

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ УКРАИНЫ
ЗАПОРОЖСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ
КАФЕДРА ФАРМАКОГНОЗИИ, ФАРМАКОЛОГИИ И БОТАНИКИ

ФАРМАКОЛОГИЯ ВЕГЕТАТИВНОЙ НЕРВНОЙ СИСТЕМЫ

(СМЫСЛОВОЙ МОДУЛЬ 2, VI семестр)

УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ ПОСОБИЕ

для студентов фармацевтического факультета
заочной формы обучения (специальность «Фармация»)

Запорожье, 2015

Рецензент:

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

Учебно-методическое пособие составили:

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

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

Фармакология вегетативной нервной системы. (Смысловой модуль 2, VI семестр) : учеб.-метод. пособие для студентов фармац. факультета заочной форм обучения (специальность «Фармация») / сост. С. Д. Тржецинский, Е. В. Гречаная, Г. В. Мазулин [и др.]. – Запорожье : [ЗГМУ], 2015. – 87 с.

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

Введение

Учебно-методическое пособие предлагается в качестве дополнительного источника информации при изучении курса фармакологии для студентов фармацевтического факультета заочной формы обучения.

Издание содержит раздел фармакологии, изучающий лекарственные средства, влияющие на вегетативную нервную систему, которые, как правило, вызывают наибольшее затруднение у студентов при изучении курса фармакологии.

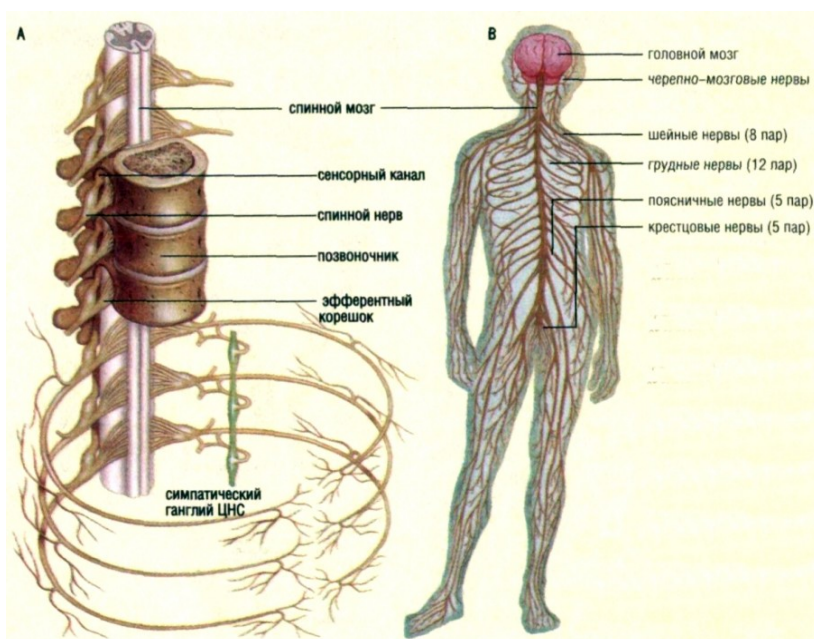
В учебном пособии приведены краткие сведения о лекарственных препаратах по изучаемым разделам курса, а также тестовые задания с обоснованием правильных ответов. Тестовые задания, выбранные из базы лицензионного экзамена КРОК-1, приурочены к отдельным темам поданного к изучению материала. Часть учебного материала представлена в виде схем и таблиц.

КРАТКИЕ СВЕДЕНИЯ О СТРОЕНИИ НЕРВНОЙ СИСТЕМЫ

Нервная система человека состоит – из центрального и периферического отделов.

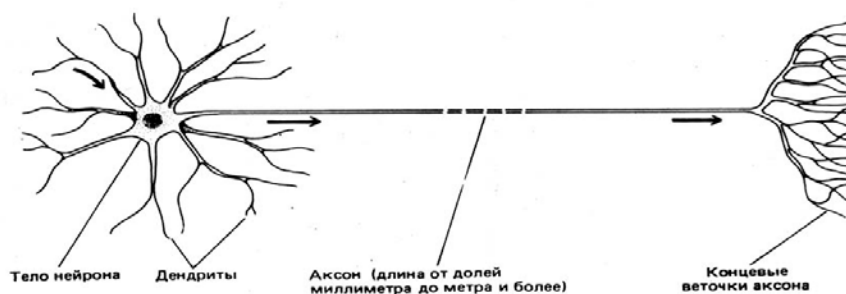


Центральная нервная система, в свою очередь состоит из головного и спинного мозга.



Периферическая - из афферентных (чувствительных) и эфферентных (нервных проводников).

Основным структурным элементом нервной системы является «нейрон».



Нейрон состоит из собственно нервной клетки и множества ветвящихся отростков – «дендритов» и одного длинного отростка – нервного волокна (аксона) – от которого также идут ответвления. Тело нейрона – микроскопическое, общая длина тела нейрона с аксоном может иметь длину нескольких десятков сантиметров.

В основе возбуждения лежит особый нервный ток «биоток», который имеет некоторое сходство, но все же отличается от электрического. Нервное возбуждение передается по нервным волокнам со **скоростью 120 м в секунду**.

Нервное волокно покрыто белой жировой «миелиновой оболочкой», обладающей свойствами **изолятора** и играющей важную роль - обеспечение проведения нервного импульса только в одном направлении (без нее процесс возбуждения распространялся бы во все стороны).

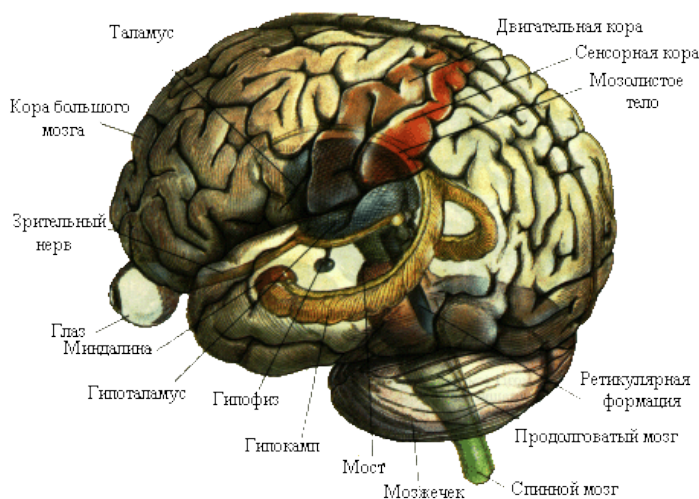
Скопление нервных клеток, вместе с дендритами – образуют серое вещество спинного и головного мозга. Скопление нервных волокон – белое вещество.

Роль серого вещества – в накапливании, усилении, переработке возбуждения. Роль белого вещества – в передаче нервных импульсов.

Нервные волокна, передающие импульс от органов к головному мозгу – **центростремительные**, от мозга к органам – **центробежные**.

Спинальный мозг – внутри позвоночного столба – толстый шнур из нервной ткани (по краям – белое вещество, внутри серое). В нем сосредоточены центры ряда **безусловных (врожденных) рефлексов**, регулирует мускульные движения тела и конечностей, работу внутренних органов, а также проводящие нервные пути.

Головной мозг находится в черепной коробке, эволюционно развился значительно позже спинного. Головной мозг человека намного сложнее головного мозга даже самого высокоразвитого животного. **Находится в жидкой среде**, мягок легко режется ножом, на 80% состоит из воды.



Составляя 2 % веса тела – потребляет 20% кислорода – который получает через капилляры, **общая длина которых составляет 560 км.**

Чрезвычайно чувствителен к перерывам снабжения кислородом, через 15 секунд полного прекращения подачи - наступает потеря сознания с интенсивным отмиранием клеток, через 10 мин - процесс становится необратимым.

Некоторые вещества быстро и без изменений поступают в мозг, например алкоголь. Мозг человека, систематически употребляющего алкоголь резко пахнет спиртом.

Вес мозга 1 - 2кг, в среднем 1400 г, который не влияет на способности.

Состоит из ряда отделов, нижняя часть в месте соединения со спинным – продолговатый мозг, над ним – средний мозг и мозжечок, выше – промежуточный мозг, покрыты большими полушариями.

Продолговатый мозг – расположены центры – регулировки дыхания, сердечнососудистой деятельности и органов пищеварения.

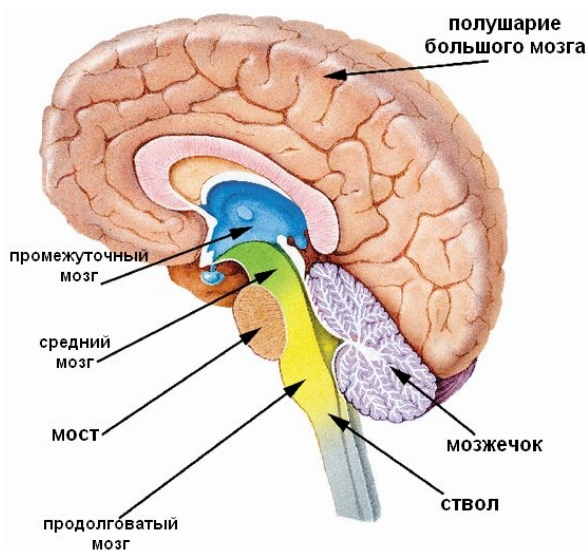
Средний – регулирует положение и координацию тела, регулирует мышечный тонус.

Мозжечок – отвечает за равновесие.

Промежуточный мозг – содержит центры инстинктивных и эмоциональных проявлений, обмена веществ и терморегуляции тела.

В продолговатом и среднем мозге – под микроскопом - густая сетка - «**ретикулярная формация**» - из нейронов и их отростков – возбудитель коры больших полушарий, приводит их в состояние бодрствования, поддерживает их активность. При повреждении человек впадает в кому (может прожить еще около года).

Все отделы мозга представляют собой единую центральную систему, но со строгой иерархией, при которой низшие отделы подчиняются высшим, над которыми доминируют большие полушария.



Кора больших полушарий – парные образования, снаружи покрыты тонким слоем серого вещества, внутри – белое вещество. Полушария соединены «мозолистым телом».

Нервные клетки – не могут делиться и размножаться, у ребенка то-же количество нейронов, что и у взрослого. Развитие идет по пути усложнения строения клеток и увеличения количества контактов между ними.

Начиная с 35 – 40 лет количество нейронов уменьшается (гибнет до 50 000 клеток ежедневно).

С развитием эволюции кора больших полушарий приобретает все большее значение – у лягушки удаление не сказывается, у птиц – теряются все условные рефлексy.

Кора не гладкая, имеет большое количество извилин и борозд. Эволюция коры идет по пути увеличения поверхности – за счет возрастания количества и глубины борозд, если расправить все складки – **составит 2 м²**.

В коре больших полушарий выделяют четыре доли: лобную, затылочную, теменную и височную. **Лобные** – высшие отделы человеческого мозга (у человека занимают до 30% поверхности, у обезьяны – 16%, у собаки -7).

При поражении лобной доли – осмысленное целенаправленное поведение становится невозможным. Больной не может сосредоточиться на цели – увидел лестницу – идет по ней, увидел проходящего человека – пошел за ним, не может решить простейшей арифметической задачи хотя примеры на сложение и вычитание решает и пр.

Остальные доли занимаются переработкой и хранением информации. Так, в затылочной, находится центр зрения, в височной - слуха, в теменной – кожных ощущений (тепла, холода и пр.).

Область передней центральной извилины – моторная (двигательная); верхняя часть – управляет движением ног, средняя – рук, нижняя – лица. Клетки предмоторной зоны (перед центральной извилиной) – обеспечивают плавность движений. При поражении – движения теряют плавность, при более глубоком поражении человек теряет способность прекратить ранее начатое действие и будет продолжать его до полного изнеможения. Например, начав писать число 3 пишет бесконечное количество кружков, другой – начать строгать доску – не в состоянии закончить работу – отстрогал доску, начал строгать верстак.

Правое и левое полушария – не симметричные – регулируют противоположные половины тела (левое – правым, правое – левым). Центры речи – в левом полушарии (речь имеет крайне сложный механизм иннервации, поэтому осуществляется тремя центрами: речедвигательный центр обеспечивает возможность говорить, слухоречевой центр обеспечивает возможность слышать и понимать чужую речь, при его нарушении человек не понимает чужой речи и зрительно-речевой центр - чтения и понимания письменной речи, при поражении теряется способность читать, хотя зрение не нарушено).

Возможно выделить и другие центры, выполняющие различные функции.

В высшей нервной деятельности участвует целая система взаимосвязанных зон. При поражении одного участка его функции берет на себя другой.

Схема строения нервной системы человека



Периферический отдел нервной системы состоит из **афферентных** (чувствительных или сенсорных) нервных волокон и **эфферентных** (нервных проводников или двигательных нервов).

Афферентные нервные окончания - передают информацию об окружающей среде и состоянии внутренних органов (вкус, боль, термические, запах, световые) в центральную нервную систему, где эта информация анализируется.

Эфферентные нервы передают информацию от ЦНС к органу, вызывая изменения его деятельности, иногда в качестве ответной реакции на информацию, поступившую от афферентных нервов.

Эфферентные (двигательные) нервы делят на **соматические (иннервирующие скелетные мышцы)** и **вегетативные или автономные - иннервирующие внутренние органы, сосуды, железы.**

Соматические нервы подчиняются произвольному управлению (например, человек по своему желанию может - сесть, встать, поднять руку и т.д.).

Вегетативная нервная система произвольному управлению не подчиняется (человек не может по своему желанию управлять работой желудочно-кишечного тракта, желез внутренней секреции и пр.).

Такое различие в функционировании соматической и вегетативной нервной системы во многом связано с особенностями и отличиями в их строении. Так соматические нервы – **непрерывные**, вегетативные прерываются в **ганглиях**.

Вегетативные (или автономные) нервные волокна в свою очередь делятся на два отдела **симпатический и парасимпатический**, особенности строения которых будут рассмотрены ниже.

Средства влияющие на афферентную иннервацию.

Средства влияющие на афферентную иннервацию это вещества, оказывающие фармакологическое действие преимущественно на чувствительные нервные окончания, **блокируя** их или **возбуждая**, вследствие чего данные средства делят на две группы:

1. Вещества блокирующие нервные окончания и - соответственно - проведение нервного импульса чувствительными нервами.
2. Вещества раздражающие нервные окончания и возбуждающие чувствительные нервы.

К веществам первой группы относятся: **местно-анестезирующие, вяжущие, обволакивающие, антацидные** (нейтрализующие соляную кислоту желудочного сока) и **адсорбирующие** вещества.

К веществам второй группы относят средства **раздражающего** (отвлекающего) действия среди которых выделяют - **горечи, эфирные масла** и средства их содержащие.

Как правило, вещества данных групп препаратов обладают относительно непродолжительным действием (до нескольких часов), но, вместе с тем, различаются по продолжительности и силе фармакологического эффекта.

Некоторые из данных веществ способны проявлять указанную фармакологическую активность не только на местном уровне, но оказывают прямое или косвенное фармакологическое действие на весь организм в целом, проявляя противовоспалительный, антибактериальный, спазмолитический, гастропротекторный и ряд других эффектов. В некоторых случаях данные эффекты могут быть нежелательны, например, кардиодепрессивный, возбуждающее действие на ЦНС, седативный и пр., в токсических дозах могут вызывать угнетение дыхания или сердечной деятельности. Кроме того, местные анестетики различают по токсичности и способности всасываться через слизистые оболочки.

Местноанестезирующие средства.

Местноанестезирующие средства способны временно блокировать восприятие и проведение нервного импульса от нервного окончания по нервным волокнам к ЦНС. Данные средства применяются, прежде всего, для блокирования болевых ощущений, а также - вкусовых, температурных и тактильных (прикосновения).

Различают следующие виды местной анестезии:

1. Поверхностная или терминальная.
2. Проводниковая.
3. Инфильтрационная.
4. Как отдельная разновидность проводниковой анестезии иногда выделяют спинномозговую.
5. Прочие виды анестезии.

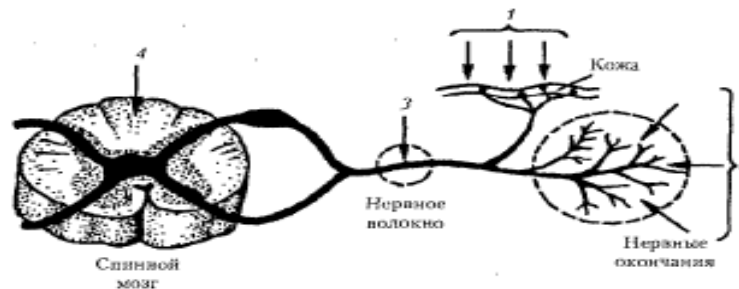
Поверхностная (терминальная) анестезия достигается при нанесении лекарственного средства на анестезируемую поверхность (чаще всего - в виде мази). Данный вид анестезии применим при повреждениях травматического характера (травмах, ушибах, растяжениях и т.д.), а также в глазной практике, при операциях на слизистой оболочке носа, носоглотки и пр.

Инфильтрационная анестезия применяется очень широко, например, при оперативном вмешательстве и невозможности или нецелесообразности применения анестезии общей. Данный вид анестезии достигается введением большого количества анестезирующего вещества в ткани, непосредственно расположенные в районе оперативного вмешательства или пораженного участка тела.

При проводниковой анестезии – анестетик вводится в район проводящего нерва. В результате теряет чувствительность весь участок, иннервируемый данным нервом и, прежде всего, блокируется проведение болевого импульса.

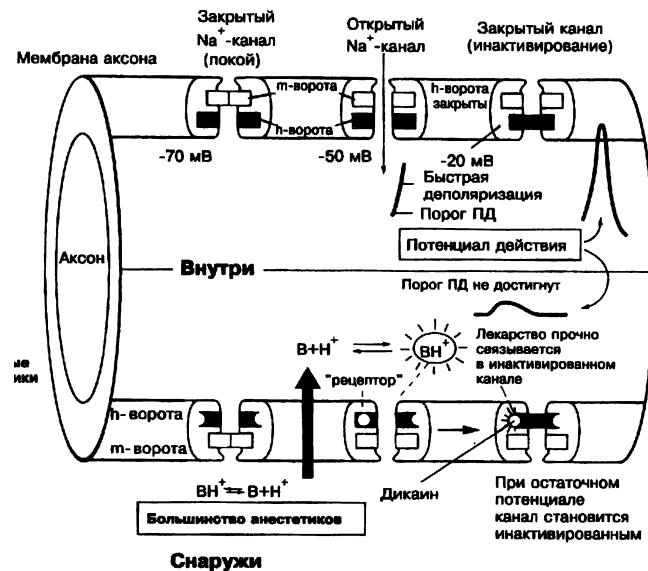
Спинальная анестезия рассматривается как разновидность проводниковой. При этом раствор анестетика вводят в поясничную область спинного мозга. В результате достигается анестезия нижних конечностей и всей нижней части туловища.

Прочие виды анестезии – которые, как правило, являются частными случаями вышеперечисленных видов, например перидуральная анестезия, один из способов смягчения родовых болей, которая, по сути, является разновидностью спинномозговой анестезии. Инъекция анестетика вводится в эпидуральное пространство между первым и вторым и третьим и четвертым поясничным позвонками.



Виды анестезии: 1. поверхностная (терминальная); 2. инфильтрационная; 3. проводниковая, 4 спинномозговая.

Механизм действия большинства местных анестетиков средств заключается в их способности проникать внутрь аксона (нервного волокна) в неионизированной (липофильной)* форме, там они превращаются в ионизированные молекулы, блокируют Na^+ каналы, препятствуя таким образом восприятию и генерации нервного импульса.



Механизм действия местных анестезирующих средств.

*- липофильность означает «средство к жирам», вследствие которого вещество обладает способностью жирорастворимости, проникновения и кумуляции внутри животной клетки.

Местно-анестезирующие средства являются слабыми основаниями и их активность во многом зависит от pH среды. При воспалении в тканях pH среды смещается в кислую сторону, вследствие чего эффективность действия местных анестетиков значительно снижается.

При оценке действующих и разработке новых лекарственных препаратов этой группы к местно-анестезирующим средствам предъявляются определенные **требования**:

1. Высокая анестезирующая активность.
2. Достаточная продолжительность действия (минимум несколько часов).
3. Отсутствие раздражающего действия на ткани в месте введения.
4. Отсутствие токсического действия на организм в целом.
5. Сосудосуживающий эффект в месте введения (препятствие всасыванию вещества и, как следствие, фармакологическому действию на весь организм) или совместимость с сосудосуживающими средствами. Сосудосуживающий эффект, кроме того, способствует увеличению продолжительности (желательное действие) анестезирующего действия вещества на местном уровне.
6. Хорошая растворимость в воде и достаточная физическая устойчивость (к стерилизации). Подавляющее большинство местно-анестезирующих лекарственных средств – это хорошо растворимые в воде хлориды (за исключением анестезина).

Достаточно многие природные и синтетические соединения проявляют анестезирующую активность, однако не применяются в качестве таковых, поскольку не отвечают вышеуказанным требованиям. Полностью не отвечают данным требованиям и некоторые из применяемых в современной медицине местно-анестезирующих средств.

Например, обладающий высокой анестезирующей активностью **кокаин** и его производное - **кокаина гидрохлорид** - длительное время применялись в медицинской практике в качестве высокоэффективного местно-анестезирующего средства (преимущественно в глазной практике). Однако, данные средства обладают значительным токсическим действием на организм. Хорошо проникая через слизистые оболочки, кокаин

оказывает наркотический эффект, действуя возбуждающе на ЦНС, вызывает состояние эйфории, восторженного возбуждения вне зависимости от жизненной ситуации. Данное вещество вызывает пристрастие (наркотическую зависимость), что, в конечном итоге, приводит к психическому заболеванию – кокаиновому психозу и необратимому слабоумию. Кроме того, возбуждение, вызванное действием кокаина сменяется угнетением ЦНС. В случае передозировки смерть может наступить от паралича дыхательного центра.

При вынужденном применении кокаина г/х на место введения накладывался пузырь со льдом для уменьшения всасывания. При применении данного препарата в качестве местно-анестезирующего средства в районе конечностей, выше введения накладывается жгут. После окончания оперативного вмешательства место применения вещества промывается изотоническим раствором натрия хлорида.

Другое широко распространенное лекарственное средство - **новокаин** - обладает сосудорасширяющим действием, а большинство лекарственных средств из группы замещенных амидов ацетанилида (лидокаин, ультракаин и пр.) в малых концентрациях проявляют сосудосуживающий эффект, в больших дозах данный эффект сменяется на противоположный – сосудорасширяющий.

Вещества, обладающие высокой токсичностью (дикаин (тетракаина гидрохлорид), кокаин) допустимо применять исключительно для поверхностной анестезии. Это же относится и к нерастворимому в воде средству – анестезину.

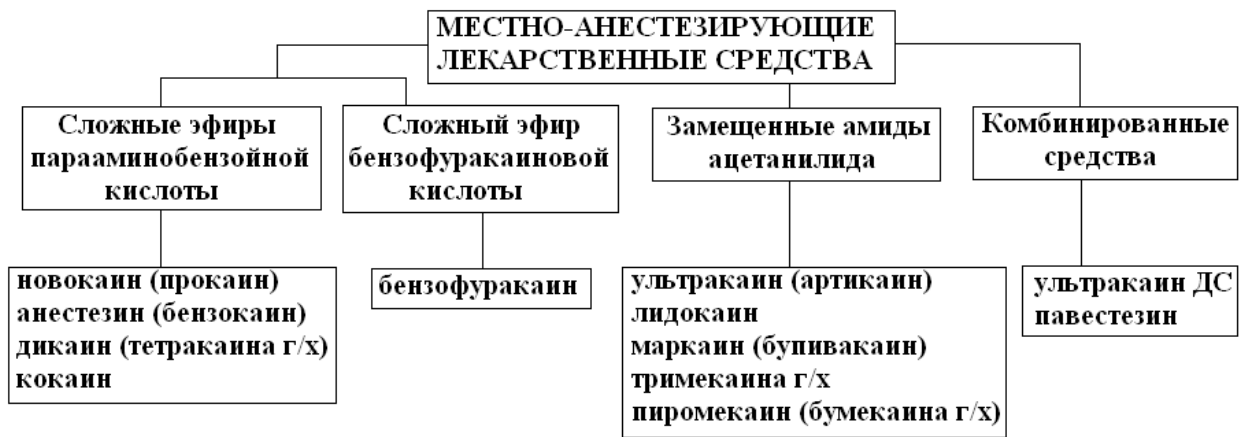
Таким образом, местные анестетики оказывают следующие виды действия:

Местно-анестезирующие лекарственные средства способны оказывать (нежелательное) общее фармакологическое действие на весь организм, в некоторых случаях это действие может быть позитивным, однако, в любом случае должно учитываться при применении этих препаратов. Так, спазмолитический эффект проявляет павестезин, центральное анестезирующее действие - бензофуракаин, гипотензивное - новокаин, ультракаин, антиаритмическое - новокаин, лидокаин, бумекаина г/х, лидокатон.

Местно-анестезирующие лекарственные средства делят на три группы по их химическому строению.

1. **Сложные эфиры парааминобензойной кислоты (ПАБК)** - новокаин (прокаин); анестезин (бензокаин); дикаин (тетракаина г/х), а также не применяемый в настоящее время в медицинской практике кокаин.
2. **Сложный эфир бензофуракарбоновой кислоты** – бензофуракаин;
3. **Замещенные амиды ацетанилида** - ультракаин (артикаин), лидокаин, маркаин (бупивакаин), тримекаина г/х, пиромекаин (бумекаина г/х).
4. **Комбинированные средства** - лидокатон (лидокаин + эpineфрин), ультракаин Д-С (ультракаин + эpineфрин), павестезин (папаверина г/х + анестезин).

Структура группы местно-анестезирующих лекарственных средств



Краткая характеристика лекарственных препаратов

Новокаин (прокаин) – уступает по силе действия многим современным лекарственным препаратам сходного фармакологического действия, однако в связи с малой токсичностью и большой терапевтической широтой до сих пор находит широкое применение. Применяется для инфильтрационной и спинномозговой анестезии (иногда для внутрикостной), а также в качестве растворителя для ряда лекарственных средств, в частности - антибиотиков (группы пенициллина). При других видах местной анестезии малоэффективен. Внутривенное введение новокаина потенцирует действие наркотических средств. Применяется внутрь в виде 0,25 – 0,5% раствора, по 2 -5 мл, 2 – 4 раза в неделю. Уменьшает возбудимость сердечной мышцы, эффективен при мерцательной аритмии.

Анестезин (бензокаин) – одно из первых синтетических соединений, примененных в качестве местно-анестезирующего средства - плохо растворим в воде, в связи с чем не применяется в виде инъекций. Применяется наружно, в виде мази (5 и 10%), входит в состав комплексных лекарственных препаратов («меновазин»), а также свечей при заболеваниях прямой кишки (геморрой, зуд). Внутрь (per os) применяется в виде таблеток в качестве обезболивающего и спазмолитического средства при заболеваниях желудочно-кишечного тракта, по 0,3 гр. – 3 - 4 раза в день. (Данный лекарственный препарат не применяют в странах Шенгенской зоны).

Дикаин (тетракаина г/х) – сильное местно-анестезирующее средство, значительно превосходящее по фармакологической активности новокаин, но обладающее значительной **токсичностью** (по токсичности в 2 раза превосходит кокаин). Применяется в офтальмологической практике в виде 0,25 – 0,5 – 1 – 2 % капель. Применяется также для поверхностной анестезии слизистых оболочек носа и носоглотки.

Кокаин (кокаина гидрохлорид) – первое вещество с местно-анестезирующей активностью. Алкалоид, выделен из южно-американского растения *Erythroxylon coca*. Хорошо всасывается через слизистые оболочки с оказанием возбуждающего (наркотического) действия на весь организм, вызывает болезненное пристрастие (зависимость), является одним из наиболее распространенных в мире наркотических средств. В настоящее время синтезировано множество лекарственных препаратов, которые по силе и эффективности местно-анестезирующего действия значительно

превосходят кокаин (кокаина г/х), в связи с чем, а также высокой токсичностью и наркотической активностью, в медицине практически не применяется.

Бензофуракаин – применяется как местно-анестезирующее средство, вместе с тем проявляет центральную анальгезирующую активность. Как средство для местной анестезии применяется в стоматологии для лечения пульпитов, периодонтитов, вскрытия абсцессов, экстракции зуба и пр., в виде разовых инъекций 1% раствора 2-5 мл (возможно с добавлением 0,1 % раствора адреналина г/х). В качестве анальгетического средства - при заболеваниях желудочно-кишечного тракта, коликах, заболеваниях периферической нервной системы, внутримышечно или внутривенно 1 % раствор, 10 – 30 мл 1 – 3 раза в сутки.

Ультракаин (артикаина гидрохлорид) – сильный местный анестетик, оказывает быстрое и достаточно длительное местно-анестезирующее действие при инфильтрационной, проводниковой, спинномозговой (люмбальной) анестезиях. Выпускается в ампулах, в виде 1 – 2 % растворов по 1 мл. Выпускается также – «ультракаин D-C», содержащий 0,04 гр (40мг) артикина и 0,006 мг адреналина г/х по 1 мл., а также «ультракаин D-C форте», содержащий 0,04 гр (40мг) артикина и 0,012 мг адреналина г/х по 1 мл. «**Ультракаин D-C**» и «**Ультракаин D-C форте**» применяют в стоматологии при пломбировании зубов, экстракции зубов и пульпы и пр. При инфильтрационной и региональной анестезии применяют ультракаин и ультракаин D-C. Дозы подбирают индивидуально.

Лидокаин (лидокаина гидрохлорид) - сильное местно-анестезирующее средство, значительно превосходящее по силе и длительности действия новокаин. Применяют для проводниковой, терминальной, инфильтрационной анестезии. Проявляет также антиаритмические свойства. В качестве местно-анестезирующего средства применяется при хирургическом удалении аппендикса, грыжесечении, хирургических операциях на конечностях, в стоматологии, офтальмологии, урологии и пр. Для инфильтрационной анестезии применяют 0,5 % растворы, при проводниковой 1 -2 % растворы (40 мл 1 % раствора или 20 мл 2 % раствора). В офтальмологии применяют 2 и 4 % растворы в виде капель (по 2 капли 2 - 3 раза с интервалом 30 - 60 секунд). В качестве антиаритмического средства вводят внутривенно в количестве 50 – 100 мг в течение 3 - 4 мин, после чего продолжают вводить со скоростью 2 мг в минуту (продолжительность зависит от эффективности и результатов применения препарата). Для смазывания слизистой оболочки при хирургических вмешательствах 1 – 2 – 5 и 10 % растворы (10 % раствор наносится в количестве не более 2 мл.).

Маркаин (бупивакаин) - анестетик длительного действия, в 4 раза эффективнее лидокаина. При интракостальной послеоперационной блокаде анальгезия поддерживается в течение 7-14 ч. Применяется при различных видах местной анестезии (травмы, хирургические вмешательства), местной инфильтрационной анестезии (в т.ч. в стоматологии), проводниковой анестезии (в т.ч. при блокаде больших и малых нервов), люмбальной блокаде и пр. Концентрация раствора зависит от вида анестезии: инфильтрационная – 0,25-0,5%, проводниковая – 0,25-0,5%, люмбальная анестезия – 0,1-0,75% и др. Для проведения спинальной анестезии используют 0,5% изобарический

раствор (на основе 0,9% раствора NaCl) и 0,5% гипербарический раствор (на основе 8% раствора декстрозы).

Тримекаина г/х - по химической структуре и свойствам близок к лидокаину, является активным местно анестезирующим средством, вызывает быструю, глубокую и продолжительную проводниковую, инфильтрационную, перидуральную, спинномозговую и поверхностную анестезию, обладает также антиаритмическим действием. Действует сильнее и продолжительнее новокаина, малотоксичен, не оказывает раздражающего действия. Для инфильтрационной анестезии применяют 0,125 – 0,5 % раствор, для проводниковой – 1-2% раствор, для спинномозговой - 5%. Механизм действия, способ применения и дозы препарата при применении его в качестве противоаритмического средства аналогичен лидокаину, обычно вводят внутривенно в виде 2% раствора, затем капельно – из расчета 2 мг в минуту (в течении суток).

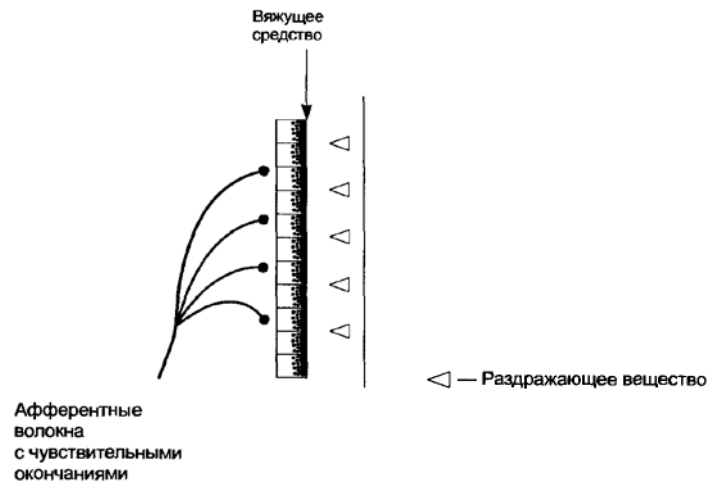
Пиромекаин (бумекаина г/х) - препарат оказывает местно-анестезирующее, а также седативное, болеутоляющее, противовоспалительное действие, обладает ярко выраженной противоаритмической активностью. Пиромекаин применяется в основном в качестве противоаритмического средства, при нарушениях ритма сердца различного генеза (происхождения), но, кроме того, вызывает быстро наступающую, глубокую и продолжительную анестезию. В качестве местного анестетика применяется для поверхностной анестезии при проведении лечебных и диагностических манипуляций в стоматологии, офтальмологии, пульманологии, оториноларингологии, хирургии, гастроэнтерологии и пр. Применяют местно в виде 0,5-1-2% раствора и 5% мази или внутривенно в виде 1% раствора. В качестве противоаритмического средства вводят внутривенно, струйно, в виде 1% раствора на 5% растворе глюкозы.

Павестезин - содержит 0,3 анестезина и 0,05 папаверина гидрохлорида и относится к группе спазмолитических средств. Комбинированный препарат оказывающий анестезирующее и спазмолитическое действие. Применяется в основном при гастритах, спазмах гладкой мускулатуры органов брюшной полости. Назначают внутрь по 1 таблетке 3 раза в день.

Вяжущие средства

Вещества, обладающие вяжущим действием, относятся к противовоспалительным средствам местного действия, которые проявляют свойство уплотнять поверхность слизистых оболочек путем коагуляции (осаждения) белков. Образующаяся в результате действия вяжущих средств защитная пленка предохраняет воспаленную или язвенную поверхность от действия раздражающих факторов (например, соляной кислоты желудочного сока или пищи при язвенной болезни желудка).

Кроме того, воспаленная поверхность под действием вяжущих средств стягивается, сосуды суживаются, что приводит не только к уменьшению раздражающего действия вредных факторов, но и к уменьшению воспалительного процесса.



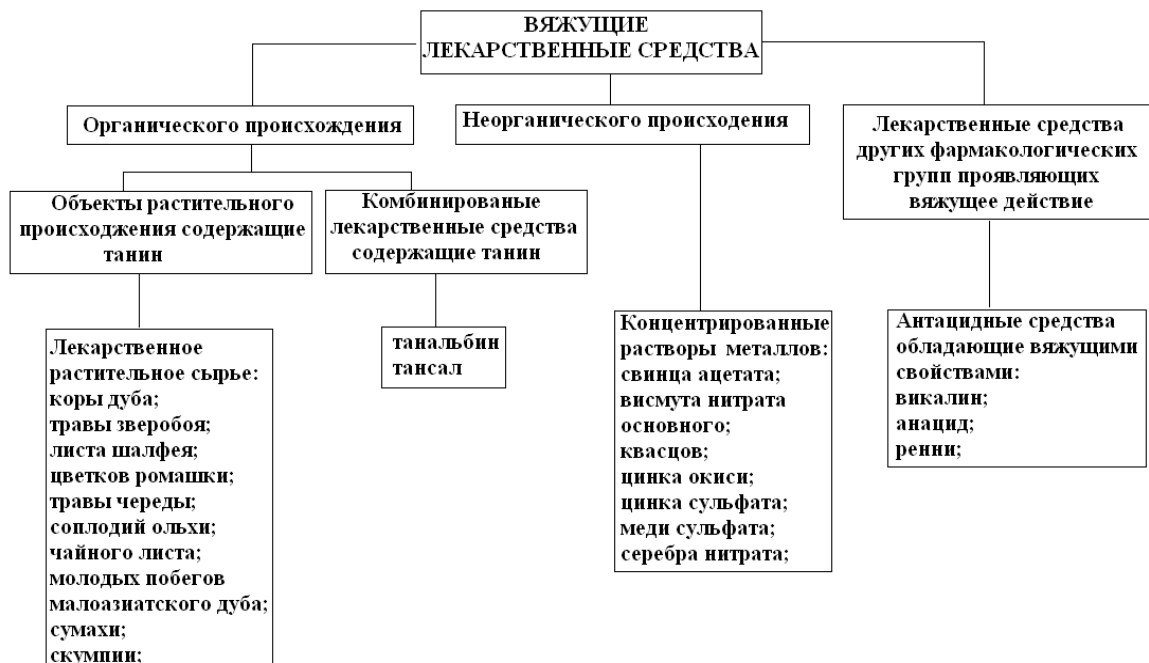
Вяжущие свойства подразделяют на две подгруппы:

1. Органического происхождения.
2. Неорганического происхождения.

К средствам **органического происхождения** относят растительные объекты содержащие танин (кора дуба, трава зверобоя, лист шалфея, цветки ромашки, трава череды, соплодия ольхи, чайный лист).

Источником промышленного получения танина являются чернильные орешки наростов на молодых побегах малоазиатского дуба (*Gallae turcicae*), а также лекарственное растительное сырье растений: сумаха (*Rhus coriaria*) и скумпии (*Cotinus coggygria*), семейства сумаховые (*Anacardiaceae*).

Структура группы вяжущих лекарственных средств



К вяжущим средствам **неорганического происхождения** относятся слабо концентрированные растворы некоторых металлов: свинца ацетата, висмута нитрата основного, квасцов, цинка окиси, цинка сульфата, меди сульфата, серебра нитрата. В

небольших концентрациях эти вещества обладают вяжущими свойствами, в больших дозах – прижигающими, образуя на поверхности слизистой плотные альбуминаты.

Некоторые из лекарственных средств других фармакологических групп, например антацидные (викалин, ренни) также обладают вяжущими свойствами.

Краткая характеристика лекарственных препаратов

Танин – (танины или таннины) – группа фенольных соединений растительного происхождения, содержащие большое количество групп – ОН. Танин обладает дубящими свойствами и характерным вяжущим вкусом. Дубящее действие танина основано на их способности образовывать прочные связи с белками, полисахаридами и другими биополимерами. Танин – фармакопейный препарат, получаемый из растений. Выпускается также – танина раствор спиртовой 4%. Для полосканий применяют также 1-2% водный раствор, 3-5-10% растворы и мази, 0,5% водный раствор для промывания желудка. Показаниями к применению являются воспалительные процессы в полости рта, носа, зева, гортани, ожоги, язвы, трещины, пролежни, интоксикация солями алкалоидов и тяжелых металлов.

Танальбин – соединение танина с альбумином. Фармакологическое действие – вяжущее, противопоносное, слабое противомикробное. Применяется при острых и хронических энтероколитах, диспепсии, диаре: внутрь по 0,3-0,5-1 на прием, 3-4 раза в день. Выпускается в таблетках по 0,5 и виде порошка.

Тансал – комбинированный лекарственный препарат, содержит танальбина и фенолсалицилата по 0,3 гр. Оказывает вяжущее, противовоспалительное, антисептическое, комплексообразующее и дезинтоксикационное действие. Танальбин – продукт взаимодействия дубильных веществ из листьев скумпии и сумаха с белком (казеином). В отличие от танина не оказывает вяжущего действия на слизистые оболочки рта и желудка. Поступая в кишечник, постепенно расщепляется, выделяя свободный танин. Фенолсалицилат угнетает патогенную микрофлору кишечника, оказывает жаропонижающее и противовоспалительное действие.

Кора дуба (*Quercus cortex*) – должна содержать не менее 8% дубильных веществ. Средство растительного происхождения, оказывает вяжущее, дубящее, противовоспалительное, гемостатическое местное, рвотное и антисептическое действие, снижает потоотделение, связывает двухвалентные катионы. Применяется в виде отвара (20 г (2 ст. ложки) – на 200 мл кипящей воды, нагревают в течение 30 мин.), наружно для полосканий, промывания ран, примочек, сидячих ванн. Отвар может применяться также при отравлении грибами и солями меди внутрь, а также заболеваниях желудочно-кишечного тракта в виде отвара, по 15-30 мл 3-4 раза в день, при диарее – 100 мл 2-3 раза в день.

Квасцы – двойные соли, кристаллогидраты сульфатов трех- и одновалентных металлов, общей формулы $M^+_2SO_4 \cdot M^{3+}_2(SO_4)_3 \cdot 2H_2O$ (где M^+ – щелочной (натрий, калий и т.д., а также ионы аммония NH_4^+), M^{3+} трехвалентный металл (алюминий, хром, железо и т.д.)). Квасцы, применяют наружно в качестве вяжущего, прижигающего и кровоостанавливающего средства. Раствором квасцов (1/2 чайной ложки на стакан

горячей воды) обрабатывают трофические язвы и гноящиеся раны. Квасцы осушают рану, стягивают ее, останавливают кровь. Квасцы не проникают в клетки и не нарушают работу потовых желез, но могут применяться в виде присыпок для снижения секреции потовых и сальных желез, в связи с чем применяются для лечения микозов стоп и их осложнений, а также в виде 0,5-1% водного раствора для полосканий и промываний. Алюминиевые квасцы являются одними из основных компонентов кровоостанавливающих карандашей.

Висмута нитрат основной – вяжущее и антацидное (снижающее кислотность желудка) средство, нерастворим в воде и спирте. Применяется внутрь, в качестве вяжущего, слабого антисептического (обеззараживающего), закрепляющего средства при желудочно-кишечных заболеваниях. Оказывает также местное вяжущее и противовоспалительное действие. Препарат принимают по 0,25 – 1 г на прием, 4-6 раз в день до еды, за 15-30 минут или местно 1-2 раза в день при дерматитах (воспалениях кожи), эрозиях и небольших язвах. Выпускается в виде порошка и 10% мази.

Свинца ацетат – свинцовая соль уксусной кислоты, растворим в 2,5 частях холодной и 0,5 частях кипящей воды. Применяют наружно в виде водных растворов (0,25–0,5%) как вяжущее средство при воспалительных заболеваниях кожи и слизистых оболочек.

Свинцовая примочка – слегка мутная жидкость со слабощелочной реакцией (готовят ex tempore), состоит из 2 частей раствора основного свинца ацетата и 98 частей воды и применяется для промывания глаз и орошения ран.

Цинка окись (оксид цинка ZnO) – бесцветный кристаллический порошок, нерастворимый в воде. Обладает многогранным действием на организм: противовоспалительное, подсушивающее, адсорбирующее, вяжущее и антисептическое. Наиболее часто применяется в качестве противовоспалительного местного средства. При нанесении на пораженную поверхность уменьшает явления экссудации, воспаления и раздражения тканей, образует защитный барьер от действия раздражающих факторов. Применяется исключительно наружно, в виде мази, пасты, линимента.

Меди сульфат (медный купорос) - белые кристаллы (на воздухе кристаллизуется в голубой пентагидрат), хорошо растворим в воде. При местном применении оказывает антисептическое, обеззараживающее и вяжущее действие, в небольших количествах входит в состав комплексных поливитаминных препаратов. Как антисептическое и вяжущее средство применяется при конъюнктивитах (воспалении наружной оболочки глаза), для промывания при уретритах (воспалении мочеиспускательного канала) – в виде 0,25% раствора. При ожогах кожи (фосфором) обильно смачивают обожженный участок 5% раствором. Ранее меди сульфат применялся в качестве рвотного средства (15-50 мл. 1% раствора). В настоящее время применяется внутрь при отравлении белым фосфором.

Серебра нитрат – лекарственное средство для наружного применения. В небольших концентрациях – оказывает вяжущее и противовоспалительное действие, в более высоких концентрациях - прижигает ткани. Обладает бактерицидным (уничтожающим бактерии) свойствами. Применяют при эрозиях (поверхностном дефекте слизистой оболочки), язвах, избыточной грануляции (образовании соединительной ткани на месте раневой поверхности), трещинах, при остром конъюнктивите (воспалении наружной оболочки

глаза), хроническом гиперпластическом ларингите (хроническом воспалении гортани). Назначается в виде водных растворов, мазей, а также ляписных карандашей. Для смазывания кожи и прижиганий (2-10% раствор, 1-2% мазь), для смазывания слизистых оболочек – 0,25-2% раствор. Ранее препарат назначался при хроническом гастрите и язвенной болезни желудка (в качестве противовоспалительного средства). Раствор серебра нитрата (2%) ранее широко использовался для профилактики бленнореи (острого гнойного воспаления наружной оболочки глаз) у новорожденных, в настоящее время для этой цели чаще применяют 30% раствор сульфацила (или другие антибактериальные препараты).

Обволакивающие средства

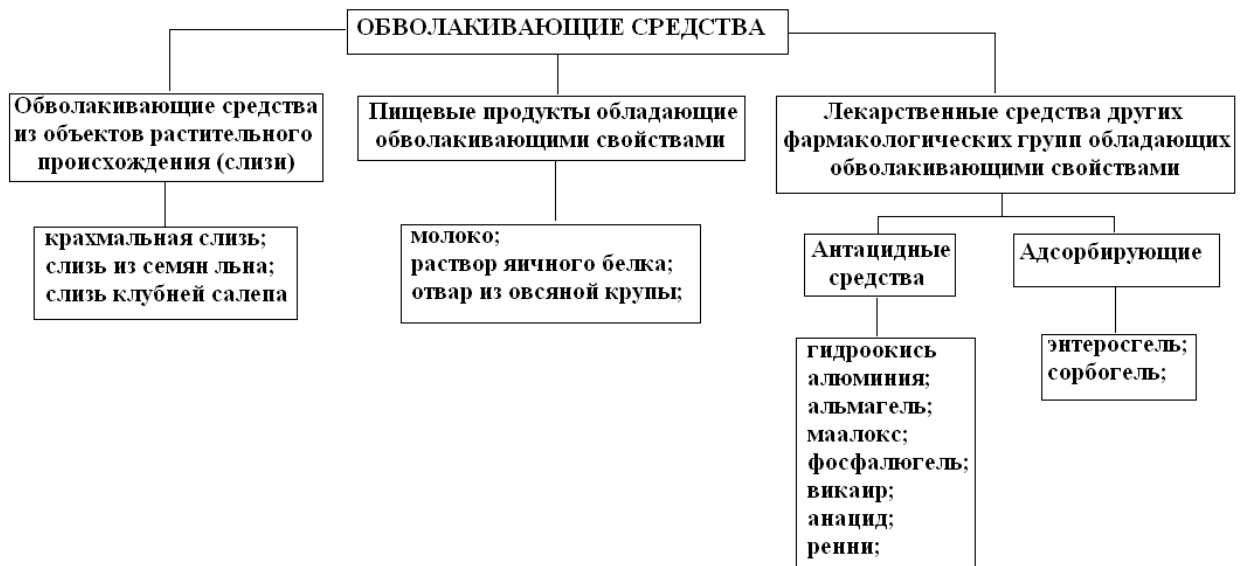
Препараты данной группы образуют защитную пленку, которая покрывает слизистые оболочки, а также воспаленные и пораженные (язвами) поверхности, препятствуя раздражению нервных окончаний. Обволакивающие вещества могут применяться как самостоятельно, так и входить в состав лекарственных средств с раздражающим действием на слизистые оболочки и желудочно-кишечный тракт. Самостоятельно лекарственные средства этой группы применяются при гастрите, язвенной болезни пищевода и желудка, а также в качестве профилактического средства. Данные средства применяют также при ожогах слизистых оболочек кислотами, щелочами др. едкими жидкостями.

Обволакивающими свойствами обладают слизи из крахмала, семян льна и пр. Среди продуктов питания обволакивающее действие оказывают: молоко, раствор яичного белка, отвары из овсяной крупы. Резорбтивного (общего) действия на организм обволакивающие средства не оказывают.



Некоторые из лекарственных средств других фармакологических групп, например антацидные (гидроокись алюминия, альмагель, маалокс, фосфалюгель, викаир, анацид, ренни) и адсорбирующие (энтеросгель, сорбогель), обладают также обволакивающими свойствами.

Структура группы обволакивающих лекарственных средств



Краткая характеристика лекарственных препаратов

Крахмальная слизь (*Mucilago Amyli*) – обволакивающее средство получают из зерновок пшеницы, кукурузны, риса, из клубней картофеля. Применяется наружно в виде присыпок и пудр (с окисью цинка и тальком), внутрь в клизмах (в виде крахмального клейстера или слизи) для защиты чувствительных нервных окончаний от воздействия раздражающих веществ при воспалении желудочно-кишечного тракта, для уменьшения раздражающего действия некоторых лекарственных средств и всасывания ядов. Как правило, применяется водная взвесь 1:5 (1 часть крахмала растворяют с такой же частью кипящей воды, после чего разводят еще 45 частями кипящей воды до 50 частей).

Слизь из семян льна (*Mucilago semenum Lini*) – семена льна, залитые водой, спустя 2-3 часа разбухают и выделяют слизь. Приготавливают слизь заливая $\frac{1}{2}$ стакана воды $\frac{1}{2}$ чайной ложки семян (3г), после чего взбалтывают в течении 15 минут или настаивают в течении 2-3 часов, процеживают, принимают по $\frac{1}{2}$ стакана перед едой. При приеме внутрь слизь оказывает обволакивающее действие, покрывает слизистую оболочку желудочно-кишечного тракта, а также пищевые массы. При приеме семян - семена льна набухают в кишечнике, увеличиваются в объеме, что усиливает перистальтику. По последним данным слизь из семян льна повышает секреторную активность поджелудочной железы, стимулирует выделение инсулина. Слизь из семян льна обладает также расслабляющим (ветрогонным) и желчегонным средством. Основное применение – в качестве обволакивающего средства при язвенной болезни, энтеритах, колитах.

Слизь клубней салепса (*Mucilago Salep*) получают из лекарственного растительного сырья – клубней салепса (ятрышника), которые содержат 50 % слизи и около 25% крахмала. Приготовление: 1ч порошка клубней увлажняют 1 ч спирта и взбалтывают с 10 ч холодной воды, затем прибавляют 88 частей кипящей воды. Укупоренную склянку заворачивают в полотенце, полученную взвесь продолжают энергично встряхивать до охлаждения жидкости, после чего процеживают. Слизь салепса используют в качестве смягчительного, обволакивающего и противовоспалительного средства при гиперацидных гастритах, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, при гастроэнтеритах

и колитах, иногда при острых респираторных заболеваниях полости рта, носоглотки, диарее, дизентерии, цистите, пищевых отравлениях.

Антацидные средства

Антацидные лекарственные средства предназначены для лечения кислотозависимых заболеваний желудочно-кишечного тракта посредством нейтрализации соляной кислоты желудочного сока. Соляная кислота желудочного сока оказывает раздражающее действие на желудок при гастрите, а также язвенной болезни желудка, чем затрудняет лечение этих заболеваний.

Наиболее известный антацид – пищевая сода, помогает быстро избавиться от изжоги и болей в желудке, связанных с повышенной кислотностью или при необходимости снижения кислотности. Однако сода, как и другие всасывающиеся антациды, имеет массу побочных эффектов, в связи с чем, современная медицина не рекомендует ее применение.

Более предпочтительными среди антацидных средств, являются магния окись и алюминия гидроксид. Их действие в сравнении с гидрокарбонатом натрия развивается медленнее (через 30-40 минут), но действуют они более продолжительное время. К тому же они лишены всех недостатков, характерных для пищевой соды, в частности – практически не всасываются.

Широкое применение получили также комбинированные лекарственные препараты с антацидными свойствами: альмагель, фосфалюгель, гастал, «Викаир», «Викалин», ренни, маалокс и пр. Данные препараты обладают, наряду с антацидными, также обволакивающими и адсорбирующими свойствами. Кроме того, «Викаир» и «Викалин» проявляют слабительный эффект, в состав данных препаратов входит также небольшое количество натрия гидрокарбоната, что обеспечивает быстрый фармакологический эффект.

В качестве противоязвенных и противогастритных средств, обладающих антацидными свойствами, применяются также лекарственные препараты – блокаторы H_2 гистаминовых рецепторов (циметидин, ранитидин и пр.), являющиеся эффективными средствами снижающими кислотность желудка.

В последнее время широкое применение в качестве противоязвенных и противогастритных средств, обладающих антацидными свойствами, получили так называемые ингибиторы протонного насоса (омепразол, пантапризол и пр.). Пассивные в нейтральной среде, в кислой среде желудка эти препараты превращаются в активных ингибиторов мембранной $H^+ K^+$ АТФазы (фермента ускоряющего обмен ионов водорода в мембранах клеток слизистой оболочки желудка), что приводит к блокированию конечной стадии образования соляной кислоты, подавлению секреции соляной кислоты и пепсина желудочного сока. Кроме того, данные препараты обладают гастропротекторными свойствами.

В неотложных случаях в качестве антацидных средств могут применяться лекарственные препараты группы атропина (м-холиноблокаторы), а также ганглиоблокаторы (бензогексоний). Однако препараты этих групп применяются, как правило, непродолжительное время, поскольку обладают широким спектром фармакологического действия.

Перечисленные группы лекарственных препаратов (блокаторы H_2 гистаминовых рецепторов, ингибиторы протонного насоса, м-холиноблокаторы и ганглиоблокаторы) не смогли полностью заменить антацидные средства. Однако, согласно современным взглядам, антацидные средства также не могут быть единственными препаратами выбора

при лечении гастритов, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, прочих кислотозависимых заболеваний, хотя и являются необходимыми дополнительными средствами в комплексной терапии.

Антацидные средства применяют:

- На начальных стадиях кислотозависимых заболеваний ЖКТ;
- Как дополнительное средство при лечении антисекреторными препаратами;
- Для снижения или устранения изжоги и загрудинной боли в эпигастральной области при проведении основного курса терапии и в период ремиссии;

Главными особенностями антацидных лекарственных средств являются быстрота кислотонейтрализации (быстрый терапевтический эффект), но относительная непродолжительность терапевтического действия.

Структура группы антацидных лекарственных средств



Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Гидроокись алюминия - антацидное средство, обладающее адсорбирующими (поглощающими избыток соляной кислоты желудочного сока) свойствами (1 г нейтрализует 250 мл 0,1N раствора соляной кислоты с образованием хлорида алюминия и воды. рН показатель желудочного сока постепенно снижается до 3,4 – 4,5 и остается на этом уровне в течении нескольких часов). Назначается при повышенной кислотности желудочного сока, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, острых и хронических гиперацидных гастритах и пищевых отравлениях. Назначают в виде суспензий (4%) в воде, обычно 1-2 чайные ложки 4-6 раз в день.

Альмагель - антацидное средство, обладающее обволакивающим и адсорбирующим эффектом (комплексный препарат, в состав которого входит оксид магния, гидроокись алюминия и D-сорбит. В альмагель А входит – анестезин). Действие альмагеля основано на локальной нейтрализации постепенно выделяющегося желудочного сока, уменьшении содержания соляной кислоты в желудочном соке до оптимального предела. Обладает местноанестезирующим действием, вызывает незначительный слабительный и желчегонный эффекты. Препарат длительного действия (70 минут), действовать начинает быстро – через 3 - 5 минут. Назначается при остром гастрите с повышенной кислотностью, язвенной болезни, отравлениях (пищевых токсикоинфекциях). Назначают

по 1-2-3 чайных ложки (максимальное количество 16) за 30 минут до еды и перед сном (курс – 14 дней).

Гастал – комбинированный препарат, содержащий алюминия гидроксид, магния карбонат и магния оксид. Сочетание действующих веществ обеспечивает эффективный антацидный эффект и уменьшение возможности запора. Назначается внутрь при повышенной кислотности желудочного сока, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гиперацидном гастрите (остром и хроническом), эффективен при повышенном содержании фосфатов в крови. Таблетки принимают по 1-2 шт, 4-6 раз в день (через 1 час после еды, таблетки не разжевывают).

Маалокс - антацидное средство, обладающее обволакивающим и адсорбирующим эффектом (комплексный препарат, в состав которого входит оксид магния и алюминия гидроксид - аналогичен – альмагелю). Выпускается в таблетках (по 40 шт.), в виде геля в пакетиках (по 30 шт.), а также в виде готовой суспензии во флаконе (250 мл).

Фосфалюгель - антацидное средство (действующее вещество - алюминия фосфат) - оказывает адсорбирующее и обволакивающее действие. Нейтрализует свободную соляную кислоту в желудке (в течение 10 мин), снижает кислотность, осаждающаяся на слизистой желудка в виде гидрофильных, коллоидных мицелл – проявляет обволакивающий эффект, усиливает собственные защитные механизмы желудка и кишечника, не изменяет физиологию пищеварения. Применяется при остром гастрите с повышенной и нормальной секреторной функцией желудка, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки. Форма выпуска – пакетики по 16 гр. Назначают внутрь в чистом виде (запивают небольшим количеством воды) или разводят в половине стакана воды. Доза 1-2 пакета 2-3 раза в день за 30 минут до еды.

Викаир - комплексный препарат, в состав которого входят субнитрат висмута, гидрокарбонат натрия, кора крушины, карбонат магния и корневища аира. Обладает антацидным, бактерицидным, слабительным, вяжущим, спазмолитическим и репаративным (улучшающим кровоснабжение органа, активизирующим и стимулирующим обменные процессы и грануляцию, препятствующим старению) действием. Антацидный эффект проявляется быстро (за счет действия гидрокарбоната натрия), соли висмута обеспечивают обволакивающее и гастропротекторное действие. Корневища аира способствуют спазмолитическому, репаративному и болеутоляющему действию, кора крушины – слабительному. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, гиперацидном гастрите, при склонности работы кишечника к запору. Таблетки принимают спустя 1-1,5 часа после приема пищи, по – 1-2 таблетки, 3 раза в день.

Викалин - комплексный препарат, обладающий антацидным, вяжущим, спазмолитическим и слабительным действием. В состав препарата входят гидрокарбонат натрия, карбонат магния, нитрат висмута, келлин и активные вещества корневища аира, рутин, кора крушины. Препарат назначают при лечении гиперацидного гастрита, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, неязвенной диспепсии и др. заболеваний ЖКТ. Гидрокарбонат натрия и карбонат магния уменьшают кислотность желудочного

сока и снижают активность пепсина, нитрат висмута – оказывает репаративное, бактерицидное и противовоспалительное, обволакивающее действие, келлин и активные вещества аира – проявляют спазмолитический эффект, кора крушины – слабительное действие, рутин – обеспечивает уменьшение проницаемости капилляров. Таблетки рекомендуют назначать через 30-60 мин после еды, предварительно измельчив, по 1 -2 шт., запивая 100 мл воды.

Висмута субцитрат – противоязвенное средство с бактерицидной активностью, эффективен при гастрите. В кислой среде желудка и двенадцатиперстной кишки образует защитную пленку (на поверхности язв и эрозий), что способствует их рубцеванию. Повышает устойчивость цитопротекторных (защищающих клетки) механизмов слизистой желудка к воздействию соляной кислоты желудочного сока, пепсина и желудочных ферментов. Препарат назначают при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, обострении гастродуоденита (воспаление желудка и двенадцатиперстной кишки) у больных язвенной болезнью, при гастрите бактериальной природы. Назначают по 1 таблетке 3 раза в день за 30 минут до еды, 4 раз – перед сном. Таблетку запивают небольшим количеством воды или молока. За 30 минут до и после приема препарата не следует принимать пищу.

Магния окись – антацидное средство, превращающееся при взаимодействии с водой в магния гидроксид. Нейтрализует свободную соляную кислоту желудочного сока, снижает активность пепсина. При приеме натощак – действие препарата непродолжительно (до 30 минут). При приеме после еды – продолжительность увеличивается до 3-4 часов. Образующийся в результате взаимодействия магния окиси с соляной кислотой желудочного сока магния хлорид обладает слабительным эффектом, увеличивая осмотическое давление в просвете кишечника и усиливая перистальтику. При приеме внутрь – разовая доза 0,25 – 2,5 гр., частота приема и длительность курса лечения зависит от медицинских показателей. При приеме вместе с другими антацидными средствами увеличивает продолжительность их действия.

Анацид - комплексный препарат, обладающий антацидным, адсорбирующим и обволакивающим действием. В состав препарата входят алюминия и магния гидроокиси (нейтрализуют соляную кислоту желудочного сока), альгельдрат (оказывает адсорбирующее и обволакивающее действие, уменьшая негативное влияние на слизистую оболочку желудка). Кроме того, препарат способен связывать фосфаты и нарушает их абсорбцию (всасывание) из ЖКТ. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения, гиперацидном гастрите, остром гастрите различного генеза, остром и хроническом рецидивирующем панкреатите и пр. Для системной терапии назначают 1-2 пакетика 4-6 раз в сутки в промежутках между приемами пищи, а также при болях и изжоге.

Ренни - антацидный и гастропротекторный препарат, активными компонентами которого являются кальция и магния карбонаты, которые попадая в полость желудка, взаимодействуют с соляной кислотой желудочного сока. В результате происходит нейтрализация кислоты с образованием воды и водорастворимых солей кальция и магния. Под действием магния повышается слизиобразование и защита клеток желудка от

негативного действия соляной кислоты. Препарат применяют при заболеваниях ЖКТ, связанных с повышенной кислотностью желудочного сока: при гастрите с повышенной и нормальной кислотностью, в том числе хроническом в период обострения; язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки; остром дуодените; при болях в желудке вызванных злоупотреблением алкоголя, курением и действиями лекарственных препаратов раздражающих слизистую оболочку желудка. Назначают по 1-2 таблетки при симптомах, связанных с повышенной кислотностью. Таблетку разжевывают во рту до растворения. При отсутствии эффекта через 2 часа прием повторяют (не более 16 таблеток в день).

Циметидин – блокатор H_2 гистаминовых рецепторов подавляет секрецию соляной кислоты как базальную (собственную), так и стимулированную пищей, гистамином, гастрином и ацетилхолином. Снижает активность пепсина. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения и пр. язвенных и воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта, в том числе для профилактики обострения язвенной болезни. Доза устанавливается индивидуально, обычно по 0,2 г 3 раза в день и 0,4 г перед сном. Как правило, препарат назначают во время или после еды, может применяться внутривенно (струйно или капельно). Перед применением необходимо исключить возможность злокачественных заболеваний пищевода, в процессе приема следует контролировать функциональное состояние печени.

Фамотидин – блокатор H_2 гистаминовых рецепторов подавляет секрецию соляной кислоты как базальную (собственную), так и стимулированную пищей, гистамином, гастрином и ацетилхолином. Снижает активность пепсина. Действует через 1 час после однократного приема, продолжительность 12 – 24 часа. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки и др. язвенных и воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта, в том числе для профилактики обострения язвенной болезни при длительном лечении глюкокортикоидами. Доза подбирается индивидуально, обычно по 0,04 г 1 раз в сутки перед сном, или по 0,02 г 2 раза в сутки утром и вечером. Прием препарата прекращают постепенно.

Ранитидин – блокатор H_2 гистаминовых рецепторов, подавляет секрецию соляной кислоты как базальную (собственную), так и стимулированную пищей, гистамином, гастрином и ацетилхолином. Снижает активность пепсина. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения и пр. язвенных и воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта, в том числе для профилактики обострения язвенной болезни. Дозы устанавливают индивидуально, обычно по 0,15 г 2 раза в день (утром и вечером) или 0,3 г перед сном. Для профилактики язвенной болезни назначают 0,15 г препарата перед сном (до 12 месяцев) при постоянном эндоскопическом контроле.

Омепразол – подавляет секрецию соляной кислоты в желудке (ингибитор «протонного насоса»). Действие препарата наступает быстро, после однократного приема 0,02 г препарата эффект длится 24 часа. Применяется при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки и др. язвенных и воспалительных заболеваниях желудочно-кишечного тракта, в т. ч. для профилактики данных заболеваний. Капсулы по 0,02 г

принимают однократно утром (перед завтраком). Капсулы следует проглатывать, запивая небольшим количеством жидкости.

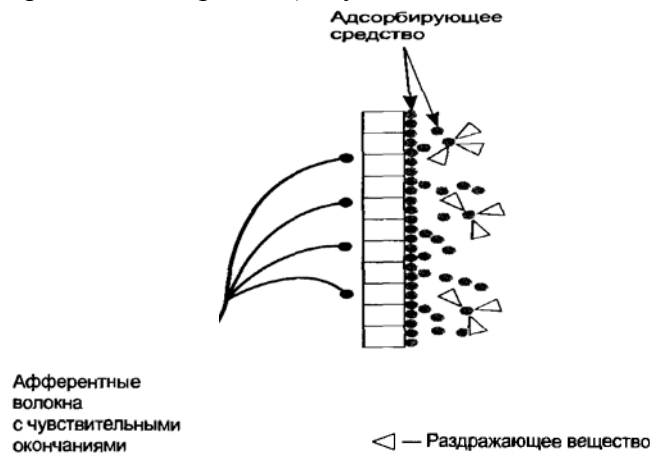
Адсорбирующие средства

К адсорбирующим лекарственным средствам относят вещества, обладающие высокой адсорбирующей способностью. Адсорбирующие вещества, как правило, имеют порошкообразную консистенцию, не растворимы в воде, являются химически инертными и не обладают раздражающим действием. Благодаря большой адсорбирующей поверхности, эти средства связывают ядовитые и токсичные вещества, препятствуют их ядовитому, раздражающему действию, а также всасыванию из желудочно-кишечного тракта. Кроме того, адсорбирующие вещества образуют тонкую пленку на коже или слизистой оболочке, механически защищая поверхность слизистой, проявляют свойства характерные для обволакивающих средств.

Адсорбирующие средства применяют также в виде присыпок для наружного применения. С этой целью могут наноситься на раневую и язвенную поверхность.

В качестве адсорбирующих средств используют: активированный уголь, белую глину, тальк, карбонат магния, окись магния, перекись магния, гидроокись алюминия.

Наиболее часто адсорбирующие вещества применяют при пищевых отравлениях, сопровождающихся диареей и метеоризме (вздутии кишечника газами).



Некоторые из лекарственных средств других фармакологических групп, например антацидные (гидроокись алюминия, магния окись), обладают адсорбирующими свойствами.

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Уголь активированный – (животного или растительного происхождения), специально обработанный и обладающий большой поверхностной активностью. Препарат способен поглощать (адсорбировать) газы, алкалоиды, токсины (ядовитые вещества) различной природы. Лекарственное средство применяют при диспепсии (расстройствах пищеварения), метеоризме, пищевых отравлениях различной природы, эффективен при отравлениях алкалоидами, солями тяжелых металлов и пр. Назначается внутрь по 20-30 г на прием в виде взвеси в воде. При повышенной кислотности и метеоризме назначают внутрь по 1-2 г (в воде) 3-4 раза в день.

Белая глина – природный кремнийсодержащий энтеросорбент сложного состава (содержащий большое количество микроэлементов). Проходя через различные отделы пищевого тракта сорбент поглощает токсичные вещества и метаболиты различной

этиологии. Белая глина способствует выведению токсинов и радионуклидов из организма. Препарат эффективен при алкогольной интоксикации и нарушениях обменных процессов. При интоксикации (отравлении) употребляют до 3 г белой глины.

Энтеросгель – энтеросорбент – с действующим веществом метилкремниевой кислотой в виде гидрогеля. Оказывает детоксикационное действие при приеме внутрь. Кремнийорганическая матрица гидрогеля метилкремниевой кислоты эффективно абсорбирует из крови (за счет действия через мембраны ворсинок клеток слизистой оболочки кишечника) и из содержимого кишечника продукты незавершенных метаболических реакций, среднемолекулярные токсические вещества и инкорпорированные радионуклиды. После абсорбции выводит их из организма с калом. Разовая дозировка – 1 столовая ложка (15 г) геля – для взрослых.

Диосмектит - лекарственное средство природного происхождения, обладающее протективным (защитным) действием в отношении слизистой оболочки кишечника и выраженными адсорбирующими свойствами. Диосмектит, являясь стабилизатором слизистого барьера, проникает в слизь и увеличивает продолжительность ее жизни, образуя физический барьер, который защищает слизистую оболочку пищеварительного тракта от отрицательного действия H^+ ионов, кишечных микроорганизмов и их токсинов. Кроме того, препарат обладает хорошей обволакивающей способностью. Применяют симптоматически (облегчающее состояние больного без существенного влияния на причину возникновения болезни), для лечения болей, связанных с заболеваниями пищевода, желудка, двенадцатиперстной кишки; кишечная колика; острая и хроническая диарея, особенно у детей. Препарат назначается взрослым по 3 пакетика в сутки, растворяя их содержимое в половине стакана воды. Для получения однородной суспензии (взвеси твердого вещества в воде) постепенно высыпать в жидкость порошок, равномерно его размешивая.

Раздражающие средства

В некоторых случаях благоприятный терапевтический эффект можно получить не блокируя нервные окончания, а наоборот, оказывая на них раздражающее действие. Для этих целей применяют лекарственные средства, обладающие раздражающим действием на нервные окончания.

При применении средств этой группы оказывается избирательное (раздражающее) действие на нервные окончания кожи и слизистых оболочек определенных участков тела, вызывается ответная реакция организма, в результате чего достигается необходимый терапевтический эффект.

Раздражающие средства проявляют следующие виды действия:

1. **Рефлекторное**
2. **Отвлекающее**

Кроме того, отвлекающее действие раздражающих средств, как правило, сопровождается **местным** действием, в месте их применения.

Рефлекторное действие лекарственных средств проявляется при раздражении нервных окончаний, результатом которого является возбуждение центральной нервной системы и, как следствие, ответная реакция всего организма.

В качестве примера можно привести раздражающее действие паров нашатырного спирта (аммиака) при обмороках. Пары нашатырного спирта раздражают нервные окончания верхних дыхательных путей, что приводит к рефлекторному возбуждению центральной нервной системы и восстановлению сознания.

Некоторые лекарственные средства этой группы, вызывая раздражение окончания нервных волокон, оказывают рефлекторное действие на сердце, тонус сосудов, дыхательную систему и пр. Так, основной компонент эфирного масла лекарственного растения мяты перечной – ментол - оказывает избирательное раздражающее воздействие на холодовые рецепторы полости рта, что приводит к рефлекторному расширению коронарных сосудов сердца. Таковым является механизм действия ментолсодержащего лекарственного средства «валидол», которое применяется для снятия приступов стенокардии. Валидол применяется сублингвально (таблетка под язык) для достижения максимально быстрого терапевтического эффекта.

Рефлекторное действие оказывают **горечи**, которые входят в состав некоторых объектов растительного происхождения: травы полыни, корней одуванчика, травы золототысячника, корневищ аира и пр. Горечи, раздражая вкусовые рецепторы, рефлекторно увеличивают секрецию желудочного сока, таким образом, повышают аппетит и улучшают пищеварение.

Раздражающие средства **отвлекающего** действия не проявляют выраженного резорбтивного (общего) действия на весь организм. Данные средства применяются при лечении заболеваний суставов, воспалительных заболеваниях внутренних органов, простудных заболеваниях и пр. Сущность отвлекающего действия заключается в том, что раздражением нервных окончаний на определенных участках тела достигается благоприятное воздействие при лечении патологических процессов в органах, имеющих сопряженную иннервацию с участком, подвергшимся раздражающему воздействию. Так, наложение горчичников в области грудной клетки благоприятно влияет на лечение заболеваний легких и дыхательных путей. Раздражающими свойствами отвлекающего характера обладают препараты, содержащие пчелиный и змеиный яд, скипидарная мазь и пр. Раздражающие средства отвлекающего действия, как правило, оказывают также и местное действие в месте их применения.

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Масло терпентинное – масло для наружного применения - жидкость с характерным запахом и жгучим вкусом (действующее вещество - скипидар живичный) - средство природного происхождения, оказывает местное раздражающее, «отвлекающее» (анальгезирующее) и антисептическое действие. Главное действующее вещество терпентинного масла терпен α -пинен липофильно проникает через эпидермис и вызывает рефлекторные изменения в результате раздражения рецепторов кожи; способствует высвобождению из кожи биологически активных веществ (в т.ч. гистамина). Применяют при невралгии, миозитах, люмбаишиалгии, ревматизме наружно, нанося на пораженные участки и втирая легкими круговыми движениями в течение нескольких минут.

Форма выпуска: Флаконы по 25 мл.

Випросал - болеутоляющее и противовоспалительное средство. Применяется при ревматических болях, невралгии (боль, распространяющаяся по ходу нерва), ишиасе (радикулит пояснично-крестцовый), люмбаго (приступообразная интенсивная боль в

поясничной области). Наносят тонким слоем на кожу, предварительно протертую теплой водой. Втирают 2-3 мин 1-2 раза в день. После втирания руки следует тщательно вымыть. Форма выпуска: Мазь в тубах по 50 г. Состав: яда гюрзы сухого - 16 МЕ, 0,9% изотонического раствора натрия хлорида - 8 г, эмульгатора №.1 - 8 г, парафина твердого - 3 г, вазелина - 7 г, камфоры - 3 г, масла пихтового - 3 г, глицерина - 2 г, кислоты салициловой - 1 г, воды дистиллированной - 65 г.

Ментол - при втирании в кожу и нанесении на слизистые оболочки ментол вызывает раздражение нервных окончаний, сопровождающееся ощущением холода, легкого жжения и покалывания, оказывает легкое местное обезболивающее действие; обладает также слабыми антисептическими свойствами. Наружно назначают как болеутоляющее (отвлекающее) средство. Внутрь ментол назначают в качестве успокаивающего средства, часто в сочетании с настойкой валерианы, красавки и др. Иногда применяют ментол при легких формах стенокардии, так как он может рефлекторно (в результате раздражения рецепторов слизистой оболочки полости рта) вызывать расширение коронарных сосудов. Применяют при воспалительных заболеваниях верхних дыхательных путей (насморк, фарингит, ларингит, трахеит и др.) назначают ментол для смазываний и ингаляций, а также в виде капель в нос. При невралгии (боли, распространяющейся по ходу нерва), артралгии (суставной боли) рекомендуется втирание 2% спиртового раствора или 10% масляной взвеси; при зудящих дерматозах (кожных болезнях) применяют 0,5% спиртовой раствор или 1% ланолиново-вазелиновую мазь. При мигрени применяют также в виде карандаша ментолового, содержащего 1 г ментола, 3,5 г парафина и 0,5 г церезина; карандашом натирают кожу в области висков.

Форма выпуска: Порошок; масло ментоловое 1% и 2%; раствор ментола спиртовой 1% и 2%; карандаш ментоловый (в пластмассовом пенале).

Раствор аммиака - при вдыхании рефлекторно оказывает возбуждающее влияние на дыхательный центр. При приеме внутрь оказывает рвотное действие. В больших дозах может вызвать рефлекторную остановку дыхания.

Форма выпуска: 10% раствор во флаконах по 10; 40 и 100 мл и в ампулах по 1 мл в упаковке по 10 штук.

Горчичники - местнораздражающее средство, действие которого обусловлено рефлекторными реакциями, возникающими в связи с раздражением нервных окончаний кожи. При смачивании теплой водой под воздействием фермента мирозина в присутствии тепла и влаги, содержащийся в горчичнике, гликозид синигрин гидролизуется с образованием аллилового масла (аллилизотиоцианата), обладающего местнораздражающим действием. Применяют наружно. Горчичник требуемого размера опускают в воду, нагретую до температуры 37°C на 15-20 сек, затем накладывают на кожу. Для усиления эффекта горчичник закрывают полиэтиленовой пленкой и плотно прижимают к телу эластичным бинтом или другой повязкой. Время процедуры - 5-20 минут (до появления стойкой красноты), у детей - 2, 3, 5 или 10 мин, в зависимости от возраста ребенка, раздражающего действия и индивидуальной чувствительности больного. При ощущении сильного жжения необходимо ослабить на некоторое время прижим горчичника к телу или снять его. Горчичники применяют при: ОРВИ, бронхите,

пневмонии, миалгии, невралгии, люмбоишиалгии, артралгии, растяжении связок, остеохондрозе, кардиалгии, ушибах мягких тканей.

ЭФФЕРЕНТНАЯ НЕРВНАЯ СИСТЕМА

Эфферентные нервы передают информацию от ЦНС к органу, вызывая изменения в его работе.

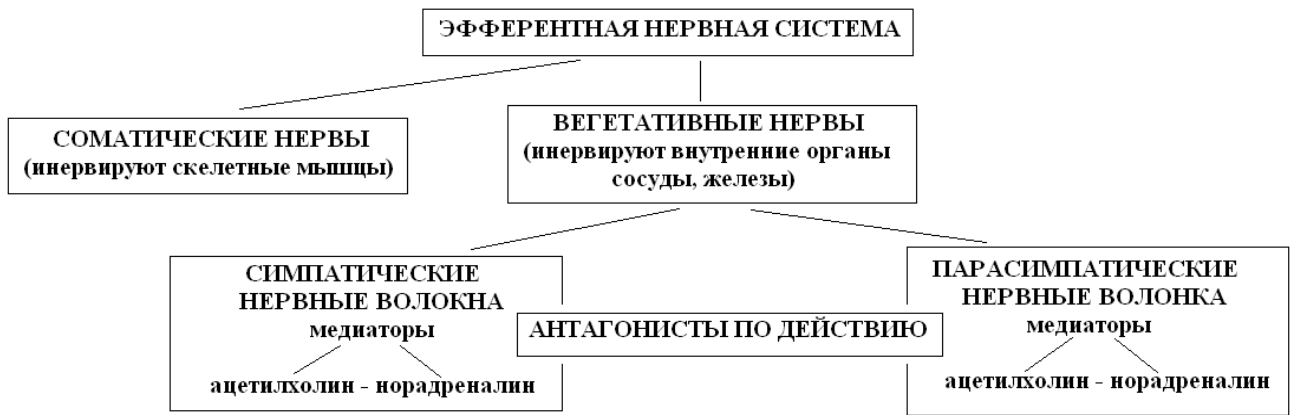


Эфферентные нервы – делятся на **соматические** (иннервирующие скелетные мышцы) и **вегетативные** (иннервирующие внутренние органы, кровеностные сосуды, железы).

Соматические нервы – подчиняются произвольному управлению (человек по своему желанию может встать, сесть, поднять руку и т.д.), вегетативные – не подчиняются произвольному управлению (человек не может произвольно управлять работой желудка, желез внутренней секреции и т.д.). Кроме того, соматические нервы – **непрерывные**, вегетативные прерываются в **ганглиях**, что является анатомической особенностью их строения, связанной с их функциональной деятельностью.

Вегетативные нервные волокна – составляют два отдела **симпатический и парасимпатический**.

Структура строения эфферентной нервной системы



Парасимпатические нервы – берут начало от специальных клеток среднего мозга, продолговатого мозга и сакрального отдела спинного мозга. Парасимпатические **ганглии** расположены **в ткани иннервируемых органов** или в непосредственной близости от них, постганглионарные волокна – непосредственно иннервируют клетки органа (являются очень короткими).

Симпатические – берут начало от специальных клеток грудного и поясничного отделов спинного мозга и заканчиваются в ганглиях – **вне иннервируемого органа**, постганглионарные симпатические волокна оканчиваются в исполнительных органах.

Функциональное различие симпатической и парасимпатической системы заключается в том, что они являются **антагонистами по действию**.

Физиологические эффекты возбуждения симпатической и парасимпатической иннервации

| Основные показатели | Возбуждение симпатической иннервации | Возбуждение парасимпатической иннервации |
|---|--------------------------------------|--|
| Частота сердечных сокращений | Учащение | Урежение |
| Сила сердечных сокращений | Увеличение | Уменьшение |
| Артериальное давление | Повышение | Снижение |
| Тонус кровеносных сосудов | Повышение (в большинстве случаев) | Снижение (в большинстве случаев) |
| Тонус мышц бронхов | Снижение | Повышение |
| Величина зрачков глаз | Расширение зрачков | Сужение зрачков |
| Перистальтика желудка и кишечника | Ослабление | Усиление |
| Тонус сфинктеров желудочно-кишечного тракта | Снижение | Повышение |
| Секреция желез бронхов, желудка, кишечника, слюнных желез | Незначительное усиление | Значительное усиление |

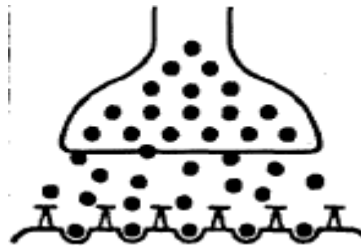
Места соединений нервных волокон - в ганглиях, нервных окончаниях и тканях органов называют **синапсами**.

Синапс состоит из пресинаптического нервного окончания, синаптической щели и постсинаптической мембраны. В пресинаптическом нервном окончании (в везикулах) вырабатывается медиатор, который частично кумулируется в находящемся здесь депо.

Синапсы не являются понятиями тождественными ганглиям, синапсы это функциональные единицы ганглий. Синапсы существуют и вне ганглий (например, на участках передачи импульса с соматических нервных окончаний на скелетные мышцы).



Схематическое строение синапса в невозбужденном состоянии



Ответная реакция синапса на действие нервного импульса

Под влиянием нервного импульса – высвобождается медиатор (из везикул), который поступает в синаптическую щель и воздействует на чувствительные участки постсинаптической мембраны – обеспечивая передачу нервного импульса.

Медиатор достаточно быстро разрушается под действием ферментов или подвергается обратному захвату пресинаптической мембраной. Кроме того, депо медиатора (в везикулах) достаточно быстро **истощается**, в результате чего передача нервного импульса **прерывается**.

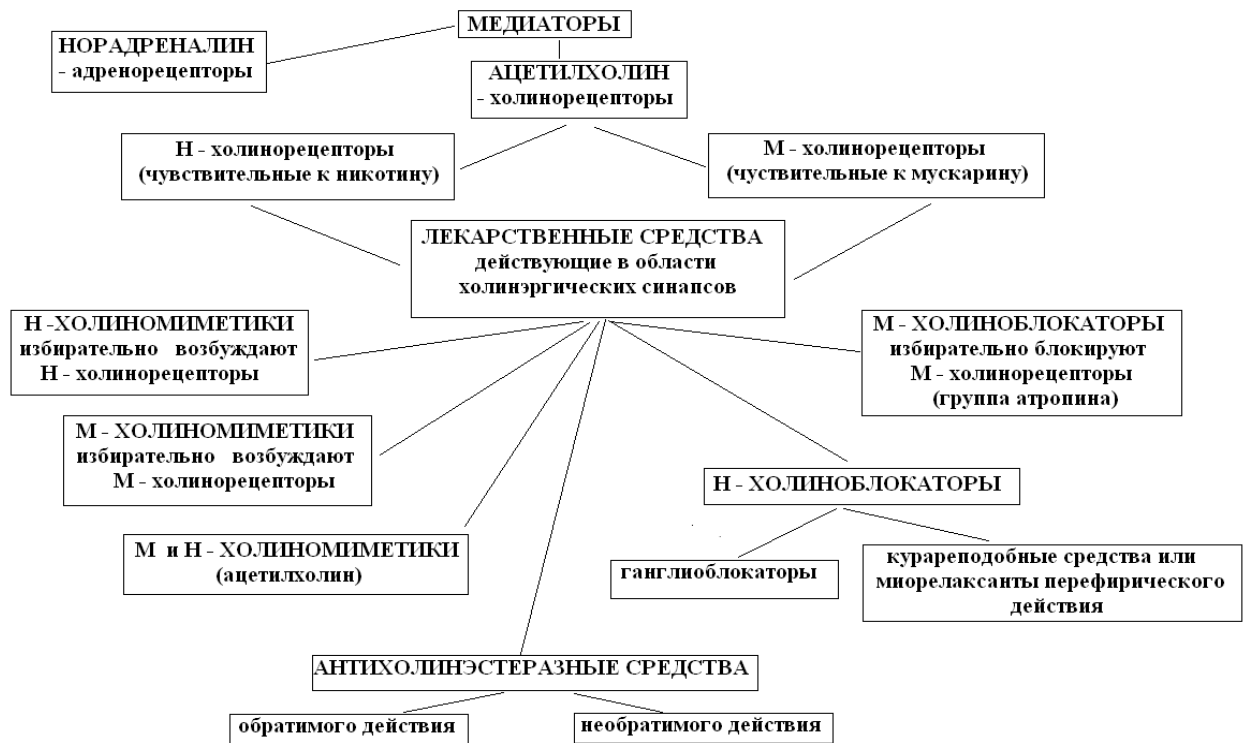
В качестве **медиаторов** при проведении нервного возбуждения в синапсах вырабатываются два основных вещества **НОРАДРЕНАЛИН** и **АЦЕТИЛХОЛИН**.

Соответственно синапсы, в которых в качестве медиатора вырабатывается ацетилхолин, а также соответствующие им рецепторы, называются **холинорецепторы**. Лекарственные средства, действующие на эти синапсы, именуется лекарственными средствами, действующими в области **холинэргических синапсов**.

Синапсы, в которых в качестве медиатора вырабатывается норадреналин и имеются соответствующие им рецепторы, именуется – **адренорецепторами**, а лекарственные средства, действующие на данные синапсы, именуется лекарственными средствами, действующими в области адренергических синапсов.

Лекарственные средства, действующие в области холинэргических синапсов

Структура лекарственных средств действующих в области холинэргических синапсов



Холинорецепторы – делят на два типа:

1. Чувствительные к никотину, Н-холинорецепторы или никотиночувствительные.
2. Чувствительные к мускарину (яд мухомора), М-холинорецепторы или мускариночувствительные.

Лекарственные средства, действующие в области холинэргических синапсов, в свою очередь, делятся на следующие группы:

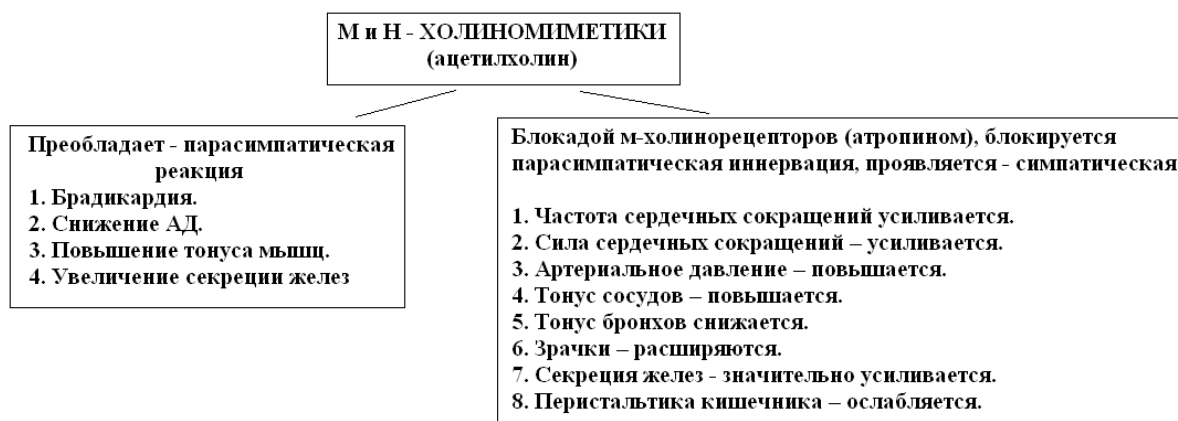
1. М-холиномиметики (избирательно возбуждают М-холинорецепторы).
2. Н – холиномиметики (избирательно возбуждают Н-холинорецепторы).
3. М и Н – холиномиметики (возбуждающе действуют как на М так и Н холинорецепторы).
4. М-холиноблокаторы.
5. Н-холиноблокаторы (к этой группе относятся ЛС из группы ганглиоблокаторов и курареподобные средства).
6. Промежуточное положение занимают антихолинэстеразные средства, которые в свою очередь делятся на средства обратимого и необратимого действия.

М и Н – холиномиметики (избирательно возбуждающие М и Н холинорецепторы).

Физиологическим возбудителем как М так и Н холинорецепторов – является сам медиатор ацетилхолин, который действует в области ганглиев как парасимпатических так и симпатических нервных волокон.

При его введении **преобладает парасимпатическая реакция**, при которой характерна: **брадикардия, снижение АД, повышение тонуса гладких мышц, увеличение секреции желез.**

Структура и особенности действия М, Н холиномиметиков



Но в случае блокады м-холинорецепторов (м-холиноблокаторами, например атропином), парасимпатическая иннервация блокируется, при этом резко проявляется реакция симпатической системы. В этом случае, физиологическое действие вещества становится прямо противоположным: **частота сердечных сокращений усиливается, сила сердечных сокращений – усиливается, АД – повышается, тонус сосудов – повышается, тонус бронхов снижается, зрачки – расширяются, перистальтика кишечника – ослабевает, секреция желез – незначительное усиливается.**

Ацетилхолин достаточно быстро **разрушается** ферментом **ацетилхолинэстеразой**, поэтому в медицине чаще находит применение другой препарат этой группы – **карбахолин**, который применяется в офтальмологической практике.

Быстрое разрушение ацетилхолина можно предупредить применением – **антихолинэстеразных средств**, которые блокируют ацетилхолинэстеразу.

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Ацетилхолин-хлорид, Ацетилхолин - М- и н-холиномиметик - порошок для приготовления раствора для внутримышечного и подкожного введения. Является медиатором нервного возбуждения в м- и н-холинергических синапсах, в больших концентрациях вызывает стойкую деполяризацию в области синапсов и блокирует передачу возбуждения. В организме под воздействием ацетилхолинэстеразы и сывороточной холинэстеразы легко разрушается. Применяют при операциях на передней камере глаза (удаление катаракты, кератопластика) - для обеспечения миоза в течение нескольких секунд после высвобождения хрусталика, эндартериит, "перемежающаяся" хромота, атония кишечника, атония мочевого пузыря. Вводят п/к или в/м 50-100 мг. Местно - равномерно наносят на поверхность радужной оболочки и в направлении к углу зрачка 0,5-2 мл.

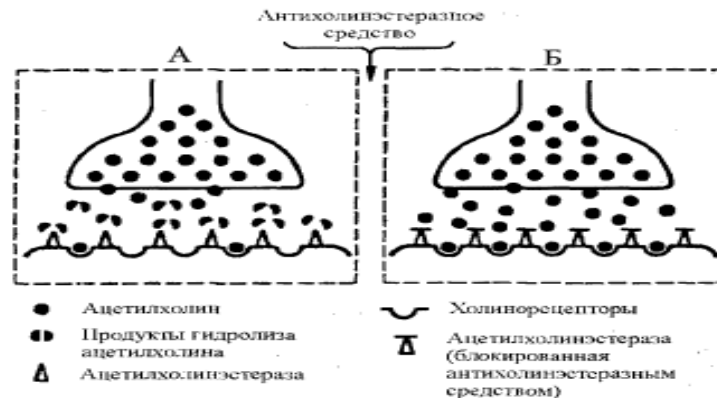
Форма выпуска: По 0,2 г в ампулах емкостью 5 мл.

Карбахолин, Карбахол - М- и н-холиномиметик - синтетическое производное холина. Связывается с м- и н-холинорецепторами постсинаптической мембраны холинергических синапсов и возбуждает их, имитируя эффект ацетилхолина. Действие в 100 раз сильнее, чем у ацетилхолина, и более продолжительное. Сужая зрачок (начинается через 15-20 мин и продолжается 4-8 ч), снижает внутриглазное давление (этот эффект начинается через 20-30 мин и достигает максимума через 2 ч). Входящая в состав капель гидроксиэтилцеллюлоза способствует проникновению через роговицу, благодаря чему еще больше увеличивается продолжительность действия. Применяют при глаукоме, закапывая в конъюнктивальный мешок 1-2 кап 3-4 раза в сутки.

Форма выпуска: Порошок.

Антихолинэстеразные средства и реaktivаторы холинэстеразы

Антихолинэстераза - фермент, который локализуется в месте выделения медиатора ацетилхолина, в постсинаптической мембране синапсов, и достаточно быстро его разрушает, гидролизуя с превращением в холин и уксусную кислоту. **Антихолинэстеразные средства блокируют ацетилхолинэстеразу** и таким образом предохраняют ацетилхолин от разрушения, усиливая и удлиняя его действие.



При применении антихолинэстеразных средств отмечается: **брадикардия, снижение АД, повышение тонуса гладких мышц ЖКТ, мочевого пузыря, бронхов, усиление действия желез, сужение зрачков и снижение внутриглазного давления**, кроме того улучшается проводимость в нервно-мышечных синапсах, повышается тонус скелетных мышц.



Представитель средств этой группы – **физостигмин** (синтетический заменитель из-за токсичности последнего – **прозерин**). Применяется при атонии кишечника, мочевого пузыря, миастении (вялости скелетных мышц), при глаукоме и пр.

Аналогичное действие у алкалоида **галантамина** (который также действует на ЦНС и применяется для лечения параличей).

Средства этой группы применяются также в качестве антагонистов миорелаксантов курареподобного действия (пиридостигмина бромид).

Антихолинэстеразные средства – делятся на 2 подгруппы:

• **Обратимого действия** - действие ацетилхолинэстеразы через несколько часов полностью восстанавливаются.

• **Необратимого действия** - восстановления не происходит. К этой группе веществ относятся некоторые яды, например, фосфорорганические соединения (ФОС), обладающие высокой биологической активностью, чрезвычайно высокой токсичностью (часть из них является боевыми отравляющими веществами, некоторые - хлорофос, дихлофос – инсектицидами).

Из антихолинэстеразных средств необратимого действия в медицине находят применение незначительное количество веществ, например, **армин** – для лечения глаукомы.

При отравлении этими веществами наблюдаются следующие симптомы: **затруднение дыхания (спазм бронхов и скопление слизи в дыхательных путях), замедление сердечной деятельности, усиленное слюноотечение, потливость, рвота, понос, судороги, сужение зрачков и нарушение аккомодации.**

Первая помощь – введение м-холиноблокаторов (атропина), искусственное дыхание, промывание желудка и симптоматическая терапия (сердечнососудистые, противосудорожные средства). При лечении острых отравлений ФОС применяют также реактиваторы ацетилхолинэстеразы.

Реактиваторы ацетилхолинэстеразы составляют особую группу веществ, которые являются антагонистами действию антихолинэстеразных средств. Реактиваторы холинэстеразы возобновляют действие фермента при ее блокаде, например, фосфорорганическими соединениями. Назначаются при отравлении фосфорорганическими соединениями. К этой группе относятся такие препараты, как дипироксим и изонитрозин, которые восстанавливают активность ацетилхолинэстеразы.

Механизм реактивации холинэстеразы веществами, содержащими оксильную группу СН-N-OH состоит в образовании более прочной связи веществ этой группы с атомом фосфора, чем образуют фосфорорганические соединения с ацетилхолинэстеразой. В результате способность ацетилхолинэстеразы гидролизовать ацетилхолин восстанавливается. Однако реактиваторы ацетилхолинэстеразы эффективны лишь в первые часы после отравления ФОВ и их действие развивается недостаточно быстро. Поэтому, в случае отравления, их, как правило, комбинируют с веществами из группы М-холиноблокаторов (атропином и пр.).

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Прозерин (Неостигмина метилсульфат) - синтетическое антихолинэстеразное средство - обратимо блокируя холинэстеразу, приводит к накоплению и усилению действия ацетилхолина на органы и ткани и восстановлению нервно-мышечной проводимости. Вызывает урежение ЧСС, повышает секрецию желез (слюнных, бронхиальных, потовых и ЖКТ) и способствует развитию гиперсаливации, бронхореи, повышению кислотности желудочного сока, суживает зрачок, вызывает спазм аккомодации, снижает внутриглазное давление, усиливает тонус гладкой мускулатуры кишечника (усиливает перистальтику и расслабляет сфинктеры) и мочевого пузыря, вызывает спазм бронхов, тонизирует скелетную мускулатуру. Применяют при миастении, двигательных нарушениях после травмы мозга, параличах, восстановительном периоде после перенесенного менингита, полиомиелите, энцефалите, слабости родовой деятельности, открытоугольной глаукоме,

атрофии зрительного нерва, неврите; атонии ЖКТ, атонии мочевого пузыря, для устранения остаточных нарушений нервно-мышечной передачи недеполяризующими миорелаксантами внутрь, за 30 мин до еды, взрослым - 10-15 мг 2-3 раза в день.

Форма выпуска: Порошок; таблетки по 0,015 г; ампулы по 1 мл 0,05% раствора.

Галантамина гидробромид (Галантамин) - антихолинэстеразное средство обратимого действия. Облегчает проведение нервных импульсов в области нервно-мышечных синапсов; усиливает процессы возбуждения в рефлекторных зонах спинного и головного мозга, хорошо проникает через ГЭБ. Повышает тонус и стимулирует сокращение гладкой и скелетной мускулатуры, секрецию пищеварительных и потовых желез, восстанавливает нервно-мышечную проводимость, блокированную курареподобными ЛС недеполяризующего типа. Применяют при полиомиелите, неврите, радикулоневрите, полиневрите, детском церебральном параличе, остаточных явлениях перенесенного инсульта и поражениях тканей мозга инфекционно-воспалительного, токсического и травматического генеза (менингит, менингоэнцефалит, миелит), миастении, прогрессивной мышечной дистрофии внутрь, после еды, в суточной дозе 5-10 мг, кратность приема - 3-4 раза в сутки, при необходимости доза может быть увеличена.

Форма выпуска: Ампулы по 1 мл 0,25%; 0,5% и 1% раствора.

Физостигмин - антихолинэстеразное средство обратимого действия. Будучи производным четвертичного аммония, обладает липофильными свойствами и хорошо проникает через ГЭБ. Поэтому воспроизводит как центральные, так и периферические эффекты ацетилхолина, связанные со стимуляцией м- и н-холинорецепторов. Вызывает урежение ЧСС, повышение тонуса гладкой мускулатуры бронхов, ЖКТ, желчевыводящих и мочевыводящих путей, матки; вызывает сокращение круговой мышцы радужки, миоз. Применяют при закрытоугольной глаукоме (остром приступе); диагностике в офтальмологии; атонии кишечника и мочевого пузыря, нервно-мышечных заболеваниях. Вводят в конъюнктивальный мешок по 1-2 кап 0,25% раствора 1-6 раз в день. При нервно-мышечных заболеваниях и при парезе кишечника - п/к, по 0,5-1 мл 0,1% раствора.

Форма выпуска: 0,25-1% растворы в склянках оранжевого стекла

Армин (этилнитрофенилэтилфосфонат) - антихолинэстеразное средство необратимого действия. Оказывает сильный миотический эффект. Активирует процесс синаптической передачи в холинергических нервных окончаниях. Образует с холинэстеразой прочный комплекс, и если не принимаются специальные реактиваторы, то активность фермента не восстанавливается, нормальный процесс гидролиза ацетилхолина начинается после синтеза молекул холинэстеразы. Вызывает сужение зрачка, снижает внутриглазное давление. Применяют при закрытоугольной глаукоме по 1-2 кап 2-3 раза в день. После каждого закапывания прижимать пальцем область слезного мешка в течение 2-3 мин, чтобы предотвратить попадание раствора в слезный канал.

Форма выпуска: Во флаконах по 10 мл 0,01% раствора.

Пиридостигмина бромид - антихолинэстеразное средство - улучшает нервно-мышечную передачу, усиливает моторику пищеварительного тракта, повышает тонус мочевого пузыря, бронхов, секрецию экзокринных желез; вызывает брадикардию. Пиридостигмин лишь частично всасывается в кишечнике. Биодоступность после приема внутрь составляет 3-8%, по этой причине при пероральном применении требуются значительно более

высокие дозы, чем при парентеральном введении. Применяют при миастении, атонии кишечника, атоническом запоре, атонии мочевого пузыря. Назначают в дозе 30–60 мг/сут в 3–6 приемов. При прогрессировании заболевания – 60–180 мг 2–4 раза в сутки.

Формы выпуска: таблетки или драже по 0,06 г; 0,5 % раствор в ампулах по 1 мл.

Аллоксим - реактиватор холинэстеразы - при отравлениях фосфорорганическими соединениями оказывает центральное действие, характеризующееся быстрым восстановлением сознания и улучшением биоэлектрической активности мозга, а также периферическое действие, проявляющееся восстановлением нервно-мышечной проводимости. Применяют при отравлении фосфорорганическими соединениями (в комбинации с холиноблокирующими ЛС) в/м, однократно или повторно в зависимости от тяжести отравления. Перед применением содержимое ампулы (75 мг) растворяют в 1 мл воды для инъекций.

Форма выпуска: Лиофилизированная пористая масса или порошок в ампулах по 0,075 г с приложением 1 мл стерильной воды для инъекций.

Изонитрозин - реактиватор холинэстеразы, специфический антидот при отравлениях фосфорорганическими соединениями. Применяют при отравлении фосфорорганическими соединениями в/м, в/в по 3 мл. При тяжелых отравлениях, сопровождающихся коматозным состоянием, введение повторяют через каждые 30–40 мин до прекращения мышечных фибрилляций и прояснения сознания. Общая доза - 8–10 мл.

Форма выпуска: 40% раствор в ампулах по 3 мл.

Дипироксим (тримедоксима бромид) - реактиватор холинэстеразы, снижает секрецию желудочного сока и НСІ. Используют при отравлении ФОС, в комбинации с холиноблокирующими ЛС (атропин, апрофен); профилактически, в сочетании с атропином, при отсутствии явных признаков отравления (после воздействия яда на организм); язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки; пароксизмальные нарушения ритма. Применяют в зависимости от тяжести отравления, однократно или за несколько приемов. При начальных признаках отравления (возбуждение, миоз, повышенное потоотделение, слюноотделение, начальные явления бронхореи) - п/к, 2–3 мл 0,1% раствора атропина сульфата и 1 мл 15% раствора триметоксима бромида. Если симптомы отравления не исчезают, вводят вторично атропин и триметоксима бромид в той же дозе.

Форма выпуска: Ампулы по 1 мл 15% раствора.

М-холиномиметики

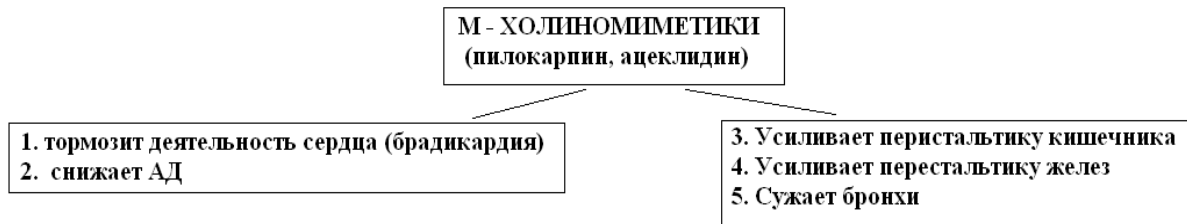
М-холиномиметики оказывают стимулирующее (возбуждающее) действие на М-холинорецепторы (мускариночувствительные), получившие свое название из-за их чувствительности к алкалоиду мухоморов – мускарину.

М-холиномиметики оказывают действие, аналогичное возбуждению парасимпатической системы, при этом наблюдается: **торможение сердечной деятельности, снижение АД, но усиление перистальтики кишечника, секреции желез и сужение просвета бронхов, а также сужение зрачка при закапывании в глаза.**

Представителями веществ, группы М-холиномиметиков являются такие вещества, как пилокарпин и ацеклидин. Пилокарпин – токсичен и, как правило, используется местно - в офтальмологии. Характерной особенностью действия пилокарпина является - сужение

зрачка, поскольку в мышцах зрачка имеются М - холинорецепторы, возбуждение которых приводит к их сокращению. Пилокарпин применяется в качестве средства для снижения внутриглазного давления при глаукоме.

Структура и особенности действия М-холиномиметиков



Ацеклидин действует также как пилокарпин, но менее токсичен, применяется для повышения тонуса гладких мышц кишечника и мочевого пузыря.

При отравлении м-холиномиметиками симптомы их действия не изменяются, но многократно усиливаются, при этом наблюдается **урежение пульса (брадикардия), падение АД, резкое сужение зрачков, обильное выделение пота, слюнотечение, рвота, понос (диарея), смерть - от паралича дыхания.**

В качестве антидота применяют вещество противоположного действия – **м-холинблокаторы (атропин).**

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Пилокарпина гидрохлорид - противоглаукомное средство - м-холиномиметик - солянокислая соль алкалоида пилокарпина, получаемого из тропического растения пилокарпус перистолистный, произрастающего в Южной Америке; М-холиностимулирующее средство, оказывает миотическое и противоглаукомное действие. Повышает секрецию пищеварительных, бронхиальных и потовых желез, тонус гладких мышц бронхов, кишечника, желчного и мочевого пузыря, матки. Вызывает сокращение циркулярной (миоз) и цилиарной мышц (спазм аккомодации).

Начало эффекта - через 30-40 мин, достигает максимума через 1,5-2 ч и продолжается в течение 4-14 ч. Системы с длительным высвобождением пилокарпина обеспечивают контроль внутриглазного давления в течение 1 сут. Применяется в офтальмологии для снижения внутриглазного давления при глаукоме, остром приступе закрытоугольной глаукомы, вторичной глаукоме (тромбоз центральной вены сетчатки). При глаукоме пилокарпин применяется в виде глазных капель - 0,5-1,0-2,0% растворы, по 1-2 капли в каждый глаз 2-3 раза в сутки и 1-5% пилокарпиновой мази (для закладывания на ночь за края век).

Форма выпуска: 1% раствор пилокарпина гидрохлорида в ампулах по 1 мл, флаконах по 10 мл; 1% раствор с метилцеллюлозой во флаконах по 5 мл и 10 мл; 2% раствор с натрий-карбоксиметилцеллюлозой в флаконах по 10 мл; 2% раствор пилокарпина гидрохлорида в поливиниловом спирте во флаконах по 10 мл; тубик-капельницы по 1,5 мл, в упаковке по 2 тубика; 1% пилокарпиновая глазная мазь в тубиках по 10 г.

Ацеклидин - М-холиномиметик - стимулирует м-холинорецепторы, повышает тонус и усиливает сокращение кишечника, мочевого пузыря, матки; вызывает миоз, снижает внутриглазное давление (после однократной инстилляцией действие продолжается до 6 ч), вызывает спазм аккомодации. В высоких дозах вызывает брадикардию, снижение АД, усиление активности желез внешней секреции, бронхоспазм. Применяют при атонии

мочевого пузыря и ЖКТ; для остановки кровотечения в послеродовом периоде; при глаукоме. При атонии желудка, кишечника, мочевого пузыря и гипотонии матки применяют п/к 1-2 мл 0.2% раствора; при необходимости инъекции повторяют 2-3 раза с промежутками 20-30 мин.

Форма выпуска: Ампулы по 1 мл 0,2% раствора; мазь 3% и 5% по 20 г.

Н-холиномиметики

Н – холиномиметики оказывают стимулирующее (возбуждающее) действие на М-холинорецепторы, получивших свое название из за их чувствительности к никотину (алкалоиду листьев табака - *Nicotiana tabacum*), именуемых также никотиночувствительными. Сам никотин не имеет какой-либо лекарственной ценности и используется исключительно в качестве средства для лабораторных экспериментов. Кроме того, никотин оказывает стимулирующее действие на М-холинорецепторы только в небольших дозах; при их увеличении, действие никотина меняется на противоположное вследствие конкурентного антагонизма с ацетилхолином.

Так, для первоначального действия никотина наиболее характерно рефлекторное возбуждение дыхательного и сосудодвигательного центра, но при накоплении в крови достаточной концентрации никотина наступает вторая стадия – угнетение этих центров. Примерно также действует никотин на ЦНС, оказывая в небольших дозах возбуждающее действие, но при увеличении дозы – проявляется его угнетающее действие на ЦНС.

Никотин крайне токсичен. Отравление никотином достаточно часто встречается в токсикологической практике, при этом характерны следующие симптомы: слюнотечение, тошнота, рвота, диарея, брадикардия меняется на тахикардию, артериальное давление повышается, наблюдается отдышка, переходящая в угнетение дыхания, зрачки первоначально суживаются, затем расширяются. Возможны расстройства слуха, зрения, мышечные судороги. Смерть может наступить от паралича дыхательного центра. Медицинская помощь при отравлении никотином заключается в обеспечении искусственной вентиляции легких и поддержании дыхания.

Наиболее характерной реакцией при возбуждении Н-холинорецепторов является рефлекторное возбуждение **сосудодвигательного и дыхательного центров продолговатого мозга** (действие распространяется как на вегетативную нервную систему так и на ЦНС).

Структура и особенности действия Н - холиномиметиков

**Н - ХОЛИНОМИМЕТИКИ
(никотин, лобелин, цитизин)**

ДЕЙСТВИЕ:

- 1. Рефлекторно возбуждают сосудодвигательный и дыхательный центры.**
- 2. Возбуждают кору надпочечников, вследствие чего продуцируется адреналин и повышается артериальное давление**
- 3. Вследствие повышенного продуцирования адреналина усиливается сердечная деятельность**

Характерными представителями лекарственных препаратов группы Н-холиномиметиков являются - лобелин (алкалоид растения *Lobelia inflata*) и цитизин (алкалоид растений - ракитник *Cytisus laburnum* и термопсис *Thermopsis lanceolata*). Лобелин, цитизин - значительно менее токсичны, чем никотин, и **используются в качестве стимуляторов дыхания (центрального действия), одновременно – возбуждается сосудодвигательный центр, и клетки мозгового слоя надпочечников, продуцирующие адреналин, что приводит к значительному повышению АД и усилению сердечной деятельности** (применяются также в качестве средств для отвыкания от курения).

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Лобелин - Н-холиномиметик - стимулятор дыхания рефлекторного действия. Возбуждает хеморецепторы синокаротидной зоны, н-холинорецепторы вегетативных ганглиев и надпочечников. Применяют при ослаблении или рефлекторной остановке дыхания, асфиксии новорожденных, никотиновой зависимости, абстинентном синдроме курильщиков в/в и в/м, взрослым - по 3-5 мг (0,3-0,5 мл 1% раствора), детям, в зависимости от возраста - по 1-3 мг (0,1-0,3 мл 1% раствора).

Цитизин - Н-холиномиметик - стимулятор н-холинорецепторов; возбуждает ганглии вегетативной нервной системы. Снижает никотиновую зависимость (конкурентное взаимоотношение в области тех-же рецепторов и биохимических субстратов, с которыми в организме взаимодействует никотин, являющийся "ганглионарным" веществом). Вызывает изменение "вкуса" курения на неприятный, уменьшает стремление к курению и облегчает проявления абстинентного синдрома, связанного с прекращением курения. Применяют при никотиновой зависимости местно (жевательная резинка).

Цититон - препарат растительного происхождения, раствор алкалоида цитизина, получаемого из ракитника (*Cytisus laburnum*) и термопсиса (*Thermopsis lanceolata*), обладает Н-холиномиметическим действием. При введении в организм тонизирует и возбуждает дыхательный центр (главным образом – рефлекторно), стимулирует сосудодвигательный центр, симпатические ганглии и надпочечники, что приводит к повышению артериального давления. Применяют при асфиксии (в том числе у новорожденных), ослаблении дыхательной и сердечно-сосудистой деятельности при различных интоксикациях - отравлениях окисью углерода, синильной кислотой, препаратами опиоя, наркотиками и др. (в связи с кратковременностью действия и появлением специфических антагонистов опиатов и барбитуратов, в настоящее время цититон имеет ограниченное применение при отравлениях), при шоковых и коллаптоидных состояниях, явлениях угнетения дыхания и рефлекторной остановке дыхания, угнетении кровообращения при операциях, травмах и в послеоперационном периоде; угнетении дыхания и кровообращения при инфекционных заболеваниях (тиф, пневмония) и др. Цититон вводят внутривенно или внутримышечно: взрослым - по 0,5-1,0 мл; детям до 12 месяцев - по 0,10-0,15 мл, 2–5 лет — 0,2–0,3 мл, 6–12 лет — 0,3–0,5 мл. При наличии показаний инъекция раствора цититона может быть повторена через 15–30 минут, но не больше 3–4 раз в сутки.

Форма выпуска: 0,15% раствор кристаллического алкалоида цитизина в ампулах по 1 мл.

Табекс - действующее вещество цитизин - препарат обладающий Н-холиномиметическим действием, возбуждает ганглии вегетативной нервной системы и дыхание рефлексорным путем, а также способствует выделению адреналина из надпочечников. Механизм действия близкий к никотину, что дает возможность отвыкнуть от курения. Препарат предупреждает появление абстинентных явлений. Применяют при хроническом курении (никотинизм) и для отвыкания от курения. Принимают внутрь по 1 таблетке каждые 2 часа (всего 6 таблеток в сутки) при одновременном уменьшении количества выкуренных сигарет. Если итог лечения окажется неудовлетворительным, то курс лечения можно повторить через 2-3 месяца. При положительном действии препарата принимают следующим образом:

с 4 по 12 день – по 1 таблетке через каждые 2,5 часа (всего 5 таблеток в сутки);

13 – 16 день – по 1 таблетке через каждые 3 часа (всего 4 таблетки);

17 – 20 день – по 1 таблетке через каждые 5 часов (всего 3 таблетки в сутки);

21 – 25 день – всего принимать 1-2 таблетки в сутки.

Окончательный отказ от курения должен быть на пятый день после начала лечения.

Форма выпуска: таблетки (1,5 мг цитизина), покрытые оболочкой.

Лобесил – препарат, обладающий Н-холиномиметическим действием. Применение таблеток лобесил уменьшает стремление к курению и облегчает тягостные для курильщиков явления, связанные с прекращением курения. Механизм действия этого средства связан, по-видимому, с конкурентными взаимоотношениями в области тех же рецепторов и биохимических субстратов, с которыми в организме взаимодействует никотин, который также является “ганглионарным” средством. После прекращения курения принимают по 1 таблетке 4-5 раз в день в течение 7-10 дней. В последующем можно при необходимости продолжить прием таблеток в течение 2-4 недель с постепенным уменьшением частоты приема. При рецидивах (возобновлении курения) курс лечения можно повторить. Отвыкание от курения требует не только применения препарата лобесил, но и одновременно твердого решения курильщика прекратить курение.

Форма выпуска: таблетки в упаковке по 50 штук.

М-холиноблокаторы

М-холиноблокаторы (вещества группы атропина) **избирательно блокируют м-холинорецепторы**, расположенные в области окончания **парасимпатических нервов**.

В результате действия М-холиноблокаторов **блокируется влияние парасимпатической нервной системы** на внутренние органы и железы. М-холиноблокаторы уменьшают или устраняют эффекты раздражения холинэргических нервов и веществ, обладающих м-холиномиметической активностью (ацетилхолина, антихолинэстеразных средств, мускариномиметических веществ). Действие веществ этой группы противоположно действию группы м-холиномиметиков.

Структура и особенности действия М холиноблокаторов

М - ХОЛИНОБЛОКАТОРЫ
(группа атропина)

ДЕЙСТВИЕ

1. Учащение сердцебиения (эффективен при брадикардии и для предупреждения рефлекторной остановки сердца).
2. Эффективный спазмолитик (снимает спазмы сосудов)
3. Значительно снижает секреторную активность желез

ПРИМЕНЕНИЕ:

1. Снятие спазма гладкой мускулатуры и желчных протоков, расширения зрачков, уменьшение секреции желез
Скополамин - действует на ЦНС при вестибулярных расстройствах, морской и воздушной болезни

ОТРАВЛЕНИЕ:

1. Психомоторное возбуждение, галлюцинация (вслед за возбуждением ЦНС - угнетение)
2. Расширение зрачков
3. Сухость во рту и кожи
4. Частое дыхание
5. Учащение пульса
6. Смерть – от паралича дыхательного центра

ЛЕЧЕНИЕ ОТРАВЛЕНИЯ:

Промывание желудка,
антидоты - антихолинэстеразные средства (прозерин),
успокаивающие.
Прямые антагонисты м-холинотики
(пилокарпин) не эффективны

Так как иннервация внутренних органов двойная (симпатическая и парасимпатическая), **блокируя парасимпатическую систему – усиливается действие симпатической системы.** В результате фармакологическое действие веществ группы атропина эквивалентно возбуждению симпатической системы (**частота сердечных сокращений учащается, сила сердечных сокращений увеличивается, повышается АД и тонус кровеносных сосудов, но при этом снижается тонус мышц бронхов, зрачки расширяются, ослабляется перистальтика ЖКТ, снижается тонус сфинктеров ЖКТ, наблюдается усиление секреции желез**).

Характерным представителем лекарственных препаратов этой группы является - **атропин** – алкалоид содержащийся в красавке, белене, дурмане. Его действие приводит к учащению сердцебиения (эффективен при брадикардии и для предупреждения рефлекторной остановки сердца).

Атропин широко применяют в качестве спазмолитика. перевозбуждение парасимпатической НС приводит к спазмам гладких мышц – ЖКТ и бронхов - что ведет к сильным болям (коликам) и удушью, **которые снимаются атропином.** Атропин значительно снижает секреторную активность желез.

В глазной практике атропин является антагонистом пилокарпина (расширяет зрачок, в то время как пилокарпин – сужает), но вызывает стойкий паралич аккомодации (невозможность сфокусировать зрение на определенном объекте).

При отравлении атропином, атропинсодержащими препаратами или растительными объектами проявляются следующие симптомы: **максимально расширенные зрачки, сухость во рту и кожи, частое дыхание, учащение пульса, психомоторное возбуждение, галлюцинации (вслед за возбуждением ЦНС – следует угнетение), смерть наступает от паралича дыхательного центра.**

Лечение отравления заключается в промывании желудка, в качестве антидотов применяют - антихолинэстеразные (прозерин) и успокаивающие средства.

Прямые антагонисты (м-холиномиметики - пилокарпин) **не эффективны**, поскольку в данном случае наблюдается такое явление, как «односторонний антагонизм» - атропин устраняет эффект пилокарпина, пилокарпин – **нет**, из-за образования более прочной фиксации атропина с холинорецепторами.

Скополамин – препарат этой группы (атропина), но действует на ЦНС (применяется, в том числе, при вестибулярных расстройствах, морской и воздушной болезнях, для расширения зрачков и уменьшения секреции желез).

Платифиллин – в отличие от прочих м-холиноблокаторов, блокирует преимущественно периферические рецепторы – расширяет сосуды и снижает давление (назначают при спазмах).

Гоматотропин – действие аналогично атропину, но менее продолжительно.

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Метацин - М-холиноблокатор - активное М-холинолитическое средство, избирательно действующий периферический холинолитик. Действие препарата сопровождается понижением тонуса гладкомышечных органов (bronхи, органы брюшной полости и др.), а также уменьшением секреции слюнных, желудочных, бронхиальных, потовых желез, поджелудочной железы, усилением сердечной деятельности. Применяется при заболеваниях, сопровождающихся спазмами гладкой мускулатуры (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки, хронический гастрит, почечная и печеночная колика и др.); в анестезиологии - для уменьшения секреции слюнных и бронхиальных желез и др. внутрь по 0,002-0,004 г 2-3 раза в день, парентерально - по 0,5-2 мл 0,1% раствора.

Форма выпуска: таблетки по 0,002 г; ампулы по 1 мл 0,1% раствора.

Атропина сульфат - М-холиноблокатор - действует (значительно слабее) на Н-холинорецепторы. Атропина сульфат относится к неизбирательным блокаторам М-холинорецепторов. Введение атропина в организм сопровождается уменьшением секреции слюнных, желудочных, бронхиальных, потовых желез, поджелудочной железы, учащением сердечных сокращений (вследствие уменьшения тормозящего действия на сердце блуждающим нервом), понижением тонуса гладкомышечных органов (bronхи, органы брюшной полости и др.). Под влиянием атропина происходит сильное расширение зрачков. Применяют при язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, пилороспазме, холецистите, желчнокаменной болезни, спазмах кишечника и мочевых путей; брадиаритмии, развившейся в результате повышения тонуса блуждающего нерва; перед наркозом и операциями (для профилактики бронхо- и ларингоспазма, уменьшения секреции слюнных и бронхиальных желез и вагусных кардиальных рефлексов); рентгенологическими исследованиями ЖКТ; при отравлении холиномиметическими (в т.ч. фосфорорганическими) средствами; при бронхиальной астме, бронхите с гиперпродукцией слизи. Применяют атропин внутрь (до еды), парентерально (минуя пищеварительный тракт) и местно (в виде глазных капель). В случае применения атропина для лечения язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки назначают препарат внутрь, подбирая дозу индивидуально (обычно до появления легкой сухости во рту).

Форма выпуска: порошок; ампулы по 1 мл 0,1% раствора; 1% раствор (глазные капли) во флаконах по 5 мл.

Платифилина гидротартрат - М-холинолитическое средство - оказывает преимущественно М-холинолитическое, а также сосудорасширяющее и успокаивающее действие. Применяют при спазмах гладкой мускулатуры органов брюшной полости, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, бронхиальной астме, гипертонической болезни, коликах (кишечных, почечных, печеночных); в офтальмологии для расширения зрачка внутрь по 0,0025-0,005 г 2-3 раза в день, подкожно - 1-2 мл 0,2% раствора. В глазной практике применяют 1% раствор для диагностики, 2% раствор для лечебных целей.

Форма выпуска: порошок; таблетки по 0,005 г; ампулы по 1 мл 0,2% раствора.

Ипратропий бромид - блокатор М-холинорецепторов - оказывает бронхолитическое действие, уменьшает секрецию желез, в том числе бронхиальных, пищеварительных. Блокирует ацетилхолиновые рецепторы в мускулатуре средних и крупных бронхов, практически не проявляя нежелательного антихолинэргического воздействия на гладкую мускулатуру ЖКТ, мочевых путей и т.д. Эффект бронходилатации начинает проявляться в среднем через 10 минут после ингаляции, длиться около 6 часов. Препарат предупреждает сужение бронхов, возникающее в результате вдыхания сигаретного дыма, холодного воздуха, действия различных вызывающих сужение просвета бронхов веществ. При ингаляционном применении практически не оказывает резорбтивного действия (действия вещества, проявляющегося после всасывания его в кровь). Применяется при бронхиальной астме, а также при хроническом и обструктивном бронхите. Дозированный аэрозоль взрослым и детям старше 3 лет для профилактики дыхательной недостаточности при хроническом обструктивном бронхите и бронхиальной астме назначают по 1-2 дозы в среднем 3 раза в сутки; в лечебных целях можно проводить дополнительные ингаляции по 2-3 дозы аэрозоля. Раствор для ингаляций взрослым и детям старше 6 лет назначают 3-5 раз в день. При использовании электрического распылителя или респираторов разовая доза составляет 4-8 капель в распыляющее устройство; при использовании ручного распылителя - 20-30 вдохов неразбавленного раствора. Порошок для ингаляций - взрослым и детям старше 6 лет ингаляция содержимого одной капсулы (0,2 мг) 3 раза в сутки (через спинхаллер или турбохаллер - специальные ингаляторы для приема препарата). Ипратропий бромид используют как для монотерапии, так и в комбинации со стимуляторами β -адренорецепторов и производными ксантина.

Форма выпуска: дозированный аэрозоль для ингаляций (1 доза - 0,02 мг); порошок для ингаляций по 0,2 мг в капсулах; раствор для ингаляций (1 мл - 0,25 мг).

Атровент - блокатор М-холинорецепторов (активный компонент препарата – ипратропия бромид). Атровент блокирует ацетилхолиновые рецепторы в мускулатуре средних и крупных бронхов, практически не проявляет нежелательного антихолинэргического воздействия на гладкую мускулатуру ЖКТ, мочевых путей и т.д. Эффект бронходилатации начинает проявляться через 10 минут после ингаляции и длится около 6 часов. Атровент применяют при лечении бронхиальной астмы и ХОЗЛ с эмфиземой с профилактической целью при ХОЗЛ, астматическом компоненте - назначают по 2-3 ингаляции (соответствующие 0,4-0,6 мг ипратропия бромида) 3 раза в сутки, с лечебной целью – до 5 раз в сутки. В комплексной терапии астмы в педиатрии до 12 лет – по 1-2 ингаляции каждые 6 часов (при необходимости применения). В небулайзер помещают

дозу препарата, предварительно разбавленную физиологическим раствором до объема 4 мл. Каждый раз готовят новый раствор непосредственно перед проведением ингаляции. Форма выпуска: атровент представлен на рынке раствором для ингаляций и аэрозольной формой выпуска. Раствор выпускается во флаконах по 20 мл. Аэрозольная форма выпуска фасуется в баллончики с дозирующим приспособлением и мундштуком. В баллончике находится 10 мл жидкости, достаточной для 200 доз препарата.

Пирензепин - представитель новой подгруппы антихолинергических веществ – специфических блокаторов М-холинорецепторов. В отличие от “типичных” блокаторов М-холинорецепторов (атропина и др.), пирензепин избирательно угнетает секрецию железами желудка соляной кислоты и пепсиногена (предшественника пепсина - фермента, расщепляющего белки), не оказывая существенного блокирующего влияния на М-холинорецепторы слюнных желез, сердца, гладких мышц глаза и других органов. Действие пирензепина на желудочную секрецию обусловлено блокадой М-холинорецепторов и выключением таким образом стимулирующего влияния блуждающего нерва на желудочную секрецию. Препарат подавляет секрецию соляной кислоты и пепсиногена, быстро уменьшает общую активность желудочного сока. Применяют для лечения острых и хронических язв желудка и двенадцатиперстной кишки, гастритов с повышенной кислотностью желудочного сока, язвенных поражений желудочно-кишечного тракта, связанных с применением нестероидных противовоспалительных средств (кислота ацетилсалициловая, натрия салицилат, метилсалицилат и т. д.). Внутрь по 0,05 г (50 мг) утром и вечером за 30 мин до приема пищи, запивая небольшим количеством воды. В начале лечения возможно сочетание перорального и парентерального введения: одну дозу вводят внутримышечно, одну принимают внутрь. Внутримышечно или внутривенно препарат применяют главным образом при тяжелых формах язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, для лечения и профилактики кровотечений, эрозий и изъязвлений. Вводят внутримышечно и внутривенно (медленно) по 10 мг (1 ампула) каждые 8-12 ч. Пирензепин растворяют непосредственно перед применением. Готовые растворы следует использовать в течение не более 12ч.

Форма выпуска: Таблетки по 25 и 50 мг; ампулы по 2 мл, содержащие по 10 мг сухого препарата с приложением растворителя.

Скополамина гидробромид - блокатор М-холинорецепторов - близок к атропину по влиянию на периферические холинореактивные системы. Подобно атропину вызывает расширение зрачков, паралич аккомодации (зрительного восприятия), учащение сердечных сокращений, расслабление гладких мышц, уменьшение секреции пищеварительных и потовых желез. Оказывает также центральное холинолитическое действие. Обычно вызывает седативный эффект: уменьшает двигательную активность, может оказать снотворное действие. Характерным свойством скополамина является вызываемая им амнезия (потеря памяти). Применяют препарат иногда в психиатрической практике в качестве успокаивающего средства, в неврологической - для лечения паркинсонизма, в хирургической практике вместе с анальгетиками (морфин, промедол) - для подготовки к наркозу, иногда как противорвотное и успокаивающее средство - при морской и воздушной болезни, а также при иритах (воспалении радужной оболочки глаза), иридоциклитах (сочетанном воспалении роговицы и радужной оболочки глаза) и с

диагностической целью для расширения зрачков вместо атропина. Назначают скополамин внутрь (обычно в растворах) и под кожу 0,5-1 мл 0,05% раствора. В глазной практике (для расширения зрачка и паралича аккомодации) применяют 0,25% водный раствор (по 1-2 капли в глаза 2 раза в день) или 0,25% мазь. В офтальмологической практике наряду с 0,25% водным раствором применяется пролонгированный (длительного действия) препарат - раствор скополамина гидробромида 0,25% с метилцеллюлозой.

Форма выпуска: порошок; 0,05% раствор в ампулах по 1 мл; 0,25% раствор с метилцеллюлозой во флаконах по 5 и 10 мл.

Экстракт красавки сухой - препарат обладает М-холиноблокирующими свойствами. В качестве основного действующего вещества содержит атропин, вследствие чего близок к атропину по фармакологическому действию. Применяют при заболеваниях желудочно-кишечного тракта, сопровождающихся болями. Входит в состав ряда комбинированных форм. В связи с меньшим содержанием алкалоидов при изготовлении лекарственных форм сухой экстракт применяют в двойном количестве по отношению к густому экстракту.

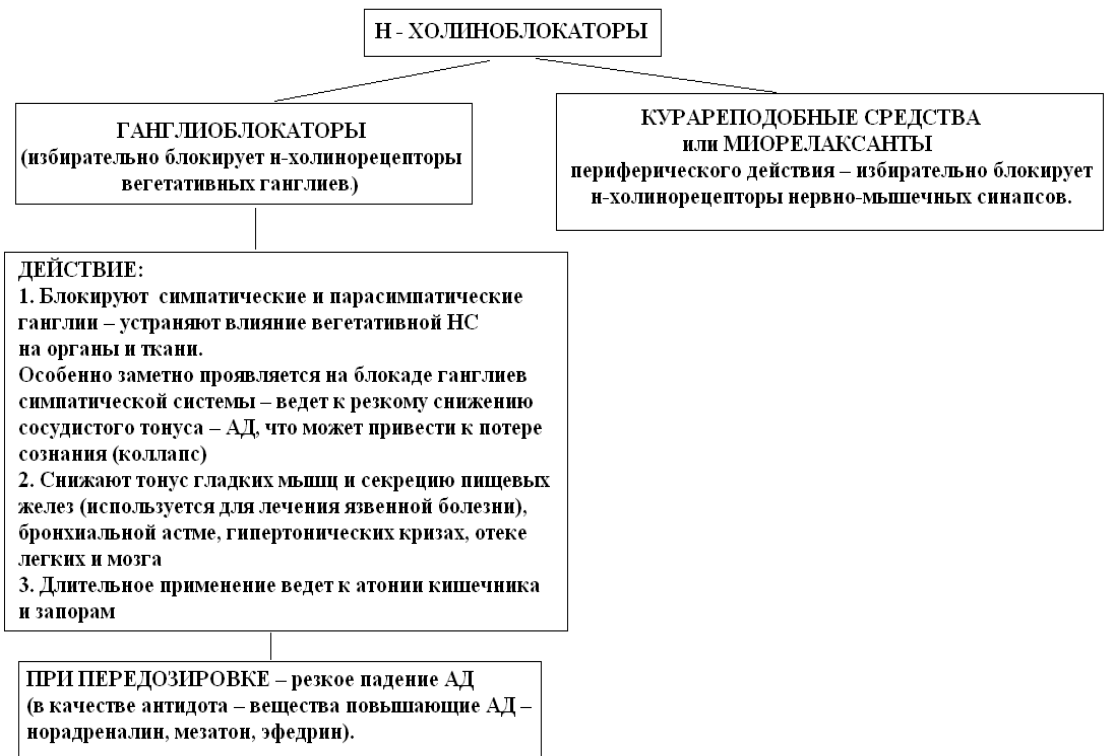
Форма выпуска: Порошок.

Н-холиноблокаторы

Н-холиноблокаторы делятся на две группы:

1. **Ганглиоблокаторы** – блокируют н-холинорецепторы вегетативных ганглиев.
2. **Курареподобные средства или миорелаксанты периферического действия** – избирательно блокируют н-холинорецепторы мышечных синапсов соматических нервов.

Структура и особенности действия Н-холиноблокаторов



Ганглиоблокаторы, в свою очередь делятся на две 2 группы, которые различаются между собой по химическому строению на: содержащие атомы **четвертичного азота** и содержащие атомы **третичного азота**.

К группе ганглиоблокаторов, содержащих атомы четвертичного азота, относятся **бензогексоний, пентамин**. Эти препараты плохо всасываются и принимаются парентерально.

Группа ганглиоблокаторов, содержащая атомы третичного азота – **пахикарпин, пирилен** - хорошо всасываются в ЖКТ и принимаются внутрь.

Ганглиоблокаторы блокируют одновременно ганглии симпатической и парасимпатической системы – устраняя таким образом влияние вегетативной НС на органы и ткани. Но особенно заметно их действие проявляется на блокаде ганглиев симпатической системы, что ведет к резкому снижению сосудистого тонуса – АД, что может привести к потере сознания (ортостатический коллапс), особенно при быстром переходе из вертикального положения в горизонтальное (рекомендуется находиться в лежачем положении 1,5-2 ч).

Кроме этого, ганглиоблокаторы снижают тонус гладких мышц и секрецию пищевых желез и используются для лечения язвенной болезни, бронхиальной астмы, при гипертонических кризах, отеке легких и мозга на фоне повышенного артериального давления.

Длительное применение лекарственных средств этой группы ведет к атонии кишечника и запорам. Некоторые ганглиоблокаторы проявляют нетипичное действие, так **пахикарпин** усиливает сократительную активность миомерия и родовую деятельность (но эффект резкого снижения АД и прочие фармакологические эффекты, характерные для этой группы, сохраняются).

Среди препаратов этой группы выделяют также - **ганглиоблокаторы кратковременного** (10-15 мин) действия (гигроний, арфонад), которые применяются для так называемой – управляемой гипотензии.

При передозировке ганглиоблокаторов наблюдается резкое падение АД (в качестве антидота применяются вещества повышающие АД – норадреналин, мезатон, эфедрин).

Противопоказаны при выраженной гипотонии, шоке, тромбах, поражении почек и печени.

Краткая характеристика лекарственных препаратов

Бензогексоний – ганглиоблокатор - стойко снижает артериальное давление, тонус гладких мышц, секрецию пищевых желез, обладает бронхорасширяющим действием. Используют при гипертонических кризах, управляемой гипотонии 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. 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; ампулы по 1 мл 2,5% раствора.

Пентамин - ганглиоблокирующее средство, блокирует н-холинорецепторы вегетативных ганглиев (симпатических и парасимпатических). Оказывает угнетающее влияние на каротидные клубочки и хромаффинную ткань надпочечников. В больших дозах может блокировать н-холинорецепторы скелетных мышц и ЦНС. Оказывает гипотензивное, артерио- и венодилатирующее действие. Уменьшает выведение катехоламинов надпочечниками и ослабляет рефлекторные прессорные реакции, что вызывает

тахикардию, парез аккомодации, мидриаз, расширение бронхов, снижение моторики органов желудочно-кишечного тракта и секреции желез, тонуса мочевого пузыря. Применяют при гипертонической болезни I, II стадии и гипертонических кризах внутримышечно 0,5-2 мл 5% раствора 2-3 раза в день. При гипертонических кризах, отеке легких, отеке мозга вводят в вену 0,2-0,5 мл или более 5% раствора, разведенных в 20 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы. Вводят медленно, под контролем артериального давления и общего состояния. Можно вводить внутримышечно 0,5-2 мл 5% раствора.

Для управляемой гипотензии (управляемого снижения артериального давления) вводят в вену перед операцией 0,8-1,2 мл 5% раствора (40-60 мг), при необходимости вводят дополнительно.

Форма выпуска: Ампулы по 1 мл 5% раствора.

Пахикарпин (пахикарпина гидройодид) – ганглиоблокатор - повышает тонус и усиливает сокращение мускулатуры матки. В связи с этим пахикарпин относительно широко применяли для усиления родовой деятельности при слабости родовых схваток и при раннем отхождении вод, а также при слабости потуг. Препарат, в отличие от питуитрина не вызывает повышения артериального давления и может назначаться роженицам, страдающим гипертонической болезнью. Применяют при спазмах периферических сосудов, ганглиолитах (воспаление нервных узлов), миопатиях (заболевание мышц), для стимуляции родов и в послеродовом периоде для уменьшения кровотечения. В последнее время для стимуляции родов применяется редко. Назначают внутрь (до еды), подкожно и внутримышечно. При облитерирующем эндартериите (воспалении внутренней оболочки артерий конечностей с уменьшением их просвета) дают внутрь по 0,05-0,1 г 2-3 раза в день. Лечение проводят в течение 3-6 недель. Через 2-3 мес. курс лечения при обострении процесса можно повторить. При ганглиолитах назначают внутрь по 0,05-0,1 г 2 раза в день в течение 10-15 дней. При миопатии назначают внутрь по 0,1 г 2 раза в день в течение 40-50 дней. Курс лечения повторяют 2-3 раза через 1-2-3 мес. Для стимуляции родовой деятельности подкожно или внутримышечно 2-4 мл 3% раствора.

Форма выпуска: Таблетки по 0,1 г; 3% раствор в ампулах по 2 мл.

Пирилен – ганглиоблокатор - резко снижает сосудистый тонус (АД), что может привести к потере сознания (ортостатический коллапс), особенно при быстром переходе из вертикального положения в горизонтальное (рекомендуется находиться в лежачем положении 1,5-2ч.), снижают тонус гладких мышц и секрецию пищевых желез. Применяют при гипертонической болезни, гипертонической энцефалопатии (пульсирующей боли в голове), спазмах периферических сосудов, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, токсикозе беременных внутрь по 0,0025-0,005 г 3-4 раза в день.

Форма выпуска: Таблетки по 0,005 г.

Гигроний - ганглиоблокирующее средство короткого действия. Используют в анестезиологии для управляемой гипотонии внутривенно (капельно) 0,1% раствор в изотоническом растворе хлорида натрия.

Форма выпуска: порошок по 0,1 г в ампулах емкостью 10 мл в упаковке по 10 штук.

Арфонад - ганглиоблокирующее средство - понижает артериальное давление посредством ганглионарной блокады с периферической вазодилатацией (расширением просвета сосудов). Обладает быстрым, выраженным, но очень кратковременным действием. Используют для искусственной гипотензии в хирургии, при остром отеке легких у гипертонических больных с левожелудочковой недостаточностью, при гипертонических кризах. Применяют при хирургических вмешательствах в состоянии гипотензии: вводится посредством внутривенного капельного вливания. Артериальное давление следует контролировать каждые 3-5 минут. Молодым и сильным больным требуются повышенные дозы, в то время как пожилым и больным с низким артериальным давлением - пониженные.

Форма выпуска: ампулы с 250 мг сухого вещества и ампулы с растворителем (5 мл воды для инъекций).

Курареподобные средства

Курареподобные средства или – **миорелаксанты** периферического типа действия. Родоначальник этой группы лекарственных средств - ядовитое вещество растительного происхождения «кураре» (содержащее алкалоид тубокурарин) - вызывающий паралич скелетных мышц. **Основной эффект курареподобных средств (миорелаксантов) – расслабление скелетных мышц**, вплоть до их полного паралича. Курареподобные вещества действуют в основном на соматические нервы скелетных мышц.

Миорелаксанты находят применение при хирургических операциях для расслабления мышц, при отравлении судорожными ядами, столбнячных судорогах. Расслабление мышц при действии курареподобных средств начинается с шеи, постепенно распространяется на всё туловище и дыхательные мышцы.

Препараты делят на две группы – **антидеполяризующие и деполяризующие миорелаксанты**.

Антидеполяризующие (тубокурарина хлорид) действует на н-холинорецепторы в соматических нервах скелетных мышц. Блокируя действие на них ацетилхолина, блокируется нервная передача.

При увеличении количества ацетилхолина в нервных окончаниях **или при введении антихолинэстеразных веществ (прозерин) –** нервно-мышечная передача восстанавливается.

Все эти вещества этой группы вводятся исключительно внутривенно (диплацин, анатруксоний и пр.)

Структура и особенности действия миорелаксантов



К миорелаксантам деполяризующего действия относится – дителин, который по химическому строению близок к ацетилхолину, вызывает кратковременное действие, сходное с действием ацетилхолина (сокращение), но далее мышцы перестают реагировать на очередные импульсы и наступает их расслабление. По мере разрушения дитилина (ацетилхолинэстеразой) – действие дитилина постепенно проходит.

Антихолинэстеразные средства не ослабляют, а наоборот - усиливают действие дитилина, поэтому эти средства (прозерин) не используют как антитоды деполяризующих миорелаксантов.

Алкалоиды мелликтин и кондельфин (из живокости сетчатой) близки по действию с миорелаксантами (тубокурарином).

Краткая характеристика лекарственных препаратов

Тубокурарина хлорид (тубокурарин) - Н-холинолитик (миорелаксант) – оказывает миорелаксирующее, расслабляющее действие на скелетные мышцы. Применяют при операциях, столбняке (для длительного - более 1 ч - расслабления мышц). Вводят парентерально, по 15-25 мг.

Форма выпуска: 1 мл раствора для инъекций содержит тубокурарина хлорида 10 мг в ампулах по 1,5 мл.

Диплацин – н-холинолитик - антидеполяризующий мышечный релаксант. Применяют в хирургии для расслабления мускулатуры и выключения произвольного (самостоятельного) дыхания. Для интубации трахеи (введения в трахею трубки для осуществления искусственного дыхания) вводят внутривенно (медленно - в течение 2-3 мин) 100-200 мг диплацина. При операции длительностью 2-2,5 ч - 20-35 мл 2% раствора. Форма выпуска: ампулы по 5 мл 1% раствора.

Анатруксоний - Н-холинолитик - антидеполяризующий мышечный релаксант, который применяется для обеспечения релаксации мышц во время оперативных вмешательств, при которых требуется тотальная или частичная кураризация пациента. С целью расслабления мышц брюшной стенки на 20–25 минут на фоне поверхностного эфирного наркоза анатруксоний вводят в дозе 0,07–0,08 мг/кг; для достижения эффекта в течение 40–60 минут - в дозе 0,15–0,20 мг/кг.

Форма выпуска: 0,3% раствор для инъекций в ампулах по 2 мл.

Дитилин - Н-холинолитик (миорелаксант) - курареподобный (расслабляющий мышцы) препарат с деполяризующим действием. Применяют при интубации, эндоскопических процедурах (осмотре каналов и полостей тела при помощи оптических приборов - бронхоскопия, цитоскопия и др.), кратковременных операциях. Вводят дитилин внутривенно. Для интубации и полного расслабления скелетных и дыхательных мышц во время операции вводят препарат в дозе 1,5-2 мг/кг. Для длительного расслабления мускулатуры в течение всей операции можно вводить препарат фракционно (дробно) через 5-7 мин по 0,5-1 мг/кг. Повторные дозы дитилина действуют более продолжительно. Прозерин и другие антихолинэстеразные вещества не являются антагонистами в отношении деполяризующего действия дитилина; наоборот, подавляя активность холинэстеразы, они удлиняют и усиливают его действие.

Форма выпуска: ампулы по 5 и 10 мл 2% раствора.

Мелликтин - Н-холинолитик (миорелаксант) - обладает курареподобными (расслабляющими мышцы) свойствами. По механизму действия на нервномышечную проводимость близок к тубокурарин-хлориду. Препарат оказывает также умеренное ганглиоблокирующее действие. Применяют для понижения тонуса при пирамидной недостаточности (заболеваниях мозга, проявляющихся повышением тонуса мышц) сосудистого и воспалительного происхождения, постэнцефалическом паркинсонизме и болезни Паркинсона и при других заболеваниях пирамидного и экстрапирамидного характера, сопровождающихся повышением мышечного тонуса и расстройствами двигательных функций. Назначают внутрь по 0,02 г, начиная с 1 раза и доводя до 5 раз в день. Лечение мелликтином сочетают при наличии показаний с другими методами лечения и лечебной гимнастикой. Антагонистами мелликтина являются прозерин и другие антихолинэстеразные вещества.

Форма выпуска: Таблетки по 0,02 г (20 мг).

Ардуан - Н-холинолитик (миорелаксант) - неполяризующий миорелаксант, средство, расслабляющее мышцы средней продолжительности действия. Применяют при всевозможных общехирургических вмешательствах, при которых необходимо достичь полного расслабления мускулатуры. Вводят ардуан внутривенно. Доза для интубации (введения в трахею трубки для осуществления искусственного дыхания) составляет 0,04-0,08 мг/кг. При дозе 0,08 мг/кг оптимальные условия для интубации наступают через 2-3 мин. Для мышечной релаксации при наркозе применяют препарат в дозах от 0,02 до 0,08 мг/кг (чаще 0,04-0,05 мг/кг). При этих дозах наступает полная релаксация длительностью около 50 мин. При необходимости удлинения эффекта применяют 1/4 часть начальной дозы. При необходимости прекратить действие ардуана вводят 1-3 мг прозерина после предварительного внутривенного введения 0,25-0,5 мг атропина.

Форма выпуска: лиофилизированный (высушенный путем замораживания в вакууме) порошок в ампулах по 0,004 г в комплекте с растворителем (4 мл в ампуле).

АДРЕНЕРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Медиатором в адренергических синапсах является **норадреналин**, который возбуждает адренорецепторы клеточных мембан.

Синтез норадреналина происходит в окончаниях симпатических нервов.

Исходным веществом биосинтеза норадреналина в синапсах является аминокислота **ТИРОЗИН** которая под влиянием ферментов трансформируется в: **ДОФА** (диоксифенилаланин), далее в – **диоксифенилаланинамин** (**дофамин**), и – в **норадреналин**.

Схема синтеза норадреналина в адренергических синапсах



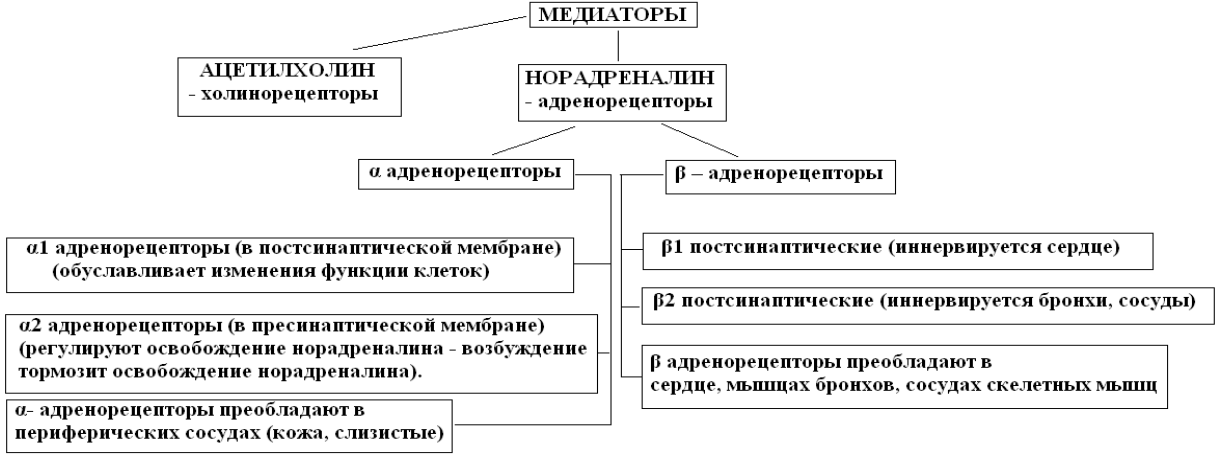
Синтез норадреналина осуществляется в окончаниях адренергических нервов, который депонируется в везикулах.

При нервном импульсе – часть норадреналина выбрасывается в синаптическую щель. Действие его кратковременно, поскольку часть подвергается обратному захвату, часть инактивируется специальными ферментами (например, **МАО** – моноаминоксидазой, или **катехолометилтрансферазой (КОМТ)**).



Различают **α** и **β** – адренорецепторы, что обусловлено их разной чувствительностью к норадреналину. Кроме того, возбуждение **α** или **β** адренорецепторов вызывает разные эффекты.

Структура и особенности действия адренергических средств



α – адренорецепторы подразделяются на α_1 (находящиеся в постсинаптической мембране) и α_2 (находящиеся в пресинаптической мембране).

α_1 - обуславливают изменения функции клеток, α_2 - регулируют освобождение норадреналина (возбуждение этих рецепторов **тормозит** освобождение норадреналина).

β – (находящиеся в постсинаптической мембране), выделяют β_1 (иннервируют сердце), β_2 (иннервируют бронхи и сосуды).

Количество α и β – в органах различно. В периферических сосудах (кожа, слизистые) преобладают α - адренорецепторы, в сердце, мышцах бронхов, сосудах скелетных мышц и внутренних органов - β .

Действие лекарственных препаратов на адренергические синапсы разнообразно.

Локализация адренорецепторов и эффекты, возникающие при их возбуждении

| Органы, процессы | Тип рецептора | Эффект возбуждения рецептора |
|--|-----------------------------------|--|
| Сердце | β_1 | Усиление и учащение сердечных сокращений Увеличение скорости проведения импульсов |
| Сосуды: скелетных мышц кожи и слизистых оболочек бронхины | β_2 α α | Расширение Сужение —→ |
| Гладкие мышцы внутренних органов: бронхов кишечника | β_2 α, β_1 | Расслабление —→ |
| Обменные процессы: глюкогенолиз в печени и мышцах липолиз | β_2 β_1 | Усиление, гипергликемия Усиление |

Вещества, действующие на передачу импульсов в адренергических синапсах (адренергические средства) делят на четыре группы:

1. Адреномиметики – возбуждающие адренорецепторы.
2. Адреноблокаторы – блокирующие адренорецепторы.
3. Симпатомиметики (адреномиметики непрямого действия)
4. Симпатолитики – блокирующие симпатическую иннервацию на уровне окончания постганглионарных синаптических нервов.

Структура веществ, действующих в области адренергических синапсов



Классификация адренергических средств

| Адреномиметики | | | Адреноблокаторы | | Симпатолитики |
|---|--|---|--|---|---------------|
| альфа | бета | альфа, бета | альфа | бета | |
| норадреналин ($\alpha_1, \alpha_2, \beta_1$) | изадрин (β_1, β_2) | адреналин (прямой) ($\beta_1, \beta_2, \alpha_1, \alpha_2$) | фентоламин (α_1, α_2) | аэтилпропилен (β_1, β_2) | октадин |
| мезатон (α_1) | орципренолин (β_1, β_2) | эфедрин (косвенный) | тропафен (α_1, α_2) | оказипролол (β_1, β_2) | резерпин |
| нафтизин (α_2) | фенотерол (β_2) | | дигидроэрготамин (α_1, α_2) | пиндолол (β_1, β_2) | |
| | салбутамол (β_2) | | проazosин (α_1) | талинолол (β_1) | |
| галазолин (α_2) | добутамин (β_1) | | | метопролол (β_1) | |
| | тербуталин (β_2) | | лабетолол (α, β) | | |

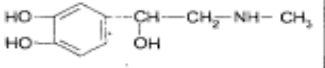
АДРЕНОМИМЕТИКИ

Адреномиметики – вещества возбуждающие α , либо β , либо α и β – адренорецепторы.

Некоторые из них – влияют **прямо** на адренорецепторы (прямые адреномиметики), другие – **косвенно** (непрямые адреномиметики).

Выявлена прямая связь химического строения адреномиметиков и продолжительности их действия – чем больше гидроксильных групп, тем быстрее они инактивируются ферментами.

Зависимость продолжительности гипертензивного действия некоторых адреномиметиков от их структуры

| Препарат | Химическое строение | Продолжительность гипертензивного действия при внутривенном введении |
|--------------|--|--|
| Норадреналин |  | Несколько минут |
| Адреналин |  | → |
| Мезатон |  | Около 20 мин |
| Эфедрин |  | Около 1 ч |

α – адреномиметики (норадреналин, мезатон, нафтизин) – возбуждают преимущественно α – адренорецепторы.

Норадреналин вызывает сильный но кратковременный сосудосуживающий эффект и резко **повышает артериальное давление** (действие – кратковременное - 3-5 мин) - сопровождается рефлекторной брадикардией. Вводится норадреналин **исключительно внутривенно**. При введении per os разрушается в ЖКТ, при подкожном или внутримышечном введении вызывает некроз тканей, вызывая спазм сосудов в месте введения.

Мезатон – действует слабее, но продолжительнее.

Нафтизин, галазолин - также обладают выраженным сосудосуживающим эффектом, внутрь не применяются из-за токсичности, поскольку эти вещества угнетают ЦНС. Применяются исключительно местно (внутриназально, при насморке), уменьшают воспаление в носовой полости.

β -адреномиметики – стимулирующе (возбуждающе) действуют на **β -адренорецепторы**. Типичный представитель лекарственных средств этой группы – **изадрин**.

Изадрин – возбуждает как **β_1** , так и **β_2** адренорецепторы, применяется в основном для снятия приступов бронхиальной астмы и редко в качестве кардиостимулятора.

Добутамин - избирательно стимулирует **β_2** адренорецепторы сердца, применяется в качестве кардиотонического средства.

Средства, стимулирующие **α** и **β -адренорецепторы** (α и β -адреномиметики), сочетают свойства препаратов предыдущих групп.

Типичный представитель веществ этой группы – **АДРЕНАЛИН (гормон мозгового вещества надпочечников)**, непосредственно действует на адренорецепторы.

Действие адреналина проявляется при его **внутривенном введении** (адреналин не оказывает какого либо действия при приеме внутрь, поскольку разрушается в ЖКТ).

Адреналин – усиливает сокращение сердца, суживает периферические сосуды – вследствие чего повышается артериальное давление, гладкая мускулатура – расслабляется, мышцы бронхов так же расслабляются.

Действие адреналина – кратковременное, всего несколько минут, поскольку вещество достаточно быстро разрушается ферментами.

Адреналин применяется для купирования приступов бронхиальной астмы, стимуляции сердечной деятельности и повышения артериального давления (как правило, в неотложных случаях при оказании экстренной медицинской помощи). Адреналин можно вводить внутрисердечно.

Адреналин вызывает спазм периферических сосудов, вследствие чего применяется совместно с местными анестетиками (новокаин, лидокаин и пр.), для пролонгирования (удлинения продолжительности) их действия.

НЕПРЯМЫЕ (косвенные) АДРЕНОМИМЕТИКИ

Адреномиметики непрямого действия, оказывают фармакологический эффект сходный с ранее описанными адреномиметиками прямого действия (группы адреналина), но отличаются от них механизмом действия. В отличие от адреналина и сходных с ним по действию препаратов, оказывающих прямое стимулирующее действие на адренорецепторы, под действием не прямых адреномиметиков усиливается выделение медиатора – **норадреналина**.

Наиболее типичным представителем веществ этой группы является **ЭФЕДРИН**, который оказывает сходное с адреналином действие (но менее эффективен). Эфедрин не разрушается в ЖКТ, вследствие чего может приниматься внутрь (per os), продолжительность действия эфедрина составляет - 1 -1,5 часа. Показания к применению те же, что и у веществ из группы адреномиметиков прямого действия, но кроме этого эфедрин проявляет еще и противовоспалительный эффект.

Эфедрин – оказывает влияние на ЦНС, вызывая ее возбуждение. При частом употреблении эфедрина депо медиатора норадреналина достаточно быстро истощается, вследствие чего сила действия препарата значительно снижается при каждом очередном приеме. Это явление называется.

Краткая характеристика лекарственных препаратов:

Адреналина гидрохлорид - адреномиметик прямого действия, действующий на α и β адренорецепторы. Действие адреналина при введении в организм связано с влиянием на α и β -адренорецепторы и во многом совпадает с эффектами возбуждения симпатических нервных волокон. Он вызывает сужение сосудов органов брюшной полости, кожи и слизистых оболочек; в меньшей степени суживает сосуды скелетной мускулатуры. Артериальное давление повышается. Однако прессорный эффект адреналина в связи с возбуждением β -адренорецепторов менее постоянен, чем эффект норадреналина. Изменения сердечной деятельности носят сложный характер: стимулируя адренорецепторы сердца, адреналин способствует значительному усилению и учащению сердечных сокращений; одновременно, в связи с рефлекторными изменениями из-за повышения артериального давления происходит возбуждение центра блуждающего нерва, оказывающего на сердце тормозящее влияние; в результате этого сердечная деятельность может замедляться - могут возникать аритмии. Адреналин вызывает расслабление мускулатуры бронхов и кишечника, расширение зрачков (вследствие сокращения радиальных мышц радужной оболочки, имеющих адренергическую иннервацию). Под влиянием адреналина происходит повышение содержания глюкозы в крови и усиление тканевого обмена. Адреналин улучшает функциональную способность скелетных мышц. Применяют при остром снижении артериального давления (коллапс), приступах бронхиальной астмы, гипогликемиях вследствие передозировки инсулина, острых медикаментозных аллергических реакциях, глаукоме (повышенном внутриглазном давлении), фибрилляции желудочков и др.; в качестве сосудосуживающего средства в оториноларингологической и офтальмологической практике. Вводят подкожно и внутримышечно, иногда внутривенно 0,3-0,5-0,75 мл 0,1% раствора. При фибрилляции желудочков внутрисердечно; при глаукоме - 1-2% раствор в каплях. Форма выпуска: 0,1% раствор в ампулах по 1 мл.

Нафтизин - адреномиметик прямого действия на α адренорецепторы - оказывает быстрое, выраженное и продолжительное вазоконстрикторное действие в отношении сосудов слизистых оболочек (уменьшает отечность, гиперемию, экссудацию). Облегчает носовое дыхание при ринитах. Через 5-7 дней возникает толерантность. Вызывает сужение периферических кровеносных сосудов, повышает артериальное давление, расширяет зрачки. Оказывает местное сосудосуживающее и противовоспалительное действие (по сравнению с адреналином более длительное). Применяют при ринитах, гайморитах, аллергических конъюнктивитах, необходимости остановки носовых кровотечений. Применяют местно в виде 0,05% и 0,1 % раствора по 1-2 капли в носовой ход 2-4 раза в день. При кровотечениях используют тампоны, смоченные 0,05% раствором. При конъюнктивитах закапывают 1-2 капли 0,05% раствора. Форма выпуска: Во флаконах по 10 мл 0,05% раствора и 0,1% раствора.

Норадреналина гидротартрат - адреномиметик прямого действия на α и β адренорецепторы, но преимущественно влияет на α -адренорецепторы. Отличается от адреналина более сильным сосудосуживающим и прессорным (повышающим артериальное давление) действием, меньшим стимулирующим влиянием на сокращения сердца, слабым бронхолитическим эффектом, слабым влиянием на обмен веществ (отсутствие выраженного гипергликемического эффекта). Кардиотропное действие норадреналина связано со стимулирующим его влиянием на β -адренорецепторы сердца,

однако β -адреностимулирующее действие маскируется рефлекторной брадикардией и повышением тонуса блуждающего нерва в ответ на повышение артериального давления. Введение норадреналина вызывает увеличение сердечного выброса; вследствие повышения артериального давления возрастает перфузионное давление в коронарных (сердечных) артериях. Вместе с тем, значительно возрастает периферическое сосудистое сопротивление (сопротивление сосудов току крови) и центральное венозное давление. Норадреналин является эффективным средством для повышения артериального давления и усиления сердечных сокращений. Применяют для повышения артериального давления при остром его понижении вследствие хирургических вмешательств, травм, отравлений, сопровождающихся угнетением сосудодвигательного центра и др. внутривенно (капельно). Ампульный раствор норадреналина разводят в 5% растворе глюкозы или изотоническом растворе натрия хлорида из расчета, чтобы в 1 л раствора содержалось 2-4 мл 0,2% раствора (4-8 мг) норадреналина гидротартрата. Следует остерегаться введения раствора норадреналина под кожу и в мышцы из-за опасности развития некрозов, поэтому необходим постоянный контроль положения иглы в вене. При попадании норадреналина под кожу вводят 5-10 мл фентоламина в 10 мл физиологического раствора.

Форма выпуска: 0,2% раствор в ампулах по 1 мл.

Эфедрин гидрохлорид - адреномиметик непрямого действия, действующий на α и β адренорецепторы. По периферическому симпатомиметическому действию эфедрин близок к адреналину: вызывает сужение сосудов, повышение артериального давления, расширение бронхов, торможение перистальтики кишечника, расширение зрачков, повышение содержания глюкозы в крови. Применяют эфедрин для сужения сосудов и уменьшения воспалительных явлений при ринитах, как средство для повышения артериального давления при оперативных вмешательствах (особенно при спинномозговой анестезии), при травмах, кровопотерях, инфекционных заболеваниях, гипотонической болезни и др. Используется также (чаще в комбинации с другими средствами) при бронхиальной астме, а иногда при сенной лихорадке, крапивнице, сывороточной болезни и других аллергических заболеваниях. Применяют также при миастении, отравлениях снотворными и наркотиками, при энурезе. Местно применяют раствор эфедрина как сосудосуживающее средство и для расширения зрачка. Препарат применяют также в кардиологии для лечения нарушений сердечного ритма. Применяют эфедрин внутрь (до еды), под кожу, в мышцы и в вену, а также местно. При остром снижении артериального давления показано медленное внутривенное введение; при инфекционных заболеваниях, перед спинномозговой анестезией и т. п. - подкожное или внутримышечное введение; при бронхиальной астме и других аллергических заболеваниях назначают обычно внутрь взрослым по 0,025-0,05 г 2-3 раза в день. Курс лечения обычно продолжается 10-15 дней. Можно также назначать циклами по 3-4 дня с 3-дневными перерывами. При бронхиальной астме применяют эфедрин в сочетании с теофиллином, димедролом, глюконатом кальция и другими средствами. Под кожу и внутримышечно вводят взрослым по 0,02-0,05 г 2-3 раза в день; внутривенно вводят взрослым струйно (медленно) по 0,02-0,05 г (0,4-1 мл 5% раствора) или капельно в 100-500 мл изотонического раствора натрия хлорида или 5% раствора глюкозы в общей дозе до 0,08 г (80 мг). В офтальмологической практике применяют 1-5% растворы (глазные капли). При вазомоторном рините (воспалении слизистой оболочки носа) - 2-3% растворы.

Побочные действия: Передозировка препарата может вызвать ряд токсических явлений: нервное возбуждение, бессонницу, расстройства кровообращения, дрожание конечностей, задержку мочи, потерю аппетита, рвоту, усиленное потоотделение, сыпь.

Форма выпуска: Порошок; таблетки по 0,002; 0,003 и 0,001 г (для педиатрической практики); 5% раствор (для инъекций) в ампулах по 1 мл; 2% и 3% растворы во флаконах по 10 мл (для оториноларингологической практики).

Фенотерол - адреномиметик прямого действия, действующий на β адренорецепторы бронхов и матки. Фенотерол оказывает выраженное, быстро наступающее бронхолитическое действие. Предупреждает, а также быстро и эффективно купирует бронхоспазмы различного происхождения, в том числе, приступы удушья, связанные с физической нагрузкой. Бронхоспазмолитическое действие длится до 8 ч. Применяют для лечения бронхиальной астмы. Используют также при спастическом астмоидном бронхите (инфекционном заболевании легких с затрудненным выдохом), эмфиземе легких (повышенная воздушность и снижение тонуса легочной ткани). Дозы препарата подбираются индивидуально. Обычно для купирования острого приступа удушья 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 6 ч. Для профилактики приступов удушья назначают по 1 вдоху аэрозоля (с содержанием 0,2 мг в одном вдохе) взрослым 3 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.

Мезатон - адреномиметик прямого действия, действующий на α адренорецепторы. Являясь сосудосуживающим средством, мезатон стимулирует α -адренорецепторы сосудов, не оказывая влияния на β -рецепторный аппарат сердца. Вызывает повышение артериального давления (возможна рефлекторная брадикардия). Препарат вызывает расширение зрачка и понижает внутриглазное давление, при этом не оказывает влияния на аккомодацию. Мезатон применяют для повышения артериального давления при гипотензии и коллапсе, при гипотонической болезни, при подготовке и во время оперативных вмешательств, при инфекционных заболеваниях, интоксикациях, для спазма сосудов при вазомоторном рините, а также для расширения зрачка. При коллапсе мезатон вводят в вену в дозировке 0,3 и 0,5 мл (1% раствор) в 40 мл 20 или 40 % раствора глюкозы. Внутривенно капельно вводят до 1 мл 1 % раствора на глюкозе (500 мл 5% раствора глюкозы). В мышцу и под кожу: от 0,3 до 1 мл 1% раствора, перорально – по 0,01-0,025г 2-3 раза в день. Для уменьшения воспалительных проявлений применяют 0,25-0,5% растворы для смазывания или закапывания. Для расширения зрачка: 1-2% раствор мезатона вводят в конъюнктивальный мешок по 2-3 капли.

Передозировка: проявляется короткими эпизодами желудочковой тахикардии и желудочковыми экстрасистолами, ощущением тяжести в голове и области конечностей, повышением артериального давления. **Купирование приступа:** внутривенное введение α и β -адреноблокаторов.

Форма выпуска: 1% раствор в ампулах по 1 мл; порошок.

Сальбутамол - адреномиметик прямого действия, действующий на β адренорецепторы. Стимулирует β -адренорецепторы бронхов и оказывает сильное и длительное (5-8 ч) бронхорасширяющее действие. В терапевтических дозах существенных изменений в работе сердечно-сосудистой системы не вызывает. Применяют при бронхиальной астме, хроническом бронхите внутрь в качестве бронхолитического средства взрослым и детям старше 12 лет по 2-4 мг 3-4 раза в сутки, при необходимости доза может быть повышена до 8 мг 4 раза в сутки. Детям в возрасте 6-12 лет назначают по 2 мг 3-4 раза в сутки; 2-6 лет - 1-2 мг 3 раза в сутки. Препарат в форме аэрозоля назначают для купирования бронхоспазма 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. Препарат в форме порошка для ингаляций назначают по той же схеме, но при этом дозы увеличиваются в 2 раза соответственно. Препарат в виде раствора для ингаляционного применения назначают в дозе 2,5 мг 3-4 раза в сутки. При необходимости возможно увеличение дозы до 5 мг 3-4 раза в сутки.

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); порошок для ингаляций (1 доза - 0,2 или 0,4 мг сальбутамола) в дисках; раствор для ингаляционного применения (1 мл - 1,25 мг сальбутамола) в ампулах по 2 мл; раствор для инъекций (1 мл - 0,1 мг сальбутамола).

Изадрин - адреномиметик прямого действия, действующий на β адренорецепторы. Действие изадрина распространяется одновременно на β_1 - и β_2 -адренорецепторы, поэтому влияние на бронхи, сердечно-сосудистую систему и другие органы, снабженные бета-адренорецепторами, не является избирательным. При блокадах сердца эффект изадрина связан с улучшением проводимости благодаря влиянию на симпатическую иннервацию сердца, с повышением возбудимости и сократительной функции миокарда. Аналогичный эффект оказывают различные симпатомиметические вещества, в том числе норадреналин, адреналин, эфедрин; однако эти препараты вызывают повышение артериального давления, стенокардические боли в сердце и другие побочные явления, что ограничивает возможность их широкого применения при атриовентрикулярной блокаде (нарушении проведения возбуждения по проводящей системе сердца). Изадрин более удобен для этой цели, так как не повышает артериального давления и в меньшей мере способен вызывать фибрилляцию желудочков. Препарат находит применение при лечении больных с нарушениями атриовентрикулярной проводимости, для снятия атриовентрикулярной блокады. Вводят капельно внутривенно в 5% растворе глюкозы в дозе 0,5-5 мкг (0,0005-0,005 мг) в минуту.

Форма выпуска: 0,5% и 1% растворы во флаконах по 25 и 100 мл; таблетки, содержащие 0,005 г препарата.

Ксилометазолин - адреномиметик прямого действия, действующий на α адренорецепторы, суживает кровеносные сосуды слизистой оболочки полости носа, устраняя отек и гиперемия слизистой оболочки. Облегчает носовое дыхание при ринитах. Действие наступает через несколько минут и продолжается в течение нескольких часов. Применяют при остром аллергическом рините, ОРЗ с явлениями ринита, синусите,

поллинозе; среднем отите (для уменьшения отека слизистой оболочки носоглотки), при подготовке больного к диагностическим манипуляциям в носовых ходах. Используют интраназально. Взрослым – вводят по 1-3 капли 0,1% раствора в каждую ноздрю 1–3 раза в сутки; детям - по 1 капле 0,05% раствора 1 раз в сутки.

Форма выпуска - 0,1% раствор (для взрослых) и 0,05% раствор (для детей) – 10 мл во флаконе и в аэрозольной упаковке.

Беротек - адреномиметик прямого действия, действующий избирательно на β_2 адренорецепторы. В состав препарата входит активный компонент – фенотерола гидробромид – лекарственное вещество, взаимодействующее со стимуляторным GS-белком и активирующее аденилатциклазу. Препарат способствует расслаблению гладкомышечного слоя бронхов и сосудов, предупреждает развитие спазма бронхов различной этиологии, в том числе вызванного гистамином, аллергенами и холодным воздухом. При применении высоких доз препарата может вызвать стимуляцию β_1 -адренорецепторов и β_2 -адренорецепторов сердца и сосудов, вследствие чего усиливается сократительная функция миокарда, увеличивается частота сердечных сокращений. Развитие системного действия препарата, при применении терапевтических доз фенотерола, ассоциируется с развитием толерантности. После ингаляции действие препарата развивается в течение 5 минут и длится в течение 3-5 часов. Препарат применяют для купирования приступов бронхиальной астмы и назначают пациентам, страдающим бронхиальной астмой для предупреждения приступов, вызванных физическим напряжением.

Препарат предназначен для ингаляционного применения. Перед первым применением препарата, а также, если препарат не применялся в течение 3 дней, следует 2 раза нажать на дно баллона для достижения равномерного дозирования аэрозоля. Длительность курса лечения и дозы препарата определяет лечащий врач индивидуально для каждого пациента. Взрослым и детям в возрасте старше 6 лет для купирования острых приступов бронхиальной астмы обычно назначают по 1 дозе препарата. В случае необходимости спустя 5 минут назначают ещё 1 дозу препарата. В случае если после проведения 2 ингаляций не происходит достаточного расширения бронхов и дыхание не облегчается, следует немедленно обратиться за медицинской помощью. Взрослым и детям в возрасте старше 6 лет для профилактики астмы физического усилия обычно назначают по 1-2 дозы препарата 1-4 раза в день.

Форма выпуска: аэрозоль дозированный по 10мл в баллонах с дозирующим устройством.

АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

Лекарственные средства этой группы **блокируют адренорецепторы:**

Адреноблокаторы делятся на 2 (основные) группы: α -адреноблокаторы и β -адреноблокаторы, кроме того выделяют еще и третью группу – блокаторов α и β адренорецепторов.

Представителями веществ этой группы являются - **дигидратированные** алкалоиды спорыньи (дигидроэрготоксин, дигидроэрготамин), фентоламин и пр.

Если сами алкалоиды спорыньи (эрготоксин и эрготамин) – вызывают сужение сосудов, **то их дегидратированные соединения - проявляют выраженное α -адреноблокирующее действие** - вследствие чего сосуды расширяются.

Еще более фармакологически активными являются синтетические представители этой группы - фентоламин и тропафен.

α -адреноблокирующее действие проявляет – также **аминазин (нейролептик)**, который будет рассмотрен ниже.

Наиболее **характерным** признаком фармакологического действия группы α -адреноблокаторов – является их способность **понижать артериальное давление** вследствие расширения сосудов (особенно периферических, содержащих много α -адренорецепторов). Расширение периферических сосудов ведет к резкому и стойкому (в течение нескольких часов) падению АД. После приема препаратов этой группы рекомендуется некоторое время находиться в лежачем положении, поскольку переход в вертикальное – вызывает потерю сознания (ортостатический коллапс).

Под действием α – адреноблокаторов наблюдается «извращенное» действие адреналина, который в этом случае вместо того, **чтобы суживать сосуды – расширяет их**. Такое действие адреналина связано с тем, что он возбуждает не только α но и β -адренорецепторы. Блокируя действия α - адренорецепторов, усиливается влияние β -адренорецепторов, что ведет к расширению сосудов и снижению артериального давления. Вследствие этой особенности адреналин не может применяться в качестве средства медикаментозной помощи при падении артериального давления, возникшего в результате передозировки адреноблокаторов.

В терапевтической практике препараты этой группы применяются при гипертонических кризах, **но при этом вызывают тахикардию** (вследствие блокады α_2 – адренорецепторов); для снятия спазмов периферических сосудов; при лечении трофических язв нижних конечностей (для улучшения кровоснабжения).

К лекарственным средствам, блокирующим преимущественно α_1 -относятся празозин, доксазозин, основной эффект которых – снижение АД без существенных изменений частоты сердечных сокращений (применяются при лечении гипертонии).

Передозировка α -адреноблокаторов ведет к **ортостатическому коллапсу**.

β -адреноблокаторы. Наиболее характерным представителем лекарственных препаратов этой группы является – **анаприлин, который блокирует одновременно β_1 и β_2 -адренорецепторы** (оказывающих влияние на сердце и бронхи). Наиболее характерно проявляется его действие на сердце.

Известно, что стимуляция сердечной деятельности связана с возбуждением **β -адренорецепторов**, однако чрезмерное возбуждение этих рецепторов ведет к нарушениям сердечной деятельности. Блокадой β -адренорецепторов снимается напряжение на сердечную мышцу, снижается ее возбудимость и потребность в кислороде, в результате чего улучшается работа сердца. Вместе с тем блокада β_2 -адренорецепторов ведет к повышению тонуса бронхиальных мышц, поэтому характерным побочным действием анаприлина является **бронхоспазм**.

Анаприлин – широко применяется **при сердечных аритмиях и стенокардии, а также при гипертонии** (вследствие способности снижать артериальное давление). Действие его до конца не выяснено, но считается, что осуществляется в основном за счет ослабления сердечной деятельности и уменьшения **ангиотензина** в крови (биологически активного вещества, сужающего сосуды).

Побочными эффектами анаприлина является – **ослабление работы сердца и сужение бронхов (бронхоспазм)**.

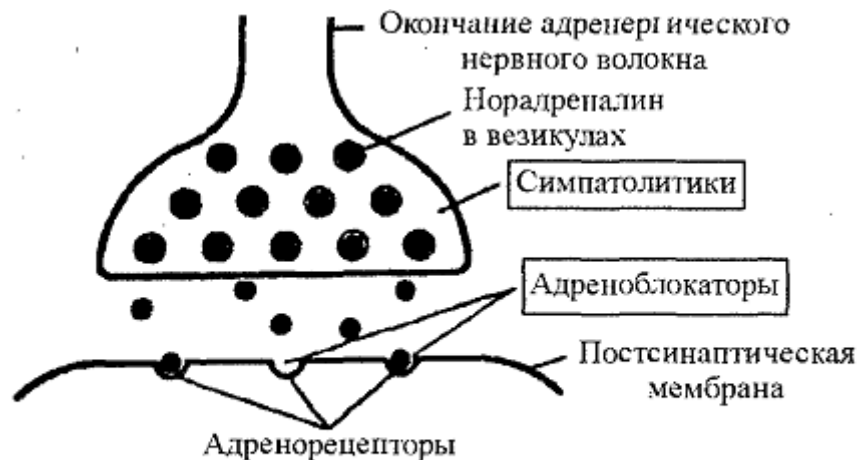
Препараты этой-же группы - метопролол, талинолол – блокируют только β_1 -адренорецепторы, поэтому более эффективны в качестве кардиостимуляторов (не влияют на дыхательную систему).

К препаратам, блокирующим одновременно α и β -адренорецепторы относится ЛАБЕТАЛОЛ – наиболее характерное действие которого – **гипотензивное**.

СИМПАТОЛИТИКИ

Симпатолитики – вещества, **блокирующие симпатическую** иннервацию органов путем **ограничения выхода медиатора из окончаний адренергических нервов**.

В отличие от адреноблокаторов, симпатолитики не влияют на адренорецепторы. Область действия симпатолитиков – окончания постганглионарного симпатического нервного волокна, адреноблокаторы же действуют на постсинаптическую мембрану.



Схематическое изображение адренергического синапса и локализация действия симпатолитиков и адреноблокаторов

Симпатолитики не блокируют действие адреномиметиков, действие адреномиметиков (адреналина) на фоне симпатолитиков не только сохраняется, но даже усиливается.

К представителями лекарственных препаратов этой группы относятся - **октадин, раунатин, резерпин**. Результатом фармакологического действия этих веществ является постепенное истощение запасов медиатора – норадреналина в окончаниях симпатических нервов, что ведет к снижению тонуса симпатической нервной системы и постепенному снижению артериального давления (вследствие расширения сосудов).

Вместе с тем, угнетение адренергической иннервации ведет к усилению иннервации холинергической (что особенно проявляется при действии на ЖКТ).

Один из представителей этой группы препаратов – резерпин при постепенном истощении норадреналина в ЦНС, проявляет успокаивающий, транквилизирующий и нейролептический эффекты. При длительном применении этого препарата могут возникнуть симптомы паркинсонизма.

Побочным действием, характерным для симпатолитиков является общая слабость и набухание слизистой дыхательных путей.

ДОФАМИНЭРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Дофамин – предшественник норадреналина - играет важную роль в деятельности ЦНС: механизмы многих психотропных противопаркинсонических средств связаны с дофаминэргическими процессами в головном мозге.

Различают два типа дофаминовых рецепторов: D_1 и D_2 . Дофамин влияет преимущественно на D_2 рецепторы, в больших дозах - на D_1 , а также α и β -адренорецепторы.

В медицине применяется ДОФАМИН и БРОМОКРИПТИН.

Дофамин – усиливает силу сердечных сокращений (вследствие чего увеличивается выброс крови), но не влияет на их частоту.

Бромокриптин - полусинтетическое производное алкалоида спорыньи эргокриптина - агонист D_2 дофаминовых рецепторов. Действие приводит к торможению секреции гормонов гипофиза, особенно соматотропина, в больших дозах приводит к рвоте, снижению температуры тела и артериального давления.

Блокатор D_2 -рецепторов – **метоклопрамид** - применяется в качестве противорвотного средства центрального действия (действует на рвотный центр), стимулятор ЖКТ.

ПРИМ. Дофаминэргические средства будут рассмотрены в следующих разделах методических рекомендаций.

Краткая характеристика лекарственных препаратов

Празозин - альфа-адреноблокатор - гипотензивный препарат, применяемый при гипертонической болезни (стойком подъеме артериального давления) и застойной сердечной недостаточности. Характерным для действия празозина является главным образом периферическая вазодилатация (расширение сосудов). Он оказывает одновременно артерии- и венорасширяющее действие (с несколько большим влиянием на объемные, т.е. венозные, сосуды), уменьшает в связи с этим венозный приток крови к сердцу и облегчает работу сердца из-за уменьшения периферического сопротивления. В отличие от обычных α -адреноблокаторов, празозин тахикардии, как правило, не вызывает. Применяют празозин при разных формах артериальной гипертензии внутрь независимо от времени приема пищи. Начинают с небольшой дозы - 0,5-1 мг, которую следует принимать перед сном, после чего больной должен находиться в постели в связи с возможностью развития “феномена первой дозы” - гипотензии, вплоть до обморочного состояния. Особенно выражена эта реакция на фоне предшествующего приема мочегонных средств. В дальнейшем назначают празозин по 1 мг 3-4 раза в день. Постепенно дозы увеличивают, добиваясь гипотензивного эффекта. Эффект обычно наступает через несколько дней, но стойкое понижение артериального давления может развиваться через 4-8 нед. Поддерживающая доза подбирается индивидуально. Форма выпуска: Таблетки по 0,001 и 0,005.

Анаприлин - β -адреноблокатор - действует как β_1 - так и β_2 -адренорецепторы (неизбирательного действия). Анаприлин ослабляет влияние симпатической импульсации на β -рецепторы миокарда, тем самым уменьшается сила и частота сердечных сокращений, блокируется положительный хроно- и ионотропный эффект кетахоламинов, при этом снижая потребность сердечной мышцы в кислороде. Под действием анаприлина снижается артериальное давление, а тонус бронхиальных мышц повышается в связи с блокадой β_2 -адренорецепторов. Также повышается сократительная способность матки.

Препарат повышает секреторную и моторную активность органов желудочно-кишечного тракта. Анаприлин применяется при лечении ишемической болезни сердца, артериальной гипертензии, стенокардии, нарушениях сердечного ритма (тахикардии!) в том числе и при тахикардии вызванной тиреотоксикозом. Также анаприлин нашел применение при инфаркте миокарда. Препарат назначают внутрь за 10-30 мин до приема пищи, запивая большим количеством жидкости. Назначают анаприлин внутрь, начиная с дозы 0,1 г. 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, промыть желудок, 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.

Метопролол - β -адреноблокатор - действует преимущественно на β_1 -адренорецепторы сердца. Обладает антиангинальным, антигипертензивным и антиаритмическим действиями. Уменьшает автоматизм синусового узла, урежает частоту сердечных сокращений, замедляет атриовентрикулярную проводимость, снижает сократимость и возбудимость миокарда, сердечный выброс и потребность миокарда в кислороде. Препарат применяют при артериальной гипертензии умеренной и средней тяжести (монотерапия или в сочетании с другими гипотензивными средствами), ИБС, нарушении сердечного ритма (синусовая тахикардия, желудочковая и суправентрикулярная аритмия, тахикардия, экстрасистолия, трепетание и мерцание предсердий, предсердная тахикардия), мигрень (профилактика) - внутрь, с едой или сразу после еды. Таблетки можно делить пополам, но не разжевывать и запивать жидкостью. При артериальной гипертензии средняя доза - 100-150 мг/сут в 1-2 приема, при необходимости - 200 мг/сут. При стенокардии - 50 мг 2-3 раза в сутки. При гиперкинетическом кардиальном синдроме (в т.ч. при тиреотоксикозе) - 50 мг 1-2 раза в сутки. При тахиаритмии - 50 мг 2-3 раза в сутки, при необходимости - 200-300 мг/сут.

Форма выпуска: таблетки по 50 и 100 мг; таблетки ретард по 200 мг; 1% раствор в ампулах по 5 мл.

Резерпин - симпатолитик растительного происхождения, блокирует симпатическую иннервацию органов путем ограничения выхода медиатора из окончаний симпатических нервов - оказывает гипотензивное и седативное действие, вызывает гипотермию и некоторое замедление процесса обмена веществ, потенцирует действие снотворных и анальгетиков. Применяют при гипертонической болезни, психических заболеваниях сосудистого происхождения, психозах, протекающих на фоне повышенного артериального давления. Назначают резерпин внутрь в виде таблеток (после еды). Дозы и длительность лечения подбирают индивидуально. При артериальной гипертензии (подъеме артериального давления) в ранних стадиях назначают резерпин обычно по 0,05-0,1 мг 2-3 раза в день. В одних случаях достаточно продолжать применение препарата в этих дозах, в других - дозу постепенно увеличивают. Обычно во избежание депрессии

(состояния подавленности) ограничиваются суточной дозой 0,5 мг, однако при хорошей переносимости ее увеличивают до 1 мг. Если в течение 10-14 дней гипотензивный эффект не наступит, препарат отменяют. По достижении эффекта дозу постепенно понижают до 0,5-0,2-0,1 мг в сутки. Лечение малыми (поддерживающими) дозами проводят длительно (курсами по 2-3 мес., при необходимости 3-4 раза в год) под наблюдением врача. При психических заболеваниях резерпин принимают внутрь в первый день от 0,25 до 2 мг, затем дозу повышают до 10-15 мг в сутки. При неврозах назначают в малых дозах, начиная с 0,25 мг 2-3 раза в день до 0,5 мг 3-4 раза в день

Форма выпуска: таблетки по 0,1 мг и 0,25 мг; ампулы по 1 мл 0,1% и 0,25% раствора.

Обзидан - β-адреноблокатор - действующее вещество – пропранолол - антиаритмическое, гипотензивное, антиангинальное, ослабляет влияние симпатической импульсации на сердце, уменьшая частоту и силу сердечных сокращений, величину сердечного выброса и потребность миокарда в кислороде. Применяют при стенокардии напряжения, прогрессирующей стенокардии, безболевой ишемии миокарда, артериальной гипертензии и аритмии. Применяют при гипертензии - по 40 мг 2 раза в день. При необходимости дозу можно увеличивать в течение 2-4 нед до 80-160 мг 2 раза в день. При стенокардии, мигрени, эссенциальном треморе - по 20 мг 2-3 раза в день. Дозу можно увеличить в течение 1 нед до 40 мг 4 раза в день или до 80 мг 2-3 раза в день.

Форма выпуска: 1 таблетка содержит пропранолола гидрохлорида 40 мг; 1 ампула с 5 мл раствора для инъекций - 5 мг;

Фентоламин - α-адреноблокатор - синтетическое соединение, одно из основных представителей современных α-адреноблокаторов с неизбирательным действием, влияя одновременно на постсинаптические α- и пресинаптические α-адренорецепторы. Основанием к применению фентоламина, так же как и других α-адреноблокаторов как лекарственного средства, является блокирующее влияние на передачу адренергических сосудосуживающих импульсов, что приводит к снятию спазма сосудов и расширению периферических сосудов, особенно артериол и прекапилляров, улучшению кровоснабжения мышц, кожи, слизистых оболочек; происходит также понижение артериального давления. Применяют фентоламин при расстройствах периферического кровообращения (болезнь Рейно, эндартериит, акроцианоз, начальные стадии атеросклеротической гангрены), при лечении трофических язв конечностей, вялозаживающих ран, пролежней, отморожений. Имеются указания, что фентоламин и другие α-адреноблокаторы (пирроксан) усиливают секрецию инсулина, вследствие чего они могут быть полезными у больных сахарным диабетом с повышенной секрецией адреналина. 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; ампулы по 1 мл, содержащие 10 мг препарата.

Доксазозин – α-адреноблокатор - оказывает вазодилатирующее (сосудорасширяющее) действие путем селективной и конкурентной блокады постсинаптических α-адренорецепторов. В отличие от неселективных α-адреноблокирующих средств, при длительном применении доксазозина привыкания (уменьшения или отсутствия эффекта при повторном применении) не наступает. Применяют при артериальной гипертензии как в

качестве монотерапии, так и в комбинации с другими лекарственными средствами. Дозы препарата устанавливаются индивидуально. Лечебная доза препарата колеблется от 0,001 до 0,016 г/сут, средняя составляет 0,002-0,004 г/сут и принимается однократно в течение дня. В течение первых 1-2-х недель препарат назначают в начальной дозе 0,001 г/сут. Затем доза может быть увеличена до 0,002 г/сут еще на две недели, при необходимости, в зависимости от уровня артериального давления, суточную дозу можно постепенно (с такими же интервалами) увеличить до 0,004-0,016 г.

Форма выпуска: таблетки, содержащие 1, 2, 4 и 8 мг доксазозина.

Лабеталол α - и β -адреноблокатор - относится к “гибридным” адреноблокаторам, блокирующим одновременно β - и α -адренорецепторы. Сочетание β -адреноблокирующего и периферического вазодилаторного (расширяющего сосуды) действия обеспечивает надежный антигипертензивный эффект. Препарат существенно не влияет на величину сердечного выброса и частоту сердечных сокращений. Применяют лабеталол для снижения артериального давления при гипертензии разной степени. В отличие от обычных β -адреноблокаторов он оказывает быстрый антигипертензивный эффект. 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. 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.

Форма выпуска: таблетки по 0,1 и 0,2 г (100 и 200 мг; 1% раствор для инъекций в ампулах по 5 мл (50 мг в ампуле).

Пирроксан – α -адреноблокатор - влияет как на периферические, так и на центральные адренореактивные системы организма. Применяют при гипертонических кризах и других проявлениях заболеваний промежуточного мозга, проявляющихся вегетососудистыми и метаболическими расстройствами. Для купирования гипертонических кризов рекомендуется ввести под кожу или внутримышечно 2-3 мл 1% раствора, а для профилактики кризов назначать по 1-2 таблетки (0,015-0,03 г) внутрь 2-3 раза в день.

Форма выпуска: таблетки по 0,015 г; 1 % раствор в ампулах по 1 мл.

Корнам - α -адреноблокатор - селективно блокирует α_1 -адренорецепторы гладкой мускулатуры вен и артериол, капсулы предстательной железы, шейки мочевого пузыря и верхних отделов уретры. Ингибирует вазоконстрикцию, уменьшает ОПСС и венозный возврат, понижает АД. Не вызывает толерантности или рефлекторной тахикардии. Применяют для симптоматического лечения доброкачественной гиперплазии предстательной железы; монотерапии артериальной гипертензии слабой и умеренной степени, лечения в комбинации с другими антигипертензивными средствами тяжелых форм гипертензии. Назначают внутрь 1 раз в сутки, перед сном. При доброкачественной гиперплазии предстательной железы начальная доза составляет 1 мг/сут, с постепенным увеличением до 2, 5 и 10 мг/сут до достижения оптимального эффекта. При гипертензии - начальная доза 1 мг, затем ее постепенно увеличивают, добиваясь стабилизации АД.

Форма выпуска: 1 таблетка содержит terazолина в виде моногидрохлорида дигидрата 2 или 5 мг.

Талинолол – β -адреноблокатор кардиоселективный (избирательно влияющий на β -адренорецепторы сердца). Обладает гипотензивным действием, не вызывая ортостатической гипотензии (падения артериального давления при переходе из горизонтального в вертикальное положение). Применяют при стенокардии, остром инфаркте миокарда, вторичной профилактике инфаркта миокарда внутрь, начиная с 0,05 г (1 драже) 3 раза в день (перед едой) При необходимости увеличивают дозу до 2 драже 3 раза в день. При тяжелой нестабильной стенокардии вводят внутривенно медленно 10 мг. При недостаточном эффекте через 10 мин введение препарата можно повторить в этой же дозе. У этих больных можно также применять талинолол в виде внутривенного капельного вливания в общей дозе 30-60 мг на 200 мл изотонического раствора натрия хлорида в течение 24 часов. При остром инфаркте миокарда назначают с первых суток заболевания - внутривенно 10-20 мг/час; суммарная доза до 50 мг. Во второй день - внутривенно в дозе 50% от дозы первых суток. Можно назначать препарат per os в суточной дозе 100-200 мг (до 300 мг). Для вторичной профилактики инфаркта миокарда 100-200 мг per os в 1 или 2 приема. Начинать лечение можно только по рекомендации врача.

Форма выпуска: драже по 0,005 и 0,1 г (50 и 100 мг); ампулы по 5 мл, содержащие 10 мг препарата.

Октадин - симпатолитик (блокирует симпатическую иннервацию органов путем ограничения выхода медиатора из окончаний симпатических нервов). Симпатолитическое действие октадина обусловлено тем, что он избирательно накапливается в гранулах симпатических нервных окончаний и вытесняет из них адренергический медиатор - норадреналин. Часть высвободившегося медиатора достигает постсинаптических α -адренорецепторов и оказывает кратковременное прессорное (повышающее артериальное давление) действие, однако основная часть медиатора подвергается разрушению. В результате истощения запасов норадреналина в адренергических окончаниях ослабляется или прекращается передача в них нервного возбуждения. Применяют октадин как антигипертензивное средство: при правильном подборе доз может вызывать понижение артериального давления у больных гипертонией в разных стадиях, включая тяжелые формы с высоким и стойким подъемом давления. Препарат применим также при глаукоме (повышенное внутриглазное давление). Для лечения гипертонической болезни октадин назначают внутрь в виде таблеток. Дозы следует подбирать индивидуально в зависимости от стадии заболевания, общего состояния больного, переносимости препарата и т. п. Начинают с малой дозы - 0,01-0,0125 г (10-12,5 мг) 1 раз в день, затем дозу постепенно повышают обычно еженедельно на 10-12,5 мг (до 0,05-0,075 г в день). Суточную дозу принимают в 1 прием (утром). После достижения терапевтического эффекта подбирают индивидуально поддерживающую дозу. Лечение проводят длительно.

Форма выпуска: Порошок; таблетки по 0,025 г (25 мг).

Теразозин – α -адреноблокатор – гипотензивный препарат - расширяет артериальные и венозные сосуды, уменьшает общее периферическое сопротивление (сопротивление сосудов току крови). Применяют при артериальной гипертонии, аденоме (доброкачественная опухоль) предстательной железы. Доза препарата устанавливается индивидуально в каждом конкретном случае. Обычно препарат оказывается эффективным в суточной дозе 1-5 мг в 1-2 приема. При лечении аденомы предстательной железы доза

теразозина должна увеличиваться постепенно до достижения желаемого клинического эффекта. Обычно рекомендуется доза 5-10 мг в сутки. Необходимо проводить контроль суточного диуреза в процессе терапии данным препаратом. Эффект симптоматического (облегчающего течение заболевания без существенного влияния на основную причину его возникновения) лечения отмечается по крайней мере через две недели после начала лечения. Улучшение диуреза может наблюдаться несколько позднее.

Форма выпуска: таблетки по 0,001 г (белого цвета), 0,002 г (оранжевого цвета), по 0,005 г (светлокоричневого цвета) и по 0,01 г (зеленого цвета).

Атенолол – β -адреноблокатор - препарат уже в небольших дозах способен блокировать β -адренорецепторы сердца. Оказывает гипотензивный эффект относительно систолического и диастолического давления, снижая 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. Применяется у взрослых для лечения таких патологий сердечно-сосудистой системы как: ишемическая болезнь сердца; стенокардия напряжения, стенокардия покоя, нестабильная стенокардия, артериальная гипертензия, гипертоническая болезнь, в том числе гипертонический криз. Таблетки рекомендуется принимать перед приемом пищи, глотать, 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. Поддерживающая доза обычно составляет 25 мг в сутки однократно, однако может быть увеличена лечащим врачом.

Форма выпуска: Таблетки по 25, 50 или 100 мг действующего вещества.

Небиволол - селективный блокатор β_1 -адренорецепторов - лекарственный препарат, обладающий антигипертензивным действием. Препарат проявляет свойства селективного конкурентного блокатора β_1 -адренорецепторов, а также не влияет на α -адренорецепторы. Невиволол способствует снижению частоты сердечных сокращений, уменьшает показатели артериального давления в состоянии покоя и при физических нагрузках независимо от исходного уровня артериального давления. При продолжительной терапии гипотензивное действие небиволола не изменяется. Невиволол применяют для терапии пациентов с эссенциальной формой артериальной гипертензии а также препарат может быть назначен в комплексной терапии пациентов пожилого возраста, страдающих стабильной хронической сердечной недостаточностью средней степени тяжести. Невиволол принимают перорально, независимо от приема пищи. Рекомендуется принимать препарат в одно и то же время суток. Суточную дозу небиволола, как правило, назначают на 1 прием. Продолжительность терапии, а также дозы небиволола определяет врач. Взрослым при эссенциальной форме артериальной гипертензии, как правило,

рекомендуется прием 5 мг небиволола в сутки. Если спустя 4 недели после начала терапии препаратом небиволол контроль артериального давления недостаточен, назначают дополнительную терапию, в том числе рекомендуется назначение сочетанного приема небиволола в стандартной суточной дозе и гидрохлоротиазида в суточной дозе 12,5-25 мг.

Карведилол - неселективный блокатор β -адренорецепторов - является также селективным блокатором α -рецепторов. Снижает общую предсердечную нагрузку за счет избирательного блокирования α -адренорецепторов. Применяется при артериальной гипертензии (монотерапия или в сочетании с другими гипотензивными препаратами), стенокардии, хронической сердечно-сосудистой недостаточности. Карведилол принимается внутрь, независимо от приема еды. В случае, если у больного сердечно-сосудистая недостаточность, рекомендуется употреблять препарат во время приема пищи (для увеличения абсорбции, что уменьшает риск развития ортостатической гипотензии). При артериальной гипертензии рекомендуют режим применения – 1-2 р/сутки. Для взрослых начальная доза – 12,5 мг/сутки первые 1-2 дня. Поддерживающая дозировка составляет 25 мг/сутки. При стабильной стенокардии: в течение первых 1-2 дней для взрослых рекомендованная дозировка составляет 25 мг/сутки, разделенная на 2 приема. Поддерживающая дозировка – 50 мг/сутки (по 25 мг на прием). При хронической сердечно-сосудистой недостаточности карведилол назначают в качестве вспомогательного средства к традиционному лечению ингибиторами ангиотензин-превращающего фактора, диуретиками, препаратами группы наперстянки и вазодилататорами. Для приема препарата требуется стабильное состояние больного на протяжении последних 4 недель до перехода на лечение с использованием карведилола. Другими важными условиями назначения препарата являются частота сердечных сокращений не больше 50 ударов в минуту, систолическое артериальное давление более 85 мм рт.ст. Стартовая доза – 6,25 мг однократно в сутки. В случае хорошей переносимости дозу можно постепенно повысить с интервалом 14 дней (не менее!) по схеме: 6,25 мг 2 раза в сутки - 12,5 мг 2 р/с - 25 мг 2 р/сутки. Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, по 12,5 и 25 мг.

Талинолол (Корданум) - селективный блокатор β -адренорецепторов – коронароактивное, противогипертоническое и антиаритмическое средство. Применяют перорально 2 раза в сутки. При легких формах заболеваний препарат достаточно принимать один раз в сутки. Драже Корданума всегда принимают за 0,5-1 час до еды, не разжевывая и запивая небольшим количеством жидкости. Парентеральное введение осуществляют путем медленного внутривенного струйного вливания в течение 3-5 минут или путем внутривенной капельной инфузии.

Форма выпуска: ампулы 10 мг талинолола по 5 мл, драже 50 мг и 100 мг

Индерал (Пропранолол) - β -адреноблокатор - неселективный β -адреноблокатор. Обладает антиангинальным, гипотензивным и антиаритмическим эффектом. Применяют при артериальной гипертензии, стенокардии напряжения, синусовой тахикардии (в т.ч. при тиреотоксикозе), инфаркте миокарда (систолическое АД более 100 мм рт.ст.), алкогольной абстиненции, тревожности, мигрени (профилактика приступов). Применяют при артериальной гипертензии - внутрь, по 40 мг 2 раза в сутки. При недостаточной выраженности гипотензивного эффекта дозу увеличивают до 40 мг 3 раза или по 80 мг 2

раза в сутки. При стенокардии, нарушениях сердечного ритма - в начальной дозе 20 мг 3 раза в сутки, затем дозу постепенно увеличивают до 80-120 мг за 2-3 приема.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой, 40 мг.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ
(с обоснованием правильных ответов)
по вышеобозначенным темам учебной дисциплины «фармакология».

Средства, влияющие на афферентную инервацию.

1. Какой местный анестетик лучше приобрести в аптеке для обезболивания при экстракции зуба?
- A. * Лидокаин
 - B. Дикаин
 - C. Анестезин
 - D. Совкаин
 - E. Кокаин

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных препаратов наиболее рациональным выбором является – лидокаин, который проявляет сильное местно-анестезирующее действие и применяется в качестве местного анестетика в стоматологии, в том числе при экстракции зубов.

2. Больному с нарушением сердечного ритма ввели лидокаин. Каким фармакологическим эффектом, помимо местноанестезирующего, обладает этот препарат?
- A. * Антиаритмический
 - B. Снотворный
 - C. Жаропонижающий
 - D. Антидепрессивный
 - E. Ноотропный

Обоснование правильного ответа: Лекарственное средство лидокаин, кроме местно-анестезирующего действия проявляет также антиаритмический эффект и применяется в качестве антиаритмического средства.

3. Напомните своему коллеге провизору как называется явление, при котором один препарат ослабляет действие второго?
- A. * Антагонизм
 - B. Привыкание
 - C. Сенсibilизация
 - D. Потенцирование
 - E. Тахифилаксия

Обоснование правильного ответа: Явление, при котором один лекарственный препарат ослабляет действие другого, называется - лекарственный антагонизм.

4. К Вам, провизору больничной аптеки, обратился врач с просьбой порекомендовать местный анестетик для проведения инфильтрационной анестезии пациенту с нарушением сердечного ритма. Какой препарат Вы выберете?
- A. * Лидокаин
 - B. Анестезин
 - C. Ультракаин
 - D. Новокаин
 - E. Кокаин

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных средств, лекарственный препарат лидокаин относится к группе местно-анестезирующих

средств, обладающий выраженными противоаритмическими свойствами. Применяется, том числе, при лечении сердечной аритмии.

5. Для продления и усиления местноанестезирующей активности лидокаина, а также для уменьшения вероятности кровотечения во время манипуляции удаления зуба, врач-стоматолог применил препарат из группы адреномиметиков. Назовите этот препарат:

- A. * Адреналина гидрохлорид
- B. Прозерин
- C. Сальбутамол
- D. Добутамин
- E. Анаприлин

Обоснование правильного ответа: Для продления местноанестезирующего действия лидокаина, а также уменьшения вероятности кровотечения, данный препарат применяют в сочетании с раствором адреналина гидрохлорида (0,1%), 1 капля раствора на 5-10 мл. лидокаина.

6. При проведении местной анестезии к раствору новокаина добавляется раствор адреналина гидрохлорида. С какой целью это проводится?

- A. * Для сужения сосудов
- B. Для расширения сосудов
- C. Для понижения тонуса гладкой мускулатуры
- D. Для повышения тонуса гладкой мускулатуры
- E. Для уменьшения болевой чувствительности

Обоснование правильного ответа: Для продления местноанестезирующего действия новокаина данный препарат применяют в сочетании с раствором адреналина гидрохлорида. Адреналина г/х проявляет сосудосуживающий эффект, пролонгирует действие препарата, уменьшает токсичность но ослабляет местно-анестезирующий эффект. Применяют разведение 0,1% раствор адреналина на 100 мл анестезирующего раствора.

7. На фоне приёма алкоголя у больного, который получает аминазин для лечения психоза, возникло резкое угнетение центральной нервной системы. С чем это может быть связано?

- A. * Потенцирование эффектов
- B. Привыкание
- C. Аллергия
- D. Тератогенное действие
- E. Идиосинкразия

Обоснование правильного ответа: В данном случае имеет место потенцирование эффектов аминазина и алкоголя. Явление, при котором действие одного препарата (вещества) усиливает действие другого называется - потенцированием эффектов. При этом одновременное применение веществ значительно превышает по силе действие простую сумму эффектов от действия каждого препарата (вещества) по отдельности..

8. Для продления и усиления местноанестезирующей активности новокаина, а также для уменьшения вероятности кровотечения во время проведения операции удаления зуба, врач-стоматолог применил препарат из группы адреномиметиков. Назовите этот препарат:

- A. * Адреналина гидрохлорид
- B. Сальбутамол

- С. Изадрин
- Д. Анаприлин
- Е. Прозерин

Обоснование правильного ответа: Для продления местноанестезирующего действия новокаина данный препарат применяют в сочетании с раствором адреналина гидрохлорида. Адреналина г/х пролонгирует действие препарата, уменьшает вероятность возникновения кровотечения, уменьшает токсичность но ослабляет местно-анестезирующий эффект новокаина. Применяют разведение 0,1% раствор адреналина на 100 мл анестезирующего раствора.

М и Н холиномиметики и холинолитические средства. Антихолинэстеразные средства

9. В приемное отделение доставлен больной с жалобами на сухость во рту, фотофобию и нарушение зрения. Кожа гиперемированная, сухая, зрачки расширены, тахикардия. Был установленный диагноз: отравление алкалоидами красавки. Какой из лекарственных средств целесообразно применить?

- А. * Прозерин
- В. Ацеклидин
- С. Пилокарпин
- Д. Армин
- Е. Дипироксим

Обоснование правильного ответа: В данном случае препаратом выбора будет – прозерин. Прозерин – синтетическое антихолинэстеразное вещество, является антагонистом и антидотом при отравлении миорелаксантами, мышечной слабости и угнетении дыхания.

10. При проведении оперативного вмешательства в качестве миорелаксанта был применен тубокурарину хлорид. Какой препарат-антагонист следует ввести больному для возобновления его самостоятельного дыхания?

- А. * Прозерин
- В. Дитилин
- С. Цититон
- Д. Етимизол
- Е. Бензогексоний

Обоснование правильного ответа: Препарат выбора будет – прозерин. Прозерин – синтетическое антихолинэстеразное вещество, является антагонистом и антидотом при отравлении миорелаксантами, мышечной слабости и угнетении дыхания, в том числе в качестве лекарственного средства экстренной помощи.

11. В больницу доставлен ребенок с признаками отравления алкалоидами белладонны. Какой препарат необходимо применить в качестве антидота?

- А. * Прозерин
- В. Магния сульфат
- С. Кофеин бензоат натрия
- Д. Парацетамол
- Е. Натрия вальпроат

Обоснование правильного ответа: При отравлении алкалоидами белладонны в качестве антидота наиболее рационально применение лекарственного препарата – прозерина. Прозерин является антихолинэстеразным средством, а также антагонистом миорелаксантов и курареподобных средств. Прозерин применяется при миастении и, как антидот, при отравлении миорелаксантами.

12. У пожилого больного развилась послеоперационная атония кишечника. Какой антихолинэстеразный препарат показан ему?

- A. * Прозерин
- B. Дитилин
- C. Пилокарпина гидрохлорид
- D. Атропина сульфат
- E. Метопролол

Обоснование правильного ответа: При послеоперационной атонии кишечника показан лекарственного препарат – прозерин, обладающий выраженной антихолинэстеразной активностью (является антихолинэстеразным средством), прозерин является антагонистом и антидотом при отравлении миорелаксантами, мышечной слабости и угнетении дыхания, в том числе применяется в качестве лекарственного средства в послеоперационный период, при послеоперационной атонии кишечника и мочевого пузыря.

13. Выберите на аптечном складе для хирургического отделения антихолинэстеразное средство обратного действия для назначения больным в послеоперационном периоде с атонией кишечника и мочевого пузыря

- A. * Прозерин
- B. Фосфакол
- C. Бензогексоний
- D. Атропина сульфат
- E. Дитилин

Обоснование правильного ответа: При послеоперационной атонии кишечника показан лекарственного препарат – прозерин, обладающий выраженной антихолинэстеразной активностью (является антихолинэстеразным средством), прозерин является антагонистом и антидотом при отравлении миорелаксантами, мышечной слабости и угнетении дыхания, в том числе применяется в качестве лекарственного средства в послеоперационном периоде, при атонии кишечника и мочевого пузыря.

14. Больному с глаукомой врач назначил прозерин в виде глазных капель. К какой фармакологической группе относится этот препарат?

- A. * Антихолинэстеразный обратимого действия
- B. М-холиноблокатор
- C. Н-холиномиметик
- D. Альфа-адреноблокатор
- E. Бета-адреномиметик

Обоснование правильного ответа: Лекарственное средство прозерин относится к антихолинэстеразным средствам обратимого действия (обратимый ингибитор холинэстеразы).

15. У больного после операции возникла атония кишечника. Проконсультируйте врача, какой препарат необходимо назначить.

- A. * Прозерин
- B. Армии
- C. Платифиллин
- D. Атропин
- E. Лобелии

Обоснование правильного ответа: При атонии кишечника препаратом выбора является прозерин. Прозерин применяют при миастении (мышечной слабости) парезах, для профилактики и лечения атонии (потере тонуса) желудка, кишечника, мочевого пузыря.

16. Перед проведением оперативного вмешательства больному ввели препарат из группы антидеполяризующих миорелаксантов - тубокурарин. Какие лекарственные средства можно использовать в случае его передозировки?

- A. * Антихолинэстеразные средства обратимого действия
- B. Ганглиоблокаторы
- C. М-холиноблокаторы
- D. Адреномиметики
- E. М-холиномиметики

Обоснование правильного ответа: При передозировке миорелаксантов применяются лекарственные препараты из группы антихолинэстеразных средств обратимого действия (физостигмин, галантамин, прозерин). Данные средства (прозерин) применяют в качестве антидотов при отравлении миорелаксантами.

17. Перед проведением оперативного вмешательства больному ввели препарат из группы антидеполяризующих миорелаксантов. Какие лекарственные средства можно использовать в случае его передозировки?

- A. * Антихолинэстеразные средства обратимого действия
- B. Ганглиоблокаторы
- C. Адреномиметики
- D. М-холиноблокаторы
- E. М-холиномиметики

Обоснование правильного ответа: В качестве антидота при передозировке миорелаксантов применяют антихолинэстеразные средства обратимого действия (обратимые ингибиторы холинэстеразы), например прозерин, который применяют при мышечной миастении, парезах, атонии кишечника и в качестве антидота при отравлении миорелаксантами (средств, расслабляющих мышцы) .

18. У пожилого больного развилась послеоперационная атония кишечника. Какой антихолинэстеразный препарат показан в данном случае?

- A. * Прозерин

- В. Пилокарпина гидрохлорид
- С. Дитилин
- Д. Атропина сульфат
- Е. Метопролол

Обоснование правильного ответа: При послеоперационной атонии кишечника применяют лекарственный препарат из группы антихолинэстеразных средств обратимого действия – прозерин. Прозерин - применяют при мышечной миастении, парезах, атонии кишечника и в качестве антидота при отравлении миорелаксантами (средств, расслабляющих мышцы) .

19. В больницу доставлен ребёнок с признаками отравления атропина сульфатом. Какой препарат необходимо применить в качестве антидота?
- А. * Прозерин
 - В. Кальция хлорид
 - С. Парацетамол
 - Д. Магния сульфат
 - Е. Натрия вальпроат

Обоснование правильного ответа: При отравление атропина сульфатом и (алкалоидами белладонны) в качестве антидота наиболее рационально применение лекарственного препарата – прозерина. Прозерин является антихолинэстеразным средством, а также антагонистом миорелаксантов и курареподобных препаратов. Прозерин применяется при миостении и как антидот при отравлении миорелаксантами.

20. При проведении оперативного вмешательства был использован миорелаксant тубокурарина хлорид. Какое средство-антагонист следует ввести больному для восстановления у него самостоятельного дыхания?
- А. * Прозерин
 - В. Дитилин
 - С. Цититон
 - Д. Бензогексоний
 - Е. Этимизол

Обоснование правильного ответа: В данном случае препарат выбора – прозерин. Лекарственное средство прозерин является антихолинэстеразным средством, а также антагонистом миорелаксантов и курареподобных препаратов.

М холиномиметики, М холинолитики, М холиноблокаторы, миорелаксанты, аденолитики. симпатолитики.

21. Ребенок случайно выпил из флакона раствор, который ее бабушка использовала для лечение глаукомы. Оказалось, что это был пилокарпина гидрохлорид. Какое лекарственное средство следует применить в качестве антидота?
- А. * Атропин
 - В. Карбахолин
 - С. Ацеклидин
 - Д. Бензогексоний

Е. Пентамин

Обоснование правильного ответа: Препаратом выбора будет – атропин. Атропин относится к группе м-холиноблокаторов, является антагонистом и эффективным антидотом при отравлении м-холиномиметиками, к которым относится пилокарпина гидрохлорид.

22. Назовите наиболее типичный симптом отравления атропином.

- А. * Расширения зрачков, которые не реагируют на свет.
- В. Сужения зрачков, которые не реагируют на свет.
- С. Повышено потовыделение.
- Д. Брадикардия.
- Е. Снижения внутриглазного давления.

Обоснование правильного ответа: Характерным признаком, свидетельствующем о применении лекарственного препарата - атропина является расширение зрачков, которые на протяжении относительно длительного времени остаются в максимально расширенном состоянии, не реагируют на изменение освещения (не сужаются). Данный эффект атропина применяют в офтальмологии для целей диагностики (исследования глазного дна).

23. Посоветуйте больному глаукомой средство из группы М-холиномиметиков.

- А. * Пилокарпина гидрохлорид
- В. Эфедрина гидрохлорид
- С. Сульфацил натрия
- Д. Атропину сульфат
- Е. Левомецетин

Обоснование правильного ответа: Из перечисленных лекарственных препаратов, средством из группы м-холиномиметиков, оказывающим миотическое и противоглаукомное действие является – пилокарпина гидрохлорид. Данный препарат применяется при лечении глаукомы, асбсцесса роговицы, кровоизлияния в стекловидное тело.

24. Для лечения глаукомы врач решил назначить больному холиномиметическое средство прямого действия. Какой это препарат?

- А. * Пилокарпина гидрохлорид
- В. Цинка сульфат
- С. Сульфацил натрия
- Д. Платифиллина гидротартрат
- Е. Атропину сульфат

Обоснование правильного ответа: Из перечисленных лекарственных препаратов, средством из группы м-холиномиметиков, оказывающим миотическое и противоглаукомное действие является – пилокарпина гидрохлорид. Данный препарат применяется при лечении глаукомы, асбсцесса роговицы, кровоизлияния в стекловидное тело.

25. В межбольничную аптеку поступил заказ от хирургического отделения на получение препарата из группы миорелаксантов депполяризующего типа действия, для проведения хирургических вмешательств. Какой препарат был заказан?

- A. * Дитилин
- B. Никотин
- C. Атропину сульфат
- D. Метацин
- E. Гигроний

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе миорелаксантов депполяризующего типа относится лекарственный препарат – дитилин. Дитилин – курареподобный (расслабляющий мышцы) лекарственный препарат, применяется при хирургических вмешательствах.

26. Больному с почечной коликой в комплексную терапию назначен спазмолитик из группы м-холиноблокаторов.

- A. * Атропин
- B. Прозерин
- C. Галантамин
- D. Дитилин
- E. Бензогексоний

Обоснование правильного ответа: К спазмолитикам из группы м-холиноблокаторов, из перечисленных препаратов, относится – атропин (атропина сульфат). Данный препарат может применяться при комплексной терапии почечной колики.

27. Какой из холинотропных лекарственных средств применяют при глаукоме для снижения внутриглазного давления?

- A. * Пилокарпин
- B. Атропин
- C. Платифиллин
- D. Скополамин
- E. Метацин

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных препаратов для снижения внутриглазного давления при глаукоме применяется лекарственное средство - пилокарпин. Лекарственный препарат пилокарпина гидрохлорид относится к группе м-холиномиметиков, оказывает миотическое и противоглаукомное действие.

28. Больному с глаукомой врач назначил пилокарпина гидрохлорид для понижения внутриглазного давления. К какой фармакологической группе принадлежит этот препарат?

- A. * М-холиномиметики
- B. Бета -адреноблокаторы
- C. Альфа -адреноблокаторы
- D. Симпатолитики
- E. Ганглиоблокаторы

Обоснование правильного ответа: Лекарственный препарат пилокарпина гидрохлорид относится к группе М-холиномиметиков, оказывает миотическое и противоглаукомное действие, а также повышает секрецию пищеварительных, бронхиальных и потовых желез, тонус гладких мышц бронхов, кишечника, мочевого пузыря.

29. У врача-стоматолога возникла необходимость в уменьшении саливации у больного в период операции. Препарат какой фармакологической группы врач использовал для этого?

- A. * М-холиноблокаторы
- B. Адреноблокаторы
- C. М-холиномиметики
- D. М,Н-холиномиметики
- E. Адреномиметики

Обоснование правильного ответа: Процесс саливации – секреция слюны слюнными железами, расположенными в полости рта. Для уменьшения саливации применяют лекарственные препараты из группы м-холиноблокаторов (атропин, платифилин, платифиллина гидротартрат, бускопан, гастрил и пр.), которые, в том числе, снижают секрецию пищеварительных (слюнных) желез.

30. Для исследования глазного дна необходимо расширить зрачок. Какой препарат для этого используется в клинике?

- A. * Атропина сульфат
- B. Пирензепин
- C. Анаприлин
- D. Прозерин
- E. Пилокарпина гидрохлорид

Обоснование правильного ответа: Для исследования глазного дна используется лекарственный препарат атропина сульфат, который вызывает стойкое расширение зрачков, что связано с расслаблением волокон радужной оболочки глаза инициирующейся парасимпатическими волокнами.

31. М-холиноблокаторы имеют весьма широкое применение в современной практической медицине. В каком случае М-холиноблокаторы противопоказаны?

- A. *Атония кишечника
- B. Язвенная болезнь желудка
- C. Бронхиальная астма
- D. Печёночная колика
- E. Почечная колика

Обоснование правильного ответа: М – холиноблокаторы оказывают спазмолитическое действие, за счет чего снижается моторика и тонус гладкой мускулатуры желудка и кишечника, также снижается секреция желудочного сока. Данные препараты не применяются при атонии кишечника, поскольку усиливают явление атонии.

32. В межбольничную аптеку поступил заказ от хирургического отделения на получение препарата из группы миорелаксантов деполяризующего действия для проведения хирургических вмешательств. Какой препарат был заказан?

- A. * Дитилин
- B. Метацин
- C. Гигроний
- D. Никотин
- E. Атропина сульфат

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных препаратов - лекарственным средством относящимся к группе миорелаксантов является – дитилин. Дитилин – курареподобный (расслабляющий мышцы) препарат деполяризующего действия.

33. Больной 40-ка лет страдает бронхиальной астмой и нарушением сердечного ритма в виде брадиаритмии. Препараты какой фармакологической группы целесообразно назначить для устранения бронхоспазма?

- A. * М-холиноблокаторы
- B. Антихолинэстеразные средства
- C. Миорелаксанты
- D. Бета-адреноблокаторы
- E. М-холиномиметики

Обоснование правильного ответа: Для устранения бронхоспазма сопряженного с нарушением сердечного ритма и брадикардией показаны лекарственные препараты из группы м-холиноблокаторов. Препараты этой группы вызывают расширение бронхов, что способствует отделению густой и вязкой мокроты, вместе с тем оказывают влияние на сердце, вызывая тахикардию и повышение артериального давления.

34. М-холиноблокаторы имеют весьма широкое применение в современной практической медицине. В каком случае М-холиноблокаторы противопоказаны?

- A. * Атония кишечника
- B. Почечная колика
- C. Печёночная колика
- D. Бронхиальная астма
- E. Язвенная болезнь желудка

Обоснование правильного ответа: М – холиноблокаторы оказывают спазмолитическое действие, за счет чего снижается моторика и тонус гладкой мускулатуры желудка и кишечника, снижается секреция желудочного сока. Данные препараты не применяются при атонии кишечника, поскольку усиливают явление атонии.

35. В межбольничную аптеку поступил заказ от хирургического отделения на получение препарата из группы миорелаксантов деполяризующего действия для проведения хирургических вмешательств. Какой препарат был заказан?

- A. * Дитилин
- B. Метацин

- C. Атропина сульфат
- D. Никотин
- E. Гигроний

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе миорелаксантов депполяризующего типа относится лекарственный препарат – дитилин. Дитилин – курареподобный (расслабляющий мышцы) лекарственный препарат, применяется в данном качестве при хирургических вмешательствах.

36. У больного в связи с обострением мочекаменной болезни возникла почечная колика. Какой препарат необходимо ввести для устранения колики?
- A. * Дротаверина гидрохлорид
 - B. Силибор
 - C. Альмагель
 - D. Этимизол
 - E. Прозерин

Обоснование правильного ответа: Для купирования почечной колики, из перечисленных лекарственных препаратов, целесообразно применить лекарственное средство дротаверина гидрохлорид, который является миотропным спазмолитиком. Данный препарат снижает тонус гладких мышц внутренних органов и перистальтику кишечника, применяется для профилактики и лечения спазмов гладкой мускулатуры, в том числе почечной колики, желчной колики, кишечной колики и пр..

37. Больному с глаукомой врач назначил пилокарпина гидрохлорид для понижения внутриглазного давления. К какой фармакологической группе принадлежит этот препарат?
- A. * М-холиномиметики
 - B. Бета-адреноблокаторы
 - C. Альфа-адреноблокаторы
 - D. Симпатолитики
 - E. Ганглиоблокаторы

Обоснование правильного ответа: Лекарственный препарат пилокарпина гидрохлорид относится к группе М-холиномиметиков, оказывает миотическое и противоглаукомное действие, а также повышает секрецию пищеварительных, бронхиальных и потовых желез, тонус гладких мышц бронхов, кишечника, мочевого пузыря.

38. Больной 40-ка лет страдает бронхиальной астмой и нарушением сердечного ритма в виде брадиаритмии. Препараты какой фармакологической группы целесообразно назначить для устранения бронхоспазма?
- A. * М-холиноблокаторы
 - B. Н-адреноблокаторы
 - C. Антихолинэстеразные средства
 - D. М-холиномиметики
 - E. Миорелаксанты

Обоснование правильного ответа: Для устранения бронхоспазма сопряженного с нарушением сердечного ритма и брадикардией показаны лекарственные препараты из группы м-холиноблокаторов. Препараты этой группы вызывают расширение бронхов, что способствует отделению густой и вязкой мокроты. Вместе с тем м-холиноблокаторы оказывают влияние на сердце, вызывая тахикардию и повышение артериального давления.

Адреномиметики, адреноблокаторы

39. Для исследования глазного дна больному закапали в конъюнктивальную щель мидриатик, который не нарушает аккомодацию. Определите препарат:

- A. * Адреналина гидрохлорид
- B. Кислота борная
- C. Левомецетин
- D. Сульфацил-натрий
- E. Цинка сульфат

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных лекарственных средств, препаратом выбора может быть адреналина гидрохлорид. Адреналина гидрохлорид, в том числе, обладает свойством расширять зрачки, способствует снижению продукции внутриглазной жидкости и внутриглазного давления, не нарушая при этом аккомодации.

40. Для продления и усиления местноанестезирующей активности новокаина, а также для уменьшения вероятности кровотечения во время проведения операции удаления зуба, врач-стоматолог применил препарат из группы адреномиметиков. Назовите этот препарат:

- A. * Адреналина гидрохлорид
- B. Сальбутамол
- C. Изадрин
- D. Анаприлин
- E. Прозерин

Обоснование правильного ответа: Для продления местноанестезирующего действия новокаина данный препарат применяют в сочетании с раствором адреналина гидрохлорида. Адреналина г/х пролонгирует действие препарата, уменьшает вероятность возникновения кровотечения, уменьшает токсичность но ослабляет местно-анестезирующий эффект новокаина. Применяют разведение 0,1% раствор адреналина на 100 мл анестезирующего раствора.

41. У больного остановилось сердце в результате травмы грудной клетки. Какой из перечисленных препаратов входит в комплекс реанимационных мероприятий (для внутрисердечного введения)?

- A. * Адреналин
- B. Эфедрин
- C. Изадрин
- D. Норадреналин
- E. Мезатон

Обоснование правильного ответа: При внезапной остановке сердца лекарственным препаратом экстренной помощи является адреналин (адреналина гидрохлорид), который может применяться, в том числе, в виде внутрисердечных инъекций.

42. Пациенту с ишемической болезнью сердца врач назначил препарат из группы бета-1-адреноблокаторов. Укажите этот препарат.

- A * Метопролол
- B Морфин
- C Дроперидол
- D Сальбутамол
- E Бензилпеницилину натриевая соль

Обоснование правильного ответа: Метопролол относится к группе лекарственных средств, блокирующих преимущественно бета-1-адренорецепторы сердца (кардиоселективные).

43. Вы - провизор-интерн. Выберите правильный ответ о фармакологических эффектах метопролола.

- A * Антиангинальный, гипотензивный;
- B Слабительное, сосудорасширяющее;
- C кардиотоническое, снотворное;
- D Антиагрегантный, жаропонижающее;
- E Противоаллергический, противовоспалительное.

Обоснование правильного ответа: Метопролол относится к группе лекарственных средств, блокирующих преимущественно бета-1-адренорецепторы сердца (кардиоселективные).

Блокируя бета-1-адренорецепторы, снижает сократимость миокарда, подавляет автоматизм, замедляет предсердно-желудочковую проводимость, ослабляет возбудимость. Ослабляется реакция сердца на физическую нагрузку и другие факторы, стимулирующие симпатическую нервную систему.

Метопролол, как и все бета-адреноблокаторы, снижает потребность миокарда в кислороде и повышает переносимость физических нагрузок у больных, страдающих стенокардией.

Снижая частоту сердечных сокращений, а также понижая потребление кислорода миокардом, бета-адреноблокаторы, и метопролол в частности, снижают насосную функцию сердца, его работу. Снижение насосной функции сердца, сердечного выброса приводит к тому, что метопролол вызывает снижение АД.

44. Врач назначил пациенту лекарственный препарат метопролол, который помог уменьшить повышенное артериальное давление. К какой фармакологической группе относится это средство?

- A * Бета-адреноблокаторы
- B Альфа-адреноблокаторы
- C М-холинолитики
- D Н-холинолитики
- E Сипматолитики

Обоснование правильного ответа: Метопролол относится к группе лекарственных средств, блокирующих преимущественно бета-1-адренорецепторы сердца (кардиоселективные).

45. Укажите препарат, принадлежащий к неселективным бета-адреноблокаторам.

- A * Анаприлин
- B Метопролол
- C Адреналина гидрохлорид
- D Прозерин
- E Атропин

Обоснование правильного ответа: Анаприлин является β -адреноблокатором, действующим как на β_1 -, так и на β_2 -адренорецепторы (неизбирательного действия).

46. Посоветуйте больному средство для лечения приступов тахикардии.

- A * Анаприлин
- B Адреналин
- C Атропин
- D Кофеин-натрия бензоат
- E Добутамин

Обоснование правильного ответа: Анаприлин - является β -блокатором действующим как β_1 - так и β_2 -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.

47. Назовите препарат, снижающий частоту и силу сердечных сокращений

- A * Анаприлин
- B Амлодипин
- C Атропина сульфат
- D Добутамин
- E Адреналина гидрохлорид

Обоснование правильного ответа: Анаприлин - является β -блокатором действующим как β_1 - так и β_2 -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.

48. Вследствие травмы грудной клетки у мужчины остановилось сердце. Указать препарат, который вводят в полость левого желудочка в такой ситуации.

- A * Адреналина гидрохлорид
- B Сальбутамол
- C Лизиноприл
- D Прозерин
- E Метопролол

Обоснование правильного ответа: При внезапной остановке сердца лекарственным препаратом экстренной помощи является адреналин (адреналина гидрохлорид), который может применяться, в том числе, в виде внутрисердечных инъекций.

49. Больному с острой сердечной недостаточностью было назначено средство из группы адреномиметиков. Какой препарат назначил врач?

A * Добутамин

B Дигоксин

C Коргликон

D Метопролол

E Сальбутамол

Обоснование правильного ответа: Среди перечисленных препаратов добутамин является представителем избирательных стимуляторов β -адренорецепторов.

Дигоксин и коргликон – препараты сердечных гликозидов.

Метопролол – селективный блокатор бета-1-адренорецепторов.

Сальбутамол – бета-2-адренореномиметик.