лекарственным препаратам (например, к ремантадину).

#### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

##### 1. Ремантадин (Remantadinum)



**Групповая принадлежность:** Противовирусное средство.

**Фармакологическое действие:** Ремантадин – специфическое химиотерапевтическое средство, обладающее хорошо выраженной противовирусной активностью. Химическая структура – *с*-метил-1-адамантилметиламинагидрохлорид (производное адамантана). На ранних стадиях развития ингибирует репликацию вирусов. Вероятно, тормозит и синтез оболочки вирусов. Эффективен против вирусов гриппа, включая грипп, вызванный вирусом В.

**Показания к применению:** Применяется для детей школьного возраста (с 7 лет) и взрослых в целях раннего лечения гриппа. Взрослым используют в качестве профилактического приема в период эпидемии гриппа. Так же используют для профилактики клещевого вирусного энцефалита.

**Способ применения:** Таблетки глотают, запивая водой. Рекомендуется принимать Ремантадин после еды. Профилактика гриппа Взрослым в течение 1 месяца по 1 таблетке (50 мг) 1 раз в сутки. Если по каким-либо причинам произошел пропуск таблетки, следующую таблетку принимать в обычном режиме, не проводя увеличение дозировки. Рекомендуется перед началом приема получить консультацию у врача. Лечение гриппа на ранних стадиях Детский возраст: с 7 до 10 лет препарат назначают 2 раза в сутки по 1 таблетке (50 мг); от 11 до 14 лет – по 1 таблетке (50 мг) 3 раза в сутки. Взрослым в течение первых суток заболевания по 2 таблетки (100 мг) 3 раза в сутки. Можно суточную дозу принять сразу - 6 таблеток (однократно) или суточную дозу разделить на 2 приема (по 3 таблетки 2 раза в сутки). На 2-е и 3-и сутки заболевания – по 2 таблетки (100 мг) 2 раза в сутки. В течение четвертого и пятого дней – по 2 таблетки (100 мг) 1 раз в сутки. Длительность курса лечения Ремантадином – 5 дней.

**Побочные действия:** Ремантадин переносится хорошо. К возможным побочным действиям относятся: • Нарушения со стороны органов желудочно-кишечного тракта: диарея, диспепсия; • нарушения со стороны кожных покровов: сыпь; • нарушения со стороны нервной системы: сонливость, нарушения внимания, атаксия, ажитация, нарушения походки по типу раскачивания, гиперкинезы, депрессия; • нарушения со стороны органа слуха: шум в ушах; • нарушения со стороны дыхательной системы: охриплость голоса. Если появляются другие побочные действия, об этом следует уведомить врача.

**Противопоказания:** • Хронические и острые заболевания почек; • острые заболевания печени; • беременность и кормление грудью;

**Форма выпуска:** Таблетки по 50 мг ремантадина белого или почти белого цвета.

## 2. Метисазон (Methisazonum).

**Групповая принадлежность:** Противовирусное средство

**Фармакологическое действие:** Подавляет репродукцию (размножение) вирусов оспенной группы, обладает профилактической активностью в отношении вируса натуральной оспы и оказывает благоприятное влияние при лечении поствакцинальных осложнений, а также эффективен при лечении рецидивирующего генитального герпеса (повторного появления вирусного воспаления слизистых оболочек половых органов).

**Показания к применению:** Для лечения натуральной оспы, генитального герпеса (вирусного заболевания, локализованного на половых органах) и herpeszoster (вирусного заболевания центральной и периферической нервной системы с появлением пузырьковой сыпи по ходу чувствительных нервов).

**Способ применения:** Внутрь (в таблетках) ежедневно через 1-1/2 ч после еды 2 раз в день в течение 4-6 дней. Разовая доза для взрослых - 0,6 г (1,2 г/сут.). Детям до 14 лет из расчета 0,01 г/кг на прием 2 раза в сутки в течение 4-6 дней.

**Побочные действия:** В отдельных случаях тошнота, рвота, головокружение. В этих случаях уменьшают дозу.

**Противопоказания:** Выраженные поражения печени и почек, хронические заболевания желудочно-кишечного тракта, злокачественные новообразования.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,2 г в упаковке по 25 штук.

## 3. Стрептомицина сульфат (Streptomycin! sulfas);



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (аминогликозид)

**Фармакологическое действие:** Стрептомицина сульфат обладает широким спектром антимикробного действия. Антибиотик активен в отношении микобактерий туберкулеза, а также большинства грамотрицательных (кишечная палочка, палочка Фридендера, палочка инфлюэнцы, возбудители чумы, туляремии, бруцеллеза) и некоторых грамположительных (стафилококки) микроорганизмов; менее активен в отношении стрептококков, пневмококков. Не действует на анаэробы (бактерии, способные существовать в отсутствии кислорода), риккетсии (род микроорганизмов, вызывающих ряд инфекционных заболеваний) и вирусы. Действует стрептомицин бактерицидно (уничтожает бактерии). Эффект связан с подавлением синтеза белка на уровне рибосом (структурных образований клетки) в микробной клетке. При приеме

внутри стрептомицин плохо всасывается и почти полностью выводится через кишечник. При внутримышечном введении всасывается хорошо.

**Показания к применению:** Стрептомицина сульфат применяют в качестве основного противотуберкулезного препарата для лечения главным образом впервые выявленного туберкулеза легких и туберкулезных поражений других органов. Пациентам, ранее получавшим стрептомицин, препарат целесообразно назначать после лабораторного определения чувствительности к нему выделяемых больным микобактерий (палочек Коха - бактерий, вызывающий туберкулез). Назначают также стрептомицина сульфат при гнойно-воспалительных процессах различной локализации, вызванных грамположительными и грамотрицательными микроорганизмами, чувствительными к препарату.

**Способ применения:** Применяют стрептомицина сульфат внутримышечно, а также в виде аэрозолей, интратрахеально (в полость трахеи), внутрикавернозно (в полость, образовавшуюся вследствие омертвления ткани) - у взрослых. При внутримышечном введении разовая доза для взрослых 0,5-1,0 г, суточная - 1 г. Высшая суточная доза - 2г. Больным с массой тела менее 50 кг и лицам старше 60 лет вводят обычно не более 0,75 г в сутки. Суточная доза для детей и подростков 15-20 мг на 1 кг массы тела, но не более 0,5 г в сутки детям и 1 г - подросткам. При лечении туберкулеза суточную дозу обычно вводят однократно, при плохой переносимости ее можно разделить на 2 введения. Длительность лечения зависит от формы и фазы заболевания (3 мес. и более). При лечении туберкулеза назначают стрептомицина сульфат в комбинации с рифампицином, изониазидом и другими противотуберкулезными препаратами, за исключением канамицина и флоримицина. При лечении инфекций нетуберкулезной этиологии (причины) суточную дозу вводят в 3-4 приема с интервалом 6-8 ч. Продолжительность лечения - 7-10 дней (не должна превышать 14 дней). Для внутримышечного введения препарат растворяют в стерильной воде для инъекций, изотоническом растворе натрия хлорида или 0,25-0,5% растворе новокаина из расчета 4 мл растворителя на 1 г препарата. Раствор готовят перед употреблением.

**Побочные действия:** При лечении стрептомицином (и его производными) могут наблюдаться различные токсические и аллергические реакции: лекарственная лихорадка (резкое повышение температуры тела), дерматит (воспаление кожи) и другие аллергические явления, головокружение, головная боль, сердцебиение, альбуминурия (белок в моче), гематурия (кровь в моче), в связи с подавлением микрофлоры кишечника может появиться понос. Наиболее серьезными осложнениями являются поражение VIII пары черепных нервов и связанные с этим вестибулярные расстройства и нарушения слуха (ототоксичность). При длительном применении больших доз может развиваться глухота. Лечение стрептомицином должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением; до и систематически в процессе лечения необходимо следить за функцией VIII пары черепных нервов, вестибулярного (структур мозга, ответственных за координацию движения) и слухового аппаратов, функцией почек, формулой крови.

**Противопоказания:** Заболевания слухового и вестибулярного аппаратов, связанные с воспалением VII пары черепных нервов и развившиеся после перенесенного отоневрита (заболевания внутреннего уха); тяжелые формы сердечно-сосудистой недостаточности (III стадия) и почечной недостаточности; нарушения мозгового кровообращения; облитерирующий эндартериит (воспаление внутренней оболочки артерий конечностей с уменьшением их просвета); повышенная чувствительность к стрептомицину; миастения. Стрептомицина сульфат нельзя принимать одновременно с антибиотиками, оказывающими ототоксическое действие (повреждающее воздействие на органы слуха) такими, как канамицин, флоримицин, ристомицин, гентамицин, мономицин, - а также с фуросемидом и курареподобными (расслабляющими скелетные мышцы) препаратами. Недопустимо смешивание стрептомицина сульфата в одном шприце с антибиотиками пенициллинового ряда и цефалоспорины.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 0.25; 0,5 и 1 г.

#### 4. Пиразинамид (Pirazinamidum);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Более активен по туберкулостатической активности (по действию, направленному на прекращение размножения бактерий туберкулеза), чем пйра-аминосалициловая кислота, хотя уступает изониазиду, стрептомицину, рифампицину, циклосерину, этионамиду, канамицину, флоримицину. Действует на микобактерии (возбудители туберкулеза), устойчивые к другим противотуберкулезным препаратам II Пряда. Препарат хорошо проникает в очаги туберкулезного поражения. Его активность не снижается в кислой среде казеозных (творожистоподобных) масс, в связи с чем его часто назначают при казеозных лимфаденитах (воспалении лимфатических узлов, заполненных творожистоподобной массой), туберкуломах (опухолях, вызываемых туберкулезным воспалением) и казеозно-пневмонических процессах (воспалительном заболевании легких с образованием в них творожистоподобной массы). При лечении одним пиразинамидом возможно быстрое развитие к нему

устойчивости микобактерии туберкулеза, поэтому его, как правило, комбинируют с другими противотуберкулезными препаратами (изониазид, стрептомицин и др.).

**Показания к применению:** Препарат особенно эффективен у больных с впервые выявленным деструктивным туберкулезом (туберкулезом легких, протекающим с нарушением структуры легочной ткани).

**Способ применения:** Суточная доза пиразинамида для взрослых 1,5-2,0 г, при хорошей переносимости до 2,5 г в сутки. Принимают внутрь после еды по 1 г 2 раза (реже по 0,5 г 3-4 раза) в день. Суточная доза для больных старше 60 лет и с массой тела до 50 кг - 1,5 г. Детям назначают из расчета 0,02-0,03 г (20-30 мг) на 1 кг массы тела в сутки (суточная доза не более 1,5 г).

**Побочные действия:** При лечении пиразинамидом могут возникать аллергические реакции: дерматиты (воспаление кожи), эозинофилия (увеличение числа эозинофилов в крови), лихорадочные реакции (резкое повышение температуры тела) и др. Возможны также диспепсические явления (расстройства пищеварения), ухудшение аппетита, головная боль, изредка - повышенная возбудимость, беспокойство. При длительном применении может оказывать токсическое действие на печень.

**Противопоказания:** Нарушение функции печени и подагра.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,5 и 0,75 г.

## 5. Изониазид (Isoniazidum);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Является основным представителем производных изоникотиновой кислоты, нашедших применение в качестве противотуберкулезных средств. Другие препараты этой группы (фтивазид и др.) могут рассматриваться как производные гидразида изоникотиновой кислоты. Изониазид обладает высокой бактериологической активностью в отношении микобактерий туберкулеза (возбудителей туберкулеза). На других распространенных возбудителях инфекционных заболеваний он выраженного химиотерапевтического действия не оказывает. Препарат хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация препарата в крови обнаруживается через 1-4 ч после приема внутрь; в течение 6-24 ч после приема разовой дозы в крови сохраняется туберкулостатическая концентрация (концентрация лекарственных средств, вызывающая прекращение жизнедеятельности бактерий туберкулеза).

**Показания к применению:** Применяют изониазид для лечения всех форм и локализаций активного туберкулеза у взрослых и детей; он наиболее эффективен при свежих, остро протекающих процессах. Назначают в комбинации с другими противотуберкулезными препаратами. При смешанной инфекции нужно одновременно с изониазидом принимать другие антибактериальные препараты: антибиотики (широкого спектра действия), сульфаниламиды, фторхинолоны (см. Офлоксацин).

**Способ применения:** При назначении изониазида и других препаратов - производных гидразида изоникотиновой кислоты следует учитывать, что в организме эти препараты инактивируются (полностью или частично теряют биологическую активность) с разной быстротой. Степень инактивирования определяют по содержанию активного гидразида изоникотиновой кислоты в крови и моче. Чем быстрее препарат инактивируется в крови, тем больше его требуется для обеспечения туберкулостатической концентрации в крови, поэтому больным, в организме которых происходит быстрая инактивация, дают препарат в несколько больших дозах. К "быстрым инактиваторам" относят больных, выделяющих в сутки с мочой до 10% активного изониазида по отношению к принятой дозе, а к "медленным (слабым)" - выделяющих более 10%. Применяют изониазид внутрь, внутрикавернозно (в полость, образовавшуюся вследствие омертвения ткани), внутримышечно, внутривенно, ингаляционно. Внутрь назначают изониазид взрослым и детям в суточной дозе 5-15 мг на 1 кг массы тела в 1 - 3 приема (после еды). Суточную дозу устанавливают индивидуально в зависимости от характера и формы заболевания, степени инактивации и переносимости. Лечение длительное. Внутримышечно (и внутривенно) изониазид вводят при активных формах туберкулеза, если больной испытывает затруднения при приеме внутрь (заболевания желудочно-кишечного тракта, непереносимость). Взрослым и подросткам вводят 10% раствор по 5-12 мг/кг в сутки в течение 2-5 мес.

**Побочные действия:** При применении изониазида и других препаратов этого ряда (фтивазид, метазид и др.) могут наблюдаться головная боль, головокружение, тошнота, рвота, болевые ощущения в области сердца, кожные аллергические реакции. Возможны эйфория (беспричинное благодушное настроение), ухудшение сна, в редких случаях - развитие психоза, а также появление периферического неврита (воспаления периферических нервов) с возникновением атрофии мышц (уменьшения массы мышц с ослаблением их функции в результате нарушения питания мышечной ткани) и паралича конечностей.

**Противопоказания:** Эпилепсия и склонность к судорожным припадкам; ранее перенесенный полиомиелит (инфекционное заболевание головного и спинного мозга), нарушения функций печени и почек, выраженный атеросклероз.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1; 0,2 или 0,3 г; порошок; 10% раствор в ампулах по 5 мл.

#### 6. Интерферон (Interferonum);



**Групповая принадлежность:** Интерферон альфа (Interferon alfa)

**Фармакологическое действие:** Интерферон является одним из основных эндогенных (вырабатываемых в организме) факторов, препятствующих поражению организма вирусной инфекцией. Кроме того, препарат обладает иммуностимулирующей (повышающей защитные силы организма) активностью.

**Показания к применению:** Препарат предназначен для профилактики и лечения гриппа, а также других ОРВИ (острых респираторных /дыхательных/ вирусных инфекций).

**Способ применения:** Для профилактики гриппа и других ОРВИ препарат следует принимать при непосредственной угрозе заражения и продолжать до тех пор, пока сохраняется опасность заражения. Применяют в виде раствора, который готовят на дистиллированной или кипяченой воде комнатной температуры. Раствор имеет красный цвет (с опалесценцией /со светорассеянием/), его можно хранить на холоде в течение 1 -2 сут. Препарат закапывают в носовые ходы или распыляют. Ампулу перед употреблением вскрывают, вливают в нее воду комнатной температуры до черты на ампуле, соответствующей 2 мл. Содержимое осторожно встряхивают до полного растворения. В каждый носовой ход вводят по 5 капель 2 раза в сутки с интервалом не менее 6 ч. При использовании распылителем (любой системы) вводят в каждый носовой ход по 0,25 мл раствора. С лечебной целью интерферон следует принимать при первых признаках гриппа. Эффективность препарата тем выше, чем раньше начат его прием. Наиболее эффективен ингаляционный способ (через нос или рот). На одну ингаляцию используют 3 ампулы препарата, содержимое которых растворяют в 10 мл воды. Воду подогревают до температуры не выше +37 °С. Ингаляции проводят 2 раза в сутки с интервалом не менее 1-2 ч. При распылении или закапывании растворяют содержимое ампулы в 2 мл воды и вводят по 0,25 мл (5 капель) в каждый носовой ход через 1-2 ч не менее 5 раз в сутки в течение 2-3 дней. Применяют также раствор интерферона для закапываний при вирусных заболеваниях глаз.

**Форма выпуска:** В ампулах емкостью 2 мл (в сухом виде).

#### 7. Рифампицин (Rifampicinum);



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (ансамидин)

**Фармакологическое действие:** Рифампицин является антибиотиком широкого спектра действия. Он активен в отношении микобактерий туберкулеза и лепры, действует на грамположительные (особенно стафилококки) и грамотрицательные (менингококки, гонококки) кокки, менее активен в отношении грамотрицательных бактерий. Рифампицин хорошо всасывается из желудочно-кишечного тракта. Максимальная концентрация в крови достигается через 2-2½ ч после приема внутрь. При внутривенном капельном введении максимальная концентрация рифампицина наблюдается к концу инфузии (вливания). Рифампицин хорошо проникает в ткани и жидкости организма и обнаруживается в терапевтических концентрациях в плевральном экссудате (накапливающейся между оболочками, окружающими легкие, богатой белком жидкости), мокроте, содержимом каверн (полостей в легких, образовавшихся вследствие омертвления ткани), костной ткани.

**Показания к применению:** Основным показанием к применению является туберкулез легких и других органов. Кроме того, препарат применяют при различных формах лепры и воспалительных заболеваниях легких и дыхательных путей: бронхите (воспалении бронхов), пневмонии (воспалении легких), - вызываемых полирезистентными (устойчивыми к большинству антибиотиков) стафилококками; при остеомиелите (воспалении костного мозга и прилегающей костной ткани); инфекциях моче- и желчевыводящих путей; острой гонорее и других заболеваниях, вызванных чувствительными к рифампицину возбудителями. В связи с быстрым развитием устойчивости микроорганизмов рифампицин



назначают при нетуберкулезных заболеваниях только в тех случаях, если неэффективны другие антибиотики. Рифампицин оказывает вирулоцидное (сопровожающееся полной или частичной потерей биологической активности вируса) действие на вирус бешенства, подавляет развитие рабического энцефалита (воспаления головного мозга, вызываемого вирусом бешенства); в связи с этим его используют для комплексного лечения бешенства в инкубационном периоде (периоде между моментом заражения и появлением первых признаков заболевания).

**Способ применения:** Рифампицин принимают внутрь натощак (за 1/2-1 ч до еды) или вводят внутривенно капельно (только взрослым). Для приготовления раствора разводят 0,15 г рифампицина в 2,5 мл стерильной воды для инъекций, энергично встряхивают ампулы с порошком до полного растворения, полученный раствор разводят в 125 мл 5% раствора глюкозы. Вводят со скоростью 60-80 капель в минуту. При лечении туберкулеза средняя суточная доза для взрослых внутрь 0,45 г 1 раз в день. У больных (особенно в период обострения) с массой тела выше 50 кг суточная доза может быть увеличена до 0,6 г. Средняя суточная доза для детей старше 3 лет - 10 мг/кг (но не более 0,45 г в сутки) 1 раз в день.

Внутривенное введение рифампицина рекомендуется при остро прогрессирующих и распространенных формах деструктивного туберкулеза легких (туберкулеза легких, протекающего с нарушением структуры легочной ткани), тяжелых гнойно-септических процессах (микробном заражении крови с последующим образованием гнойников в тканях), когда необходимо быстро создать высокую концентрацию препарата в крови и если прием препарата внутрь затруднен или плохо переносится больным. При внутривенном введении суточная доза для взрослых составляет 0,45 г, при тяжелых быстро прогрессирующих (развивающихся) формах - 0,6 г и вводится в 1 прием. Препарат внутривенно вводят в течение 1 мес. и более с последующим переходом на прием внутрь в зависимости от переносимости препарата. Общая продолжительность применения рифампицина при туберкулезе определяется эффективностью лечения и может достигать 1 года.

**Побочные действия:** Лечение рифампицином должно проводиться под тщательным врачебным наблюдением. Возможны аллергические реакции (разной степени тяжести), хотя наблюдаются они относительно редко; кроме того, диспепсические явления (расстройства пищеварения), дисфункция (нарушение функции) печени и поджелудочной железы.

**Противопоказания:** Рифампицин противопоказан детям грудного возраста, беременным, при желтухе, заболеваниях почек со снижением выделительной функции, гепатите (воспалении ткани печени) и повышенной чувствительности к препарату. Внутривенное введение противопоказано при легочно-сердечной недостаточности (недостаточном снабжении тканей организма кислородом вследствие заболевания сердца и легких) и флебите.

**Форма выпуска:** В капсулах по 0,05 и 0,15 г в упаковке по 10-20 или 30 капсул; в ампулах по 0,15 г в виде пористой массы в упаковке по 10 ампул.

#### 8. Фтивазид (Phthivazidum);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Обладает высокой бактериостатической (препятствующей размножению бактерий) активностью в отношении микобактерий туберкулеза.

**Показания к применению:** Туберкулез (различные формы и локализации). Способ применения: Внутрь по 0,5 г 2-3 раза в день, детям из расчета 0,02-0,03-0,04 г/кг в сутки в 3 приема (но не более 1,5 г и сутки). При туберкулезной волчанке 0,25-0,3 г 3-4 раза в день; на курс лечения 40-60 г. Курс лечения повторяют 2-3 раза с месячными перерывами. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая - 1 г, суточная - 2 г.

**Побочные действия:** Переносится лучше, чем изониазид, но возможны те же побочные явления, что и при применении изониазида.

**Противопоказания:** Стенокардия, сердечно-сосудистая декомпенсация (недостаточное кровоснабжение органов и тканей вследствие снижения насосной функции сердца), органические заболевания центральной нервной системы, заболевания почек нетуберкулезного характера, сопровождающиеся нарушением выделительной функции.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки в упаковках по 100 штук по 0,1 г, 0,3 г и 0,5 г.

#### 9. Этамбутол (Ethambutolum);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Обладает бактериостатической (препятствующей размножению бактерий) активностью в отношении микобактерий туберкулеза (возбудителя туберкулеза); в том числе и в отношении штаммов, устойчивых к другим противотуберкулезным препаратам.

**Показания к применению:** Различные формы туберкулеза. Способ применения: Внутрь, 1 раз в день (после завтрака), первичным больным, ранее не принимавшим противотуберкулезные препараты, - по 15 мг/кг; больным, ранее принимавшим противотуберкулезные препараты, - по 25 мг/кг. Курс лечения - 2 мес. Затем препарат назначают в поддерживающих дозах - 15 мг/кг раз в сутки.

**Побочные действия:** Возможны ухудшение зрения, аллергические реакции.

**Противопоказания:** Неврит (воспаление) зрительного нерва, катаракта (помутнение хрусталика глаза с понижением остроты зрения), воспалительные заболевания глаз, диабетическая ретинопатия (невоспалительные поражения сетчатки глаза вследствие высокого содержания сахара в крови), беременность.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,1; 0,2 и 0,4 г в упаковке по 100 штук.

#### 10. Канамицин (Канамуцин);



**Групповая принадлежность:** Антибиотик (аминогликозид)

**Фармакологическое действие:** Канамицина сульфат - антибиотик широкого спектра действия, уничтожающий кислотоустойчивые бактерии, большинство грамотрицательных, грамположительных микроорганизмов, штаммы туберкулезных микобактерий, устойчивых к стрептомицину, изониазиду, кислоте парааминосалициловой, препаратам против туберкулеза (кроме флоримицина). Также Канамицин активен против микроорганизмов, которые устойчивы к эритромицину, тетрациклину, левомецетину.

**Показания к применению:** Канамицин назначают при тяжелых гнойных, септических заболеваниях (перитонит, эндокардит септический, менингит, сепсис), инфекционных воспалительных болезнях органов дыхания (легочный абсцесс, плевральная эмпиема, пневмония), инфекциях мочевыводящих путей, почек, при гнойных осложнениях после операций, инфицированных ожогах, при туберкулезе, других заболеваниях, вызванных чувствительными к Канамицину микроорганизмами.

**Способ применения:** Канамицина вводят только внутримышечно. Детям препарат при инфекциях нетуберкулезного происхождения вводят в таких суточных дозировках: до 1го года (назначают в исключительных случаях) - 0,1гр; детям 1-5лет - 0,1-0,3гр.; детям старше 5лет - 0,3-0,5гр. Допустимая суточная доза - 15мг на килограмм веса. Вводят препарат 2-3р в сутки. Лечение продолжается 5-7дн. Взрослым для лечения нетуберкулезной инфекции назначают принимать Канамицин по 0,5гр каждые 8-12ч. В сутки нельзя вводить больше 2гр., а за один раз - более 1,0гр. Перерыв между уколами - 12 часов. Продолжительность терапии - 5-7дн. Для лечения туберкулеза взрослым назначают 1,0гр один р/сутки, детям - 15мг на килограмм один р/сутки. Лечение длится один месяц и более. Во время терапии Канамицин вводят на протяжении шести дней каждый день, на седьмой день делают перерыв. Для разведения раствора для введения препарата внутримышечно, порошок Канамицина сульфат смешивают со стерильной водой для уколов (4мл) или с р-ром новокаина 0,25-0,5%.

**Побочные действия:** Канамицин может вызывать диарею, аллергию, тошноту, рвоту, парестезии, дисбактериоз, раздражение в месте введения укола. Длительное использование препарата может привести к невриту слухового нерва, нефротоксическим реакциям.

**Противопоказания** Препарат противопоказан при неврите слухового нерва, непроходимости кишечника, нарушениях функции печени, почек, гиперчувствительности. Пожилым пациентам препарат назначают, если нет возможности применить антибиотики, которые менее токсичны. Нельзя принимать Канамицин одновременно с мономицином, флоримицином, неомицином, стрептомицином, гентамицином, прочими нефро-ототоксичными средствами. Также нельзя сочетать препарат с фуросемидом, другими диуретиками.

**Форма выпуска:** Порошок для приготовления инъекционного раствора содержит канамицина сульфата 1 г; во флаконе 10 мл, в коробке 50 флаконов..

## 11. Этоксид (Aethoxydum)

**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Этоксид (Aethoxydum; список Б) — противотуберкулезный и противолепрозный препарат; 4,4'-диэтокситиокарбанилид. Применяется длительно, до 40 недель. В качестве противотуберкулезных средств относится к противотуберкулезным препаратам II ряда, обладающий меньшей бактериостатической активностью, чем Фтивазид или Стрептомицин, но большей, чем у парааминосалицилата натрия. Плохо всасывается из желудочно-кишечного тракта.

**Показания к применению:** Все формы туберкулеза, особенно больным, не переносящим другие противотуберкулезные препараты или при наличии штаммов, резистентных к ним. Лепра (проказа).

**Способ применения:** Для лечения туберкулеза применяется в комбинации с Фтивазидом, Изониазидом, Стрептомицином и ПАСК-натрием. При устойчивости к этим препаратам или их плохой переносимости Этоксид сочетают с противотуберкулезными препаратами второго ряда (Циклосерин, Канамицин и др.).

Этоксид назначается внутрь сразу после еды в дозе 0,25 г 3–4 раза в день, для лучшей всасываемости таблетки следует измельчать и запивать молоком. При хорошей переносимости доза препарата постепенно повышается и с 3–4-го дня может быть доведена до 1–2 г.

Этоксид можно применять длительно (6–12 месяцев) и дольше в сочетании с другими противотуберкулезными средствами.

Для лечения лепры препарат назначается в возрастающих дозах курсами по 40 недель: в первую неделю — по 0,1 г 3 раза в день, во вторую — 0,2 г 3 раза в день, затем по 0,3 г 3 раза в день в течение 20 недель. В дальнейшем при хорошей переносимости суточную дозу увеличивают до 1,5 г и более. Ежедневно делают 1 день перерыва в лечении. Повторные курсы лечения проводят после месячного перерыва. Высшие дозы Этоксида внутрь взрослым: разовая — 1,5 г, суточная — 4,5 г.

**Побочные действия:** Иногда по ходу лечения отмечают головные боли, повышение температуры, нарушения состояния желудочно-кишечного тракта, кожные аллергические реакции, лейкопения, гипохромная анемия. Это требует снижения дозы препарата или временного перерыва в его приеме.

**Противопоказания:** Этоксид противопоказан больным с нарушениями функций почек и печени, а также при заболеваниях органов кроветворения.

Форма выпуска: Таблетки «Этоксид», содержащие по 0,10 г, 0,25 г и 0,50 г действующего вещества, в ячейковых упаковках и банках по 20, 150 и 760 таблеток.

## 12. Амантадин (Amantadine);

**Групповая принадлежность:** Противопаркинсоническое и противовирусное средство (трициклический симметричный адамантанамин).

**Фармакологическое действие:** противопаркинсонический, противовирусное средство; трициклический симметричный адамантанамин, блокирует глутаматных NMDA-рецепторы, снижая чрезмерное стимулирующее влияние кортикальных глутаматных нейронов на неостриатум, который развивается на фоне недостаточного выделения дофамина; уменьшая поступления ионизированного  $Ca^{2+}$  в нейроны, снижает возможность их деструкции; значительной степени влияет на скованность (ригидность и брадикинезию) противовирусное действие возможно связана со способностью амантадина блокировать проникновение вируса гриппа типа А в клетки.

**Показания к применению:** болезнь Паркинсона, паркинсонизм различной этиологии невралгия при опоясывающем лишае (Herpes zoster), профилактика и лечение гриппа (вызванного вирусом гриппа А) БНФ (рекомендация к применению ЛС в Британском Национальном формуляре, 60 выпуск).

**Способ применения:** Режим дозирования индивидуальный; в связи с возможным активирующим влиянием на ЦНС (центральная нервная система) последнюю дозу препарата желателно принять не позднее 16 ч (Час) рекомендуемая начальная доза - 1 табл. (Таблетки) 1 р /сутки (количество раз в сутки) в первые 4 - 7 дней, затем возможно увеличение суточной дозы на 100 мг, пока не будет достигнуто нужной дозы, которую следует принимать за 2 - 3 приема МДД (максимальная суточная доза) - 600 мг, длительность лечения зависит от природы и тяжести болезни;

**Побочные действия:** Возможны психические расстройства, сопровождающиеся зрительными галлюцинациями, снижение остроты зрения, головокружение, расстройства сна, двигательное или психическое возбуждение, беспокойство, раздражительность, тремор, судороги, головная боль, СН (сердечная недостаточность), тахикардия, аритмия, тошнота, сухость во рту, анорексия, диспепсия задержка мочи у больных с гиперплазией предстательной железы, полиурия, никтурия, периферические отеки, в отдельных случаях - появление синеватого оттенка кожи верхних и нижних конечностей.

**Противопоказания:** Состояние делирия и предделирия, наличие психозов в анамнезе, эпилепсия, тиреотоксикоз, глаукома, аденома предстательной железы, почечная и /или печеночная недостаточность, период беременности и кормления грудью, язва желудка и ДПК (двенадцатиперстная кишка).

**Формы выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 100 мг капс. Капсулы по 100 мг.

### 13. Натрия пара – аминосалицилат (Natriipara-aminosalicilas);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Пара-аминосалициловая кислота (сокращенно ПАСК) и ее натриевая соль обладают бактериостатической (препятствующей размножению бактерий) активностью в отношении микобактерий туберкулеза и относятся к основным противотуберкулезным препаратам. При приеме внутрь ПАСК хорошо всасывается и проникает в сыворотку крови и ткани внутренних органов. По туберкулостатической (препятствующей размножению возбудителей туберкулеза) активности ПАСК уступает изониазиду и стрептомицину, поэтому ее сочетают с другими, более активными, противотуберкулезными препаратами (изониазид или другие препараты гидразид изоникотиновой кислоты, циклосерин, канамицин и др.). Комбинированная терапия замедляет развитие лекарственной устойчивости и усиливает действие соответствующих препаратов.

**Показания к применению:** ПАСК в комбинации с другими препаратами эффективна при различных формах и локализациях туберкулеза.

**Способ применения:** Назначают ПАСК внутрь в виде порошка, таблеток (драже) или гранул взрослым по 9-12 г в сутки (3-4 г 3 раза в день), детям - по 0,2 г/кг в сутки в 3-4 приема (суточная доза не более 10 г). Принимают через 1/2-1 ч после еды, запивают молоком, щелочной минеральной водой, 0,5-2% раствором гидрокарбоната натрия. Истощенным взрослым больным (с массой тела меньше 50 кг), а также при плохой переносимости препарат дают в дозе 6 г в сутки. В амбулаторной практике (вне больницы) можно назначать всю суточную дозу в 1 прием, однако при плохой переносимости суточную дозу делят на 2-3 приема. При внутривенном введении удается получить высокие концентрации натрия пара-аминосалицилата в крови, в связи с чем химиотерапевтический эффект усиливается. При необходимости назначают раствор натрия пара-аминосалицилата одновременно с раствором изониазида. Курс лечения обычно продолжается 1-2 мес., редко более.

**Побочные действия:** При применении ПАСК могут наблюдаться побочные явления. Наиболее часто отмечаются желудочно-кишечные расстройства: ухудшение (или потеря) аппетита, тошнота, рвота, боли в животе, понос или запор. Эти явления обычно уменьшаются при снижении дозы или кратковременном перерыве в лечении, они менее выражены при правильном (равномерном трехразовом) режиме питания, а иногда при приеме препарата в виде гранул. Лучше, чем обычные таблетки, переносятся таблетки натрия пара-аминосалицилата, растворимые в кишечнике. При применении натрия пара-аминосалицилата могут также наблюдаться аллергические реакции: дерматиты (воспаление кожи) типа крапивницы или пурпуры (множественных мелких кровоизлияний в кожу и слизистые оболочки), энантемы (сыпи, возникающие на слизистых оболочках тела), лихорадочная реакция (резкое повышение температуры тела), астматические явления, боли в суставах, эозинофилия (увеличение числа эозинофилов в крови) и др. В отдельных случаях возможны увеличение и болезненность печени.

**Противопоказания:** Выраженная патология почек (нефрит/воспаление почки/), печени (гепатиты /воспаление ткани печени/, цирроз), амилоидоз (заболевание, связанное с нарушением белкового обмена и отложением амилоида во внутренних органах, что приводит к нарушению их функции), язвенная болезнь, микседема (угнетение функции щитовидной железы), сердечная декомпенсация (снижение насосной функции сердца). Осторожность следует соблюдать у больных с умеренно выраженной патологией желудочно-кишечного тракта.

**Форма выпуска:** Натрия пара-аминосалицилат для приема внутрь применяют в следующих лекарственных формах: а) порошок; б) таблетки (белого цвета или белого цвета с розоватым или желтоватым оттенком) по 0,5 г; в) таблетки, растворимые в кишечнике (оранжево-красного цвета) по 0,5 г; г) таблетки, покрытые оболочкой (светло-сиреневого цвета или светло-сиреневого с розоватым оттенком) по 0,5 г; д) гранулы по 100 г (от светло-желтого до зеленовато-желтого цвета); е) раствор для инъекций во флаконах по 250 или 500 мл. Гранулы лучше переносятся, чем чистая ПАСК. Одна чайная ложка вмещает 6 г гранул, что соответствует 2 г натрия пара-аминосалицилата и 4 г сахара. Принимая по 1 или 2 чайные ложки 3 раза в день, больной получает 6 или 12 г натрия пара-аминосалицилата. Для внутривенных инъекций применяют раствор натрия пара-аминосалицилата 3% для инъекций -водный раствор натриевой соли пара-аминосалициловой кислоты, содержащий консервант.

### 14. Оксолин; Оксолиновая мазь (UnguenturnOxolini)



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Действующим веществом мази является оксолин, обладающий противовирусной активностью в отношении вируса гриппа и вируса герпеса простого.

**Показания к применению:** Вирусные заболевания глаз, кожи, вирусные риниты (воспаление слизистой оболочки носа, вызываемое вирусом). С профилактической целью применяется при гриппе. Для лечения пузырькового и опоясывающего лишая, бородавок, контактного моллюска, герпетического дерматита Дюринга (воспаления кожи, вызываемого неясными причинами и проявляющегося появлением зудящей, мокнущей сыпи), чешуйчатого лишая.

**Способ применения:** Наружно при лечении аденовирусного кератоконъюнктивита (сочетанного воспаления роговицы и наружной оболочки глазного яблока, вызываемого аденовирусом), вирусных кератитов (воспаление роговицы) - за веко 0,25% мазь 1-3 раза в день. Для лечения вирусного ринита смазывают слизистую оболочку носа 0,25% мазью 2-3 раза в день в течение 3-4 дней, а для профилактики гриппа 2 раза в день в период подъема и максимального развития эпидемической вспышки гриппа (на протяжении 25 дней) или при контакте с больным гриппом. При простом, пузырьковом и опоясывающем лишае, контактном моллюске и других кожных заболеваниях наносят на поврежденную кожу 3% мазь 2-3 раза в день в течение 2 нед. - 2 мес.

**Побочные действия:** Скоропреходящее чувство жжения.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препарату.

**Форма выпуска:** 0,25% мазь в упаковке по 10 г, 3% мазь в упаковке по 30 г.

#### 15. Циклосерин (Cycloserinum);



**Групповая принадлежность:** Антибиотик

**Фармакологическое действие:** Препарат обладает широким спектром антибактериального действия: угнетает грамположительные и грамотрицательные бактерии. Наиболее ценным свойством является его способность задерживать рост микобактерий туберкулеза (возбудителей туберкулеза). По активности уступает стрептомицину, изониазиду и фтивазиду, но действует на микобактерий туберкулеза, устойчивые к этим препаратам и пара-аминосалициловой кислоте.

**Показания к применению:** Циклосерин рассматривается как "резервный" противотуберкулезный препарат, т. е. назначаемый больным хроническими формами туберкулеза, у которых ранее применявшиеся основные препараты перестали оказывать эффект. Циклосерин можно также сочетать с основными препаратами для предупреждения развития резистентности (устойчивости к препарату) микобактерий. Возможно также комбинированное использование циклосерина с другими препаратами II ряда, этионамидом, пипразинамидом и др.

**Способ применения:** Назначают внутрь (непосредственно перед едой: взрослым по 0,25 г 3 раза в день. Высшая разовая доза для взрослых - 0,25 г, суточная доза - 1 г. Больные старше 60 лет и с массой тела менее 50 кг принимают по 0,25 г 2 раза в день. Суточная доза для детей - из расчета 0,01-0,02 г/кг, но не свыше 0,75 г в сутки, причем большую дозу дают только в острой фазе туберкулезного процесса или при недостаточной эффективности меньших доз.

**Побочные действия:** При лечении циклосерином могут наблюдаться побочные явления, обусловленные главным образом токсическим влиянием препарата на нервную систему: головная боль, головокружение, бессонница (иногда, наоборот, сонливость), беспокойство, повышенная раздражительность, ухудшение памяти, парестезии (чувство онемения в конечностях), периферические невриты (воспаление нервов). Иногда возможны более тяжелые симптомы: чувство страха, психастенические состояния (состояние, характеризующееся быстрой сменой настроения, склонностью к депрессии /подавленности/ и т. д.), галлюцинаторные феномены (бред, видения, приобретающие характер реальности), эпилептиформные припадки (припадки, протекающие по типу эпилептических), потеря сознания.

**Противопоказания:** Органические заболевания центральной нервной системы, эпилепсия, нарушения психики, а также наличие в анамнезе (истории болезни) указаний на психические болезни. Нельзя принимать циклосерин перед хирургическим вмешательством и в первую неделю после него. С

осторожностью следует назначать препарат при нарушении функции почек, лицам с неустойчивой психикой, страдающим алкоголизмом.

**Форма выпуска:** Таблетки или капсулы по 0,25 г.

#### 16. Флоримицин; Флоримицина сульфат (Florimycinisulfas);

**Групповая принадлежность:** Антибиотик (аминогликозид)

**Фармакологическое действие:** По химиотерапевтическим свойствам близок к канамицину. Оказывает специфическое бактериостатическое (препятствующее размножению бактерий) действие на микобактерий туберкулеза (возбудители туберкулеза), активен также в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий.

**Показания к применению:** Является “резервным” препаратом при лечении различных форм и локализаций туберкулеза. Его назначают больным, у которых туберкулостатические (препятствующие размножению возбудителей туберкулеза) препараты Иряда оказались неэффективными из-за развития резистентности (устойчивости) к ним или по другим причинам, а также при непереносимости других противотуберкулезных препаратов.

**Способ применения:** Применяют внутримышечно (в кишечнике он не всасывается). Вводят (медленно) глубоко в верхний наружный квадрант ягодицы. Растворы для инъекций готовят перед применением; во флакон, содержащий 0,5-1,0 г (500000-1000000 ЕД) препарата, вводят 3-5 мл стерильной воды для инъекций, изотонического раствора натрия хлорида или 0,25-0,5% раствора новокаина. Раствор должен быть использован в течение первых суток. Суточная доза для взрослых составляет 1 г. Вводят ежедневно по 0,5 г 2 раза в день (утром и вечером) или по 1 г 1 раз в день в течение 6 дней подряд, на 7-й день перерыв. При длительном лечении иногда делают перерыв на 2 дня в неделю (подряд или через 2-3 дня по одному дню). Высшая разовая доза для взрослых - 1 г, суточная - 2 г. Доза для больных с массой тела ниже 50 кг и лицам старше 60 лет составляет 0,5-0,75 г в сутки.

Назначают его детям, страдающим хроническим деструктивным туберкулезом (туберкулезом легких, протекающим с нарушением структуры легочной ткани), при неэффективности других средств. Суточная доза для детей 0,015-0,02 г/кг (15-20 мг/кг) - не более 0,5 г для детей и 0,75 г для подростков.

**Побочные действия:** Следует учитывать, что флоримицин может оказывать токсическое (повреждающее) действие на слуховой нерв, поэтому лечение должно проводиться под контролем аудиометрии (измерения остроты слуха). При первых признаках понижения слуха препарат отменяют. Ослаблению нейротоксических (повреждающего воздействия на нервную систему) и аллергических реакций может способствовать применение кальция пантотената. Флоримицин можно сочетать с препаратами 1 и 2 ряда (пара-аминосалициловая кислота, циклосерин и др.). Однако его нельзя комбинировать со стрептомицином и другими антибиотиками, оказывающими ототоксическое действие (неомицин, мономицин, канамицин и др.). При применении флоримицина могут появиться головная боль, аллергические дерматиты (воспаление кожи), белок в моче. Необходимо учитывать, что у больных с нарушением выделительной функции почек выведение флоримицина из организма задерживается, что может привести к усилению его токсического действия.

**Противопоказания:** Противопоказания: поражение VIII пары черепных нервов и нарушение функции почек.

**Форма выпуска:** В герметически укупоренных флаконах по 0,5 и 1 г.

#### 17. Протионамид (Protionamidum);



**Групповая принадлежность:** Противотуберкулезное средство

**Фармакологическое действие:** Обладает противомикробной активностью в отношении микобактерий туберкулеза. По эффективности близок к этионамиду, но лучше переносится.

**Показания к применению:** Различные формы туберкулеза, а также устойчивость возбудителя к другим противотуберкулезным препаратам или их непереносимость больным.

**Способ применения:** Внутрь по 0,25 г 2-4 раза в день. У больных старше 60 лет и при массе тела менее 50 кг суточная доза не должна превышать 0,75 г (чаще всего по 0,25 г 2 раза в сутки). Детям назначают из расчета 10-20 мг/кг в сутки.

**Побочные действия:** В отдельных случаях желудочно-кишечные расстройства, головокружение, тахикардия (учащенные сердцебиения), слабость, парестезии (чувство онемения в конечностях).

**Противопоказания:** Беременность, заболевания почек.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковке по 50 штук,

**18. Идоксуридин (Idoxuridine);****Групповая принадлежность:****Фармакологическое действие:** Идоксуридин блокирует репродукцию (размножение) Herpes simplex (вируса, вызывающего заболевание, характеризующееся воспалением носоглотки и роговицы глаза) путем изменения нормального синтеза ДНК (дезоксирибонуклеиновой кислоты - составной части ядра клетки, ответственной за перенос наследственной информации).**Показания к применению:** Лечение кератита, вызванного простым герпесом (воспаления роговицы /прозрачной оболочки глаза/, вызванного вирусом герпеса).**Способ применения:** В начале лечения по одной капле в оба инфицированных глаза, каждый час днем и через каждые 2 ч ночью. После окончания курса лечения (2-4 дня) для профилактики рецидивов (повторного появления признаков болезни) следует продолжать лечение еще в течение 3-5 дней, закапывая препарат каждые 2 ч днем и 1 раз ночью. Побочные действия: Иногда небольшое раздражение, зуд, краснота отмечаются в области век или глаза.**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препарату, беременность. Противопоказано одновременное местное применение кортикостероидов.**Форма выпуска:** Глазные капли 10 мл.**19. Ацикловир (Aciclovir);****Групповая принадлежность:** Противовирусное средство**Фармакологическое действие:** Противовирусный препарат, особенно эффективный в отношении вирусов простого герпеса (вируса, вызывающего поражение кожи и слизистых) и опоясывающего герпеса (вируса, вызывающего заболевание центральной и периферической нервной системы с появлением пузырьковой сыпи по ходу чувствительных нервов). Ацикловир является аналогом пуринового нуклеозида дезоксигуанидина, нормального компонента ДНК (дезоксирибонуклеиновой кислоты - составной части ядра клетки, ответственной за перенос наследственной информации). Сходство структур ацикловира и дезоксигуанидина позволяет ацикловиру взаимодействовать с вирусными ферментами, что приводит к прерыванию размножения вируса. После внедрения ацикловира в пораженную герпесом клетку под влиянием тимидинкиназы, выделяемой вирусом, ацикловир превращается в ацикловир-монофосфат, который ферментами клетки-хозяина превращается в ацикловир-дифосфат, а затем в активную форму ацикловир-трифосфат, который блокирует репликацию вирусной ДНК (сложный внутриклеточный механизм деления ДНК, следствием которого является размножение вирусов). Препарат действует избирательно на синтез вирусной ДНК. На репликацию ДНК клетки хозяина (клетки человека) ацикловир-трифосфат практически не влияет. При приеме внутрь ацикловир всасывается лишь частично (около 20%).**Показания к применению:** Ацикловир при герпесе предупреждает образование новых элементов сыпи, снижает вероятность кожной диссеминации (распространения по коже) и висцеральных осложнений (осложнений на внутренние органы), ускоряет образование корок, ослабляет боли в острой фазе опоясывающего герпеса. Внутривенно вводят ацикловир при инфекциях, вызванных вирусом простого герпеса у больных с нарушениями иммунной системы; при тяжелых формах первичных инфекций половых органов в случае, если инфекции обусловлены вирусом простого герпеса; при инфекциях, вызванных вирусом опоясывающего герпеса; для профилактики инфекций, вызываемых вирусом простого герпеса у больных с тяжелыми нарушениями иммунной системы (при пересадке органов, химиотерапии опухолей). Препарат оказывает также иммуностимулирующее действие (направленное на активацию защитных сил организма).**Способ применения:** Применяют ацикловир внутрь, внутривенно и местно (в виде мази и крема). Таблетки ацикловира назначают при инфекциях кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом простого герпеса, и для профилактики этих заболеваний у больных с нарушениями иммунной системы, а у больных опоясывающим лишаем - при нормальной иммунной системе. Взрослым при инфекциях, вызванных вирусом простого герпеса, дают по 1 таблетке (0,2 г) 5 раз в день (за исключением ночи), а для профилактики - по 1 таблетке 4 раза в день; при опоясывающем лишае - по 4 таблетки (0,8 г) 5 раз в день. Детям старше 2 лет назначают дозу взрослых; до 2 лет - половину дозы взрослых. Продолжительность лечения обычно 5 дней, при опоясывающем герпесе - еще 3 дня после исчезновения признаков заболевания. Крем применяют при инфекциях кожи и слизистых оболочек, вызванных вирусом простого герпеса, при герпесе губ, половых органов. Наносят на пораженную поверхность 5 раз в день (через 1 ч). Продолжительность лечения - 5-10 дней.**Побочные действия:** Ацикловир обычно хорошо переносится. При приеме внутрь возможны тошнота, рвота, понос, головная боль, аллергические кожные реакции, повышенная утомляемость, а при

внутривенном введении и приеме внутрь - увеличение содержания мочевины, креатинина и билирубина в сыворотке крови, повышение активности ферментов печени. При попадании растворов ацикловира в подкожную жировую клетчатку возникает местная реакция.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 0,25 г (250 мг) в упаковке по 5 флаконов; таблетки по 9,2 г (200 мг) в упаковке по 20 и 100 штук; 3% глазная мазь (30 мг в 1 г) в тубах по 4,5 или 5 г; 5% крем (50 мг в 1 г) в тубах по 5 г.

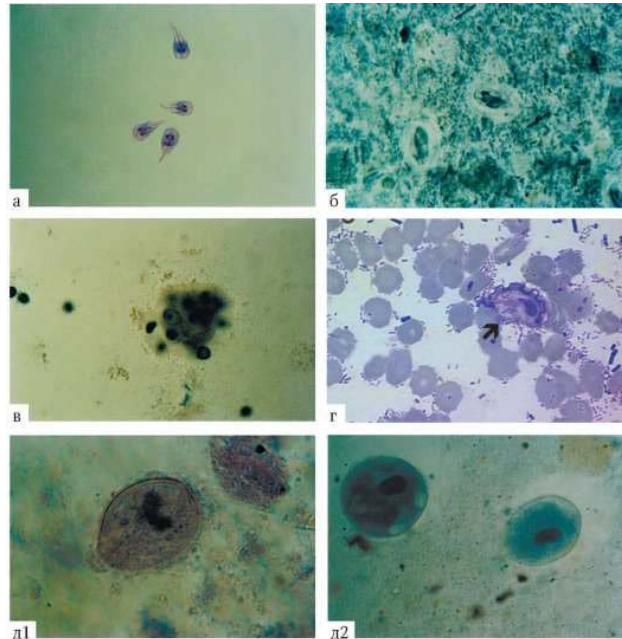


## ПРОТИВОПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА

Среди заболеваний особую группу представляют инфекции вызываемые простейшими.

Простейшие (Protozoa) — тип одноклеточных животных, который включает свыше 25 тысяч видов, значительно более сложные по строению по сравнению с бактериями. Большинство простейших ведут свободный образ жизни, обитая в морях и океанах (в толще воды и на дне), а также в пресных водоемах и в почве, но более 6700 видов простейших являются паразитами человека, различных животных и растений. Некоторые из них вызывают тяжелые заболевания человека, такие как: малярию, амебиаз, трихомоноз, лейшманиоз, токсоплазмоз, лямблиоз, балантидиаз, пневмоцистоз и др., у животных — пироплазмозы, бабезиеллезы, кокцидиозы, трихомониазы, токсоплазмоз, трипаносомозы и др.

Размеры простейших чаще от 2 до 50 мк. Форма тела простейших сильно варьирует. Тело простейших состоит из протоплазмы, ядра и органелл. Некоторые простейшие имеют наружный скелет в виде раковины или панциря, а у других простейших имеется внутренний скелет, состоящий из различных по форме кремниевых игл или фибрилл. Простейшие являются одновременно и клеткой и самостоятельным организмом, которому свойственны все жизненные функции: обмен веществ, раздражение, движение, размножение и т. д.



**Рис. Простейшие, обитающие в тонкой и толстой кишке: а - лямблия; б - цисты лямблии; в - дизентерийная амеба; г - кишечная трихомонада; д - балантидий кишечный: 1 - трофозоиты, 2- цисты.**

Жизненные циклы простейших разнообразны и иногда достигают высокой степени сложности (например, малярийный плазмодий). Некоторые простейшие образуют покоящиеся стадии. Размножаются простейшие бесполом (делением на 2 или большее число клеток) или половым путем. Половое размножение может сопровождаться сменой хозяев.

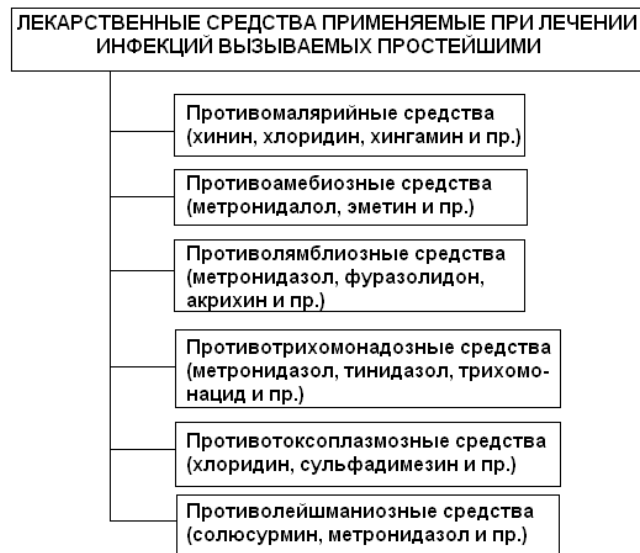
Методы изучения простейших многообразны — применяют нативные препараты, методы обогащения, готовят из простейших культуры. Для диагностики ряда заболеваний, вызываемых патогенными простейшими (токсоплазмоз, малярия, амебиаз и др.), применяют серологические и аллергологические методы исследования, широко используются достижения в области цитологии, гистологии, электронной микроскопии, биохимии и др.

### Лекарственные средства применяемые при лечении инфекций вызываемых простейшими

Лекарственные средства, применяемые при лечении заболеваний вызываемых простейшими делят на группы в зависимости от вида возбудителя болезни и заболевания которое вызывает данный возбудитель. Так, данные лекарственные средства делят на:

1. Противомаларийные (хинин, хлоридин, хингамин, примахин, мефлохин и пр.);

2. Противоамебиозные (метронидазол, эметин и пр.);
3. Противолямблиозные (метронидазол, фуразолидон, акрихин);
4. Противотрихомонадозные (метронидазол, тинидазол, трихомонацид и пр.);
5. Противотоксоплазмозные (хлоридин, сульфадимезин и пр.);
6. Противолейшманиозные (соллюсурмин, метронидазол);



### Противомалярийные средства

Малярия – тяжелое инфекционное заболевание, возбудителем которого является малярийный плазмодий. Малярия (Средние века итал. *mala aria* — «плохой воздух», ранее известная как «болотная лихорадка») — группа трансмиссивных инфекционных заболеваний, передаваемых человеку при укусах комаров рода *Anopheles* («малярийных комаров»), сопровождается крайне тяжелыми симптомами и последствиями. При несвоевременном лечении или его отсутствии заболевание может привести к смерти больного.

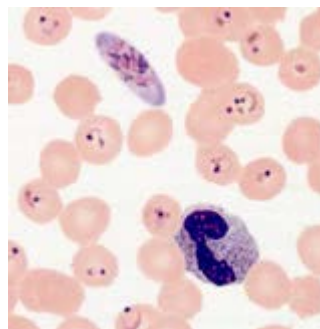


Рис. Плазмодии тропической малярии в эритроцитах и гаметоцит.

Выделяют несколько форм малярии: трехдневную; четырехдневную, тропическую; а также африканскую форму малярии.

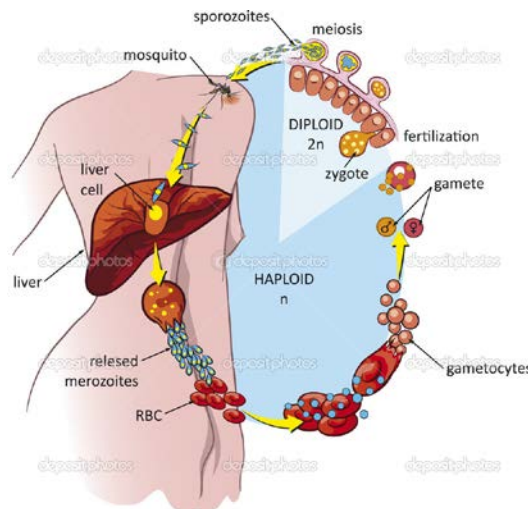
Характерными признаками малярии являются: крайне высокая температура (свыше  $40^{\circ}\text{C}$ ), лихорадка сопровождающаяся ознобом, поражением селезенки и печени, нарушением процесса кроветворения

(анемия, лейкопения) и пр. Развитие заболевания при отсутствии лечения приводит к малярийной коме, в результате которой наступает потеря сознания, судороги и смерть больного.

Малярия имела чрезвычайно широкое распространение в Европе вплоть до XX века. В настоящее время это заболевание достаточно часто встречается в странах Азии, Африки и Латинской Америки. В Европе, в том числе в Украине, заболевание малярией носят достаточно редкий, эпизодический характер.

Заболевание малярией проходит несколько стадий. При укусе зараженного комара в кровь человека попадают спорозоиты (одна из форм малярийного плазмодия). Из крови спорозоиты попадают в печень, в клетках которой размножаются образуя молодые формы плазмодиев – первичные тканевые мерозоиты. Большая часть тканевых мерозоитов попадает в кровь и внедряется в эритроциты. В эритроцитах крови (эритроцитарные мерозоиты) начинают интенсивно размножаться, вследствие чего эритроциты разрушаются. Размножившиеся мерозоиты внедряются в новые эритроциты, повторяя цикл развития эритроцитарной формы плазмодия.

Часть эритроцитарных мерозоитов вновь попадает в печень, где повторяет тканевой цикл развития плазмодиев (вторичные мерозоиты), т.е. цикл развития мерозоитов повторяется вновь.



**Рис. Цикл развития малярийного плазмодия**

При разрушении эритроцитов в течении короткого промежутка времени в кровь выделяется значительное количество токсических веществ (пирогенные вещества) – продуктов разложения погибшего плазмодия и эритроцитов, продуктов жизнедеятельности плазмодия и пр., что является причиной значительного повышения температуры и приступов лихорадки. Часть эритроцитарных мерозоитов в результате этого цикла развития мерозоитов трансформируются в «гаметы» - половые формы плазмодиев. При попадании в желудок комара гаметы проходят половой цикл развития, а

результате чего образуется большое количество спорозоитов, которые становятся источником заражения здоровых людей.

Таким образом, одновременно в организме больного малярией могут находиться эритроцитарные и тканевые формы плазмодия, а также половые клетки гамет.

### Противомалярийные средства

В настоящее время существует значительное количество противомалярийных лекарственных препаратов, которые однако проявляют неодинаковую активность в отношении различных видов малярийного плазмодия и гамет.

Сравнительная характеристика противомалярийных средств

Препараты	Формы плазмодиев		
	тканевые	эритроцитарные	половые
Бигумаль	+++	1	+++
Хлоридин	+++		+++
Акрихин	—		++
Хингамин	—		++++
Хинин	—		+++
Хиноид	+++	2	—
Примахин	+++		—

Примечание. Число знаков (+) показывает степень активности, знак (-) — эффект практически отсутствует; 1 — первичные тканевые формы; 2 — вторичные тканевые формы.

Так, на эритроцитарные формы плазмодиев эффективно действует хинин, хингамин и акрихин, что снимает симптомы лихорадки, значительно снижает температуру тела, устраняет прочие симптомы обострения заболевания. Вместе с тем, эти препараты не оказывают влияние на тканевые формы плазмодия.

Такие лекарственные средства, как хлоридин, бигумаль, хиноид, примахин эффективны в отношении тканевых форм плазмодия, а также в отношении гамет. Поэтому, для эффективного лечения заболевания и предупреждения рецидивов необходимо применение комбинации различных лекарственных препаратов, действующих на различные формы плазмодия и гамет. Хорошие результаты при лечении малярии дают лекарственные препараты некоторых других фармакологических групп, например, сульфаниламидные средства.

Долгое время малярия являлась неизлечимой болезнью. Первым эффективным противомалярийным лекарственным средством стал хинин — алкалоид коры хинного дерева, произрастающего в Южной Америке. Хинин на протяжении длительного времени оставался единственным лекарственным средством для лечения малярии.

Вместе с тем, применение хинина не избавляло больного от рецидивов заболевания, поскольку это лекарственное средство способно подавлять

только эритроцитарные формы плазмодиев, на тканевые же формы и гаметы хинин практически не влияет. Кроме того, хинин обладает достаточно высокой токсичностью: вызывает гемоли эритроцитов, угнетает сердечную деятельность, при его применении у больного ухудшается зрение и слух.

В настоящее время существует ряд противомаларийных лекарственных средств, достаточно эффективно действующих на все формы малярийного плазмодия и гаметы, которые практически вытеснили из употребления хинин.

Лекарственный препарат акрихин сходен по фармакологическому действию с хинином, оказывая влияние на эритроцитарные формы плазмодиев, но при этом менее токсичен. Кроме того, акрихин эффективен при лечении инфекций вызываемых простейшими (лямблиозе, лейшманиозе), а также в качестве противоглистного средства.

Вместе с тем, акрихин проявляет ряд негативных побочных эффектов, ограничивающих применение этого средства. Так, акрихин возбуждающе действует на центральную нервную систему вызывая нарушение психики, сопровождающееся появлением галлюцинаций, а также двигательное и речевое возбуждение. При применении акрихина кожа и слизистые оболочки окрашиваются в желтый цвет, который исчезает после отмены препарата. Лекарственный препарат противопоказан при психических расстройствах, болезнях печени и почек.

Лекарственное противомаларийное средство - хингамин действует на эритроцитарные формы плазмодиев, а также на некоторые формы простейшие (например, применяется при лечении амебной дизентерии). Препарат эффективен при лечении ревматизма. При применении препарата могут возникнуть головные боли, диспепсия, а также дерматиты и ухудшение зрения.

Лекарственное средство хлоридин активен в отношении эритроцитарных форм плазмодия и гамет, действует медленнее хингамина, но сохраняется в организме в течении 2 недель. Хингамин также вызывает ряд побочных эффектов: головокружение, головную боль, боль в области сердца, диспепсию и пр.

Лекарственное средство бигумаль обладает широким спектром действия в отношении различных форм плазмодия и гамет и не вызывает значительных побочных эффектов. Препарат применяется для лечения и профилактики тропической малярии. Вместе с тем, у плазмодиев достаточно быстро развивается устойчивость (резистентность) к препарату.

Лекарственное противомаларийное средство хиноцид действует преимущественно тканевые формы плазмодия и гаметы. Хиноцид обладает достаточно высокой токсичностью, проявляя ряд нежелательных побочных действий (гемолиз эритроцитов, нарушение функции мочевыводящей системы, головные боли и пр.).

### **Противоамебные средства**

Дизентерийная амёба (лат. *Entamoeba histolytica*) — вид паразитических протозоа класса амёб. Вызывает тяжёлое заболевание — амёбиаз (амёбную дизентерию, амёбный колит). Размером дизентерийная амёба мельче обыкновенной амёбы (*Amoeba proteus*), и отличается большей подвижностью.

Может существовать в трёх формах: тканевой, просветной и цисты. Тканевая форма обнаруживается только у больных амёбиазом, другие — и у носителей. Заражение наступает при попадании цист в верхний отдел толстого кишечника (слепая и восходящая ободочная кишка). Здесь цисты превращаются в просветные формы и глубоко внедряются в ткань кишки (тканевая форма), что сопровождается воспалением и формированием язв.

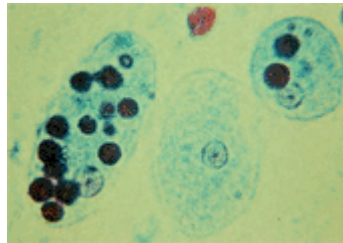


Рис. Дизентерийная амёба

Симптомами амёбной дизентерии является сильные боли в области кишечника, кровавый понос, что характерно для бактериальной дизентерии. Однако, в отличие от бактериальной дизентерии амёба проникает глубоко в стенку толстого кишечника, а также распространяться и в другие органы организма (печень, легкие пр.), вызывая воспалительные заболевания этих органов: гепатит, холецистит, абсцесс легких и пр.

Для лечения амёбиаза применяются такие лекарственные средства, как метронидазол, эметина гидрохлорид, хинофон. Эффективными являются антибиотики из группы тетрациклина, а также хингамин (противомалярийное средство).

### Средства для лечения лямблиоза и хламидиоза

Лямблиоз - широко распространенное заболевание, течение которого может варьироваться от субклинической до тяжелой формы и возникает вследствие поражения лямблиями тонкого кишечника и протоков желчного пузыря. У человека паразитирует один вид – *L. intestinalis*. По виду относится к простейшим паразитам.

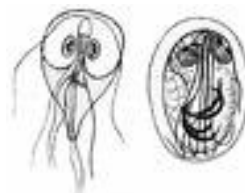


Рис. Лямблии

В организме человека лямблии размножаются в огромном количестве (до 900 миллионов цист за сутки). При этом в тонком кишечнике человека на

одном квадратном сантиметре может паразитировать до 1 миллиона лямблий.

В организме человека лямблии существуют в двух формах. В виде вегетативной формы они находятся преимущественно в верхних отделах тонкой кишки, где питаются продуктами расщепления пищи, особенно углеводной (сладости и мучные изделия). При попадании в толстую кишку лямблии превращаются в цисты (споровая форма), которые с испражнениями выделяются во внешнюю среду. Во влажных условиях, в тени, цисты сохраняют свою жизнедеятельность до 70 дней, в почве – до 9-12 дней, а при недостатке влаги 4-5 дней. При массивной инвазии заболевание протекает с выраженной клинической симптоматикой, имеет острое или хроническое течение.

Острый лямблиоз встречается чаще у детей младшего возраста и характеризуется диарейным синдромом в виде типичной острой кишечной инфекции с преимущественным поражением тонкой кишки. Заболевание протекает на фоне нормальной или субфебрильной температуры тела. Длительность процесса составляет не более 5-7 дней.

При лечении лямблиоза эффективны такие лекарственные средства, как метронидазол, фуразолидон, аминохинол и пр.

Хламидиоз относится к заболеваниям, передающимся половым путем. Возбудитель – хламидия (*Chlamydia trachomatis*). При этом заболевании возможно поражение мочеиспускательного канала (уретры), прямой кишки, влагалища, шейки матки и глаз.

В большинстве случаев заражение хламидиозом происходит при половых контактах. При прохождении через родовые пути возможно инфицирование новорожденного с развитием у него конъюнктивита и воспаления легких. Бытовое заражение маловероятно. Это обусловлено тем, что хламидия быстро погибает вне организма человека. Инкубационный период хламидиоза составляет 1-3 нед.

Симптомы хламидиоза у мужчин: выделения из мочеиспускательного канала (чаще всего прозрачные, скудные), боль при мочеиспускании (часто легкая) и пр.

При лечении хламидиоза применяют такие лекарственные средства, как эритромицин, азитромицин, доксициклин, офлоксацин и пр.

### **Средства для лечения трихомонадоза**

Трихомонадоз относится к венерическим заболеваниям и самым распространенным среди инфекционных болезней, передающихся половым путем. Возникает в результате занесения в половые органы влагалищных трихомонад. Инкубационный период длится от 5 до 15 дней. Трихомонадозом чаще болеют женщины.

Основные симптомы трихомонадоза в острой форме: постоянные и обильные пенистые выделения, ощущение жжения и зуда в области наружных половых органов. Иногда встречается болезненность при мочеиспускании, нарушение сна, чувство тяжести внизу живота.



Рис. Трихомонадоз

Первичные очаги поражения трихомонадозом у женщин — влагалище и уретра, у мужчин — мочеиспускательный канал. Болезнь может перейти в хроническую стадию и способствовать развитию эрозии, воспалений, простатита, цистита, активизации хронического пиелонефрита, привести к бесплодию, внематочной беременности, патологии новорожденных и целому ряду других тяжелых последствий.

Для лечения трихомонадоза эффективны такие лекарственные средства, как фуразолидон, трихомонацид, тинидазол и пр.

### Средства для лечения токсоплазмоза

Токсоплазмоз — это заболевание, вызываемое одноклеточным паразитом токсоплазмой (*Toxoplasma gondii*). Заболевание достаточно широко распространено по всему миру.

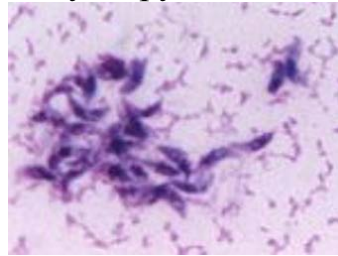


Рис. Токсоплазмы

Источником токсоплазмоза являются кошки. Половое размножение токсоплазм происходит только в клетках, выстилающих кишечник котом. Яйца токсоплазм (ооцисты) выделяются с калом животного и могут быть проглочены домашним скотом и другими животными.

Инфицирование людей происходит при близком общении с кошкой, при употреблении инфицированного сырого мяса, а также при контакте с почвой, содержащей ооцисты, которые попали туда с кошачьими фекалиями.

Симптомами легкого лимфатического токсоплазмоза являются увеличение лимфатических узлов шеи и подмышечных областей, чувство общего недомогания, боль в мышцах, периодическое повышение температуры. Возможны легкая анемия, снижение артериального давления, увеличение числа лимфоцитов и снижение уровня лейкоцитов в крови.

При хроническом токсоплазмозе наблюдается воспаление внутренних структур глаза. Острый диссеминированный токсоплазмоз проявляется в виде сыпи, повышенной температуры и выраженного истощения.

Для лечения токсоплазмоза применяются сульфаниламидные препараты, хлоридин, аминохинол и пр.



### Средства для лечения лейшманиоза

Лейшманиоз – общее название инфекций, вызываемых внутриклеточно паразитирующими жгутиковыми простейшими рода *Leishmania*. Переносчики лейшманиоза – самки moskitov.

Проявления заболевания формируются через 3–12 месяцев после заражения.



Рис. Лейшманиоз

Различают две формы лейшманиоза – висцеральный и кожный. Возбудителем лейшманиоза являются одноклеточные микроорганизмы, относящиеся к простейшим, переносчиком – москиты (комары).

Симптомами заболевания (наблюдают преимущественно у детей) являются: острое начало с высокой температурой тела и увеличением лимфатических узлов.

Лихорадочные приступы продолжаются, постепенно угасая, в течение 2–8 недель. Затем приступы проявляются с нерегулярными интервалами. Добавляется диарея; увеличивается печень и селезенка; наблюдаются отеки. У лиц со слабой пигментацией кожи возможны сероватые пятна на лице и голове. Нередка анемия.

Лейшманиоз кожный Нового Света (лейшманиоз кожно-слизистый, лейшманиоз слизистых оболочек, лейшманиоз американский). Обычно регистрируют у рабочих, занятых на лесных и дорожных работах, среди населения лесных поселков. Признаки кожного лейшманиоза появляются через 1–4 недели после укуса переносчика.

При кожном лейшманиозе наблюдаются деформирующие поражения рта и носа, распространяющиеся на соседние участки с появлением грибовидных и эрозивных язв на языке, слизистой щек, носа, различных участках тела. Возможны рецидивы через несколько лет после самостоятельного исчезновения первичных очагов. Наблюдают разрушение носовой перегородки, твердого неба и поражения глотки. Заболевание сопровождается лихорадкой, снижение веса.

Для лечения лейшманиоза применяют такие лекарственные средства как препараты сурьмы соллюсурмин (вводится внутривенно) и натрия стиболоконат, а также мономицин (обладает широким спектром антимикробного действия) и раствор акрихина местно.

К лекарственным средствам широкого спектра действия, применяемых для лечения протозойных и других инфекций вызываемых простейшими относится метронидазол или трихопол. Этот лекарственный препарат эффективен в отношении амёб, трихомонад, лямблий и пр. Препарат хорошо всасывается и выделяется почками в неизменном виде, поэтому

эффективен при лечении инфекций мочевыводящих путей. Метронидазол, как правило, не проявляет побочных действий, но, в некоторых случаях при его применении могут возникнуть головные боли, диспепсия, сухость во рту, аллергические реакции. Препарат противопоказан при заболеваниях центральной нервной системы.

### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

#### 1. Хингамин (Chingaminum);

**Групповая принадлежность:** Противомаларийное средство

**Фармакологическое действие:** Хингамин быстро вызывает гибель бесполой эритроцитарных форм всех видов плазмодиев (возбудителей малярии, находящихся в стадии развития, протекающей в эритроцитах человека). Действует также гамонтоцидно (уничтожает половые формы возбудителя малярии). Препарат хорошо и быстро всасывается и медленно выделяется из организма.

**Показания к применению:** Применяют для лечения острых проявлений всех видов малярии и химиопрофилактики. Спектр действия хингамина не ограничивается влиянием на малярийный плазмодий. Он оказывает тормозящее действие на синтез нуклеиновых кислот (соединений, ответственных в клетке за перенос наследственной информации), активность некоторых ферментов, иммунологические процессы. Препарат широко применяют при лечении коллагенозов (диффузных заболеваний соединительной ткани): системной красной волчанки, склеродермии и особенно ревматоидного артрита (инфекционно-аллергической болезни из группы коллагенозов, характеризующейся хроническим прогрессирующим воспалением суставов), при котором он рассматривается как один из базисных препаратов.

**Способ применения:** При лечении малярии назначают хингамин внутрь (после еды) взрослым по 2,0-2,5 г на курс лечения. На первый прием дают 1 г (4 таблетки по 0,25 г), через 6-8 ч - 0,5 г, во 2-й и 3-й дни - по 0,5 г в 1 прием. Дополнительно назначают 0,5 г хингамина в 1-й день лечения, преимущественно при тропической малярии. При тропической малярии лечение может продолжаться 5 дней; на 4-й и 5-й дни дают по 0,5 г в 1 прием. Высшие дозы для взрослых при приеме внутрь: разовая - 0,5 г, суточная - 1,5 г.

Обычно препарат принимают внутрь, однако при злокачественном течении малярии лечение начинают с внутримышечного введения. Разовая доза для взрослого 10 мл 5% раствора; при необходимости повторяют инъекции с промежутком 6-8 ч, но не более 3 раз (не выше 30 мл). Внутривенно вводят только в особо тяжелых случаях: 10 мл 5% раствора разводят в 10-20 мл 40% раствора глюкозы или изотонического раствора натрия хлорида. Вводят в вену медленно. После улучшения состояния больного прекращают инъекции и переходят на прием препарата внутрь.

**Побочные действия:** Кратковременное применение хингамина внутрь в терапевтических дозах обычно переносится без выраженных побочных явлений. При длительном приеме возможно появление дерматита (воспаления кожи), часто в виде красновато-фиолетовых папул (форменных элементов сыпи, представляющих собой бесполое образование, выступающее над поверхностью тела), напоминающих красный лишай и расположенных на разгибательной поверхности конечностей и туловище. Могут возникнуть головокружение, головная боль, тошнота, иногда рвота, шум в ушах, нарушение аккомодации (нарушение зрительного восприятия). Обычно эти явления проходят самостоятельно. Могут также наблюдаться уменьшение аппетита, боли в животе (в связи с раздражением слизистой оболочки желудка); у некоторых больных - временное снижение массы тела. Возможны умеренная лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), снижение остроты зрения, мелькание в глазах, отложение пигмента в роговице (прозрачной оболочке глаза). Большие дозы хингамина могут вызывать поражение печени, дистрофические изменения миокарда (изменения сердечной мышцы, связанные с нарушением питания), поседение волос, ретинопатию (невоспалительные поражения сетчатки глаза). При назначении хингамина в комбинации с другими препаратами (салицилатами, кортикостероидами и др.) следует учитывать возможность усиления явлений поражения кожных покровов (дерматит).

**Противопоказания:** Тяжелые заболевания сердца, диффузное поражение почек, нарушения функции печени, болезнь кроветворных органов.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г; порошок; 5% раствор в ампулах по 5 мл.

#### 2. Мебендазол Мебендазол Амеда (Mebendazole / Mebendazole Ameda);

**Групповая принадлежность:** Антигельминтный лекарственный препарат.

**Фармакологическое действие:** Мебендазол – синтетический антигельминтный лекарственный препарат. Мебендазол имеет широкий спектр противоглистной активности. При приеме мебендазола отмечается изменение энергетических процессов гельминтов, в частности препарат приводит к дегенеративным процессам в цитоплазматических микротубулах, нарушению усвоения глюкозы и замедлению синтеза АПФ в организме гельминтов. Мебендазол наиболее эффективен при инфекциях, обусловленных кишечными

нематодами, а также некоторых других гельминтозах. Отмечается активность мебендазола относительно *Ascaris lumbricoides* (до 98 %), *Necator americanus* (до 96 %), *Enterobius vermicularis* (до 95 %), *Trichuris trichiura* (до 68 %) и *Ancylostoma duodenale*.

**Показания к применению:** Мебендазол и Мебендазол Амеда применяют для лечения пациентов, страдающих аскаридозом, трихоцефалозом, энтеробиозом, стронгилоидозом, тениозом и анкилостомидозом. Мебендазол также может применяться в лечении смешанных глистных инвазий. Способ применения: Мебендазол принимают перорально. Таблетки Мебендазол следует глотать целиком, измельчать или добавлять в пищу, запивая достаточным количеством жидкости. Жевательные таблетки Мебендазол измельчают непосредственно перед приемом или разжевывают, запивая небольшим количеством жидкости. В период лечения мебендазолом нет необходимости придерживаться диеты или принимать дополнительно слабительные средства. Продолжительность лечения и дозы мебендазола определяет врач. При энтеробиозе обычно рекомендуется прием 100 мг мебендазола однократно. Повторный прием той же дозы проводят через 2-4 недели.

**Побочные действия:** Мебендазол, как правило, неплохо переносится. Побочные эффекты развиваются редко, однако при приеме мебендазола нельзя исключать такое влияние: На нервную систему: головная боль, повышенная утомляемость, головокружение. На пищеварительную систему: боль в эпигастральной и абдоминальной области, нарушения стула. Аллергические реакции: гипертермия, крапивница, отек Квинке, судороги.

**Форма выпуска:** Таблетки Мебендазол, расфасованные в блистерные упаковки по 6 штук, в пачку из картона вложена 1 блистерная упаковка. Таблетки жевательные Мебендазол Амеда, расфасованные в блистерные упаковки по 6 штук, в пачку из картона вложена 1 блистерная упаковка.

### 3. Нафтамон (Naphthamoni);

**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Препарат вызывает контрактуру (стойкое сокращение) мускулатуры паразитов, что способствует их удалению из кишечника. Оболочка из ацетилфталилцеллюлозы, покрывающая таблетки нафтамона "К", обеспечивает их распадаемость в двенадцатиперстной кишке или в верхних отделах тонкой кишки, поэтому препарат оказывает антигельминтное (направленное на уничтожение глистов /паразитарных червей/) действие на всем протяжении кишечника, а таблетки нафтамона, растворимые в кишечнике, в отличие от таблеток нафтамона "К", распадаются в нижнем отделе тонкой кишки или в верхнем отделе толстой кишки, т.е. в месте основной локализации власоглава (паразитарного червя, обитающего в тонкой кишке человека, возбудителя трихоцефалеза). В связи с этими особенностями таблетки нафтамона "К" применяют при аскаридозах (заболевании, вызываемом кишечными паразитарными червями - аскаридами), анкилостомидозах (заболевании, вызываемом паразитарными червями, приводящем к развитию анемий /уменьшению числа эритроцитов в крови/) и трихостронгилоидозах (заболевании, вызываемом кишечными паразитарными червями /глистами/), а также при сочетании этих инвазий (заражения глистами) с трихоцефалезом (заболеванием кишечника, вызываемом кишечным паразитом - власоглавом), а таблетки нафтамона, растворимые в кишечнике, - только при трихоцефалезе.

**Показания к применению:** Применяют при лечении аскаридоза, анкилостомидоза, энтеробиоза (заболевания, вызываемого кишечными паразитарными червями - острицами), трихостронгилоидоза, трихоцефалеза.

**Способ применения:** Оба вида таблеток принимают внутрь, не разжевывая, натощак, за 2 ч до завтрака и запивают водой. Предварительной подготовки и соблюдения диеты не требуется, однако желательно ограничить употребление острых, соленых и жирных продуктов и молока. В связи с тем, что препарат оказывает послабляющее действие, слабительное после его приема обычно не назначают. Взрослым и детям старше 10 лет дают 5 г препарата (10 таблеток), детям от 3 до 5 лет - 2,0-2,5 г (4-5 таблеток), от 6 до 7 лет - 3 г (6 таблеток), от 8 до 9 лет - 4 г (8 таблеток). Высшая разовая и суточная дозы внутрь для взрослых 5 г; для детей 3-5 лет - 2,5 г, 6-7 лет - 3 г, 8-9 лет - 4 г, 10-14 лет - 5г. Принимают препарат в течение 3-5 дней. При необходимости лечение повторяют через 2-3 нед.

**Побочные действия:** При применении нафтамона возможны тошнота, рвота, частый стул. Эти явления проходят после прекращения приема препарата.

**Противопоказания:** Нарушение функции печени.

**Форма выпуска:** Таблетки нафтамона "К", покрытые оболочкой и таблетки нафтамона, растворимые в кишечнике, содержат по 0,5 гр. нафтамона.

### 4. Бигумаль (Bigumalum);

**Групповая принадлежность:** Противомаларийное средство

**Фармакологическое действие:** По типу действия на малярийных плазмодиев (внутриклеточный паразит, вызывающий малярию) бигумаль близок к хлоридину. Длительность действия меньше по сравнению с хлоридином. Эффект наступает медленнее, чем при применении хингамина и акрихина. В связи с относительно медленным наступлением эффекта, быстрым выделением из организма и быстрым развитием

лекарственной устойчивости к нему малярийных плазмодиев бигумаль используют ограниченно. При лечении тропической малярии его назначают только при средней степени тяжести.

**Показания к применению:** Малярия всех видов, профилактика и лечение.

**Способ применения:** Принимают внутрь после еды, запивают водой (1/4 - 1/2 стакана). На курс (4-5 дней) назначают взрослым 1,5 г по следующей схеме: в 1-й день суточная доза 0,6 г в 2 приема с интервалом 6 ч; 2-4-й дни - суточная доза 0,3 г в 1 прием. В 1-й день суточная доза может быть 0,3 г; в этом случае курс лечения продолжается 5 дней. При тяжелом течении заболевания лечение может продолжаться до 7 дней; суточная доза со 2-го по 7-й день составляет 0,3 г (в 1 прием). Высшие дозы бигумалья для взрослых внутрь: разовая - 0,3 г, суточная - 0,6 г. Детям дозу уменьшают в соответствии с возрастом. Суточная доза составляет: для детей до 1 года - 0,025 г; 1-2 лет - 0,05 г; 2-4 лет - 0,075 г; 4-6 лет - 0,1 г; 6-8 лет - 0,15 г; 8-12 лет - 0,15-0,2 г; 12-16 лет - 0,25 г; старше 16 лет - 0,3 г. Курс лечения - 5 дней. Суточную дозу назначают в один прием.

**Побочные действия:** Бигумаль обычно хорошо переносится. Иногда кратковременно увеличивается количество лейкоцитов (форменных элементов крови) в периферической крови и появляются молодые формы нейтрофилов (форменных элементов крови), а в моче обнаруживаются в небольшом количестве эритроциты (форменные элементы крови, переносящие кислород). Длительное применение бигумалья может вызвать угнетение желудочной секреции и потерю аппетита, что чаще возникает при приеме препарата натощак. Недостатками бигумалья являются медленное действие, быстрое выведение из организма и быстрое развитие к нему устойчивости малярийных плазмодиев.

**Форма выпуска:** Таблетки и драже по 0,1 г для взрослых и 0,05 г для детей; порошок.

## 5. Пирантел (Pyrantel);



**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Антигельминтное (уничтожающее глистов /паразитарных червей/) средство. Поражает мышцы кишечных паразитов, блокируя в них двигательные нервные окончания. Действует на паразитов в ранней фазе развития и на их зрелые формы.

**Показания к применению:** Аскаридоз (заболевание, вызываемое кишечными паразитарными червями - аскаридами), энтеробиоз (заболевание, вызываемое кишечными паразитарными червями - острицами), анкилостомидоз (заболевание, вызываемое паразитарными червями, приводящее к развитию анемий /уменьшению числа эритроцитов в крови/).

**Способ применения:** Принимают препарат внутрь (без приема слабительного) 1 раз в день (после завтрака) в виде таблеток или сиропа. Таблетки перед проглатыванием следует тщательно разжевать. При энтеробиозе и аскаридозе назначают однократно из расчета 10 мг/кг; при некаторозе (заболевании кишечника, вызываемом глистами) и сочетании некатороза с аскаридозом - по 10 мг/кг в течение 3 дней или по 20 мг/кг в течение 2 дней.

**Побочные действия:** Хорошо переносится больными. В отдельных случаях возможны тошнота, рвота, понос.

**Противопоказания:** Беременность.

**Форма выпуска:** Суспензия в упаковке по 15 мл. Таблетки по 0,125 и 0,25 г в упаковке по 3 штуки.

## 6. Фенасал (Phenasalum);

**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Препарат обладает противоглистной активностью.

**Показания к применению:** Применяют как противоглистное средство при тениаринхозе (инвазии /заражении/) бычьим, или невооруженным, цепнем), дифиллоботриозе (инвазии широким лентецом) и гименолепидозе (инвазии карликовым цепнем). По современным данным, фенасал является одним из наилучших противотениаринхозных средств (противоглистных средств при тениаринхозе).

**Способ применения:** Назначают фенасал внутрь в следующих суточных дозах: взрослым 2-3 г (8-12 таблеток); детям до 2 лет - 0,5 г (2 таблетки), от 2 до 5 лет - 1 г (4 таблетки), от 5 до 12 лет - 1,5 г (6 таблеток), старше 12 лет - 2-3 г (8-12 таблеток). При тениаринхозе и дифиллоботриозе принимают препарат утром натощак или вечером через 3-4 ч после легкого ужина. В день лечения рекомендуется жидкая или полужидкая, легкоусвояемая обезжиренная пища (жидкие каши, пюре, кисели, фруктовые соки и др.). Перед приемом фенасала дают 2 г натрия гидрокарбоната (питьевой соды). Суточную дозу фенасала принимают однократно. Таблетки тщательно разжевывают или тщательно размельчают в теплой воде (1 таблетку в 1/4 стакана теплой воды). Через 2 ч выпивают стакан сладкого чая с сухарями или печеньем. Слабительное не назначают. При гименолепидозе суточную дозу фенасала делят на 4 разовые дозы, принимают через каждые 2 ч (в 10, 12, 14 и 16 ч). Пищу принимают в 8, 13 и 18 ч. Фенасал назначают в

течение 4 дней. Через 4 дня курс лечения повторяют. Контрольное исследование проводят через 15 дней после окончания лечения и в последующем ежемесячно. При рецидиве заболевания (повторном появлении признаков болезни) лечение по указанной схеме повторяют; контрольные исследования проводят в течение 6 мес., а в упорных случаях - до 12 мес.

**Побочные действия:** Обычно фенасал хорошо переносится, но возможны тошнота, аллергические реакции, обострение нейродермита (заболевания кожи, обусловленного нарушением функции центральной нервной системы).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковке по 30 или 60 штук.

## 7. Тинидазол (Tinidazolium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное и противопротозойное средство

**Фармакологическое действие:** Препарат подавляет развитие *Trichomonas vaginalis* (вида простейших /одноклеточных/ организмов, паразитирующих в органах мочеполовой системы человека; передаются, как правило, половым путем), *Entamoeba histolytica* (вида амёб -простейших /одноклеточных/ организмов - вызывающего инфекционное заболевание, характеризующееся хроническим воспалением толстой кишки с образованием язв) и лямблий (вида простейших /одноклеточных/ организмов, паразитирующих в тонком кишечнике человека). При приеме внутрь быстро всасывается и из-за высокой липофильности (средства к жирам) легко проникает в трихомонады (одноклеточные паразиты). Препарат накапливается в крови и медленно выводится из организма почками за счет обратного всасывания в почечных канальцах.

**Показания к применению:** Острый и хронический трихомоноз (заболевание мочеполовой сферы, вызываемое трихомонадами) у женщин и мужчин. Лямблиоз (заболевание тонкого кишечника, вызванное лямблиями).

**Способ применения:** Для лечения трихомоноза мужчины и женщины принимают таблетки тинидазола внутрь по 0,5 г по одной из следующих схем: 1) однократно в дозе 2 г; 2) в той же дозе по 0,5 г через каждые 15 мин в течение часа (4 приема); 3) по 0,15 г 2 раза в день ежедневно в течение недели. Детям дают из расчета 50-60 мг/кг. При лямблиозе (заболевании, вызванном простейшими одноклеточными организмами, паразитирующими в тонком кишечнике человека) назначают в дозе 2 г (4 таблетки) однократно через 40-50 мин после завтрака или по 0,3 г в сутки в течение 7 дней, причем при упорном течении заболевания проводят 6-7 курсов. При амёбной дизентерии - по 1,5 г (3 таблетки) 1 раз в день в течение 3 дней.

**Побочные действия:** В отдельных случаях возможны умеренная лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), головное жужжание, нарушение координации движений, в единичных случаях аллергические реакции.

**Противопоказания:** Нарушение кроветворения, заболевания центральной нервной системы в активной фазе, первые 3 мес. беременности; препарат назначают с осторожностью в последующие месяцы беременности и в период кормления грудью. Во время лечения запрещается употребление алкогольных напитков во избежание спазма органов брюшной полости, тошноты, рвоты, не рекомендуется назначать с этионоmidом.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,5 г в упаковке по 4 штуки.

## 8. Примахин (Primachinum);

**Групповая принадлежность:** Противомаларийное средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает антипротозойное (направленное на уничтожение простейших /одноклеточных/ организмов) действие на половые формы, шизонты (клетки, образующиеся на стадии бесполого размножения возбудителя малярии) и паразитроцитарные формы всех видов малярийных плазмодиев (возбудители малярии, находящиеся в стадии развития, протекающей вне эритроцитов человека). Показания к применению: Трехдневная, четырехдневная и тропическая малярия. Профилактика отдаленных рецидивов (повторного появления признаков болезни).

**Способ применения:** Внутрь, суточная доза для взрослых 0,027 г. Курс лечения 14 дней. Суточная доза для детей до 1 года - 0,00225 г (1/4 таблетки), 1-2 лет - 0,0045 г (1/2 таблетки), 2-4 лет - 0,0075 г (3/4 таблетки), 4-7 лет - 0,009 г (1 таблетка), 7-12 лет - 0,0135 г (1 1/2 таблетки), 12-15 лет - 0,018 г (2 таблетки), старше 15 лет - 0,027 г (3 таблетки).

**Побочные действия:** Боли в животе, диспепсические явления (расстройства пищеварения), общая слабость, боли в области сердца, цианоз (посинение кожи и слизистых оболочек), метгемоглобинемия (повышенное содержание в крови метгемоглобина - производного гемоглобина, неспособного переносить кислород), анемия (снижение содержания гемоглобина в крови), лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), гемолиз (разрушение) эритроцитов (форменных элементов крови, переносящих кислород).

**Противопоказания:** Заболевания крови и кроветворных органов, болезни почек, стенокардия, ревматизм, красная волчанка. Нельзя назначать примахин одновременно с препаратами, угнетающими кроветворение.

**Форма выпуска:** Драже по 0,009 г в упаковке по 100 штук.

### 9. Левамизол (Levamisolum);

**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Первоначально этот препарат был предложен в качестве противоглистного средства. При изучении антигельминтного (направленного на уничтожение паразитарных червей) действия левамизола было обнаружено, что он повышает общую сопротивляемость организма и может быть использован как средство для иммунотерапии.

**Показания к применению:** В связи с этими свойствами левамизол был предложен для лечения различных заболеваний, в патогенезе (в механизме развития) которых придают значение расстройствам иммуногенеза (процесса формирования защитных сил организма): первичные и вторичные иммунодефицитные состояния (снижение или отсутствие защитных сил организма), аутоиммунные болезни (болезни, в основе которых лежат аллергические реакции на собственные ткани или продукты жизнедеятельности организма), хронические и рецидивирующие (повторяющиеся) инфекции, опухоли и др.

**Способ применения:** Препарат относится к базисным средствам (основным средствам лечения), действует при длительном применении; эффект развивается медленно (начиная примерно с 3-го месяца). Назначают препарат внутрь в суточной дозе 150 мг ежедневно (иногда дают прерывистыми курсами по 3 последующих дня в неделю). Терапевтический эффект отмечается также у больных с хроническими неспецифическими заболеваниями легких, получающих по 150 мг левамизола через день или по 100 мг в день.

**Побочные действия:** Препарат может вызывать различные побочные явления. При однократном применении (для лечения гельминтозов /болезней, вызываемых паразитарными червями/) выраженных явлений не отмечено, однако при повторном применении могут наблюдаться головная боль, нарушения сна, повышение температуры тела, изменение вкусовых ощущений, диспепсические явления (расстройства пищеварения), обонятельные галлюцинации (изменение запахов), аллергические кожные реакции, агранулоцитоз (резкое уменьшение числа гранулоцитов в крови). В процессе лечения левамизолом следует периодически (не менее чем через 3 нед.) проводить анализы крови.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан в случае, если через 10 ч после первого приема в дозе 150 мг количество лейкоцитов (форменных элементов крови) уменьшится ниже 3 млрд/л (или при уменьшении количества нейтрофильных гранулоцитов /вида форменных элементов крови, ответственных за формирование защитных сил организма/до 1 млрд/л).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 и 0,15 г.

### 10. Эметина гидрохлорид (Emetinihydrochloridum);

**Групповая принадлежность:** Противоамебное средство

**Фармакологическое действие:** Эффективен в отношении возбудителя амебной дизентерии и некоторых трематод (плоских червей /глистов/).

**Показания к применению:** Амебная дизентерия.

**Способ применения:** Вводят под кожу или в мышцы взрослым по 1,5 мл 1% раствора 2 раза в сутки. Высшие дозы для взрослых: разовая - 0,05 г (5 мл 1% раствора), суточная - 0,1 г (10 мл 1% раствора). Суточные дозы для детей в зависимости от возраста составляют: от 6 мес. до 1 года - 0,005 г; от 1 года до 2 лет - 0,01 г; от 2 до 5 лет - 0,02 г; от 5 до 9 лет - 0,03 г; от 9 до 15 лет - 0,04 г. Эти дозы нельзя превышать. Детям до 6 мес. эметин не назначают. Продолжительность цикла лечения от 4 до 6 сут., максимум 7-8 сут. Когда стул принимает оформленный или полуоформленный вид, введение эметина прекращают и переходят на другие противоамебные препараты. Доза эметина на курс лечения не должна превышать 0,01 г (10 мг) на 1 кг массы тела больного; в подавляющем большинстве случаев достаточны значительно меньшие дозы препарата. Как правило, эметин назначают только при острых кишечных проявлениях. Ввиду кумулятивных свойств эметина (способности накапливаться в организме) повторять цикл лечения этим препаратом можно не ранее чем через 7-10 сут. после окончания предыдущего цикла.

**Побочные действия:** Возможны тошнота, рвота, боли в мышцах конечностей, сердечная слабость, полиневриты (множественное воспаление периферических нервов).

**Противопоказания:** Детям до 6 мес. не назначают.

**Форма выпуска:** В ампулах по 1 мл 1% раствора в упаковке по 10 штук.

### 11. Хиноцид (Chinocidum);

**Групповая принадлежность:** Противомаларийное средство

**Фармакологическое действие:** Действует на паразитроцитарные тканевые формы малярийного паразита (возбудители малярии, находящиеся в стадии развития, протекающей вне эритроцитов человека), которые обуславливают отдаленные рецидивы (повторное появление признаков болезни). Показания к применению: Для предупреждения отдаленных рецидивов трехдневной и четырехдневной малярии. Препарат оказывает гамотропное действие в отношении половых форм всех видов плазмодиев (действие, направленное на повреждение или уничтожение всех половых форм возбудителя малярии).

**Способ применения:** При тропической малярии назначают после окончания лечения препаратами, не действующими на гамонты (половые формы возбудителя малярии), для предупреждения распространения малярии через комара. Доза на курс лечения для взрослых 0,3 или 0,28 г. При курсовой дозе 0,3 г назначают

по 0,03 г в день в течение 10 дней подряд. При курсовой дозе 0,28 г назначают по 0,02 г в день в течение 14 дней. Высшие дозы для взрослых внутрь: разовая и суточная 0,03 г.

**Побочные действия:** Тошнота, головная боль, цианоз (посинение) губ и ногтевого ложа, раздражение почек и мочевого пузыря, лекарственная лихорадка (резкое повышение температуры тела в ответ на введение хиноцида), небольшой гемолиз (разрушение эритроцитов /форменных элементов крови, переносящих кислород/), лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови) или лейкоцитоз (увеличение числа лейкоцитов в крови).

**Противопоказания:** Заболевания крови и органов кроветворения, заболевания почек, стенокардия. Нельзя назначать одновременно с другими противомаларийными препаратами; соблюдать осторожность при назначении лицам пожилого возраста и ослабленным больным.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,01 г в упаковке по 50 штук.

## 12. Бийохинол (Biiochinolum);

**Групповая принадлежность:** Противосифилитическое средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает лечебное действие при спирохетозах (заболеваниях человека, вызываемых микроорганизмами спиральной формы), а также противовоспалительное и рассасывающее действие.

**Показания к применению:** Все формы сифилиса (в сочетании с препаратами пенициллина); неспецифические поражения центральной нервной системы: арахноэнцефалит (воспаление оболочек и тканей мозга), менин-гомиелит (одновременное воспаление оболочек и тканей спинного мозга) и др.; травмы черепа.

**Способ применения:** Внутримышечно в верхний наружный квадрант ягодицы, двухмоментным способом. Перед инъекцией флакон подогревают в теплой воде и тщательно взбалтывают. При сифилисе - по 3 мл каждый четвертый день. Курсовая доза - 40-50 мл. Высшая разовая доза для взрослых - 3 мл (раз в 3 дня). Детям в соответствии с возрастом. При неспецифических поражениях центральной нервной системы по 2 мл через день. Курсовая доза - 30-40 мл в зависимости от стадии процесса.

**Побочные действия:** Возможны слюнотечение, гингивиты (воспаление слизистой оболочки десны), стоматиты (воспаление слизистой оболочки полости рта), дерматиты (воспаление кожи), висмутовая нефропатия (повреждение почек вследствие лечения бийохинолом), альбуминурия (белок в моче), полиневриты (множественное воспаление периферических нервов) и неврит тройничного нерва (воспаление лицевого нерва).

**Противопоказания:** Возраст до 6 мес. Заболевания почек, печени, геморрагические диатезы (повышенная кровоточивость), тяжелые формы туберкулеза, декомпенсация сердечной деятельности (резкое снижение насосной функции сердца), гингивиты (воспаление слизистой оболочки десны), стоматиты (воспаление слизистой оболочки полости рта), повышенная чувствительность к хинину.

**Форма выпуска:** Во флаконах по 100 г.

## 13. Солюсурмин (Solusurminum);

**Групповая принадлежность:** Противопротозойное средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает антипротозойное действие на лейшмании (действие, направленное на уничтожение простейших /одноклеточных/ организмов-возбудителей лейшманиоза). Показания к применению: Висцеральный и кожный лейшманиоз (повреждение внутренних органов и кожи, вызываемое внутриклеточным паразитом, передающимся человеку посредством укуса москита).

**Способ применения:** Препарат в виде 20% раствора вводят внутривенно. Подкожные инъекции болезненны, иногда образуются инфильтраты (уплотнения). Вводят под кожу только при невозможности введения в вену (отсутствие выраженных поверхностных вен). При висцеральном лейшманиозе (повреждении внутренних органов и кожи, вызываемом внутриклеточным паразитом, передающимся человеку посредством укуса москита) суточная доза составляет от 0,1 до 0,15 г препарата, а курсовая доза - от 1,4 до 1,8 г; доза зависит от возраста и массы тела больного.

**Противопоказания:** Наличие сопутствующего острого инфекционного заболевания, значительная дистрофия, интоксикация вследствие хронических заболеваний, тяжелые поражения внутренних органов, не связанные с лейшманиозом.

**Форма выпуска:** Порошок, 20% раствор во флаконах по 10 мл в упаковке по 10 штук.

## 14. Хлоридин (Chloridinum);

**Групповая принадлежность:** Противомаларийное средство

**Фармакологическое действие:** Эффективен в отношении эритроцитарных форм всех видов возбудителей малярии (возбудителей малярии, находящихся в стадии развития, протекающей в эритроцитах человека /шизонты и гамонты/). Оказывает химиотерапевтическое действие при токсоплазмозе (заболевании, вызванном внутриклеточным паразитом и характеризующемся преимущественным поражением центральной нервной системы, глаз, скелетных мышц, сердца; источник заражения - кошки). Показания к

применению: Малярия - в сочетании с хингином или сульфаниламидами; токсоплазмоз - в сочетании с сульфадимезином.

**Способ применения:** Принимают хлоридин внутрь одновременно с сульфаниламидами или/и хингином, при этом эффективность хлоридина значительно повышается. Детям дают в меньших дозах в соответствии с возрастом. При острых формах малярии принимают препарат в течение 2-4 сут. Для профилактики малярии и лейшманиоза (заболевания, вызываемого внутриклеточным паразитом, передающимся человеку посредством укуса москита) назначают за 3-5 дней до наступления опасности заражения и продолжают давать по 1 разу в неделю в течение всего периода возможного заражения и еще в течение 4-6 нед. При остром и хроническом токсоплазмозе принимают хлоридин циклами по 5 дней с перерывом между ними 7-10 дней. Курс лечения - 2-3 цикла. При необходимости курсы (всего 3) повторяют с промежутком 1-2 мес.

**Побочные действия:** Головная боль, головокружение, боли в области сердца, диспепсические расстройства (расстройства пищеварения), анемия (снижение содержания гемоглобина в крови), лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови).

**Противопоказания:** Заболевания кроветворных органов и почек.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,01 г в упаковке по 10 штук.

#### 15. Хиниофон (Chiniofonum);

**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Оказывает антипротозойное действие (подавление жизнедеятельности простейших организмов) на дизентерийную амёбу, а также антимикробное и антигрибковое действие.

**Показания к применению:** Амебная дизентерия, язвенный колит (воспаление толстой кишки с образованием язв), кишечные инфекции.

**Способ применения:** Внутрь. При амебной дизентерии и язвенном колите внутрь взрослым по 0,5 г 3 раза в день в течение 8-10 дней. Повторный курс через 10 дней. Высшая разовая доза для взрослых внутрь - 1 г, суточная - 3г. Детям суточные дозы устанавливают в соответствии с возрастом: от 1 года до 2 лет - 0,1 г; от 2 до 3 лет - 0,15 г; от 3 до 4 лет - 0,2 г; от 4 до 5 лет - 0,25 г; от 5 до 6 лет - 0,3 г; от 6 до 8 лет - 0,45 г; от 8 до 12 лет - 0,6 г; от 12 до 13 лет - 0,7 г; от 13 до 15 лет - 1,0 г; от 16 лет и старше - 1,5 г.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к йоду.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,25 г в упаковке по 10 штук.

#### 16. Вермокс (Vermox);

**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Антигельминтный препарат широкого спектра действия; наиболее эффективен при энтеробиозе и трихоцефалезе. Вызывая необратимое нарушение утилизации глюкозы, истощает запасы гликогена в тканях гельминтов, препятствует синтезу клеточного тубулина, а также тормозит синтез АТФ.

**Показания к применению:** Аскаридоз (заболевание, вызываемое кишечными паразитарными червями /аскаридами/), энтеробиоз (заболевание, вызываемое кишечными паразитарными червями /острицами/), анкилостомоз (заболевание, вызываемое паразитарными червями, приводящее к развитию анемий /уменьшению числа эритроцитов в крови/) и трихоцефалез (заболевание кишечника, вызываемое паразитарными червями /власоглавами/).

**Способ применения:** При энтеробиозе взрослым и детям назначают 100 мг (1 таб.) препарата однократно. Для предупреждения повторной инвазии прием препарата повторяют через 2 и 4 недели в той же дозе. При аскаридозе, анкилостомидозе, трихоцефалезе, смешанных гельминтозах взрослым и детям старше 1 года назначают по 100 мг 2 раза в сутки (утром и вечером) в течение 3 дней. При тениозе и стронгилоидозе взрослым рекомендуется принимать по 200 мг 2 раза в сутки в течение 3 дней.

**Побочные действия:** Головокружение, тошнота, абдоминальные боли. При применении в высоких дозах в течение длительного времени: рвота, диарея, головная боль, аллергические реакции (кожная сыпь, крапивница, ангионевротический отек), повышение активности "печеночных" трансаминаз, гиперкреатинемия, лейкопения, анемия, эозинофилия, выпадение волос, гематурия, цилиндрурия. Может оказать отрицательное влияние на развитие плода.

**Противопоказания:** Гиперчувствительность, неспецифический язвенный колит, болезнь Крона, печеночная недостаточность, детский возраст (до 2 лет). Беременность: В период беременности, особенно в I триместре, Вермокс следует применять с особой осторожностью, сопоставляя потенциальный риск от назначения препарата с ожидаемым терапевтическим эффектом. В период применения препарата следует прекратить грудное вскармливание.

**Форма выпуска:** Таблетки в упаковке по 6 штук по 100 мг.

#### 17. Примахин (Primachinum);

**Групповая принадлежность:** Противомалярийное средство

**Фармакологическое действие:** Оказывает антипротозойное (направленное на уничтожение простейших /одноклеточных/ организмов) действие на половые формы, шизонты (клетки, образующиеся на стадии бесполого размножения возбудителя малярии) и паразитроцитарные формы всех видов малярийных



плазмодиев (возбудители малярии, находящиеся в стадии развития, протекающей вне эритроцитов человека).

**Показания к применению:** Трехдневная, четырехдневная и тропическая малярия. Профилактика отдаленных рецидивов (повторного появления признаков болезни).

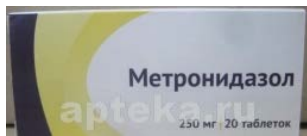
**Способ применения:** Внутрь, суточная доза для взрослых 0,027 г. Курс лечения 14 дней. Суточная доза для детей до 1 года - 0,00225 г (1/4 таблетки), 1-2 лет - 0,0045 г (1/2 таблетки), 2-4 лет - 0,0075 г (3/4 таблетки), 4-7 лет - 0,009 г (1 таблетка), 7-12 лет - 0,0135 г (1 1/2 таблетки), 12-15 лет - 0,018 г (2 таблетки), старше 15 лет - 0,027 г (3 таблетки).

**Побочные действия:** Боли в животе, диспепсические явления (расстройства пищеварения), общая слабость, боли в области сердца, цианоз (посинение кожи и слизистых оболочек), метгемоглобинемия (повышенное содержание в крови метгемоглобина - производного гемоглобина, неспособного переносить кислород), анемия (снижение содержания гемоглобина в крови), лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), гемолиз (разрушение) эритроцитов (форменных элементов крови, переносящих кислород).

**Противопоказания:** Заболевания крови и кроветворных органов, болезни почек, стенокардия, ревматизм, красная волчанка. Нельзя назначать примахин одновременно с препаратами, угнетающими кроветворение.

**Форма выпуска:** Драже по 0,009 г в упаковке по 100 штук.

## 18. Метронидазол (Metronidazolium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное и противопротозойное средство

**Фармакологическое действие:** Противопротозойный и противомикробный препарат, производное 5-нитроимидазола. Механизм действия заключается в биохимическом восстановлении 5-нитрогруппы метронидазола внутриклеточными транспортными протеинами анаэробных микроорганизмов и простейших. Восстановленная 5-нитрогруппа метронидазола взаимодействует с ДНК клетки микроорганизмов, ингибируя синтез их нуклеиновых кислот, что ведет к гибели бактерий. К метронидазолу нечувствительны аэробные микроорганизмы и факультативные анаэробы, но в присутствии смешанной флоры (аэробы и анаэробы) метронидазол действует синергидно с антибиотиками, эффективными против обычных аэробов. Увеличивает чувствительность опухолей к облучению, вызывает дисульфирамоподобные реакции, стимулирует репаративные процессы.

**Показания к применению:** Протозойные инфекции: внекишечный амебиаз, включая амебный абсцесс печени, кишечный амебиаз (амебная дизентерия), трихомониаз, гиазидиоз, балантидиоз, лямблиоз, кожный лейшманиоз, трихомонадный вагинит, трихомонадный уретрит. Инфекции, вызываемые *Bacteroides* spp. (в т.ч. *Bacteroides fragilis*, *Bacteroides distasonis*, *Bacteroides ovatus*, *Bacteroides thetaiotaomicron*, *Bacteroides vulgatus*): инфекции костей и суставов, инфекции ЦНС, в т.ч. менингит, абсцесс мозга, бактериальный эндокардит, пневмония, эмпиема и абсцесс легких, сепсис. Инфекции, вызываемые видами *Clostridium* spp., *Peritococcus* и *Peritostreptococcus*: инфекции брюшной полости (перитонит, абсцесс печени), инфекции органов таза (эндометрит, абсцесс фаллопиевых труб и яичников, инфекции свода влагалища). Псевдомембранозный колит (связанный с применением антибиотиков).

**Способ применения:** Порошок для приготовления раствора для внутривенного введения, раствор для инфузий, суспензия для приема внутрь, таблетки, таблетки вагинальные, таблетки покрытые оболочкой: Внутрь и парентерально. Внутрь, во время или после еды (или запивая молоком), не разжевывая. При трихомониазе - по 250 мг 2 раза в сутки в течение 10 дней или по 400 мг 2 раза в сутки в течение 5-8 дней. Женщинам необходимо дополнительно назначать метронидазол в форме вагинальных свечей или таблеток. При необходимости можно повторить курс лечения или повысить дозу до 0.75-1 г/сут. Между курсами следует сделать перерыв в 3-4 нед с проведением повторных контрольных лабораторных исследований. Альтернативной схемой терапии является назначение по 2 г однократно пациенту и его половому партнеру. Детям 2-5 лет - 250 мг/сут; 5-10 лет - 250-375 мг/сут, старше 10 лет - 500 мг/сут. Суточную дозу следует разделить на 2 приема. Курс лечения - 10 дней. При лямблиозе - по 500 мг 2 раза в сутки в течение 5-7 дней. Детям до 1 года - по 125 мг/сут, 2-4 лет - по 250 мг/сут, 5-8 лет - по 375 мг/сут, старше 8 лет - по 500 мг/сут (в 2 приема). Курс лечения - 5 дней. При гиазидиозе - по 15 мг/кг/сут в 3 приема в течение 5 дней. Взрослым: при бессимптомном амебиазе (при выявлении кисты) суточная доза - 1-1.5 г (по 500 мг 2-3 раза в сутки) в течение 5-7 дней. При хроническом амебиазе суточная доза - 1.5 г в 3 приема в течение 5-10 дней, при острой амебной дизентерии - 2.25 г в 3 приема до прекращения симптомов. При абсцессе печени максимальная суточная доза - 2.5 г в 1 или 2-3 приема, в течение 3-5 дней, в комбинации с антибиотиками (тетрациклинами) и др. методами терапии.

**Побочные действия:** Со стороны пищеварительной системы: диарея, снижение аппетита, тошнота, рвота, кишечная колика, запоры, "металлический" привкус во рту, сухость во рту, глоссит, стоматит, панкреатит. Со стороны нервной системы: головокружение, нарушения координации движений, атаксия, спутанность

сознания, раздражительность, депрессия, повышенная возбудимость, слабость, бессонница, головная боль, судороги, галлюцинации, периферическая невропатия. Аллергические реакции: крапивница, кожная сыпь, гиперемия кожи, заложенность носа, лихорадка, артралгии. Со стороны мочевыделительной системы: дизурия, цистит, полиурия, недержание мочи, кандидоз, окрашивание мочи в красно-коричневый цвет. **Противопоказания:** Гиперчувствительность, лейкопения (в т.ч. в анамнезе), органические поражения ЦНС (в т.ч. эпилепсия), печеночная недостаточность (в случае назначения больших доз), беременность (I триместр), период лактации. С осторожностью. Беременность (II-III триместры), почечная/печеночная недостаточность. Лекарственное взаимодействие. Усиливает действие непрямых антикоагулянтов, что ведет к увеличению времени образования протромбина. Аналогично дисульфираму вызывает непереносимость этанола.

**Форма выпуска:** Гель для наружного применения, крем для наружного применения, гель вагинальный, суппозитории вагинальные, таблетки вагинальные, порошок для приготовления раствора для внутривенного введения, раствор для инфузий, суспензия для приема внутрь, таблетки 250 мг по 10, 20, 30 шт., таблетки покрытые оболочкой.

## 19. Пиперидина адипинат (Piperazine adipate);



**Групповая принадлежность:** Противогельминтное средство

**Фармакологическое действие:** Противогельминтный препарат, эффективен при аскаридозе и энтеробиозе. Оказывает парализующее действие на нематод: нарушая функцию их нервно-мышечной системы, вызывает паралич мускулатуры. Выраженность дегельминтизации препаратом находится на уровне 90-95%, а при повторном применении может составить около 100%. Ввиду того что пиперазин не уничтожает аскарид, отсутствует опасность всасывания биологических токсичных продуктов их распада. Малотоксичен.

**Показания к применению:** Инвазия аскаридами (аскаридоз) и острицами (энтеробиоз).

**Способ применения:** Внутрь. При аскаридозе взрослым и детям старше 15 лет назначают по 1,5 - 2 г, суточная доза - 3 - 4 г. Детям. Разовая и суточная доза соответственно: с 3 лет - 0,3 и 0,6 г; 4-5 лет - 0,5 и 1 г; 6-8 лет - 0,75 и 1,5 г; 9-12 лет - 1 и 2 г; 13-15 лет - 1,5 и 3 г

При лечении аскаридоза назначают 2 раза в день за 1 ч или через 0,5-1 ч после еды в течение 2 дней подряд. По другой схеме - однократно (0,4-4 г в зависимости от возраста) или 2 раза по 0,2-2 г. Для лечения энтеробиоза назначают в таких же дозах, что и при аскаридозе, в течение 5 дней подряд с 7-дневными интервалами между курсами. Проводят 1-3 курса терапии.

Для удаления остриц из прямой кишки между курсами лечения на ночь ставят клизму из 1-3 стаканов воды, с добавлением на 1 стакан 1/2 ч. ложки натрия гидрокарбоната (питьевая сода).

Лечение пиперазина адипинатом не требует специальной диеты или подготовки больных. Слабительные назначают только при склонности к запорам. Во время лечения энтеробиоза соблюдают строгий гигиенический режим.

**Побочные действия:** Тошнота, абдоминальная боль спастического характера, головная боль. У больных с почечной недостаточностью - нейротоксические осложнения (мышечная слабость, тремор, эйфория, галлюцинации, ухудшение зрения, нарушения координации движений).

**Противопоказания:** Дети в возрасте до 3-х лет (для данной лекарственной формы).

Гиперчувствительность, органические заболевания центральной нервной системы, хроническая почечная недостаточность.

**Форма выпуска:** таблетки 500 мг. По 10 таблеток в контурную ячейковую упаковку. По 10 таблеток в контурную безъячейковую упаковку.

## 20. Тинидазол (Tinidazolium);



**Групповая принадлежность:** Противомикробное и противопротозойное средство

**Фармакологическое действие:** Препарат подавляет развитие *Trichomonas vaginalis* (вида простейших /одноклеточных/ организмов, паразитирующих в органах мочеполовой системы человека; передаются, как правило, половым путем), *Entamoeba histolytica* (вида амёб -простейших /одноклеточных/ организмов - вызывающего инфекционное заболевание, характеризующееся хроническим воспалением толстой кишки с

образованием язв) и лямблий (вида простейших /одноклеточных/ организмов, паразитирующих в тонком кишечнике человека). При приеме внутрь быстро всасывается и из-за высокой липофильности (средства к жирам) легко проникает в трихомонады (одноклеточные паразиты). Препарат накапливается в крови и медленно выводится из организма почками за счет обратного всасывания в почечных канальцах.

**Показания к применению:** Острый и хронический трихомоноз (заболевание мочеполовой сферы, вызываемое трихомонадами) у женщин и мужчин. Лямблиоз (заболевание тонкого кишечника, вызванное лямблиями). Способ применения: Для лечения трихомоноза мужчины и женщины принимают таблетки нитазола внутрь по 0,5 г по одной из следующих схем: 1) однократно в дозе 2 г; 2) в той же дозе по 0,5 г через каждые 15 мин в течение часа (4 приема); 3) по 0,15 г 2 раза в день ежедневно в течение недели. Детям дают из расчета 50-60 мг/кг. При лямблиозе (заболевании, вызванном простейшими одноклеточными организмами, паразитирующими в тонком кишечнике человека) назначают в дозе 2 г (4 таблетки) однократно через 40-50 мин после завтрака или по 0,3 г в сутки в течение 7 дней, причем при упорном течении заболевания проводят 6-7 курсов. При амёбной дизентерии - по 1,5 г (3 таблетки) 1 раз в день в течение 3 дней.

**Побочные действия:** В отдельных случаях возможны умеренная лейкопения (снижение уровня лейкоцитов в крови), головокружение, нарушение координации движений, в единичных случаях аллергические реакции.

**Противопоказания:** Нарушение кроветворения, заболевания центральной нервной системы в активной фазе, первые 3 мес. беременности; препарат назначают с осторожностью в последующие месяцы беременности и в период кормления грудью. Во время лечения запрещается употребление алкогольных напитков во избежание спазма органов брюшной полости, тошноты, рвоты, не рекомендуется назначать с этиономидом.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,5 г в упаковке по 4 штуки.

## Общие сведения об онкологических заболеваниях

**Опухоль** (син.: новообразование, неоплазия, неоплазма, бластома) — патологический процесс, представленный новообразованной тканью, в которой изменения генетического аппарата клеток приводят к нарушению регуляции их роста и дифференцировки.

Опухоль является патологическим процессом которое проявляется в местном разрастании тканей. Опухоль разрастается из тканей организма, но опухолевые клетки приобретают иные свойства, отличаются от здоровых клеток и не могут созреть и превращаться в здоровые клетки.

Выделяют пять основных особенностей опухолевой ткани: **атипизм (тканевой, клеточный), органоидность строения, прогрессия, относительная автономность и неограниченный рост.**

Рост опухоли начинается из зачатка и продолжается за счет деления и размножения клеток самой опухоли (автономность).

Все опухоли подразделяют в зависимости от способности к росту и клинко-морфологических особенностей на две основные группы:

1. **доброкачественные опухоли,**
2. **злокачественные опухоли.**

**Доброкачественные** (зрелые, гомологичные) опухоли состоят из клеток, дифференцированных в такой мере, что можно определить, из какой ткани они растут. Для этих опухолей характерен медленный экспансивный рост, отсутствие метастазов, отсутствие общего влияния на организм.

Доброкачественные опухоли растут в виде ограниченного узла отодвигающего и сдавливающего соседние ткани. Такие опухоли относительно легко удаляются при хирургической операции, так как имеют хорошо заметные границы, в отличие от злокачественных опухолей не имеющих четких границ.

Большинство доброкачественных опухолей не представляет угрозы для жизни человека, за исключением доброкачественных опухолей головного мозга, которые сдавливают окружающие ткани, что может стать причиной смерти. Опасность доброкачественных опухолей может заключаться и в том, что при неблагоприятных условиях эти опухоли могут трансформироваться в злокачественные.

**Злокачественные** (незрелые, гетерологичные) опухоли состоят из умеренно- и малодифференцированных клеток. Как правило клетки злокачественной опухоли утрачивают сходство с тканью, из которой они исходят. Для злокачественных опухолей характерен быстрый, **чаще инфильтрирующий, рост, метастазирование и рецидивирование**, поэтому при хирургическом удалении такой опухоли нет уверенности, что рост опухоли не возобновится. Злокачественные новообразования оказывают общее влияние на весь организм, разрушают ткани организма, вызывают общую интоксикацию (кахексию) и истощение, что при отсутствии своевременного лечения приводит к смерти больного.

Причины развития онкологических заболеваний в настоящее время до конца не выяснены. В настоящее время ведущей считается мутационная теория канцерогенеза. Ниже перечислены основные исторически сложившиеся теории.

1. **Вирусно-генетическая теория** решающую роль в развитии опухолей отводит онкогенным вирусам, к которым относят: герпесоподобный вирус Эпштейна-Барр (лимфома Беркитта), вирус герпеса (лимфогранулематоз, саркома Капоши, опухоли головного мозга), папилломавирус (рак шейки матки, бородавки обыкновенные и ларингеальные), ретровирус (хронический лимфолейкоз), вирусы гепатитов В и С (рак печени). Согласно вирусно-генетической теории интеграция генома вируса с генетическим аппаратом клетки может привести к опухолевой трансформации клетки. При дальнейшем росте и размножении опухолевых клеток вирус перестает играть существенную роль.

2. **Физико-химическая теория** основной причиной развития опухолей считает воздействие различных физических и химических факторов на клетки организма (рентгеновское и гамма-излучение, канцерогенные вещества), что приводит к их онкотрансформации. Помимо экзогенных химических канцерогенов рассматривается роль в возникновении опухолей эндогенных канцерогенов (в частности, метаболитов триптофана и тирозина) путем активации этими веществами протоонкогенов, которые посредством синтеза онкобелков приводят к трансформации клетки в опухолевую.

3. **Теория дисгормонального канцерогенеза** рассматривает в качестве причины возникновения опухолей различные нарушения гормонального равновесия в организме.

4. **Дизонтогенетическая теория** причиной развития опухолей считает нарушения эмбриогенеза тканей, что под действием провоцирующих факторов может привести к онкотрансформации клеток ткани.

4. **Теория четырёхстадийного канцерогенеза** объединяет все вышеперечисленные теории.

**Характерными** особенностями злокачественной опухоли являются следующие:

В зависимости от характера взаимодействия растущей опухоли с элементами окружающей ткани:

- экспансивный рост — опухоль растет «сама из себя», раздвигая окружающие ткани, ткани на границе с опухолью атрофируются, происходит коллапс стромы — формируется псевдокапсула;
- инфильтрирующий (инвазивный, деструктивный) рост — клетки опухоли врастают в окружающие ткани, разрушая их;
- аппозиционный рост опухоли происходит за счет неопластической трансформации клеток окружающей ткани в опухолевые.

В зависимости от отношения к просвету полого органа:

- экзофитный рост — экспансивный рост опухоли в просвет полого органа, опухоль закрывает часть просвета органа, соединяясь с его стенкой ножкой;
- эндофитный рост — инфильтрирующий рост опухоли вглубь стенки органа.

В зависимости от числа очагов возникновения опухоли:

- унициентрический рост — опухоль растет из одного очага;
- мультицентрический рост — рост опухоли из двух и более очагов.

**Метастазирование** — процесс распространения опухолевых клеток из первичного очага в другие органы с образованием вторичных (дочерних) опухолевых очагов (метастазов). Пути метастазирования:

- гематогенный — путь метастазирования при помощи опухолевых эмболов, распространяющихся по кровеносному руслу;
- лимфогенный — путь метастазирования при помощи опухолевых эмболов, распространяющихся по лимфатическим сосудам;
- имплантационный (контактный) — путь метастазирования опухолевых клеток по серозным оболочкам, прилежащим к опухолевому очагу.
- интраканикулярный - путь метастазирования по естественным физиологическим пространствам (синовиальные влагалища и т.д.)
- периневрально (частный случай интраканикулярного метастазирования)- по ходу нервного пучка.

В зависимости от локализации различают опухоли эпителиальной, соединительной, мышечной, нервной и других тканей. Для обозначения опухолей обычно к названию ткани, из которой возникла опухоль, добавляют окончание «ома» (например, опухоль сосудов называется «ангиома», мышечной ткани - «миома», костной ткани «остеома»). Иногда к названию ткани прибавляют слово «бластома» (например: «остеобластома», «миобластома» и пр.).

Злокачественные опухоли эпителиальных тканей называют «раком», соединительной - «саркомой». Опухоли кроветворных органов называют «лейкозом», лимфатических узлов «лимфомаркомой», «лимфагранулематозом».

Для разных опухолей характерны разные типы метастазирования, разные органы, в которые происходит метастазирование, что определяется взаимодействием рецепторных систем опухолевых клеток и клеток органа-мишени. Гистологический тип метастазов такой же, как и опухоли в первичном очаге, однако, опухолевые клетки метастазов могут становиться более зрелыми или, наоборот, менее дифференцированными. Как правило, метастатические очаги растут быстрее первичной опухоли, поэтому могут быть крупнее ее.

Развитие заболевания оказывает влияние на организм, как на **местное**, так и **резорбтивное** - на весь организм в целом. Местное влияние заключается в сдавлении или разрушении (в зависимости от типа роста опухоли) окружающих тканей и органов. Конкретные проявления местного действия зависят от локализации опухоли. Общее влияние на организм характерно для злокачественных опухолей, проявляется различными нарушениями метаболизма, вплоть до развития кахексии. В процессе роста злокачественной опухоли могут возникать некротические процессы с образованием полостей заполненных гноем.

Опухолевые клетки эндокринных желез начинают усиленно вырабатывать соответствующие гормоны, резко повышая их концентрацию в организме, что приводит к гормональной интоксикации и соответствующим изменениям в организме, вызванными физиологическим действием этих гормонов. Так, при опухоли мозгового слоя надпочечников резко повышается артериальное давление.

## **Лекарственные препараты применяемые при лечении онкологических заболеваний**

Для лечения злокачественных опухолей предложено большое количество лекарственных препаратов. Однако, несмотря на значительный

перечень лекарственных средств подобной направленности добиться излечения онкологических заболеваний с помощью исключительно медикаментозных средств в подавляющем большинстве случаев не представляется возможным. Химиотерапия онкологических заболеваний, в настоящее время, является только дополнительным методом лечения, которому как правило предшествует хирургическое удаление опухоли.

Характерной особенностью противоопухолевых средств является их выраженный цитостатический эффект (угнетение роста и размножения клеток). При этом, следует учитывать, что химиотерапевтические средства, применяемые при лечении онкологических заболеваний, проявляют цитостатическое действие не только на опухолевые, но и на здоровые клетки организма. Но в связи с тем, что интенсивный рост характерен, прежде всего, для опухолевых клеток цитостатическое действие лекарственных препаратов направлено, на подавление роста и размножения именно этих клеток.

Вместе с тем, лекарственные цитостатические препараты проявляют токсическим действием на организм, поскольку также угнетают рост здоровых клеток, для которых свойственен быстрый рост и размножение, например, клеток кроветворных органов, половых клеток, клеток слизистых оболочек желудочно-кишечного тракта и пр. Применение препаратов этой группы приводит к расстройствам в работе ЖКТ, угнетению иммунитета и кроветворения и пр.

Механизм цитостатического, противоопухолевого действия препаратов связан с их способностью нарушать обмен нуклеиновых кислот в клеточных ядрах, что ведет к нарушению деления и размножения клеток.

Лекарственные противоопухолевые препараты классифицируются в зависимости от их происхождения, а также механизма действия и химического строения.

Среди противоопухолевых средств выделяют следующие группы:

1. Алкилирующие средства;
2. Антиметаболиты;
3. Антибиотики (обладающие противоопухолевым действием);
4. Средства растительного происхождения;
5. Гормональные средства и их антагонисты;
6. Ферментные препараты;
7. Цитокины;
8. Радиоактивные изотопы;

Алкилирующие средства – составляют наиболее многочисленную группу противоопухолевых лекарственных средств. К ним относятся такие препараты, как: хлорбутин, циклофосфан, сарколизин, миелован, тиофосфамид, нитрозометилмочевина и пр.

Фармакологическое действие алкилирующих соединений основано на реакции алкилирования (замене атома водорода в органических соединениях

на алкильную группу). Взаимодействуя с молекулами ДНК препараты этой группы вызывают цитостатический эффект.

К противоопухолевым средствам растительного происхождения относятся такие лекарственные средства, как колхамин, винбластин, винкристин. Препараты этой группы являются митотическими ядами (митотические яды – вещества подавляющие процесс митоза, митоз - не прямое деление клеток). Противоопухолевые растительные препараты наиболее эффективны при лечении раковых заболеваний желудочно-кишечного тракта, а также лимфатических узлов и костного мозга. Колхамин применяется при лечении рака кожи.

Гормональные средства применяются при лечении онкологических заболеваний, связанных с заболеваниями гормонозависимых органов, например, половых (эстрогены и андрогены). Так, лекарственные препараты женских половых гормонов (синестрол, фосфжстро и пр.) назначаются мужчинам при раковом заболевании предстательной железы или женщинами при раке молочной железы. Лекарственные препараты мужских половых гормонов (например, метилтестостерон) применяются при лечении рака молочной железы и яичников у женщин.

Эффективными при лечении онкологических заболеваний являются антагонисты некоторых гормонов, например, тамоксифена цитрат (антиэстрогенное средство) применяется при раке молочной железы у женщин.

Ферменты (L – аспарагиназа), некоторые виды интерферонов (реаферон) и интерлейкинов (интерлейкины - синтезируемая лейкоцитами, являются частью иммунной системы) – пролейкин также проявляют противоопухолевую активность и применяются при лечении онкологических заболеваний

К отдельной группе лекарственных препаратов относятся разные по структуре и механизму действия синтетические лекарственные средства, такие как: натулан, проспидин, цисплатин, дакарбазин и пр.

Так, лекарственный препарат цисплатин применяется при лечении онкологических заболеваний мочевого пузыря, а также области головы и шеи и пр. Проспидин эффективен при раке гортани, натулан применяется при лечении онкологических заболеваний легких и головного мозга, дакарбазин – при лечении злокачественных заболеваний лимфоидной ткани.

---

## Краткая характеристика препаратов

### 1. Цистамина дигидрохлорид (Cystaminidihydrochloridum)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкалоид

**Фармакологическое действие:** Цистамин относится к группе аминотиолов. Аминотиолы оказывают профилактическое радиозащитное действие при остром лучевом поражении, повышая устойчивость организма к действию ионизирующей радиации. Действие аминотиолов основано на их способности уменьшать количество радикалов, ионизированных и возбужденных молекул, образующихся в тканях при облучении, а также на способности этих соединений взаимодействовать с некоторыми ферментами и придавать им устойчивость по отношению к лучистой энергии. Действие аминотиолов проявляется более отчетливо при введении за короткий срок (10-30 мин) до облучения. Защитный эффект после однократного введения продолжается около 5 ч.

**Показания к применению:** Цистамин применяют для профилактики и уменьшения проявлений лучевой болезни (общего недомогания, тошноты, рвоты и др.), возникающих при применении больших доз радиации для радио- и рентгенотерапии.

**Способ применения:** Назначают внутрь в виде таблеток за 1 ч до облучения. Доза зависит от характера заболевания, состояния кроветворной системы больного, дозы радиации. Суточные дозы колеблются от 0,2 до 0,8 г. Препарат применяют во время всего курса лучевой терапии. Одновременно больные должны получать общеукрепляющую терапию. Применение цистамина при уже развившейся лучевой болезни (при значительной лейкопении /снижении уровня лейкоцитов в крови/) лечебного эффекта не дает. Развития лейкопении препарат не предупреждает. При значительном уменьшении количества лейкоцитов (форменных элементов крови) в крови в период облучения и необходимости продолжать лечение возможно применение цистамина в сочетании со стимуляторами лейкопоэза (процесса образования лейкоцитов); при необходимости назначают гемотрансфузии (переливание крови).

**Побочные действия:** После приема цистамина в некоторых случаях отмечаются жжение в пищеводе, тошнота, иногда боли в области желудка; эти явления обычно не служат препятствием для продолжения приема препарата. Следует учитывать, что препарат оказывает гипотензивное (снижающее артериальное давление) действие; при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления) может наблюдаться значительное понижение артериального давления.

**Противопоказания:** Относительными противопоказаниями к применению цистамина дигидрохлорида являются острые заболевания желудочно-кишечного тракта, острая недостаточность сердечно-сосудистой системы (ухудшение кровоснабжения органов и тканей вследствие снижения насосной функции сердца), нарушение функции печени.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,2 и 0,4 г.

### 2. Винбластин (Vinblastin)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкалоид

**Фармакологическое действие:** Винбластин – химиотерапевтический противоопухолевый препарат. В состав препарата Винбластин входит алкалоид растительного происхождения (получаемый из барвинка розового - *Cataranthus roseus*). Препарат обратимо блокирует на стадии метафазы митоз клеток за счет способности связываться с микротрубочками и замедлять образование митотических веретен. Винбластин в опухолевых клетках избирательно ингибирует синтез РНК и ДНК, угнетая фермент РНК-полимеразу. После внутривенного введения быстро распределяется по тканям организма, практически не проникает через гематоэнцефалический барьер. Активный компонент препарата Винбластин связывается с белками плазмы крови, а также ее форменными элементами. Биотрансформируется в печени с образованием активных метаболитов. Период полувыведения составляет 25ч. Выводится преимущественно кишечником.

**Показания к применению:** Винбластин применяют для терапии пациентов со злокачественными опухолями различной локализации и этиологии, включая болезнь Ходжкина, рак яичка, хронический лейкоз и неходжкинские лимфомы.

**Способ применения:** Препарат Винбластин предназначен исключительно для внутривенного применения, следует избегать введения раствора не в вену, так как это может привести к развитию некроза тканей. Доза препарата Винбластин, а также схема применения определяется врачом с учетом состояния пациента. Начальная доза препарата Винбластин для взрослых, как правило, составляет 0,1 мг/кг, для детей – 2,5 мг/м<sup>2</sup> (препарат вводят один раз в неделю). Далее, с каждой следующей инъекцией, дозу повышают на 0,05 мг/кг для взрослых, на 1,25 мг/м<sup>2</sup> - для детей. Дозу препарата Винбластин следует увеличивать до достижения максимальной рекомендованной дозы - 0,5 мг/кг для взрослых и 7,5 мг/м<sup>2</sup> для детей (либо до снижения уровня количества лейкоцитов в крови до 3000 мкл). Разовую дозу препарата Винбластин, как правило, вводят 1 раз в неделю. Поддерживающая доза: для взрослых на 0,05 мг/кг (для детей – на 1,25 мг/м<sup>2</sup>) меньше последней начальной дозы может применяться 1 раз в 7—14 дней. Кроме того, допускается в качестве поддерживающей дозы для взрослых введение 10мг препарата Винбластин однократно или каждые 14 дней до исчезновения симптомов.



**Побочные действия:** Наиболее часто встречающимися побочными эффектами в период терапии препаратом Винбластин являются облысение, лейкопения, стоматит, гиперурикемия, мочекишечная нефропатия, боль в мышцах, тромбоцитопения, рвота и тошнота. Кроме того, при применении препарата Винбластин возможно развитие геморрагического колита, а также желудочного кровотечения (преимущественно у пациентов с язвенной болезнью). Препарат Винбластин может оказывать нейротоксическое действие, в частности у некоторых пациентов отмечалось развитие двоения в глазах, слабости, депрессивных состояний, головной боли, головокружения, ощущения онемения кожи, а также нарушения выработки антидиуретического гормона. Развитие нейротоксического действия требует отмены препарата Винбластин.

**Противопоказания:** Препарат Винбластин не назначают пациентам с известной гиперчувствительностью к компонентам препарата. Запрещено введение препарата Винбластин пациентам, страдающим вирусными и бактериальными инфекционными заболеваниями. С осторожностью назначают Винбластин пациентам, которые недавно закончили курс или получают в данный момент миелосупрессивную лучевую или химиотерапию. Кроме того, осторожность необходимо соблюдать при назначении препарата Винбластин пациентам, страдающим лейкопенией, тяжелыми поражениями печени и тромбоцитопенией, а также пациентам пожилого возраста. **Беременность:** Препарат применяют во время беременности только в случае, когда положительный ожидаемый результат превышает возможное негативное влияние на плод.

**Форма выпуска:** Лиофилизированный порошок для приготовления инъекционного раствора во флаконах по 5 или 10 г в комплекте с растворителем (по 5 или 10 мл растворителя в ампуле соответственно), в пачку из картона вложено 10 флаконов с препаратом Винбластин и 10 ампул с растворителем.

### 3. Метилурацил (Methyluracilum)



**Групповая принадлежность:** Регенерации стимулятор

**Фармакологическое действие:** Ускоряет процессы клеточной регенерации (восстановления); ускоряет заживление ран, стимулирует клеточные и гуморальные (тканевые) факторы защиты. Оказывает также противовоспалительное действие. Характерной особенностью препарата является стимуляция эритро- и особенно лейкопоэза (процесса образования эритроцитов и особенно лейкоцитов), в связи с чем его обычно относят к группе стимуляторов лейкопоэза.

**Показания к применению:** Как стимулятор лейкопоэза метилурацил назначают при рентгене- и радиотерапии и других состояниях, сопровождающихся лейкопенией (снижением уровня лейкоцитов в крови).

**Способ применения:** Принимают метилурацил внутрь во время или после еды. Взрослым дают по 0,5 г 4 раза в день (при необходимости до 6 раз в сутки); детям в возрасте от 3 до 8 лет - по 0,25 г, старше 8 лет - по 0,25-0,5 г 3 раза в день. Курс лечения при заболеваниях желудочно-кишечного тракта продолжается обычно 30-40 дней, в других случаях может быть менее продолжительным. При местных повреждениях (поражения кожи, проктиты /воспаление прямой кишки/, сигмоидиты /воспаление сигмовидной кишки/ и др.), возникающих при лучевой терапии, назначают внутрь и местно. Местно при ранах, ожогах, трофических язвах (длительно незаживающих дефектов кожи) применяют 10% метилурациловую мазь. Для лечения проктитов, сигмоидитов, язвенных колитов (воспалении толстой кишки с образованием язв) применяют свечи, содержащие метилурацил (по 1-4 свечи в день взрослому).

**Побочные действия:** Метилурацил обычно хорошо переносится; при введении свечей в прямую кишку иногда ощущается кратковременное легкое жжение; при приеме внутрь возможны аллергические кожные реакции (уртикарная сыпь /кожные высыпания/), иногда головная боль, головокружение.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при острых и хронических лейкемических формах лейкоза (формах злокачественной опухоли /рака крови/, возникающей из кроветворных клеток и поражающей костный мозг), лимфогранулематозе (злокачественном заболевании лимфоидной ткани), злокачественных заболеваниях костного мозга.

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,5 г в упаковке по 50 штук; свечи с метилурацилом по 0,5 г в упаковке по 10 свечей; мазь метилурациловая 10% в алюминиевых тубах по 25 г.

### 4. Циклофосфан (Cyclophosphmum)



**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкилирующее соединение

**Фармакологическое действие:** Является алкилирующим (вызывающим химические процессы в клетке, приводящие к нарушению стабильности ДНК - дезоксирибо-нуклеиновой кислоты, содержащейся в основном в ядре клетки и являющейся носителем генной информации) и митостатическим (препятствующим росту клеток) препаратом. Синтез препарата произведен с таким расчетом, чтобы препарат обладал избирательной противоопухолевой активностью, т. е. чтобы он был неактивным, находясь в крови, но при проникновении в опухолевые клетки быстро разлагался под влиянием содержащихся в них в относительно большом количестве фосфатаз (фосфамидаз) с освобождением бис-(бета-хлорэтил)-амина. Таким образом, препарат может рассматриваться как пролекарство с “транспортной” функцией, доставляющее активное цитостатическое вещество в опухолевые клетки. Препарат обладает относительно широким противоопухолевым спектром действия и оказывает более мягкое, чем другие аналогичные препараты, влияние на тромбоцитопоз (процессообразования тромбоцитов в организме).

**Показания к применению:** При мелкоклеточном раке легкого; раке яичников; раке молочной железы; ретикулосаркоме (злокачественной опухоли, возникающей из рыхлой быстрорастущей соединительной ткани); лимфосаркоме (злокачественной опухоли, возникающей из незрелых лимфоидных клеток); хроническом лимфолейкозе (раке крови, при котором источником опухолевого процесса являются лимфоциты /клетки костного мозга, из которых развиваются форменные элементы крови - лимфоциты/); острым лимфобластном лейкозе (раке крови, при котором источником опухолевого процесса являются лимфоциты /клетки костного мозга, из которых образуются лимфоциты/, которые в большом количестве выявляются в кровяном русле); множественной миеломе (заболевании костного мозга, характеризующемся разрастанием кровяных клеток); опухоли Вильмса (раке, развивающемся из тканей почки у детей); костной ретикулосаркоме (злокачественной опухоли кости, возникающей из рыхлой быстрорастущей соединительной ткани); опухоли Юинга (злокачественной опухоли костной ткани); ангиосаркоме (злокачественной опухоли, развивающейся из клеток кровеносных или лимфатических сосудов).

**Способ применения:** Вводят внутривенно, внутримышечно, внутрь, а также в полости. Используют разные схемы лечения: а) по 200 мг (3 мг/кг) ежедневно или 400 мг (6 мг/кг) через день (внутрь, внутривенно или внутримышечно); б) по 1 г (15 мг/кг) 1 раз в 5 дней внутривенно; в) 2 - 3 г (30 - 45 мг/кг) 1 раз в 2 - 3 нед внутривенно. Курсовая доза при всех режимах лечения составляет 6 - 14 г. Используют и другие схемы лечения. При скоплениях жидкости в результате ракового процесса в брюшной и плевральной полостях, в дополнение к внутривенным инфекциям, вводят в полости по 0,4 - 1,0 г циклофосфана (при каждой пункции). Количество препарата, вводимого в вену, при этом соответственно уменьшают. После окончания основного курса лечения циклофосфаном, может применяться поддерживающая терапия: 2 раза в неделю вводят внутривенно (или внутримышечно) по 0,1 - 0,2 г препарата или назначают его внутрь в виде таблеток по 0,05 - 0,1 г 2 раза в день. Прием препарата внутрь удобен для длительной терапии. Циклофосфан используется также как иммунодепрессивное средство. Он подавляет (как и другие цитостатики) пролиферацию участвующих в иммунном ответе лимфоцитарных клонов.

**Побочные действия:** При применении циклофосфана, особенно при передозировке, могут наблюдаться различные побочные явления. Часто бывает тошнота и рвота. Для уменьшения этих явлений рекомендуется введение пиридоксина внутримышечно 0,05 г или аминазина 0,025 г внутривенно или внутримышечно через 1 ч после введения циклофосфана. Часто (до 90% случаев) через 18-20 дней после начала применения препарата наблюдается частичная или полная алопеция (полное или частичное выпадение волос); волосы отрастают после прекращения приема циклофосфана. Иногда возникают головкружение, ухудшение зрения, дизурические явления (расстройства мочеиспускания), гематурия (кровь в моче). Дизурические явления проходят обычно через 4-5 дней. Часто больные жалуются на боль в костях, длящуюся до 2-3 нед. Местного раздражающего влияния циклофосфан не оказывает, однако при внутриплевральном введении препарата может повыситься температура тела (на 2-3-й день), появиться кашель и боль в грудной клетке.

**Противопоказания:** Циклофосфан противопоказан при анемии (снижении содержания гемоглобина в крови), кахексии (крайней степени истощения), тяжелых заболеваниях сердца, печени и почек, в терминальных стадиях болезни (при состоянии организма, предшествующем смерти).

**Форма выпуска:** В ампулах по 0,1 и 0,2 г препарата; таблетки, покрытые оболочкой, по 0,05 г в упаковке по 50 штук.

## 5. Миелосан (Myelosanum)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкилирующее соединение

**Фармакологическое действие:** Цитостатическое (препятствующее росту клеток) средство, избирательно угнетающее гранулоцитопоз (процесс образования различных форм лейкоцитов /форменных элементов крови/ в организме) и оказывающее сильное антилейкемическое (направленное на лечение рака крови) действие.

**Показания к применению:** Обострение хронического миелолейкоза - лейкемическая форма (рак крови, при котором источником опухолевого процесса являются гранулоцитарные клетки /клетки костного мозга, из которых развиваются форменные элементы крови - лейкоциты/, сопровождающийся появлением в кровеносном русле наряду со зрелыми лейкоцитами большого числа их предшественников, в норме определяемых только в костном мозге).

**Способ применения:** Внутрь. В зависимости от формы заболевания (степень спленомегалии /увеличения массы печени и селезенки/, число лейкоцитов) по 2-10 мг/сут. в 1-3 приема. Курс лечения - 3-5 нед. При рецидиве (повторном появлении признаков заболевания) курс лечения повторяют.

**Побочные действия:** При передозировке возможны гранулоцитопения (уменьшение содержания гранулоцитов в крови) и тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови), которая иногда сопровождается геморрагиями (кровотечениями). У больных пожилого возраста иногда отмечаются головокружение и головная боль, боль в области сердца. При длительном применении аменорея (отсутствие менструации) у женщин и снижение потенции (половой активности) у мужчин.

**Противопоказания:** Острый лейкоз (злокачественная опухоль крови, возникающая из властных клеток /клеток костного мозга, из которых образуются лейкоциты, лимфоциты, эритроциты и т. д./, и характеризующаяся их появлением в кровеносном русле), обострение хронического миелолейкоза, протекающее по типу острого лейкоза, алейкемические и сублейкемические формы (формы течения) хронического лейкоза.

**Форма выпуска:** В таблетках по 0,002 г (2 мг) в упаковке по 50 штук.

## 6. Натрия нуклеинат (Natriinucleinas)



**Групповая принадлежность:** Лейкопоза стимулятор

**Фармакологическое действие:** Натрия нуклеинат обладает широким спектром биологической активности. Он способствует ускорению процессов регенерации (заживления), стимулирует деятельность костного мозга, вызывает лейкоцитарную реакцию (изменение числа лейкоцитов в крови), стимулирует лейкопоз (процесс образования лейкоцитов), а также естественные факторы иммунитета: миграцию и кооперацию Т- и В-лимфоцитов (передвижение и объединение форменных элементов крови, ответственных за поддержание клеточных и тканевых защитных сил организма), фагоцитарную активность макрофагов (захват и уничтожение болезнетворных микроорганизмов макрофагами /клетками крови/) и активность факторов неспецифической резистентности (устойчивости).

**Показания к применению:** Применяют натрия нуклеинат в комплексной терапии в качестве иммуностимулирующего (активирующего защитные силы организма) средства при заболеваниях, сопровождающихся развитием иммунодефицита (снижения или отсутствия защитных сил организма), в том числе при лейкопениях (снижении уровня лейкоцитов в крови) и агранулоцитозе (резким снижением числа гранулоцитов в крови). Имеются данные об эффективности препарата в комплексной терапии хронического воспаления легких, герпетических кератитов (воспаления роговицы, вызванного вирусом герпеса), вирусного гепатита (воспаления ткани печени, вызываемого вирусом) и некоторых других заболеваний.

**Способ применения:** Принимают внутрь после еды. В качестве иммуностимулирующего средства назначают взрослым в суточных дозах 1,0-1,5-2,0 г (в 3-4 приема). Продолжительность лечения - от 2 нед. до 3 мес. и более. Курс лечения - 10-15 дней и более в зависимости от течения заболевания.

**Побочные действия:** Боль в месте внутримышечной инъекции, иногда брадикардия (урежение пульса), одышка, усиленное потоотделение, угнетение нервной системы. При приеме внутрь перед едой может появиться боль в надчревной области. Аллергические реакции.

**Противопоказания:** Гемобластозы (лейкозы и злокачественные лимфомы), органические заболевания сердечной мышцы с нарушением проводимости.

**Форма выпуска:** Во флаконах темного стекла по 100 г.

## 7. Метотрексат (Methotrexatum)



**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, антиметаболит

**Фармакологическое действие:** По химической структуре метотрексат близок к кислоте фолиевой и является ее антиметаболитом-антагонистом (веществом, близким к естественным продуктам обмена веществ, но оказывающим противоположное действие). В связи с антифолиевым эффектом препарат подавляет клеточный митоз (деление клеток), рост активно пролиферирующих (растущих) тканей, в том числе костного мозга, тормозит рост злокачественных новообразований.

**Показания к применению:** Назначают метотрексат и его натриевую соль самостоятельно или в комбинированной химиотерапии при остром лимфобластном и миелобластном лейкозе (опухолях кроветворных клеток, возникших из клеток костного мозга /лимфобластов и миелобластов); в поздних стадиях хронического миелолейкоза (рака крови, при котором источником опухолевого процесса являются гранулоцитарные клетки /клетки костного мозга, из которых развиваются форменные элементы крови -лейкоциты/); при лимфосаркоме (злокачественной опухоли, возникающей из незрелых лимфоидных клеток); при комбинированной химиотерапии у больных раком молочной железы, легкого, яичников. В повышенных дозах (под прикрытием кальция фолината) применяют также при остеогенной саркоме (злокачественной опухоли, возникающей из остеобластов /клеток кости/; опухоли Юинга (злокачественной опухоли костной ткани); саркоме мягких тканей (злокачественной опухоли, развивающейся в соединительной ткани, подкожной клетчатке или мышцах); хориокарциноме матки (раке матки, возникшем из клеток наружного слоя зародыша /трофобластов/).

**Способ применения:** Внутрь назначают метотрексат в виде таблеток. При комплексной терапии лейкозов назначают взрослым по 0,03 г (30 мг) 2 раза в неделю. Максимальная суточная доза для детей -0,02 г (20 мг) на 1 м<sup>2</sup> поверхности тела. Курс лечения - 2 нед. При интенсивном курсе назначают взрослым по 0,02-0,025 г (20-25 мг) ежедневно в течение 5 дней. Перерывы между курсами - 2-3 нед.

При хориокарциноме матки назначают по 0,05 г (50 мг) 1 раз в 5 дней. На курс лечения -0,3-0,4 г. Курсы повторяют с перерывами не менее 1 мес. Назначают также в более высоких дозах: по 15-30 мг ежедневно в течение 5 дней с перерывами 1-2 нед.

Натриевую соль метотрексата вводят внутримышечно, внутривенно (струйно или капельно) или в спинномозговой канал. Содержимое ампулы растворяют в стерильном изотоническом растворе натрия хлорида.

Взрослым при лейкозах назначают натриевую соль метотрексата парентерально (минуя желудочно-кишечный тракт) обычно в дозе 0,01-0,03 г; суточная доза - 0,03 г (30 мг). Вводят 1 или 2 раза в неделю или 1 раз в 4 дня. Детям в возрасте до 7 лет вводят парентерально в разовой и суточной дозе 0,003-0,005 г (3-5 мг), 7-14 лет - 0,005-0,015 г (5-15 мг); на курс лечения вводят детям в возрасте до 7 лет 0,009-0,015 г (9-15 мг), 7-14 лет - 0,015-0,045 г (15-45 мг).

**Побочные действия:** Во всех случаях применения метотрексата следует учитывать, что препарат может вызывать побочные явления: тошноту, диарею (понос), стоматит (воспаление слизистой оболочки полости рта), а при более длительном применении - язвенные поражения слизистой оболочки полости рта с кровоточениями, выпадение волос, тромбоцитопению (уменьшение числа тромбоцитов в крови) с общей кровоточивостью, анемию (снижение содержания гемоглобина в крови). Возможно присоединение вторичной инфекции; возможны токсический гепатит (воспаление ткани печени), поражение почек и др.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при беременности, заболеваниях печени и почек, костного мозга.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, по 0,0025 г (2,5 мг) в упаковке по 50 штук в ампулах (для инъекций) по 0,005; 0,05 и 0,1 г.

## 8. Фторурацил (Phthoruracilum)



**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, антиметаболит

**Фармакологическое действие:** Фторурацил относится к группе антиметаболитов нуклеинового обмена (веществ, близких к естественным продуктам обмена веществ, но оказывающих противоположное действие). В отличие от

многих противоопухолевых препаратов эффективен при опухолях желудочно-кишечного тракта. Относительно высокотоксичен (оказывает выраженное повреждающее воздействие), особенно сильно нарушает функции костного мозга и желудочно-кишечного тракта.

**Показания к применению:** Иноперабельные (не поддающиеся хирургическому лечению) формы, рецидивы (повторное появление рака желудка) и метастазы рака желудка (новые опухоли, появившиеся в других органах и тканях в результате переноса раковых клеток с кровью или лимфой из первичной опухоли в желудке); опухоли различных отделов толстой кишки и поджелудочной железы.

**Способ применения:** Внутривенно (медленно) ежедневно по 10-15 мг/кг в день до появления побочных реакций со стороны желудочно-кишечного тракта (понос, рвота и др.). Иногда препарат вводят в тех же дозах ежедневно в течение 4 дней и при отсутствии побочных реакций через день: на 6-й, 8-й, 10-й и 12-й день по 5-7,5 мг/кг. Курс лечения - 12 дней (3-7 г), суточная доза - не более 1 г. При хорошей переносимости через 4-6 нед. курс лечения повторяют. Для улучшения переносимости фторурацила больным иногда назначают кальция фолинат.

**Побочные действия:** Лейкопения (пониженное содержание лейкоцитов в крови), тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови), тошнота, рвота, понос, язвенный стоматит (воспаление с образованием язв слизистой оболочки полости рта), язвенные поражения слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта, алопеция (полное или частичное выпадение волос).

**Противопоказания:** Терминальные стадии заболевания (состояние организма, предшествующее смерти), кахексия (крайняя степень истощения), лейкопения (ниже 3 млрд./л), тромбоцитопения (ниже 100 млрд./л), тяжелые поражения печени и почек. Не следует вводить препарат ранее чем через 3-4 нед. после сложных хирургических вмешательств и ранее чем через 1 мес. после лучевой терапии и лечения другими противоопухолевыми препаратами, а также при обширных метастазах в костный мозг.

**Форма выпуска:** В ампулах по 5 мл 5% раствора в упаковке по 10 штук.

## 9. Батилол (Batilolum)

**Групповая принадлежность:** Гемопоза стимулятор

**Фармакологическое действие:** Стимулирует эритро- и лейкопоз (образование эритроцитов и лейкоцитов). Тормозит уменьшение числа лейкоцитов (форменных элементов крови) и снижение уровня гемоглобина (функциональной структуры эритроцита, обеспечивающей его взаимодействие с кислородом) в крови при лучевом воздействии на организм и способствует быстрому их восстановлению. Малотоксичен (мало вреден).

**Показания к применению:** Для предупреждения и лечения лучевой болезни при рентгено- и радиотерапии. Способ применения: Внутрь по 0,02 г за 30 мин до еды с начала лучевой терапии для профилактики осложнений 2 раза в день, при лучевой болезни 3-4 раза в день. Курс лечения 4-6 нед. при периодическом исследовании крови (1 раз в 7-10 дней). Детям дозу уменьшают в соответствии с возрастом.

**Побочные действия:** Не выявлено. **Противопоказания:** Не установлено.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,02 г в упаковке по 50 штук.

## 10. Полисорб, Полисорб МП (Polysorbum MP)



**Групповая принадлежность:** Абсорбирующее средство

**Фармакологическое действие:** Полисорб МП - неорганический неселективный полифункциональный энтеросорбент на основе высокодисперсного кремнезема с размерами частиц до 0.09 мкм и с химической формулой SiO<sub>2</sub>. Полисорб МП обладает сорбционными, детоксикационными, антиоксидантными и мембраностабилизирующими свойствами.

Препарат адсорбирует из содержимого кишечника и выводит из организма экзо- и эндогенные токсины различного происхождения, включая патогенные бактерии и бактериальные токсины, антигены, пищевые аллергены, лекарственные препараты и яды, соли тяжелых металлов, радионуклиды, алкоголь.

Полисорб МП адсорбирует также некоторые продукты обмена веществ организма (в т.ч. билирубин, мочевины, холестерин и липидные комплексы).

**Показания к применению:** Препарат применяется при острых и хронических интоксикациях у детей и взрослых различной этиологии; острых кишечных инфекциях (в т.ч. пищевые токсикоинфекции); диарейном синдроме

неинфекционной этиологии; дисбактериозе кишечника (в составе комбинированной терапии); гнойно-септических состояниях; острых отравлениях сильнодействующими и ядовитыми веществами (в т.ч. лекарственными препаратами, этанолом, алкалоидами, солями тяжелых металлов); пищевой и лекарственной аллергии; гипербилирубинемии (в т.ч. при вирусном гепатите); гиперазотемии (в т.ч. при хронической почечной недостаточности); для проживающих в экологически неблагоприятных регионах при работе в условиях вредного производства (с целью профилактики).

**Способ применения:** Взрослым препарат Полисорб МП назначают в средней суточной дозе 100-200 мг/кг массы тела (6-12 г). Кратность приема - 3-4 раза/сут. Максимальная суточная доза у взрослых составляет 330 мг/кг массы тела (20 г). 1 чайная ложка Полисорба МП "с верхом" содержит 1 г препарата, 1 ст. ложка "с верхом" - 3 г.

Препарат принимают внутрь только в виде водной суспензии. Для получения суспензии необходимое количество препарата Полисорб МП тщательно размешивают в 1/4-1/2 стакана воды.

Препарат принимают за 1 ч до еды или приема других лекарственных средств. Перед каждым приемом рекомендуется готовить свежую суспензию.

**Побочные действия:** Редко: аллергические реакции, запор.

**Противопоказания:** – язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения; желудочно-кишечные кровотечения; атония кишечника; повышенная чувствительность к компонентам препарата.

При длительном приеме препарата Полисорб МП (более 14 дней) возможно нарушение всасывания витаминов и кальция, в связи с чем рекомендуется профилактический прием поливитаминных препаратов и препаратов, содержащих кальций.

Наружно порошок Полисорба МП можно использовать с целью остановки кровотечения из небольших ран, а также при комплексном лечении гнойных ран, трофических язв и ожогов.

**Форма выпуска:** Порошок для приготовления суспензии для приема внутрь легкий, белый или белый с голубоватым оттенком, без запаха; при взбалтывании с водой образует взвесь. В пакетиках одноразового использования содержится 1, 2, 3, 6, 10, 12 г кремния диоксида. В банках пластиковых 12, 25, 35, 50 г кремния диоксида, 1 банка в картонной пачке.

## 11. Линимент тезана (Linimentum Thesani)

**Групповая принадлежность:** Лейкопозза стимулятор

(Состав: тезана 0,2 г, масла касторового 10 г, эмульгатора 10 г, воды дистиллированной 79,8 г.)

**Фармакологическое действие.** Стимулирует процессы регенерации тканей.

**Показания к применению:** для предупреждения повреждений кожи при лучевой терапии. Эритема; сухой и влажный дерматит после рентгено- и радиотерапии; длительно не заживающие трофические язвы, пролежни, термические и химические ожоги.

**Способ применения:** После каждого сеанса облучения линимент тезана наносят на облучаемую поверхность кожи; при кожных реакциях после лучевой терапии препарат наносят тонким слоем на поврежденную поверхность и накрывают марлевой салфеткой. Процедуры повторяют 2—3 раза в день, не снимая марлевой салфетки. Лечение продолжают в течение 7—10 дней.

**Форма выпуска.** Линимент 0,2% в упаковке по 25 г

## 12. Винкристин (Vincristinum)



**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство.

**Фармакологическое действие:** Противоопухолевое средство.

**Показания к применению:** В комплексной терапии острого лейкоза (злокачественной опухоли крови, возникающей из бластных клеток /клеток костного мозга, из которых образуются лейкоциты, лимфоциты, эритроциты и т. д./ и характеризующейся появлением в кровеносном русле этих незрелых клеток); при лимфосаркоме (злокачественной опухоли, возникающей из незрелых лимфо-идных клеток); саркоме Юинга (злокачественной опухоли костной ткани).

**Способ применения:** Винкристин вводят внутривенно с недельными интервалами. Дозировку препарата следует подбирать строго индивидуально. Назначают взрослым 0,4-1,4 мг/м<sup>2</sup> поверхности тела в неделю, детям - 2 мг/м<sup>2</sup> поверхности тела в неделю. Внутривенно (в полость между легочными обочками) вводят 1 мг препарата, предварительно растворенного в 10 мл физиологического. Следует избегать попадания препарата в глаза и в окружающие ткани из-за сильного раздражающего действия, при попадании на кожу вызывает некроз (омертвление тканей).

**Побочные действия:** Выпадение волос, запор, бессонница, парестезии (чувство онемения в конечностях), атаксия (нарушение движения), мышечная слабость, потеря в весе, повышение температуры тела, лейкопения (пониженное содержание лейкоцитов в крови), реже - полиурия (обильное мочеиспускание), дизурия (расстройства мочеиспускания), язвенные стоматиты (воспаление слизистой оболочки полости рта), тошнота, рвота, потеря аппетита. Нейротоксичность (повреждающее воздействие на центральную нервную систему) раствора. Пожилые больные и люди с неврологическими заболеваниями в анамнезе (бывшим ранее) могут быть более чувствительными к нейротоксическому действию (повреждающему воздействию на центральную нервную систему) винкристина. При одновременном применении с другими нейротоксичными препаратами, при проведении лучевой терапии на область спинного мозга возможно усиление нейротоксического действия винкристина. Частота побочных эффектов препарата связана с суммарной дозой и длительностью терапии.

**Противопоказания:** Раствор винкристина сульфата несовместим в одном объеме в растворе фуросемида (из-за образования осадка).

**Форма выпуска:** В ампулах по 0,5 мг с приложением растворителя в упаковке по 10 штук.

### 13. Хлорбутин (Chlorbutin)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкилирующее соединение

**Фармакологическое действие:** Обладает широким спектром противоопухолевой активности, в большей степени действует на лимфоидную ткань, чем на гранулоциты. Может вызывать необратимую миелосупрессию. Взаимодействует с нуклеофильными центрами ДНК и РНК (особенно гуанином), образует с ними прочные ковалентные связи, нарушает репликацию ДНК и повреждает РНК.

**Показания к применению:** Лимфогранулематоз, неходжкинские лимфомы (лимфо- и ретикулосаркома), хронический лимфолейкоз, волосатоклеточный лейкоз, миеломная болезнь, макроглобулинемия Вальденстрема, болезнь Леттерера-Сиве, рак яичника, молочной железы, хорионэпителиома матки, нефротический синдром.

**Способ применения:** Внутрь. Хронический лимфолейкоз — 2–10 мг (в зависимости от степени лейкоцитоза) в сутки. Общая доза на курс — 200–400 мг, его длительность — 3–6 нед; при уменьшении числа лейкоцитов до 25000–20000/мл в крови, больного переводят на поддерживающую терапию — по 2–6 мг в неделю в течение года и более.

Лимфогранулематоз (без лейко- и тромбоцитопении) — ежедневно — 20 мг, затем (к концу курса) — 10 мг; общая доза на курс — 400–500 мг.

**Побочные действия:** Миелодепрессия (лейкопения, тромбоцитопения, анемия).

**Передозировка:** Симптомы: выраженная лейкопения (сохраняется в течение 10–12 дней после отмены препарата).

**Противопоказания:** Тяжелые поражения печени и почек, острые заболевания ЖКТ, период непосредственно после применения других цитостатиков или лучевой терапии, выраженная лейкопения, тромбоцитопения и анемия (обусловленные развитием злокачественного процесса).

**Форма выпуска:** Таблетки 2 мг; банка (баночка) темного стекла 100 коробка (коробочка) 1; таблетки 5 мг; банка (баночка) темного стекла 100 коробка (коробочка) 1; таблетки 2 мг; банка (баночка) темного стекла 100 коробка (коробочка) 1; таблетки 5 мг; банка (баночка) темного стекла 100 коробка (коробочка) 1. 1 таблетка содержит хлорамбуцила 2 или 5 мг; во флаконах по 100 шт.

### 14. Батилол (Batilolum)

**Групповая принадлежность:** Гемопоза стимулятор

**Фармакологическое действие:** Стимулирует эритро- и лейкопоз (образование эритроцитов и лейкоцитов). Тормозит уменьшение числа лейкоцитов (форменных элементов крови) и снижение уровня гемоглобина (функциональной структуры эритроцита, обеспечивающей его взаимодействие с кислородом) в крови при лучевом воздействии на организм и способствует быстрому их восстановлению. Малотоксичен (мало вреден).

**Показания к применению:** Для предупреждения и лечения лучевой болезни при рентгене- и радиотерапии.

**Способ применения:** Внутрь по 0,02 г за 30 мин до еды с начала лучевой терапии для профилактики осложнений 2 раза в день, при лучевой болезни 3–4 раза в день. Курс лечения 4–6 нед. при периодическом исследовании крови (1 раз в 7–10 дней). Детям дозу уменьшают в соответствии с возрастом.

**Побочные действия:** Не выявлено. **Противопоказания:** Не установлено.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,02 г в упаковке по 50 штук.

### 15. Меркаптопурин (Mercaptopurinum)



**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, антиметаболит

**Фармакологическое действие:** Замедляет течение лейкозов (злокачественной опухоли крови, возникающей из бластных клеток /клеток костного мозга, из которых образуются лейкоциты, лимфоциты, эритроциты и т. д./, и характеризующейся появлением в кровеносном русле этих незрелых клеток). Препарат уменьшает количество незрелых форм клеток крови: гемоцитобластов (клеток костного мозга, из которых развиваются все форменные элементы крови) и лимфобластов (клеток костного мозга, из которых развиваются форменные элементы крови - лимфоциты).

**Показания к применению:** В комплексе с другими лекарственными средствами при остром лейкозе; обострении хронического миелолейкоза, протекающего по типу острого лейкоза (форме рака крови, при котором источником опухолевого процесса являются гранулоцитарные клетки /клетки костного мозга, из которых развиваются форменные элементы крови - лейкоциты/, в результате обострения болезни появляющиеся в большом количестве в кровеносном русле). Меркаптопурин, благодаря наличию иммунодепрессивной (подавляющей иммунитет /защитные силы организма/) активности, применяют для лечения ревматоидного артрита (инфекционно-аллергической болезни из группы коллагенозов, характеризующейся хроническим прогрессирующим воспалением суставов), волчаночного нефроза (поражения почечной ткани при волчанке), а также псориаза.

**Способ применения:** Внутрь ежедневно по 0,002-0,0025 г/кг в 1 или 2 приема, При хорошей переносимости дозу повышают до 0,005 г/кг. Лечение проводят при тщательном клиническом и гематологическом контроле (контроле клеточного состава крови).

**Побочные действия:** При повышенной чувствительности к препарату наблюдаются тенденция к геморрагиям (кровотечениям) и диспепсические явления (расстройства пищеварения). Токсическое (повреждающее действие) препарата на организм проявляется в угнетении кроветворения (лейкопения /пониженное содержание лейкоцитов в крови/, тромбоцитопения /уменьшение числа тромбоцитов в крови/, ретикулоцитопения /уменьшение содержания эритроцитов в крови/).

**Противопоказания:** Заболевания, сопровождающиеся нарушением функции печени и почек.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 г в упаковке по 50 штук.

### 16. Мексамин (Mexaminum)

**Групповая принадлежность:** Серотониновых рецепторов стимулятор

**Фармакологическое действие:** Важной особенностью мексамина является его радиозащитная активность. В условиях эксперимента он снижает смертность животных, подвергшихся воздействию рентгеновского или гамма-облучения, а также протонов высоких энергий. В механизме радиозащитного действия важное значение имеет, по-видимому, вызываемая препаратом гипоксия (нехватка кислорода) в "критических" органах - костном мозге, селезенке и др., что, возможно, связано с сужением в этих органах кровеносных сосудов. У больных, подвергшихся рентгенотерапии по поводу злокачественных новообразований, предварительный прием внутрь мексамина уменьшает явления лучевой реакции.

**Показания к применению:** Применяют для профилактики общей лучевой реакции при лучевой терапии. Способ применения: Назначают внутрь по 0,05 г (1 таблетка) за 30-40 мин перед каждым сеансом лучевой терапии. При хорошей переносимости доза может быть увеличена до 0,1 г.

**Побочные действия:** Препарат обычно хорошо переносится. В отдельных случаях возможны легкая тошнота, головокружение, боли в эпигастральной области (области живота, располагающейся непосредственно под местом схождения реберных дуг и грудины), реже рвота. Побочные явления могут уменьшаться при применении кофеина. При плохой переносимости дальнейший прием препарата прекращают.

**Противопоказания:** Противопоказан при выраженном склерозе сосудов сердца и мозга, сердечно-сосудистой недостаточности (ухудшении кровоснабжения органов и тканей вследствие снижения насосной функции сердца), бронхиальной астме, заболеваниях почек с нарушением их функции, при беременности.

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,05 г (50 мг), покрытые оболочкой.

### 17. Фторафур (Phthorafurum)





**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, антиметаболит

**Фармакологическое действие:** Противоопухолевое действие фторафура обусловлено фторурацилом, высвобождающимся в организме в результате его метаболизма (реакций превращения в организме). По сравнению с фторурацилом фторафур лучше переносится больными. На кроветворение действует подобно фторурацилу, вызывая в больших дозах лейкопению (пониженное содержание лейкоцитов в крови), тромбоцитопению (уменьшение числа тромбоцитов в крови), анемию (снижение содержания гемоглобина в крови). При приеме внутрь фторафур быстро всасывается.

**Показания к применению:** Применяют при злокачественных опухолях желудка, толстой, слепой и прямой кишки, раке молочной железы, при ретикулезе кожи (прогрессирующем разрастании ретикулярных /сетчатых/ клеток кожи), а также при диффузных нейродермитах (/печесухе обыкновенной/ зудящем заболевании кожи, располагающемся симметрично на сгибательной поверхности конечностей, лица, половых органов) и эндогенных увеитах (воспалении сосудистой оболочки глазного яблока).

**Способ применения:** Раствор натриевой соли вводят внутривенно ежедневно 1-2 раза в сутки с интервалом между введениями 12 ч. Суточная доза составляет обычно 30 мг/кг, но не более 2 г. Общая доза на курс лечения - 30-40 г. Внутрь назначают фторафур в капсулах. Суточная доза - 1,6-2,0 г (30 мг/кг) в 2 приема с промежутком 12 ч. Доза на курс лечения - 40-60 г. При необходимости проводят через 1,5-2 мес. повторные курсы.

**Побочные действия:** При длительном применении фторафура и его натриевой соли и при повышенной чувствительности больного возможно возникновение тошноты, рвоты, стоматита (воспаления слизистой оболочки полости рта), диареи (поноса), лейкопении, тромбоцитопении. Лечение должно проводиться под контролем состояния кроветворения. В случае нарушений процессов кроветворения вливают 100-125 мл крови 2-3 раза в неделю. При внутривенном введении препарата возможно головокружение. Во избежание этого рекомендуется производить вливание фторафура при положении больного лежа.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при уровне лейкоцитов ниже  $3 \cdot 10^9/\text{л}$  и тромбоцитов ниже  $100 \cdot 10^9/\text{л}$ , в терминальных стадиях болезни (при состоянии организма, предшествующем смерти), при заболеваниях печени и почек, при острых профузных (обильных) кровотечениях, резко выраженных анемиях. Применение препарата допускается не ранее чем через месяц после предшествующего лучевого или химиотерапевтического лечения. Применение фторафура методом фонофореза противопоказано при гипотензии глаза (понижении внутриглазного давления), отслойке сетчатки и заболеваниях, при которых исключается лечение ультразвуком.

**Форма выпуска:** 4% раствор натриевой соли в ампулах по 10 мл (0,4 г в ампуле); желатиновые капсулы, содержащие по 0,4 г фторафура, в упаковке по 100 капсул.

### 18. Тиофосфамид (Thiophosphamidum)

**Групповая принадлежность:** Противоопухолевое средство, алкилирующее соединение

**Фармакологическое действие:** Тиофосфамид оказывает цитостатическое (препятствующее росту клеток) действие и угнетает развитие пролиферирующей (увеличивающей число образующих ее клеток), в том числе злокачественной ткани. В механизме действия препарата важную роль играют нарушение обмена нуклеиновых кислот и блокада митотического деления клеток.

**Показания к применению:** Применяют тиофосфамид при раке яичников (при запущенных формах, для предоперационного лечения, в послеоперационном периоде); раке молочной железы (при рецидивах - повторном появлении признаков болезни и метастазах - новых опухолях, появившихся в результате переноса раковых клеток с кровью или лимфой из первичного очага), неоперабельных (не поддающихся хирургическому лечению) опухолях, для лечения канцероматозного плеврита (воспаления оболочек легких в результате распространения на них опухолевого процесса), в послеоперационном периоде) и некоторых других опухолях: мезотелиоме (злокачественной опухоли, развивающейся из клеток, выстилающих наружную поверхность внутренних органов), ретинобластоме (злокачественной опухоли сетчатки глаза), раке мочевого пузыря. Применение тиофосфамида способствует уменьшению числа рецидивов и метастазов после радикальной мастэктомии (хирургического удаления молочной железы и прилегающих к ней лимфатических узлов), а при комплексном лечении рака

молочной железы повышает процент безрецидивного течения процесса (без повторного возникновения симптомов заболевания).

**Способ применения:** Тиофосфамид можно вводить внутримышечно, внутривенно, внутриартериально и в полости (внутриплеврально - в полость между оболочками легкого и внутрибрюшинно - в брюшную полость). Возможно также непосредственное введение в опухоль. Растворы готовят непосредственно перед применением: вводят из шприца во флакон 5 или 10 мл стерильной воды для инъекций. Дозы и сроки лечения должны быть строго индивидуальными в зависимости от характера заболевания, общего состояния больного, эффективности лечения и переносимости препарата. Больным с массой тела 60-70 кг назначают тиофосфамид обычно в разовой дозе 0,015 г (15 мг); больным с устойчивой кроветворной системой можно в начале курса лечения вводить по 20 мг; больным с небольшой массой тела и со склонностью к лейкопении (уменьшению числа лейкоцитов в крови) назначают 10 мг. Препарат вводят через день (3 раза в неделю). На курс лечения - 0,15-0,2 г (150-200 мг). Во время лечения систематически исследуют кровь. Дополнительный курс назначают при восстановлении до нормы количества лейкоцитов и тромбоцитов.

**Побочные действия:** При лечении тиофосфамидом необходимо не реже чем через день контролировать содержание лейкоцитов и 2 раза в неделю - содержание тромбоцитов. Общий анализ крови производят 1 раз в неделю. **Противопоказания:** Тиофосфамид противопоказан при общем тяжелом состоянии и кахексии (крайней степени истощения), при количестве лейкоцитов в периферической крови ниже 4 млрд./л и тромбоцитов ниже 150 млрд./л, непосредственно после лучевой терапии (введение тиофосфамида допустимо через месяц после окончания лучевой терапии при условии восстановления картины крови). Противопоказаниями к применению тиофосфамида при хронических лейкозах являются алейкические формы заболевания (форма течения рака крови) - число лейкоцитов менее  $20 \times 10^9$  л; тромбоцитопения (уменьшение числа тромбоцитов в крови ниже 200 млрд./л), выраженная анемия (количество эритроцитов ниже 3 трлн./л).

**Форма выпуска:** Порошок или таблетки по 0,01-0,02 г для приготовления инъекционных растворов в герметически закупоренных флаконах (по 1 таблетке во флаконе). Условия хранения:

### 19. Энтеросгель (Enterosgelum)



**Групповая принадлежность:** Энтеросорбирующее средство

**Фармакологическое действие:** Действующим веществом энтеросгеля является метилкремниевая кислота в виде гидрогеля. Препарат относится к энтеросорбентам. Оказывает детоксикационное действие при приеме внутрь. Кремний-органическая матрица гидрогеля метилкремниевой кислоты эффективно абсорбирует из крови (за счет действия через мембраны ворсинок клеток слизистой оболочки кишечника) и из кишечного содержимого продукты незавершенных метаболических реакций, среднемолекулярные токсические вещества (с молекулярной массой 70-1000) и инкорпорированные радионуклиды. После абсорбции выводит их из организма с калом. Также связывает и выводит микроорганизмы (условно-патогенные и патогенные). Купирует проявления токсикоза, нормализует лабораторные показатели мочи и крови, улучшает функционирование печени, почек и кишечника. Предупреждает развитие эрозивно-язвенных поражений слизистой оболочки желудочно-кишечного тракта при влиянии агрессивных внешних факторов за счет обволакивающего действия. Улучшает пристеночное пищеварение. Активизирует перистальтические движения кишечника, не вызывает атонию. Препарат не абсорбируется в системный кровоток. Стабилизирует иммунные реакции благодаря эффективной детоксикации.

**Показания к применению:** Инфекционно-токсические заболевания печени (вирусный гепатит А и В, токсический гепатит, цирроз печени, гепатохолецистит); заболевания почек, особенно с развитием хронической почечной недостаточности (гломерулонефрит, пиелонефрит, поликистоз почек и др.); холестаза различного генеза, в том числе при присоединении аллергических реакций и печеночной недостаточности; заболевания желудочно-кишечного тракта (энтероколит, гастрит, колит, диарея, пострезекционный синдром, язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки и др.); пищевая и лекарственная аллергия

инфекционно-аллергическая и атопическая бронхиальная астма, дерматит атопический, крапивница экзема, и др.); диарея и диспепсия неинфекционного генеза, инфекционные заболевания (сальмонеллез, пищевая токсикоинфекция, дизентерия, ротавирусные инфекции); интоксикации (включая наркотическую, ожоговую, гнойно-септическую и алкогольную интоксикации); кожные заболевания (нейродермит, диатез и др.); ранний гестоз, комплексное лечение дисбактериоза кишечника, злокачественные заболевания (для детоксикации перед и после операции, во время лучевой или химиотерапии).

**Способ применения:** Энтеросгель назначается внутрь. Лекарственная форма – паста – полностью готова к применению. Длительность лечения определяется индивидуально. В среднем продолжительность терапии – 7-14 дней, в случае выраженной интоксикации возможно увеличение дозы в 2 раза в первые 3 дня терапии. При механической желтухе, циррозе печени возможно назначение более длительного времени (2 месяца и больше). Энтеросгель следует запивать достаточным количеством воды. Принимать препарат следует между приемами лекарственных средств пищи (спустя 2 часа после приема еды или лекарственного средства или за 1,5-2 часа до приема). Суточная доза (45 г для взрослых) разделяется в 3 приема. Разовая дозировка – 1 столовая ложка (15 г) – для взрослых. В педиатрии: детям до 3 лет – 1 чайная ложка (5 г) 2 раза в сутки (суточная доза – 10 г); детям 3-5 лет – по 1 чайной ложке 3 раза в сутки (суточная доза – 15 г), детям 5-14 лет – по 1 десертной ложке (10 г) 3 раза в сутки (суточная доза – 30 г).

**Побочные действия:** Могут наблюдаться запоры (особенно у пациентов со склонностью к запорам) в первые дни приема средства. При развитии запора рекомендуется провести очистительную клизму (в первые 2 дня применения энтеросгеля).

**Противопоказания:** Энтеросгель не назначают при острой кишечной непроходимости. После устранения кишечной непроходимости энтеросгель не противопоказан.

**Форма выпуска:** Паста для внутреннего применения в контейнерах 135; 270; 405 г. Пластиковый контейнер упакован в картонную коробку.

## ЛЕКАРСТВЕННАЯ ТОКСИКОЛОГИЯ

В медицинской практике достаточно часто встречаются ситуации связанные с осложнениями медикаментозной терапии, а именно с передозировкой и отравлениями лекарственными препаратами.

Лечение отравлений – индивидуально и связано, прежде всего, с фармакологической группой лекарственных средств и конкретным лекарственным препаратом, в результате передозировки которого наступила острая интоксикация.

Вместе с тем, существует определенная общая схема лечения отравлений вызванных отравлениями лекарственными препаратами, состоит из следующих четырех основных этапов:

1. Предупреждение всасывания вещества (яда) в кровь;
2. Нейтрализации уже всосавшегося вещества (яда) с помощью антидотной терапии или ослабление его действия функциональным антагонистом;
3. Ускоренное выведение вещества (яда) из организма;
4. Симптоматическая терапия, направленная на восстановление нарушенных жизненно важных функций организма (дыхания, сердцебиения, кровообращения);



Перечисленные мероприятия, как правило, должны проводиться одновременно и параллельно а не последовательно.

### Предупреждение всасывания вещества в кровь

С кожных покровов и слизистых оболочек ядовитое вещество удаляется путем смывания обильным количеством жидкости (как правило, холодной воды).

При попадании ядовитого вещества внутрь – необходимо промыть желудок через зонд. Возможно применение рвотных средств (например, апоморфина гидрохлорида 1% подкожно). Для нейтрализации ядовитого вещества в желудке при промывании целесообразно использовать раствор перманганата калия (1: 5000 – 1:10000), который окисляет органические соединения (например, алкалоиды).

Для предупреждения всасывания ядовитого вещества в кровь также применяется раствор танина (0,5%), поскольку танин осаждает многие органические и неорганические соединения, образуя с ними нерастворимые комплексы.

Нерастворимые, комплексные соединения со многими ядовитыми веществами образуют также белки (яичный белок или белки содержащиеся в молоке, которые в народной медицине издавна применялись в качестве противоядий).

При отравлении ядовитыми веществами и лекарственными препаратами целесообразно применить адсорбирующие средства, прежде всего, активированный уголь. Активированный уголь адсорбирует как органические так и неорганические соединения, тормозит всасывание ядовитых веществ в кровь. Препарат назначают в сочетании с промыванием желудка.

Активированный уголь вводят внутрь в виде водной кашицы (2-3 столовых ложки на 1-2 стакана воды), обладает высокой сорбционной способностью ко многим алкалоидам (атропин, кокаин, кодеин, морфин, стрихнин и пр.), гликозидам (строфантин, дигитоксин и пр.), а также микробным токсинам, органическим и в меньшей степени неорганическим веществам. Один грамм активированного угля может адсорбировать до 800 мг морфина, до 700 мг барбитуратов, до 300 мг алкоголя.

Способностью связывать ядовитые вещества, кроме активированного угля, обладают танин, марганцовокислый калий, которые добавляют к промывной воде. С этой же целью. используют обильное питье молока, белковой воды, яичных белков (по показаниям).

Обволакивающие средства (до 12 яичных белков на 1 л кипяченой холодной воды, растительные слизи, кисели, растительное масло, водная смесь крахмала или муки) особенно показаны при отравлениях раздражающими и прижигающими ядами, такими как кислоты, щелочи, соли тяжелых металлов.

Высокой адсорбирующей способностью (во многом превосходящие активированный уголь) обладают такие лекарственные средства, как полифепан, энтеросгель, полисорб, полисорб МП и пр. Препараты также могут назначаться при поносах, метеоризме и других расстройствах желудочно-кишечного тракта.

Применение солевых слабительных средств (например, магния сульфата) препятствуют всасыванию жидкости из кишечника, блокируя поступления ядовитых веществ из кишечника в кровь.

### **Нейтрализация ядовитых веществ**

Нейтрализация ядов всасавшихся в кровь достигается применением антидоты (противоядия). Чем раньше введен антидот, тем благоприятнее прогноз и выше эффективность этого антидота, для достижения максимально быстрого эффекта антидоты вводятся в организм, как правило, парентерально.

Так, при отравлении солями тяжелых металлов (ртути, мышьяка, висмута, меди, свинца, железа, марганца и пр.) эффективным антидотом является лекарственный препарат унитиол, который вводится внутримышечно. Унитиол содержит СН – группы, вследствие чего образует стойкие нерастворимые и малотоксичные соединения с металлами и металлоидами, которые выводятся с мочой.

При отравлении ФОС – реактиваторы холинэстеразы – дипироксим.

При отравлении солями цианидами, ртути, свинца и мышьяка антитоксическую активность проявляет натрия тиосульфат. Препарат вводится внутривенно, в виде 30% раствора (от 10 до 50 мл.).

Соединения этилендиаминтетраацетата (ЭДТА), также способны образовывать нерастворимые, нетоксичные соединения в большинстве металлов (свинцом, железом, медью, цинком, марганцем и пр.). Эти соединения применяются в качестве средства комплексной терапии (лекарственный препарат – тетагин кальция, вводится внутривенно).

Некоторые ядовитые вещества, а также лекарственные средства способны оказывать токсическое действие на организм человека, образуя комплексные соединения с гемоглобином переводя его в метгемоглобин. Поскольку метгемоглобин не способен выполнять функции по переносу кислорода, при отравлении такими веществами возникает кислородное голодание. Для обратной трансформации метгемоглобина в гемоглобин применяется метиленовый синий.

Ослабление действия ядовитых и токсических веществ на организм достигается также при применении функциональных антагонистов. Так, М-холиноблокатор атропин – применяется при отравлении антихолинэстеразными средствами, М-холиномиметиками, налоксон – при отравлении морфином, протамина сульфат – при передозировке гепарина, магния сульфат – при передозировке препаратами кальция и т.д.

**Симптоматическая терапия**, применяемая при лечении отравлений, связана с устранением негативных симптомов вызванных действием ядов.

Симптоматическая терапия направлена на восстановления нарушенных функций организма: восстановление деятельности центральной нервной системы, дыхания, функционирования сердечно-сосудистой системы и пр. В качестве средств симптоматической терапии могут применяться, в том числе упомянутые выше, функциональные антагонисты ядовитых веществ.

В качестве средств симптоматической терапии, например при отравлении наркотическими анальгетиками, могут назначаться аналептики (камфора, кордиамин, бемеград, кофеин и пр.), стимуляторы сердечной деятельности (сердечные гликозиды). В случае падения артериального давления – средства его повышающие (адреналин, норадреналин, эфедрин и пр.), для уменьшения отечности применяют мочегонные средства (фуросемид и пр.).

При угнетении дыхания – вводятся дыхательные аналептики (кордиамин, бемеград, кофеин).

При снижении АД – мезатон, норадреналин, кордиамин.

Ингаляции кислорода – при дыхательной недостаточности.

Сердечные гликозиды (коргликон, строфантин) при сердечной недостаточности.

Раствор натрия гидрокарбоната – при ацидозе.

Электролиты (калия хлорид, натрия хлорид, магния сульфат, кальция хлорид) вводятся при нарушении электролитного баланса.

### **Ускорение выведения ядовитых веществ из организма**

Одним из этапов оказания помощи при отравлении лекарственными средствами и ядовитыми веществами является их ускоренное удаление из организма. Активную детоксикацию организма производят в специализированных центрах по лечению отравлений.

Применяют следующие методы:

1. Форсированный диурез — основан на использовании мочегонных средств (мочевина, маннитол, лазикс, фуросемид) и др. методов, которые способствуют повышенному выделению мочи. Метод используют при большинстве интоксикации, когда выведение токсических веществ осуществляется преимущественно почками.

Водная нагрузка создается обильным питьем щелочных вод (до 3-5 л в сутки) в сочетании с мочегонными средствами. Больным в коматозном состоянии или с выраженными диспепсическими расстройствами делают подкожное или внутривенное введение раствора хлористого натрия или раствора глюкозы.

При бессознательном состоянии больному внутривенно вводят изотонический раствор глюкозы или натрия хлорида (до 3 – 5 л в сутки). Введение в организм большого количества жидкости увеличивает объем циркулирующей крови и уменьшает концентрацию яда, а применение диуретических средств способствует быстрому выведению жидкости.

Противопоказания к проведению водной нагрузки — острая сердечно-сосудистая недостаточность (отек легких) или почечная недостаточность.

Алкалинизация мочи создается внутривенным капельным введением раствора бикарбоната натрия до 1,5-2 л в сутки под контролем определения щелочной реакции мочи и резервной щелочности крови. При отсутствии диспепсических расстройств можно давать бикарбонат натрия (питьевую соду) внутрь по 4-5 г каждые 15 минут в течение часа, в дальнейшем по 2 г каждые 2 часа. Алкалинизация мочи является более активным

диуретическим средством, чем водная нагрузка, и широко применяется при острых отравлениях барбитуратами, салицилатами, алкоголем и его суррогатами. Противопоказания те же, что и при водной нагрузке.

Осмотический диурез создается при помощи внутривенного введения осмотически активных диуретических препаратов, значительно усиливающих процесс обратного всасывания в почках, что позволяет добиться выделения с мочой значительного количества яда, циркулирующего в крови. Наиболее известными препаратами этой группы являются: гипертонический раствор глюкозы, раствор мочевины, маннитола.

2. Гемодиализ — метод, при котором используется аппарат "искусственная почка" как мера неотложной помощи. По скорости очищения крови от ядов в 5-6 раз превосходит форсированный диурез.

3. Перитонеальный диализ — ускоренное выведение токсических веществ, обладающих способностью скапливаться в жировых тканях или прочно связываться с белками крови. При операции перитонеального диализа через фистулу, вшитую в брюшную полость, вводят 1,5-2 литра стерильной диализирующей жидкости, меняя ее через каждые 30 минут.

4. Гемосорбция (гемосорбция (от греч. haema кровь + лат. sorbere поглощать) — метод лечения, направленный на удаление из крови различных токсических продуктов и регуляцию гомеостаза путем контакта крови с сорбентом вне организма) — метод перфузии (перегонки) крови больного через специальную колонку с активированным углем или другим сорбентом.

5. Операция замещения крови проводится при острых отравлениях химическими веществами, вызывающими токсическое поражение крови. Используют 4-5 литров одноклассной, резус-совместимой, индивидуально подобранной донорской крови.

Средствами быстрого удаления яда из кишечника являются солевые слабительные средства (магния сульфат), действие которых наступает достаточно быстро. Кроме того, солевые слабительные препятствуют всасыванию жидкости из кишечника, блокируя таким образом всасывание яда из кишечника в кровь.

Таким образом, лечение острых отравлений лекарственными средствами включает комплекс детоксикационных мероприятий в сочетании с симптоматической, и если это необходимо, интенсивной терапией!

## **Примеры оказания медицинской помощи при отравлении отдельными веществами**

### **1. Снотворные средства (барбитураты)**

Все производные барбитуровой кислоты (фенобарбитал, барбитал, мединал, этаминалпатрий, смесь Серейского, тардил, белласпон, бромитал и др.) довольно быстро всасываются и практически полностью в желудочно-кишечном тракте. Смертельная доза: около 10 врачебных доз с большими индивидуальными различиями.



Острое отравление снотворными прежде всего сопровождается угнетением функций центральной нервной системы. Ведущим симптомом является нарушение дыхания и прогрессирующее развитие кислородного голодания. Дыхание становится редким, прерывистым. Все виды рефлекторной деятельности подавлены. Зрачки вначале суживаются и реагируют на свет, а затем (вследствие кислородного голодания) расширяются и на свет уже не реагируют. Резко страдает функция почек: уменьшение диуреза способствует медленному выделению барбитуратов из организма. Смерть наступает в результате паралича дыхательного центра и острого нарушения кровообращения.

**Наблюдаются 4 клинические стадии интоксикации.**

Стадия 1 — "засыпания": характеризуется сопливостью, апатией, снижением реакций на внешние раздражители, однако контакт с больным может быть установлен.

Стадия 2 — "поверхностной комы": отмечается потеря сознания. На болевое раздражение больные могут отвечать слабой двигательной реакцией, кратковременным расширением зрачков. Затрудняется глотание и ослабевает кашлевой рефлекс, присоединяются нарушения дыхания из-за западения языка. Характерно повышение температуры тела до 39°-40°С.

Стадия 3 — "глубокой комы": характеризуется отсутствием всех рефлексов, наблюдаются признаки угрожающего нарушения жизненно важных функций организма. На первый план выступают нарушения дыхания от поверхностного, аритмичного до полного его паралича, связанного с угнетением деятельности центральной нервной системы.

В стадии 4 — "посткоматозном состоянии" постепенно восстанавливается сознание. В первые сутки после пробуждения у большинства больных наблюдаются плаксивость, иногда умеренное психомоторное возбуждение, нарушение сна.

Наиболее частыми осложнениями являются пневмонии, трахеобронхиты, пролежни.

**Первая помощь.** Отравление снотворными требует неотложной помощи. В первую очередь необходимо удалить яд из желудка, уменьшить его содержание в крови, поддержать дыхание и сердечно-сосудистую систему. Яд из желудка удаляют путем его промывания (чем раньше начато промывание, тем оно эффективнее), расходуя 10-13 л воды, целесообразно повторное промывание, лучше всего через зонд. Если пострадавший находится в сознании и отсутствует зонд, промывание можно осуществить повторным приемом нескольких стаканов теплой воды с последующим вызыванием рвоты (раздражение зева). Рвоту можно вызвать порошком горчицы (1/2-1 чайная ложка на стакан теплой воды), поваренной солью (2 столовые ложки на стакан воды), теплой мыльной водой (один стакан) или рвотным средством, в том числе апоморфина подкожно (1 мл 0,5%).

Для связывания яда в желудке используют активированный уголь, 20-50 г которого в виде водной эмульсии вводят в желудок. Прореагировавший уголь (через 10 минут) необходимо удалить из желудка, так как адсорбция яда представляет обратимый процесс. Та часть яда, которая прошла в желудок, может быть удалена с помощью слабительных. Предпочтение отдается сульфату натрия (глауберова соль), 30-50 г. Сульфат магния (горькая соль) при нарушении функции почек может оказать угнетающее действие на ЦНС. Не рекомендуется касторовое масло.

Для ускоренного выведения всосавшихся барбитуратов и выделения их почками дают обильное питье и мочегонные средства. Если больной находится в сознании, то жидкость (обычная вода) принимается внутрь, в случаях тяжелого отравления внутривенно вводят 5% раствор глюкозы или изотонический раствор натрия хлорида (до 2-3 л в сутки). Эти

мероприятия осуществляют лишь в тех случаях, если выделительная функция почек сохранена.

Для ускоренного выведения яда и избытка жидкости назначают внутривенно быстродействующий диуретик. При выраженном нарушении дыхания проводится интубация, отсасывание содержимого бронхов и искусственная вентиляция легких, при менее значительных расстройствах дыхания прибегают к применению стимуляторов дыхания (аналептики). Для профилактики пневмоний назначают антибиотики, при резком повышении температуры — внутримышечно 10 мл 4% раствора амидопирина. Для восстановления сосудистого тонуса используют сосудосуживающие средства. Для стимуляции сердечной деятельности — гликозиды быстрого действия, при остановке сердца показано введение адреналина в полость левого желудочка с последующим массажем через грудную клетку.

## 2. Противодепрессивные препараты

В группу аптидепрессантов входят имизин (имипрамин), амитриптилин, азафен, фторацизин и др. Они хорошо всасываются в желудочно-кишечном тракте, легко связываются с белками кропи и органов, быстро распределяются по организму, оказывая токсический эффект.

Прогноз всегда серьезен и летальность при приеме более 1 г превышает 20%.

**Симптомы.** Характерны изменения со стороны центральной и сердечно-сосудистой системы. Уже с ранние сроки после отравления возникает психомоторное возбуждение, появляются галлюцинации, резко падает температура тела, развивается кома с угнетением дыхания. Острая кардиопатия и остановка сердца — главная причина смерти при данных отравлениях. Основные проявления токсического действия на миокард выражены на протяжении первых 12 ч, но могут развиваться и в течение последующих 6 суток.

Тяжесть отравления проявляется резким расширением зрачков, сухостью слизистой оболочки рта, нарушением моторики желудочно-кишечного тракта вплоть до пареза кишечника.

**Первая помощь.** Промывание желудка раствором гидрокарбоната натрия (питьевой соды), раствором поваренной соли или водой с активированным углем. Промывание проводится в первые 2 ч после отравления, а затем повторно. Одновременно вводится солевое слабительное, ставится очистительная клизма. Применяются рвотные средства, искусственное дыхание при возникновении дыхательной недостаточности. Противопоказаны сердечные гликозиды, так как токсичность трициклических антидепрессантов при этом резко возрастает.

Для коррекции сосудистого тонуса используют гипертензин. Для купирования судорог и психомоторного возбуждения целесообразно применение барбитуратов и аминазина. Основным препаратом, дающим антидотный эффект является физостигмин, который вводится внутривенно. Критерий его эффективности — снижение пульса до 100-120 ударов в минуту и повышение артериального давления (100/80 мм рт. ст.).

## 3. Транквилизаторы

К препаратам данной группы относятся мепротан (андаксин, мепробамат), диазепам (седуксен, реланиум, валиум), нитразепам, триоксазин, элениум, либриум и др. средства,

обладающие выраженным транквилизирующим или успокаивающим действием. Все вещества легко всасываются в желудочно-кишечном тракте и образуют прочные соединения с белками крови и тканей.

**Симптомы.** Клиническая картина проявляется в угнетении центральной нервной системы. На фоне мышечной слабости отмечается тремор (дрожание) конечностей, нарушение ритма сердца, падение артериального давления. Усиливается моторика или резко угнетается перистальтика желудочно-кишечного тракта, сочетающаяся со снижением секреции слюны и ощущением сухости во рту.

При тяжелых отравлениях преобладают симптомы со стороны ЦНС: спутанность сознания, психомоторное возбуждение, галлюцинации, судороги. Со стороны сердечно-сосудистой системы — тахикардия, склонность к коллапсам; нарушение дыхания, цианоз.

**Первая помощь.** Ранние частые и повторные промывания желудка с активированным углем, солевое слабительное, сифонная клизма. Велика роль консервативной терапии с целью поддержания жизненных функций: применение сосудосуживающих средств при резкой недостаточности кровообращения, введение сердечных средств (строфантин, кокарбоксилаза, коргликон), введение щелочных растворов, коррекция судорожного состояния и внешнего дыхания, включая кислородотерапию.

#### 4. Стимуляторы центральной нервной системы

Группа кофеина и его апологи (теофиллин, теобромин, эуфиллин, аминофиллин, теофедрин, дипрофиллин и др.). Из всей группы наибольшим стимулирующим действием обладает кофеин, токсическая доза которого находится на уровне 1 г, а смертельная доза — около 20 г с большими индивидуальными различиями. При внутривенном введении эуфиллина бывают случаи смерти от дозы порядка 0,1 г, летальные дозы у детей при введении в свечах — 25100 мг/кг.

**Симптомы.** Основные признаки токсического действия при длительном употреблении относительно больших доз (например, у людей злоупотребляющих кофе и чаем) проявляются в раздражительности, беспокойстве, возбудимости, в устойчивой головной боли, мало поддающейся лекарственной терапии, расстройствах сна. Влияние на желудочно-кишечный тракт проявляется ощущением жжения в подложечной области, тошнотой, рвотой, резким повышением желудочной секреции, что особенно опасно для язвенных больных, запорами.

Острое отравление кофеином выражается в психомоторных реакциях, переходящих в бред и галлюцинации, бывают нарушения сенсорных функций (определение времени и дистанции) и скорости движения. Начальная фаза возбуждения быстро сменяется сопорозным состоянием. Наиболее опасное осложнение кофеином и его аналогами — развитие острой сердечно-сосудистой недостаточности с явлениями коллапса. Паралич сердца возможен также при быстром введении в вену эуфиллина.

**Первая помощь.** Промывание желудка 1-2 % раствором танина или гидрокарбоната натрия (питьевой соды), взвесью активированного угля. Если отравление вызвано свечами, содержащими эуфиллин, ставят клизму, принимают солевое слабительное.

Для купирования психомоторного возбуждения и судорог используют хлоралгидрат в клизме (1,5-2 г на 50 мл воды), аминазин (2 мл 2,5 % раствора на новокаине), димедрол (1 мл 2% раствора с новокаином) — внутримышечно.

Коррекция сердечно-сосудистой недостаточности в случае отравления кофеином затруднительна в условиях доврачебной помощи, так как большинство сосудосуживающих средств будут усиливать токсический эффект кофеина и его аналогов. Целесообразно этот вид реанимации проводить в условиях стационара, где может быть произведено обменное переливание крови (плазмы) и использован форсированный диурез с ошелачиванием.

### 5. Стрихнин.

Смертельная доза: 0,2-0,3 г. Стрихнин легко поглощается из желудочнокишечного тракта и также легко проникает в организм изо всех мест инъекирования.

**Симптомы:** возбуждение, головные боли, одышка. Повышение тонуса затылочных мышц, тризм жевательной мускулатуры, тетанические судороги при малейшем раздражении. Спазм дыхательной мускулатуры с развитием резкой ригидности грудной клетки. Смерть наступает при явлениях асфиксии (удушья).

**Лечение.** При поступлении яда внутрь — раннее промывание желудка, солевое слабительное, хлоралгидрат в клизме повторно. Седативная терапия: барбитал (3-5 мл 10 % раствора) в вену, морфин (1 мл 1% раствора), димедрол (2 мл 1% раствора) под кожу. При нарушениях дыхания — интубационный наркоз с использованием миорелаксантов (листенон, диплацин). Форсированный диурез (алкализация мочи). Наркотические средства

### 6. Индийская конопля

Индийская конопля (гашиш, план) — наркотическое одурманивающее средство. Употребляется для жевания, курения и приема внутрь с целью своеобразного опьянения. Токсическое действие связано с угнетением центральной нервной системы.

**Симптомы.** Вначале характерны психомоторное возбуждение, расширение зрачков, шум в ушах, яркие зрительные галлюцинации (видение цветов, больших пространств), быстрая смена мыслей, смех, легкость движений. Затем наступают общая слабость, вялость, плаксивое настроение и долгий глубокий сон с замедлением пульса и понижением температуры тела.

**Лечение.** Промывание желудка при приеме яда внутрь. При резком возбуждении — аминазин (1-2 мл 2,5 % раствора) внутримышечно, хлоралгидрат в клизме, сердечнососудистые средства.

### 7. Никотин

Никотин - алкалоид табака. Смертельная доза — 0,05 г.

**Симптомы:** при попадании яда внутрь во рту, за грудиной и в подложечной области — чувство зуда, участки онемения кожных покровов, головокружение, головная боль, расстройство зрения и слуха. Расширение зрачков, бледность лица, слюнотечение, повторная рвота. Одышка с затрудненным выдохом, учащенное сердцебиение, неправильный пульс, фибриллярные подергивания отдельных групп мышц с развитием общих клонико-тонических судорог. Во время судорог наблюдается повышение артериального давления с последующим его падением. Потеря сознания. Цианоз слизистых оболочек.

Смерть наступает при явлениях паралича дыхательного центра и дыхательных мышц.

Остановка сердца в диастоле. При приеме токсических доз картина отравления развивается быстро.

**Лечение.** Внутрь активированный уголь, после чего обильное промывание желудка раствором перманганата калия (1:1000), солевое слабительное. Сердечно-сосудистые средства (кофеин, кордиамин). Новокаин с глюкозой в вену капельно, сульфат магния внутримышечно, димедрол под кожу. При судорогах с затруднением дыхания — 10 % раствор барбитала (можно 2,5 % раствор гексенала или тиопентал-натрия) по 5-10 мл в вену медленно с интервалами 20-30 сек до купирования судорог или 1 % раствор хлоралгидрата в клизме.

При безуспешности этих мероприятий — дитилин (или другие подобные препараты) в вену с последующей интубацией и искусственным аппаратным дыханием. При нарушении сердечного ритма типа тахикардии — сердечные гликозиды, при резком замедлении пульса — атропин и раствор хлорида кальция внутривенно. Оксигенотерапия.

### 8. Группа морфина.

Смертельная доза: 0,1-0,2 г внутрь.

**Симптомы.** При приеме внутрь или внутривенном введении токсических доз препаратов развивается коматозное состояние, для которого характерно значительное сужение зрачков с ослаблением реакции на свет. Характерно преимущественное угнетение дыхательного центра — паралич дыхания даже при неглубокой коме или при сохраненном сознании больного (при отравлении кодеином). Возможно также значительное падение артериального давления. Смерть наступает в результате угнетения деятельности дыхательного центра.

**Первая помощь:** промывание желудка теплыми растворами марганцовокислого калия (так как он окисляет морфин) с прибавлением активированного угля, солевое слабительное. Не давать отравленному спать, горячие ванны с холодными обливаниями, растирание. На голову, к рукам и ногам грелки.

**Лечение.** Повторные промывания желудка, даже при внутривенном введении морфина. Налорфин (анторфин) по 1-3 мл 0,5% раствора в вену повторно. Форсированный диурез (алкализация мочи). Сердечно-сосудистые средства по показаниям. Антибиотики. Витаминотерапия. Искусственная вентиляция легких.

### 9. Противовоспалительные и жаропонижающие средства

Наиболее употребительные из них принадлежат к трем различным химическим группам: салицилаты (средства, в состав которых входит ацетилсалициловая кислота), пиразолонны (амидопирин, анальгин, бутадиион) и анилины (парацетамол и фенацетин). Для каждой из групп характерны свои побочные эффекты, но картина отравления имеет довольно много сходных черт.

**Аспирин, аскафен и др. салицилаты.** Смертельная доза: 30-50 г, для детей — 10 г.

**Симптомы.** При приеме внутрь салициловой кислоты, особенно спиртового раствора, возникает жжение и боль по ходу пищевода, в желудке, повторная рвота, часто с кровью, иногда жидкий стул с примесью крови. Характерны шум в ушах, ослабление слуха, расстройство зрения. Больные возбуждены, эйфоричны. Дыхание шумное, учащенное, может наступить коматозное состояние. Салицилаты снижают свертываемость крови, поэтому постоянный признак отравления геморагии на коже, профузные (массивные) носовые и маточные кровотечения. Прогноз обычно благоприятный для жизни.

**Лечение.** После промывания желудка через зонд вводят внутрь вазелиновое масло (стакан), дают слабительное — 20-30 г сульфата натрия (глауберова соль). Усиленное щелочное питье гидрокарбоната натрия (питьевая сода) или в клизме (из расчета 0,4 г/кг массы тела) каждый час до восстановления нормальной частоты дыхания и появления щелочной реакции мочи.

Назначение больших доз аскорбиновой кислоты (до 0,5-1 г) в сутки внутрь или в инъекциях ускоряет обезвреживание салициловой кислоты. При кровотечении — викасол, хлорид кальция, переливание крови. Лечение почечной и печеночной недостаточности, ожогов пищеварительного тракта.

**Анальгин, амидопирин и другие производные пиразолона.** Смертельная доза: 10-15 г.

**Симптомы:** шум в ушах, тошнота, рвота, общая слабость, снижение температуры, одышка, сердцебиение. При тяжелых отравлениях — судороги, сонливость, бред, потеря сознания и коматозное состояние. Возможно развитие периферических отеков, желудочных кровотечений, геморрагической сыпи.

**Лечение.** Основные мероприятия те же, что и при отравлении салицилатами: промывание желудка, слабительное, обильное щелочное питье, мочегонные. Дополнительно возможно противосудорожное лечение — хлоралгидрат по 1 г в клизме с крахмальной слизью, барбитал внутримышечно, диазепам внутривенно. При судорогах аналептиков лучше избегать, пользуясь для стимуляции сердца строфантинном или аналогичными средствами. Обязательным является назначение хлорида или ацетата калия внутрь по 0,5-1 г за 1-2 приема.

**Парацетамол и др. производные анилина.** Явления раздражения пищеварительного тракта при отравлении выражены слабее, однако значительнее признаки образования метгемоглобина в крови — бледность, цианоз, буровато-коричневый цвет кожи. В тяжелых случаях — расширение зрачков, одышка, судороги, рвота с запахом анилина. В более поздние сроки развивается анемия и токсический нефрит. Прогноз обычно благоприятный.

**Лечение** такое же, как в предыдущих случаях. Однако выраженная метгемоглобинемия нередко заставляет прибегать к обменному переливанию крови. Больше внимания следует уделить борьбе с нарушениями функции почек (осмотический диурез или фуросемид с обильным введением жидкости и минеральных солей). Антисептические средства

**Йод.** Смертельная доза: 2-3 г. Симптомы: бурое окрашивание языка и слизистой рта, рвота бурыми и синими массами (если в содержимом желудка имеется крахмал), понос. Головная боль, насморк, кожные сыпи. Раздражение слизистой оболочки дыхательных путей. В тяжелых случаях — отек легких, судороги, малый учащенный пульс, коматозное состояние.

**Первая помощь:** промывание желудка, внутрь — жидкий крахмальный или мучной клейстер в больших количествах, молоко, слизистое питье, слабительное - жженая магнезия (окись магния).

**Лечение:** внутрь 1% р-р тиосульфата натрия в количестве 250-300 мл. Симптоматическая терапия, лечение ожогов пищеварительного тракта.

**Калия перманганат (марганцовокислый калий).** Смертельная доза: 0,5-1 г.

**Симптомы:** резкая боль в полости рта, по ходу пищевода, в животе. Понос, рвота. Слизистая оболочка полости рта темно-коричневого цвета. Отек гортани, ожоговый шок, судороги.

**Первая помощь и лечение.** Если отравление произошло от вдыхания паров, пострадавшего необходимо вывести из загрязненной атмосферы, прополоскать глотку водой, содовым раствором (2 %) или раствором фурацилина (1:5000). Внутрь — теплое молоко с содой или щелочную минеральную (боржоми) воду, горчичники на область гортани. Глаза промыть и закапать 1-2 капли 2 % раствора новокаина или 0,5 % раствора дикаина.

Если отравление произошло при попадании яда внутрь, то необходимо немедленное промывание желудка обильным количеством воды через зонд или беззондовым способом. Внутрь — молоко, яичные белки, крахмал, слизистые отвары, окись магния (жженая магнезия) — 1 столовая ложка на стакан воды, глотать кусочки льда, пить растительное масло (100 г).

Основные принципы симптоматического лечения после госпитализации — борьба с болевым шоком. При появлении темной мочи — введение в вену бикарбоната натрия, сердечно-сосудистые средства, новокаиновая блокада. В случаях значительной кровопотери — повторные переливания крови. Раннее применение массивных доз антибиотиков, гидрокортизон или АКТГ. Витаминотерапия. Кровоостанавливающие средства — викасол внутримышечно, хлористый кальций в вену.

При отеке гортани ингаляция аэрозоли пенициллина с эфедрином. В случае безуспешности этого мероприятия — трахеотомия.

#### **10. Отравление алкоголем и его сурогатами.**

Этиловый спирт (винный спирт) — входит в состав спиртных напитков, духов, одеколona, лосьонов, лекарственных растительных настоек, является растворителем для спиртовых лаков, щелочной политуры, клеев марки "БФ" и тд. Смертельная концентрация этилового алкоголя в крови: около 300400 мг %.

**Симптомы.** При легком опьянении ведущим признаком является эйфория (повышенное настроение). При опьянении средней тяжести присоединяется нарушение походки и координации движений, умеренное возбуждение, которое сменяется сонливостью и глубоким сном. Эти стадии опьянения лечения не требуют.

При тяжелом отравлении все явления выражены сильнее и опьянение заканчивается наркозом, т.е. глубоким сном с утратой всех видов чувствительности, в том числе болевой и температурной. И хотя это состояние само по себе не опасно для жизни, так как проходит через несколько часов, но в состоянии наркоза возможны тяжелые травмы, возникновение глубоких пролежней, вплоть до гангрены мягких тканей, вызванных нарушением местного кровообращения при сне в одном и том же неудобном положении. Существенную опасность представляет переохлаждение. Оно может возникнуть даже при температуре воздуха 12°C. При этом температура тела снижается до 31-32°C, пульс урежается до 28-52 ударов, дыхание угнетено до 8-10 в минуту. Такое комбинированное поражение очень опасно и может привести к гибели или в первые сутки от нарушения дыхания или в ближайшие недели от пневмонии и гангрены легких, вызванных переохлаждением.

При очень тяжелом алкогольном опьянении больной быстро проходит все предыдущие стадии опьянения (эйфория, возбуждение, наркоз) и впадает в глубокую кому. Различают три стадии коматозного состояния.

**Поверхностная кома 1:** Зрачки сужены с временным расширением при болевом раздражении. Из рта — резкий запах алкоголя. На вдыхание нашатырного спирта больные отвечают мимической реакцией, защитными движениями рук. Эта стадия алкогольной интоксикации отличается наиболее благоприятным течением и нередко после промывания желудка через зонд больные приходят в сознание.

**Поверхностная кома 2:** отличается выраженной мышечной гипотонией (расслабленностью) при сохраненных рефлексах (сухожильных, зрачковых). На ингаляционное раздражение парами нашатырного спирта реагируют слабо. Эти больные подлежат госпитализации, так как коматозное состояние более длительное и мероприятия по прекращению дальнейшего всасывания алкоголя (промывание желудка через зонд) не сопровождаются быстрым восстановлением сознания.

**Глубокая кома:** характеризуется полным отсутствием рефлекторной деятельности. Зрачки сужены или, при явлениях недостаточности дыхания, расширены. Болевая чувствительность и реакция на раздражение нашатырным спиртом отсутствуют.

Надо помнить, что алкогольные интоксикации могут сопровождаться нарушением дыхания из-за западения языка, аспирации слизи и рвотных масс в дыхательные пути, повышенной секреции бронхиальных желез. Нарушения функции сердечно-сосудистой системы сказываются в виде умеренной гипертонии, сменяющейся гипотонией (снижение артериального давления) и выраженной тахикардией в стадии глубокой комы.

Ведущим признаком для диагноза в затруднительном случае является определение количества алкоголя в крови, что возможно лишь в условиях специализированного стационара. Алкогольная кома обычно недолга, продолжается лишь несколько часов. Длительность ее более суток в сочетании с резкими нарушениями дыхания является неблагоприятным признаком.

**Первая помощь.** При очень тяжелом состоянии (кома) должна быть энергичной, особенно при нарушении дыхания.

При падении артериального давления назначают сердечно-сосудистые средства (кордиамин, эфедрин, строфантин), внутривенно вводят полиглюкин и преднизолон.

Главное при лечении интоксикации — прекратить всасывание алкоголя, обильно промывать желудок через зонд. Его также выводят из организма при помощи внутривенного введения гипертонического раствора глюкозы с инсулином; в глубокой коме целесообразно использовать метод форсированного диуреза, витаминотерапию. Аналептики и, в частности, бемегид в стадии тяжелой алкогольной комы противопоказаны. Из рвотных средств - лишь апоморфин подкожно, но и он противопоказан при отсутствии сознания, а также при низком артериальном давлении, сильном общем истощении, что нередко встречается у алкоголиков.

Для восстановления сознания применяют также раствор аммиака внутрь (5-10 капель нашатырного спирта на стакан воды). Так как у больного развивается ацидоз ("закисление крови"), то обязательно надо вводить раствор натрия гидрокарбоната в вену или внутрь (2-7 г пищевой соды на прием). Обязательным является согревание больного грелками,



особенно при сочетании опьянения с охлаждением. При возбуждении не следует для успокоения больного давать барбитуратов или препаратов группы морфина из-за опасности угнетения дыхания. В таком случае следует ввести аминазин или хлоралгидрат не более 0,2-0,5 г в клизме с крахмальной слизью. Больному необходимо давать горячий крепкий сладкий чай или кофе, содержащийся в этих напитках кофеин способствует стимуляции дыхания, сердечнососудистой системы и пробуждению.

### **Суррогаты алкоголя:**

**Метиловый спирт** — менее ядовит, чем этиловый, но в процессе его окисления в организме образуется крайне ядовитые продукты (муравьиная кислота и формальдегид), которые и вызывают отсроченные и очень тяжелые последствия. Индивидуальная чувствительность к метиловому спирту колеблется еще больше, чем к этиловому, минимальная доза для человека считается 100 мл. Летальность при отравлении метиловым спиртом значительна.

**Симптомы и течение.** При очень больших дозах отравление может протекать в молниеносной форме. В таком случае все явления, сходные с тяжелым алкогольным опьянением (эйфория, расстройства координации, возбуждение), развиваются гораздо быстрее, и смерть может наступить в течение 2-3 часов. При относительно небольших дозах метилового спирта отравление развивается по типу скрытого периода.

**При легкой форме** отравления появляются головная боль, тошнота, упорная рвота, боли в области желудка, головокружение и умеренное нарушение зрения: мелькание "мушек" перед глазами, неясность видения — "туман перед глазами". Эти явления держатся от 2 до 7 суток, а затем проходят.

**При средней форме** отравления наблюдаются те же явления, но более выраженные и через 1-2 дня наступает слепота. При этом зрение сначала медленно восстанавливается, но не полностью, и через некоторое время опять ухудшается. Прогноз для жизни благополучный, для зрения плохой. Неблагоприятным признаком является стойкое расширение зрачка.

**Тяжелая форма** начинается так же, но затем появляется сонливость и оглушенность, через 6-10 часов могут появиться боли в ногах, голове, нарастает жажда. Кожные покровы и слизистые оболочки сухие, воспаленные, с синюшным оттенком, язык обложен серым налетом, запах алкоголя изо рта. Пульс частый, с постепенным замедлением и нарушением ритма, артериальное давление повышено с последующим его падением. Сознание становится спутанным, возникает психомоторное возбуждение, возможны судороги. Иногда быстро развивается коматозное состояние, ригидность затылочных мышц, гипертонус мышц конечностей. Смерть наступает от паралича дыхания и падения сердечно-сосудистой деятельности.

**Лечение.** Сходно с таковым при алкогольной коме: промывание желудка с последующим введением 20-30 г натрия сульфата, растворенного в стакане воды, через зонд. Борьба с нарушениями дыхания — вдыхание чистого кислорода, при необходимости и возможности — искусственная вентиляция легких. Промывание желудка следует неоднократно повторять в течение 2-3 суток, так как метиловый спирт всасывается из желудочно-кишечного тракта медленно. В первые часы после отравления показано назначение этилового спирта в виде стакана коньяка внутрь или в виде 2-5 % раствора в вену капельно из расчета до 1 мл чистого алкоголя на 1 кг массы больного. Введение этилового спирта предотвращает окисление метилового до муравьиной кислоты и

формальдегида и ускоряет его выведение. Для борьбы с поражением глаз следует прибегать к ранним люмбальным пункциям и к назначению АТФ, атропина, преднизолона, витаминов (ретинола, аскорбиновой кислоты, тиамина, рибофлавина и др.) в принятых дозах.

Гидролизный и сульфитный спирты. Представляют собой этиловый спирт, полученный из древесины путем гидролиза в 1,11,4 раза токсичнее этилового спирта из-за примесей метилового спирта, карбонильных соединений и др.

**Симптомы, лечение см. Спирт этиловый.**

## Краткая характеристика лекарственных препаратов

### 1. Унитиол (Unithiolum)



#### Групповая принадлежность:

**Фармакологическое действие:** Унитиол содержит две сульфгидрильные группы. По механизму действия препарат приближается к комплексонам (органическим веществам, образующим прочные соединения с катионами /положительными ионами/ металлов). Его активные сульфгидрильные группы вступают в реакцию с тиоловыми ядами, находящимися в крови и тканях, и образуют с ними нетоксичные (невредные) комплексы, которые выводятся с мочой. Связывание ядов приводит к восстановлению функции ферментных систем организма, пораженных ядом. Этот же механизм действия послужил основанием для применения унитиола при лечении гепатоцеребральной дистрофии (наследственного заболевания печени и мозга, связанного с нарушением обмена белков и меди /болезни Вильсона - Вестфала - Коновалова/), в патогенезе (процессе развития болезни) которой определенную роль играют нарушения обмена меди в организме и накопление металла в подкорковых ядрах (в структурных образованиях мозга).

**Показания к применению:** Применяют унитиол для лечения острых и хронических отравлений соединениями мышьяка, ртути, хрома, висмута и других металлов, относящихся к так называемым тиоловым ядам, т. е. веществам, способным вступать во взаимодействие с сульфгидрильными (тиоловыми) группами ферментных белков и тем самым их инактивировать (подавлять активность). Менее активен унитиол при отравлениях свинцом. Применяют унитиол при отравлениях сердечных гликозидами, а также в комплексной терапии при хроническом алкоголизме.

**Способ применения:** Для лечения острых и хронических отравлений соединениями мышьяка и ртути вводят унитиол внутримышечно или под кожу в виде 5% водного раствора в количестве 5-10 мл (из расчета 0,05 г препарата или 1 мл 5% раствора на 10 кг массы тела больного). Лечение следует начинать как возможно раньше. При отравлениях соединениями мышьяка инъекции делают в первые сутки каждые 6-8 ч (3-4 инъекции в сутки в зависимости от состояния больного), во вторые сутки 2-3 инъекции через каждые 8-12 ч, в последующие - по 1-2 инъекции в сутки. При отравлениях соединениями ртути инъекции делают по той же схеме в течение 6-7 сут. Детям препарат назначают в меньших дозах в соответствии с возрастом. Продолжительность применения зависит от скорости выведения токсичных (вредных) соединений из организма. Лечение проводят до исчезновения признаков интоксикации (отравления). При отравлениях солями ртути вводят в течение не менее 6 сут. При отравлениях сердечными гликозидами вводят в первые 2

дня в указанных выше дозах 3-4 раза в сутки, затем 1-2 раза в сутки до прекращения кардиотоксического действия (повреждающего воздействия на сердце). Введение унитиола при острых отравлениях не исключает применения других лечебных мероприятий (промывание желудка, вдыхание кислорода, введение глюкозы и др.). При гепатоцеребральной дистрофии вводят внутримышечно по 5-10 мл 5% раствора ежедневно или через день; на курс 25-30 инъекций с перерывом между курсами 3-4 мес. При хроническом алкоголизме применяют унитиол в комплексной терапии по 3-5 мл 5% раствора 2-3 раза в неделю. Для купирования делирия (снятия бредовых состояний, являющихся следствием хронического алкоголизма) вводят однократно 4-5 мл 5% раствора унитиола.

**Побочные действия:** Унитиол обычно хорошо переносится. В отдельных случаях возникают тошнота, тахикардия (учащенные сердцебиения), побледнение лица, головокружение. Все эти явления проходят самостоятельно.

**Противопоказания:** Препарат противопоказан при тяжелых заболеваниях печени, при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления).

**Форма выпуска:** 5% раствор в ампулах по 5 мл.

## 2. Бемегрид (Bemegridum)

**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Возбуждает центральную нервную систему, стимулирует дыхание и кровообращение. Антагонист (лекарственное средство, оказывающее противоположное действие) барбитуратов и снотворных средств.

**Показания к применению:** При отравлении барбитуратами, передозировке наркотических веществ, для прекращения наркоза, вызванного барбитуратами и пр.

**Способ применения:** Внутривенно медленно 1-20 мл 0,5% раствора.

**Побочные действия:** При передозировке тошнота, рвота, мышечные подергивания, судороги.

**Противопоказания:** Психозы, психомоторное возбуждение.

**Форма выпуска:** Ампулы по 10 мл 0,5% раствора в упаковке по 10 штук.

## 3. Натрия тиосульфат (Natrii thiosulfas)



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Натрия тиосульфат оказывает противотоксическое (препятствующее повреждающему воздействию вредных факторов), противовоспалительное и десенсибилизирующее (предупреждающее или тормозящее аллергические реакции) действие.

**Показания к применению:** Как противотоксическое средство применяют при отравлении соединениями мышьяка, ртути, свинца (образуются неядовитые сульфиты), синильной кислотой и ее солями (образуются менее ядовитые роданистые соединения), солями йода, брома. Назначают также внутривенно и внутрь при аллергических заболеваниях, артритах (воспалении сустава), невралгиях (воспалении нерва). Наружно используют для лечения чесотки.

**Способ применения:** Вводят внутривенно по 5-10 мл 30% раствора, при поражениях цианистыми соединениями - по 50 мл 30% раствора. Внутрь назначают по 2-3 г на прием в виде 10% раствора в воде или в изотоническом растворе натрия хлорида. Наружно применяют для лечения больных чесоткой по методу Демьяновича, основанному на способности натрия тиосульфата распадаться в кислой среде, выделяя серу и сернистый ангидрид, оказывающие противопаразитарное действие (действие, направленное против возбудителя чесотки). В кожу втирают 60% раствор натрия тиосульфата (последовательно по 2-3 мин в левую и правую верхние конечности, туловище, левую и правую нижние конечности, всего в течение 10-15 мин). После окончания втирания делают перерыв на несколько минут до высыхания кожи и появления на ней кристалликов. Затем производят в той же последовательности второй цикл втираний. После высыхания кожи втирают 6% раствор кислоты хлористоводородной, наливая его на ладонь, в таком же порядке 3-4 раза в течение 10-15 мин с перерывами до высыхания раствора на коже после каждого втирания. Мытье разрешается через 3 дня.

**Форма выпуска:** Порошок; 30% раствор в ампулах по 5; 10 и 50 мл.

#### 4. Тетацин-кальций (Tetacinum-calcium)

**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Комплексообразующее соединение.

**Показания к применению:** Отравления тяжелыми металлами и редкоземельными элементами (свинец, кадмий, кобальт, ртуть, уран, иттрий, цезий и др.) и их солями.

**Способ применения:** Внутривенно (капельно) в изотоническом растворе натрия хлорида или в 5% растворе глюкозы по 20 мл 10% раствора 1-2 раза в день в течение 3-4 дней с последующим перерывом 3-4 дня. Курс лечения 1 мес.

**Побочные действия:** Нарушение функции желудочно-кишечного тракта и почек; уменьшение содержания в организме гемоглобина, железа и витамина В.

**Противопоказания:** Нефриты (воспаление почки) и нефрозы (заболевание почек), заболевания печени с нарушением функции.

**Форма выпуска:** Раствор 10% в ампулах по 20 мл и по 10 мл, в упаковке 10 штук.

#### 5. Метиленовый синий (Methylenum coeruleum)



**Групповая принадлежность:**

**Фармакологическое действие:** Метиленовый синий – лекарственный препарат группы антисептических средств. Механизм действия препарата основан на его способности образовывать малорастворимые комплексные соединения с мукополисахаридами и белками бактериальной клетки, что приводит к гибели микроорганизмов. При местном применении препарат не абсорбируется в системный кровоток.

**Показания к применению:** Препарат предназначен для обработки поврежденного кожного покрова у пациентов с ожогами, гнойно-воспалительными поражениями кожи и пиодермией.

**Способ применения:** Препарат предназначен для наружного применения. Следует избегать попадания препарата в глаза и на слизистые оболочки. Препарат наносят на очищенный пораженный участок с помощью ватного тампона. Раствором обрабатывают поврежденные участки кожного покрова и некоторую прилегающую часть здоровых тканей. Длительность курса лечения определяет лечащий врач.

**Побочные действия:** В единичных случаях отмечалось развитие кожных аллергических реакций. **Противопоказания:** Повышенная индивидуальная чувствительность к компонентам препарата. Препарат не применяют для лечения детей в возрасте младше 1 года.

**Форма выпуска:** Раствор спиртовой для наружного применения по 10мл в стеклянных флаконах.

#### Налоксон (Naloxonium)



**Фармакологическое действие:** Налоксон является опиатным антагонистом, лишенным морфиноподобной активности. Действует по типу конкурентного антагонизма, блокируя связывание агонистов или вытесняя их из опиатных рецепторов.

**Показания к применению:** Применяют налоксон главным образом при острой интоксикации (отравлении) наркотическими анальгетиками. Он эффективен также при алкогольной коме (тяжелом отравлении алкоголем) и различных видах шока, что связано, по-видимому, с активацией при шоке и некоторых формах стресса опиоидной системы организма, а также со способностью налоксона уменьшать гипотензию (повышать пониженное артериальное давление). Кратковременность действия налоксона ограничивает возможность его применения при терапии наркомании (болезненного пристрастия к наркотическим веществам).

**Способ применения:** Применяют налоксон в дозе 0,4-0,8 мг. Для снятия явлений интоксикации при применении агонистов-антагонистов (пентазоцин, нальбуфин, буторфанол , 254) требуются большие дозы налоксона (до 10-15 мг). Для диагностики наркомании вводят 0,5 мг налоксона при употреблении “чистых” агонистов (морфин, омнопон и т.д. ) и более высокие дозы при употреблении агонистовантагонистов.

**Побочные действия:** Введение налоксона страдающим наркоманией вызывает характерный приступ абстинен-ции (состояния, возникающего в результате внезапного прекращения приема наркотических средств), чем иногда пользуются для выявления заболевания.

**Противопоказания:** Повышенная чувствительность к препарату.

Форма выпуска: В ампулах по 1 мл, содержащих 0,4 мг налоксона гидрохлорида. Выпускается также специальная лекарственная форма для применения у новорожденных - Narcan neonatal, - с содержанием 0,02 мг налоксона в 1 мл раствора. Условия хранения: