

МИНИСТЕРСТВО НАУКИ И ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ РОССИЙСКОЙ
ФЕДЕРАЦИИ

ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ
ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ОБРАЗОВАНИЯ

СЕВЕРО-КАВКАЗСКАЯ ГОСУДАРСТВЕННАЯ АКАДЕМИЯ

СРЕДНЕПРОФЕССИОНАЛЬНЫЙ КОЛЛЕДЖ

МДК 01.04 Лекарствоведение с основами фармакологии
Практикум для обучающихся специальности
33.02.01 Фармация

Рассмотрено и утверждено
на заседании ЦК «Социально-правовые дисциплины»
Протокол № 1 от «31» 08 2023 г.
Председатель ЦК Е.В. Батракова Е.В. Батракова

Черкесск
2023

Авторы:

Кипкеева Ф.И. – преподаватель ФГБОУ ВО «СевКавГА»

Батчаева А.Х. – преподаватель ФГБОУ ВО «СевКавГА»

Содержание

Методические указания по выполнению практических работ

Рекомендации по решению задач

Требования, предъявляемые к выполнению и оформлению практической работы

Перечень практических работ

Методические указания по выполнению практических работ

Целью практической работы является оказание практической помощи студентам в изучении дисциплины и сдаче экзаменационного зачета по МДК 01.04 «Лекарствоведение с основами фармакологии»

Практикум для подготовки к занятиям по фармакологии предназначен студентам фармацевтических институтов и фармацевтических факультетов медицинских вузов.

По объему информации и структуре курса методичка соответствует программе по фармакологии для студентов фармацевтических факультетов, утвержденной Министерством здравоохранения РФ.

Практикум в виде рабочей тетради предусматривает не только запоминание и воспроизведение учебного материала, но и использование полученной информации для выполнения практических заданий.

Кроме того, практикум такого рода способствует ориентировке обучающегося в информационном потоке (выполнение предлагаемых заданий позволяет студенту выбрать из учебника наиболее принципиальные сведения).

Поставленные в практических работах темы соответствуют вопросам, которые содержатся в экзаменационных билетах по МДК 01.04 Лекарствоведение с основами фармакологии.

В работе задействованы задачи, тестовые задания, как наиболее эффективная форма контроля и самоконтроля полученных знаний по соответствующим темам учебного курса.

Рекомендации по решению задач

В соответствии с планом изучения курса МДК 01.04 «Лекарствоведение с основами фармакологии» студенты на основе изученного теоритического материала должны решать задачи – это должно развить навыки работы с Фармакопеей XIV.

Решение каждой задачи должно начинаться с внимательного ознакомления с ее содержанием. Необходимо уяснить ее смысл и условия, исходя из которых, нужно дать ответы на поставленные вопросы. Ответы требуют, как правило, верного решения. В задачах нередко ставится вопрос о фармакологическом действии препарата. Ответ не должен быть односложным – «да» или «нет». Студент должен грамотно ответить на поставленный вопрос.

При решении задач студентам рекомендовано работать с Фармакопеей XIV.

Требования, предъявляемые к выполнению и оформлению практической работы

1 Практическая работа должна охватывать теоретические вопросы и их практическую реализацию.

2. Подобранные к теме материалы должны быть творчески переработаны и связаны с исследуемой проблемой.

3. Практическая работа должна быть грамотно изложена и оформлена в соответствии с принятыми стандартами.

4. Практическая работа выполняется на стандартных листах бумаги хорошего качества (формата А4). Текст пишется только на одной стороне листа. Объем работы составляет не менее 10 страниц.

5. Практическая работа сшивается слева. Соблюдаются размеры поля: левое 20-35 мм, правое 10 мм, верхнее 15-20 мм, нижнее 10-20 мм.

6. Практическая работа начинается с титульного листа, который оформляется в соответствии с приложением 2. На второй странице излагается содержание работы.

7. Нумерация работы начинается с 3 страницы, страницы нумеруются арабскими цифрами в правом верхнем углу или по центру без тира, точки, сокращенных слов с., стр.

Перечень практических работ

по дисциплине: МДК 01.04 «Лекарствоведение с основами фармакологии»
для специальности: 33.02.01 «Фармация»

Наименование разделов	Тема практической работы
Раздел I Общая фармакология	Практическая работа №1 Тема 1.1 Ведение. Общая рецептура
	Практическая работа №2 Тема 1.1 Ведение. Общая рецептура
	Практическая работа №3 Тема 1.2 Общая фармакология
	Практическая работа №4 Тема 1.2 Общая фармакология
Раздел II Частная фармакология Лекарственные препараты, влияющие на периферическую нервную систему.	Практическая работа №5 Тема 2.1 Лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему Местные анестетики. Вяжущие, обволакивающие
	Практическая работа №6 Тема 2.1 Лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему. Адсорбирующие, раздражающие лекарственные препараты
	Практическая работа №7 Тема 2.2 Лекарственные препараты, влияющие на эфферентную нервную систему. Холиномиметики, холинолитики
	Практическая работа №8 Тема 2.2 Лекарственные препараты, влияющие на эфферентную нервную систему. Адреномиметики, адренолитики.
Раздел III Лекарственные препараты, влияющие на центральную нервную систему.	Практическая работа №9 Тема 3.1 Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Средства для наркоза. Снотворные средства.
	Практическая работа №10 Тема 3.1 Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Противосудорожные средства.
	Практическая работа №11

	<p>Тема 3.1 Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Анальгетики.</p> <p>Практическая работа №12</p> <p>Тема 3.1 Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Психотропные средства</p> <p>Практическая работа №13</p> <p>Тема 3.1 Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Психотропные средства</p>
	<p>Практическая работа №14</p> <p>Тема 3.2 Лекарственные препараты, возбуждающие центральную нервную систему. (ЦНС). Средства, возбуждающие ЦНС</p> <p>Практическая работа №15</p> <p>Тема 3.2 Лекарственные препараты, возбуждающие центральную нервную систему. (ЦНС). Средства, возбуждающие ЦНС</p>
<p>Раздел IV Лекарственные средства, влияющие на функцию исполнительных органов.</p>	<p>Практическая работа №16</p> <p>Тема 4.1 Лекарственные препараты, регулирующие водно-солевой обмен. Диуретики. Урикозурические средства.</p>
	<p>Практическая работа №17</p> <p>Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Лекарственные средства, регулирующие артериальное давление.</p> <p>Практическая работа №18</p> <p>Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Лекарственные средства, регулирующие артериальное давление.</p> <p>Практическая работа №19</p> <p>Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Антиаритмические средства</p> <p>Практическая работа №20</p> <p>Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Сердечные гликозиды</p> <p>Практическая работа №21</p> <p>Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему.</p>

	<p>систему. Антиангинальные средства.</p> <p>Практическая работа №22 Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Средства, улучшающие мозговое и периферическое кровообращение.</p> <p>Практическая работа №23 Тема 4.2. Лекарственные препараты, влияющие на сердечно-сосудистую систему. Средства для лечения атеросклероза.</p>
	<p>Практическая работа №24 Тема 4.3. Лекарственные препараты, влияющие на функции органов дыхания. Стимуляторы дыхания (Аналептики). Противокашлевые препараты.</p> <p>Практическая работа №25 Тема 4.3 Лекарственные препараты, влияющие на функции органов дыхания. Бронхолитические препараты.</p> <p>Практическая работа №26 Тема 4.3. Лекарственные препараты, влияющие на функции органов дыхания. Отхаркивающие средства. Муколитические препараты.</p> <p>Практическая работа №27 Тема 4.4. Лекарственные препараты, влияющие на функции органов пищеварения. Лекарственные препараты, влияющие на аппетит. Горечи. Лекарственные препараты для заместительной терапии при гипосекреции пищеварительных желез.</p> <p>Практическая работа №28 Тема 4.4. Лекарственные препараты, влияющие на функции органов пищеварения. Антисекреторные препараты Средства для лечения язвенной болезни.</p> <p>Практическая работа №29 Тема 4.4 Лекарственные препараты, влияющие на функции органов пищеварения. Гепатотропные средства.</p> <p>Практическая работа №30 Тема 4.4. Лекарственные препараты,</p>

	<p>влияющие на функции органов пищеварения. Лекарственные средства, влияющие на моторику желудочно-кишечного тракта. Лекарственные средства, нормализующие микрофлору кишечника.</p>
	<p>Практическая работа №31 Тема 4.5. Лекарственные препараты, влияющие на систему крови. Лекарственные препараты, влияющие на свертывание крови.</p>
	<p>Практическая работа №32 Тема 4.5 Лекарственные препараты, влияющие на систему крови. Лекарственные препараты, регулирующие кроветворение</p>
	<p>Практическая работа №33 Тема 4.6. Лекарственные препараты, влияющие на миометрий. Лекарственные препараты, стимулирующие мускулатуру матки. Лекарственные препараты, понижающие сократительную деятельность матки.</p>
<p>Раздел V Лекарственные препараты, регулирующие процессы обмена веществ</p>	<p>Практическая работа №34 Тема 5.1 Лекарственные препараты гормонов, их синтетические заменители и антагонисты. Лекарственные препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза. Лекарственные препараты гормонов щитовидной железы. Антигипертензивные средства. Препараты гормонов паращитовидных желез.</p>
	<p>Практическая работа №35 Тема 5.1 Лекарственные препараты гормонов, их синтетические заменители и антагонисты. Лекарственные препараты гормонов поджелудочной железы. Синтетические противодиабетические препараты.</p>
	<p>Практическая работа №36 Тема 5.1 Лекарственные препараты гормонов, их синтетические заменители и антагонисты. Лекарственные препараты гормонов коры надпочечников. Лекарственные препараты половых гормонов.</p>
	<p>Практическая работа №37</p>

	<p>Тема 5.2 Витамины. Водорастворимые витамины. Жирорастворимые витамины.</p> <p>Практическая работа №38</p> <p>Тема 5.2 Витамины. Витаминно-минеральные комплексы. Биогенные стимуляторы.</p>
<p>Раздел VI Лекарственные препараты для коррекции иммунных реакций</p>	<p>Практическая работа №39</p> <p>Тема 6.1 Противоаллергические лекарственные препараты. Антигистаминные препараты. Стабилизаторы мембран тучных клеток.</p>
	<p>Практическая работа №40</p> <p>Тема 6.2 Иммуномодуляторы и иммунодепрессанты.</p>
<p>Раздел VII Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты.</p>	<p>Практическая работа №41</p> <p>Тема 7.1. Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Антисептики. Дезинфицирующие препараты.</p>
	<p>Практическая работа №42</p> <p>Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Антибиотики группы пенициллинов, цефалоспоринов.</p>
	<p>Практическая работа №43</p> <p>Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Антибиотики группы макролитов, аминогликозидов, тетрациклинов.</p>
	<p>Практическая работа №44</p> <p>Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Сульфаниламиды, синтетические противомикробные препараты.</p>
	<p>Практическая работа №45</p> <p>Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты.</p>

	<p>Противотуберкулезные препараты.</p> <p>Практическая работа №46 Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Противопротозойные препараты, антигельминтные препараты.</p>
	<p>Практическая работа №47 Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Противогрибковые препараты.</p> <p>Практическая работа №48 Тема 7.1 Иммуномодуляторы и Противомикробные, противопаразитарные, противовирусные и противоопухолевые препараты. Противовирусные препараты. Противоопухолевые препараты.</p>

Практическая работа №1

Тема 1.1. Ведение. Общая рецептура

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- охарактеризовать основные понятия и термины лекарственная форма, лекарственное средство фармацевтическая субстанция, вспомогательное вещество, международное непатентованное наименование лекарства, фирменное (торговое) наименование лекарства, оригинальное лекарственное средство, генерическое лекарственное средство

- перечислить элементы структуры рецептами обсудить правила выписки рецептов и проверки рецептурных прописей

- охарактеризовать твердые лекарственные формы: порошки, таблетки, драже и капсулы, растворы для внутреннего применения, слизи, эмульсии, суспензии, сборы, настои, отвары, настойки, экстракты, микстуры, лекарственные формы для инъекций.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаль.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: общая рецептура, рецепт, лекарственная форма, лекарственное средство порошок, таблетка дженерик, фармакология, драже, фармакотерапия, галеновые препараты, международное непатентованное наименование.

Задание №2 Совместите единицы массы с их обозначениями, принятыми в рецептурных прописях. Произведите расчеты и ответьте на следующие вопросы.

Задание №3 Составьте рецептурные прописи в соответствии с нижеприведенными условиями.

Задание №4 Проведите анализ врачебных рецептов.

Задание №5 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: общая рецептура, рецепт, лекарственная форма, лекарственное средство, порошок, таблетка, дженерик, фармакология, драже, фармакотерапия, галеновые препараты, международное непатентованное наименование.

Задание №1 Дайте определение следующих понятий и терминов:

общая рецептура _____

рецепт _____

лекарственная форма _____

лекарственное средство _____

порошок _____

таблетка _____

дженерик _____

фармакология _____

драже _____

фармакотерапия _____

галеновые препараты _____

международное непатентованное _____

наименование _____

Задание 2 Совместите единицы массы с их обозначениями, принятыми в рецептурных прописях. Произведите расчеты и ответьте на следующие вопросы.

1. Совместите единицы массы с их обозначениями, принятыми в рецептурных прописях.

5	мг	0,0005
5	г	0,005
500	мг	0,05
50	мг	0,5
0,5	мг	5,0

2. Произведите расчеты и ответьте на следующие вопросы.

1. Какое количество действующего вещества содержится в 1 столовой ложке 10% раствора кальция хлорида (1,5 г; 150 мг; 15 мг)?

2. Какое количество действующего вещества содержится в 1 мл 0,05% раствора неостигмина (0,5 г; 0,5 мг; 5 мг)?

3. Какой концентрации должен быть раствор, чтобы за один прием (1 столовая ложка) больной получал 150 мг натрия бромиды?

4. Какой процентной концентрации соответствует указанная в рецепте концентрация 3,6-180 ml?

Задание №3 Составьте рецептурные прописи в соответствии с нижеприведенными условиями

1) 10 мл 0,05% раствора нафазолина (Naphazolinum). По 2 капли в каждый носовой ход 3 раза в день.

2) 100 мл 1% спиртового раствора кислоты салициловой (Acidum salicylicum). Для обработки пораженных участков кожи.

3) 180 мл настоя из 0,45 г травы термопсиса (herba Thermopsisidis,). По 1 столовой ложке 3 раза в день внутрь после еды.

4) 15 мл настойки полыни (Absinthium). По 10 капель внутрь за 5 мин до еды. Предварительно развести в половине стакана воды.

5) 40 г 10% мази индометацина (Indometacinum). Наносить на область сустава 2 раза в сутки.

6) 6 свечей с ихтиолом (Ichthyolum) по 200 мг. По 1 свече 2 раза в день.

7) 6 свечей «Бетиол» («Bethyolum»). По 1 свече 2 раза в день.

8) 20 таблеток пропранолола (Propranololum) по 40 мг. По 1 таблетке 3 раза в день внутрь.

9) 20 таблеток «Аугментин» («Augmentin»). По 1 таблетке 4 раза в сутки внутрь.

10) 6 ампул, содержащих по 1 мл 2,5% раствора хлорпромазина (Chlorpromazinum). По 1 мл внутримышечно.

11) Аэрозоль «Вентолин» («Ventolinum»). По 1 ингаляции для купирования приступа удушья.

12) 100 драже пролонгированного действия, содержащих по 100 мг ортофена (Ortophenum) Назначать внутрь по 1 драже 1 раз в сутки, не разжевывая.

Задание №4 Проведите анализ врачебных рецептов

1.Какая из прописей жидкого экстракта алоэ верна и почему неверны две

другие?

*Rp.: Extracti Aloe 100 ml
D.S. По 1 чайной ложке
3 раза в день внутрь
до еды.*

*Rp.: Extracti Aloe sicci 100 ml
D.S. По 1 чайной ложке
3 раза в день.*

*Rp.: Extracti Aloe fluidi 100 ml
D.S. По 1 чайной ложке
3 раза в день внутрь
до еды.*

2.Какая из прописей мази преднизолона верна и почему неверны две другие?

*Rp.: Unguenti Prednisoloni 0,5%
D.S. Наносить на по-
раженные участки
кожи.*

*Rp.: Prednisoloni 0,5% — 15,0
D.S. Наносить на по-
раженные участки
кожи.*

*Rp.: Unguenti Prednisoloni
0,5% — 15,0
D.S. Наносить на по-
раженные участки
кожи.*

3.Какая из прописей суппозиторий «Неоанузол» верна и почему неверны две

другие?

*Rp.: Suppositoria Neoanusoli
N. 6
D.S. По 1 свече при боли.*

*Rp.: «Neoanusolum»
D.t.d. N. 6 in suppositoria
S. По 1 свече при боли.*

*Rp.: Suppositoria
«Neoanusolum» N. 6
D.S. По 1 свече при боли.*

4.Какая из прописей таблеток ибупрофена неверна и почему?

*Rp.: Ibuprofeni 0,2
D.t.d. N. 10 in tabulettis
S. По 1 таблетке внутрь
при боли.*

*Rp.: Tabulettam Ibuprofeni 0,2
D.t.d. N. 10
S. По 1 таблетке внутрь
при боли.*

*Rp.: Tabulettam Ibuprofeni 0,2
D.t.d. N. 10 in tabulettis
S. По 1 таблетке внутрь
при боли.*

5.Какая из прописей таблеток «Ко-тримоксазол» верна и почему неверны две другие?

*Rp.: Tabulettae
«Cotrimoxazolium»
S. По 1 таблетке внутрь
2 раза в сутки.*

*Rp.: Tabulettas
«Cotrimoxazolium» N. 6
S. По 1 таблетке внутрь
2 раза в сутки.*

*Rp.: Tabulettam Cotrimoxazoli
D.t.d. N. 6
S. По 1 таблетке внутрь
2 раза в сутки.*

6. Укажите, в каких формах заводской стерильной упаковки выписаны следующие лекарственные формы для инъекций. Укажите, какой вариант прописи неверен и почему.

*Rp.: Solutionis Dimoestrolis
oleosae 0,06% — 1 ml
D.t.d. N. 6 in ampullis
S. Вводит по 1 мл под
кожу.*

*Rp.: Gentamycini sulfatis
4% — 2 ml
D.t.d. N. 10 in ampullis
S. По 2 мл внутримы-
шечно.*

*Rp.: Insulini 10 ml
(à 100 ED — 1 ml)
D.t.d. N. 6
S. Вводит под кожу по
16 ЕД.*

Контрольные вопросы:

- 1.Что изучает фармакология?
- 2.Из каких разделов состоит фармакология?
- 3.Перечислите виды фармакотерапии.
- 4.Расскажите о принципах классификации лекарственных средств.
- 5.Назовите ученых-фармакологов.
- 6.Что такое лекарственное вещество, лекарственное средство, лекарственный препарат?
- 7.Какое значение рецепта как медицинского, юридического и денежного документов?
- 8.Назовите основные рецептурные сокращения.
- 9.Какие жидкие лекарственные формы вам известны?
- 10.Дайте характеристику твердым лекарственным формам.

Практическая работа №2

Тема 1.1. Ведение. Общая рецептура

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- обсудить правила выписки рецептов и проверки рецептурных прописей лекарственных форм для местного применения;
- охарактеризовать твердые лекарственные формы: линименты, мягкие лекарственные формы: мази, пасты, суппозитории, палочки, пластыри, пленки глазные, аэрозоли, растворы для наружного применения.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаль.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь выучить определение следующих понятий и терминов: раствор, слизь, эмульсия, суспензия, настой, отвар, линимент, паста, пленка глазная, аэрозоль, микстура, инъекционные лекарственные формы, настойка, экстенпоральные лекарственные формы.

Задание №2 Составьте рецептурные прописи в соответствии с нижеприведенными условиями

Задание №3 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь выучить определение следующих понятий и терминов: раствор, слизь, эмульсия, суспензия, настой, отвар, линимент, паста, пленка глазная, аэрозоль, микстура, инъекционные лекарственные формы, настойка, экстемпоральные лекарственные формы.

Задание №1 Дайте определение следующих понятий и терминов

Раствор-

слизь-

эмульсия-

суспензия-

настой-

отвар-

линимент-

паста-

пленка глазная-

аэрозоль-

микстура-

инъекционные лекарственные формы-

настойка-

экстемпоральные лекарственные формы-

Задание №2 Составьте рецептурные прописи в соответствии с нижеприведенными условиями

1) 80,0 сложного официального линимента скипидарного масла (Olei Terebinthinae compositum) Назначать для растирания болезненных участков кожи 3 раза в день.

2) 50,0 геля «Мобилат» («Mobilat») Наносить на больное место 3 раза в день.

3) 10 официальных суппозиторияев, содержащих 0,015 экстракта красавки (Belladonna) Назначить по 1 свече 2 раза в день.

4) 100,0 гранул гастротарма (Gastropharm). Назначать по 1 чайной ложке 3 раза в день за 30 минут до еды.

5) 3 ампулы, содержащие по 5 мл 4 % раствора дофамина (Dopamine)

Назначить в виде внутривенной капельной инфузии на 400 мл изотонического раствора.

6) 10 мл 1% спиртового раствора нитроглицерина (Nitroglycerin) во флаконе. Назначать под язык по 1 мг на сахаре при приступе загрудинной боли.

7) Капли в нос, содержащие 01% раствор галазолина (Halazolinum). Применять 2 раза в день в нос.

8) 10 мл 10% суспензии профезима (Profezim) Для нанесения на рану.

9) 50 мягких желатиновых капсул форте, содержащих 300 мг эссенциале (Essentiale). Назначить внутрь по 2 капсулы 3 раза в день.

Контрольные вопросы:

- 1) Перечислите лекарственные формы для инъекций, которые вы знаете.
- 2) Какие мазевые основы вы знаете?
- 3) Какие правила прописывания твердых лекарственных форм- порошков, таблеток, капсул?
- 4) Какие правила прописывания мягких лекарственных форм-мазей, паст, суппозиториев, линиментов.
- 5) В чем особенности суппозиториев как лекарственной формы?
- 6) Назовите отличия галеновых и новогаленовых препаратов.
- 7) Чем отличается паста от мази?
- 8) Перечислите лекарственные формы для инъекций, которые вы знаете?
- 9) Какие существуют прописи растворов?
- 10) Назовите основные обозначения модифицированных таблеток с пролонгированным действием.

Практическая работа №3

Тема 1.2 Общая фармакология

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- перечислить и охарактеризовать основные этапы движения лекарств в организме.
- оценить относительную скорость переноса через биологическое мембраны лекарств, являющимися слабыми кислотами или основаниями.
- обсудить влияние курения, заболевания печени и почек на элиминацию лекарств.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаля.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: энтеральный путь, парентеральный путь, ингаляция, внутривенное введение, электрофорез, внутримышечное введение, подкожное введение, пассивная диффузия, активный транспорт, фильтрация, пиноцитоз, биотрансформация, экскреция, доза, биоэквивалентность, индукция ферментов, элиминация, клиренс, период полувыведения.

Задание №2 Укажите, какие пути введения относятся к энтеральным, а какие – к парентеральным. Составить таблицу. Таблица 2.1

Таблица 2.2. Сравнительная оценка основных путей введения лекарственных веществ

Путь введения	Пресистемная элиминация (есть, нет)	Лекарственные формы
Внутри		1.
		2.
		3.
		4.
		5. 6.
Под язык		1.
		2.
Ректально		1.
		2.
Внутривенно		1.
Внутримышечно		1.
		2. 3.
Подкожно		1.
		2.
		3.

Примечание. Лекарственные формы выберите из следующего списка: водные растворы, масляные растворы, суспензии, мази, свечи, таблетки, драже, капсулы.

Задание 3 На схеме 2.1 отметьте основные способы проникновения лекарственных веществ через клеточные мембраны.

Схема 2.1. Основные способы проникновения лекарственных веществ через клеточные мембраны: ЛВ - лекарственное вещество

Задание 4 Дайте определения основным параметрам клинической фармакокинетики.

Задания 5 Решите тесты

Задание 6 Ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: энтеральный путь, парентеральный путь, ингаляция, внутривенное введение, электрофорез, внутримышечное введение, подкожное введение, пассивная диффузия, активный транспорт, фильтрация, пиноцитоз, биотрансформация, экскреция, доза, биоэквивалентность, индукция ферментов, элиминация, клиренс, период полувыведения.

Задание 2.1 Укажите, какие пути введения относятся к энтеральным, а какие – к парентеральным (таб 2.1).

Таблица 1. Пути введения лекарственных веществ

Энтеральные	Парентеральные
1.	1.
2.	2.
3.	3.
	4.

Задание 2.2

Дайте сравнительную оценку основных путей введения лекарственных форм (табл. 2.2).

Примечание. Впишите в таблицу следующие пути введения: внутрь, внутривенно, внутримышечно, под язык, ректально, подкожно, под оболочки спинного мозга.

Таблица 2.2. Сравнительная оценка основных путей введения лекарственных веществ

Путь введения	Пресистемная элиминация (есть, нет)	Лекарственные формы
Внутри		1.
		2.
		3.
		4.
		5. 6.
Под язык		1.
		2.
Ректально		1.
		2.
Внутривенно		1.
Внутримышечно		1.
		2. 3.
Подкожно		1.
		2.
		3.

Примечание. Лекарственные формы выберите из следующего списка: водные растворы, масляные растворы, суспензии, мази, свечи, таблетки, драже, капсулы.

Задание 3 На схеме 2.1 отметьте основные способы проникновения лекарственных веществ через клеточные мембраны.

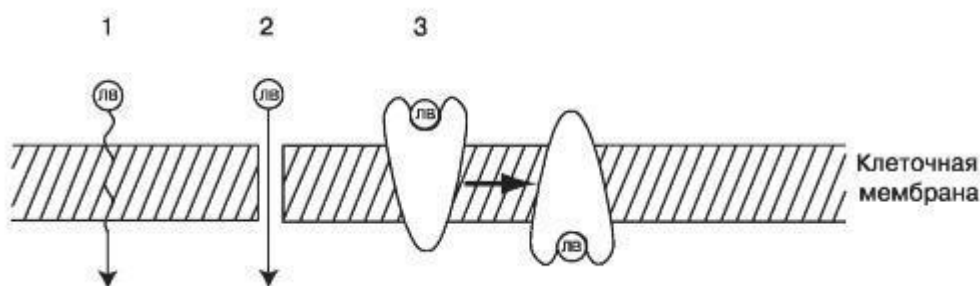


Схема 2.1. Основные способы проникновения лекарственных веществ через клеточные мембраны: ЛВ - лекарственное вещество

Задание 4 Дайте определения основным параметрам клинической фармакокинетики.

Биодоступность (F):

Кажущийся объем распределения (Vd):

Клиренс (Cl):

Константа элиминации (Kel):

Период полуэлиминации ($t_{1/2}$):

Стационарная концентрация (C_{ss}):

Задание 5 Решите тесты

Выберите правильные ответы.

Понятие «фармакокинетика» включает:

- 1) всасывание;
- 2) биотрансформацию
- 3) фармакологические эффекты;
- 4) распределение;
- 5) выведение.

Энтеральные пути введения лекарственных средств:

- 1) внутримышечно
- 2) внутрь
- 3) под язык;
- 4) в прямую кишку.

В вену нельзя вводить:

- 1) масляные растворы;
- 2) эмульсии;
- 3) водные растворы.

Контрольные вопросы

1. Опишите и охарактеризуйте пероральный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

2. Опишите и охарактеризуйте подкожный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

3. Опишите и охарактеризуйте внутримышечный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

4. Опишите и охарактеризуйте внутривенный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

5. Опишите и охарактеризуйте ректальный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

6. Опишите и охарактеризуйте сублингвальный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.

7. Опишите и охарактеризуйте ингаляционный путь введения лекарственных средств по следующим параметрам: достоинства и недостатки этого пути введения, скорость развития эффекта после введения лекарства, путь, который должно проделать лекарственное средство до поступления к органу-мишени.
8. Перечислите энтеральные и парентеральные пути введения лекарственных средств.

Практическая работа №4

Тема 1.2 Общая фармакология. Фармакодинамика. Фармакокинетика.

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- перечислить и обсудить основные этапы формирования фармакологического эффекта;
- привести примеры биологических субстратов, при связывании с которыми лекарство индуцирует фармакологический эффект;
- перечислить и охарактеризовать основные типы рецепторов;
- привести определение понятий, характеризующих взаимодействие лекарственных веществ с рецепторами: агонист, парциальный агонист
- нарисовать кривые зависимости эффекта от концентрации для лекарств, являющихся агонистами и парциальными агонистами рецепторов;
- охарактеризовать способы градуальной и квантовой оценки эффекта лекарств и обсудить термины и понятия количественной фармакологии - эффект, эффективность, активность, EC_{50} , ED_{50} , TD_{50} , ТИ;
- указать, в чем состоит различие между фармакологическими (конкурентными и необратимыми), физиологическими и химическими антагонистами.
- обсудить возрастные различия в действии лекарств и охарактеризовать причины их обуславливающие; привести способы расчета доз для детей и взрослых.
- обсудить возможные изменения действия лекарств при их повторном введении;
- обсудить возможные изменения действия лекарств при их комбинированном применении;
- перечислить основные виды нежелательного действия лекарств;
- охарактеризовать основные принципы терапии острых отравлений лекарственными средствами.
- Биотрансформация лекарственных веществ в организме. Несинтетические и синтетические реакции метаболизма лекарств. Роль микросомальных ферментов печени. Внепеченочный метаболизм лекарственных веществ. Понятие о «пролекарствах». Индивидуальные различия в скорости инактивации лекарств и

причины их обуславливающие.

- Пути выведения лекарств из организма. Механизмы почечной экскреции и факторы, влияющие на выделение веществ с мочой. Циркуляция лекарственных веществ в организме.

- Элиминирование лекарств. Элиминация первого и нулевого порядка. Клиренс как основной показатель элиминирования лекарств. Понятие о периоде полувыведения.

- Обеспечение заданной концентрации лекарства в крови.

- Проблема биоэквивалентности лекарственных средств

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаля.

Порядок выполнения работы:

1. **Задание №1** Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: доза, эффект, рецептор, агонист, фармакологический антагонист, конкурентный антагонист, необратимый антагонист, физиологический антагонист, химический антагонист, EC_{50} , ED_{50} , LD_{50} , эффективность, активность, терапевтический индекс, терапевтическая широта.

2. **Заполнить таблицу** сравнительной характеристики рецепторов клетки.

Вид	Рецептор, связанный с G-белком	Рецептор, связанный с ионным каналом	Рецептор, связанный с ферментом	Цитозольный рецептор
Локализация в клетке				
Примеры рецепторов				
Трансдуктор сигнала рецепторов				

Эффекторная система				
----------------------------	--	--	--	--

Задание №3 Продолжите следующие утверждения.

Задание №4 Решите тест

Задание №5 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: доза, эффект, рецептор, агонист, фармакологический антагонист, конкурентный антагонист, необратимый антагонист, физиологический антагонист, химический антагонист, EC_{50} , ED_{50} , LD_{50} , эффективность, активность, терапевтический индекс, терапевтическая широта.

Задание №2 Заполнить таблицу сравнительной характеристики рецепторов клетки.

Вид	Рецептор, связанный с G-белком	Рецептор, связанный с ионным каналом	Рецептор, связанный с ферментом	Цитозольный рецептор
Локализация в клетке				
Примеры рецепторов				
Трансдуктор сигнала рецепторов				
Эффекторная система				

Задание 3 Продолжите следующие утверждения

Продолжите следующие утверждения.

Под синергизмом понимают

Под антагонизмом понимают

Б. Основными вариантами синергизма являются: 1)

_____ ; 2)

Продолжите следующие утверждения.

Аддитивный эффект - вариант синергизма, при котором

Потенцирование - вариант синергизма, при котором

Дайте определение следующим видам побочного действия.

Тератогенное действие

Эмбриотоксическое действие

Фетотоксическое действие

Задание №4 Решите тест

Выберите правильные ответы.

К понятию «фармакодинамика» относятся:

- 1) механизмы действия;
- 2) виды действия;
- 3) биотрансформация лекарственных веществ
- 4) локализация действия;
- 5) фармакологические эффекты.

При повторном применении лекарственных веществ может наблюдаться:

- 1) антагонизм;
- 2) привыкание
- 3) кумуляция;
- 4) тахифилаксия;
- 5) лекарственная зависимость.

При комбинированном применении лекарственных веществ может наблюдаться

- 1) аддитивный эффект;
- 2) антагонизм;
- 3) привыкание;
- 4) потенцирование.

Если снижение концентрации лекарства подчиняется кинетике первого порядка, это значит, что ...

- 1) Имеется только один путь для выведения лекарства.
- 2) Период полувыведения относительно не зависит от концентрации вещества в плазме.
- 3) Лекарство преимущественно метаболизируется в печени после приема внутрь и имеет низкую биодоступность.
- 4) Скорость элиминации все время пропорциональна скорости введения.
- 5) Лекарство распределено только в крови.

Окончание действия лекарственного средства подразумевает, что ...

- 1) Лекарство должно быть выведено из организма, чтобы его действие прекратилось.
- 2) Метаболизм лекарства всегда приводит к повышению его растворимости в воде.
- 3) Метаболизм лекарства всегда лишает его фармакологической активности.
- 4) Печеночный метаболизм и почечная экскреция - два важнейших механизма, которые вовлечены в этот процесс.
- 5) Распределение лекарства во внесосудистом пространстве обеспечивает прекращение его действия.

Биодоступность лекарственного средства ...

- 1) Правилами фармакологического комитета МЗ РБ принимается равной 100% для любых препаратов при условии их внутримышечного введения.
- 2) Составляет 100% при оральном введении для препаратов, не метаболизирующихся в печени.
- 3) Эквивалентна содержанию лекарства в организме во время пика концентрации, разделенному на введенную дозу этого лекарства.
- 4) Определяет, какая фракция введенной дозы достигает системного кровотока и скорость с которой это происходит.
- 5) Меньше чем 1 (100%) только у лекарств, которые вводятся внутрь.

1. Для обеспечения бактерицидного действия тобрамицина его уровень в плазме должен быть не менее 4 мг/л (желаемая стационарная концентрация или терапевтически эффективная концентрация). Какую поддерживающую дозу тобрамицина следует назначить каждые 6 часов в виде внутривенной инъекции?

- 1) 0,32 мг
- 2) 115 мг
- 3) 160 мг
- 4) 230 мг
- 5) Ни один из приведенных выше вариантов не верен

Оценив состояние пациента из предыдущего задания, Вы понимаете, что желаемая терапевтическая концентрация тобрамицина должна быть достигнута как можно быстрее. Какую нагрузочную дозу Вы назначите для достижения терапевтической концентрации тобрамицина в плазме 4 мг/л?

- 1) 0,1 мг;
- 2) 10 мг;
- 3) 2 мг;
- 4) 160 мг;
- 5) Ни одну из приведенных выше.

Несмотря на тщательное соблюдение основных принципов фармакокинетики у пациента N. во время лечения дигоксином появились первые симптомы интоксикации. При лабораторном исследовании установлено, что уровень дигоксина в плазме составляет 4 нг/мл. Функция почек у пациента нормальная. Как долго следует воздержаться от введения дигоксина данному пациенту, для того чтобы содержание лекарства в плазме достигло бы безопасного терапевтического уровня в 1 нг/мл?

- 1) 1,6 дня;
- 2) 2,4 дня;
- 3) 3,2 дня;
- 4) 4,8 дня;
- 5) 6,4 дня.

Молодой человек был доставлен в приемный покой больницы в глубокой коме. Его друзья сообщили, что он принял большую дозу морфина 6 часов назад. Выполненный анализ крови показал, что уровень морфина составляет в плазме 0,25 мг/л. Располагая справочными сведениями, что фармакокинетика морфина характеризуется следующими параметрами: $V_d=200$ л, период полувыведения 3 часа, определите, какую дозу морфина ввел молодой человек 6 часов назад?

1) 25 мг;

2) 50 мг;

3) 100 мг;

4) 200 мг;

5) Недостаточно данных, чтобы дать заключение

Контрольные вопросы:

1. Какие причины обуславливают индивидуальные различия в действии лекарств? Перечислите важнейшие из них?
2. Чем отличается привыкание от лекарственной зависимости?
3. Что такое кумуляция и чем она опасна?
4. Перечислите явления, которые могут иметь место при комбинированном назначении лекарств.
5. Чем отличается побочное действие от токсического?
6. Перечислите явления, которые могут иметь место при повторном применении лекарств.
7. Чем проявляются синдром «отмены» и синдром «рикошета» («отдачи»)?
8. Приведите примеры лекарств, которые вызывают мутагенное, тератогенное, канцерогенное действие.
9. Приведите определение фармакологии. Назовите основные цели и задачи фармакологии.
10. Перечислите и охарактеризуйте основные механизмы переноса лекарственных веществ через биологические мембраны.
11. Перечислите и охарактеризуйте энтеральные пути введения.
12. Назовите основной механизм всасывания лекарственных веществ при приеме внутрь.
13. Перечислите и охарактеризуйте парентеральные пути введения лекарств.
14. Какие требования предъявляют к лекарственным формам для инъекций?
15. Дайте определение биодоступности. Как оценивают биодоступность?
16. Какие факторы влияют на распределение лекарств?
17. В чем сущность такого параметра фармакокинетики как объем распределения?
18. Приведите примеры белков крови, неспецифически и специфически связывающие лекарственные вещества.

Раздел II

Частная фармакология Лекарственные препараты, влияющие на периферическую нервную систему.

Практическая работа №5

Тема 2.1 Лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему. Местные анестетики. Вяжущие, обволакивающие

Цели работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- Перечислить и разобрать лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему.
- Разобрать действие местных анестетиков.
- Дать определение вяжущим, обволакивающим, лекарственным средствам.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаля.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь Выучить определение следующих понятий и терминов: поверхностная анестезия, инфильтрационная анестезия, проводниковая анестезия, обволакивающие средства, адсорбирующие средства, проводниковая анестезия, спинномозговая анестезия.

Задание №2 Раздражающие средства. Классификация. Механизм действия. Показания к применению.

Задание №3 Дополните классификацию местных анестетиков препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Задание №4 Проведите сравнительный анализ местных анестетиков (табл. 3.1).

Задание №5 Укажите основные показания к применению вяжущих, адсорбирующих и обволакивающих средств.

Задание №6 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение следующих понятий и терминов: поверхностная анестезия, инфильтрационная анестезия, проводниковая анестезия, обволакивающие средства, адсорбирующие средства, проводниковая анестезия, спинномозговая анестезия.

Задание №2 Раздражающие средства. Классификация. Механизм действия. Показания к применению.

А. Местноанестезирующие средства.

Артикаин (ультракаин)
Бензокаин (анестезин)
Бупивакаин

Лидокаин (ксикаин)
Прокаин (новокаин)

Б. Вяжущие, обволакивающие и адсорбирующие средства.

Висмута нитрат основной
Отвар коры дуба
Слизь из крахмала

Тальк
Танин
Уголь активированный

В. Раздражающие средства: Меновазин, Валидол, Пектусин, Горчицы семя, терпентиновое масло, спирт камфорный, Никофлекс, Апизатрон, Финалгон.

Задание №3 Дополните классификацию местных анестетиков препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, применяемые только при поверхностной анестезии:

Средства, применяемые при инфильтрационной и проводниковой анестезии:

- а)
- б)
- в)

Средства, применяемые при всех видах анестезии:

Укажите механизм действия местных анестетиков, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Нарушение входа ионов натрия в нервные клетки, что препятствует деполяризации их мембран.

Блокада натриевых каналов чувствительных нервных окончаний и нервных волокон.

Нарушение генерации и проведения возбуждения по чувствительным нервным волокнам.

Задание №4

Проведите сравнительный анализ местных анестетиков (табл.3.1).

Таблица 3.1. Сравнительная характеристика бензокаина, прокаина, бупивакаина, лидокаина

	Бензокаин	Прокаин	Бупивакаин	Лидокаин
Параметры сравнения	докаин			
Химическая структура (эфир или амид)				
В каких концентрациях применяется для:				
поверхностной анестезии				
проводниковой анестезии				
спинномозговой анестезии				
инфильтрационной анестезии				
Продолжительность действия при инфильтрационной анестезии				

Примечание. Продолжительность действия указывайте при применении препарата без адреналина.

Задание №5

Укажите основные показания к применению вяжущих, адсорбирующих и обволакивающих средств.

1) Отвар коры дуба

2) Раствор танина:

3) Висмута нитрат основной:

4) Слизь из крахмала:

5) Уголь активированный:

Контрольные вопросы:

1. Каков принцип действия местноанестезирующих средств?
2. Почему местноанестезирующие средства могут быть неэффективны при инфильтрационной анестезии во время вскрытия абсцессов и флегмон?
3. Какие средства используют для терминальной анестезии?
4. Чем можно заменить прокаин, если к нему имеется повышенная чувствительность?
5. С какой целью к растворам анестезирующих веществ добавляют эpineфрина гидрохлорид?
6. При отравлении какими ядами для промывания желудка следует использовать активированный уголь, таннин?
7. Каков механизм действия вяжущих средств?
8. Почему горчичники перед применением необходимо смачивать теплой, а не горячей водой.
9. Объясните механизм действия аммиака на дыхание.

Практическая работа №6

Тема 2.1 Лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему. Адсорбирующие, раздрожжающие лекарственные препараты

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- Перечислить и разобрать лекарственные препараты, влияющие на афферентную нервную систему.
- Разобрать действие местных анестетиков.
- Дать определение вяжущим, обволакивающим, лекарственным средствам
- Сические эффекты местных анестетиков;
- Обсудить принцип действия вяжущих, обволакивающих и адсорбирующих средств;
- Описать механизм отвлекающего и трофического эффекта раздражающих средств;
- Выброписать механизм нарушения генерации и проведения нервных импульсов местными анестетиками;
- Обсудить зависимость между pK_A местного анестетика, pH среды и скоростью наступления анестезии;
- Перечислить основные томаты изучаемые лекарственные средства в соответствии с основными показаниями к их применению и корректировать рецептурные прописи.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаль.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Средства действующие на периферическую нервную систему (механизм действия лекарственных препаратов, показания к

применению, способ применения и дозы, побочное действие, противопоказания, форма выпуска) Дикаин, Анестезин, Новокаин, Лидокаин, Мезокаин, кора Дуба, черники плоды, листья шалфея, Де-нол, Алмагель, слизь семян льна, настой корня Алтея, Фосфолюгель, Полифепан, Смекта, Меновазин, Валидол, Пектусин, Горчицы семя, терпентиновое масло, спирт камфорный, Никофлекс, Аписатрон, Финалгон. Сделать таблицу 1.1

Задание №2 Решите тесты.

Задание №3 Проведите анализ врачебных рецептов.

Задание №4 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1

Составить таблицу 1.1 Средства действующие, на периферическую нервную систему (механизм действия лекарственных препаратов, показания к применению, способ применения и дозы, побочное действие, противопоказания, форма выпуска) Дикаин, Анестезин, Новокаин, Лидокаин, Мезокаин, кора Дуба, черники плоды, листья шалфея, Де-нол, Алмагель, слизь семян льна, настой корня Алтея, Фосфолюгель, Полифепан, Смекта, Меновазин, Валидол, Пектусин, Горчицы семя, терпентиновое масло, спирт камфорный, Никофлекс, Аписатрон, Финалгон. (сделать таблицу)

Задание №2 Решите тесты

Выберите правильные ответы.

Местно при ринитах применяют:

- 1) бупивакаин
- 2) слизь из крахмала
- 3) водный раствор аммиака
- 4) масляный раствор ментола

Внутри при метеоризме применяют:

- 1) бензокаин
- 2) отвар коры дуба
- 3) тальк
- 4) уголь активированный

Бензокаин применяют:

- 1) для поверхностной анестезии

2) для инфильтрационной анестезии

3) для блокады нервных сплетений

При всех видах анестезии эффективен:

1) бензокаин;

2) бупивакаин;

3) прокаин;

4) лидокаин.

Наиболее продолжительным действием обладает:

1) артикаин;

2) прокаин;

3) бупивакаин;

4) лидокаин.

В сочетании с адреналином местноанестезирующее действие артикаина:

1) укорачивается;

2) удлиняется;

3) не изменяется.

Задание №3. Проведите анализ врачебных рецептов.

1) Отвар коры дуба.

*Rp.: Decocti Corticis Quercus 1:30
D.S. Для полосканий.*

Ваши замечания

2). Средство при метеоризме.

*Rp.: Tab. Carbonis activati
D.t.d. N. 10
S. Применять внутрь.*

Ваши замечания

Контрольные вопросы:

1) Назовите классификацию средств, действующих на афферентную нервную систему

2) Какие виды местной анестезии вы можете назвать?

3) Перечислите свойства анестезирующего вещества

4) Какие вяжущие средства можно отнести к веществам растительного происхождения?

5) Какие средства используются в качестве обволакивающих и адсорбирующих?

6) С какой целью применяют раздражающие средства?

7) Назовите побочные эффекты и противопоказания средств, влияющих на афферентную нервную систему?

Практическая работа №7

Тема 2.2 Лекарственные препараты, влияющие на эфферентную нервную систему. Холиномиметики, холинолитики

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- нарисовать синапс и охарактеризовать основные этапы синаптической передачи возбуждения;
- описать синтез, высвобождение и утилизацию нейромедиатора ацетилхолина;
- нарисовать схему симпатической, парасимпатической и соматической иннервации и описать эффекты их возбуждения;
- привести классификацию лекарственных веществ, действующих в областях холинергических синапсов;
- перечислить локализацию и типы холинорецепторов в органах и тканях (ЦНС, вегетативные ганглии, глаза, сердце, сосуды, бронхи, ЖКТ, мочепо-ловый тракт, скелетные мышцы, экзокринные железы);
- перечислить группы холиномиметических веществ, назвать их основных представителей;
- охарактеризовать фармакологические свойства прототипов в каждой группе и указать особенности фармакодинамики и фармакокинетики остальных;
- описать фармакодинамические различия между холиномиметиками прямого и косвенного действия;
- перечислить основные показания к применению веществ, возбуждающих холинорецепторы;
- выбрать изучаемые средства в соответствии с их основными показаниями к применению, провести коррекцию врачебных рецептов;
- перечислить основные признаки и симптомы острого отравления никотином и фосфорорганическими соединениями.
- эффекты. Подходы к фармакологической регуляции нейромедиаторных процессов.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после

этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаля.

Порядок выполнения работы:

1. **Задание №1 Поурочный словарь.** Выучить определения основных понятий и терминов: синапс, медиатор, адренорецептор, холинорецептор, адренергический синапс, адренергическое волокно, холинергический синапс, холинергическое волокно, холиномиметик, холиноблокатор, М-холиномиметик, М,Н-холиномиметик, Н-холиномиметик, антихолинэстеразное средство, миоз, спазм аккомодации, атония, миастения, глаукома, фосфорорганические соединения, реактиваторы холинэстеразы. антихолинергические средства, М-холиноблокаторы, ганглиоблокаторы, курареподобные средства, миорелаксанты, мидриаз, паралич аккомодации, антидеполяризирующий миорелаксант, деполяризирующий миорелаксант, ортостатический коллапс.

Задание №2

Составить таблицу, в которой антихолинергические средства разместить в соответствии с их классификацией с указанием их международных названий и основных синонимов, химического строения и форм выпуска.

2.1 Решите задачи:

- Пациенту Б. Для купирования тяжелого гипертонического криза был введен бензогексоний. Давление понизилось и, почувствовав себя лучше, пациент решил позвонить домой, и сообщить о своем состоянии жене. Однако, встав с постели, он внезапно почувствовал резкую слабость и потерял сознание. Какое нежелательное действие бензогексония развилось у пациента? Объясните его механизм. О чем врачу следовало предупредить пациента?
- Объясните, почему индейцы, применяющие стрельный яд кураре для охоты, употребляли отравленных животных в пищу без каких-либо последствий для своего организма?

Задание №3 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

2. **Задание №1 Поурочный словарь.** Выучить определения

основных понятий и терминов: синапс, медиатор, адренорецептор, холинорецептор, адренергический синапс, адренергическое волокно, холинергический синапс, холинергическое волокно, холиномиметик, холиноблокатор, М-холиномиметик, М,Н-холиномиметик, Н-холиномиметик, антихолинэстеразное средство, миоз, спазм аккомодации, атония, миастения, глаукома, фосфорорганические соединения, реактиваторы холинэстеразы. антихолинергические средства, М-холиноблокаторы, ганглиоблокаторы, курареподобные средства, миорелаксанты, мидриаз, паралич аккомодации, антидеполярирующий миорелаксант, деполярирующий миорелаксант, ортостатический коллапс.

Задание №1

1. Нарисовать схему эфферентной иннервации внутренних органов и указать на ней локализацию холино- и адренорецепторов.

Задание №2

2. Нарисовать схему эфферентной иннервации радужки и цилиарной мышцы и отметить на ней локализацию действия пилокарпина.

Задание №3

3. Нарисовать схему эфферентной иннервации скелетной мышцы. Отметить холинергический синапс и локализацию действия антихолинэстеразных средств

Задание №4

4. Заполнить таблицу основных эффектов возбуждения симпатической и парасимпатической иннервации со стороны внутренних органов с указанием типа рецепторов, которые опосредуют данные изменения.

Тип	Локализация	Эффект при возбуждении
Н _Н	1. ганглионарные клетки 2. нейроны ЦНС 3. хромаффинные клетки надпочечника 4. синокаротидная зона	
Н _М	1. клетки скелетных мышц	
М ₁	1. нейроны ЦНС 2. клетки слизистой желудка	
М ₂	1. миокард 2. пресинаптическая мембрана нейрона	
М ₃	1. гладкие мышцы внутренних органов 2. экзокринные железы 3. эндотелий сосудов	

Задание №5

5. Провести коррекцию рецептурных прописей:

1. Пилокарпин для купирования острого приступа глаукомы.
Rp: Ung. Pilocarpini hydrochloridi 2%-5,0
D.S. Закладывать за нижнее веко в пораженный глаз 3 раза в день.

2. М,Н-холиномиметик для лечения послеоперационной атонии кишечника.
Rp: Tab. Neostigmini 0,015 N 20
D.S. По 15 мг 3 раза в день.

3. Антихолинэстеразное средство для лечения глаукомы.
Rp: Sol. Galanthamini hydrobromidi 1%-1 ml
D.t.d. N 2 in amp.
S. Ампулу вскрыть, закапывать по 1-2 капли в оба глаза 3 раза в день.

4. Н-холиномиметик для оказания неотложной помощи при асфиксии новорожденных.
Rp: Sol. Lobelini hydrochloridi 1%-1 ml
D.t.d. N 3 in amp.
S. Ввести внутримышечно 0,5 мл через каждые 15 минут до появления спонтанного дыхания.

5. Лекарственное средство для лечения миастении у молодой женщины, которая работает кассиром в супермаркете.
Rp: Tab. Proserini 0,015 N 10
D.S. Внутрь по 1 таблетке 3 раза в день натощак.

- 6М-холиноблокатор для создания циклоплегии при иридоциклите.
Rp: Sol. Platyphyllini hydrotartratis 2%-5 ml
D.S. Закапывать в больной глаз по 1-2 капли 1 раз в день.

- 7М-холиноблокирующее средство для лечения атриовентрикулярной блокады.
Rp: Sol. Methacini 0,1%-1 ml
D.t.d. N 10 in amp.
S. Вводить подкожно по 1 мл 2 раза в день.

- 8 Средство для купирования тяжелого гипертонического криза с неврологическими нарушениями.
Rp: Sol. Trimetaphani camsilatis 5%-5 ml
D.t.d. N 6 in amp.
S. Содержимое ввести внутривенно медленно

Задание №6

Тестовые задания:

Выберите правильные ответы.

М-холиномиметики:

- 1) неостигмин
- 2) ацеклидин
- 3) армин
- 4) пилокарпин
- 5) донепезил.

Антихолинэстеразные средства вызывают:

- 1) спазм аккомодации
- 2) мидриаз;
- 3) снижение внутриглазного давления;
- 4) облегчение нервно-мышечной передачи;
- 5) повышение тонуса и моторики кишечника.

N-холиномиметики применяют:

- 1) при асфиксии новорожденных;
- 2) при повышении артериального давления;
- 3) при глаукоме.

Антихолинэстеразные препараты применяют:

- 1) при глаукоме;
- 2) при болезни Альцгеймера
- 3) при атонии кишечника;
- 4) при гипертонической болезни.

Обратимо ингибирует ацетилхолинэстеразу. Проникает через гематоэнцефалический барьер. Применяется при атонии кишечника, миастении, остаточных явлениях после перенесенного полиомиелита. При закапывании в глаз может вызвать отек конъюнктивы.

- 1) Неостигмин.
- 2) Цитизин.
- 3) Галантамин
- 4) Пилокарпин.

M-холиноблокаторы:

- 1) атропин;
- 2) скополамин;
- 3) ипратропий;
- 4) тропикамид;
- 5) пирензепин;

б) суксаметоний.

M-холиноблокаторы применяют:

- 1) при коликах;
- 2) при сердечных блоках;
- 3) при бронхоспазмах;
- 4) при глаукоме;
- 5) при подборе очков.

Побочные эффекты атропиноподобных средств:

- 1) сухость во рту
- 2) тахикардия;
- 3) паралич аккомодации;
- 4) светобоязнь;
- 5) диарея.

Ганглиоблокаторы применяют:

- 1) при гипертензивном кризе;
- 2) для управляемой гипотензии;
- 3) при атонии мочевого пузыря.

Неизбирательно блокирует M-холинорецепторы. Применяется в качестве бронхолитика. При ингаляционном введении практически не всасывается в системный кровоток.

- 1) Атропин
- 2) Скополамин.
- 3) Ипратропий
- 4) Тропикамид.
- 5) Пирензепин.

Избирательно блокирует M-холинорецепторы. При приеме внутрь снижает секрецию желез желудка. Применяется при язвенной болезни и гиперацидном гастрите. В меньшей степени, чем атропин, вызывает тахикардию и сухость во рту.

- 1) Скополамин
- 2) Ипратропий.
- 3) Тропикамид.
- 4) Пирензепин.

M-холиноблокатор. Применяется только в офтальмологии. При закапывании в глаз быстро вызывает мидриаз. Действует кратковременно (2-4 ч).

- 1) Атропин.
- 2) Пирензепин.
- 3). Тропикамид
- 4). Ипратропий.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Пилокарпин снижает внутриглазное давление, потому что пилокарпин вызывает миоз.

Пилокарпин снижает внутриглазное давление, потому что пилокарпин вызывает спазм аккомодации.

Донепезил применяют при болезни Альцгеймера, потому что донепезил хорошо проникает в мозг

Проведите анализ врачебных рецептов.

Средство для лечения глаукомы.

*Rp.: Pilocarpini hydrochloridi
1% — 10 ml
D.S. Глазные капли.*

Ваши замечания

Б. Средство при миастении.

*Rp.: Solutionis Neostigmini 0,5% — 1 ml
D.t.d.N. 6
S. Вводить подкожно по 1 мл.*

Ваши замечания

В. Средство при асфиксии новорожденных.

*Rp.: Cytiloni 1 ml
D.t.d.N. 10 in ampullis
S. Вводить внутривенно по 0,3 мл.*

Ваши замечания

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

При передозировке тубокурарина применяют эдрофоний, потому что эдрофоний ослабляет и укорачивает миопаралитическое действие тубокурарина.

При передозировке суксаметония применяют неостигмин, потому что неостигмин ослабляет и укорачивает миопаралитическое действие суксаметония.

Азаметоний вызывает ортостатический коллапс, потому что азаметоний блокирует-холинорецепторы парасимпатических ганглиев.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для купирования гипертензивного криза.

<i>Rp.: Sol. Pentamini 5% D.t.d.N. 6 in amp. S. По 1 мл внутривенно.</i>	Ваши замечания
--	----------------

Б. М-холиноблокатор для лечения язвенной болезни.

<i>Rp.: Pirenzepini 0,025 D.t.d.N. 50 S. По 1 таблетке 3 раза в день после еды.</i>	Ваши замечания
---	----------------

М-холиноблокатор в аэрозоле

<i>Rp.: Aerosolum «Итроп» N. 1 D.S. По 2 ингаляции 4 раза в день.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Контрольные вопросы

1. Перечислите анатомо-морфологические особенности симпатических, парасимпатических и соматических нервных проводников. Нарисуйте их.

2. Перечислите холинергические и адренергические нервные волокна и отметьте их на схеме иннервации внутренних органов.

3. Нарисуйте схему синапса и укажите на ней основные элементы.

4. Опишите основные этапы синаптической передачи.

5. Дайте характеристику холинергической передачи возбуждения в синапсах.

6. Перечислите основные эффекты возбуждения симпатической и парасимпатической иннервации со стороны глаз, бронхов, сердца, ЖКТ, мочевыводящих путей, сосудов кожи, брыжейки, мышц, экзокринных желез и назовите рецепторы, которые участвуют в передаче эфферентных влияний в каждом случае.

7. Перечислите лекарственные вещества, влияющие на периферические холинергические нейромедиаторные процессы в

соответствии с принятой классификацией.

8. Укажите локализацию М-холинорецепторов.
9. Укажите локализацию Н-холинорецепторов.
10. Объясните механизм действия пилокарпина на глаз.
11. Почему пилокарпин в отличие от ацеклидина не применяют для лечения атонии внутренних органов?
12. Каков механизм влияния Н-холиномиметических средств на дыхание и артериальное давление?
13. Каков механизм действия антихолинэстеразных средств?
14. Перечислите показания к применению антихолинэстеразных средств.
15. Каковы симптомы отравления ФОС?
16. Что такое реактиваторы холинэстеразы?
17. Перечислите М-холиноблокаторы.
18. Объясните, почему атропин вызывает расширение зрачка?
19. В чем преимущество пирензепина перед атропином при лечении язвенной болезни желудка?
20. На чем основано применение атропина при лечении иридоциклитов?
21. На чем основано применение М-холиноблокаторов для предупреждения рефлекторной брадикардии?
22. Почему при применении ганглиоблокаторов возможен ортостатический коллапс? Нарисуйте схему барорефлекса.

Практическая работа №8

Тема 2.2 Лекарственные препараты, влияющие на эфферентную нервную систему. Адреномиметики, адренолитики

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- описать влияние фентоламина на гемодинамические эффекты эпинефрина и норэпинефрина;
- провести сравнительную характеристику фармакологических эффектов пропранолола, окспренолола, пиндолола, метопролола, бетаксолола, эсмолола, лабеталола;
- перечислить основные показания к применению а и в адреноблокаторов;
- выбрать адренонегативные средства для конкретных целей фармакотерапии, корректировать рецептурные прописи.

Определение понятия и классификация адренонегативных средств

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике, рекомендованную специальную литературу, относящиеся к данной теме, другие материалы, и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаля.

Порядок выполнения работы:

1. **Задание №1** Поурочный словарь. Выучить определение и значение основных понятий и терминов: адреномиметик, а, в-адреномиметик, а-адреномиметик, в-адреномиметик, симпатомиметик, бронхолитическое средство, коллапс, шок, деконгестивное действие, ринит.

Задание №2

2. Составить таблицу, в которой адреномиметические средства расположить в соответствии с их классификацией с указанием их международных названий и основных синонимов, химического строения и форм выпуска.

Задание №3 Подготовить ответы на контрольные вопросы для контроля знаний при защите практической работы.

Ход выполнения работы:

Задание №1

Заполнить таблицу типов адренорецепторов с указанием их локализации в периферических тканях и основных эффектов их активации.

Тип	Локализация	Эффект при стимуляции
α_1	1. мышца, расширяющая зрачок 2. сосуды	
α_2	1. сосуды 2. пресинаптическая мембрана нейронов	
β_1	1. сердце 2. клетки ЮГА	
β_2	1. бронхи 2. миомерий 3. сосуды 4. печень 5. пресинаптическая мембрана нейронов	
β_3	1. адипоциты (жировая ткань)	

Задание №2

1. Составить таблицу, в которой адrenoблокаторные средства расположить в соответствии с их классификацией с указанием их международных названий и основных синонимов, химического строения и форм выпуска.

Тестовые задания :

Выберите правильные ответы.

При артериальной гипертензии применяют:

- 1) празозин;
- 2) пропранолол;
- 3) йохимбин;
- 4) резерпин.

При доброкачественной гиперплазии предстательной железы для облегчения мочеиспускания применяют:

- 1) резерпин
- 2) тамсулозин;
- 3) тимолол.

Атенолол и пропранолол применяют в качестве:

- 1) антиангинальных средств;
- 2) антигипертензивных средств;
- 3) противоаритмических средств;
- 4) бронхолитических средств.

Адреноблокатор. Расширяет кровеносные сосуды, вызывает длительное (12-ч) снижение артериального давления. Применяется для систематического лечения артериальной гипертензии. В качестве побочных эффектов вызывает рефлекторную тахикардию и ортостатическую гипотензию

Атенолол.

2. Пропранолол.
3. Доксазозин
- . 4. Лабеталол.

А. Адреноблокатор при тахиаритмиях.

Б. Адреноблокатор при открытоугольной глаукоме.

В. Адреноблокатор, расширяющий кровеносные сосуды

М-холиномиметики:

- 1) неостигмин;
- 2) донепезил
- 3) ацеклидин;
- 4) цитизин;
- 5) пилокарпин;
- 6) галантамин.

Н-холиномиметики:

- 1) эдрофоний;
- 2) донепезил
- 3) ацеклидин;
- 4) цитизин;
- 5) галантамин;
- 6) пилокарпин.

Антихолинэстеразные средства:

- 1) неостигмин
- 2) донепезил;
- 3) ацеклидин;
- 4) эдрофоний
- 5) пилокарпин
- 6) физостигмин.

Антихолинэстеразные вещества, легко проникающие в мозг:

- 1) неостигмин;
- 2) донепезил;
- 3) ацеклидин
- 4) галантамин;
- 5) пилокарпин.

При атонии кишечника и мочевого пузыря применяют:

- 1) цитизин;
- 2) неостигмин;
- 3) ацеклидин;
- 4) пилокарпин.

При миастении применяют:

- 1) неостигмин;
- 2) ацеклидин;
- 3) цитизин;
- 4) пилокарпин.

При болезни Альцгеймера применяют:

- 1) цитизин;
- 2) донепезил;
- 3) ацеклидин;
- 4) галантамин
- 5) пилокарпин.

При глаукоме применяют:

- 1) ацеклидин;
- 2) пилокарпин
- 3) галантамин;
- 4) физостигмин;
- 5) цитизин.

При асфиксии новорожденных применяют:

- 1) неостигмин;
- 2) донепезил;
- 3) ацеклидин;
- 4) цитизин;
- 5) пилокарпин.

Побочные эффекты, общие для М-холиномиметиков и антихолинэстеразных средств:

- 1) Бронхоспазм.
- 2). Спазм кишечника.
- 3). Повышение тонуса скелетных мышц.
- 4). Спазм аккомодации.

М-холиноблокаторы:

- 1) атропин;

- 2) атракурий;
- 3) ипратропий;
- 4) азаметоний;
- 5) пирензепин.

К селективным М-холиноблокаторам относится:

- 1) атропин;
- 2) скополамин
- 3) ипратропий;
- 4) тропикамид;
- 5) пирензепин.

Ганглиоблокаторы:

- 1) азаметоний;
- 2) ипратропий;
- 3) триметафан;
- 4) суксаметоний;
- 5) векуроний.

Миорелаксанты периферического действия:

- 1) азаметоний;
- 2) атракурий;
- 3) триметафан;
- 4) суксаметоний;
- 5) векуроний.

Для купирования печеночной и кишечной колики, при язвенной болезни и гиперацидном гастрите, а также в качестве бронхолитиков применяют:

- 1) атропин;
- 2) ипратропий
- 3) скополамин;
- 4) тропикамид
- 5) пирензепин.

Только при язвенной болезни и гиперацидном гастрите

применяют:

- 1) атропин
- 2) ипратропий;
- 3) скополамин;
- 4) тропиками;
- 5) пирензепин.

Только в качестве бронхолитика применяют:

- 1) атропин;
- 2) ипратропий;
- 3) скополамин;
- 4) тропикамид;
- 5) пирензепин.

Только местно в офтальмологии применяют:

- 1) атропин.
- 2) ипратропий
- 3) гоматропин
- 4) тропикамид;
- 5) пирензепин.

Побочные эффекты атропиноподобных средств:

- 1) Нарушения зрения.
- 2). Брадикардия
- 3). Сухость слизистых оболочек.
- 4). Обстипация.
- 5). Задержка мочеиспускания.

Атропиноподобные средства противопоказаны:

- 1) при бронхиальной астме;
- 2) при глаукоме
- 3) при язвенной болезни;
- 4) при аденоме предстательной железы.

В наименьшей степени нарушения зрения, тахикардию, сухость слизистых оболочек, констипацию и задержку мочеиспускания вызывают:

- 1) атропин;
- 2) ипратропий;
- 3) скополамин;
- 4) пирензепин.

Для купирования гипертензивного криза применяют:

- 1) азаметоний;
- 2) суксаметоний;
- 3) векуроний;
- 4) атракурий.

Для управляемой гипотензии применяют:

- 1) азаметоний

- 2) суксаметоний;
- 3) триметафан;
- 4) векуроний;
- 5) атракурий.

Для расслабления скелетных мышц во время хирургических операций применяют: 1) азаметоний; 2) суксаметоний; 3) триметафан; 4) векуроний; 5) атракурий.

α 1-Адреномиметики:

- 1) адреналин;
- 2) фенилэфрин;
- 3) фенотерол;
- 4) нафазолин;
- 5) ксилометазолин.

α 2-Адреномиметики:

- 1) оксиметазолин;
- 2) фенилэфрин
- 3) фенотерол
- 4) нафазолин;
- 5) ксилометазолин.

β 1-Адреномиметики:

- 1) фенилэфрин;
- 2) фенотерол
- 3) добутамин;
- 4) сальбутамол;
- 5) эфедрин.

β 2-Адреномиметики:

- 1) фенилэфрин;
- 2) фенотерол;
- 3) добутамин;
- 4) сальбутамол;
- 5) эфедрин.

К β 1, β 2-адреномиметикам относится:

- 1) изопреналин;
- 2) фенотерол
- 3) добутамин;
- 4) сальбутамол;
- 5) эфедрин.

К α , β -адреномиметикам относятся:

- 1) эфедрин;
- 2) эпинефрин;
- 3) ксилометазолин
- 4) норэпинефрин.

К симпатомиметикам относится:

- 1) эфедрин;
- 2) эпинефрин;
- 3) ксилометазолин;
- 4) норэпинефрин.

Местно при ринитах применяют:

- 1) фенилэфрин
- 2) фенотерол;
- 3) нафазолин;
- 4) ксилометазолин.

При сосудистом коллапсе применяют:

- 1) эпинефрин;
- 2) фенилэфрин;
- 3) фенотерол;
- 4) нафазолин.

В комбинации с местноанестезирующими средствами применяют:

- 1) пинефрин;
- 2) фенилэфрин
- 3) фенотерол;
- 4) нафазолин;
- 5) добутамин.

При анафилактическом шоке применяют:

- 1) сальбутамол;
- 2) фенилэфрин;
- 3) фенотерол
- 4) эпинефрин.

В качестве кардиотоника при острой сердечной недостаточности применяют:

- 1) сальбутамол;
- 2) фенилэфрин;
- 3) фенотерол;
- 4) добутамин.

В качестве бронхолитиков и токолитиков применяют:

- 1) сальбутамол;
- 2) фенилэфрин;
- 3) фенотерол;
- 4) добутамин.

α 1-Адреноблокаторы:

- 1) карведилол
- 2) небиволол;
- 3) йохимбин;
- 4) празозин;
- 5) доксазозин.

К α 1А-адреноблокаторам относится:

- 1) тамсулозин;
- 2) небиволол;
- 3) йохимбин
- 4) празозин;
- 5) доксазозин.

К α 2-адреноблокаторам относится:

- 1) пропранолол;
- 2) небиволол
- 3) йохимбин;
- 4) празозин;
- 5) фентоламин.

К β 1-адреноблокаторам относятся:

- 1) талинолол;
- 2) пропранолол;
- 3) небиволол;
- 4) атенолол;
- 5) метопролол.

К β 1, β 2-адреноблокаторам относится:

- 1) талинолол;
- 2) пропранолол;
- 3) небиволол;
- 4) атенолол;
- 5) метопролол.

К α , β -адреноблокаторам относятся:

- 1) тамсулозин

- 2) карведилол;
- 3) небиволол;
- 4) лабеталол
- ; 5) доксазозин.

К симпатолитикам относятся:

- 1)талинолол;
- 2) йохимбин;
- 3) празозин;
- 4) резерпин;
- 5) доксазозин.

Вызывают гипотензию, рефлекторную тахикардию и ортостатический коллапс: 1) пропранолол;

- 2) празозин;
- 3) тимолол;
- 4) доксазозин;
- 5) резерпин.

Вызывают гипотензию и брадикардию:

- 1)атенолол;
- 2) празозин;
- 3) резерпин;
- 4) доксазозин
- ; 5) пропранолол.

Механизм антигипертензивного действия β -адреноблокаторов включает:

- 1)уменьшение секреции ренина и расширение кровеносных сосудов;
- 2) уменьшение работы сердца и снижение сердечного выброса
- 3) уменьшение атриовентрикулярной проводимости;
- 4) восстановление чувствительности барорефлекса.

Механизм антиангинального действия β -адреноблокаторов включает:

- 1)уменьшение силы и частоты сердечных сокращений и снижение потребности миокарда в кислороде;
- 2) уменьшение автоматизма и подавление эктопических очагов.

Механизм антиаритмического действия β -адреноблокаторов включает:

- 1) уменьшение силы сердечных сокращений и снижение потребности миокарда в кислороде;

2) уменьшение автоматизма и подавление эктопических очагов.

Преимущества β_1 -адреноблокаторов перед β_1 , β_2 -адреноблокаторами:

- 1) Реже вызывают бронхоспазм.
- 2) Реже вызывают спазм кровеносных сосудов.

Реже вызывают блокады проводящей системы.

Празозин и доксазозин применяют:

- 1) при блокадах проводящей системы;
- 2) при стенокардии;
- 3) при артериальной гипертензии.

Атенолол и небиволол применяют в качестве:

- 1) антигипертензивных средств;
- 2) антиангинальных средств;
- 3) противоаритмических средств;
- 4) антиглаукоматозных средств.

Тимолол применяют в качестве:

- 1) антигипертензивного средства
- 2) антиангинального средства;
- 3) противоаритмического средства;
- 4) антиглаукоматозного средства;
- 5) гипертензивного средства.

Тамсулозин применяют:

- 1) для снижения нагрузки на сердце при сердечной недостаточности;
- 2) для облегчения мочеотделения при доброкачественной гиперплазии предстательной железы.

Контрольные вопросы

1. На какие группы делятся адреномиметики?
2. Какие эффекты характерны для α -адреномиметических средств?
3. В каких случаях используют ν -адреномиметики?
4. Каков механизм бронхолитического действия изопреналина?
5. В каких лекарственных формах выпускается изопреналин?
6. На какие рецепторы действует эпинефрин?
7. При каких патологических состояниях показан эпинефрин?
8. Какой механизм деконгестивного действия нафазолина при рините?
9. Какие адренергические средства применяют при шоке и коллапсе?
10. Почему клонидин при быстром внутривенном

введении вызывает кратковременное повышение артериального давления? Как этого избежать?

11. Почему лекарственные средства, содержащие эфедрина гидрохлорид, относят к средствам рецептурного отпуска?

12. Перечислите, на какие рецепторы действуют фентоламин, празозин, йо-химбин, пропранолол, метопролол.

13. Какое влияние на артериальное давление окажет эpineфрина гидрохлорид на фоне фентоламина и резерпина?

Раздел III

Лекарственные препараты, влияющие на центральную нервную систему. Практическая работа №9

Тема 3.1. Лекарственные препараты, угнетающие центральную нервную систему. (ЦНС). Средства для наркоза. Снотворные средства.

Цель работы:

В итоге самоподготовки студенты должны быть готовы:

- обсудить механизм действия средств для наркоза;
- перечислить ингаляционные и неингаляционные анестетики;
- провести сравнительную характеристику фармакологических свойств каждого из средств для ингаляционного и неингаляционного наркоза.

Методические указания

При подготовке к практической работе студент должен изучить соответствующую главу в учебнике „рекомендованную специальную литературу ,относящиеся к данной теме, другие материалы ,и только после этого можно приступать к решению задач и выполнению заданий. Внимательно прочитайте задачу. Уясните ее содержание и поставленные вопросы пользуясь Фармакопеей и справочниками Машковского и Видаль.

Порядок выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение и значение основных понятий и терминов: анестезия, общая анестезия, наркоз, ингаляционный наркоз, неингаляционный наркоз, базисный наркоз, вводный наркоз, МАК. Аналептики

Задание №2 Кратко ответьте на следующие вопросы

Задание №3 Заполнить таблицу «Характеристика стадий наркоза».

Параметр	Стадия анальгезии	Стадия возбуждения	Стадия хирургического наркоза			Токсическая стадия
			I уровень	II уровень	III уровень	
Сознание Чувств. боли Тонус мышц АД ЧС С ЧД Зрачки Р-ция зрачка Рогович. рефлекс						

1. Заполнить таблицу «Сравнительная характеристика средств для ингаляционного наркоза».

	Закись азота	Галотан	Энфлуран	Изофлуран
Активность Выраженность стадии возбуждения Раздражающее действие Скорость введения в наркоз				

2. Заполнить таблицу «Сравнительная характеристика неингаляционных наркозных средств».

	Активность	Скорость введения в наркоз	Длительность наркоза	Миорелаксация	Способ введения
Тиопентал Пропанидид Пропофол Этомидат Кетамин Оксибутират Na					

3. **Составить таблицу** средств для наркоза с указанием их международных и торговых названий, химической структуры и форм выпуска.

Задание №4 Решить задачи:

1) Во время галотанового наркоза у пациента резко понизилось АД. Анестезиолог располагает следующими средствами, способными повышать АД: эпинефрин, норэпинефрин, мезатон. Какое из средств следует применить в данной ситуации?

2) У анестезиолога, обратившегося к врачу по поводу утомляемости, одышки, нарушения чувствительности в руках и ногах была диагностирована мегалобластная анемия. Анестезиолог продолжал работать. Несмотря на проводимое лечение, состояние пациента не улучшалось. Какое из лекарственных средств, применяемое в анестезиологии, могло послужить причиной этого состояния?

Задание №5 Решить тесты:

Ход выполнения работы:

Задание №1 Поурочный словарь. Выучить определение и значение основных понятий и терминов: анестезия, общая анестезия, наркоз, ингаляционный наркоз, неингаляционный наркоз, базисный наркоз, вводный наркоз, МАК. Аналептики

Задание №2 Кратко ответьте на следующие вопросы

Средства для наркоза это _____

Аналептики. _____

Перечислите средства для неингаляционного наркоза. Средства короткого действия (до 15 мин): _____

М-холиноблокаторы используют для премедикации, потому что _____

Антигистаминные средства - блокаторы H₁-рецепторов используют для премедикации, потому что _____

Болеутоляющие средства используют для премедикации и в послеоперационном периоде, потому что _____

Миорелаксанты периферического действия используют в комбинации со средствами для наркоза с целью _____

Аналептики используют в посленаркозном периоде с целью _____

Задание №3 Заполнить таблицу «Характеристика стадий наркоза».
Сравнительная характеристика средств для ингаляционного наркоза».
Заполнить таблицу «Сравнительная характеристика неингаляционных наркозных средств».

Задание №4 Решить задачи:

Задача №1

1) Во время галотанового наркоза у пациента резко понизилось АД. Анестезиолог располагает следующими средствами, способными повышать АД: эпинефрин, норэпинефрин, мезатон.

Какое из средств следует применить в данной ситуации? _____

Задача №2

2) У анестезиолога, обратившегося к врачу по поводу утомляемости, одышки, нарушения чувствительности в руках и ногах была диагностирована мегалобластная анемия. Анестезиолог продолжал работать. Несмотря на проводимое лечение, состояние пациента не улучшалось.

Какое из лекарственных средств, применяемое в анестезиологии, могло послужить причиной такого состояния? _____

Задание №5 Решить тесты

Выберите правильные ответы.

Для ингаляционного наркоза применяют:

- 1) азота закись;
- 2) пропофол;
- 3) севофлуран;
- 4) пропанидид;
- 5) кетамин;
- 6) галотан.

Для неингаляционного наркоза применяют:

- 1) азота закись;
- 2) пропофол
- 3) севофлуран;
- 4) пропанидид;
- 5) кетамин;
- 6) галотан.

Брадикардию, гипотензию и сердечные аритмии вызывает:

- 1) азота закись;
- 2) пропофол
- 3) севофлуран
- 4) пропанидид;
- 5) кетамин;
- 6) галотан.

Галлюцинации в посленаркозном периоде вызывает:

- 1) азота закись
- 2) пропофол
- 3) севофлуран;
- 4) пропанидид;
- 5) летамин;
- 6) галотан.

Практически не оказывает гепатотоксического действия:

- 1) азота закись;
- 2) пропофол
- 3) севофлуран
- 4) пропанидид;
- 5) кетамин
- 6) галотан.

Прямое стимулирующее действие на дыхательный и сосудодвигательный центры оказывают:

- 1) камфора
- 2) кофеин-бензоат натрия
- 3) бемегрид;
- 4) пропанидид.

Смешанное (прямое + рефлекторное) стимулирующее действие на дыхательный и сосудодвигательный центры оказывают:

- 1) камфора
- 2) никетамид
- 3) бемегрид.

Прямое стимулирующее действие на сердце оказывают:

- 1) камфора;
- 2) никетамид;
- 3) бемегрид;
- 4) кофеин-бензоат натрия.

Действие средств для наркоза аналептики:

- 1) усиливают;
- 2) ослабляют;
- 3) не изменяют.

Средство для ингаляционного наркоза. Не вызывает глубокого хирургического наркоза. Обладает выраженным болеутоляющим действием. Может использоваться для обезболивания родов и купирования болей при инфаркте миокарда.

- 1) Азота закись
2. Пропофол.
3. Севофлуран.
4. Пропанидид.
5. Кетамин
6. Галотан.

Средство для неингаляционного наркоза. Антагонист NMDA-рецепторов. Обладает выраженным болеутоляющим действием. Вызывает «диссоциативную анестезию». Действует 5-10 мин. Может вызвать галлюцинации.

- 1) Азота закись
2. Пропофол.
3. Севофлуран.
4. Пропанидид.
5. Кетамин.
6. Галотан.

Средство для неингаляционного наркоза. Наркоз возникает через 30-40 с после внутривенного введения и длится около 3-5 мин.

- 1) Азота закись.
2. Севофлуран.
3. Пропанидид.
4. Кетамин
5. Галотан.

Проведите анализ врачебных рецептов

А. Средство для неингаляционного наркоза.

Б. Аналептик при легком отравлении снотворными средствами наркотического типа действия.

В. Аналептик для приема внутрь.

Контрольные вопросы:

1. Опишите основные признаки стадии хирургического наркоза.
2. С чем связана стадийность в действии средств для наркоза?
3. Перечислите особенности наркоза, вызываемого закисью азота.
4. Укажите причину кратковременности наркотического эффекта тиопента-ла-натрия.
5. Что такое диссоциативная анестезия (наркоз)? Какое средство используют для этого вида наркоза?
6. При применении какого средства для наркоза могут возникать сердечные аритмии?
7. Какое из средств для наркоза рекомендуется применять при операциях у лиц с кровопотерей и гипотонией?
8. Почему при операциях у лиц с бронхиальной астмой рекомендуют использовать галотановый наркоз?
9. Почему анестезию галотаном не рекомендуют проводить повторно в течение 6 месяцев после его первого применения у пациента?

Тема 5.2. Снотворные, противозепилептические, противопаркинсонические средства

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Снотворные средства. Требования, предъявляемые к снотворным средствам. Классификация. Применение.

NB! Снотворные средства применяют при различных формах нарушений сна. Основное требование, предъявляемое к этой группе препаратов, - минимальное влияние на структуру сна. Под структурой сна понимают чередование фаз (засыпание, медленноволновой сон, быстроволновой сон). Фаза медленноволнового сна определяет ощущение удовлетворенности сном, фаза быстроволнового сна (REM-фаза) характеризуется возникновением сновидений. После отмены препаратов, укорачивающих REM-фазу, возникает феномен «отдачи» - компенсаторное пролонгирование REM-фазы, что приводит к возникновению у пациентов красочных сновидений, как правило, неприятного, устрашающего характера.

Снотворные средства из группы производных бензодиазепаина. Механизм действия, фармакологические эффекты. Влияние на структуру сна. Отравление производными бензодиазепаина и его лечение. Антагонисты бензодиазепиновых рецепторов.

NB! Производные бензодиазепаина вызывают следующие фармакологические эффекты:

- анксиолитический (устранение страха, тревоги, беспокойства);
- седативный;
- снотворный;
- центральный миорелаксирующий;
- противосудорожный (в том числе противоэпилептический);
- амнестический.

Бензодиазепины применяют как анксиолитики; снотворные средства; противоэпилептические средства; средства, снижающие тонус скелетных мышц.

Небензодиазепиновые агонисты бензодиазепиновых рецепторов. Отличия от производных бензодиазепаина.

Снотворные средства из группы производных барбитуровой кислоты. Механизм действия, фармакологические эффекты. Влияние на структуру сна. Отравление производными барбитуровой кислоты и его лечение.

NB! Производные барбитуровой кислоты в качестве снотворных средств имеют ограниченное применение. Это связано с малой шириной их терапевтического действия, наркотическим потенциалом (способностью вызывать лекарственную зависимость), а также выраженной способностью нарушать структуру сна.

Мелатонин.

NB! Мелатонин - препарат гормона эпифиза (шишковидной железы). Мелатонин является биологическим регулятором суточных ритмов смены бодрствования и сна. Как снотворное средство мелатонин применяют при бессоннице, связанной с резкой сменой часовых поясов и работой в ночное время.

Блокаторы гистаминовых H1-рецепторов, применяемые в качестве снотворных средств. Отличия от барбитуратов и бензодиазепинов.

Противоэпилептические средства. Классификация. Применение. NB! Существует несколько классификаций противоэпилептических средств:

- по химической структуре;
- по механизму действия;
- по эффективности при разных формах эпилепсии.

Противоэпилептические препараты применяют для систематического лечения (с целью предупреждения эпилептических припадков). Отдельные противоэпилептические средства применяют для купирования эпилептического статуса.

Сравнительная характеристика лекарственных препаратов, применяемых при разных формах эпилепсии. Побочные эффекты.

Принципы фармакологической коррекции болезни Паркинсона и паркинсонизма. Классификация противопаркинсонических средств. Побочные эффекты.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО

ТЕМЕ А. Снотворные средства.

Доксиламин (донормил) Золпидем Зопиклон (имован) Мелатонин

Мидазолам (дормикум) Нитразепам (раделорм, зуноктин) Пентобарбитал (этаминал-натрий) Флунитразепам (рогипнол)
--

Б. Противоэпилептические средства.

Диазепам (седуксен) Карбамазепин (финлепсин, тегретол) Клоназепам Ламотриджин (ламиктал)

Натрия вальпроат (депакин) Фенитоин (дифенин) Фенобарбитал Этосуксимид (суксилеп)
--

В. Противопаркинсонические средства.

Амантадин (мидантан) Бромокриптин (парлодел) Бипериден (акитенон) Леводопа Мадопар
--

Наком Селегилин (депренил) Тригексифенидил (циклодол, паркопан) Энтакапон

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию снотворных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, стимулирующие ГАМК-эргические процессы в головном мозге. Агонисты бензодиазепиновых рецепторов. Производные бензодиазепина:

- а)
- б)
- в)

Небензодиазепиновые соединения (производные циклопирролина и имидазопиридина):

- а)
- б)

Агонисты барбитуратных рецепторов:

Блокаторы H₁-гистаминовых рецепторов:

Препараты гормона эпифиза:

Задание 2

А. На схеме 5.1 отметьте действие: нитразепама, золпидема, пентобарбитала, флумазенила.

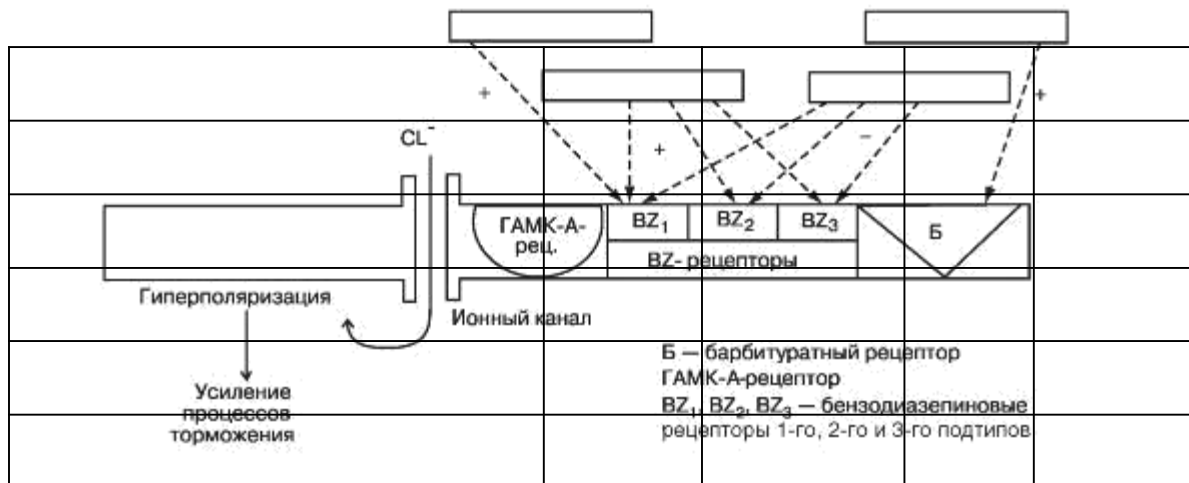


Схема 5.1. ГАМК-бензодиазепин-барбитуратный рецепторный хлор-ионофорный комплекс

Б. Объясните механизм действия бензодиазепинов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Стимулируют бензодиазепиновые рецепторы.

Усиливают тормозные процессы в ЦНС.

Увеличивают частоту открывания хлорных каналов.

Повышают аффинитет ГАМК-А-рецепторов к медиатору (ГАМК).

Увеличивают вход ионов хлора в нейроны, что приводит к гиперполяризации их мембран.

В. Объясните механизм действия барбитуратов (по аналогии с предыдущим заданием).

Г. Объясните различия в механизмах действия и фармакологических свойствах нитразепама и золпидема.

Д. Укажите показания к применению флумазенила.

Задание 3 Проведите сравнительный анализ снотворных средств из разных групп (табл.

5.4).

Таблица 5.4. Сравнительная характеристика снотворных средств из разных групп

	Нитразепам	Пентобарбитал	Золпидем	Док
Параметры сравнения	силамин			

Продолжительность сна

Влияние на структуру сна

Феномен «отдачи»

Наличие и выраженность последействия

Наркогенный потенциал

Широта терапевтического действия

Наличие специфического антагониста

Примечание. Выраженность эффекта обозначьте символами от «+» до «++++».

NB! Многие заболевания ЦНС сопровождаются нарушениями тонуса скелетной мускулатуры. Выделяют следующие нозологические формы, для которых данный синдром является ведущим:

эпилепсия (характерен судорожный синдром, сопровождающийся тонико-клоническими сокращениями скелетных мышц);

болезнь Паркинсона и паркинсонизм (характерна мышечная скованность - ригидность, уменьшение объема произвольных движений - гипокинезия и тремор);

спастический синдром (характерно тоническое сокращение скелетной мускулатуры; часто возникает после перенесенного инсульта, паралича, при рассеянном склерозе).

Задание 4. Дополните классификацию противоэпилептических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, активирующие ГАМК-эргические процессы. Агонисты бензодиазепиновых рецепторов:

а)

б) Агонисты барбитуратных рецепторов:

Ингибиторы ГАМК-трансферазы:

Средства, угнетающие выделение возбуждающих аминокислот:

Средства, блокирующие ионные каналы мембран нейронов.

Блокаторы натриевых каналов:

а)

б).

Блокаторы кальциевых каналов Т-типа:

Задание 5. На схеме 5.2 отметьте действие: ламотриджина, карбамазепина, фенитоина, клоназепама, фенобарбитала, натрия вальпроата, этосуксимида.

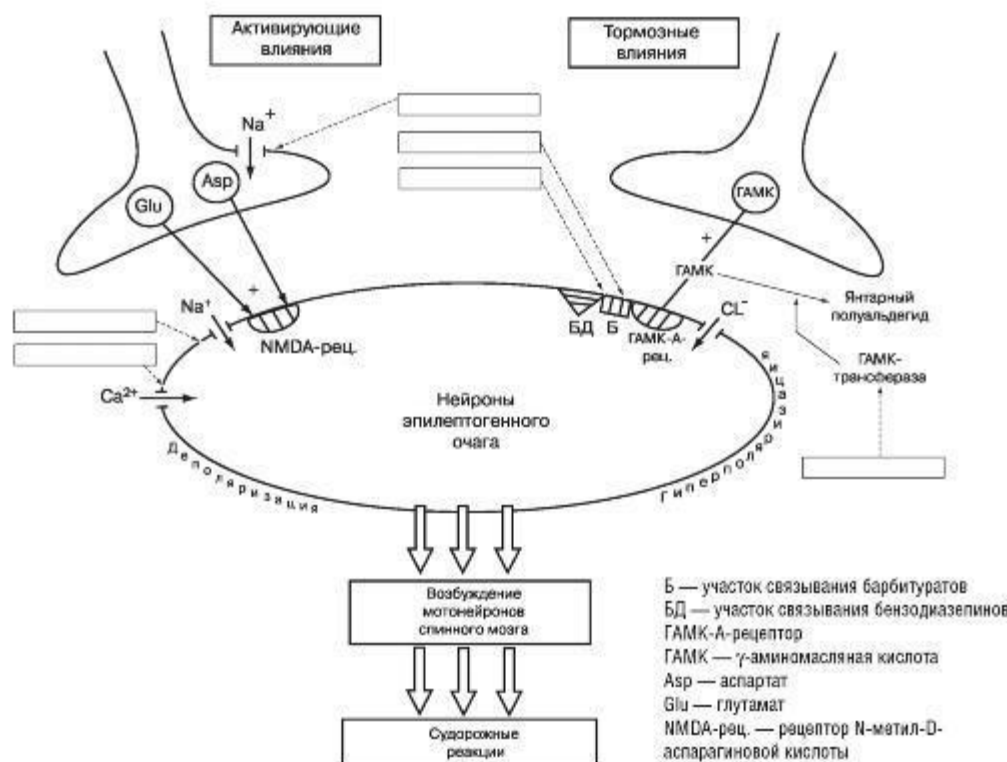


Схема 5.2. Механизмы действия противоэпилептических средств

Задание 6. Укажите показания к применению противоэпилептических средств (табл. 5.5).

Таблица 5.5. Показания к применению противоэпилептических средств

Препарат	Профилактика (предупреждение)		Купирование	
	больших припадков	малых приступов	психомоторных припадков	эпилептического статуса
Диазепам				
Натрия вальпроат				
Фенобарбитал				
Ламотриджин				
Карбамазепин				

Этосуксимид						
-------------	--	--	--	--	--	--

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

NB! С целью купирования эпилептического статуса могут проводиться следующие мероприятия:

внутривенное введение средств с противосудорожным действием (диазепам, фенитоиннатрий);

внутривенное введение средств для неингаляционного наркоза (тиопентал-натрий);

ингаляционный наркоз.

Задание 7. Укажите характерные побочные эффекты противоэпилептических средств (табл. 5.6).

Таблица 5.6. Побочные эффекты некоторых противоэпилептических средств

Препарат	Сонливость (гингивит)	Гиперплазия десен	Угнетение кроветворения	Головокружение
Фенобарбитал				
Фенитоин				
Карбамазепин				

Этосуксимид

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

NB! Отмену противоэпилептических препаратов следует производить постепенно во избежание возникновения феномена отмены, проявляющегося возобновлением и усилением судорог.

Задание 8. Дополните классификацию противопаркинсонических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, стимулирующие дофаминергические процессы в головном мозге. Предшественник дофамина:

Ингибиторы MAO-B:

Агонисты дофаминовых D2-рецепторов:

Средства, угнетающие глутаматергические влияния:

Средства, угнетающие холинергические влияния:

а)

б)

NB! В основе развития болезни Паркинсона лежит уменьшение тормозных дофаминергических влияний черной субстанции на холинергические нейроны неостриатума (экстрапирамидной системы). В результате начинают преобладать стимулирующие влияния глутаматергических нейронов. Это вызывает растормаживание холинергических нейронов экстрапирамидной системы, ведущее к двигательным расстройствам (гипокинезии, ригидности, тремору).

Задание 9

На схеме 5.3 отметьте действие: леводопы, бромокриптина, селегилина, амантадина, тригексифенидила.

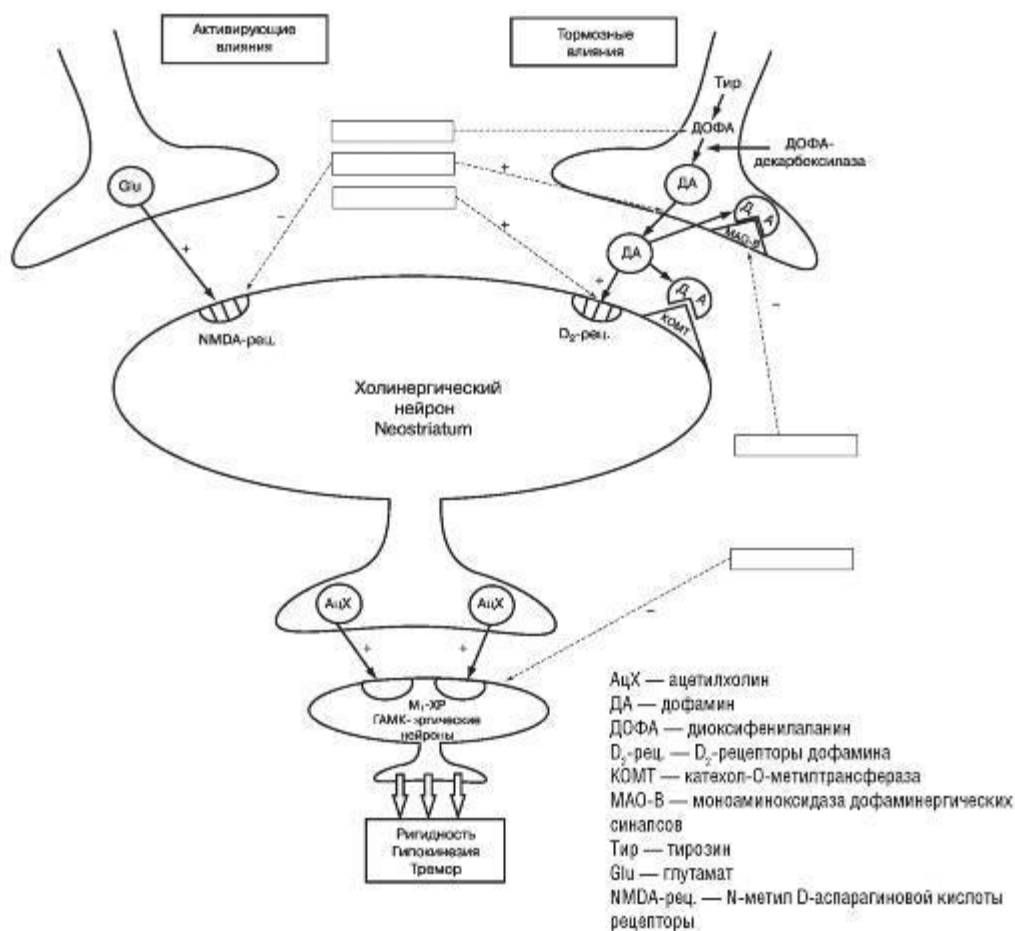


Схема 5.3. Механизмы действия противопаркинсонических средств

Задание 10

А. Укажите характерные побочные эффекты леводопы и объясните механизмы их возникновения.

Б. Укажите ингибиторы периферической ДОФА-декарбоксилазы.

Укажите состав комбинированных препаратов:

Наком = _____ + _____.

Мадопар = _____ + _____.

Г. Объясните цели создания указанных комбинированных препаратов.

NB! К способам коррекции побочных эффектов леводопы также относятся:

применение ингибиторов КОМТ (энтакапон),
препятствующих энзиматическому метаболизму дофамина;

применение блокаторов дофаминовых рецепторов пусковой зоны рвотного центра (домперидон);

применение атипичных антипсихотических средств (клозапин). Эти препараты устраняют вызываемые леводопой бред и галлюцинации, но не препятствуют ее противопаркинсоническому действию.

Задание 11

Перечислите побочные эффекты и укажите противопоказания к применению противопаркинсонических средств из группы центральных холиноблокаторов.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ

САМОКОНТРОЛЯ Совместите.

<p style="text-align: center;">Препараты</p> <ol style="list-style-type: none">1. Золпидем.2. Нитразепам.3. Мелатонин.4. Зопиклон.5. Доксиламин.6. Флунитразепам.	<p style="text-align: center;">Группы</p> <ol style="list-style-type: none">А. Снотворные средства бензодиазепиновой структуры.Б. Небензодиазепиновые агонисты бензодиазепиновых рецепторов.В. Блокаторы гистаминовых H_1-рецепторов.Г. Препарат гормона эпифиза.
<p style="text-align: center;">Препараты</p> <ol style="list-style-type: none">7. Фенobarбитал.8. Ламотриджин.9. Клоназепам.10. Этосуксимид.11. Натрия вальпроат.12. Фенитоин.	<p style="text-align: center;">Механизмы действия</p> <ol style="list-style-type: none">А. Блокирует Na^+-каналы мембран нейронов.Б. Повышает чувствительность ГАМК-рецепторов к медиатору за счет стимуляции бензодиазепиновых рецепторов.В. Блокирует Ca^{2+}-каналы Т-типа.Г. Повышает чувствительность ГАМК-рецепторов к медиатору за счет стимуляции барбитуратных рецепторов.Д. Уменьшает выделение глутамата из пресинаптических окончаний.Е. Увеличивает количество ГАМК за счет угнетения ГАМК-трансферазы.
<p style="text-align: center;">Препараты</p> <ol style="list-style-type: none">13. Селегилин.14. Леводопа.15. Тригексифенидил.16. Амантадин.17. Бромкриптин.	<p style="text-align: center;">Механизмы действия</p> <ol style="list-style-type: none">А. Увеличивает синтез дофамина в ЦНС, являясь его предшественником.Б. Блокирует NMDA-рецепторы.В. Угнетает MAO-B.Г. Стимулирует дофаминовые рецепторы.Д. Блокирует центральные холинергические рецепторы.

Определите лекарственные препараты.

18. Относится к группе циклопирролонов. Повышает чувствительность ГАМК-А-рецепторов к медиатору, стимулируя бензодиазепиновые рецепторы. Практически не изменяет структуру сна. Крайне редко вызывает последствие. После пробуждения часто отмечается горечь и металлический привкус во рту.

1. Мидазолам. 2. Мелатонин. 3. Зопиклон.

19. Активирует ГАМК-эргические процессы в ЦНС. Применяется для профилактики больших судорожных припадков. Растворимая в воде натриевая соль может применяться для купирования эпилептического статуса. В качестве побочных эффектов может вызывать седативное действие и сонливость, индукцию микросомальных ферментов печени. При длительном применении не исключен риск развития лекарственной зависимости.

1. Фенитоин. 2. Ламотриджин. 3. Фенобарбитал. 4. Натрия вальпроат.

20. Производное фенилтриамина. Эффективен при всех формах эпилепсии. Угнетает глутаматергические процессы в ЦНС. Действует продолжительно (24-ч). В качестве побочных эффектов может вызвать диплопию, атаксию, головокружения.

1. Фенитоин. 2. Ламотриджин. 3. Фенобарбитал. 4. Натрия вальпроат.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

21. Леводопу комбинируют с карбидопой, потому что карбидопа усиливает действие леводопы.

22. Карбидопа усиливает действие леводопы, потому что карбидопа увеличивает поступление леводопы в мозг.

23. Карбидопа увеличивает поступление леводопы в мозг, потому что карбидопа препятствует превращению леводопы в дофамин в периферических тканях.

24. Карбидопа препятствует превращению леводопы в дофамин в периферических тканях, потому что карбидопа угнетает периферическую ДОФА-декарбоксилазу.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Снотворное средство.

*Rp.: Nitrazepamі 0,005
D.t.d.N. 10
S. По 1 таблетке 3 раза в день.*

Ваши замечания

Б. Противосудорожное средство.

*Rp.: Tab. Carbamazepini
D.t.d.N. 10
S. По 1 таблетке внутрь.*

Ваши замечания

В. Центральный холиноблокатор при паркинсонизме.

*Rp.: Tab. Bromocriptini 0,005
D.t.d.N. 10 in capsulis
S. Внутрь.*

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-Б.2-А.3-Г.4-Б.5-В.6-А.7-Г.8-Д.9-Б.10-В.11-Е.12-А.13-В. 14 - А. 15 - Д.
16 - Б. 17 - Г. 18 - 3. 19- 3. 20 - 2. 21 - верно, верно, есть связь. 22 -
верно, верно, есть связь. 23 - верно, верно, есть связь. 24 - верно, верно,
есть связь.

Тема 5.3. Болеутоляющие средства. Опиоидные (наркотические) анальгетики. Неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью. Анальгетики преимущественно периферического действия (нестероидные противовоспалительные средства)

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Болеутоляющие средства (анальгетики). Понятие о группе препаратов. Общая классификация.

NB! Боль - защитная реакция организма, сигнализирующая о неблагополучии в организме существует система восприятия и проведения болевых импульсов - так называемая ноцицептивная система (от лат. *noxia* - повреждение). Она представлена: 1) первичными афферентными волокнами, по которым болевой импульс проводится от периферических ноцицепторов (чувствительных нервных окончаний, генерирующих болевой импульс) к спинному мозгу; 2) восходящими путями, по которым возбуждение проводится по спинному мозгу к таламусу и коре больших полушарий, где происходит осознание и эмоциональное восприятие боли.

Передача импульса с окончаний первичных афферентов на вставочные нейроны происходит с участием разных медиаторов, в том числе вещества Р (от англ. *rain* - боль) В организме существует эндогенная антиноцицептивная система (система подавления боли). Она представлена определенными структурами среднего и продолговатого мозга (околоводопроводное серое вещество, гигантоклеточное и парагигантоклеточное ретикулярные ядра,

большое ядро шва, голубое пятно), которые оказывают нисходящее тормозное влияние на проведение болевых импульсов по афферентным путям спинного мозга. Основным медиаторами антиноцицептивной системы являются эндогенные опиоидные пептиды (эндорфины, динорфины, энкефалины), а также серотонин и норадреналин. Опиоидные пептиды являются эндогенными лигандами (агонистами) специфических опиоидных рецепторов. В соответствии с локализацией действия анальгетики принято разделять на вещества преимущественно центрального и вещества преимущественно периферического действия. В соответствии с механизмами действия среди болеутоляющих средств выделяют:

опиоидные анальгетики;

неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью;

болеутоляющие средства преимущественно периферического действия из группы нестероидных противовоспалительных средств.

2. Классификация опиоидных (наркотических) анальгетиков. Механизм болеутоляющего действия.

NB! Выделяют несколько подтипов опиоидных рецепторов: μ (мю), δ (дельта), κ (каппа). При стимуляции опиоидными анальгетиками разных опиоидных рецепторов возникают неодинаковые эффекты.

Опиоидные анальгетики можно классифицировать по типу их взаимодействия с опиоидными рецепторами следующим образом:

– полные агонисты (стимулируют опиоидные рецепторы и вызывают максимальный эффект);

– частичные агонисты (стимулируют опиоидные рецепторы и вызывают эффект меньше максимального);

– агонисты-антагонисты (стимулируют один подтип опиоидных рецепторов и блокируют другой).

Центральные и периферические эффекты опиоидных анальгетиков (на примере морфина). Показания к применению. Сравнительная характеристика природных и синтетических препаратов.

Побочные эффекты опиоидных анальгетиков. Возможность лекарственной зависимости. Отравление опиоидными анальгетиками и его лечение.

Неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью. Классификация. Показания к применению.

NB! Неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью - препараты разных фармакологических групп, способные оказывать болеутоляющее действие только при определенных болевых

синдромах. Механизмы действия этих веществ связаны с влиянием на разные звенья эндогенной антиноцицептивной системы (исключая опиоидные рецепторы).

Анальгетики преимущественно периферического действия - нестероидные противовоспалительные средства (ингибиторы синтеза простагландинов; ингибиторы циклооксигеназ).

NB! Простагландины - продукты метаболизма арахидоновой кислоты.

Простагландины E2 и I2 являются медиаторами воспаления. Их накопление в тканях обуславливает такие проявления воспаления, как боль, повышение температуры тела, отек. Ключевой фермент синтеза простагландинов - циклооксигеназа, катализирующая превращение арахидоновой кислоты в циклические эндопероксиды. Ингибирование циклооксигеназы приводит к нарушению синтеза простагландинов.

Простагландины E2 и I2 стимулируют в слизистой оболочке желудка секрецию слизи и гидрокарбонатных ионов, оказывая гастропротекторное действие; стимулируют сократимость миомерия; регулируют сперматогенез, тонус сосудов и агрегантные свойства тромбоцитов.

Классификация ингибиторов циклооксигеназы по преимущественной локализации действия и избирательности в отношении изоформ циклооксигеназы.

NB! Циклооксигеназа - фермент, катализирующий превращение арахидоновой кислоты в простагландины классов G2 и H2 (циклические эндопероксиды). Существует несколько изоформ циклооксигеназы:

циклооксигеназа 1-го типа (ЦОГ-1) - «конституциональная, физиологическая» - не имеет тканевой специфичности и опосредует синтез простагландинов в периферических тканях;

циклооксигеназа 2-го типа (ЦОГ-2) - «воспалительная» - изофермент, продукция которого индуцируется воспалением. Таким образом, синтез и накопление простагландинов в очаге воспаления является результатом каталитического действия главным образом ЦОГ-2.

В зависимости от избирательности в отношении изоформ циклооксигеназы ее ингибиторы можно классифицировать следующим образом:

неизбирательные ингибиторы ЦОГ;

избирательные ингибиторы ЦОГ-2.

Основные фармакологические эффекты ингибиторов ЦОГ. Механизм действия. Показания к применению. Сравнительная характеристика препаратов по выраженности болеутоляющего, жаропонижающего и противовоспалительного эффектов.

NB! Для неизбирательных ингибиторов ЦОГ, действующих преимущественно в периферических тканях, характерны три основных фармакологических эффекта: болеутоляющий, жаропонижающий и противовоспалительный. У разных препаратов преимущественная выраженность каждого из этих свойств различна.

Побочные эффекты, связанные с угнетением синтеза простагландинов, и их коррекция.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО

ТЕМЕ А. Опиоидные анальгетики.

Бупренорфин Буторфанол (морадол) Кодеин Морфин

Оmnopон Тримеперидин (промедол) Фентанил
--

Б. Неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью.

Диклофенак-натрий (вольтарен) Ибупрофен (бруфен) Кеторолак (кеторол)
--

Ацетилсалициловая кислота (аспирин) Метамизол-натрий (анальгин) Целекоксиб (целебрекс)
--

Анальгетики смешанного действия (опиоидный + неопиоидный компоненты). Трамадол (трамал)

Г. Анальгетики преимущественно периферического действия (нестероидные противовоспалительные средства)

Азота закись Амитриптилин (триптизол) Парацетамол (ацетаминофен)
--

Карбамазепин (финлепсин) Кетамин (кеталар) Клонидин (клофелин)
--

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию опиоидных анальгетиков препаратами из предложенного списка.

Полные агонисты опиоидных рецепторов. Производные фенантрена:

- а)
- б)

Производные пиперидина:

- а)

б)

Препарат, содержащий смесь алкалоидов опия:

Частичные агонисты и агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов:

а)

б)

Задание 2. Укажите эффекты, возникающие при стимуляции опиоидных рецепторов (табл.5.7).

Таблица 5.7. Типы опиоидных рецепторов и эффекты, связанные с их стимуляцией

Типы рецепторов	Эффекты, возникающие при их стимуляции
μ	1.

	2.	
	3.	
	4.	
κ	1.	
	2.	

Задание 3

На схеме 5.4 отметьте действие опиоидных анальгетиков. Объясните механизм их болеутоляющего эффекта.

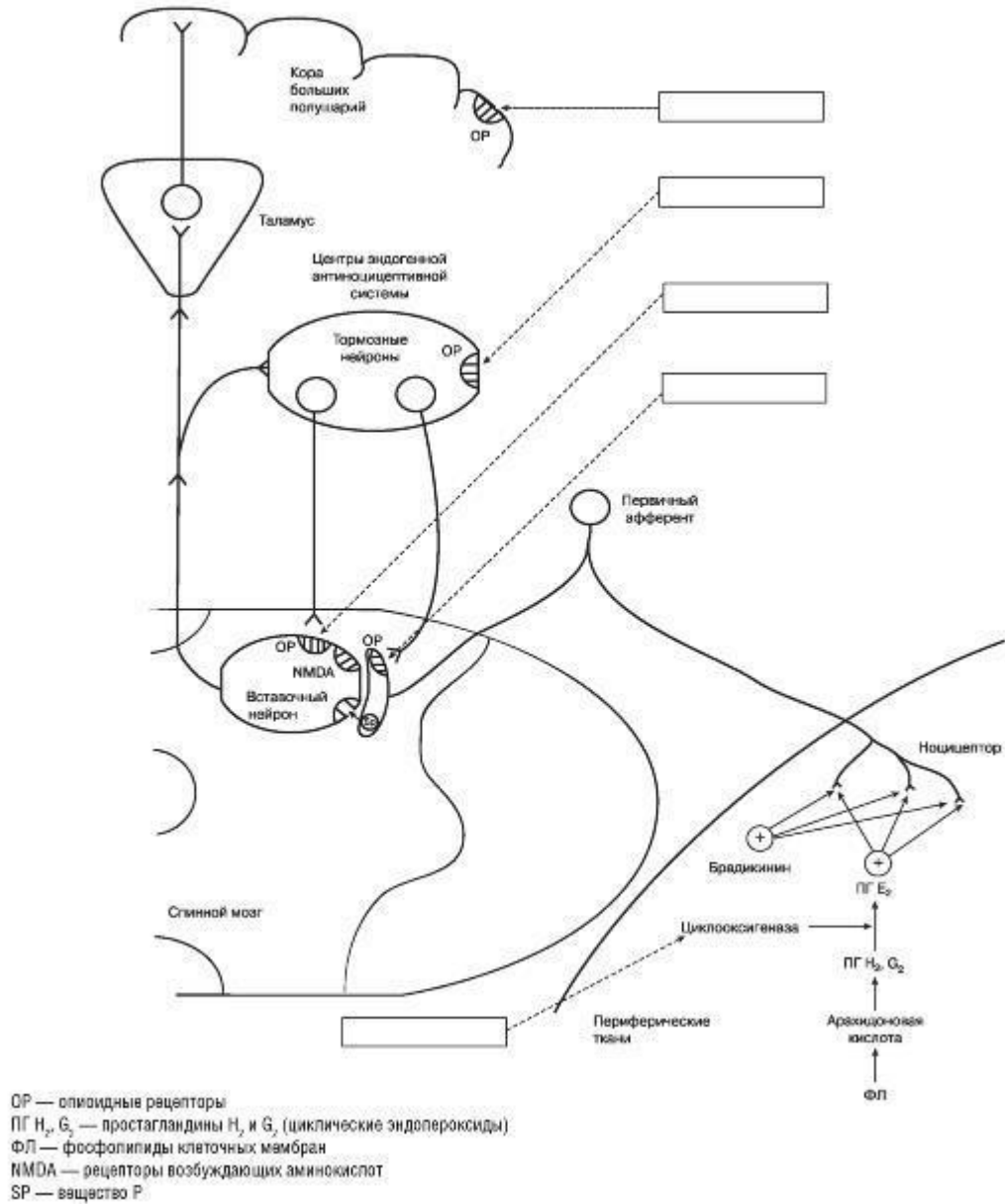


Схема 5.4. Механизмы действия болеутоляющих средств

Задание 4. Укажите фармакологические эффекты морфина (табл. 5.8).

Таблица 5.8. Фармакологические эффекты морфина

Локализация действия	Эффект
Центры эндогенной антиноцицептивной системы	
Дыхательный центр	

Центр кашлевого рефлекса

Центр терморегуляции

Центр глазодвигательных нервов

Центр блуждающих нервов

Гладкие мышцы ЖКТ

Примечание. Укажите, какие эффекты используются в клинической практике, а какие являются побочными.

Задание 5. Из приведенного перечня болевых синдромов выберите те, при которых показаны опиоидные анальгетики.

А. Боли при травмах.

Б. Боли воспалительного характера.

В. Боли при злокачественных новообразованиях.

Г. Боли при инфаркте миокарда.

Д. Боли при невралгии тройничного нерва.

Е. Послеоперационные боли.

Задание 6

А. Сравните морфин и омнопон по следующим параметрам:

состав;

влияние на тонус гладкомышечных органов.

Б. Сравните морфин и фентанил по следующим параметрам:

анальгетическая активность;

продолжительность действия;

влияние на дыхательный центр.

В. Сравните морфин и тримеперидин по следующим параметрам:

анальгетическая активность;

влияние на дыхательный центр;

влияние на тонус гладкомышечных органов.

Г. Сравните опиоидные анальгетики из разных групп (полные агонисты; агонисты-антагонисты и частичные агонисты) (табл. 5.9).

Таблица 5.9. Сравнительная характеристика опиоидных анальгетиков из разных групп

Параметры сравнения	Агонисты	Агонисты-антагонисты и частичные
Выраженность болеутоляющего действия		агонисты
Угнетение дыхательного центра		
Способность вызывать эйфорию		
Способность вызывать лекарственную зависимость		

Примечание. Выраженность эффекта обозначьте следующим образом: «++» максимальное значение эффекта; «+» значение эффекта меньше максимального.

NB! Передозировка опиоидных анальгетиков проявляется утратой сознания, угнетением дыхания, гипотермией. Основная причина смерти при отравлении опиоидами - паралич дыхательного центра.

В качестве средств скорой помощи при отравлении опиоидными анальгетиками внутривенно вводят антагонист опиоидных рецепторов - налоксон (продолжительность действия 20-40 мин).

Задание 7. Дополните классификацию неопиоидных средств центрального действия с анальгетической активностью препаратами из списка лекарственных препаратов по теме:

Центральные $\alpha 2$ -адреномиметики:

Блокаторы натриевых каналов мембран нейронов:

Ингибиторы обратного нейронального захвата моноаминов:

Средства для наркоза: средство для неингаляционного наркоза (антагонист NMDA-рецепторов):

средство для ингаляционного наркоза:

Ингибиторы ЦОГ (производные парааминофенола):

Задание 8. Отметьте показания к применению неопиоидных средств центрального действия с анальгетической активностью (табл. 5.10).

Таблица 5.10. Показания к применению неопиоидных средств центрального действия с анальгетической активностью

	Клонидин	Карбамазепин	Амитриптилин	Кетамин	Закись азота	Парацетамол
Болевой синдром	1			н		
Боль при невралгии						

тройничного нерва						
<i>Окончание табл. 5.10</i>						
Болевой синдром	Клонидин	Карбамазепин	Амитриптилин	Кетами	Закись азота	Парацетамол
Нейропатические и фантомные боли, боли в спине						
Головная боль						
Послеоперационные боли						

Боли при инфаркте миокарда

Боли при обработке ран ожоговых поверхностей

Препарат вводится под оболочки спинного мозга. Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 9. Пользуясь схемой 5.5, объясните механизм гепатотоксического действия парацетамола и предложите пути его коррекции.



Схема 5.5. Гепатотоксическое действие парацетамола

NB! Механизм болеутоляющего действия трамадола складывается из опиоидного и неопиоидного компонентов. Опиоидный компонент связан со стимуляцией μ -рецепторов, а неопиоидный - с ингибированием обратного нейронального захвата норадреналина и серотонина. Трамадол применяется по тем же показаниям, что и опиоидные анальгетики. По сравнению с опиоидными анальгетиками трамадол:

- обладает несколько менее выраженным анальгетическим действием;
- обладает меньшим наркогенным потенциалом;
- в меньшей степени угнетает дыхательный центр.

Задание 10. Дополните классификацию анальгетиков преимущественно периферического действия препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Неизбирательные ингибиторы ЦОГ:

- а)
- б)
- в)
- г)
- д)

Избирательные ингибиторы ЦОГ-2:

Задание 11

А. На схеме 5.6 отметьте действие ингибиторов ЦОГ.

Б. Дополните схему, дописав эффекты анальгетиков периферического действия, связанные с ингибированием циклооксигеназы, и объясните, при каких болях применяются эти препараты.



Схема 5.6. Фармакологические эффекты ингибиторов ЦОГ

В. Перечислите побочные эффекты ингибиторов циклооксигеназы, связанные с угнетением синтеза простагландинов в здоровых тканях. В чем преимущество избирательных ингибиторов ЦОГ-2?

NB! В связи с тем, что в формировании болевого синдрома принимают участие различные механизмы, широкое распространение получили

комбинированные болеутоляющие средства: цитрамон (ацетилсалициловая кислота + парацетамол + кофеин), пенталгин (метамизол-натрий + парацетамол + кодеин фосфат + кофеин + фенobarбитал), солпадеин (парацетамол + кодеин кофеин) и др.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Опиоидные анальгетики-агонисты опиоидных μ -рецепторов:

1) фентанил; 2) буторфанол; 3) морфин; 4) бупренорфин.

2. Опиоидные анальгетики из группы частичных агонистов и агонистов-антагонистов опиоидных рецепторов:

1) фентанил; 2) буторфанол; 3) тримеперидин; 4) морфин; 5) бупренорфин.

3. Препарат, содержащий смесь алкалоидов опия:

1) буторфанол; 2) омнопон; 3) кодеин; 4) морфин; 5) бупренорфин.

4. Опиоидные анальгетики стимулируют:

1) центры эндогенной антиноцицептивной системы; 2) центр кашлевого рефлекса; 3) дыхательный центр; 4) центр глазодвигательного нерва.

5. Опиоидные анальгетики применяют при болях, вызванных:

1) травмой; 2) острым инфарктом миокарда; 3) воспалением; 4) злокачественными новообразованиями; 5) хирургическими операциями.

6. Побочные эффекты опиоидных анальгетиков:

1) диарея; 2) угнетение дыхания; 3) лекарственная зависимость; 4) замедление продвижения химуса по кишечнику.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
7. Клонидин.	А. Ингибирует обратный нейрональный захват моноаминов.
8. Морфин.	Б. Ингибирует ЦОГ преимущественно в ЦНС.
9. Кетамин.	В. Ингибирует преимущественно ЦОГ-2.
10. Амитриптилин.	Г. Ингибирует ЦОГ неизбирательно.
11. Целекоксиб.	Д. Блокирует Na^+ -каналы.
12. Карбамазепин.	Е. Блокирует NMDA-рецепторы.
13. Парацетамол.	Ж. Стимулирует α_1 -адренорецепторы.
14. Ацетилсалициловая кислота.	З. Стимулирует опиоидные μ -рецепторы.

*Rp.: Tab. Carbamazepini 0,1
D.t.d.N. 10
S. По 1 таблетке 2 раза в день внутрь.*

Ваши замечания

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

21. Ацетилсалициловая кислота оказывает ульцерогенное действие, потому что ацетилсалициловая кислота угнетает синтез простагландинов в очагах воспаления.

22. Целекоксиб крайне редко оказывает ульцерогенное действие, потому что целекоксиб избирательно ингибирует ЦОГ-2 в очагах воспаления.

23. Ацетаминофен практически не оказывает противовоспалительного действия, потому что ацетаминофен избирательно ингибирует ЦОГ в ЦНС.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Анальгетик при остром инфаркте миокарда.

*Rp.: Solutionis Fentanylii
0,005% — 2 ml
D.t.d.N. 10 in amp.
S. Вводить внутримышечно по 2 мл.*

Ваши замечания

Б. Анальгетик при невралгии тройничного нерва.

Анальгетик-антипиретик, не оказывающий противовоспалительного

*Rp.: Paracetamoli 0,5
D.t.d.N. 10
S. По 1 таблетке 3 раза в день внутрь.*

Ваши замечания

действия.

Ответы на тестовые задания

1-1,3. 2-2,5. 3-2. 4-1,4. 5-1,2,4,5. 6-2,3,4. 7-Ж. 8-3. 9-Е. 10-А. 11-В.
12-Д. 13-Б. 14-Г. 15-Б,В. 16-Г. 17-Е. 18-Д. 19-А. 20-В. 21-верно,
верно, связи нет. 22 - верно, верно, связь есть. 23 - верно, верно, связь есть.

Тема 5.4. Психотропные средства. Антипсихотические средства (нейролептики), антидепрессанты, антиманиакальные средства (соли лития)

NB! Психотропные средства - группа веществ, применяемых при психических расстройствах. Антипсихотические средства, антидепрессанты и антиманиакальные средства применяют главным образом при психозах - шизофрении и маниакально-депрессивном психозе (это не исключает возможности их использования при других расстройствах психики).

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Антипсихотические средства (нейролептики). Определение термина. Классификация. Механизмы действия. Центральные и периферические эффекты. Показания к применению. Сравнительная характеристика препаратов из разных химических групп. Побочные эффекты и их коррекция.

NB! Под антипсихотическим действием понимают способность лекарственных веществ устранять продуктивную симптоматику психозов (бред и галлюцинации).

Антипсихотические средства классифицируют по нескольким критериям:
по химической структуре;

по выраженности экстрапирамидных расстройств (препараты делятся на типичные и атипичные).

Антидепрессанты. Определение термина. Классификация. Механизмы действия. Сравнительная характеристика препаратов из разных химических групп. Побочные эффекты.

NB! Под депрессией понимают аффективное расстройство (расстройство в сфере эмоций), проявляющееся патологическим снижением настроения, мотиваций, психомоторной активности, а также суицидальными мыслями и попытками. Антидепрессанты классифицируются по нескольким критериям:

по химической структуре;

по механизму действия;

по выраженности основных психотропных эффектов (антидепрессивный, психоседативный и психостимулирующий). Препараты, у которых все три эффекта выражены в равной степени, называются «сбалансированными» антидепрессантами.

Антиманьякальные средства (соли лития, нормотимические средства). Имипрамин (имизин) Миртазапин (ремирон) Мапротилин (людиомил) Тиафетин (коаксил)	(Соли лития, нормотимические средства). Миртазапин (ремирон) Флуоксетин (аурорикс) Наламид Флуоксетин (прозак)
--	--

Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Под манией понимают аффективное расстройство, проявляющееся

патологически повышенным настроением и увеличением нецелесообразной психомоторной активности. Препараты лития используются как для профилактики, так и для купирования маниакальной фазы маниакально-депрессивного психоза.

Кроме того, препараты лития могут использоваться в качестве средств, стабилизирующих эмоциональную сферу (нормотимических средств) у лиц, не страдающих маниакально-депрессивным психозом, но имеющих циклические изменения настроения (циклотимия). Кроме препаратов лития, в качестве нормотимических (тимолептических) средств могут применяться карбамазепин и натрия вальпроат.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Антипсихотические средства (нейролептики).

Галоперидол Дроперидол Клозапин (азалептин, лепонекс) Оланзапин (зипрекса) Рисперидон (рисполепт) Сульпирид (эглонил)
--

Тиоридазин (сонапакс) Трифлуоперазин (трифтазин) Флуфеназина деканоат (фторфеназина-деканат, модитен-депо) Хлорпромазин (аминазин) Хлорпротиксен (труксал)
--

Б. Антидепрессанты и соли лития.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию антипсихотических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

- А. Типичные антипсихотические средства.
- Фенотиазиновые производные. Алифатические:
- Пиперазиновые:
 - Пиперидиновые:
- Производные бутирофенона:

- а)
- б)

Производные тиоксантена:

Б. Атипичные антипсихотические средства.

Производные дибензодиазепина:

- а)
- б)

Производные замещенных бензамидов:

Производные бензизоксазола:

Задание 2. Объясните фармакологические эффекты антипсихотических средств (нейролептиков), исходя из их механизма действия.

А. На схеме 5.7 укажите фармакологические эффекты, связанные с блокадой дофаминовых D2-рецепторов.

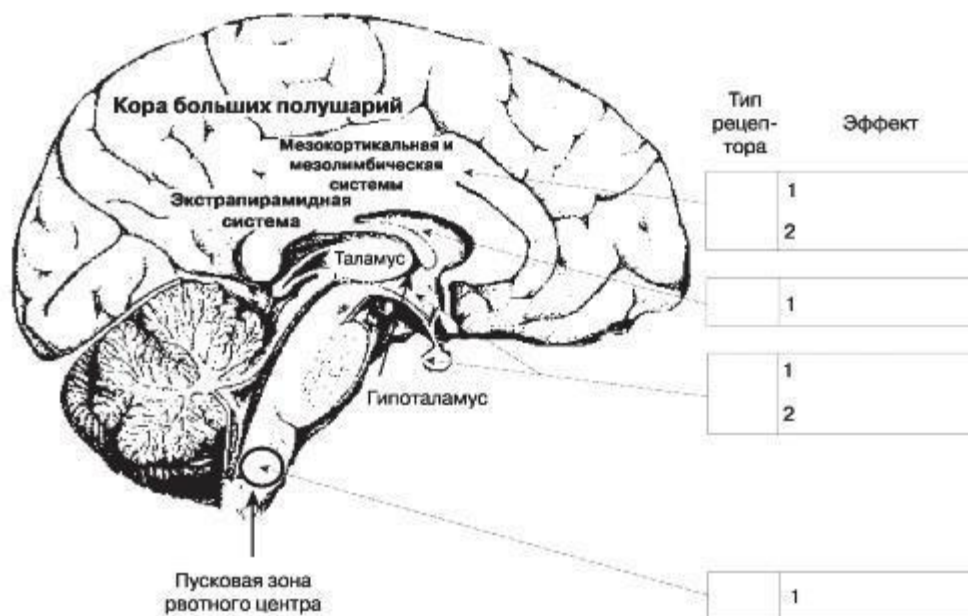


Схема 5.7. Локализация дофаминовых D2-рецепторов и эффекты антипсихотических средств, связанные с их блокадой

Б. Перечислите фармакологические эффекты антипсихотических средств, не связанные с блокадой дофаминовых рецепторов, дополнив причинно-следственную связь рецептор-эффект:

блокада α -адренорецепторов в ЦНС →;

блокада гистаминовых H1-рецепторов в ЦНС →;

блокада периферических α -адренорецепторов →;

блокада периферических M-холинорецепторов →.

Задание 3. Укажите основные показания к применению антипсихотических средств (нейролептиков):

- 1.
- 2.

3..

Какой нейролептик входит в состав комбинированного препарата «Таламонал»? Объясните выбор.

Задание 4. Решите ситуационные задачи.

Ситуационные задачи

- А. У больного, принимающего галоперидол, возникли явления паркинсонизма. Каким противопаркинсоническим препаратом (наком, леводопа, бромкриптин, селегилин, тригексифенидил) следует воспользоваться для устранения лекарственного паркинсонизма?
- Б. После применения хлорпромазина у больного развилась ортостатическая гипотензия. Каким прессорным средством (эпинефрин, фенилэфрин) следует воспользоваться для повышения артериального давления? Объясните выбор.
- В. Больному шизофренией назначен антипсихотический препарат, не вызывающий экстрапирамидных нарушений. Очередной анализ крови выявил у больного агранулоцитоз. Определите лекарственный препарат, назначенный больному.
- Г. Пожилой пациент с глаукомой и аденомой предстательной железы доставлен в отделение с острым психомоторным возбуждением. Каким антипсихотическим препаратом (хлорпромазин, галоперидол) следует воспользоваться для купирования психомоторного возбуждения? Объясните выбор.
- Д. У пациента, страдающего депрессией, появились бред и галлюцинации. Какой антипсихотический препарат целесообразно назначить в данном случае?

Задание 5. Дополните классификацию антидепрессантов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Ингибиторы моноаминоксидазы: неизбирательные ингибиторы МАО:

избирательные ингибиторы МАО-А:

Ингибиторы обратного нейронального захвата моноаминов.

Неизбирательные ингибиторы обратного нейронального захвата серотонина и норадреналина («трициклические» антидепрессанты):

а)

б)

Избирательные ингибиторы обратного нейронального захвата норадреналина («тетрациклические» антидепрессанты):

Избирательные ингибиторы обратного нейронального захвата серотонина:

Стимуляторы обратного нейронального захвата серотонина:

Блокаторы центральных пресинаптических α_2 -адренорецепторов.

Норадренергических и серотонинергических синапсов:

Норадренергических синапсов:

Задание 6

На схеме 5.8 отметьте действие: моклобемида, amitриптилина, флуоксетина, мапротилина, миансерина, миртазапина.

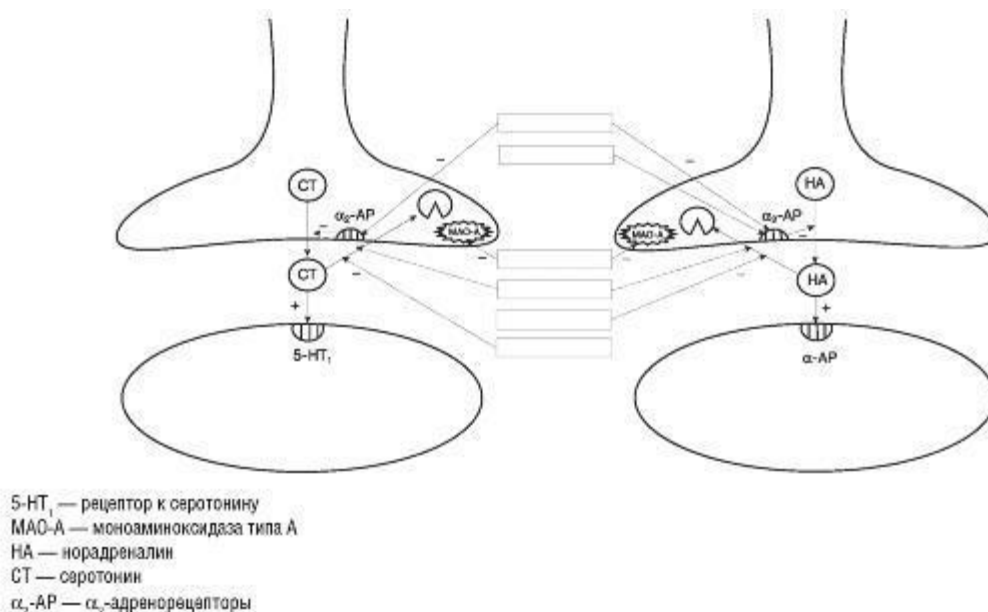


Схема 5.8. Механизмы действия антидепрессантов

Задание 7. Отметьте различия в психотропных эффектах антидепрессантов (табл. 5.11).

Таблица 5.11. Психотропные эффекты антидепрессантов

Препарат	Антидепрессивный	Психостимулирующий	Седативный
Амитриптилин			
Моклобемид			
Флуоксетин			

Мапротилин

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

NB! Различия в психоседативных или психостимулирующих эффектах антидепрессантов определяют предпочтительное применение разных препаратов у пациентов с разным течением депрессивных состояний (сопровождающихся ажитацией, тревогой, нарушениями сна, заторможенностью, суицидальными мыслями).

Задание 8. Укажите побочные эффекты антидепрессантов (табл. 5.12).

Таблица 5.12. Побочные эффекты антидепрессантов

Препарат	М-холиноблокирующее действие	Кардиотоксическое действие	«Серотониновый синдром»
Амитриптилин			
Моклобемид			
Флуоксетин			
Мапротилин			

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 9. Решите ситуационную задачу.

Ситуационная задача

Больному Л. и больному О. в связи с депрессией назначен ниламид. Через 2 нед оба пациента в тяжелом состоянии были доставлены в больницу. При сборе анамнеза выяснилось, что больной Л. страдал гипертонзией и накануне принял таблетку «от давления», а больной О. посетил дегустацию сырных продуктов. Объясните причины ухудшения состояния пациентов.

1. Вызывает антипсихотический, психоседативный эффект, может вызывать депрессию и экстрапирамидные расстройства:

1) галоперидол; 2) оланзапин; 3) хлорпромазин; 4) хлорпротиксен; 5) сульпирид.

2. Вызывает антипсихотический и психоседативный эффект, экстрапирамидные расстройства и обладает антидепрессивными свойствами:

1) хлорпромазин; 2) клозапин; 3) сульпирид; 4) хлорпротиксен; 5) дроперидол.

3. Антипсихотические средства, редко вызывающие экстрапирамидные расстройства:

1) оланзапин; 2) хлорпротиксен; 3) клозапин; 4) рисперидон; 5) сульпирид.

Определите лекарственные препараты.

4. Типичное антипсихотическое средство. Устраняет продуктивную симптоматику психозов (бред, галлюцинации). Обладает выраженными седативными и противорвотными свойствами. Вызывает экстрапирамидные нарушения. Снижает артериальное давление, извращает прессорное действие адреналина.

1. Галоперидол. 2. Оланзапин. 3. Хлорпромазин. 4. Хлорпротиксен. 5. Сульпирид.

5. Типичное антипсихотическое средство. Превосходит хлорпромазин по выраженности антипсихотического действия и уступает по выраженности психоседативному действию. В меньшей степени, чем хлорпромазин, снижает артериальное давление.

1. Галоперидол. 2. Оланзапин. 3. Хлорпротиксен. 4. Сульпирид.

6. Типичное антипсихотическое средство - производное бутирофенона. Отличается короткой продолжительностью действия. Применяется в основном для премедикации (перед наркозом и инструментальными обследованиями), а также для нейролептаналгезии.

1. Галоперидол. 2. Оланзапин. 3. Хлорпромазин. 4. Хлорпротиксен. 5. Дроперидол.

7. Атипичное антипсихотическое средство. Блокирует D₂-рецепторы. Устраняет не только продуктивную, но и негативную симптоматику психозов. Обладает незначительными психоседативными свойствами. Обладает некоторой гастрокинетической активностью. Применяется в гастроэнтерологии при язвенной болезни.

1. Галоперидол. 2. Хлорпромазин. 3. Хлорпротиксен. 4. Сульпирид.

8. Обладает антидепрессивными и седативными свойствами. Неизбирательно угнетает нейрональный захват моноаминов (норадреналина и серотонина). Может применяться в качестве анальгетика при нейропатических болях (боли в спине, боли при постгерпетической нейропатии).

1. Мапротилин. 2. Флуоксетин. 3. Миртазапин. 4. Амитриптилин. 5. Моклобемид.

9. Обладает антидепрессивными и психостимулирующими свойствами. Избирательно угнетает нейрональный захват серотонина. Не оказывает кардиотоксического и атропиноподобного действия. Может назначаться лицам с глаукомой и аденомой предстательной железы.

1. Мапротилин. 2. Флуоксетин. 3. Миртазапин. 4. Амитриптилин. 5. Моклобемид.

10. Обладает антимианкальными и тимолептическими свойствами без выраженного психоседативного эффекта. Имеет длительный латентный период (2-3 нед) и малую терапевтическую широту. Применяется для профилактики и купирования маниакальной фазы маниакально-депрессивного психоза.

1. Оланзапин. 2. Имипрамин. 3. Лития карбонат. 4. Дроперидол.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
11. Моклобемид.	А. Неизбирательно ингибирует MAO-A и MAO-B.
12. Мапротилин.	Б. Избирательно ингибирует MAO-A.
13. Амитриптилин.	В. Неизбирательно ингибирует нейрональный захват моноаминов.
14. Ниаламид.	Г. Избирательно ингибирует нейрональный захват норадреналина.
15. Флуоксетин.	Д. Избирательно ингибирует нейрональный захват серотонина.
16. Миансерин.	Е. Блокирует пресинаптические α_2 -адренорецепторы в адренергических и серотонинергических синапсах ЦНС.
17. Тианептин.	Ж. Блокирует пресинаптические α_2 -адренорецепторы в адренергических синапсах ЦНС.
18. Миртазапин.	З. Стимулирует нейрональный захват серотонина.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для купирования острого психомоторного возбуждения.

<i>Rp.: Aminazini</i> <i>2,5% — 2 ml</i> <i>D.t.d.N. 6 in amp.</i> <i>S. Вводить внутривенно по 2 мл.</i>	Ваши замечания
--	----------------

Б. Атипичное антипсихотическое средство.

<i>Rp.: Sulpiridi 0,05</i> <i>D.t.d.N. 15 in capsulis</i> <i>S. По 1 капсуле 3 раза в день.</i>	Ваши замечания
---	----------------

В. Сбалансированный антидепрессант.

<i>Rp.: Maprotilini 0,01</i> <i>D.t.d.N. 20 in dragee</i> <i>S. По 1 драже 3 раза в день внутрь.</i>	Ваши замечания
--	----------------

Ответы на тестовые задания

1-1,3. 2-4. 3-1,3,4,5. 4-3. 5-1. 6-5. 7-4. 8-4. 9-2. 10-3. 11-Б. 12-Г. 13-В. 14-А. 15-Д. 16-Ж. 17-3. 18-Е.

Тема 5.5. Психотропные средства (продолжение). Анксиолитические средства (транквилизаторы), седативные средства, психостимуляторы, ноотропные средства

NB! Рассматриваемые в настоящей теме группы средств применяют главным образом при психических расстройствах непсихотического характера:

при неврозах и невротоподобных состояниях (анксиолитики, седативные средства, психостимуляторы);

при умственной недостаточности (ноотропные средства).

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Анксиолитические средства (транквилизаторы). Определение термина. Классификация. Механизмы действия. Фармакологические эффекты. Показания к применению. Побочные эффекты. Отравление производными бензодиазепина и его лечение.

NB! Анксиолитические средства классифицируются:

по химической структуре;

по механизму действия;

по выраженности седативно-снотворного действия.

Седативные средства. Определение термина. Показания к применению.

Психостимуляторы. Определение термина. Классификация. Механизм действия. Центральные и периферические эффекты. Показания к применению. Побочные эффекты. Противопоказания.

NB! Психостимуляторы вызывают временное повышение умственной и физической работоспособности.

Ноотропные средства. Определение термина. Классификация. Механизм действия. Показания к применению.

NB! Ноотропные препараты обладают ноотропным и антигипоксическим действием. Ноотропный эффект (улучшение памяти и обучения) проявляется только при длительном (не менее месяца) применении препаратов.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Анксиолитические средства.

Алпразолам (ксанакс) Буспирон Гидроксизин (атаракс) Диазепам (реланиум, сибазон, седуксен, валиум)	Медазепам (рудотель) Феназепам Хлордiazэпоксид (хлорзепид, элениум)
---	---

Б. Седативные средства.

Валокордин Препараты брома (натрия бромид, калия бромид) Препараты валерианы (настой корневища с корнями валерианы, настойка валерианы, экстракт валерианы сухой)	Препараты пустырника (настойка пустырника, экстракт пустырника жидкий) Препараты пассифлоры (экстракт пассифлоры жидкий)
---	---

В. Психостимуляторы и ноотропные средства.

Аминалон (гаммалон) Кофеин Пирацетам (ноотропил)	Пиритинол (энцефабол, пиридитол) Мезокарб (сиднокарб)
--	--

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию анксиолитических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Агонисты бензодиазепиновых рецепторов.

С выраженным седативно-снотворным действием:

- а)
- б)
- в)

С минимально выраженным седативно-снотворным действием (дневные):

- а)
- б)

Агонисты серотониновых 5-НТ1А-рецепторов:

Задание 2

А. Перечислите фармакологические эффекты анксиолитиков из группы производных бензодиазепа.

- 1.
- 2.
- 3.
- 4.
- 5.
- 6.

Б. Перечислите основные показания к применению анксиолитиков из группы производных бензодиазепа.

- 1.
- 2.
- 3.
- 4.

В. Укажите отличительные особенности «дневных» анксиолитиков.

Г. Укажите отличия бупропиона от бензодиазепиновых анксиолитиков.

NB! Гидроксизин (атаракс) - анксиолитик из группы производных пиперазина. Вызывает анксиолитический и седативный эффекты. Кроме

того, обладает противорвотными, антигистаминными и М-холиноблолирующими свойствами.

Задание 3. Сравните бензодиазепиновые анксиолитики и типичные антипсихотические средства (табл. 5.13).

Таблица 5.13. Сравнительная характеристика анксиолитиков и антипсихотических средств

Эффект	Бензодиазепиновые анксиолитики	Типичные антипсихотические средства
Антипсихотический		
Анксиолитический		
Психоседативный		
Противосудорожный		
Способность вызывать экстрапирамидные расстройства		
Способность потенцировать действие средств, угнетающих ЦНС		
Способность вызывать физическую лекарственную зависимость		

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 4. Дополните классификацию седативных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Синтетические средства:

Средства растительного происхождения:

а)

б)

в)

Комбинированные препараты:

Задание 5

А. Укажите отличия седативных средств от анксиолитиков и снотворных средств.

Б. Укажите показания к применению седативных средств.

- 1.
- 2.
- 3.

В. Укажите состав комбинированных седативных средств и объясните принцип составления комбинации.

Задание 6

А. Дополните классификацию психостимуляторов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Производные сидномина:

Производные метилксантина:

Б. Объясните возможный механизм действия психостимуляторов.

В. Укажите фармакологические эффекты, связанные с влиянием психостимуляторов на ЦНС.

- 1.
- 2.

Г. Перечислите показания к применению психостимуляторов. Д. Укажите возможные побочные эффекты психостимуляторов.

Задание 7

А. Дополните классификацию ноотропных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Производные гамма-аминомасляной кислоты (ГАМК):

- а)
- б)

Производные витамина В6:

Б. Объясните возможный механизм улучшения памяти и обучения под влиянием ноотропных средств.

В. Перечислите основные показания к применению ноотропных средств.

- 1.
- 2.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Бензодиазепиновые анксиолитики:

1) диазепам; 2) буспирон; 3) медазепам; 4) феназепам; 5) хлордиазэпоксид.

2. «Дневные» анксиолитики:

1) диазепам; 2) буспирон; 3) медазепам; 4) феназепам; 5) хлордиазэпоксид.

3. Фармакологические эффекты бензодиазепиновых анксиолитиков:

1) анксиолитический; 2) противосудорожный; 3) психостимулирующий; 4) снотворный.

4. Фармакологические эффекты, общие для феназепама и валокордина:

1. Седативный. 2. Анксиолитический. 3. Снотворный. 4. Миорелаксирующий.

5. Временное повышение умственной и физической работоспособности вызывают:

1) буспирон; 2) пирацетам; 3) кофеин; 4) мезокарб; 5) пиритинол.

6. При нарколепсии (патологической сонливости) применяют:

1) валокордин; 2) медазепам; 3) мезокарб; 4) пиритинол; 5) пирацетам.

7. Улучшают память и обучение при умственной недостаточности:

1) валокордин; 2) медазепам; 3) пиритинол; 4) пирацетам.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
8. Диазепам.	А. Стимулирует серотониновые рецепторы.
9. Мезокарб.	Б. Повышает чувствительность ГАМК-рецепторов к медиатору.
10. Буспирон.	В. Активирует адренергические процессы в мозге.
11. Пирацетам.	Г. Воспроизводит метаболическое действие ГАМК в мозге.

Определите лекарственные препараты.

12. Обладает анксиолитическими, седативными, снотворными и противосудорожными свойствами. Вводится внутрь и внутривенно. Может применяться при неврозах, в качестве снотворного средства, для уменьшения абстинентного влечения при наркомании, а также для купирования эпилептического статуса.

1. Пиритинол. 2. Буспирон. 3. Феназепам. 4. Мезокарб.

13. Бензодиазепиновый анксиолитик. Уменьшает тревогу, страх, напряжение. Практически не вызывает сонливости. Применяется внутрь. Может использоваться в дневное время.

Пиритинол. 2. Буспирон. 3. Феназепам. 4. Медазепам.

14. Производное сиднонимина. Временно повышает умственную и физическую работоспособность. Применяется при патологической сонливости. Практически не влияет на сердечнососудистую систему. В качестве побочных эффектов вызывает бессонницу и беспокойство. Лекарственную зависимость практически не вызывает.

Кофеин. 2. Буспирон. 3. Пирацетам. 4. Мезокарб.

15. Циклическое производное гамма-аминомасляной кислоты. Воспроизводит метаболические эффекты ГАМК в ЦНС. Обладает антигипоксическим действием. Вводится внутрь и внутривенно. Применяется для уменьшения очаговой симптоматики после перенесенных инсультов и травм головного мозга, а также для улучшения памяти и обучения при умственной недостаточности.

Диазепам. 2. Буспирон. 3. Пирацетам. 4. Сиднокарб.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство, улучшающее память и обучение.

<i>Rp.: Piracetami 0,4 D.t.d.N. 60 in capsulis S. Принимать внутрь.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Б. «Дневной» анксиолитик.

<i>Rp.: Sol. Diazepamii 0,5% – 2 ml D.t.d.N. 10 in amp. S. Вводить внутривенно.</i>	Ваши замечания
---	----------------

В. Средство для уменьшения утомления.

<i>Rp.: Sydnocarbi 0,005 D.t.d.N. 10 in tab. S. По 1 таблетке перед сном.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Ответы на тестовые задания

1-1,3,4,5. 2-2,3. 3-1,2,4. 4-1,3. 5-3,4. 6-3. 7-3,4. 8-Б. 9-В.
10-А. 11-Г. 12-3.1 3-4. 14-4. 15-3.

Заключительное занятие по разделу «Средства, действующие на центральную нервную систему»

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Средства для ингаляционного наркоза:
азота закись; 2) пропофол; 3) севофлуран; 4) пропанидид; 5) кетамин; 6) галотан.
2. Средства для неингаляционного наркоза:
азота закись; 2) пропофол; 3) севофлуран; 4) пропанидид; 5) кетамин; 6) галотан.
3. Аналептики, оказывающие прямое и рефлекторное стимулирующее действие на дыхательный и сосудодвигательный центры:
камфора; 2) никетамид; 3) бемеGRID.
4. Аналептики, оказывающие смешанное действие:
1) камфора; 2) никетамид; 3) бемеGRID; 4) кофеин.
5. Действие средств для наркоза аналептики:
1) усиливают; 2) ослабляют; 3) не изменяют.
6. Снотворные средства бензодиазепиновой структуры:
золпидем; 2) нитразепам; 3) мелатонин; 4) зопиклон; 5) доксиламин; 6) флуни-нитразепам.
7. К небензодиазепиновым агонистам бензодиазепиновых рецепторов относится:
1) золпидем; 2) нитразепам; 3) мелатонин; 4) зопиклон; 5) доксиламин.
8. К блокаторам гистаминовых H₁-рецепторов относится:
золпидем; 2) нитразепам; 3) мелатонин; 4) зопиклон; 5) доксиламин.
9. При бессоннице, связанной с изменением часовых поясов, применяют:
1) золпидем; 2) нитразепам; 3) мелатонин; 4) зопиклон; 5) доксиламин.
10. Противозипептические средства, стимулирующие ГАМК-эргические процессы в ЦНС:

фенобарбитал; 2) ламотриджин; 3) клоназепам; 4) этосуксимид; 5) натрия вальпроат; 6) фенитоин.

11. Противосудорожные средства - блокаторы натриевых каналов:
карбамазепин; 2) ламотриджин; 3) клоназепам; 4) этосуксимид; 5) натрия вальпроат; 6) фенитоин.

12. Противосудорожные средства, угнетающие глутаматергическую систему мозга:

фенобарбитал; 2) ламотриджин; 3) клоназепам; 4) этосуксимид; 5) натрия вальпроат; 6) фенитоин.

13. Сонливость, индукция микросомальных ферментов печени и лекарственная зависимость - побочные эффекты:

ламотриджина; 2) клоназепама; 3) фенобарбитала; 4) фенитоина.

14. Противопаркинсонические средства, стимулирующие дофаминергические процессы в ЦНС:

селегилин; 2) леводопа; 3) тригексифенидил; 4) бромокриптин.

15. Противопаркинсонические средства, блокирующие холинорецепторы в ЦНС:

селегилин; 2) леводопа; 3) тригексифенидил; 4) бромокриптин.

16. Сухость во рту, паралич аккомодации, задержка мочеиспускания и запор - побочные эффекты:

селегилина; 2) леводопы; 3) тригексифенидила; 4) бромокриптина.

17. Сердечные аритмии, нестабильность артериального давления, тошнота, рвота, галлюцинации - побочные эффекты:

селегилина; 2) леводопы; 3) тригексифенидила; 4) бромокриптина.

18. Для уменьшения периферических побочных эффектов и усиления противопаркинсонического действия леводопу комбинируют с:

бромокриптином; 2) селегилином; 3) карбидопой; 4) тригексифенидилом.

19. Наком и мадопар содержит:

тригексифенидил; 2) селегилин; 3) леводопу; 4) бромокриптин.

20. Опиоидные анальгетики - агонисты опиоидных μ -рецепторов:

1) фентанил; 2) буторфанол; 3) морфин; 4) бупренорфин.

21. Опиоидные анальгетики из группы частичных агонистов и агонисты-антагонисты опиоидных рецепторов:

фентанил; 2) буторфанол; 3) тримеперидин; 4) морфин; 5) бупренорфин.

22. Опиоидные анальгетики вызывают:

аналгезию; 2) угнетение дыхания; 3) лекарственную зависимость; 4) повышение моторики кишечника.

23. Буторфанол в меньшей степени, чем морфин:

угнетает дыхание; 2) замедляет продвижение химуса по кишечнику; 3) обладает наркотическим потенциалом; 4) вызывает экстрасистолы.

24. Неопиоидные анальгетики центрального действия:

ацетаминофен; 2) амитриптилин; 3) карбамазепин; 4) кетамин; 5) омнопон.

25. При головной боли и лихорадке применяют:

ацетаминофен; 2) амитриптилин; 3) карбамазепин; 4) кетамин; 5) омнопон.

26. При боли, обусловленной невралгией тройничного нерва, применяют:

ацетаминофен; 2) амитриптилин; 3) карбамазепин; 4) кетамин; 5) омнопон.

27. При боли, обусловленной острым инфарктом миокарда, травмами, а также при послеоперационной боли применяют:

ацетаминофен; 2) амитриптилин; 3) карбамазепин; 4) кетамин; 5) омнопон.

28. При боли, обусловленной воспалительными заболеваниями опорно-двигательного аппарата, применяют:

карбамазепин; 2) амитриптилин; 3) целекоксиб; 4) кетамин; 5) омнопон.

29. Ибупрофен вызывает:

противовоспалительный эффект; 2) болеутоляющий эффект; 3) ulcerогенный эффект; 4) эйфорию; 5) жаропонижающий эффект.

30. Типичные антипсихотические средства:

оланзапин; 2) хлорпромазин; 3) хлорпротиксен; 4) сульпирид; 5) галоперидол.

31. «Атипичные» антипсихотические средства:
галоперидол; 2) оланзапин; 3) хлорпротиксен; 4) рисперидон; 5) сульпирид.

32. Типичные антипсихотические средства вызывают:
уменьшение продуктивной симптоматики психозов; 2) экстрапирамидные расстройства; 3) психоседативное действие; 4) психостимулирующее действие.

33. Атипичные антипсихотические средства отличаются от типичных тем, что:

не устраняют продуктивную симптоматику психозов; 2) обладают психостимулирующими свойствами; 3) обладают антидепрессивными свойствами; 4) в меньшей степени вызывают экстрапирамидные расстройства.

34. Хлорпромазин вызывает:
антипсихотический эффект; 2) противорвотный эффект; 3) экстрапирамидные расстройства; 4) гипотензию; 5) антидепрессивный эффект.

35. Прессорное средство, неэффективное при гипотензии, вызванной хлорпромазином:
фенилэфрин; 2) адреналин; 3) норадреналин.

36. Основной механизм антипсихотического эффекта и экстрапирамидных расстройств, вызываемых типичными антипсихотическими средствами:

блокаду дофаминовых рецепторов; 2) блокаду холинорецепторов; 3) блокаду гистаминовых рецепторов.

37. Противопаркинсонический препарат, применяемый для коррекции лекарственного паркинсонизма, вызванного типичными антипсихотическими средствами:

селегилин; 2) леводопа; 3) тригексифенидил; 4) бромкриптин.

38. К антидепрессантам - ингибиторам МАО-А - относится:
моклобемид; 2) мапротилин; 3) флуоксетин; 4) amitриптилин; 5) мirtазапин.

39. Антидепрессанты - неизбирательные ингибиторы обратного нейронального захвата моноаминов:

1) ниламид; 2) флуоксетин; 3) имипрамин; 4) мапротилин; 5) амитриптилин.

40. К антидепрессантам - избирательным ингибиторам обратного нейронального захвата серотонина - относится:

1) моклобемид; 2) мапротилин; 3) флуоксетин; 4) амитриптилин; 5) миртазапин.

41. Антидепрессант, блокирующий пресинаптические α_2 -адренорецепторы:

1) миансерин; 2) мапротилин; 3) флуоксетин; 4) амитриптилин; 5) миртазапин.

42. При применении антидепрессантов моноаминергические процессы в ЦНС:

1) усиливаются; 2) ослабляются; 3) не изменяются.

43. Бензодиазепиновые анксиолитики:

1) диазепам; 2) буспирон; 3) медазепам; 4) феназепам; 5) хлордиазэпоксид.

44. «Дневные» анксиолитики:

1) диазепам; 2) буспирон; 3) медазепам; 4) феназепам; 5) хлордиазэпоксид.

45. Фармакологические эффекты бензодиазепиновых анксиолитиков: 1) анксиолитический; 2) противосудорожный; 3) психостимулирующий; 4) снотворный; 5) центральный миорелаксирующий; 6) амнестический.

46. Механизм действия бензодиазепиновых анксиолитиков:

1) накопление ГАМК в ЦНС; 2) прямая стимуляция ГАМК-А-рецепторов; 3) повышение чувствительности ГАМК-А-рецепторов к медиатору.

47. Диазепам применяют:

1) при неврозах; 2) при бессоннице; 3) для купирования эпилептического статуса; 4) для премедикации перед наркозом; 5) для улучшения памяти и обучения.

48. Психостимуляторы:

буспирон; 2) пирацетам; 3) кофеин; 4) мезокарб; 5) медазепам.

49. Психостимуляторы применяют:

для временного повышения умственной и физической работоспособности; 2) при бессоннице; 3) при нарколепсии.

50. К ноотропным средствам относится:

мезокарб; 2) пирацетам; 3) кофеин; 4) буспирон; 5) медазепам.

51. Ноотропные средства применяют:

для улучшения памяти и обучения при умственной недостаточности; 2) для стимуляции работоспособности при утомлении; 3) для ускорения восстановления функций после инсультов и травм головного мозга.

Определите лекарственные препараты.

52. Средство для ингаляционного наркоза. Не вызывает глубокого хирургического наркоза. Обладает выраженными болеутоляющими свойствами. Может использоваться для обезболивания родов и купирования болей при инфаркте миокарда.

Азота закись. 2. Пропофол. 3. Кетамин. 4. Галотан.

53. Средство для неингаляционного наркоза. Антагонист NMDA-рецепторов. Обладает выраженными болеутоляющими свойствами. Вызывает «диссоциативную анестезию». Действует 5-10 мин. Может вызвать галлюцинации.

Галотан. 2. Пропофол. 3. Азота закись. 4. Кетамин.

54. Противозепилептический препарат. Эффективен при всех формах эпилепсии. Угнетает глутаматергические процессы в ЦНС. Действует продолжительно (24-ч). В качестве побочных эффектов может вызвать диплопию, атаксию, головокружения.

Фенитоин. 2. Ламотриджин. 3. Фенобарбитал. 4. Натрия вальпроат.

55. Типичное антипсихотическое средство. Устраняет продуктивную симптоматику психозов (бред, галлюцинации). Обладает выраженными седативными и противорвотными свойствами. Вызывает экстрапирамидные нарушения. Снижает артериальное давление, извращает прессорное действие адреналина.

Галоперидол. 2. Оланзапин. 3. Хлорпромазин. 4. Хлорпротиксен. 5. Сульпирид.

56. Типичное антипсихотическое средство - производное бутирофенона. Имеет короткую продолжительность действия. Применяется в основном для премедикации (перед наркозом и инструментальными обследованиями), а также для нейролептаналгезии.

Галоперидол. 2. Оланзапин. 3. Хлорпромазин. 4. Хлорпротиксен. 5. Дроперидол.

57. Антидепрессант. Обладает антидепрессивными и седативными свойствами. Неизбирательно угнетает нейрональный захват моноаминов (норадреналина и серотонина). Может применяться в качестве анальгетика при нейропатических болях (боли в спине, боли при постгерпетической нейропатии).

Мапротилин. 2. Флуоксетин. 3. Амитриптилин. 4. Моклобемид.

58. Производное бензодиазепа. Обладает анксиолитическими, седативными, снотворными и противосудорожными свойствами. Вводится внутрь и внутривенно. Применяется при неврозах, в качестве снотворного средства, для премедикации перед наркозом, а также для купирования эпилептического статуса.

Нитразепам. 2. Буспирон. 3. Диазепам. 4. Медазепам.

59. Производное бензодиазепа. Уменьшает тревогу, страх, напряжение. Практически не вызывает сонливости. Применяется внутрь. Может использоваться в дневное время.

Диазепам. 2. Буспирон. 3. Нитразепам. 4. Медазепам.

60. Циклическое производное гамма-аминомасляной кислоты. Воспроизводит метаболические эффекты ГАМК в ЦНС. Обладает антигипоксическими свойствами. Вводится внутрь и внутривенно. Применяется для ускорения восстановления функций после перенесенных инсультов и травм головного мозга, а также для улучшения памяти и обучения при умственной недостаточности.

Диазепам. 2. Буспирон. 3. Пирацетам. 4. Мезокарб. Ответы на тестовые задания

1-1,3,6. 2-2,4,5. 3-2. 4-4. 5-2. 6-2,6. 7-1,4. 8-5. 9-3. 10-1,3,5. 11-1. 12-2. 13-3. 14-1,2,4. 15-3. 16-3. 17-2. 18-3. 19-3. 20-1,3. 21-2. 22-1,2,3. 23-1,2,3. 24-1,2,3,4. 25-1. 26-3. 27-5. 28-3. 29-1,2,3. 30-2,3,5. 31-2,4,5. 32-1,2,3. 33-4. 34-1,2,3,4.

35-2. 36-1. 37-3. 38- 39-3,5. 40-3. 41-1,5. 42-1. 43-
1,3,4,5. 44-2,3. 45-1,2,4,5,6. 46- 47-1,2,3,4. 48-3,4. 49-1,3.
50-2. 51-1,3. 52-1. 53-4. 54-2. 55-3. 56- 57-3. 58-3.
59-4. 60-3.

Раздел 6. Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему

NB! В данном разделе рассматриваются лекарственные средства, оказывающие влияние как на сердце, так и на сосуды. Эти лекарственные средства представлены следующими клинико-фармакологическими группами:

- средства, применяемые при сердечных аритмиях;
- средства, применяемые при ишемической болезни сердца;
- средства, применяемые при артериальной гипертензии;
- средства, применяемые при артериальной гипотензии;
- средства, применяемые при сердечной недостаточности;
- венотропные средства;
- средства, применяемые при нарушениях мозгового кровообращения;
- антиатеросклеротические средства.

Тема 6.1. Противоаритмические средства

NB! Под термином «аритмия» понимают любое отклонение сердечного ритма от синусового. Возникновение аритмий может быть связано с нарушением проводимости, автоматизма. Атипичные кардиомиоциты собраны в ассоциации, называемые «проводящая система сердца». Ее основными компонентами являются: синоатриальный (синусовый) узел, интернодальные (межузловые) проводящие пучки, атриовентрикулярный (предсердножелудочковый) узел, атриовентрикулярный пучок (пучок Гиса), делящийся на две ножки, и волокна Пуркинье.

При угнетении проводимости возникают блокады проводящей системы. При повышении автоматизма или повышении автоматизма с одновременным нарушением проводимости возникают экстрасистолы и тахиаритмии, которые по локализации подразделяются на желудочковые (вентрикулярные) и наджелудочковые (суправентрикулярные).

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация лекарственных средств, применяемых при тахикардиях и экстрасистолиях.

Блокаторы натриевых каналов. Классификация. Механизм антиаритмического действия. Сравнительная характеристика препаратов из разных подгрупп. Показания к применению. Побочные эффекты и противопоказания.

NB! Быстрый вход ионов натрия в волокно Пуркинье опосредует деполяризацию мембраны (фаза 0). Эта фаза определяет проводимость волокон Пуркинье. Кроме того, вход ионов натрия в волокно Пуркинье (наряду с выходом ионов калия) опосредует медленную диастолическую деполяризацию (фаза 4). Эта фаза определяет автоматизм волокон Пуркинье. Таким образом, блокада натриевых каналов приводит к снижению автоматизма и проводимости волокон Пуркинье.

β -Адреноблокаторы. Механизм антиаритмического действия. Показания к применению. Побочные эффекты и противопоказания.

NB! Симпатическая нервная система (через β_1 -адренорецепторы) повышает автоматизм и проводимость во всех отделах проводящей системы.

Таким образом, блокада β_1 -адренорецепторов атипичных кардиомиоцитов приводит к снижению их автоматизма и проводимости.

Блокада β_1 -адренорецепторов типичных кардиомиоцитов приводит к снижению их сократимости.

Блокаторы калиевых каналов (средства, пролонгирующие реполяризацию). Механизм антиаритмического действия амиодарона. Показания к применению. Побочные эффекты и противопоказания.

NB! Выход ионов калия из волокон Пуркинье изменяет заряд мембраны в электроотрицательном направлении. Вследствие этого движение ионов калия является основным фактором, обеспечивающим реполяризацию мембран волокон Пуркинье (фаза 3).

фазу 3 потенциала действия абсолютная рефрактерность (невозбудимость) волокна Пуркинье сменяется относительной. Период времени, в течение которого абсолютная рефрактерность сменяется относительной, обозначают термином «эффективный рефрактерный период».

Таким образом, блокада калиевых каналов приводит к удлинению продолжительности потенциала действия и увеличению эффективного рефрактерного периода (ЭРП).

Блокаторы кальциевых каналов (фенилалкиламины, бензотиазепины).
Механизм антиаритмического действия. Показания к применению.
Побочные эффекты и противопоказания.

NB! Деполяризация в кардиомиоцитах синоатриального и атриовентрикулярного узлов, в отличие от волокон Пуркинье, является результатом движения ионов кальция через потенциалзависимые кальциевые каналы.

Таким образом, блокада кальциевых каналов приводит к снижению автоматизма и проводимости клеток водителей ритма, что и обуславливает противоаритмическое действие блокаторов кальциевых каналов.

Блокада кальциевых каналов типичных кардиомиоцитов приводит к снижению их сократимости.

Препараты гликозидов наперстянки. Механизм противоаритмического действия при суправентрикулярных тахиаритмиях.

Препараты калия и магния. Механизм антиаритмического действия. Показания к применению.

Аденозин. Механизм противоаритмического действия.
Продолжительность действия и показания к применению.

Классификация лекарственных средств, применяемых при брадиаритмиях и блокадах сердца.

NB! Блокады проводящей системы являются результатом снижения проводимости. Симпатическая нервная система (через β_1 -адренорецепторы)

стимулирует проводимость во всех отделах сердца. Парасимпатическая нервная система (через M2-холинорецепторы) снижает проводимость в водителях ритма (синоатриальном и атриовентрикулярном узлах).

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Аденозин (аденокор)
Аймалин
Амиодарон (кордарон)
Аспаркам
Атенолол

Лаптаконитина гидробромид (аллапинин)
Мексилетин
Метопролол
Морапизина гидрохлорид (этmozин)
Нибентан

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию противоаритмических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

А. Средства, применяемые при тахикардиях и экстрасистолиях.

I. Блокаторы натриевых каналов. Подгруппа 1А:

- а)
- б)
- в)
- г)

Подгруппа 1В:

- а)
- б)
- в)

Подгруппа 1С:

- а)
- б)
- в)

β -Адреноблокаторы. Неселективные β -адреноблокаторы:

Кардиоселективные β_1 -адреноблокаторы:

- а)
- б)
- в)

Блокаторы калиевых каналов (средства, пролонгирующие реполяризацию):

- а) в) б) г)

IV. Блокаторы кальциевых каналов. Производные фенилалкиламина:

Производные бензотиазепина:

V. Разные средства, обладающие противоаритмической активностью.

Препараты гликозидов наперстянки:

Препараты калия и магния:

а)

б)

Препараты нуклеозидов:

Б. Средства, применяемые при брадиаритмиях и блокадах проводящей системы сердца. М-холиноблокаторы:

β -Адреномиметики:

Задание 2

Используя схему 6.1 (потенциал действия волокна Пуркинье), заполните табл.

6.1.

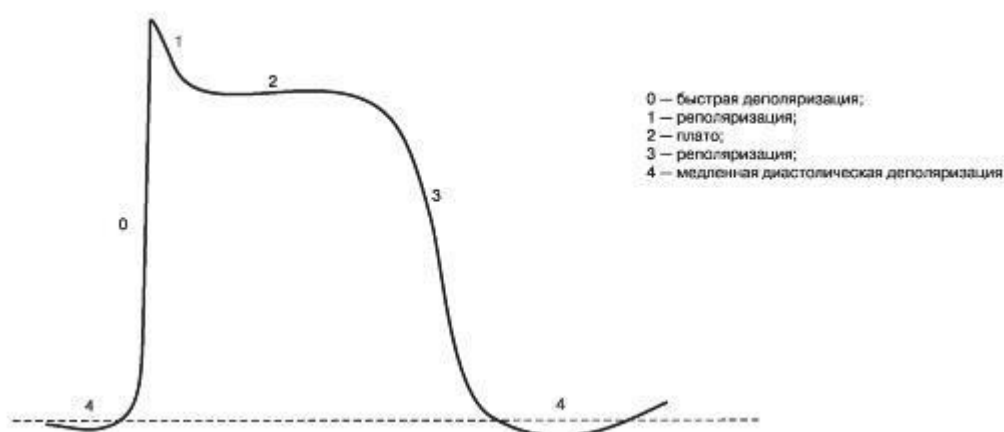


Схема 6.1. Потенциал действия волокна Пуркинье

Таблица 6.1. Фазы потенциала действия волокна

Пуркинье

Фаза потенциала действия волокна	Характеристика (название) фазы	Ионный механизм (вход или выход ионов Na ⁺ , K ⁺)	Какой параметр миокарда (проводимость, автоматизм, ЭРП) отражает
Пуркинье			

0

3

4

NB! Под экстрасистолой понимают внеочередное сокращение миокарда. Желудочковые экстрасистолы могут возникать в результате: 1) генерации внеочередного импульса в эктопических очагах; 2) «повторного входа» возбуждения (механизм re-entry).

Эктопические очаги возникают в желудочках в результате повышения автоматизма отдельных групп кардиомиоцитов. Повторный вход возбуждения возникает в результате однонаправленного блока проводимости, при котором невозможно проведение ортодромного импульса, а ретроградный импульс может проводиться через зону блокады, вызывая экстрасистолу.

Фармакотерапевтически целесообразными воздействиями при экстрасистолии являются:

снижение автоматизма, что приводит к подавлению активности эктопических очагов;

снижение проводимости, что приводит к переводу однонаправленного блока в двусторонний и прекращению циркуляции возбуждения по замкнутым цепям кардиомиоцитов;

увеличение эффективного рефрактерного периода, что приводит к пролонгированию времени «нечувствительности» миокарда к внеочередным импульсам и целесообразно как при первом, так и при втором механизмах возникновения экстрасистол.

Угнетение сократимости миокарда не приводит к противоаритмическому эффекту и расценивается как побочное действие противоаритмических средств.

Задание 3

Дайте фармакологическую характеристику блокаторов натриевых каналов подгруппы IA (хинидиноподобных средств) по следующей схеме.

А. Механизм действия: влияние на ионный канал → изменение фазы ПД (0, 3, 4) → изменение параметра миокарда (проводимость, эффективный рефрактерный период, автоматизм).

Б. На какой отдел миокарда влияют (желудочки,водители ритма).

В. При каких аритмиях применяются (желудочковые, наджелудочковые и те и другие). Г. Характерные побочные эффекты.

Задание 4

Дайте фармакологическую характеристику блокаторов натриевых каналов подгруппы IV по следующей схеме.

А. Механизм действия: влияние на ионный канал - изменение фазы ПД - изменение параметра миокарда.

Б. На какой отдел миокарда влияют (желудочки,водители ритма).

В. При каких аритмиях применяются (желудочковые, наджелудочковые и те и другие).

Г. Характерные побочные эффекты.

NB! Препараты подгруппы IV являются средствами выбора при желудочковых экстрасистолиях, вызванных инфарктом миокарда и передозировкой сердечных гликозидов. Это обусловлено тем, что эти препараты:

мало влияют на сократимость и, таким образом, не препятствуют положительному инотропному действию сердечных гликозидов, а также не снижают существенно сердечный выброс при инфаркте миокарда;

мало влияют на атриовентрикулярную проводимость;

мало влияют на артериальное давление.

Задание 5

Дайте фармакологическую характеристику блокаторов натриевых каналов подгруппы IC по следующей схеме.

А. Механизм действия: влияние на ионные каналы и изменение фаз ПД.

Б. При каких аритмиях применяются (желудочковые, наджелудочковые и те и другие).

Характерные побочные эффекты.

NB! Большинство препаратов подгруппы IC применяются главным образом при угрожающих жизни желудочковых экстрасистолиях, резистентных к другим противоаритмическим средствам. Ограниченная сфера их применения обусловлена выраженными проаритмическим, кардиодепрессивным и отрицательным дромотропным эффектами.

Исключение составляет лапаконитин. Он мало угнетает автоматизм синусного узла, атриовентрикулярную проводимость (снижая проводимость по пучку Гиса и добавочным пучкам), практически не снижает сократимость и артериальное давление. Применяется как при желудочковой экстрасистолии, так и при наджелудочковых тахиаритмиях.

Задание 6

Дайте фармакологическую характеристику амиодарона по следующей схеме.

А. Механизм действия: влияние на ионные каналы и изменение фаз ПД.

Б. На какой отдел миокарда влияет (желудочки, водители ритма).

В. При каких аритмиях применяется (желудочковые, наджелудочковые и те и другие).

Г. Характерные побочные эффекты.

NB! Волокна атриовентрикулярного пучка (пучка Гиса) содержат большое количество калиевых каналов, поэтому фаза реполяризации в них значительно короче, чем в других отделах проводящей системы. Короткий период рефрактерности определяет высокий уровень проводимости волокон атриовентрикулярного пучка.

Нибентан избирательно блокирует калиевые каналы, что приводит к пролонгированию реполяризации, увеличению эффективного рефрактерного периода и снижению проводимости главным образом в волокнах атриовентрикулярного пучка. Эффективен только при наджелудочковых тахиаритмиях.

Задание 7. Дайте фармакологическую характеристику верапамила по следующей схеме.

А. С влиянием на какой отдел миокарда (желудочки, водители ритма) связано противоаритмическое действие верапамила.

Б. Механизм противоаритмического действия верапамила.

В. При каких аритмиях применяется (желудочковые, наджелудочковые и те и другие). Г. Характерные побочные эффекты.

Задание 8. Заполните табл. 6.2.

Таблица 6.2. Сравнительная характеристика противоаритмических средств, влияющих на ионные каналы кардиомиоцитов

Параметры сравнения		Группы противоаритмических средств в				
		IA	IB	IC	III	IV
	Натриевых					
Блокада каналов	Калиевых					
	Кальциевых					

	Фаза 0
Влияние на ПД волокон	
Пуркинье	Фаза 3
	Фаза 4
	Длительность ПД
Влияние на параметры	Проводимость, автоматизм
миокарда	Продолжительность ЭРП Наджелудочковых Желудочковых
Применение при аритмиях	

Примечание. При заполнении таблицы используйте следующие обозначения: «+» - наличие эффекта; «↑» - повышение; «↓» - снижение.

Задание 9

А. Объясните механизм действия сердечных гликозидов при тахиаритмической форме мерцательной аритмии.

Б. Объясните механизм противоаритмического действия препаратов калия и магния. Перечислите показания к применению этих препаратов в качестве противоаритмических средств.

В. Объясните механизм противоаритмического действия аденозина. При каких аритмиях применяется аденозин?

Задание 10. Заполните табл. 6.3.

Таблица 6.3. Побочные эффекты противоаритмических средств

	Хинидин ил	Лидокаин	Пропранолол	Амиодарон	Верапам
Побочные эффекты					
Снижение сократимости миокарда					
Нарушение атриовентрикулярной проводимости					
	121				

Артериальная гипотензия					
Бронхоспазм					
Нарушение функции щитовидной железы					

Отложение микрокристаллов в роговице

Альвеолиты; фиброзные изменения в легких

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

При тахикардиях и экстрасистолиях применяют:

1) блокаторы натриевых каналов; 2) бета-адреноблокаторы; 3) блокаторы кальциевых каналов; 4) М-холиноблокаторы; 5) блокаторы калиевых каналов.

Только при наджелудочковых тахикардиях и экстрасистолиях применяют:

1) пропранолол; 2) верапамил; 3) аденозин; 4) лидокаин; 5) небинтан.

Только при желудочковых тахикардиях и экстрасистолиях применяют:

1) амиодарон; 2) соталол; 3) лидокаин; 4) хинидин; 5) прокаинамид.

Определите лекарственные препараты.

Блокирует калиевые каналы, увеличивает эффективный рефрактерный период. В некоторой степени блокирует натриевые и кальциевые каналы, а также β -адренорецепторы. Применяется при желудочковых и наджелудочковых нарушениях ритма, стенокардии. В качестве побочных эффектов вызывает брадикардию, нарушение атриовентрикулярной проводимости, нарушение функций щитовидной железы, бронхоспазм.

1. Верапамил. 2. Амиодарон. 3. Пропранолол. 4. Хинидин. 5. Дизопирамид.

Препараты	Механизмы действия
6. Прокаинамид.	А. Блокирует калиевые каналы.
7. Метопролол.	Б. Блокирует β_1 -адренорецепторы.
8. Верапамил.	В. Блокирует кальциевые каналы L-типа.
9. Небинтан.	Г. Блокирует натриевые каналы.
10. Лидокаин.	Д. Блокирует натриевые и калиевые каналы.

Обладает противоаритмической и противосудорожной активностью. Существенно не влияет на сократимость миокарда и уровень артериального давления. Препарат выбора при аритмиях, вызванных передозировкой сердечных гликозидов.

Панангин 2. Морацизин. 3. Фенитоин. 4. Соталол. 5.

Пропафенон.

Совместите.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Пропранолол применяют при тахиаритмиях и экстрасистолиях, потому что пропранолол снижает сократимость миокарда.

Хинидин является препаратом выбора для устранения желудочковых аритмий, связанных с инфарктом миокарда, потому что хинидин не влияет на сократимость миокарда и уровень артериального давления.

Верапамил применяют при наджелудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях, потому что верапамил снижает автоматизм и проводимость синоатриального и атриовентрикулярного узлов.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство при атриовентрикулярном блоке.

<i>Rp.: Isoprenalini 0,005 D.t.d.N. 20 in tab. S. По 1 таблетке внутрь.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Б. Средство при желудочковых экстрасистолиях из группы IV.

<i>Rp.: Fenitoini 0, 117 D.t.d.N. 20 in tab. S. По 1 таблетке 2 раза в день.</i>	Ваши замечания
--	----------------

В. Противоаритмическое средство из группы блокаторов калиевых каналов.

<i>Rp.: Verapamili 0,04 D.t.d.N. 20 in tab. S. По 1 таблетке 2 раза в день.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3,5.2-2,3,5.3-3.4-2.5-3.6-Д.7-Б.8-В.9-А.10-Г.11-верно, верно, связи нет.
12 - неверно, неверно, связи нет. 13 - верно, верно, связь есть.

Тема 6.2. Средства, применяемые при недостаточности коронарного кровообращения

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Понятие об ишемической болезни сердца.

NB! Под ишемической болезнью сердца понимают патологическое состояние, в основе которого лежит недостаточность коронарного кровотока. Основными формами ишемической болезни сердца являются стенокардия и инфаркт миокарда. Стенокардия обычно проявляется приступами сжимающих болей за грудиной локализации, иррадиирующих обычно в левую руку, левое плечо, под левую лопатку. Причиной приступа за грудиных болей является несоответствие между потребностью миокарда в кислороде и доставкой кислорода к миокарду. Выделяют следующие формы стенокардии:

стенокардия напряжения (стабильная), при которой приступы за грудиных болей возникают при физическом или эмоциональном напряжении;

вазоспастическая (вариантная, стенокардия Принцметала), при которой приступ возникает вследствие спазма коронарных сосудов;

стенокардия покоя (нестабильная), при которой приступы возникают в состоянии покоя, вне связи с физическим или эмоциональным напряжением, и связаны с образованием тромба в коронарных сосудах на фоне их выраженного атеросклероза.

2. Основные принципы фармакологической коррекции стенокардии.

NB! Синоним термина «стенокардия» - «грудная жаба» (*angina pectoris*). В связи с этим препараты, применяемые при стенокардии, принято называть антиангинальными.

Классификация антиангинальных средств.

Миотропные и рефлекторные коронарорасширяющие средства.

Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

Противопоказания.

Бета-адреноблокаторы. Классификация. Механизм антиангинального действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

Противопоказания.

Брадикардические (брадикардитические) средства. Механизм антиангинального действия, показания к применению, побочные эффекты.

NB! Брадикардические средства блокируют It-каналы в синусном узле, что приводит к снижению его автоматизма и возникновению брадикардии, не сопровождающейся отрицательным инотропным действием.

Органические нитраты. Классификация. Механизм сосудорасширяющего действия. Механизм антиангинального действия. Сравнительная характеристика препаратов. Побочные эффекты.

Блокаторы кальциевых каналов. Классификация по химической структуре и тканевой специфичности. Механизмы антиангинального действия, показания к применению и побочные эффекты блокаторов кальциевых каналов разных групп. Противопоказания.

NB! Применяемые в кардиологии блокаторы кальциевых каналов L-типа классифицируют по химической структуре, которая определяет их «тканевую специфичность», т.е. преимущественное влияние на кардиомиоциты или ангиомиоциты.

Кардиопротекторные средства. Механизм действия. Показания к применению.

NB! В комплексной терапии ишемической болезни сердца применяют препараты, повышающие устойчивость кардиомиоцитов к гипоксии (кардиопротекторные средства). Эти препараты не влияют на коронарный кровоток, а нормализуют метаболические процессы в миокарде. Основным представителем этой группы - триметазидин (предуктал).

Принципы фармакотерапии инфаркта миокарда. Группы средств, используемых в комплексной терапии инфаркта миокарда.

NB! Инфаркт миокарда в остром периоде, как правило, сопровождается:
болевым синдромом;

сердечными (желудочковыми) аритмиями;

острой сердечной недостаточностью;

снижением артериального давления.

комплексной терапии инфаркта миокарда используют лекарственные средства из различных фармакологических групп.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО

Амлодипин (норваск)
Атенолол
Валидол
Верапамил (изоптин, финоптин)
Дилтиазем (кардил)
Дипиридамол (курантил)
Ивабрадин (кораксан)
Изосорбида динитрат (китросорбид)
Изосорбида мононитрат

Метопролол
Молсидомин (корватон)
Никорандил
Нитроглицерин
Нифедипин (коринфар, фенигидин)
Пропранолол (анаприлин)
Талинолол
Триметазидин (предуктал)

ТЕМЕ

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию антиангинальных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, повышающие доставку кислорода к миокарду.

Миотропные коронарорасширяющие средства:

_____.

Рефлекторные коронарорасширяющие средства:

_____.

Средства, понижающие потребность миокарда в кислороде. β -Адреноблокаторы.

Неселективные β -адреноблокаторы:

_____.

Селективные β_1 -адреноблокаторы: а)

_____.

б) в) Брадикардические средства:

_____.

Средства, повышающие доставку и снижающие потребность миокарда в кислороде.

Донаторы NO.

Органические нитраты: а)

б)

в)

Производные сиднонимина:

Блокаторы кальциевых каналов.

Производные 1,4-дигидропиридина: а)

б) Производные фенилалкиламина:

Производные бензотиазепина:

Активаторы калиевых каналов:

Каким цифрам на схеме 6.2 соответствует действие: дипиридамола (), пропранолола (), нифедипина (), верапамила (), нитроглицерина (), ивабрадина ().

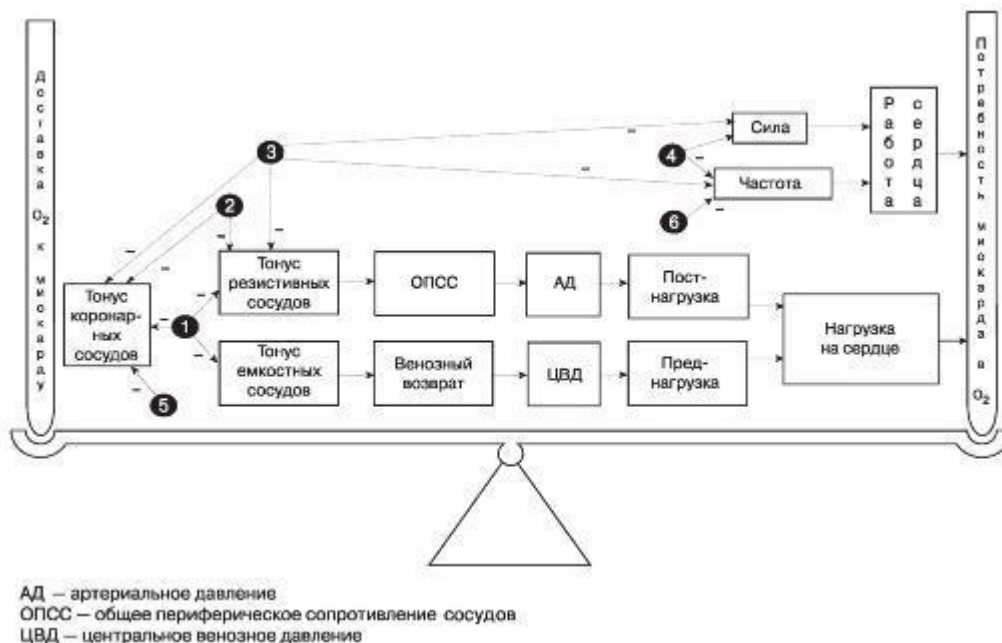


Схема 6.2. Механизмы действия антиангинальных средств

Задание 3

А. Объясните механизм сосудорасширяющего действия органических нитратов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Образование оксида азота (NO) в ходе метаболических превращений.

Релаксация гладких мышц сосудов.

Снижение содержания ионизированного Ca^{2+} в гладких мышцах сосудов.

Активация гуанилатциклазы и повышение синтеза цГМФ.

Б. Объясните механизм развития привыкания (толерантности) к органическим нитратам и укажите пути его преодоления.

В. Используя схему 6.2, объясните механизм антиангинального действия органических нитратов.

NB! Увеличение доставки кислорода к миокарду при действии нитроглицерина имеет следующие механизмы.

Нитроглицерин расширяет крупные и коллатеральные коронарные сосуды, но не расширяет мелкие коронарные сосуды, в связи с чем происходит перераспределение коронарного кровотока в пользу ишемизированного участка миокарда.

Нитроглицерин расширяет емкостные сосуды. Это приводит к снижению венозного возврата к сердцу и центрального венозного давления (уменьшение преднагрузки на сердце). Уменьшается диастолическое растяжение желудочков и происходит снижение экстравазальной компрессии субэндокардиальных коронарных сосудов.

Нитроглицерин угнетает центральные звенья коронаросуживающего рефлекса.

Г. Дайте сравнительную характеристику препаратов органических нитратов. Результаты отразите в табл. 6.4.

Таблица 6.4. Сравнительная характеристика препаратов органических нитратов

Название	Название	Начало	Продолжительность	Купирование
лекарственного	лекарственной	Пути введения действия,	действия (минуты,	и/или

средства

формы

мин

часы)

профилактика

приступов

					стенокардии
Нитроглицерин	Таблетки, капсулы, аэрозоль				
	Таблетки «Сустанк-форте»				
	Таблетки «Нитрогранулонг»				
	Пластырь «Депонит»				
Изосорбид а динитрат	Аэрозоль «Изомаксспрей»				
	Таблетки нитросорбида				
Изосорбид а мононитрат	Таблетки «Изомонат»				
	Таблетки «Эфоксалонг»				

Д. Решите ситуационную задачу.

Ситуационная задача

Больному, 56 лет, по поводу стенокардии назначены капсулы с масляным раствором нитроглицерина. В каком положении (стоя, сидя, лежа) целесообразно купировать приступы стенокардии?

Е. Укажите характерные побочные эффекты органических нитратов.

Отметьте их в табл. 6.6. Объясните механизм их возникновения.

Задание 4

А. Объясните связь между тканевой селективностью, фармакологическими эффектами и показаниями к применению блокаторов кальциевых каналов (табл. 6.5).

Таблица 6.5. Фармакологические эффекты и показания к применению блокаторов кальциевых каналов

--	--	--	--

кардиомиоцитов артериальных сосудов

	1.	1.
Дигидропиридины	2.	2.
		1.
Фенилалкиламин ы		2.
		3.
		1.
Бензотиазепины		2.
		3.

Примечание. При заполнении графы «Преимущественная блокада кальциевых каналов» используйте символ «+». При заполнении графы «Показания к применению» используйте следующие показания: стенокардия, артериальная гипертензия, наджелудочковые тахиаритмии.

Б. Объясните механизмы антиангинального действия блокаторов кальциевых каналов из разных химических групп, используя схему 6.3.

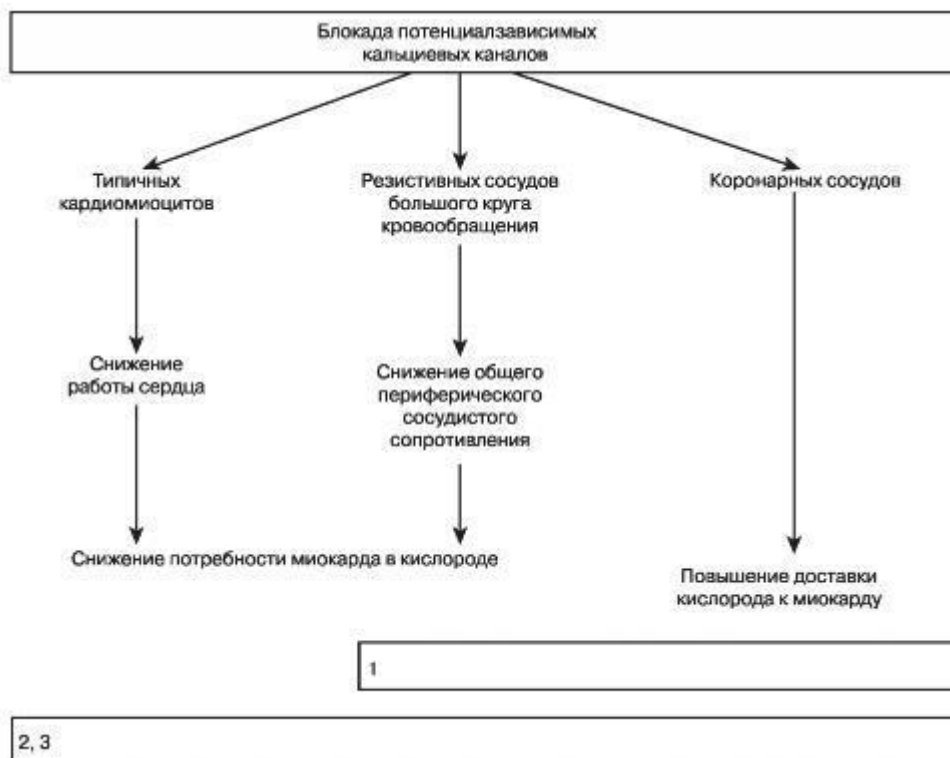


Схема 6.3. Механизм антиангинального действия блокаторов кальциевых каналов из разных химических групп

В. Укажите характерные побочные эффекты блокаторов кальциевых каналов.

Отметьте их в табл. 6.6. Объясните механизм их возникновения.

NB! В настоящее время фармацевтической промышленностью выпускаются блокаторы кальциевых каналов длительного действия (амлодипин, фелодипин, лацидипин), а также лекарственные формы блокаторов кальциевых каналов с замедленным высвобождением действующего вещества (верапамил SR, алтиазем SR, нифедипин GITS, осмо-адалат).

Применение пролонгированных форм позволяет уменьшить суточную дозу препарата и снизить риск развития побочных эффектов.

Задание 5

А. Объясните механизм антиангинального действия β -адреноблокаторов, используя схему 6.2.

Б. Укажите побочные эффекты β -адреноблокаторов (табл. 6.6) и объясните, в чем состоят преимущества кардиоселективных β_1 -адреноблокаторов. Задание 6

Заполните табл. 6.6.

Таблица 6.6. Побочные эффекты антиангинальных средств

Побочные эффекты	Нитроглицерин	Пропранолол	Нифедипин	Верапамил	Дипиридамол
Гипотензия					
Головная боль					
Головокружение					
Тахикардия					
Брадикардия					
Затруднение А-В-проводимости					

Ослабление сердечных сокращений

Бронхоспазм

Синдром «обкрадывания»

Отек лодыжек

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 7

Укажите группы средств и препараты, применяемые при остром инфаркте миокарда (табл. 6.7). Таблица 6.7. Фармакотерапия острого инфаркта миокарда

Цель фармакотерапии	Группы лекарственных средств	Препараты
Купирование болевого синдрома		
Купирование желудочковых аритмий		
	1.	
Профилактика тромбообразования	2.	
	3.	
Нормализация гемодинамики («разгрузка» сердца и улучшение коронарного кровообращения)		

Примечание. При заполнении графы «Группы лекарственных средств» используйте следующие фармакологические группы: органические нитраты, блокаторы Na⁺-каналов подгруппы IV, антиагреганты, опиоидные анальгетики, фибринолитические средства, антикоагулянты прямого действия. При заполнении графы «Препараты» используйте следующие препараты: лидокаин, морфин, азота закись, нитроглицерин, ацетилсалициловая кислота, гепарин, алтеплаза, стрептокиназа.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

Средства, одновременно уменьшающие потребность миокарда в кислороде и увеличивающие доставку кислорода к миокарду:

1) дилтиазем; 2) нитроглицерин; 3) нифедипин; 4) пропранолол; 5) верапамил.

Антиангинальное действие нитроглицерина обусловлено:

уменьшением преднагрузки на сердце;
уменьшением постнагрузки на сердце;
расширением крупных коронарных сосудов;
улучшением коллатерального кровообращения;
рефлекторным коронарорасширяющим действием.

3. Антиангинальное действие верапамила обусловлено:

уменьшением преднагрузки на сердце;
расширением мелких коронарных сосудов;
снижением силы и частоты сердечных сокращений.

Антиангинальное действие пропранолола обусловлено:

снижением силы и частоты сердечных сокращений;
уменьшением преднагрузки на сердце;
расширением крупных коронарных сосудов.

Для купирования приступов стенокардии применяют:

1) спрей с нитроглицерином; 2) таблетки «Сустак-форте»; 3) капсулы с нитроглицерином; 4) пластырь с нитроглицерином; 5) таблетки «Нитрогранулонг».

Для лечения инфаркта миокарда применяют:

1) опиоидные анальгетики; 2) фибринолитики; 3) антиагреганты; 4) органические нитраты; 5) противоаритмические средства; 6) эпинефрин.

Побочные эффекты органических нитратов:

1) головная боль; 2) головокружение; 3) гипотензия; 4) рефлекторная тахикардия; 5) синдром «обкрадывания».

Определите лекарственные препараты.

Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет ослабления и урежения сокращений сердца. Расширяет коронарные сосуды. В качестве побочных эффектов вызывает брадикардию, нарушение атриовентрикулярной проводимости, снижение сократимости миокарда, запор.

Нитроглицерин. 2. Атенолол. 3. Пропранолол. 4. Верапамил. 5. Нифедипин.

Уменьшает потребность миокарда в кислороде за счет уменьшения частоты сердечных сокращений. Не оказывает влияния на тонус коронарных сосудов и на артериальное давление. В качестве побочных эффектов вызывает фотопсии (вспышки света в зрительных полях).

Нифедипин 2. Ивабрадин. 3. Пропранолол. 4. Нитроглицерин. 5. Атенолол.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
10. Нитроглицерин.	А. Блокирует I ₂ -каналы.
11. Ивабрадин.	Б. Блокирует β ₁ -адренорецепторы.
12. Дипиридамол.	В. Блокирует кальциевые каналы L-типа.
13. Атенолол.	Г. Ингибирует аденозиндезаминазу.
14. Нифедипин.	Д. Образует оксид азота в ходе метаболических превращений.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Пропранолол оказывает антиангинальное действие, потому что пропранолол уменьшает потребность миокарда в кислороде.

Нитроглицерин уменьшает преднагрузку на сердце, потому что нитроглицерин расширяет артериальные сосуды.

Триметазидин оказывает кардиопротекторное действие, потому что триметазидин устраняет несоответствие между потребностью сердца в кислороде и его доставкой.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Препараты из группы нитратов для купирования приступов стенокардии.

<i>Rp.: Nitroglycerini 0,0005 D.l.d.N. 40 in tab. S. По 1 таблетке внутрь при приступе.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Б. Средство для профилактики приступов стенокардии напряжения.

<i>Rp.: Propranololi 0,4</i> <i>D.t.d.N. 20 in tab.</i> <i>S. По 1 таблетке 3 раза в день.</i>	Ваши замечания
--	----------------

Кардиопротекторное

<i>Rp.: Trimetazidini 0,02</i> <i>D.t.d.N. 20 in tab.</i> <i>S. По 1 таблетке 2 раза в день.</i>	Ваши замечания
--	----------------

средство.

Ответы на тестовые задания

1-2,3,5. 2-1,2,3,4. 3-2,3. 4-1. 5-1,3. 6-1,2,3,4,5. 7-1,2,3,4. 8-4. 9 -
10 - Д. 11 - А. 12 - Г. 13 - Б. 14 - В. 15 - верно, верно, связь есть. 16 -
верно, верно, связи нет. 17 - верно, неверно, связи нет.

Тема 6.3. Антигипертензивные средства. Гипертензивные средства (средства, применяемые при артериальной гипотензии)

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Принципы фармакологического влияния на системное артериальное давление.

NB! Уровень артериального давления зависит от:

работы сердца (сердечного выброса);

тонуса периферических сосудов (общего периферического сосудистого сопротивления);

объема циркулирующей жидкости (объема циркулирующей крови).

Классификация антигипертензивных средств.

Нейротропные антигипертензивные средства. Классификация.

Локализация и механизм действия. Побочные эффекты.

NB! Симпатическая нервная система регулирует работу сердца (через β_1 -адренорецепторы), тонус сосудов (через α_1 -адренорецепторы), а также секрецию ренина (через β_1 -адренорецепторы).

Снизить артериальное давление можно путем угнетения центров симпатической нервной системы или путем блокады периферической симпатической иннервации.

Миотропные сосудорасширяющие средства. Классификация. Механизм действия. Побочные эффекты.

NB! Фармакологические свойства лекарственных веществ, расширяющих емкостные сосуды (венулы), и веществ, которые в основном расширяют

резистивные сосуды (артериолы), неодинаковы. И те и другие вещества снижают артериальное давление и увеличивают секрецию ренина. При этом вещества, расширяющие емкостные сосуды, вызывают выраженную рефлекторную тахикардию и ортостатическую гипотензию, а вещества, расширяющие резистивные сосуды, вызывают умеренную рефлекторную тахикардию и не вызывают ортостатической гипотензии.

Средства, снижающие активность ренин-ангиотензиновой системы. Классификация. Локализация и механизмы действия. Сравнительная характеристика ингибиторов АПФ и блокаторов ангиотензиновых АТ1-рецепторов. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Секреция ренина стимулируется:

повышением тонуса симпатической нервной системы (за счет стимуляции β 1-адренорецепторов юкстагломерулярных клеток почек);

снижением давления и уменьшением кровотока в почечных артериолах.

Ренин способствует образованию ангиотензина-I из ангиотензиногена. Ангиотензин-II образуется из ангиотензина-I под влиянием ангиотензинпревращающего фермента (АПФ).

Ангиотензин-II, стимулируя специфические АТ1-рецепторы резистивных сосудов, вызывает повышение их тонуса; стимулируя АТ1-рецепторы коры надпочечников, усиливает выделение альдостерона.

а) _____;

Кроме того, ангиотензин-II стимулирует симпатическую иннервацию сердца и сосудов.

Средства, снижающие активность ренин-ангиотензиновой системы.

Средства, снижающие секрецию ренина (группа препаратов):

Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента (АПФ):

а) _____;

б) _____;

в) _____;

Блокаторы АТ1-рецепторов:

Средства, влияющие на водно-солевой баланс

(диуретики)

а) _____;

б) _____;

в) _____;

г) _____;

Задание 3

На схеме 6.5 отметьте действие: клонидина, моксонидина, азаметония, резерпина, атенолола, празозина, нифедипина, натрия нитропруссид, эналаприла, лозартана, гидрохлоротиазида.

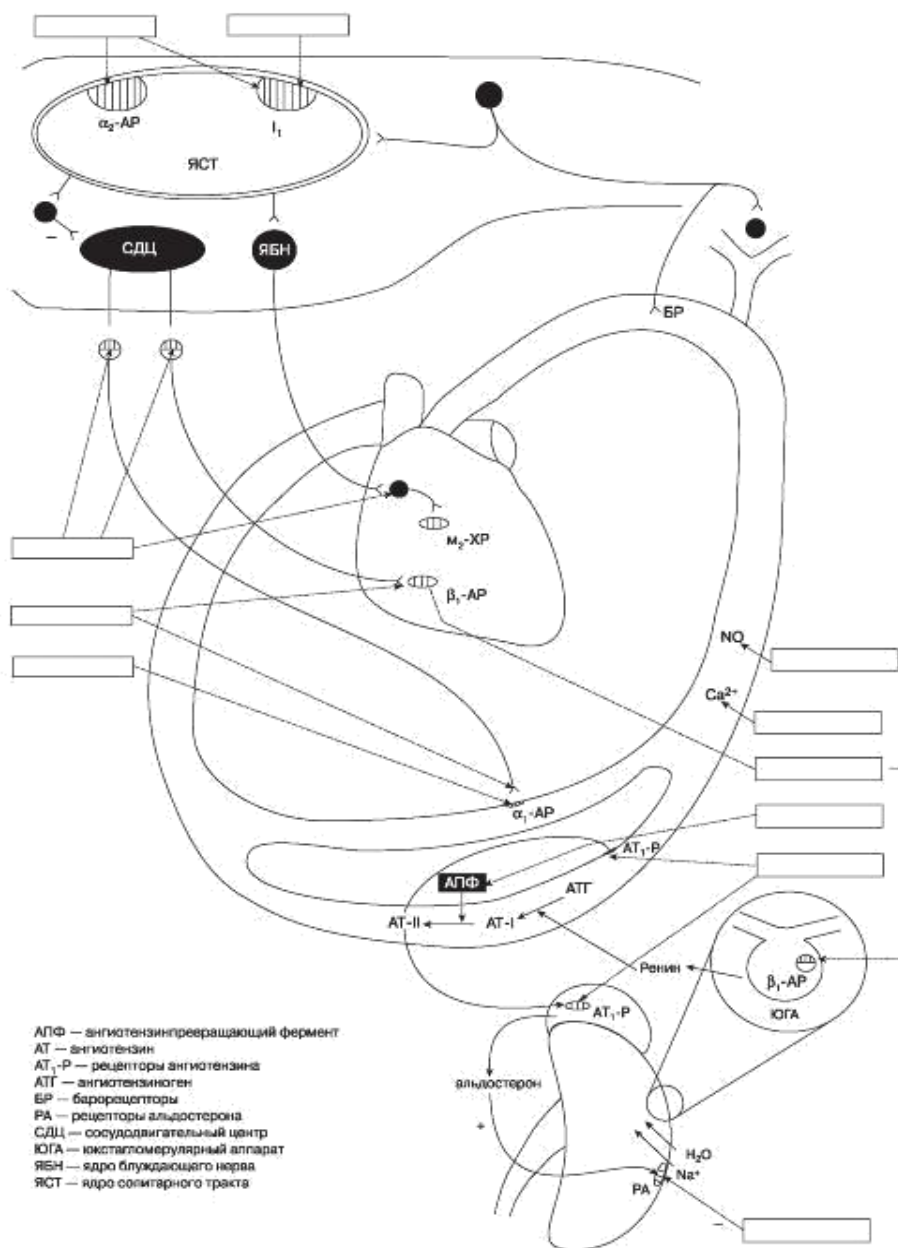


Схема 6.5. Локализация и механизмы действия антигипертензивных средств

Задание 4

А. Объясните механизм антигипертензивного действия клонидина, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Стимуляция центральных α_2 -адренорецепторов и имидазолиновых II-рецепторов.

Расширение сосудов и уменьшение сердечного выброса.

Снижение артериального давления.

Угнетение сосудодвигательного центра и возбуждение центра блуждающего нерва.

Б. Объясните различия между клонидином и моксонидином (табл. 6.8).

Таблица 6.8. Сравнительная характеристика клонидина и моксонидина

Параметры сравнения	Клонидин	Моксонидин
Механизм действия	Стимуляция центральных α_2 -адренорецепторов	Стимуляция центральных 11-имидазолиновых рецепторов
Применение	Купирование гипертензивных кризов	Систематическое лечение артериальной гипертензии
Пути введения		
Продолжительность действия		Выраженное седативно-снотворное действие
Побочные эффекты	Сухость во рту	Синдром «отмены»

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 5

А. Объясните механизм антигипертензивного действия ганглиоблокаторов. Почему ганглиоблокаторы не используют для систематического лечения артериальной гипертензии?

Б. Объясните механизм антигипертензивного действия симпатолитиков.

В. Объясните механизм антигипертензивного действия α -адреноблокаторов. Почему для систематического лечения артериальной гипертензии используют преимущественно α_1 адреноблокаторы?

Г. Объясните механизм антигипертензивного действия β -адреноблокаторов.

Задание 6

А. Дайте определение термину «миотропное сосудорасширяющее средство».

Б. Объясните механизм сосудорасширяющего и антигипертензивного действия натрия нитропруссид (табл. 6.9). Назовите показания к применению. Перечислите побочные эффекты (табл. 6.10).

В. Объясните механизм антигипертензивного действия блокаторов кальциевых каналов. Укажите различия между производными 1,4-дигидропиридина и фенилалкиламина (результаты отразите в табл. 6.9). Перечислите побочные эффекты (табл. 6.10).

Г. Объясните механизм антигипертензивного действия активаторов калиевых каналов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Активация (открытие) калиевых каналов.

Расширение артериальных сосудов и снижение артериального давления.

Уменьшение частоты открывания потенциалзависимых кальциевых каналов.

Выход ионов калия из ангиомиоцитов.

Гиперполяризация клеточных мембран ангиомиоцитов.

Уменьшение входа ионов кальция в ангиомиоциты. Перечислите побочные эффекты диазоксида (табл. 6.9 и 6.10).

Д. Перечислите показания к применению бендазола и гидралазина.

Е. Заполните табл. 6.9.

Таблица 6.9. Влияние антигипертензивных средств на тонус сосудов, сердечный выброс и секрецию ренина

Препарат	Тонус резистивных сосудов	Тонус емкостных сосудов	Сердечный выброс	Секреция ренина
Натрия нитропруссид				

Нифедипин

Верапамил

Диазоксид

Гидралазин

Примечание. При заполнении таблицы используйте следующие обозначения: «↑» - повышение; «↓» - снижение.

Ж. Ответьте на следующие вопросы. Какие ЛС вызывают ортостатическую гипотензию? Какой препарат не следует применять при сердечной недостаточности?

3. Заполните табл. 6.10.

Таблица 6.10. Побочные эффекты антигипертензивных средств

	Натрия нитропруссид	Нифедипин	Верапамил	Диазоксид	Гидралазин
Побочные эффекты					
Ортостатическая гипотензия					
Головокружение					
Головная боль					
Тахикардия					
Брадикардия					
Затруднение атриовентрикулярной проводимости					
Ослабление сокращений сердца					
Задержка натрия и воды					

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Какой группой препаратов целесообразно комбинировать приведенные в таблице вещества?

Задание 7

А. Нарисуйте схему ренин-ангиотензиновой системы и укажите локализацию действия лекарственных средств, снижающих ее активность.

Б. Объясните механизм антигипертензивного действия ингибиторов АПФ и блокаторов ангиотензиновых АТ1-рецепторов.

В. Заполните табл. 6.11.

Таблица 6.11. Сравнительная характеристика ингибиторов ангиотензинпревращающего фермента и блокаторов ангиотензиновых АТ1-рецепторов

Параметры сравнения	Ингибиторы	Блокаторы АТ1-
	АПФ	рецепторов
Ангиотензина-П		
Содержание в крови	Альдостерона	
	Брадикинина	
Систематическое лечение артериальной гипертензии		
Применение	Лечение хронической сердечной недостаточности	
	Головокружение	
Побочные эффекты	Сухой кашель	
	Ангионевротический отек	

Примечание. При заполнении таблицы используйте следующие обозначения: «↑»-повышение; «↓» - снижение; «+» - наличие эффекта.

Задание 8. Объясните, с какими целями при артериальной гипертензии назначают диуретики. Какие диуретики являются средствами выбора для систематического лечения артериальной гипертензии?

Задание 9

А. Укажите состав приведенных ниже комбинированных антигипертензивных средств.

Адельфан-эзидрекс К = _____ + _____ + _____ + _____.

Трирезид К = _____ + _____ + _____ + _____.

Кристефин = _____ + _____ + _____.

Б. Объясните принцип составления комбинаций.

Задание 10. Из списка лекарственных препаратов по теме выберите средства, повышающие артериальное давление. Объясните механизм их гипертензивного действия.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Нейротропные антигипертензивные средства:

1) моксонидин; 2) доксазозин; 3) нифедипин; 4) атенолол; 5) клонидин.

2. Средства, угнетающие ренин-ангиотензиновую систему:

1) лозартан; 2) эналаприл; 3) пропранолол; 4) гидрохлоротиазид; 5) периндоприл.

3. Для систематического лечения артериальной гипертензии применяют:

1) азаметония бромид; 2) периндоприл; 3) доксазозин; 4) бетаксолол; 5) амлодипин.

4. Антигипертензивное действие за счет снижения сердечного выброса оказывают:

1) верапамил; 2) нифедипин; 3) пропранолол; 4) натрия нитропруссид; 5) гидралазин.

5. Антигипертензивное действие преимущественно за счет расширения сосудов оказывают:

1) верапамил; 2) нифедипин; 3) доксазозин; 4) амлодипин; 5) диазоксид.

6. Антигипертензивное действие за счет расширения сосудов и уменьшения объема циркулирующей крови оказывают:

1) гидралазин; 2) гидрохлоротиазид; 3) пропранолол; 4) празозин.

7. Антигипертензивное действие за счет снижения сердечного выброса и расширения сосудов оказывают:

1) клонидин; 2) дилтиазем; 3) карведилол; 4) индапамид; 5) моксонидин; б) резерпин.

8. Для купирования гипертензивных кризов применяют:

1) клонидин; 2) моксонидин; 3) фуросемид; 4) азаметония бромид; 5) натрия нитропруссид.

9. Рефлекторную тахикардию и ортостатическую гипотензию вызывают:

1) нифедипин; 2) гидралазин; 3) празозин; 4) натрия нитропруссид; 5) верапамил.

10. Сухой кашель вызывают:

1) ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента; 2) блокаторы ангиотензиновых рецепторов.

11. Для повышения артериального давления применяют:

1) каптоприл; 2) ангиотензинамид; 3) фенилэфрин; 4) гуанфацин; 5) метопролол.

Определите лекарственные препараты.

12. Антигипертензивное средство. Стимулирует имидазолиновые I₁-рецепторы в ядре продолговатого мозга. Применяется для систематического лечения артериальной гипертензии. Назначается 1 раз в сутки. В качестве побочного эффекта вызывает сухость во рту.

1. Гуанфацин. 2. Моксонидин. 3. Клонидин. 4. Резерпин.

13. Блокатор кальциевых каналов L-типа. Действует преимущественно на артериальные сосуды. Применяется внутрь для систематического лечения артериальной гипертензии. Назначается 1 раз в сутки.

1. Дилтиазем. 2. Верапамил. 3. Нифедипин. 4. Амлодипин.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
14. Диазоксид.	А. Активирует калиевые каналы.
15. Нифедипин.	Б. Блокирует АТ ₁ -рецепторы.
16. Клонидин.	В. Блокирует кальциевые каналы L-типа.
17. Периндоприл.	Г. Ингибирует АПФ.
18. Лозартан.	Д. Стимулирует α ₂ -адренорецепторы и имидазолиновые I ₁ -рецепторы.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Клонидин снижает артериальное давление, потому что клонидин уменьшает сердечный выброс и расширяет сосуды.

Неселективные Р-адреноблокаторы при систематическом применении повышают артериальное давление, потому что неселективные Р-адреноблокаторы при систематическом применении суживают кровеносные сосуды.

Ингибиторы АПФ вызывают сухой кашель, потому что ингибиторы АПФ повышают уровень брадикинина.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для купирования гипертензивного криза.

<i>Rp.: Clophelini 0,000075</i> <i>D.S. По 1 таблетке внутрь при кризе.</i>	Ваши замечания
--	----------------

Б. Антигипертензивное средство, снижающее сердечный выброс.

<i>Rp.: Nifedipini 0, 01</i> <i>D.t.d.N. 20 in tab.</i> <i>S. По 1 таблетке 3 раза в день.</i>	Ваши замечания
--	----------------

В. Средство при острой гипотензии.

<i>Rp.: Indapamidi 0,0025</i> <i>D.t.d.N. 10 in tab.</i> <i>S. По 1 таблетке внутрь, утром.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4,5. 2-1,2,3,5.3-2,3,4,5.4-1,3.5-2,3,4,5.6-2.7-1,3,5,6.8-1, 3,4,5.9-3,4.10-1.11-2.12-2.13-4.14-А.15-В.16-Д.17-Г.18-Б.19-верно, верно, связьсть. 20 - неверно, неверно, связи нет. 21 - верно, верно, связь есть.

Тема 6.4. Средства, применяемые при сердечной недостаточности. Кардиотонические средства

NB! Снижение сократимости миокарда приводит к уменьшению насосной функции сердца и застою в большом и малом кругах кровообращения.

Подобное патологическое состояние обозначается термином «сердечная недостаточность».

Структурным элементом сердца являются кардиомиоциты. Они бывают типичными (сократительными) и атипичными (проводящая система

сердца). Типичные кардиомиоциты обладают сократимостью (инотропизмом), проводимостью (дромотропизмом), возбудимостью (батмотропизмом). Основные свойства клеток проводящей системы - автоматизм (способность к самопроизвольной генерации импульса) и проводимость.

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Группы средств, применяемых при хронической застойной сердечной недостаточности.

NB! Хроническая сердечная недостаточность - прогрессирующее заболевание, сопровождающееся снижением насосной функции сердца, застойными явлениями в большом и малом кругах кровообращения, гипертрофией и ремоделированием сердца.

патогенезе прогрессирования сердечной недостаточности имеет значение активация ренин-ангиотензиновой и симпатико-адреналовой систем.

Ангиотензин-II суживает кровеносные сосуды и активирует влияние симпатической нервной системы на сердце и сосуды. Симпатическая нервная система, в свою очередь, активирует ренин-ангиотензиновую систему (усиливая выделение ренина клетками юкстагломерулярного аппарата), суживает кровеносные сосуды, увеличивая нагрузку на сердце. Вследствие увеличения нагрузки на сердце и его стимуляции катехоламинами развиваются гипертрофия стенки левого желудочка, ремоделирование, а также ослабляются сокращения сердца и нарушается сердечный ритм.

комплексной терапии хронической застойной сердечной недостаточности применяют средства, снижающие чрезмерную нагрузку на сердце (ингибиторы АПФ, вазодилататоры, диуретики), некоторые адреноблокирующие средства, а также средства, повышающие сократительную активность миокарда (кардиотонические средства).

2. Классификация кардиотонических средств.

Сердечные гликозиды. Определение. Классификация по источникам получения.

Фармакологические эффекты и механизм кардиотонического действия сердечных гликозидов.

Сравнительная характеристика препаратов сердечных гликозидов. Показания к применению.

Побочное и токсическое действие сердечных гликозидов. Интоксикация сердечными гликозидами и ее лечение.

NB! Интоксикация сердечными гликозидами проявляется кардиальными и экстракардиальными симптомами. К кардиальным симптомам относятся:

атриовентрикулярная блокада и желудочковая экстрасистолия; к экстракардиальным - тошнота, рвота, нарушение цветового восприятия, психомоторное возбуждение.

Кардиотонические средства негликозидной структуры. Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Сердечные гликозиды. Средства, применяемые при интоксикации сердечными гликозидами.

Аспаркам	Убаин (строфантин)
Атропина сульфат	Панангин
Дигитоксин	Унитиол
Дигоксин	Фенитоин (дифенин)
Коргликон	ЭДТА

Б. Негликозидные кардиотонические средства.

Добутамин (добутрекс)
Допамин (дофамин)
Левосимендан
Милринон

В. Средства, угнетающие ренин-ангиотензиновую систему, диуретики, адреноблокаторы и вазодилататоры.

Гидралазин
Гидрохлоротиазид
Изосорбида динитрат
Карведилол (дилатренд)

Лозартан
Спиронолактон
Эналаприл (ренитек)

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию кардиотонических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Кардиотонические средства гликозидной структуры (сердечные гликозиды).

Гликозиды наперстянки: а)

_____;

б) Гликозиды строфанта:

_____.

Гликозиды ландыша:

_____.

Кардиотонические средства негликозидной структуры.

Средства, влияющие на адренергическую иннервацию миокарда.

Селективные агонисты β_1 -адренорецепторов:

_____.

Агонисты дофаминовых и β_1 -адренорецепторов:

_____.

Ингибиторы фосфодиэстеразы III:

_____.

Средства, повышающие чувствительность миофибрилл к ионам кальция:

_____.

Задание 2

Нарисуйте общую структурную формулу сердечных гликозидов. Укажите, какой фрагмент молекулы определяет фармадинамику, а какой - фармакокинетику сердечных гликозидов.

Задание 3

А. На схеме 6.6 отметьте действие сердечных гликозидов.

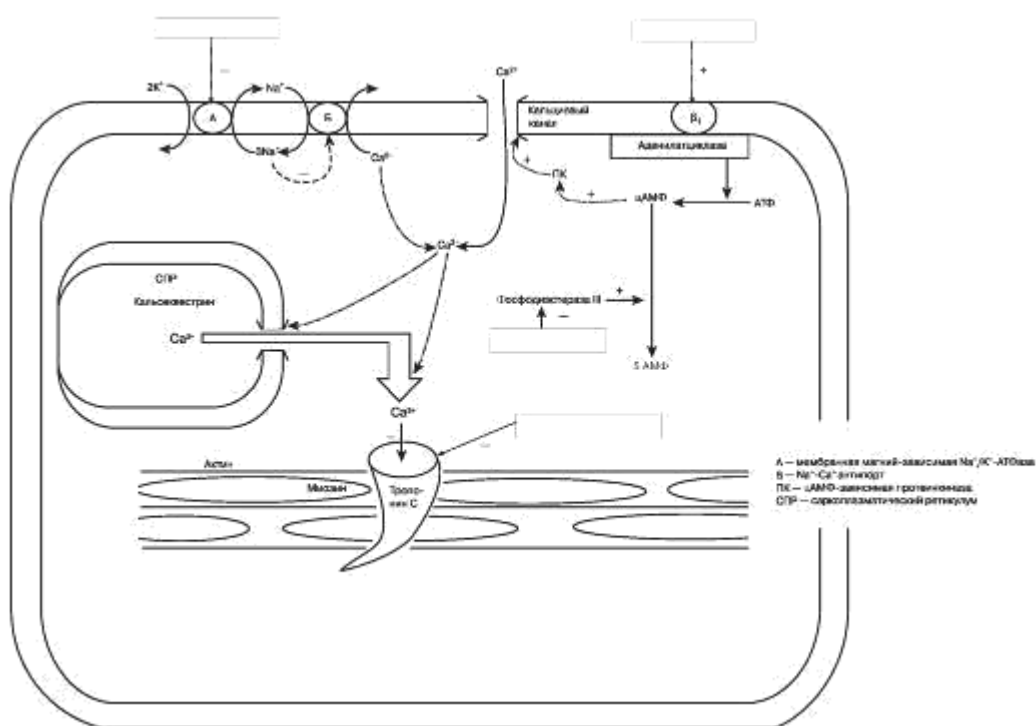


Схема 6.6. Механизмы действия кардиотонических средств

Б. Объясните механизм кардиотонического действия сердечных гликозидов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Ингибирование Na^+/K^+ -АТФазы мембран кардиомиоцитов.

Связывание Ca^{2+} с тропонином С.

Снижение активности $\text{Na}^+/\text{Ca}^{2+}$ -насоса.

Устранение тормозного действия тропонин-тропомиозин.

Увеличение содержания ионов натрия внутри кардиомиоцитов.

Повышение силы сердечных сокращений (положительное инотропное действие).

Нарушение выхода ионов кальция из кардиомиоцитов.

Взаимодействие актина и миозина.

В. Заполните табл. 6.12.

Таблица 6.12. Действие сердечных гликозидов на кардиомиоциты

Параметры	Изменение под действием сердечных
	ГЛИКОЗИДОВ

Активность мембранной Na^+/K^+ -АТФазы	
Содержание внутри кардиомиоцитов	
Образование актомиозина	

Примечание. При заполнении таблицы используйте следующие обозначения: «↑»-повышение; «↓» - снижение.

Задание 4

А. Расшифруйте кардиальные эффекты сердечных гликозидов:

положительное инотропное действие:

_____;

отрицательное хронотропное действие:

_____;

отрицательное дромотропное действие:

_____;

положительное батмотропное действие:

_____.

Б. Заполните табл. 6.13.

Таблица 6.13. Кардиальные эффекты сердечных гликозидов и их значение

Эффект	Механизм возникновения эффекта	Значение эффекта
--------	--------------------------------	------------------

Положительный инотропный

Отрицательный хронотропный

Отрицательный дромотропный

Повышение автоматизма волокон

Пуркинье

Примечание. При заполнении таблицы используйте приведенные ниже утверждения.

Механизм возникновения эффекта
Ингибирование Na⁺/K⁺-АТФазы.

Ваготоническое действие.

Снижение содержания ионов K⁺ в кардиомиоцитах.

Значение эффекта

Полезен при сердечной недостаточности.

Полезен при тахисистолической форме мерцательной аритмии предсердий.

Является причиной желудочковых экстрасистол.

Приводит к удлинению диастолы, что способствует более полному восстановлению энергетических ресурсов кардиомиоцитов.

Задание 5

А. Заполните табл. 6.14.

Таблица 6.14. Сравнительная характеристика препаратов сердечных гликозидов

Препарат	Липофильность (Л) или гидрофильность (Г)	Связь с белками плазмы, %	Пути введения	Начало действия (минуты, часы)	Максимум действия (дни, часы)	Пути выведения
Дигитоксин						

Дигоксин

Убаин

Коргликон

Б. Ответьте на следующие вопросы.

Какие сердечные гликозиды применяют как средства скорой помощи при острой сердечной недостаточности?

Какие сердечные гликозиды применяют при хронической сердечной недостаточности?

Задание 6

Заполните табл. 6.15.

Таблица 6.15. Группы средств, применяемых при интоксикации сердечными гликозидами

Группы средств	Препараты (выбрать из списка лекарственных препаратов по теме)	Принцип действия
Препараты калия и магния		
Антиаритмические средства		
М-холиноблокаторы		
Хелатообразующие соединения		
Донаторы сульфгидрильных групп		

Задание 7

А. На схеме 6.6 отметьте действие добутамина и левосимендана.

Б. Объясните механизм кардиотонического действия добутамина, расположив приведенные ниже утверждения, в логической последовательности.

Стимуляция β_1 -адренорецепторов кардиомиоцитов.

Открытие кальциевых каналов мембран кардиомиоцитов.

Активация выхода ионов Ca^{2+} из саркоплазматического ретикулула.

Активация аденилатциклазы.

Связывание ионами Ca^{2+} тропонина С.

Активация цАМФ-зависимой протеинкиназы.

Увеличение образования цАМФ.

Поступление в кардиомиоциты экзогенного Ca^{2+} .

Образование актин-миозинового комплекса.

Повышение силы сердечных сокращений.

NB! Негликозидные кардиотонические средства применяются только в качестве средств интенсивной терапии при острой сердечной недостаточности.

Задание 8

На схеме 6.7 отметьте действие: эналаприла, лозартана, гидрохлоротиазида, спиронолактона, дигоксина, изосорбида динитрата, гидралазина, карведилола.

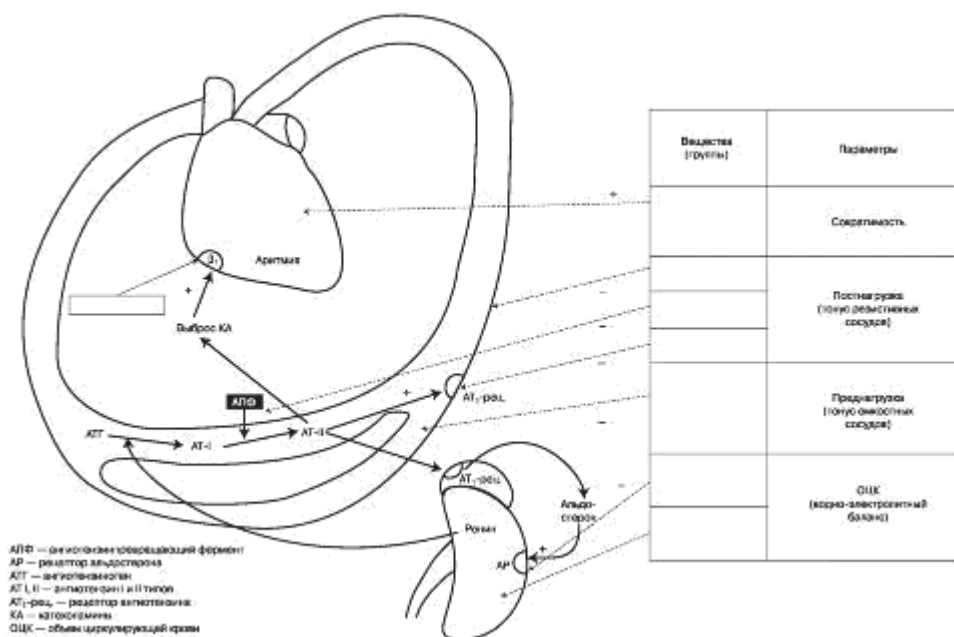


Схема 6.7. Локализация и механизмы действия средств, применяемых при хронической застойной сердечной недостаточности

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ

САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

При застойной хронической сердечной недостаточности применяют:

- 1) гидрохлоротиазид;
- 2) дигоксин;
- 3) эналаприл;
- 4) изосорбида динитрат;
- 5) лозартан;
- 6) атропин.

Сердечные гликозиды применяют:

- 1) при сердечной недостаточности;
- 2) при атриовентрикулярной блокаде;
- 3) при брадикардии;
- 4) при тахикардической форме мерцательной аритмии предсердий.

При интоксикации сердечными гликозидами применяют:

- 1) фенитоин;
- 2) кальция хлорид;
- 3) аспаркам;
- 4) унитиол.

Определите лекарственные препараты.

Препарат увеличивает силу сердечных сокращений. Повышает содержание цАМФ в кардиомиоцитах вследствие стимуляции β_1 -адренорецепторов. Применяется только при острой сердечной недостаточности.

1. Добутамин.
2. Коргликон.
3. Дигоксин.
4. Убаин.

Сердечный гликозид - препарат наперстянки. Обладает выраженными кумулятивными свойствами. Применяется только при хронической сердечной недостаточности. Вводится внутрь.

Коргликон. 2. Дигоксин. 3. Убаин. 4. Дигитоксин.

Совместите.

Эффекты сердечных гликозидов	Механизмы возникновения
6. Положительный инотропный.	А. Ингибирование Na^+/K^+ -АТФазы.
7. Отрицательный хронотропный.	Б. Повышение тонуса блуждающего нерва.
8. Отрицательный дромотропный.	В. Снижение содержания ионов калия в кардиомиоцитах.
9. Повышение автоматизма волокон Пуркинье.	

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Дигоксин применяют при тахиаритмической форме мерцательной аритмии предсердий, потому что дигоксин оказывает положительное инотропное действие.

Сердечные гликозиды противопоказаны при атриовентрикулярном блоке, потому что сердечные гликозиды оказывают отрицательное дромотропное действие.

Допамин увеличивает силу сердечных сокращений, потому что допамин сенсibiliзирует тропонин С к ионам кальция.

Фенитоин применяют при интоксикации сердечными гликозидами, потому что фенитоин устраняет атриовентрикулярный блок.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Сердечный гликозид при острой сердечной недостаточности.

<i>Rp.: Sol. Corglyconi 0,6%</i> <i>D.l.d. N 6 in amp.</i> <i>S. По 1 мл внутривенно, в 20 мл 20% раствора глюкозы.</i>	Ваши замечания
---	----------------

Б. Комбинированный препарат калия и

<i>Rp.: Tab. «Asparcam»</i> <i>D.S. По 1–2 таблетки внутрь.</i>	Ваши замечания
--	----------------

магния.

В. Средство при кардиогенном шоке.

Rp.: Sol. Dopramini 0,5% — 5 ml.

D.S. Известно.

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3,4,5.2-1,4.3-1,3,4.4-1.5-4.6-А.7-Б.8-Б.9-В.10-верно, верно, связи нет. 11 - верно, верно, связь есть. 12 - верно, неверно, связи нет. 13 - верно, неверно, связи нет.

Тема 6.5. Венотропные средства. Средства, применяемые при нарушениях мозгового кровообращения

ВЕНОТРОПНЫЕ СРЕДСТВА

NB! Состояние венозной системы имеет особое значение для системы кровообращения. Тонус вен определяет преднагрузку на сердце, а резкое снижение тонуса периферических вен приводит к ортостатической гипотензии. Фармакологическая коррекция нарушений венозного тонуса применяется в комплексной терапии заболеваний сердечно-сосудистой системы (хроническая ишемическая болезнь сердца, хроническая застойная сердечная недостаточность, гипертоническая болезнь).

Распространенными являются заболевания, связанные с непосредственным поражением венозной системы. К ним относятся хроническая венозная недостаточность нижних конечностей (варикозное расширение вен) и геморрой.

Лекарственные средства, оказывающие действие на вены, обозначают как венотропные средства.

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация венотропных средств.

NB! Венотропные средства классифицируют:

по направленности влияния на венозный тонус (венодилатирующие и венострикторные);

по наличию или отсутствию венопротекторного действия.

Венодилатирующие средства. Классификация, применение.

Венострикторные (венотонизирующие) средства.

Классификация, применение.

Венопротекторные средства. Классификация, применение.

NB! Под венопротекторным действием понимают способность лекарственных препаратов уменьшать повреждение вен. Венопротекторное действие - результат уменьшения проницаемости венул, перивенозного отека и воспаления.

Препараты со смешанным (венотоническим и венопротекторным) действием. Классификация, эффекты, пути введения, применение.

Средства, применяемые при геморрое. Классификация, принципы действия, пути введения.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО

ТЕМЕ Венотропные средства.

Биллобил	Мидодрин (гутрон)
Гинкор форт	Рутин (рутозид)
Детралекс	Трибенозид (гливенол)
Дигидроэрготамин	Троксерутин (троксевазин)
Доксазозин (карлура)	Цикло 3 форт
Изосорбида динитрат	Эндотелон
Кальция добезилат (доксиум)	Эсцин (эскузан)

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию венодилатирующих средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Органические нитраты:

α 1-Адреноблокаторы:

Задание 2

Дополните классификацию веноконстрикторных (венотонизирующих) средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Дигидрированные алкалоиды спорыньи:

α 1-Адреномиметики:

Задание 3

Укажите показания к применению венотропных средств (табл. 6.16).

Таблица 6.16. Показания к применению некоторых венотропных средств

Показание	Изосорбида динитрат	Доксазозин рготамин	Фуросемид	Мидодрин	Дигидроэ
Стенокардия					
Гипертоническая болезнь					
Отек легких					
Ортостатическая гипотензия					
Мигрень					

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 4

Дополните классификацию венопротекторных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты рутина и его производных:

а)

б)

Препараты гинкго двулистного:

а)

б)

Синтетические препараты:

Задание 5

Дополните классификацию венотропных средств со смешанным (венотоническим и венопротекторным) действием препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты флавоноидов:

Препараты каштана конского:

Препараты иглицы шиповатой:

Препараты виноградных косточек:

Синтетические препараты:

Задание 6

Укажите показания к применению препаратов с венотоническим и венопротекторным действием (табл. 6.17).

Таблица 6.17. Показания к применению средств с венотоническим и венопротекторным действием

Показания к применению

Препарат	Варикозное расширение вен нижних конечностей	Геморрой	Нарушения мозгового кровообращения
----------	--	----------	------------------------------------

Эндотелон

Эсцин

Цикло 3

форт

Детралекс

Трибенози

д

Троксерут ин			
-----------------	--	--	--

Гинкор
форт

Билобил

СРЕДСТВА, ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ НАРУШЕНИЯХ МОЗГОВОГО КРОВООБРАЩЕНИЯ ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Принципы фармакологической коррекции нарушений
мозгового кровообращения.

NB! Нарушения мозгового кровообращения могут иметь ишемический или
геморрагический характер. В цереброваскулярной патологии основное место
занимают ишемические поражения мозга, которые могут протекать в острой
или хронической форме.

Острая форма проявляется ишемическим инсультом, требующим
экстренных мероприятий по устранению ишемии мозга. Хроническая
недостаточность мозгового кровотока приводит к психическим нарушениям
(снижение памяти, нарушения в интеллектуальной сфере, эмоциональные
расстройства). Одним из основных способов профилактики и лечения
недостаточности мозгового кровообращения является применение средств,
расширяющих сосуды мозга. Возможно использование любых
сосудорасширяющих средств. Однако средства, расширяющие
периферические сосуды, снижают системное давление, что приводит к
ухудшению кровоснабжения мозга. В связи с этим более предпочтительно -
использование веществ, расширяющих преимущественно мозговые сосуды.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Средства, применяемые при нарушении мозгового кровообращения.

Винпоцетин (кавинтон) Ксантинола никотинат (компламин) Нимодипин (нимотоп)
--

Ницерголин (сермион) Пентоксифиллин (трентал) Циннаризин (стугерон)

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Укажите фармакологические эффекты и показания к применению средств, улучшающих мозговое кровообращение (табл. 6.18).

Таблица 6.18. Фармакологические эффекты и показания к применению средств, улучшающих мозговое кровообращение

Эффекты и показания	Нимодип	Циннари	из Винпоцет	Пентоксифилл		
	Ницергол	Ксантино				

ИН

ИН

ИН

ИН

ИН

ла
НИКОТИН
а
т

Расширение
преимуществ
енн
о мозговых
сосудов

Эффек
т
ы

Расширение
мозговых и
периферическ
их
сосудов

Антиагрегант
ное
действие

Нейропротект
ор
ное действие

Нарушение
кровообращен
ия
мозга при его
ишемии

Показа
н
ия

Расстройства
периферическ
ог
о
кровообраще
ния

Мигрень

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ

САМОКОНТРОЛЯ Выберите правильные

ответы.

Веноконстрикторные средства:

дигидроэрготамин; 2) детралекс; 3) трибенозид; 4) мидодрин; 5) эндотелон.

Венодилатирующие средства:

доксазозин; 2) изосорбида динитрат; 3) эсцин; 4) троксерутин.

Венопротекторные средства:

рутин; 2) кальция добезилат; 3) гинкор форт; 4) эсцин; 5) билобил.

При ортостатической гипотензии применяют:

мидодрин; 2) изосорбида динитрат; 3) дигидроэрготамин; 4) доксазозин.

При варикозном расширении вен нижних конечностей применяют:

эндотелон; 2) эсцин; 3) гинкор форт; 4) детралекс; 5) трибенозид;
6) пентоксифиллин.

Расширяет сосуды мозга за счет блокады кальциевых каналов:

винпоцетин; 2) нимодипин; 3) пентоксифиллин; 4) циннаризин;
5) ницерголин.

Расширяет в равной степени сосуды мозга и периферические сосуды:

винпоцетин; 2) нимодипин; 3) пентоксифиллин; 4) ксантинола никотинат;
5) ницерголин.

При нарушении мозгового кровообращения применяют:

билобил; 2) винпоцетин; 3) детралекс; 4) нимодипин; 5) циннаризин.

Определите лекарственный препарат.

Блокирует кальциевые каналы преимущественно в сосудах головного мозга. Применяется для улучшения кровообращения в мозге при его ишемии, а также для уменьшения неврологических нарушений после перенесенного инсульта.

Оказывает нейропротекторное действие.

Винпоцетин. 2. Нимодипин. 3. Ксантинола никотинат. 4. Ницерголин.
5. Пентоксифиллин.

Ответы на тестовые задания

1-1,4. 2-1,2. 3-1,2,3,4. 4-1. 5-1,2,3,4,5. 6-2,4. 7-3,4,5. 8-1,2,4,5. 9-2.

Тема 6.6. Антиатеросклеротические средства ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Принципы фармакотерапии атеросклероза.

NB! Развитие атеросклероза связано с повышением содержания в крови атерогенных липопротеинов и нарушением целостности интимы (внутреннего слоя) сосудов.

При этих условиях атерогенные липопротеины проникают в интиму сосудов и там задерживаются. В интиме сосудов липопротеины поглощаются макрофагами.

Если липопротеины окислены, то они поглощаются без ограничительного механизма; при этом макрофаги увеличиваются в размерах и превращаются в так называемые пенистые клетки, после распада которых высвобождается холестерин и его эфиры, участвующие в образовании атеросклеротической бляшки.

Классификация антиатеросклеротических средств.

Средства, снижающие уровень атерогенных липопротеинов (гиполипидемические средства). Классификация. Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Средства, понижающие уровень атерогенных липопротеинов в плазме крови, классифицируются: 1) по химической структуре; 2) по механизму действия; 3) по эффективности при разных типах гиперлипидемий. Выделяют следующие типы гиперлипидемий:

I - повышено содержание ХМ (хиломикронов); IIa - повышено содержание ЛПНП (липопротеинов низкой плотности);

IIb - повышено содержание ЛПНП и ЛПОНП (липопротеинов очень низкой плотности);

- повышено содержание ЛППП (липопротеинов промежуточной плотности);

IV - повышено содержание ЛПОНП;

V - повышено содержание ХМ + ЛПОНП.

Наиболее атерогенными являются гиперлипопротеинемии II, III и IV типов.

Средства, препятствующие повреждению интимы сосудов.

Классификация. Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Уменьшить повреждение интимы сосудов можно путем:

уменьшения действия брадикинина на интиму сосудов;

снижения перекисного окисления липидов.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО

Аторвастатин (липримар)
Безафибрат
Гемфиброзил (гевилон)
Никотиновая кислота (ниацин)
Колестипол
Колестирамин (холестирамин)
Ловастатин (мевакор)

Аторвастатин (липримар)
Безафибрат
Гемфиброзил (гевилон)
Никотиновая кислота (ниацин)
Колестипол
Колестирамин (холестирамин)
Ловастатин (мевакор)

ТЕМЕ

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию антиатеросклеротических средств препаратами из предложенного списка.

Средства, снижающие уровень атерогенных липопротеинов.

Ингибиторы 3-гидрокси-3-метилглутарилкоэнзим А-редуктазы (статины):

а) б) в) г) Ингибиторы триглицеридлипазы:

Активаторы липопротеинлипазы

а) _____

б) _____

(фибраты): в) _____

Секвестранты желчных кислот (анионообменные смолы):

а) _____

б) _____

Средства, препятствующие всасыванию холестерина: .

Средства, препятствующие повреждению интимы сосудов.

Ангиопротекторы:

Антиоксиданты:

а) _____

б) _____

Задание 2

На схеме 6.8 отметьте действие: ловастати́на, гемфибрози́ла, кислоты никотино́вой, эзетими́ба, колестирамина.

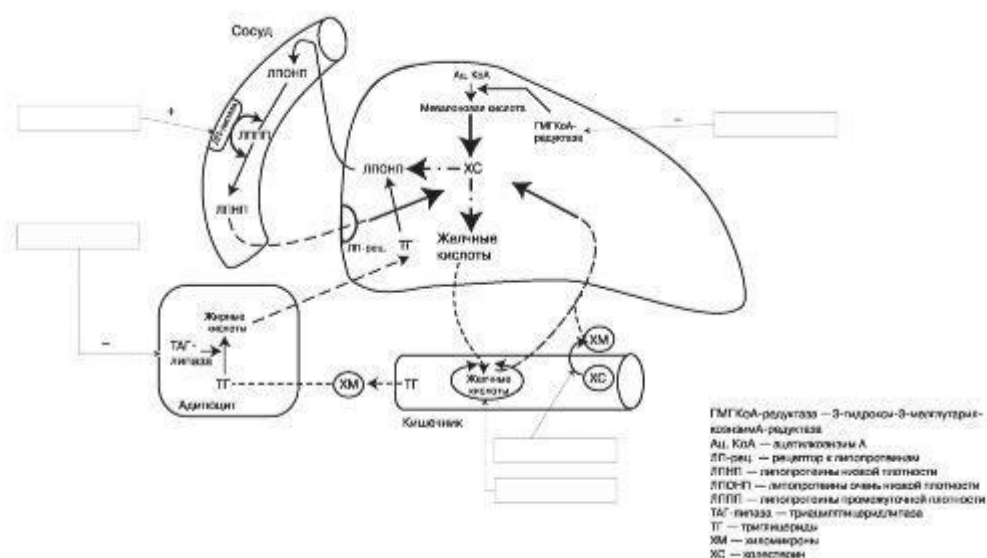


Схема 6.8. Механизмы действия гипополипидемических средств Задание 3

Используя схему 6.8, объясните механизмы действия гипополипидемических средств, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Статины

Ингибируют ГМГКоА-редуктазу.

Снижают ЛПНП в плазме крови.

Нарушают синтез холестерина в печени на стадии образования мевалоновой кислоты.

Увеличивают рецептор-зависимый эндоцитоз ЛПНП.

Увеличивают плотность ЛПНП-рецепторов в печени.

Никотиновая кислота

Ингибирует триглицеридлипазу жировых клеток (адипоцитов).

Снижает образование ЛПОНП в печени.

Снижает образование жирных кислот из триглицеридов в адипоцитах.

Снижает поступления жирных кислот в гепатоциты и образование триглицеридов в печени.

Снижает в плазме крови ЛПОНП, ЛППП, ЛПНП.

Секвестранты желчных кислот

Связывают желчные кислоты в тонкой кишке.

Увеличивают рецептор-зависимый эндоцитоз ЛПНП печенью.

Увеличивают синтез желчных кислот из холестерина и уменьшают его запасы в печени.

Препятствуют всасыванию холестерина и желчных кислот в тонкой кишке.

Увеличивают плотность ЛПНП-рецепторов в печени.

Снижают ЛПНП в плазме крови.

Фибраты

Активируют липопротеинлипазу.

Снижают ЛПОНП и ЛППП в плазме крови.

Увеличивают катаболизм ЛПОНП и ЛППП.

Задание 4

Заполните табл. 6.19.

Таблица 6.19. Свойства и показания к применению гиполипидемических средств

Группы лекарственных веществ	Влияние на уровень в плазме крови				Применение при типах гиперлипидемии и			
	ЛПОНП	ЛППП	ЛПНП	ЛПВ	IIa	IIb	III	IV
Статины								

Секвестранты
желчных
кислот

Ниацин

Фибраты

Примечание. При заполнении таблицы пользуйтесь следующими обозначениями: «↑» - повышение; «↓» - снижение; «*» - отсутствие изменений; «+» - применение.

Задание 5

Заполните табл. 6.20.

Таблица 6.20. Побочные эффекты гиполипидемических средств

	Фибраты	Никотиновая кислота	Статины	Секвестранты желчных кислот
Побочные эффекты				
Тошнота и рвота				
Констипация				
Диарея				
Нарушение всасывания в кишечнике лекарственных веществ				
Образование желчных камней (холелитиаз)				
Нарушение функции печени				
Миопатии				

Гиперемия и зуд кожи

Гипергликемия

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 6

Решите ситуационные задачи.

Ситуационные задачи

А. Больному К. для лечения хронической застойной сердечной недостаточности назначены гидрохлоротиазид и дигоксин. В качестве гиполипидемического средства пациенту назначили колестирамин. Объясните пациенту, как рационально принимать колестирамин и средства, назначенные по поводу сердечной недостаточности.

Б. Больному З. по поводу выраженной гиперлипидемии Па типа назначен препарат, вызвавший сильный зуд волосистой части головы, покраснение кожи лица и шеи, ощущение жара. Что за препарат был назначен и каким образом можно предупредить возникновение этих побочных эффектов?

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ

САМОКОНТРОЛЯ Выберите правильные

ответы.

Гиполипидемические средства:

колестирамин; 2) симвастатин; 3) пирикарбат; 4) ловастатин; 5) пробукол.

К средствам, уменьшающим содержание в крови преимущественно холестерина, относятся:

аторвастатин; 2) колестирамин; 3) симвастатин; 4) безафибрат; 5) гемфиброзил.

К средствам, уменьшающим содержание в крови преимущественно триглицеридов, относятся:

никотиновая кислота; 2) гемфиброзил; 3) безафибрат; 4) фенофибрат; 5) флувастатин.

К средствам, значительно повышающим уровень ЛПВП, относится:

1) никотиновая кислота; 2) ловастатин; 3) колестипол; 4) симвастатин.

Статины рационально комбинировать:

с секвестрантами желчных кислот; 2) с фибратами.

Миопатии, нарушение функций печени вызывают:

фибраты; 2) статины; 3) секвестранты желчных кислот; 4) никотиновая кислота.

Нарушают всасывание в кишечнике лекарственных веществ:

фибраты; 2) статины; 3) секвестранты желчных кислот; 4) никотиновая кислота.

К препаратам, препятствующим окислению атерогенных липопротеинов, относятся:

пирикарбат; 2) пробукол; 3) токоферола ацетат.

Определите лекарственный препарат.

<p>Оказывает антибрадикининовое действие и уменьшает проницаемость сосудистой стенки. Повышает микроциркуляцию в сосудистой стенке. Применяется в комплексной терапии атеросклероза.</p> <p>10. Довестанил. 11. Гемфиброзил. 12. Колестирамин. 13. Никотиновая кислота.</p>	<p>А. Ингибирует 3-гидрокси-3-метилглютарилкоксили А-дегидратазу. Б. Ингибирует триглицеридлипазу. В. Активирует липопротеинлипазу. Г. Связывает желчные кислоты в кишечнике.</p>
---	---

1. Пробукол. 2. Ниацин. 3. Пирикарбат. 4. Гемфиброзил. 5. Никотиновая кислота. Совместите.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Статины снижают уровень ЛПНП в плазме крови, потому что статины увеличивают рецепторзависимый эндоцитоз ЛПНП гепатоцитами.

Статины увеличивают рецептор-зависимый эндоцитоз ЛПНП гепатоцитами, потому что статины снижают уровень холестерина в печени.

Статины снижают уровень холестерина в печени, потому что статины нарушают синтез холестерина в печени на стадии образования мевалоновой кислоты.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство при всех типах гиперлипотеинемий.

*Rp.: Acidī nicotīnici 0,05
D.t.d.N. 50 in tab.
S. По 1 таблетке 1 раз в сутки.*

Ваши замечания

Б. Гиполипидемическое средство из группы фибратов.

*Rp.: Gemfibrozili
D.t.d.N. 10 in caps.
S. По 1 капсуле 3 раза в день.*

Ваши замечания

В. Эндотелиотропное

*Rp.: Probucol 0, 25
D.S. По 1 таблетке 3 раза в день.*

Ваши замечания

средство.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4.2-1,2,3.3-2,3,4.4-1.5-1.6-1,2,4.7-3.8-2,3.9-3.10-А.11-В. 12 - Г. 13 - Б. 14 - верно, верно, связь есть. 15 - верно, верно, связь есть. 16 - верно, верно, связь есть.

Раздел 7. Мочегонные средства (диуретики)

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО РАЗДЕЛУ

Классификации диуретических средств.

NB! Существует несколько подходов к классификации диуретиков:

по химической структуре;

по характеру и механизму действия (первичное нарушение реабсорбции ионов или воды, нарушение гормональной регуляции мочеобразования или избирательное угнетение систем транспорта ионов);

по локализации действия (на какие участки нефрона действует);

по эффективности (в значительной степени определяется локализацией действия диуретика);

по влиянию на выведение ионов калия и магния из организма (гипокалиемия и гипомагниемия могут усиливать побочные эффекты сердечных гликозидов).

Общие показания к применению диуретиков.

NB! Диуретики применяют:

при отеках (хронических и острых - используется способность диуретиков выводить из организма избыток ионов натрия и воды);

в качестве антигипертензивных средств (для систематического лечения артериальной гипертензии, реже - для купирования гипертензивных кризов);

в качестве средств терапии при отравлениях (для форсированного диуреза). Форсированный диурез проводится мочегонными препаратами с высокой эффективностью и малым латентным периодом. Диуретик

вводится внутривенно после введения 1-2 л изотонического раствора (водная нагрузка).

Тиазиды и тиазидоподобные диуретики. Локализация, механизм действия, эффективность. Показания к применению. Побочные эффекты. Способы коррекции гипокалиемии. Сравнительная характеристика препаратов.

Петлевые диуретики. Локализация, механизм действия, эффективность. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Хронические отеки (отеки при хронической застойной сердечной недостаточности, заболеваниях почек и печени) возникают постепенно. Отек легких и отек мозга возникают остро и могут быстро привести к летальному исходу, поэтому при острых отеках применяют высокоэффективные диуретики быстрого действия.

Калийсберегающие диуретики. Локализация действия и эффективность. Классификация по механизму действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

Осмотические диуретики. Локализация, механизм действия, эффективность. Показания к применению. Противопоказания.

NB! При применении маннитола (вводят внутривенно) наблюдаются дегидратирующий и диуретический эффекты. В основе обоих эффектов лежит осмотическая активность маннитола. Дегидратирующее действие возникает вследствие повышения осмотического давления плазмы крови (жидкость из тканей по осмотическому градиенту переходит в просвет сосудов). Диуретическое действие является результатом уменьшения реабсорбции воды вследствие повышения осмотического давления в просвете почечных канальцев.

Ингибиторы карбоангидразы.

NB! В настоящее время ингибиторы карбоангидразы в качестве диуретиков практически не применяют ввиду их низкой эффективности и быстрого возникновения толерантности. В медицинской практике используется способность ингибиторов карбоангидразы снижать продукцию внутриглазной жидкости, а также спинномозговой жидкости. Ацетазоламид (диакарб) применяется при глаукоме; эпилептиформных припадках,

вызванных повышением внутричерепного давления; отеком синдроме в сочетании с алкалозом (при легочно-сердечной недостаточности).

Дорзоламид (трусопт) применяют местно при глаукоме.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Амилорид Буметанид (буфенокс) Гидрохлоротиазид (дихлотиазид, гипотиазид) Индапамид (арифон, индап) Этакриновая кислота (урегит) Клопамид (бринальдикс)	Маннитол (маннит) Спиронолактон (верошпирон, альдактон) Триамтерен Фуросемид (лазикс) Хлорталидон (оксодотин, гигротон) Циклометиазид
---	--

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

Дополните классификацию диуретиков препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, нарушающие функцию эпителия почечных канальцев.

Средства, действующие на толстый сегмент восходящей части петли Генле (петлевые диуретики):

- а) _____;
- б) _____;
- в) _____.

Средства, действующие на начальный отдел дистальных канальцев.

Производные бензотиадиазина (тиазиды):

- а) _____;
- б) _____.

Тиазидоподобные диуретики:

- а) _____;
- б) _____;
- в) _____.

Средства, действующие на конечный отдел дистальных канальцев и собирательные трубочки:

- а) _____;
- б) _____.

Антагонисты альдостерона:

Осмотические диуретики:

Задание 2

На схеме 7.1 отметьте действие: гидрохлоротиазида, фуросемида, маннитола, спиронолактона, триамтерена, ацетазоламида.

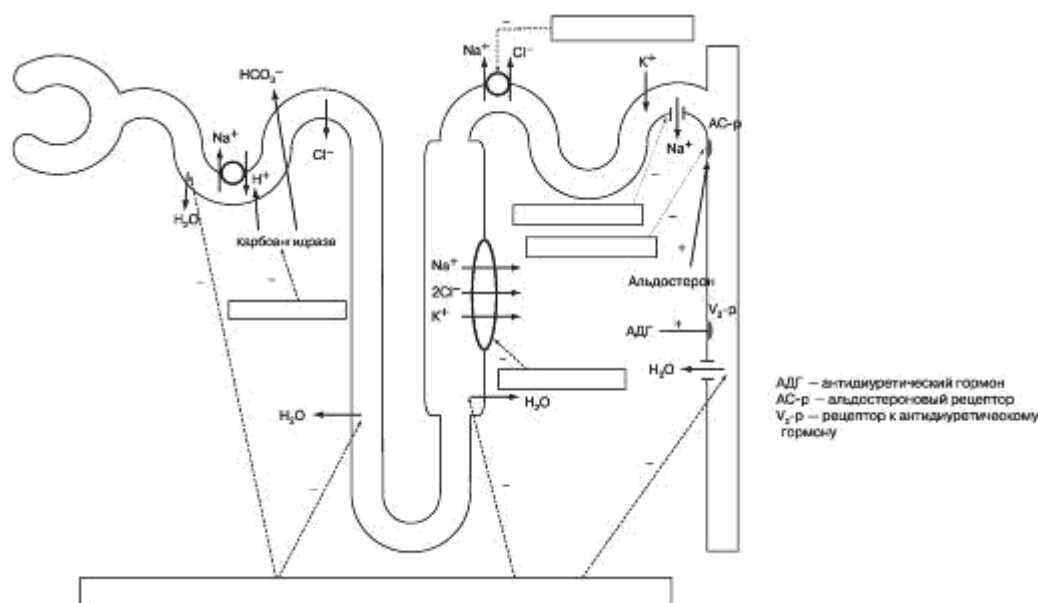


Схема 7.1. Локализация и механизм действия диуретиков

NB! Реабсорбция ионов в разных отделах нефрона происходит либо за счет котранспорта (симпорта) при участии специфических транспортных систем (белков-переносчиков), либо за счет движения ионов через ионные каналы апикальных мембран эпителия почечных канальцев.

в конечном отделе дистальных извитых канальцев и собирательных трубочках реабсорбция ионов натрия (и секреция ионов калия) регулируется альдостероном.

в собирательных трубочках реабсорбция воды происходит через водные каналы под влиянием вазопрессина (антидиуретический гормон).

Вещества, первично нарушающие реабсорбцию ионов натрия и хлора, называют салуретиками.

Вещества, первично нарушающие реабсорбцию воды, называют акваретиками.

Задание 3

А. Объясните механизм мочегонного действия тиазидов и тиазидоподобных диуретиков, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Ингибируют котранспорт ионов натрия и хлора в начальном отделе дистальных канальцев.

Угнетают реабсорбцию ионов натрия и хлора.

Увеличивают выведение натрия, хлора, калия, магния и воды.

Б. Объясните механизм мочегонного действия петлевых диуретиков, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Ингибируют котранспорт ионов натрия, калия, хлора в толстом сегменте восходящей части петли Генле.

Угнетают реабсорбцию ионов натрия, хлора, кальция, магния.

Увеличивают выведение натрия, хлора, калия, кальция, магния и воды.

В. Объясните механизм мочегонного действия триамтерена, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Блокирует натриевые каналы в конечном отделе дистальных канальцев и собирательных трубочках.

Угнетает реабсорбцию ионов натрия и секрецию ионов калия.

Увеличивает выведение натрия и воды.

Задерживает выведение калия и магния.

Г. Объясните механизм мочегонного действия спиронолактона, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Блокирует рецепторы альдостерона в конечном отделе дистальных канальцев и собирательных трубочках.

Угнетает реабсорбцию ионов натрия и секрецию ионов калия.

Способствует увеличению диуреза.

Д.мОбъясните механизм мочегонного действия маннитола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Является осмотически активным веществом.

Вторично (умеренно) нарушает реабсорбцию ионов (натрия и хлора).

Фильтруется в почечных клубочках и не реабсорбируется в почечных канальцах.

Нарушает реабсорбцию воды.

Повышает осмотическое давление в просвете почечных канальцев.

Задание 4. Заполните табл. 7.1.

Таблица 7.1. Преимущественная локализация действия диуретиков и их эффективность

Препараты	Локализация действия	Эффективность (высокая, средняя, низкая)
2.	Толстый сегмент восходящей части петли Генле	
3.		
1. 2.	Начальный отдел дистальных канальцев (разводящий сегмент)	
3.		
4.		
5.		
1. 2. 3.	Конечный отдел дистальных канальцев и корковый отдел собирательных трубочек	
1.	Проксимальные канальца, нисходящая часть петли Генле, собирательные трубочки	

Примечание. При заполнении таблицы используйте препараты из предложенного выше списка.

Задание 5

Заполните табл. 7.2.

Таблица 7.2. Влияние диуретиков на выведение ионов и мочевой кислоты

Диуретик	Na ⁺	K ⁺	Ca ²⁺	Mg ²⁺	Cl ⁻	Мочевая кислота
Гидрохлоротиазид						
Фуросемид						
Триамтерен						
Спиринолактон						

Примечание. При заполнении таблицы используйте следующие обозначения: «В» - выведение; «З» - задержка.

Ответьте на следующие вопросы.

Какие препараты относятся к калий- и магнийсберегающим диуретикам?

Какие диуретики нельзя применять при уролитиазе (мочекаменной болезни) и почему?

Какие диуретики нельзя применять при остеопорозе и почему?

Какие диуретики могут вызвать обострение подагры?

Задание 6. Заполните табл. 7.3.

Таблица 7.3. Фармакокинетические характеристики некоторых диуретиков

Препарат	Путь введения	Начало действия (минуты, часы, сутки)	Продолжительность действия (минуты, часы, сутки)
Гидрохлоротиазид			
Хлорталидон			
Фуросемид			
Спиринолактон			

Ответьте на следующие вопросы.

Какие диуретики применяют в качестве средств скорой помощи и почему?

Какие диуретики целесообразно применять при хронических отеках и почему?

Задание 7. Заполните табл. 7.4.

Таблица 7.4. Основные показания к применению некоторых диуретиков

Показания	Тиазиды и тиазидоподобные диуретики	Петлевые диуретики	Осмотические диуретики
Хронические отеки			
Артериальная гипертензия			
Отек легких			
Отек мозга			
Острый приступ глаукомы			
Терапия острых отравлений (форсированный диурез)			

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

ВВ! Калий- и магнийсберегающие диуретики часто применяют в комбинации с более эффективными диуретиками для коррекции, вызываемой ими гипокалиемии.

Фармацевтическая промышленность выпускает комбинированные препараты: триампур (содержит триамтерен и гидрохлоротиазид) и модуретик (содержит амилорид и гидрохлоротиазид).

Задание 8. Перечислите характерные побочные эффекты диуретических средств (табл. 7.5).

Таблица 7.5. Побочные эффекты некоторых диуретических средств

Побочные эффекты	Гидрохлоротиазид	Фуросемид	Триамтерен	Спиринолактон
Гипокалиемия				
Гиперкалиемия				

Гиперурикемия

Гипергликемия

Ототоксичность

Гинекомастия

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 9. Перечислите общие противопоказания к назначению диуретиков, угнетающих функцию эпителия почечных канальцев.

NB! Маннитол, повышая осмотическое давление плазмы крови, увеличивает объем циркулирующей жидкости, что приводит к увеличению нагрузки на сердце и повышению артериального давления. В связи с этим он противопоказан при сердечной недостаточности и артериальной гипертензии.

Задание 10. Решите ситуационную задачу.

Ситуационная задача

Пациентке с диагнозом «хроническая застойная сердечная недостаточность» назначена следующая комбинация лекарственных средств: дигоксин + гидрохлоротиазид. На третий день лечения больная стала жаловаться на тошноту, диарею, головную боль, перебои в работе сердца. На ЭКГ отмечаются желудочковые экстрасистолы. Объясните, с чем связано ухудшение состояния больной. Предложите пути коррекции.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

- Диуретики, нарушающие функцию эпителия почечных канальцев:
1) гидрохлоротиазид; 2) спиронолактон; 3) фуросемид; 4) маннитол; 5) хлорталидон.
- Диуретики, первично нарушающие реабсорбцию ионов:
1) индапамид; 2) кислота этакриновая; 3) маннитол; 4) клопамид; 5) триамтерен.
- Калий- и магнийсберегающие диуретики:
1) спиронолактон; 2) триамтерен; 3) фуросемид; 4) амилорид; 5) циклометиазид.
- Диуретики, применяемые для систематического лечения артериальной гипертензии:
1) гидрохлоротиазид; 2) индапамид; 3) маннитол; 4) триампур; 5) клопамид.

5. Для форсированного диуреза применяют:

1) маннитол; 2) спиронолактон; 3) фуросемид; 4) хлорталидон; 5) клопамид.

6. Для лечения отеков при застойной хронической сердечной недостаточности применяют:

1) спиронолактон; 2) маннитол; 3) гидрохлоротиазид; 4) триамтерен; 5) клопамид.

7. При отеке легких применяют:

1) гидрохлоротиазид; 2) маннитол; 3) фуросемид; 4) спиронолактон; 5) этакриновую кислоту.

8. Калий- и магнийсберегающие диуретики целесообразно комбинировать с:

1) гидрохлоротиазидом; 2) фуросемидом; 3) маннитолом; 4) этакриновой кислотой.

Определите лекарственные препараты.

9. Оказывает дегидратирующее и диуретическое действие. Первично нарушает реабсорбцию воды. Применяется при отеке мозга, острых приступах глаукомы. В качестве побочных эффектов вызывает жажду и мышечную слабость.

1.Фуросемид. 2. Этакриновая кислота. 3. Спиронолактон. 4. Маннитол. 5. Хлорталидон.

10. Нарушает реабсорбцию ионов натрия и хлора в начальном отделе дистальных канальцев. Применяется для лечения хронических отеков и артериальной гипертензии. Диуретический эффект развивается через 2-4 ч и продолжается около 3 сут.

1.Гидрохлоротиазид. 2. Циклометиазид. 3. Индапамид. 4. Хлорталидон.

Совместите.

Препараты	Механизмы и локализация действия
11. Гидрохлоротиазид.	А. Ингибирует котранспорт ионов Na^+ , K^+ , Cl^- в восходящей части петли Генле.
12. Фуросемид.	Б. Ингибирует котранспорт ионов Na^+ и Cl^- в начальном отделе дистальных канальцев.
13. Триамтерен.	В. Блокирует рецепторы альдостерона в конечном отделе дистальных канальцев и собирательных трубочках.
14. Спиронолактон.	Г. Нарушает реабсорбцию воды в проксимальных канальцах, нисходящей части петли Генле, собирательных трубочках.
15. Маннитол.	Д. Блокирует натриевые каналы в конечном отделе дисталь-

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

16. Тиазиды и тиазидоподобные диуретики вызывают гиперурикемию, потому что тиазидные и тиазидоподобные диуретики уменьшают секрецию мочевой кислоты в проксимальных канальцах.

Rp.: Furosemidi 1% 2 ml

Ваши замечания

17. Фуросемид применяют при уролитоэ (мочекаменная болезнь), потому что фуросемид снижает содержание Ca^{2+} в почечном фильтрате.

18. Маннитол противопоказан при сердечной недостаточности, потому что маннитол увеличивает нагрузку на сердце.

Проведите анализ врачебных рецептов.

Высокоэффективный диуретик быстрого действия.

Б. Диуретик для систематического лечения артериальной гипертензии.

*Rp.: Indapamidi 0, 0025
D.t.d.N. 10 in tab.
S. По 1 таблетке внутрь утром.*

Ваши замечания

В. Диуретик при первичном гиперальдостеронизме.

*Rp.: Spironolactoni 0, 025
D.S. По 1 таблетке 3 раза в день.*

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-1,3,5. 2-1,2,4,5. 3-1,2,4. 4-1,2,4,5. 5-1,3. 6-1,3,4,5.
7-3,5. 8-1,2. 9 - 4. 10 - 4. 11 - Б. 12 - А. 13 - Д. 14 - В. 15 - Г.
16 - верно, верно, связь есть. 17- неверно, неверно, связи нет. 18 - верно, верно, связь есть.

Заключительное занятие по разделам «Средства, действующие на сердечнососудистую систему», «Мочегонные средства»

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Блокаторы натриевых каналов подгруппы IA:

1) хинидин; 2) прокаинамид; 3) пропafenон; 4) дизопирамид; 5) лидокаин.

2. Блокаторы натриевых каналов подгруппы IV:

1) фенитоин; 2) морацизин; 3) мексилетин; 4) лидокаин; 5) аймалин.

3. Блокаторы натриевых каналов подгруппы IC:

1) лидокаин; 2) лаппаконитин; 3) морацизин; 4) мексилетин; 5) прокаинамид.

4. При наджелудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях применяют:

1) хинидин; 2) фенитоин; 3) верапамил; 4) пропранолол; 5) лидокаин.

5. При желудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях применяют:

1) верапамил; 2) амиодарон; 3) мексилетин; 4) лидокаин; 5) фенитоин.

6. К противоаритмическим средствам из группы блокаторов калиевых каналов относится:

1) верапамил; 2) амиодарон; 3) соталол; 4) нибентан; 5) лидокаин.

7. Кардиотонические средства гликозидной структуры:

1) коргликон; 2) добутамин; 3) убаин; 4) допамин; 5) дигоксин.

8. При интоксикации сердечными гликозидами применяют:

1) фенитоин; 2) панангин; 3) унитиол; 4) допамин.

9. Антиангинальное действие оказывают:

1) органические нитраты; 2) β -адреноблокаторы; 3) блокаторы кальциевых каналов; 4) M-холиноблокаторы; 5) сердечные гликозиды.

10. Антигипертензивное действие оказывают:

1) β -адреноблокаторы; 2) ингибиторы АПФ; 3) α -адреномиметики; 4) активаторы калиевых каналов.

11. Нейротропные антигипертензивные средства центрального действия:

1) доксазозин; 2) клонидин; 3) моксонидин; 4) гуанфацин; 5) резерпин.

12. Миотропные антигипертензивные средства:

1) нифедипин; 2) diazoxid; 3) натрия нитропруссид; 4) эналаприл; 5) амлодипин.

13. Тиазиды и тиазидоподобные диуретики:

1) гидрохлоротиазид; 2) маннитол; 3) индапамид; 4) хлорталидон; 5) клопамид.

14. «Петлевые» диуретики:

1) маннитол; 2) буметанид; 3) фуросемид; 4) этакриновая кислота; 5) спиронолактон.

15. Гиполипидемические средства из группы фибратов:

1) гемфиброзил; 2) ловастатин; 3) никотиновая кислота; 4) фенофибрат; 5) безафибрат.

16. Антиаритмическое, антиангинальное, антигипертензивное действие оказывают:

1) верапамил; 2) нифедипин; 3) дилтиазем; 4) пропранолол; 5) амлодипин.

17. Антиангинальное и антиаритмическое действие оказывают:

1) нифедипин; 2) амиодарон; 3) атенолол; 4) амлодипин; 5) верапамил.

18. Ингибиторы АПФ применяют:

1) для систематического лечения артериальной гипертензии; 2) при тахикардиях и экстрасистолиях; 3) при застойной хронической сердечной недостаточности; 4) при блокадах сердца.

19. При наджелудочковых экстрасистолиях, артериальной гипертензии и стенокардии применяют:

1) лидокаин; 2) метопролол; 3) верапамил; 4) пропранолол; 5) талинолол.

20. При желудочковых экстрасистолиях и стенокардии применяют:

1) верапамил; 2) амиодарон; 3) атенолол; 4) нифедипин; 5) фенитоин.

21. При нарушении мозгового кровообращения применяют:

1) нифедипин; 2) нимодипин; 3) дилтиазем; 4) циннаризин; 5) верапамил.

22. При хронической сердечной недостаточности применяют:

1) сердечные гликозиды; 2) ингибиторы АПФ; 3) сосудорасширяющие средства; 4) диуретики; 5) β -адреномиметики.

23. Положительное инотропное действие на сердце оказывают: 1) дигоксин; 2) добутамин; 3) атропин; 4) убаин; 5) допамин.

24. Снижают пред- и постнагрузку на сердце:

1) органические нитраты; 2) ингибиторы АПФ; 3) блокаторы кальциевых каналов; 4) блокаторы АТ1-рецепторов; 5) активаторы калиевых каналов.

25. При блокадах проводящей системы сердца применяют:

1) β -адреноблокаторы; 2) β 2-адреномиметики; 3) сердечные гликозиды; 4) М-холиноблокаторы.

26. Диуретики применяют:

1) при отеках; 2) при тахикардиях и экстрасистолиях; 3) при артериальной гипертензии; 4) при стенокардии.

27. При тахикардиях и экстрасистолиях применяют:

1) блокаторы натриевых каналов; 2) активаторы калиевых каналов; 3) β -адреноблокаторы; 4) блокаторы калиевых каналов; 5) блокаторы кальциевых каналов.

28. Антиатеросклеротическое действие оказывают:

1) статины; 2) β -адреноблокаторы; 3) фибраты; 4) антиоксиданты.

29. При артериальной гипотензии применяют:

1) ангиотензинамид; 2) фенилэфрин; 3) резерпин; 4) карведилол; 5) азаметония бромид.

30. При острой сердечной недостаточности применяют:

1) дигитоксин; 2) коргликон; 3) панангин; 4) убаин; 5) допамин.

31. Кардиопротекторные средства применяют:

1) при стенокардии; 2) при артериальной гипертензии; 3) при тахикардиях и экстрасистолиях; 4) при блокадах сердца.

32. При стенокардии напряжения применяют:

1) нитроглицерин; 2) дипиридамол; 3) пропранолол; 4) триметазидин; 5) талинолол.

33. При вазоспастической стенокардии применяют:

1) нитроглицерин; 2) дипиридамол; 3) пропранолол; 4) верапамил; 5) нифедипин.

34. При инфаркте миокарда применяют:

1) нитроглицерин; 2) ацетилсалициловую кислоту; 3) хинидин; 4) лидокаин; 5) закись азота.

35. Нейротропные антигипертензивные средства центрального действия уменьшают:

1) сердечный выброс; 2) тонус сосудов; 3) объем циркулирующей крови.

36. Миотропные антигипертензивные средства уменьшают:

1) сердечный выброс; 2) тонус сосудов; 3) объем циркулирующей крови.

37. Средства, снижающие активность ренин-ангиотензиновой системы:

1) пропранолол; 2) лизиноприл; 3) лозартан; 4) гидралазин.

38. В механизме антигипертензивного действия β -адреноблокаторов имеет место:

1) снижение сердечного выброса; 2) снижение секреции ренина юкстагломерулярными клетками почек; 3) восстановление ослабленного барорецепторного рефлекса (при систематическом применении); 4) миотропное сосудорасширяющее действие; 5) уменьшение выделения норадреналина симпатическими волокнами.

39. В механизме антигипертензивного действия диуретиков имеет место:

1) снижение сердечного выброса; 2) уменьшение объема циркулирующей крови; 3) расширение кровеносных сосудов (при систематическом применении); 4) снижение секреции ренина юкстагломерулярными клетками почек.

40. Оказывают сосудорасширяющее действие за счет высвобождения оксида азота (NO):

1) нитроглицерин; 2) карведилол; 3) натрия нитропруссид; 4) изосорбида динитрат; 5) нифедипин.

41. Оказывают сосудорасширяющее действие за счет блокады кальциевых каналов:

1) диазоксид; 2) амлодипин; 3) празозин; 4) нифедипин; 5) нимодипин.

42. Оказывают сосудорасширяющее действие за счет блокады α_1 -адренорецепторов:

1) фенилэфрин; 2) празозин; 3) бетаксолол; 4) доксазозин; 5) резерпин.

43. Комбинированные антигипертензивные средства:

1) адельфан-эзидрекс К; 2) трирезид К; 3) моксонидин; 4) периндоприл;
5) индапамид.

44. Оказывают отрицательное инотропное, хронотропное и дромотропное действие на сердце:

1) β -адреноблокаторы; 2) негликозидные кардиотонические средства; 3) блокаторы кальциевых каналов (верапамил); 4) блокаторы калиевых каналов (амиодарон).

45. Рефлекторная тахикардия возникает при применении:

1) нифедипина; 2) верапамила; 3) доксазозина; 4) нитроглицерина; 5) гидралазина.

46. Головная боль, головокружение, сухой кашель могут возникать при применении:

1) лозартана; 2) эналаприла; 3) нифедипина; 4) периндоприла; 5) нитроглицерина.

Определите группы веществ и лекарственные препараты.

47. Блокируют натриевые и калиевые каналы, снижают автоматизм и проводимость и увеличивают эффективный рефрактерный период во всех отделах сердца. Применяются при наджелудочковых и желудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях. Вызывают нарушение атриовентрикулярной проводимости, снижение сократимости миокарда, артериальную гипотензию. Оказывают аритмогенное действие.

1. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IA). 2. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IB). 3. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IC).

48. Блокируют натриевые каналы, снижают автоматизм и проводимость в желудочках. Практически не влияют на сократимость и атриовентрикулярную проводимость, не снижают артериальное давление. Являются препаратами выбора при желудочковых экстрасистолиях, вызванных инфарктом миокарда и передозировкой сердечных гликозидов.

1. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IA). 2. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IB). 3. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IC).

49. Блокируют натриевые каналы, снижают автоматизм и проводимость во всех отделах сердца. Применяются при угрожающих жизни желудочковых экстрасистолиях, резистентных к другим противоаритмическим средствам. Оказывают выраженное аритмогенное, кардиодепрессивное и отрицательное дромотропное действие.

1. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IA). 2. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IB). 3. Блокаторы натриевых каналов (подгруппа IC).

50. Блокирует потенциалзависимые кальциевые каналы сердца и в меньшей степени артериальных сосудов. Снижает автоматизм синоатриального узла, автоматизм и проводимость атриовентрикулярного узла, снижает сократимость миокарда. Расширяет коронарные и периферические сосуды. Применяется при наджелудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях, вазоспастической стенокардии, артериальной гипертензии. Вызывает сердечную недостаточность, атриовентрикулярный блок, констипацию.

1. Амiodарон. 2. Верапамил. 3. Нифедипин. 4. Дилтиазем. 5. Нимодипин.

51. Блокируют Na⁺/K⁺-АТФазу мембран кардиомиоцитов. Оказывают положительное ино- и батмотропное действие, отрицательное хроно- и дромотропное действие. Применяются при сердечной недостаточности.

1. β1-Адреномиметики. 2. Сенситизаторы кальция. 3. Сердечные гликозиды.

52. Оказывают антиангинальное, антиаритмическое и антигипертензивное действие. Уменьшают сердечный выброс и общее периферическое сосудистое сопротивление (при систематическом применении). Применяются при стенокардии напряжения, артериальной гипертензии, наджелудочковых и желудочковых тахиаритмиях и экстрасистолиях. Повышают тонус бронхов у больных бронхиальной астмой.

1. Блокаторы кальциевых каналов. 2. β-Адреноблокаторы. 3. Блокаторы калиевых каналов.

53. Уменьшают потребность миокарда в кислороде за счет снижения пред- и постнагрузки на сердце. Увеличивают доставку кислорода к миокарду за счет расширения крупных коронарных сосудов и коллатералей. Применяют при стенокардии, остром инфаркте миокарда, сердечной недостаточности. Вызывают головную боль, головокружение, гипотензию.

1. Органические нитраты. 2. β -Адреноблокаторы. 3. Блокаторы кальциевых каналов.

54. Расширяют артериальные и венозные сосуды, снижают нагрузку на сердце. Уменьшают объем циркулирующей крови. Повышают уровень брадикинина. Применяются при артериальной гипертензии и хронической застойной сердечной недостаточности. Вызывают сухой кашель, ангионевротический отек, головную боль, головокружение.

1. β -Адреноблокаторы. 2. Блокаторы АТ1-рецепторов. 3. Ингибиторы АПФ. 4. Блокаторы кальциевых каналов.

55. Оказывают диуретическое действие за счет нарушения реабсорбции ионов Na^+ и Cl^- в начальном отделе дистальных канальцев. Применяются для уменьшения отеков при сердечной недостаточности, заболеваниях почек. Для систематического лечения артериальной гипертензии назначаются в небольших дозах 1 раз в сутки. Вызывают гипокалиемию, гипомагниемию, гиперурикемию, гипергликемию.

1. Тиазиды и тиазидоподобные диуретики. 2. Петлевые диуретики. 3. Антагонисты альдостерона. 4. Осмотические диуретики.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4. 2-1,3,4. 3-2,3. 4-1,3,4. 5-2,3,4,5. 6-2,3,4. 7-1,3,5. 8-1,2,3.
9-1,2,3. 10-1,2,4. 11-2,3,4. 12-1,2,3,5. 13-1,3,4,5. 14-2,3,4.
15-1, 4,5. 16-1,3,4. 17-2,3,5. 18-1,3. 19-2,3,4,5. 20-2,3. 21-2,4.
22-1,2,3,4. 23-1,2,4,5. 24-1,2,4. 25-2,4. 26-1,3. 27-1,3,4,5.
28-1,3,4. 29-1. 30-2,4,5. 31-1. 32-1,3,4,5. 33-1,2,4,5. 34-1,2,4,5.
35-1,2. 36-2. 37-1,2,3. 38-1,2,3,5. 39-2,3. 40-1,3,4. 41-2,4,5.
42-2,4. 43-1,2. 44-1,3. 45-1,3,4,5. 46-2,4. 47-1. 48-2. 49-3.
50-2. 51-3. 52-2. 53-1. 54- 55-1.

Раздел 8. Средства, влияющие на функции органов дыхания

Тема 8.1. Стимуляторы дыхания. Противокашлевые средства.

Отхаркивающие средства. Средства, применяемые при бронхиальной астме

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Стимуляторы дыхания. Классификация, механизмы действия, применение.

Противокашлевые средства. Классификация по механизму действия. Применение.

NB! Кашель возникает рефлекторно в ответ на стимуляцию чувствительных рецепторов слизистой оболочки дыхательных путей. С целью подавления кашлевого рефлекса можно использовать средства, снижающие чувствительность слизистой оболочки дыхательных путей к раздражающим факторам, или средства, подавляющие активность кашлевого центра, который находится в продолговатом мозге.

Отхаркивающие средства. Классификация, механизмы действия, применение.

NB! Отхаркивающие средства - средства, облегчающие отделение мокроты. Облегчение выделения мокроты может достигаться либо путем усиления секреции бронхиальных желез и активацией движения ресничек мерцательного эпителия бронхов (секретомоторное действие), либо уменьшением вязкости и адгезивности мокроты за счет деполимеризации белковых молекул (муколитическое действие).

Некоторые препараты обладают как муколитическим, так и секретомоторным свойствами.

Средства, применяемые при бронхиальной астме. Классификация.

NB! Бронхиальная астма - хроническое воспалительное заболевание инфекционноаллергической природы, протекающее с приступами бронхоспазма. В связи с этим основными направлениями медикаментозной коррекции бронхиальной астмы являются:

- подавление воспалительного процесса в дыхательных путях;
- подавление аллергической реакции;
- предупреждение или устранение бронхоспазма.

Препараты глюкокортикоидов для ингаляционного применения. Механизмы действия. Побочные эффекты.

NB! «Антиастматическое» действие препаратов глюкокортикоидов - результат их:

- противовоспалительного действия (уменьшение воспалительного процесса в бронхах);
- противоаллергического действия (уменьшение продукции и выделения медиаторов аллергии);
- иммуносупрессивного действия (уменьшение пролиферации и дифференцировки лимфоцитов, подавления продукции цитокинов).

Стабилизаторы мембран тучных клеток. Механизм действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! В тучных клетках синтезируются биологически активные вещества (в том числе лейкотриены, гистамин), выделение которых вызывает различные симптомы бронхиальной астмы (в том числе бронхоспазм). Выделение

биологически активных веществ из тучных клеток происходит вследствие дегрануляции последних. Дегрануляция возникает при взаимодействии антигенаадсорбированным на поверхности тучной клетки иммуноглобулином Е. При этом в тучные клетки поступают ионы кальция, способствующие экзоцитозу

медиаторов аллергии. Стабилизаторы мембран тучных клеток препятствуют входу ионов кальция в тучные клетки и их дегрануляции.

Средства, препятствующие синтезу и действию лейкотриенов. Механизм действия, применение.

NB! Лейкотриены C₄, D₄, E₄ (цистеиниловые лейкотриены) синтезируются в тучных клетках из арахидоновой кислоты при участии фермента 5-липоксигеназы. Выделяясь из тучных клеток при их дегрануляции, цистеиниловые лейкотриены стимулируют специфические рецепторы (Cis-LT-рецепторы) в бронхах, что приводит к бронхоспазму.

Уменьшить действие цистеиниловых лейкотриенов можно путем нарушения их синтеза или блокадой специфических к ним рецепторов.

Бронхолитические средства. Классификация по механизму действия. Применение, побочные эффекты.

Тема 8.1. Стимуляторы дыхания. Противокашлевые средства. Отхаркивающие средства. Средства, применяемые при бронхиальной астме

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Стимуляторы дыхания. Классификация, механизмы действия, применение.

Противокашлевые средства. Классификация по механизму действия. Применение.

NB! Кашель возникает рефлекторно в ответ на стимуляцию чувствительных рецепторов слизистой оболочки дыхательных путей. С целью подавления кашлевого рефлекса можно использовать средства, снижающие чувствительность слизистой оболочки дыхательных путей к раздражающим факторам, или средства, подавляющие активность кашлевого центра, который находится в продолговатом мозге.

Отхаркивающие средства. Классификация, механизмы действия, применение.

NB! Отхаркивающие средства - средства, облегчающие отделение мокроты. Облегчение выделения мокроты может достигаться либо путем усиления секреции бронхиальных желез и активацией движения ресничек мерцательного эпителия бронхов (секретомоторное действие), либо уменьшением вязкости и адгезивности мокроты за счет деполимеризации белковых молекул (муколитическое действие).

Некоторые препараты обладают как муколитическим, так и секретомоторным свойствами.

Средства, применяемые при бронхиальной астме. Классификация.

NB! Бронхиальная астма - хроническое воспалительное заболевание инфекционноаллергической природы, протекающее с приступами бронхоспазма. В связи с этим основными направлениями медикаментозной коррекции бронхиальной астмы являются:

- подавление воспалительного процесса в дыхательных путях;
- подавление аллергической реакции;
- предупреждение или устранение бронхоспазма.

Препараты глюкокортикоидов для ингаляционного применения. Механизмы действия. Побочные эффекты.

NB! Гладкомышечные элементы бронхов содержат:

M3-холинорецепторы, которые возбуждаются при активации блуждающего нерва;

- неиннервируемые β_2 -адренорецепторы;
- аденозиновые A1-рецепторы.

Бронхолитический эффект достигается блокадой M3-холинорецепторов, стимуляцией β_2 -адренорецепторов или блокадой A1-рецепторов. Блокаторы аденозиновых рецепторов - метилксантины обладают, кроме того, миотропными бронхолитическими свойствами (за счет неизбирательного ингибирования фосфодиэстераз).

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Стимуляторы дыхания.

Кофени-бензоат натрия
Никетамид (кордиамин)

Цитизин

Б. Противокашлевые средства.

Глауцин (глаувент)
Кодсин

Окселадин (тусупрекс)
Преноксдиазин (либексин)

В. Отхаркивающие и муколитические средства.

Г. Средства, применяемые при бронхиальной астме.

Аминофиллин (эуфиллин)	Недокромил (тайлед)
Беклометазон (бекотид)	Омализумаб (ксолар)
Будесонид (пульткорт)	Салметерол (серевент)
Зафирлукаст (аколат)	Сальбутамол (вентолин)
Ипратропий (атровент)	Тиотропий
Кетотифен (задитен)	Фенотерол (беротек)
Кромоглициевая кислота (кромолин-натрий, интал)	Флунизолид (ингакорт)
Монтелукаст (сингуляр)	Флутиказон (фликсотид)
	Формотерол (форатил)

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию стимуляторов дыхания препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Стимуляторы дыхания центрального действия:

_____.

Стимуляторы дыхания рефлекторного действия:

_____.

Стимуляторы дыхания смешанного действия:

_____.

Задание 2

А. Дополните классификацию противокашлевых средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства центрального действия.

Опиоидные:

_____.

Неопиоидные:

а) _____.

б) _____.

Средства периферического действия:

_____.

Б. Дайте сравнительную характеристику противокашлевых средств.
 Результаты отразите в табл. 8.1.

Таблица 8.1. Сравнительная характеристика противокашлевых средств

Параметры сравнения	Глауцин н	Кодеин	Преноксдиазин
Механизм действия			
Прямое угнетение кашлевого центра			
Стимуляция опиоидных рецепторов кашлевого центра			
Снижение чувствительности рецепторов слизистой оболочки дыхательных путей			
Угнетение дыхательного центра			
Побочное действие			
Лекарственная зависимость			
Запор (констипация)			

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».
 NB! Применение кодеина в виде монопрепарата резко ограничено ввиду наркотического потенциала. Основная сфера его применения как противокашлевого средства - в составе комбинированных препаратов.

Задание 3

А. Дополните классификацию отхаркивающих средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства прямого действия (муколитические средства):

а) _____ ;

б) _____ ;

в) _____ ;

Средства рефлекторного действия:

Б. Дайте сравнительную характеристику отхаркивающих средств. Результаты отразите в табл. 8.2.

Таблица 8.2. Сравнительная характеристика отхаркивающих средств

Ацетилцистеин	Амброксол	Препараты термопсиса
Параметры сравнения		
Снижение вязкости и адгезивности мокроты за счет деполимеризации молекул протеогликанов		
Механизм отхаркивающего действия		
Увеличение объема мокроты		
Повышение активности мерцательного эпителия		
Рефлекторная стимуляция секреции бронхиальных желез		
Хронические бронхиты, пневмония		
Бронхиальная астма		
Показания к применению		
Респираторный дистресссиндром		
Для уменьшения гепатотоксического действия ацетаминофена		

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

NB! Противокашлевые и отхаркивающие средства применяют при заболеваниях, сопровождающихся кашлем. При этом следует иметь в виду, что при острых воспалительных процессах подавлять умеренный кашель нецелесообразно в связи с тем, что кашель способствует дренированию бронхов и удалению мокроты.

Задание 4. Дополните классификацию средств, применяемых при бронхиальной астме, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства с противовоспалительным, противоаллергическим и иммунодепрессивным действием.

Препараты глюкокортикоидов:

- а) _____;
- б) _____;
- в) _____;
- г) _____.

Стабилизаторы мембран тучных клеток:

- а) _____;
- б) _____;
- в) _____.

Блокаторы лейкотриеновых рецепторов:

- а) _____;
- б) _____.

Препараты моноклональных антител к иммуноглобулинам:

_____.

Бронхолитические средства.

Средства, стимулирующие β_2 -адренорецепторы:

а) _____;

б) _____;

в) _____;

г) _____.

Средства, блокирующие М-холинорецепторы:

а) _____;

б) _____.

Средства миотропного действия:

_____.

Задание 5. На схеме 8.1 отметьте действие: будесонида, кромоглициевой кислоты, zileutona, зафирлукаста, тиотропия, формотерола, аминофиллина, омализумаба.

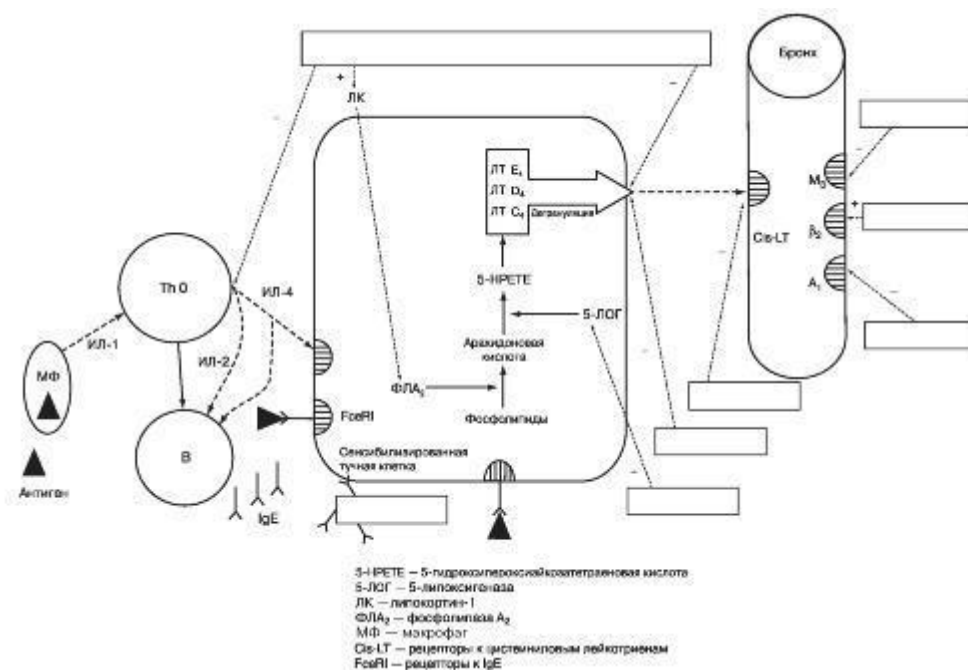


Схема 8.1. Локализация и механизмы действия средств, применяемых при бронхиальной астме

Задание 6. Дайте фармакологическую характеристику средств, применяемых при бронхиальной астме (табл. 8.3).

Таблица 8.3. Фармакологическая характеристика средств, применяемых при бронхиальной астме

Препарат	Показания	Длительность действия, эффекты	Побочные эффекты
Беклометазон			1. 2.
Будесонид			1. 2.
Кромоглициевая кислота			
Сальбутамол			1. 2.
Формотерол			1. 2.
Ипратропий			1. 2.
Аминофиллин			1. 2. 3.

Примечание. В рубрике «Показания» укажите: «Профилактика бронхоспазма»; «Купирование бронхоспазма». При заполнении рубрики «Побочные эффекты» используйте приведенный ниже перечень:

- сухость во рту;
- тахикардия;
- тремор;
- психомоторное возбуждение;

- рефлекторный бронхоспазм;
- дисфония (охриплость голоса);
- кандидамикоз ротовой полости и глотки.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

- К стимуляторам дыхания относятся:
1) никетамид; 2) кодеин; 3) цитизин; 4) ацетилцистеин; 5) кофеин-бензоат натрия.
- К противокашлевым средствам относятся:
1) ацетилцистеин; 2) глауцин; 3) окселадин; 4) преноксдиазин; 5) кодеин.
- Подавляет кашлевой рефлекс, стимулируя опиоидные рецепторы кашлевого центра:
1) ацетилцистеин; 2) преноксдиазин; 3) окселадин; 4) глауцин; 5) кодеин.
- Подавляет кашлевой рефлекс, снижая чувствительность слизистой оболочки бронхов:
1) кодеин; 2) глауцин; 3) окселадин; 4) преноксдиазин; 5) ацетилцистеин.
- К отхаркивающим средствам относятся:
1) глауцин; 2) амброксол; 3) преноксдиазин; 4) ацетилцистеин; 5) бромгексин.
- Облегчает отделение мокроты за счет разрушения дисульфидных мостиков протеогликанов:
1) амброксол; 2) глауцин; 3) преноксдиазин; 4) бромгексин; 5) ацетилцистеин.
- Облегчает отделение мокроты за счет рефлекторного увеличения секреции бронхиальных желез:
1) преноксдиазин; 2) ацетилцистеин; 3) настой травы термопсиса; 4) бромгексин.
- К бронхолитикам относятся:
1) фенотерол; 2) кетотифен; 3) ипратропий; 4) зафирлукаст; 5) будесонид.
- Расширяют бронхи за счет стимуляции β_2 -адренорецепторов:

1) формотерол; 2) недокромил; 3) фенотерол; 4) кетотифен; 5) сальбутамол.

10. Расширяют бронхи за счет блокады М3-холинорецепторов:

1) недокромил; 2) ипратропий; 3) аминофиллин; 4) тиотропий; 5) монтелукаст.

11. Расширяет бронхи за счет прямого миотропного действия:

1) будесонид; 2) ипратропий; 3) аминофиллин; 4) зафирлукаст; 5) кетотифен.

12. К стабилизаторам мембран тучных клеток относятся:

1) монтелукаст; 2) кромоглициевая кислота; 3) флунизолид; 4) недокромил; 5) кетотифен.

13. К блокаторам лейкотриеновых рецепторов относятся:

1) флутиказон; 2) зафирлукаст; 3) флунизолид; 4) монтелукаст; 5) беклометазон.

14. К препаратам глюкокортикостероидов относятся:

1) флунизолид; 2) будесонид; 3) монтелукаст; 4) флутиказон; 5) беклометазон.

15. Для купирования бронхоспазма применяют:

1) фенотерол; 2) недокромил; 3) сальбутамол; 4) зафирлукаст; 5) ипратропий.

16. Для купирования бронхоспазма не применяют:

1) сальбутамол; 2) недокромил; 3) фенотерол; 4) монтелукаст; 5) кромоглициевую кислоту.

17. При бронхоспазме, обусловленном приемом нестероидных противовоспалительных средств, применяют:

1) зафирлукаст; 2) недокромил; 3) кромоглициевую кислоту; 4) монтелукаст.

18. Препараты глюкокортикостероидов эффективны при бронхиальной астме, так как:

1) препятствуют синтезу лейкотриенов; 2) стабилизируют мембраны тучных клеток; 3) оказывают противовоспалительное действие; 4) уменьшают

дифференцировку В-лимфоцитов и продукцию ими антител; 5) обладают иммуностимулирующим действием.

Определите лекарственные препараты.

19. Применяется ингаляционно для купирования бронхоспазма. Действует около 6 ч. В качестве побочных эффектов вызывает мышечный тремор и тахикардию.

1.Ипратропий. 2. Фенотерол. 3. Кромоглициевая кислота. 4. Беклометазон.

20. Применяется ингаляционно для купирования бронхоспазма. Действует около 6 ч. В качестве побочных эффектов может вызвать сухость в ротовой полости, тахикардию и нарушение зрения.

1.Фенотерол. 2. Будесонид. 3. Недокромил. 4. Ипратропий.

21. Применяется ингаляционно при бронхиальной астме. Эффект нарастает постепенно и достигает максимума через неделю. Применяется 2 раза в сутки. Малоэффективен как средство купирования бронхоспазма. В качестве побочных эффектов вызывает дисфонию и кандидамикоз ротовой полости.

1. Кромоглициевая кислота. 2. Фенотерол. 3. Будесонид. 4. Ипратропий.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Муколитическое средство.

*Rp.: Pulv. Acetylcysteini 0,2
D.t.d. N. 10
S. Принимать внутрь.*

Ваши замечания

Б. Стабилизатор мембран тучных клеток.

*Rp.: Cromolyni-natrii 0,02
D.t.d. N. 10 in capsulis
S. По 1 капсуле внутрь 3 раза в день.*

Ваши замечания

В. Глюкокортикоид для лечения бронхиальной

астмы.

*Rp.: Aerosolum «Beclomet» N. 1
D.S. По 2 ингаляции 4 раза в сутки.*

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-1,3,5. 2-2,3,4,5. 3-5. 4-4. 5-2,4,5. 6-5. 7-3. 8-1,3. 9-1,3,5. 10-2,4.
11-3. 12-2,4,5. 13-2,4. 14-1,2,4,5. 15-1,3,5. 16-2,4,5. 17-1,4. 18-
1,2,3,4. 19-2. 20-4. 21-3.

Раздел 9. Средства, влияющие на функции органов пищеварения

Тема 9.1. Средства, влияющие на аппетит. Средства, применяемые при язвенной болезни. Гастрокинетики. Противорвотные средства

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация средств, влияющих на аппетит. Горечи: особенности применения. Анорексигенные средства: механизмы действия, особенности применения, побочные эффекты.

Классификация средств, применяемых при язвенной болезни.

NB! Пептические язвы слизистой оболочки желудка возникают вследствие дисбаланса между факторами агрессии (пепсин, соляная кислота, желчные кислоты, *Helicobacter pylori*) и факторами защиты (слизь, бикарбонат, значительная регенераторная способность эпителия, активное кровоснабжение слизистой оболочки). Эндогенными активаторами защитных факторов являются синтезирующиеся в стенке желудка простагландины группы E и I₂.

Средства, снижающие секрецию желез желудка (антисекреторные средства). Классификация, механизмы действия, побочные эффекты.

Средства, нейтрализующие свободную хлористоводородную кислоту (антацидные средства). Классификация, особенности применения, побочные эффекты.

Гастропротекторы. Классификация, механизмы действия, особенности применения.

Средства для эрадикации *Helicobacter pylori*.

Гастрокинетики. Механизмы действия, эффекты, применение.

Противорвотные средства. Механизмы действия, эффективность при рвоте различного происхождения, применение.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ А.

Средства, влияющие на аппетит.

Настой травы золототысячника
Настойка полыни

Сибутрамин (меридиа)
Фенилпропаноламин (тримекс)

Б. Средства, применяемые при язвенной болезни. Б.1. Антисекреторные и антацидные средства.

Алюминия гидроокись Лансопризол Магния гидроокись Магния трисиликат Омепразол (омез, лосек)

Пирензепин (гастроцепин) Рабипразол (париет) Ранитидин (зантак) Фамотидин (ульфамид)

Б.2. Гастропротекторы и средства для эрадикации *Helicobacter pylori*.

В. Гастрокинетики и противорвотные средства.

Домперидон (мотилиум) Метоклопрамид (церукал, реглан) Ондансетрон (зофран) Прометазин (дипразин, дедалон)
--

Таблетки «Аэрон» Тиэтилперазин (торекан) Цизаприд (координакс)
--

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

А. Дополните классификацию средств, влияющих на аппетит, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, повышающие аппетит. Горечи:

а) _____;

б) _____.

Препараты инсулина:

_____.

Средства, снижающие аппетит (анорексигенные средства).

Средства, стимулирующие норадренергическую систему:

_____.

Средства, стимулирующие норадренергическую и серотонинергическую системы:

_____.

Б. Укажите побочные эффекты анорексигенных средств.

Задание 2. Дополните классификацию средств, применяемых при язвенной болезни, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, снижающие секрецию хлористоводородной кислоты (антисекреторные средства). Ингибиторы H^+ , K^+ -АТФазы (ингибиторы протонного насоса):

а) _____;

Блокаторы гистаминовых H_2 -рецепторов:

а) _____;

б) _____.

Блокаторы M_1 -холинорецепторов:

_____.

Средства, нейтрализующие свободную хлористоводородную кислоту (антацидные средства):

а) _____;

б) _____;

в) _____.

Гастропротекторы:

а) _____;

б) _____.

Средства для эрадикации *Helicobacter pylori*:

а) _____;

б) _____;

в) _____;

г) _____.

Задание 3

А. На схеме 9.1 отметьте действие: омепразола, ранитидина, пирензепина и атропина.

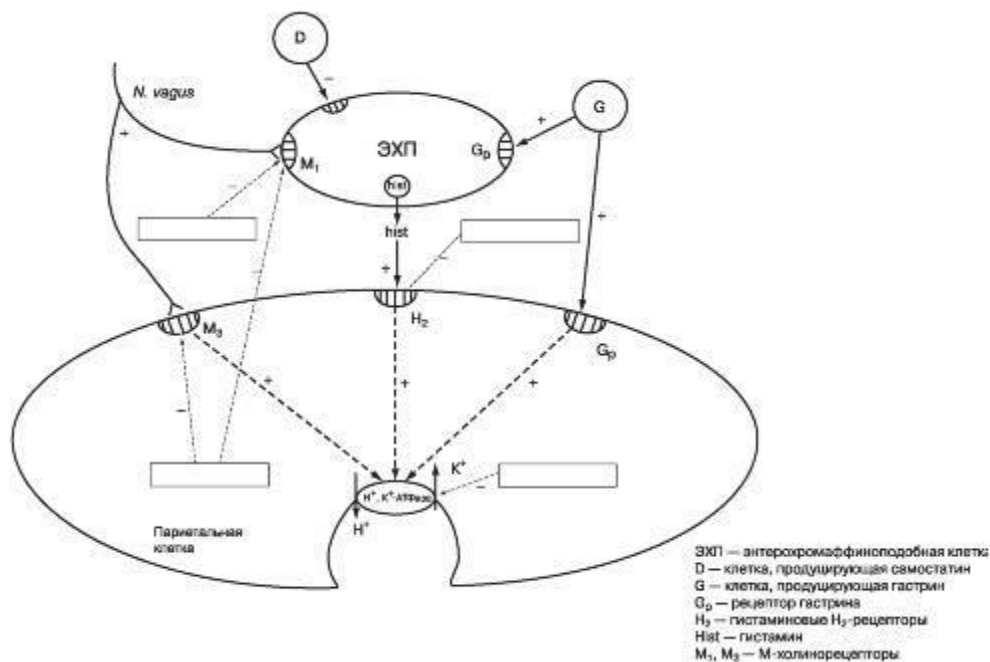


Схема 9.1. Механизмы действия антисекреторных средств

Б. Объясните механизм антисекреторного действия ингибиторов протонного насоса, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Превращение препарата в сульфенамид (в кислой среде секреторных канальцев).

Длительное (около суток) снижение секреции хлористоводородной кислоты.

Нарушение транспорта ионов водорода (протонов) в просвет желудка.

Ковалентное связывание сульфенамидом тиоловых группировок H^+ , K^+ -АТФазы.

Необратимое угнетение протонного насоса.

В. Объясните механизм антисекреторного действия пирензепина, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Блокада M_1 -холинорецепторов энтерохромаффиноподобных клеток.

Подавление секреции гистамина энтерохромаффиноподобными клетками.

Снижение секреции хлористоводородной кислоты.

Прекращение стимуляции гистамином H_2 -рецепторов париетальных клеток.

Г. Объясните, в чем преимущества пирензепина как антисекреторного средства перед атропином.

NB! Средства, уменьшающие секрецию хлористоводородной кислоты, применяют не только при язвенной болезни, но также при гиперацидном гастрите, рефлюкс-эзофагите, синдроме Золлингера-Эллисона и др.

По клинической эффективности группы антисекреторных средств можно расположить в следующей последовательности: ингибиторы протонного насоса > блокаторы гистаминовых H₂-рецепторов > M₁-холиноблокаторы.

Задание 4.

А. Сравните антацидные средства (табл. 9.1).

Таблица 9.1. Сравнительная характеристика антацидных средств

Препарат	Параметры сравнения		
	Скорость наступления эффекта	Продукты реакции нейтрализации	Побочные эффекты
Алюминия гидроокись			
Магния гидроокись			

Примечание. При заполнении рубрики «Побочные эффекты» используйте эффекты, приведенные ниже: послабляющее действие, закрепляющее действие, нарушение всасывания фосфатов в кишечнике

Б. Объясните, почему антацидные средства целесообразно назначать через 1 ч, а затем через 3 ч после еды.

NB! Ввиду разнонаправленного действия антацидных препаратов алюминия и магния на моторику кишечника целесообразно применять эти препараты в комбинации друг с другом. Фармацевтическая промышленность выпускает комбинированные антацидные средства маалокс, алмагель и др.

Задание 5

А. Объясните механизм гастропротекторного действия сукралфата, дополнив приведенную ниже схему 9.2.

NB! Простагландины E₁, E₂ и I₂ повышают устойчивость слизистой оболочки желудка вследствие:

- увеличения секреции слизи, покрывающей эпителиоциты;

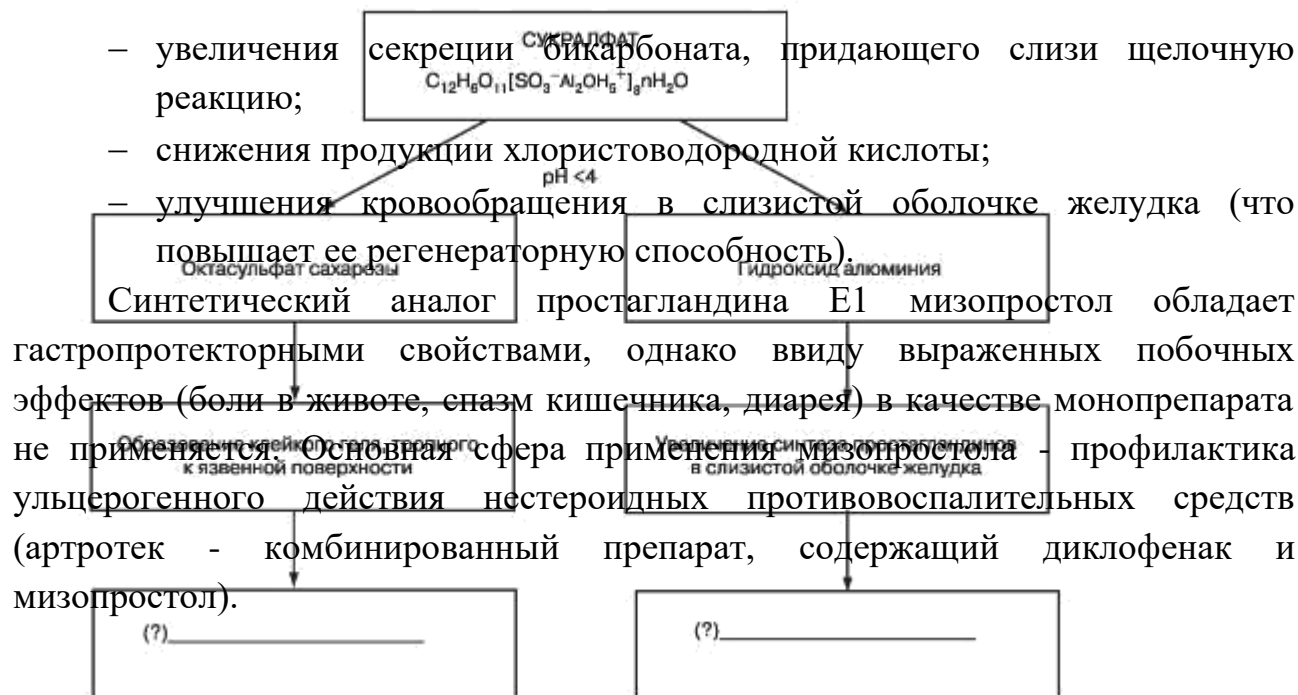


Схема 9.2. Механизм гастропротекторного действия сукралфата Б. Объясните, почему:

- сукралфат, висмута трикалия дицитрат нецелесообразно комбинировать с антисекреторными и антацидными средствами;
- гастропротекторы целесообразно назначать за 1 ч до еды.

NB! Висмута трикалия дицитрат (денол) не только оказывает гастропротекторное действие, но и способствует эрадикации *Helicobacter pylori*.

Снижение кислотности содержимого желудка увеличивает эффективность средств, действующих на *H. pylori*. Пилорид - комбинированный препарат, содержащий висмута трикалия дицитрат и ранитидин.

Прочие антигеликобактерные средства (метронидазол, амоксициллин) чаще всего комбинируют с ингибиторами протонного насоса.

Задание 6. Дайте сравнительную характеристику гастрокинетиков (табл. 9.2).

Таблица 9.2. Сравнительная характеристика гастрокинетиков

Параметры сравнения	Метоклопрамид	
	Домперидон	Цизаприд

Механизм	Блокада дофаминовых D2-рецепторов		
	Блокада серотониновых 5-HT3-рецепторов		
	Стимуляция пресинаптических 5-HT4рецепторов		

действи

я

Окончание табл. 9.2

Параметры сравнения	Метоклопрами д	Домперидон д	Цизапри д
Задержка эвакуации содержимого желудка			
Показания к применению	Рефлюкс-эзофагит		
	В качестве противорвотного средства		

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 7. Дайте сравнительную характеристику противорвотных средств (табл.9.3). Таблица 9.3. Сравнительная характеристика противорвотных средств

Параметры сравнения	Таблетки Прометазин «Аэрон»	Тиэтилперазин	Ондансетро н
Блокада М-холинорецепторов			
Блокада гистаминовых H1-рецепторов			
Механизм действия	Блокада дофаминовых D2-рецепторов		

Блокада центральных и
периферических
серотониновых 5-НТЗ-
рецепторов

Рвота при болезни
Рвота в
Показание к послеоперационном
применению периоде
Рвота, вызванная
химиотерапией опухолей

движения					
	Рвота в послеоперационном периоде				
	Рвота, вызванная химиотерапией опухолей				

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. К анорексигенным средствам относятся:
 - 1) сибутрамин; 2) настойка полыни; 3) фенилпропаноламин.
2. При язвенной болезни применяют:
 - 1) антацидные средства; 2) антисекреторные средства; 3) ферментные препараты; 4) гастропротекторные средства; 5) средства, вызывающие эрадикацию *H. pylori*.
3. Секрецию соляной кислоты снижают:
 - 1) антацидные препараты; 2) ингибиторы H^+ , K^+ -АТФазы; 3) М-холиноблокаторы; 4) простагландины группы Е; 5) блокаторы гистаминовых H_1 -рецепторов.
4. Антацидное действие оказывают:
 - 1) алюминия гидроксид; 2) магния гидроксид; 3) метронидазол; 4) магния трисиликат; 5) ранитидин.
5. К ингибиторам H^+ , K^+ -АТФазы относятся:
 - 1) пирензепин; 2) омепразол; 3) рабепразол; 4) ранитидин; 5) лансопрозол.
6. К блокаторам гистаминовых H_2 -рецепторов относятся:
 - 1) фамотидин; 2) пирензепин; 3) ранитидин; 4) рабепразол; 5) лансопрозол.
7. К M_1 -холиноблокаторам относится:
 - 1) пирензепин; 2) омепразол; 3) атропин; 4) фамотидин; 5) мизопростол.
8. Создают механическую защиту слизистой оболочки желудка и двенадцатиперстной кишки:
 - 1) висмута трикалия дицитрат; 2) мизопростол; 3) сукралфат.
9. Для эрадикации *Helicobacter pylori* применяют:
 - 1) пирензепин; 2) висмута трикалия дицитрат; 3) метронидазол; 4) сукралфат; 5) амоксициллин.

10. Стимулируют моторику желудка, ускоряют эвакуацию желудочного содержимого:

1) домперидон; 2) ондансетрон; 3) метоклопрамид; 4) цизаприд.

11. Противорвотное действие оказывают:

1) цизаприд; 2) метоклопрамид; 3) таблетки «Аэрон»; 4) ондансетрон; 5) прометазин.

Определите лекарственные препараты.

Оказывает гастрокинетическое действие в связи со стимуляцией пресинаптических серотониновых 5-HT₄-рецепторов в холинергических окончаниях миентерального сплетения и повышением выделения ацетилхолина. Стимулирует моторику кишечника. Применяется при рефлюкс-эзофагите, гастропарезе, задержке эвакуации содержимого желудка, хронической констипации.

1. Метоклопрамид. 2. Домперидон. 3. Ондансетрон. 4. Цизаприд.

Оказывает гастропротекторное действие, образуя клейкий гель, тропный к язвенной поверхности. Стимулирует образование простагландинов в слизистой оболочке желудка. Может вызывать констипацию.

1. Висмута трикалия дицитрат. 2. Сукралфат. 3. Алюминия гидроокись. 4. Мизопростол.

Оказывает гастропротекторное действие. Основная сфера применения препарата - профилактика язвенного действия нестероидных противовоспалительных средств.

1. Мизопростол. 2. Висмута трикалия дицитрат. 3. Сукралфат. 4. Омепразол. 5. Алюминия гидроокись.

Совместите.

Препараты	Механизмы действия
15. Ранитидин.	А. Блокирует серотониновые 5-HT ₃ -рецепторы.
16. Метоклопрамид.	Б. Блокирует M ₁ -холинорецепторы.
17. Омепразол.	В. Блокирует гистаминовые H ₂ -рецепторы.
18. Ондансетрон.	Г. Блокирует дофаминовые D ₂ - и серотониновые 5HT ₃ -рецепторы.
19. Пирензепин.	Д. Ингибирует H ⁺ , K ⁺ -АТФазу.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для повышения аппетита.

*Rp.: Tincturae Absinthii 25 ml
D.S. По 10 капель перед приемом пищи.*

Ваши замечания

Б. Гастропротекторное средство.

*Rp.: Bismuthi tripotassii dicitratis
D.t.d.N. 100 in tab.
S. По 1 таблетке за час до еды и на ночь.*

Ваши замечания

В. Средство при рвоте, вызванной химиотерапией опухолей.

*Rp.: Sol. Ondancetroni 2 ml
D.S. По 2 мл внутривенно.*

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-1,3. 2-1,2,4,5. 3-2,3,4,5. 4-1,2,4. 5-2,3,5. 6-1,3. 7-1. 8-1,3.
9-2, 3,5. 10-1,3,4. 11-2,3,4,5. 12-4. 13-2. 14-1. 15-В. 16-Г.
17-Д. 18-А. 19-Б.

Тема 9.2. Средства, влияющие на моторную функцию кишечника.
Средства, применяемые при нарушении экскреторной функции поджелудочной
железы. Средства, влияющие на функцию печени

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация средств, влияющих на моторную функцию кишечника.

NB! Нарушения моторной функции кишечника могут проявляться ее снижением или повышением. Снижение моторной функции может проявляться атонией (приводящей к кишечной непроходимости) или констипацией. Повышение тонуса и моторики кишечника может проявляться коликами (спастическими болями) или диареей.

Слабительные средства. Классификация, механизмы действия, применение.

NB! Слабительные средства применяются при запоре (обстипации, констипации). Существуют классификации слабительных средств:

- по механизму действия;
- по локализации действия;
- по клиническому применению.

Антидиарейные средства. Механизмы действия.

Ферментные препараты.

NB! Железы желудка, кишечника, а также экскреторная часть поджелудочной железы продуцируют пищеварительные ферменты (протеазы, липазы, амилазы и др.). Гипофункция пищеварительных желез приводит к нарушениям кишечного пищеварения. При подобных состояниях в качестве средств заместительной терапии используют препараты пищеварительных ферментов.

Желчегонные средства. Классификация, механизмы действия, показания к применению.

NB! Желчь, продуцируемая гепатоцитами, выделяется в просвет двенадцатиперстной кишки, где выполняет ряд важных для кишечного пищеварения функций (эмульгирует жиры, активирует липолитические ферменты, что способствует всасыванию в тонком отделе кишечника триглицеридов и холестерина, и др.). Недостаточное поступление желчи в просвет кишечника может быть результатом сниженного желчеобразования или нарушенного желчевыведения.

Холелитолитические средства. Механизм действия, показания к применению.

NB! Холелитиаз (желчнокаменная болезнь) - заболевание, при котором в желчном пузыре образуются конкременты. Их образование является результатом изменения физикохимических свойств желчи, в частности перенасыщенности желчи холестерином. Холелитолитические средства способствуют растворению или уменьшению размеров холестериновых конкрементов.

Гепатопротекторы. Классификация, показания к применению.

NB! Гепатопротекторы - группа лекарственных препаратов, повышающих устойчивость гепатоцитов к повреждающим воздействиям и способствующих восстановлению функций печени при различных повреждениях.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Средства, влияющие на моторную функцию кишечника.

Атропин
Ацеклидин
Дротаверин (но-шпа)

Неостигмин (прозерин)
Цизаприд (координакс)

Б. Слабительные средства.

Бисакодил (дьюколакс)
Жидкий парафин (вазелиновое масло)
Касторовое масло
Лактулоза (дюфалак)
Магния сульфат

Макрогол 4000 (форлак)
Метилцеллюлоза
Натрия пикосульфат (гутталакс)
Натрия сульфат
Сеннозиды А + В (гласена)

В. Антидиарейные средства.

Диосмектит (смекта)

Лоперамид (имодиум, лопедиум)

Г. Препараты пищеварительных ферментов (коммерческие названия).

Абомин
Креон (панкреатин микрогранулированный)
Мезим форте

Панзинорм форте
Фестал

Д. Желчегонные средства.

Гимекромон (одестон)
Дротаверин (но-шпа)
Магния сульфат
Осальмид (оксафенамид)

Таблетки «Аллохол»
Таблетки «Холензим»
Холосас
Экстракт кукурузных рылец

Е. Холелитолитические средства и гепатопротекторы.

Адеметионин (гептрал)
Силибинин (легалон)
Урсодезоксихолевая кислота (урсофальк)

Хенодезоксихолевая кислота (хенофальк)
Эссенциале

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1.

А. Дополните классификацию средств, влияющих на моторную функцию кишечника, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, стимулирующие моторную функцию кишечника.

М-холиномиметики:

_____.

Антихолинэстеразные средства:

_____.

Стимуляторы пресинаптических серотониновых 5-HT₄-рецепторов:

_____.

Средства, угнетающие моторную функцию кишечника.

М-холиноблокаторы:

_____.

Спазмолитики миотропного действия:

Б. Укажите показания к применению средств, влияющих на моторную функцию кишечника (табл. 9.4).

Таблица 9.4. Показания к применению средств, влияющих на моторную функцию кишечника

Показания к применению	Ацеклидин	Неостигмин	Атропин	Дротаверин
Послеоперационная атония кишечника				
Кишечная непроходимость				
Кишечная колика				
Печеночная колика				

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 2. Дополните классификацию слабительных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, стимулирующие перистальтику кишечника. Средства, раздражающие хеморецепторы.

Средства растительного происхождения (содержащие антрагликозиды):

Синтетические средства:

а) _____;

б) _____.

Растительные масла:

Средства, раздражающие механорецепторы (средства с осмотическими свойствами). Солевые слабительные:

а) _____;

б) _____.

Средства органического происхождения:

а) _____;

Средства, способствующие размягчению каловых масс:

Задание 3.

А. Объясните механизм действия сеннозидов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Усиление перистальтики толстого отдела кишечника.

Расщепление микрофлорой толстой кишки до активных метаболитов.

Стимуляция хеморецепторов слизистой оболочки толстого отдела кишечника.

Б. Объясните механизм действия касторового масла, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Усиление перистальтики кишечника на всем его протяжении.

Стимуляция хеморецепторов слизистой оболочки кишечника.

Расщепление в двенадцатиперстной кишке с образованием рициноловой кислоты.

В. Объясните механизм действия магния сульфата, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Нарушение (задержка) всасывания воды в кишечнике.

Повышение осмотического давления в просвете кишечника.

Стимуляция механорецепторов кишечника.

Увеличение объема содержимого кишечника.

Усиление перистальтики кишечника на всем его протяжении.

Г. Объясните механизм действия лактулозы, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Увеличение объема содержимого толстого отдела кишечника.

Повышение осмотического давления в кишечнике.

Расщепление в кишечнике с образованием низкомолекулярных органических кислот.

Усиление перистальтики толстого отдела кишечника.

Стимуляция механорецепторов слизистой оболочки толстого отдела кишечника.

Задание 4. Дайте сравнительную характеристику слабительных средств (табл. 9.5).

Таблица 9.5. Сравнительная характеристика слабительных средств

		Локализация действия		Показания к применению		
	Время					
Препараты	наступления	толстый	на всем	хронические	острые	отравления
	эффекта, ч	отдел	протяжении			
				запоры	запоры	
		кишечника	кишечника			
Сеннозиды						

+ В						
Бисакодил						
Масло касторовое						
Натрия сульфат						
Лактулоза						

Примечание. При заполнении рубрик «Локализация действия» и «Показания к применению» используйте символ «+».

Задание 5. Объясните механизм действия лоперамида, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Уменьшение выделения ацетилхолина из окончаний холинергических волокон.

Стимуляция опиоидных μ -рецепторов на окончаниях холинергических нейронов.

Снижение моторики кишечника.

NB! Фармакотерапия диареи не ограничивается только применением собственно антидиарейных средств (лоперамид, диосмектит). При инфекционной диарее применяют лекарственные препараты, воздействующие на возбудители кишечных инфекций. Кроме того, в комплексной терапии диареи значительное место занимают средства, восстанавливающие нормофлору кишечника (эубиотики, пробиотики). В состав таких препаратов входят либо лиофилизированные бактерии, устойчивые к действию большинства антибиотиков, либо споры бактерий, переходящие в вегетативные формы в просвете кишечника. К таким препаратам относятся:

- линекс (содержит лиофилизированные *Lactobacillus acidophilus*, *Bifidobacterium infantis*, *Streptococcus faecium*);
- бактисубтил (содержит споры *Bacillus* штамма IP-3);
- энтерол (содержит лиофилизированные *Saccharomyces boulardii*).

Задание 6. А. Дополните классификацию желчегонных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, стимулирующие желчеобразование.

Средства, содержащие желчь или ее компоненты:

а) _____;

б) _____.

Синтетические средства:

а) _____;

б) _____.

Средства растительного происхождения:

а) _____;

б) _____.

Средства, стимулирующие желчевыведение:

а) _____;

б) _____.

Б. Укажите основные показания к применению желчегонных средств.

Задание 7. А. Дополните классификацию гепатопротекторов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты, содержащие эссенциальные фосфолипиды:

_____.

Препараты, содержащие флавоноиды:

_____.

Препараты производных аминокислот:

Препараты урсodeоксихолевой кислоты:

_____.

Б. Укажите основные показания к применению гепатопротекторов.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Средства, стимулирующие моторную функцию кишечника:

1) ацеклидин; 2) дротаверин; 3) атропин; 4) лоперамид; 5) неостигмин.

2. Средства, угнетающие моторную функцию кишечника:

1) ацеклидин; 2) дротаверин; 3) атропин; 4) лоперамид; 5) неостигмин.

3. К слабительным средствам, раздражающим хеморецепторы кишечника, относятся:

1) бисакодил; 2) сеннозиды А + В; 3) натрия сульфат; 4) касторовое масло; 5) натрия пикосульфат.

4. К слабительным средствам, при действии которых раздражаются механорецепторы кишечника, относятся:

1) лактулоза; 2) жидкий парафин; 3) метилцеллюлоза; 4) макрогол 4000; 5) магния сульфат.

5. Антидиарейное действие оказывают:

1) диосмектит; 2) неостигмин; 3) лоперамид; 4) ацеклидин.

6. К средствам, восстанавливающим нормальную флору кишечника, относятся:

1) линекс; 2) креон; 3) мезим форте; 4) энтерол; 5) бактисубтил.

7. К ферментным препаратам относятся:

1) абомин; 2) панзинорм форте; 3) фестал; 4) лоперамид; 5) мезим форте.

8. К желчегонным средствам относятся:

1) таблетки «Аллохол»; 2) эссенциале; 3) осалмид; 4) холосас; 5) гимекромон.

9. К холелитолитическим средствам относятся:

1) адеметионин; 2) урсодеоксихолевая кислота; 3) силибинин; 4) хенодеоксихолевая кислота.

10. К гепатопротекторным средствам относятся:

1) адеметионин; 2) фестал; 3) эссенциале; 4) силибинин.

11. При кишечных коликах применяют:

1) ацеклидин; 2) дротаверин; 3) атропин; 4) неостигмин.

12. При послеоперационной атонии кишечника применяют:

1) ацеклидин; 2) дротаверин; 3) атропин; 4) неостимин.

13. На толстый отдел кишечника избирательно действуют:

1) сеннозиды А + В; 2) касторовое масло; 3) бисакодил; 4) натрия сульфат; 5) лактулоза.

14. На всем протяжении кишечника действуют:

1) сеннозиды А + В; 2) касторовое масло; 3) бисакодил; 4) натрия сульфат; 5) лактулоза.

15. При хронических запорах применяют:

1) сеннозиды А + В; 2) натрия пикосульфат; 3) натрия сульфат; 4) лактулозу; 5) касторовое масло.

16. При острых запорах и отравлениях применяют:

1) бисакодил; 2) натрия сульфат; 3) магния сульфат; 4) макрогол 4000; 5) лактулозу.

17. При нарушении экскреторной функции поджелудочной железы применяют:

1) креон; 2) эссенциале; 3) мезим форте; 4) панзинорм форте; 5) фестал.

18. При гепатитах и циррозе печени применяют:

1) абомин; 2) адеметионин; 3) силибинин; 4) эссенциале.

19. К средствам, стимулирующим желчеобразование, относятся:

1) таблетки «Холензим»; 2) дротаверин; 3) таблетки «Аллохол»; 4) холосас.

20. К средствам, стимулирующим желчевыведение, относятся:

1) таблетки «Холензим»; 2) дротаверин; 3) таблетки «Аллохол»; 4) холосас.

21. При воспалительных заболеваниях желчного пузыря, желчевыводящих протоков (холециститах, холангитах) применяют:

1) таблетки «Аллохол»; 2) гимекромон; 3) абомин; 4) осалмид; 5) экстракт кукурузных рылец.

Определите лекарственные препараты.

22. Стимулирует опиоидные μ -рецепторы на окончаниях холинергических нейронов, уменьшает выделение ацетилхолина. Применяется при острой и хронической диарее.

1. Диосмектит. 2. Дротаверин. 3. Лоперамид. 4. Атропин. 5. Ацеклидин.

23. Оказывает миотропное спазмолитическое действие за счет уменьшения входа ионов кальция в гладкомышечные клетки. Применяется при спазмах гладкой мускулатуры внутренних органов.

1. Атропин. 2. Дротаверин. 3. Ацеклидин. 4. Неостигмин.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Солевые слабительные нельзя применять систематически, потому что солевые слабительные нарушают всасывание питательных веществ в тонкой кишке.

Атропин расслабляет сфинктер Одди, потому что атропин оказывает миотропное спазмолитическое действие.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство заместительной терапии при хроническом панкреатите.

*Rp.: Dragee Festali
D.S. По 1 таблетке во время еды.*

Ваши замечания

Б. Слабительное средство при хроническом запоре.

*Rp.: Olei Ricini 30,0
D.t.d.N. 1
S. По 15,0–30,0 г внутрь.*

Ваши замечания

В. Средство, стимулирующее секрецию желчи.

*Rp.: Tab. «Cholenzymum» N. 50
D.S. По 1 таблетке во время еды.*

Ваши замечания

Ответы на тестовые задания

1-1,5. 2-2,3,4. 3-1,2,4,5. 4-1,3,4,5. 5-1,3. 6-1,4,5. 7-1,2,3,5. 8-1,3,4,5. 9-2,4. 10-1,3,4. 11-2,3. 12-1,4. 13-1,3,5. 14-2,4. 15-1,2,4. 16-2, 17-1,3,4,5. 18-2,3,4. 19-1,3,4. 20-2. 21-1,2,4,5. 22-3. 23-2. 24-верно, верно, связь есть. 25 - верно, неверно, связи нет.

Раздел 10. Средства, влияющие на тонус и сократительную активность миометрия

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

NB! Матка представляет собой полый гладкомышечный орган, которому свойственны два типа сокращений: ритмические и тонические. Родовая деятельность - результат ритмических сокращений миометрия, которые способствуют изгнанию плода. Ритмические сокращения миометрия регулируются нейрональными и гуморальными механизмами. Нейрональная регуляция осуществляется через парасимпатическую систему (стимуляция МЗ-холинорецепторов приводит к повышению тонуса миометрия). Гуморальная регуляция осуществляется:

- циркулирующими катехоламинами (стимуляция β 2-адренорецепторов приводит к снижению ритмических сокращений миометрия);
- окситоцином (повышает тонус и ритмические сокращения миометрия, но не снижает тонус шейки матки);
- простагландинами E2 и F2a (повышают тонус и ритмические сокращения миометрия и снижают тонус шейки матки).

Классификация средств, влияющих на миометрий.

NB! Разные группы средств, влияющих на миометрий, применяют:

- для стимуляции родовой деятельности;
- в качестве токолитических средств;
- для остановки маточных кровотечений.

Средства, повышающие тонус и сократительную активность миометрия. Классификация, механизм действия. Различия в действии на матку и применении препаратов гормонов задней доли гипофиза и препаратов простагландинов. Побочные эффекты.

Средства, повышающие в основном тонус миометрия.

Классификация, применение.

Средства, снижающие тонус шейки матки. Применение.

Средства, снижающие тонус и сократительную активность миометрия.

Механизмы действия, применение.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Атропин	Дротаверин (но-шпа)
Гексопреналин (гинипрал)	Котарнин
Демокситоцин	Окситоцин
Динопрост	Эргометрин
Динопростон	Фенотерол (партусистен)

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию средств, влияющих на миометрий, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, повышающие сократительную активность и тонус миометрия.
Препараты гормонов задней доли гипофиза:

а) _____;

б) _____.

Препараты простагландинов:

а) _____;

б) _____.

Средства, снижающие сократительную активность и тонус миометрия
(токолитические средства).

Средства, стимулирующие β_2 -адренорецепторы:

а) _____;

Средства, повышающие преимущественно тонус миометрия.

Препараты алкалоидов спорыньи:

_____.

Синтетические средства:

_____.

Средства, снижающие тонус шейки матки.

Спазмолитики миотропного действия:

_____.

M-холиноблокаторы:

_____.

Задание 2. Дайте сравнительную фармакологическую характеристику препаратов окситоцина и простагландина F2a (табл. 10.1).

Таблица 10.1. Сравнительная характеристика окситоцина и динопроста

Параметры сравнения	Окситоцин	Динопрост
Эффективен в течение всей беременности и в родах		
Эффективен перед родами и в родах		
Снижает тонус шейки матки		
Применяют для стимуляции родов, ускорения инволюции матки и остановки кровотечений в последовом периоде		
Применяют для прерывания беременности		

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

NB! Поскольку препараты окситоцина не расширяют шейку матки, для стимуляции родов их применяют либо при полном раскрытии цервикального канала, либо в комбинации со средствами, снижающими тонус шейки матки.

Задание 3. Выберите из списка и впишите показания к применению следующих препаратов.

А. Препараты окситоцина:

Б. Препараты простагландинов E₂ и F_{2α}:

В. β₂-Адреномиметики:

Г. Эргометрин, котарнин:

Показания:

для предупреждения преждевременных родов;

для стимуляции родовой деятельности;

для прерывания беременности;

для остановки маточных кровотечений, связанных с гинекологическими заболеваниями;

для ослабления чрезмерно сильной родовой деятельности;

для ускорения инволюции матки в послеродовом периоде и остановки последовых кровотечений; для предупреждения выкидышей.

NB! Менструации могут сопровождаться болью (альгодисменорея). Болевой синдром связан с усилением сократительной активности миометрия, вызванным простагландином F_{2α}. Для снижения боли при альгодисменорее применяют препараты, уменьшающие тонические сокращения миометрия (дротаверин), а также нестероидные противовоспалительные средства (ибупрофен и др.).

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Совместите.

Определите лекарственные препараты.

1. Увеличивает тонус и ритмические сокращения миометрия. Действует только на беременную матку. Максимально эффективен в период родов. Применяется для стимуляции родов только при полном открытии цервикального канала либо в комбинации с препаратами, снижающими тонус шейки матки. Может применяться для ускорения инволюции матки после родов, остановки кровотечений послеродового периода, а также для усиления лактации.

1. Котарнин. 2. Окситоцин. 3. Эргометрин. 4. Динопростон. 5. Фенотерол.

2. Увеличивает тонус и ритмические сокращения миометрия. Действует как на беременную, так и на небеременную матку. Уменьшает тонус шейки матки. Применяется при производстве медицинских абортов. Может применяться для стимуляции родов вне зависимости от степени раскрытия цервикального канала.

1. Котарнин. 2. Окситоцин. 3. Эргометрин. 4. Динопростон. 5. Фенотерол.

3. Обладает токолитическими и бронхолитическими свойствами. В качестве токолитика применяется внутрь. Назначается для сохранения беременности при угрожающем выкидыше, при преждевременных родах и чрезмерно бурной родовой деятельности.

1. Котарнин. 2. Окситоцин. 3. Эргометрин. 4. Динопростон. 5. Фенотерол.

4. Алкалоид спорыньи с маловыраженным α -адреноблокирующим действием. Увеличивает только тонус миометрия. Эффективен при приеме внутрь. Применяется для остановки маточных кровотечений.

1. Котарнин. 2. Окситоцин. 3. Эргометрин. 4. Динопростон. 5. Фенотерол.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Препарат для стимуляции родов.

Б. Средство при угрожающем выкидыше.

В. Синтетическое средство при маточных кровотечениях.

Ответы на тестовые задания

1-Б. 2-А. 3-А. 4-В. 5-Б. 6-2. 7-4. 8-5. 9-3.

NB! Средства, влияющие на систему крови, представлены следующими группами:

- средства, влияющие на кроветворение (гемопоз);
- средства, влияющие на тромбообразование.

Тема 11.1. Средства, влияющие на кроветворение

NB! Средства, влияющие на кроветворение (гемопоз), представлены следующими группами:

- средства, влияющие на эритропоз;
- средства, влияющие на лейкопоз.

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация средств, влияющих на эритропоз.

NB! Недостаточный гемопоз проявляется анемиями. Выделяют гипохромные и гиперхромные анемии.

Гипохромные анемии связаны, как правило, с железодефицитными состояниями.

Гиперхромные анемии подразделяются на злокачественную (пернициозную, мегалобластную) и макроцитарную (фолиеводефицитную).

Кроме того, в ряде случаев анемии могут возникать в связи с недостаточной продукцией почками эритропоэтина (например, при хронической почечной недостаточности, СПИДе, злокачественных новообразованиях и др.).

Избыточный гемопоз наблюдается при полицитемии (эритремии, болезни Вакеза).

Препараты железа. Классификация. Показания к применению. Побочные эффекты и пути их коррекции.

NB! Выделяют препараты железа для энтерального и парентерального применения. Для приема внутрь используют соединения двухвалентного железа.

Для парентерального введения используют неионизированные органические комплексы с трехвалентным железом. Их применяют при нарушении всасывания железа из пищеварительного тракта.

Механизм фармакотерапевтического действия цианокобаламина и кислоты фолиевой при гиперхромных анемиях. Различия в показаниях к применению.

NB! При гиперхромных анемиях наблюдаются морфологические изменения в эритроцитах.

При дефиците цианокобаламина эритропоэз протекает по мегалобластическому типу: эритробласт → гиперхромный мегалобласт → мегалоцит.

При дефиците фолиевой кислоты эритропоэз протекает по макроцитарному типу: эритробласт - гиперхромный макронормобласт - макроцит.

Морфологически измененные эритроциты (мегалобласты, мегалоциты и макроциты) содержат большое количество гемоглобина, однако не в состоянии обеспечивать адекватную транспортировку кислорода к тканям.

Препараты эритропоэтина. Показания к применению.

Средства, угнетающие эритропоэз.

NB! С целью угнетения эритропоэза при полицитемии применяют раствор натрия фосфата, меченного радиоактивным изотопом фосфора (³²P). При его применении снижается содержание эритроцитов и тромбоцитов. Ввиду радиоактивных свойств препарат используют только в специализированных стационарах.

Средства, стимулирующие лейкопоэз. Показания к применению. Препараты колониестимулирующих факторов.

Средства, угнетающие лейкопоэз.

NB! С целью угнетения лейкопоэза при лейкозах и лимфогрануломатозе применяют цитостатические средства.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Препараты, стимулирующие эритропоэз.

Б. Препараты, стимулирующие лейкопоэз.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дайте фармакологическую характеристику средств, применяемых при анемиях (табл. 11.1).

Таблица 11.1. Сравнительная характеристика некоторых препаратов, применяемых при анемиях

Препарат	Применяется при анемии	Путь введения	Побочные эффекты
	железодефицитной пернициозной макроцитарной		
Ферроградумет			
Ферроплекс			

Феррум лек			

Фолиевая
кислота

Цианокобаламин

Б. Укажите рациональный способ применения препаратов железа для приема внутрь (с учетом времени приема пищи и других лекарственных средств).

Задание 2. Дайте фармакологическую характеристику препаратов колониестимулирующих факторов и эритропоэтина (табл. 11.2).

Таблица 11.2. Сравнительная характеристика некоторых факторов роста, регулирующих кроветворение

	Международное	Торговое	Увеличивает в	
Фактор роста	название	название	крови	Показания
	препарата		количество:	
Эритропоэтин				
			1.	
Гранулоцитарномакрофагальный колониестимулирующий фактор (GM-CSF)			2.	
			3.	
			4.	
Гранулоцитарный колониестимулирующий фактор (G-CSF)				

Примечание. При заполнении четвертого столбца выберите наименование форменных элементов из предложенного списка: эритроциты, нейтрофилы, моноциты, эозинофилы.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. При железодефицитных анемиях применяют:

1) фолиевую кислоту; 2) ферроплекс; 3) цианокобаламин; 4) феррум лек.

2. При макроцитарной анемии применяют:

1) ферроградумет; 2) фолиевую кислоту; 3) ферроплекс.

3. При пернициозной анемии применяют:

1) ферроплекс; 2) цианокобаламин; 3) ферроградумет.

Определите лекарственные препараты

4. Назначается внутрь при железодефицитных анемиях. Обеспечивает постепенное всасывание железа и имеет продолжительное действие. В качестве побочных эффектов вызывает прокрашивание кариозных зубов и констипацию.

1. Эпоэтин альфа. 2. Ферроградумет. 3. Филграстим. 4. Феррум лек. 5. Молграмостим.

5. Гликопротеин. Стимулирует пролиферацию и дифференцировку эритроцитов. Эффект развивается через 1-2 нед. Нормализация картины крови наступает через 2-3 мес. Назначается при анемиях, обусловленных хронической почечной недостаточностью, ревматоидным артритом, синдромом приобретенного иммунодефицита.

1. Эпоэтин альфа. 2. Цианокобаламин. 3. Филграстим. 4. Феррум лек. 5. Молграмостим.

6. Гликопротеин. Препарат рекомбинантного человеческого гранулоцитарного колониестимулирующего фактора. Стимулирует пролиферацию и дифференцировку предшественников гранулоцитов. Повышает в периферической крови количество нейтрофилов. Назначают при агранулоцитозе, обусловленном химиотерапией, миелодиспластическим синдромом, синдромом приобретенного иммунодефицита.

1. Эпоэтин альфа. 2. Цианокобаламин. 3. Филграстим. 4. Феррум лек. 5. Молграмостим.

7. Гликопротеин. Препарат рекомбинантного человеческого гранулоцитарно-макрофагального колониестимулирующего фактора. Повышает в периферической крови количество нейтрофилов, эозинофилов, базофилов, макрофагов, эритроцитов. Назначается при агранулоцитозе, обусловленном химиотерапией злокачественных опухолей, миелодиспластическом синдроме, а также при апластической анемии.

1. Эпоэтин альфа. 2. Цианокобаламин. 3. Филграстим. 4. Феррум лек. 5. Молграмостим.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство при злокачественной анемии.

Б. Препарат железа для приема внутрь.

Ответы на тестовые задания

1-2,4. 2-2. 3-2. 4-2. 5-1. 6-3. 7-5.

Тема 11.2. Средства, влияющие на тромбообразование

NB! Тромбообразование - защитная реакция системы крови, препятствующая кровопотере. Тромбообразование включает:

агрегацию тромбоцитов;

коагуляцию (свертывание крови).

Тромбообразованию препятствует фибринолиз.

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Антиагреганты. Классификация. Механизмы действия. Показания к применению.

NB! Процесс агрегации тромбоцитов осуществляется в три этапа: 1) адгезия;

активация; 3) собственно агрегация.

ходе адгезии тромбоциты «приклеиваются» к стенке сосуда в местах поврежденного эндотелия. При этом с коллагеновыми волокнами сосудистой стенки тромбоциты связываются с помощью гликопротеиновых рецепторов Ia, а с фактором фон Виллебранда - посредством гликопротеиновых рецепторов Ib.

ходе «активации» в тромбоцитах образуются и выделяются биологически активные вещества (АДФ, тромбоксан A₂ и др.), способствующие агрегации. Эти вещества стимулируют соответствующие рецепторы, что приводит к изменению конформации на поверхности тромбоцитов гликопротеинов IIb/IIIa.

ходе агрегации гликопротеиновые рецепторы IIb/IIIa взаимодействуют с фибриногеном, в результате чего тромбоциты оказываются связанными друг с другом фибриногеновыми мостиками. Это приводит к образованию тромбоцитарных агрегатов. Таким образом возникает тромбоцитарный тромб.

Антикоагулянты. Классификация. Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! В процессе свертывания крови происходит «укрепление» тромбоцитарного тромба нитями фибрина.

Свертывание происходит при участии факторов, образующихся в печени и активирующихся в плазме крови.

Синтез факторов свертывания происходит в печени при участии витамина К.

Активация факторов свертывания в плазме крови носит каскадный характер.

Это способствует чрезвычайно быстрому протеканию процесса свертывания.

Сравнительная характеристика антикоагулянтов прямого и непрямого действия (скорость развития и продолжительность эффекта, пути введения, механизмы действия, специфические антагонисты).

Сравнительная характеристика антикоагулянтов прямого действия: гепарин, препараты низкомолекулярных (фракционированных) гепаринов, гепариноиды, препараты гирудина (взаимодействие с антитромбином III, пути введения, продолжительность действия, риск кровотечений, способность вызывать тромбоцитопению).

Средства, способствующие свертыванию крови (гемостатики). Классификация. Применение.

Фибринолитические (тромболитические) средства. Механизм действия. Применение. Побочные эффекты. Преимущества препаратов тканевого активатора плазминогена.

Антифибринолитические средства. Механизм действия. Применение.

NB! Процесс фибринолиза приводит к растворению тромбов. Это способствует восстановлению нормального кровотока.

Однако при ряде патологических процессов возможна чрезмерная активация процессов фибринолиза, что может стать причиной кровотечений.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ По ТЕМЕ

А. Антиагреганты.

Б. Антикоагулянты.

В. Гемостатики и антагонисты антикоагулянтов.

Г. Фибринолитические и антифибринолитические средства.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Определите группы средств, влияющих на тромбообразование (антикоагулянты, гемостатики, антиагреганты, фибринолитические и антифибринолитические средства), по их фармакологическим свойствам (схема 11.1).

Схема 11.1. Общая фармакологическая характеристика средств, влияющих на тромбообразование

Задание 2

А. На схеме 11.2 отметьте действие: ацетилсалициловой кислоты, клопидогрела, дипиридамола, индобуфена, абциксимаба.

Схема 11.2. Механизмы действия антиагрегантов

Б. Дайте сравнительную фармакологическую характеристику антиагрегантов (табл. 11.3).

Таблица 11.3. Сравнительная характеристика антиагрегантов

Препарат	Пути	Кратность приема в сутки	Побочные эффекты (кроме кровоточивости)
	введения		

Ацетилсалициловая
кислота

Индобуфен

Тиклопидин

Клопидогрел

Абциксимаб

Примечание. При заполнении рубрики «Побочные эффекты» используйте нижеприведенный список побочных эффектов:

анафилактическая реакция;
нейтропения (часто);
нейтропения (редко);
язвенно-эрозивное действие, бронхоспазм.

В. Укажите особенности применения ацетилсалициловой кислоты в качестве антиагреганта. Объясните, почему при увеличении дозы ацетилсалициловой кислоты снижается ее антиагрегантное действие.

Задание 3. Дополните классификацию антикоагулянтов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Антикоагулянты прямого действия
Зависимые от антитромбина III ингибиторы тромбина.
Препараты среднемoleкулярного гепарина:
Препараты низкомолекулярных (фракционированных) гепаринов:
Гепариноиды:
Независимые от антитромбина III ингибиторы тромбина. Препараты
гирудина:
Олигопептиды:
Антикоагулянты непрямого действия:

Задание 4. На схеме 11.3 отметьте действие антикоагулянтов: гепарина, надропарина, аценокумарола.

Схема 11.3. Механизмы действия антикоагулянтов

Задание 5

А. Дайте сравнительную фармакологическую характеристику антикоагулянтов (табл. 11.4).

Таблица 11.4. Сравнительная характеристика антикоагулянтов

		Препараты
Параметры сравнения		гепариннадропаринлепирудиндабигатранварфарин
Активность in vitro		
Активность in vivo		
Механизм действия		Угнетает факторы свертывания в плазме (в комплексе с антитромбином
		III)
		Угнетает факторы свертывания в плазме (независимо от антитромбина)
		Угнетает синтез факторов свертывания в печени
		Парентерально (в/м, п/к)
	Пути введения	Внутрь

Скорость развития эффекта (минуты, часы, дни)

Антагонист при передозировке

Б. Решите ситуационную задачу.

Задание 6. Дайте сравнительную фармакологическую характеристику фибринолитических средств (табл. 11.5).

Таблица 11.5. Сравнительная характеристика фибринолитических средств

Параметры сравнения	Стрептокиназа	Урокиназа	Алтеплаза
В тромбе и в плазме крови			
Локализация действия			
Преимущественно в тромбе			
Пирогенные и аллергические реакции			

Задание 7. Укажите показания к применению гемостатических и антифибринолитических средств (табл. 11.6).

Таблица 11.6. Показания к применению гемостатических и антифибринолитических средств

Показания к применению	Гемостатическая губка	Фитоменадиол	Протамина сульфат	Транексамовая кислота

Местно при капиллярных кровотечениях

Кровотечения, связанные с повышенным фибринолизом

Кровотечения, связанные с гипопротромбинемией
Передозировка антикоагулянтов непрямого действия
Передозировка антикоагулянтов прямого действия
Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Уменьшают агрегацию тромбоцитов:
1) абциксимаб; 2) алтеплаза; 3) аценокумарол; 4) клопидогрел; 5) этамзилат.

2. Уменьшают свертывание крови:

1) этамзилат; 2) эноксапарин; 3) абциксимаб; 4) аценокумарол; 5) гепарин.

3. Увеличивают свертывание крови и применяются при кровотечениях:

1) надропарин; 2) этамзилат; 3) абциксимаб; 4) гемостатическая губка.

4. Способствуют фибринолизу и применяются для растворения свежих тромбов:

1) стрептокиназа; 2) транексамовая кислота; 3) урокиназа; 4) гепарин; 5) фитоменадион.

5. Способствует фибринолизу и действует только в тромбе:

1) стрептокиназа; 2) транексамовая кислота; 3) алтеплаза; 4) урокиназа; 5) гепарин.

6. Препятствуют фибринолизу и применяются для остановки кровотечений:

1) стрептокиназа; 2) транексамовая кислота; 3) аминокaproновая кислота; 4) алтеплаза.

Совместите.

Определите лекарственные препараты.

Снижает агрегацию тромбоцитов за счет угнетения биосинтеза тромбоксана. В качестве антиагреганта назначается 1 раз в сутки. При увеличении дозы или частоты приема антиагрегантное действие уменьшается. Обладает анальгетическим, противовоспалительным и жаропонижающим эффектом. В качестве побочных эффектов может вызывать изъязвление слизистой оболочки желудка и бронхоспазм.

1. Абциксимаб. 2. Клопидогрел. 3. Дипиридамол. 4. Ацетилсалициловая кислота.

Снижает свертывание крови. Вводится под кожу и внутривенно. При внутривенном введении действие развивается сразу и продолжается 4-6 ч. При длительном применении может вызвать кровотечение и тромбоцитопению. В качестве антагониста используют протамина сульфат.

1. Надропарин. 2. Аценокумарол. 3. Гепарин. 4. Эноксапарин.

Снижает свертывание крови. Отличается медленным развитием эффекта. Применяется внутрь. Эффект достигает максимума через 24-48 ч. При передозировке применяют фитоменадион.

1. Надропарин. 2. Аценокумарол. 3. Гепарин. 4. Эноксапарин.

Фибринолитическое средство. Вводится внутривенно капельно. Действует как в тромбе, так и в плазме крови. Фибринолитическое действие оказывает только в комплексе с плазминогеном. Применяется как для профилактики тромбоэмболических осложнений, так и для растворения свежих тромбов. В качестве побочных эффектов вызывает кровотечения, может вызвать анафилактический шок.

1. Транексамовая кислота. 2. Алтеплаза. 3. Стрептокиназа. 4. Урокиназа.

Фибринолитическое средство. Действует главным образом на плазминоген, связанный с фибрином тромба. Относительно мало действует в плазме крови. Вводится внутривенно, способствует реканализации тромбов. Практически не обладает антигенными свойствами.

1. Транексамовая кислота. 2. Алтеплаза. 3. Стрептокиназа. 4. Урокиназа.

Антифибринолитическое средство. Ингибирует активацию плазминогена. Применяется внутривенно и внутрь. Назначается для остановки кровотечений, связанных с фибринолизом.

1. Аprotинин. 2. Алтеплаза. 3. Транексамовая кислота. 4. Урокиназа.

Проведите анализ врачебных рецептов

А. Антиагрегантное средство.

Б. Антикоагулянт прямого действия.

В. Антикоагулянт непрямого действия.

Ответы на тестовые задания

1-1,4. 2-2,4,5. 3-2,4. 4-1,3. 5-3. 6-2,3. 7-Г. 8-В. 9-Б. 10-А. 11-Д.
12-В. 13-Б. 14-А. 15-В. 16-Г. 17-4. 18-3. 19-2. 20-3. 21-2.
22-3.

Раздел 12. Средства, регулирующие процессы обмена веществ

NB! Средства, регулирующие процессы обмена веществ, представлены следующими группами препаратов.

Препараты гормонов.

Препараты витаминов.

Средства, применяемые при ожирении.
Средства, применяемые при остеопорозе.
Средства, применяемые при подагре.

Тема 12.1. Препараты гормонов пептидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов

NB! Гормоны выделяются эндокринными железами непосредственно в системный кровоток. Достигая с током крови тканей-мишеней, они стимулируют специфические рецепторы, что приводит к соответствующим метаболическим изменениям в тканях-мишенях. Система эндокринных желез представлена гипоталамусом, гипофизом и периферическими железами (щитовидная, паращитовидные, половые, кора надпочечников, островки поджелудочной железы).

Гипоталамус и передняя доля гипофиза (так называемая гипоталамо-гипофизарная система) регулируют выделение гормонов периферическими железами, а также пролиферацию в них секретирующих элементов. При увеличении в системном кровотоке концентрации гормонов периферических желез подавляется выделение рилизинг-гормонов гипоталамуса и тропных гормонов передней доли гипофиза (обратная отрицательная связь). Задняя доля гипофиза выделяет окситоцин и вазопрессин (антидиуретический гормон). Нарушения функции периферических эндокринных желез могут проявляться либо снижением (гипофункция), либо повышением (гиперфункция) их инкреторной активности. Для коррекции эндокринных расстройств могут быть использованы следующие принципы медикаментозного воздействия:

- заместительная терапия;
- стимулирующая (активирующая) терапия;
- подавляющая (супрессивная) терапия.

NB! Средства, регулирующие процессы обмена веществ, представлены следующими группами препаратов.

Препараты гормонов.
Препараты витаминов.
Средства, применяемые при ожирении.
Средства, применяемые при остеопорозе.
Средства, применяемые при подагре.

Тема 12.1. Препараты гормонов пептидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов

NB! Гормоны выделяются эндокринными железами непосредственно в системный кровоток. Достигая с током крови тканей-мишеней, они стимулируют специфические рецепторы, что приводит к соответствующим метаболическим изменениям в тканях-мишенях. Система эндокринных желез представлена гипоталамусом, гипофизом и периферическими железами (щитовидная, паращитовидные, половые, кора надпочечников, островки поджелудочной железы).

Гипоталамус и передняя доля гипофиза (так называемая гипоталамо-гипофизарная система) регулируют выделение гормонов периферическими железами, а также пролиферацию в них секретирующих элементов. При увеличении в системном кровотоке концентрации гормонов периферических желез подавляется выделение рилизинг-гормонов гипоталамуса и тропных гормонов передней доли гипофиза (обратная отрицательная связь). Задняя доля гипофиза выделяет окситоцин и вазопрессин (антидиуретический гормон). Нарушения функции периферических эндокринных желез могут проявляться либо снижением (гипофункция), либо повышением (гиперфункция) их инкреторной активности. Для коррекции эндокринных расстройств могут быть использованы следующие принципы медикаментозного воздействия:

- заместительная терапия;
- стимулирующая (активирующая) терапия;
- подавляющая (супрессивная) терапия.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза. Средства, подавляющие продукцию гормонов гипоталамуса и гипофиза.

Б. Препараты гормонов щитовидной железы. Антитиреоидные средства.

В. Препараты, содержащие гормон паращитовидных желез. Препараты С-клеток щитовидной железы.

Г. Средства, применяемые при сахарном диабете.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1

А. Укажите препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза и основные показания к их применению (табл. 12.1).

Гормоны

Препараты Показания

Таблица 12.1. Препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза	Тиротропин-рилизинггормон	
	Гонадотропин-рилизинггормон	1. (при «пульсирующем» введении).
	Фолликулостимулирующий гормон	2. (при непрерывном введении)
	Лютеинизирующий гормон	
	АКТГ	
	Соматостатин	1. 2.
	Соматотропный гормон (гормон роста)	

Примечания. 1. При заполнении рубрики «Препараты» используйте препараты из списка лекарственных препаратов по теме. 2. При заполнении рубрики «Показания» используйте приведенный ниже перечень показаний:

при акромегалии;
для остановки кровотечений из варикозно расширенных вен пищевода;
при карликовом росте;
для диагностики и лечения гипотиреоза;
при ановуляторном бесплодии и гипогонадизме;
при злокачественных новообразованиях яичников и предстательной железы;
при атрофии коры надпочечников, вызванной длительным применением глюкокортикоидов.

NB! Инкрецию гормона роста и пролактина тормозит дофамин.

Блокада эстрогеновых рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы кломифеном приводит к повышению инкреции гонадотропных гормонов (ФСГ и ЛГ).

Стимуляция гестагеновых рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы даназолом приводит к снижению инкреции гонадотропина и гонадотропных гормонов.

Б. Выберите из приведенного ниже списка основные показания к применению:

бромокриптин:

кломифена:

даназола:

Гипогонадизм гипоталамо-гипофизарного генеза.

Эндометриоз.

Паркинсонизм.

Гиперпролактинемия и галакторея.

Акромегалия.

Задание 2. Дайте фармакологическую характеристику препаратов гормонов задней доли гипофиза (табл. 12.2). Таблица 12.2. Препараты гормонов задней доли гипофиза

Гормоны	Препараты	Органы-мишени	Эффекты	Показан	Пути введения
Вазопресси				1. 2.	1. 2.
н					

Окситоцин

Примечание. При заполнении рубрики «Эффекты» пользуйтесь следующим списком.

Увеличение сократительной активности и тонуса миометрия.

Увеличение реабсорбции воды и снижение диуреза.

Увеличение тонуса кровеносных сосудов и повышение АД.

NB! Окситоцин действует только на беременную матку и тем сильнее, чем больше срок беременности. Это связано с увеличением плотности специфических рецепторов. Максимальная чувствительность миометрия к окситоцину проявляется непосредственно перед родами, в родах и сразу после них.

Окситоцин не влияет на тонус шейки матки, поэтому для стимуляции родов его следует применять либо при полном раскрытии цервикального канала, либо в комбинации с препаратами, снижающими тонус шейки матки.

Задание 3

А. Дополните классификацию препаратов, применяемых при нарушениях функции щитовидной железы, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, применяемые при гипотиреозе:

Средства, применяемые при гипертиреозе (анти тиреоидные средства):

NB! Препараты нерадиоактивного йода (калия йодид и натрия йодид) эффективны как при гипотиреозе, так и при гипертиреозе. При гипотиреозе препараты йода применяют в качестве средств заместительной терапии в невысоких дозах (40 мг 1 раз в неделю), при этом наблюдается увеличение синтеза тиреоидных гормонов. При гипертиреозе препараты йода применяют в высоких дозах (160-180 мг) с целью подавления секреции тиролиберина и тиреотропного гормона по принципу обратной отрицательной связи.

При гипотиреозе широко используются комбинированные препараты, содержащие препарат гормона щитовидной железы и препарат йода (тиреокомб, йодтирокс).

Наиболее типичным побочным эффектом йодсодержащих препаратов является их способность вызывать признаки йодизма.

Б. Объясните механизм антитиреоидного действия тиамазола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Угнетение пероксидазы фолликулов щитовидной железы.

Снижение синтеза Т3 и Т4.

Снижение йодирования предшественников тиреоидных гормонов.

В. Укажите механизм зобогенного действия тиамазола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности, и укажите возможный путь коррекции этого побочного эффекта.

Снижение синтеза тиреоидных гормонов и их содержания в крови.

Увеличение объема щитовидной железы (нетоксический зоб).

Уменьшение стимуляции специфических рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы.

Увеличение выделения тиролиберина и тиреотропного гормона.

NB! Лечение гипертиреоза осуществляется хирургическими, фармакотерапевтическими методами и их комбинацией. Наиболее эффективными антитиреоидными средствами являются препараты радиоактивного йода (^{131}I). Эти препараты разрушают фолликулы, т.е. вызывают медикаментозную деструкцию щитовидной железы. Ввиду радиоактивных свойств эти препараты применяются только в специализированных стационарах.

Г. Укажите характерные побочные эффекты препаратов, применяемых при нарушениях функции щитовидной железы (табл. 12.3).

Таблица 12.3. Побочные эффекты тиреоидных и антитиреоидных средств

Побочные эффекты	Левотироксин	Тиамазо
	л	л
		Пути коррекции (группа препаратов)

Токсическое действие на сердце
(тахикардия,
аритмия, приступы стенокардии)

Беспокойство, бессонница

Зобогенное действие

Угнетение кроветворения

Задание 4. Дайте фармакологическую характеристику препаратов, регулирующих обмен кальция (табл. 12.4).

Таблица 12.4. Препараты кальцитонина и паратгормона

Гормоны	Препараты	Эффекты			Уровень кальция в крови	Показания к применению	Путь введения
		Всасывание Ca ²⁺ в кишечнике	Реабсорбция Ca ²⁺ в почках	Содержание Ca ²⁺ в костях			
Паратгормон							
Кальцитонин							

Примечание. При заполнении таблицы пользуйтесь следующими обозначениями: «↑» - повышение; «↓» - понижение.

Задание 5

А. Дополните классификацию средств, применяемых при сахарном диабете, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства заместительной терапии:

Гипогликемические средства, применяемые преимущественно при сахарном диабете 2-го типа.

Средства, стимулирующие выделение эндогенного инсулина:

Производные сульфонилмочевины:

Прандиальные регуляторы гликемии (меглитиниды):

Инкретиномиметики:

Ингибиторы ДПП-4 (дипептидилпептидазы 4-го типа):

Средства, применяемые при инсулинорезистентности тканей.

Средства, способствующие утилизации глюкозы тканями и угнетающие глюконеогенез (бигуаниды):

Средства, повышающие чувствительность тканей к инсулину (лиганды PPAR- γ), (тиазолидиндионы):

Средства, препятствующие всасыванию глюкозы в кишечнике (ингибиторы α -глюкозидазы):

Б. Объясните механизм гипогликемического действия инсулина, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Стимуляция инсулиновых рецепторов.

Активация ферментов углеводного обмена.

Эндоцитоз димера инсулин + рецептор клетками инсулинзависимых тканей.

Усиление захвата и утилизации глюкозы тканями, активация синтеза гликогена.

NB! Препараты инсулина классифицируют:

– по источникам и способам получения (свиные, рекомбинантные человеческие);

– по степени очистки (монокомпонентные, монопиковые);

– по продолжительности действия и времени наступления эффекта (коротко-и быстродействующие, пролонгированного действия).

В. Укажите фармакологические свойства и показания к применению препаратов инсулина разных групп (табл. 12.5).

Таблица 12.5. Сравнительная характеристика препаратов инсулина

Группа	Скорость наступления эффекта (минуты, часы)	Продолжительность действия, ч	Лекарственная форма		Путь введения	Показания к применению
			(раствор	или суспензия)		
Быстрои короткодействующие						
Средней продолжительности действия						
Длительного действия						

Примечание. При заполнении рубрики «Показания к применению» используйте следующие показания: 1) купирование гипергликемической комы; 2) систематическое лечение.

NB! Инсулинотерапия должна имитировать процесс выделения эндогенного инсулина. С этой целью подбираются индивидуальный режим дозирования и частота введения препаратов инсулина различной продолжительности действия.

Фармацевтической промышленностью производятся комбинированные препараты, содержащие короткодействующий инсулин и инсулин средней продолжительности действия. Короткодействующий компонент обеспечивает быстрое наступление гипогликемического эффекта, а пролонгированный обеспечивает достаточную продолжительность эффекта.

Г. Укажите основные симптомы гипогликемической комы и способы коррекции передозировки инсулина.

NB! Главным недостатком препаратов инсулина является невозможность их энтерального применения.

Д. Укажите механизмы действия гипогликемических средств для приема внутрь (табл. 12.6).

Таблица 12.6. Механизмы действия гипогликемических средств для приема внутрь

Механизм действия	Глибенкламид ин	Натеглинид	Пиоглитазон	Метформин	Акарбоза
Усиление инкреции эндогенного инсулина					
Увеличение количества и чувствительности инсулиновых рецепторов					
Уменьшение глюконеогенеза					
Увеличение утилизации глюкозы					

тканями

Уменьшение всасывания
глюкозы в кишечнике

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Е. Объясните механизм увеличения инкреции инсулина под действием производных сульфонилмочевины, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Блокада АТФ-зависимых калиевых каналов β -клеток островков поджелудочной железы.

Деполаризация мембран β -клеток.

Открытие потенциалзависимых кальциевых каналов.

Увеличение входа ионов кальция.

Уменьшение выхода ионов калия.

Усиление экзоцитоза эндогенного инсулина.

Ж. Объясните механизм гипогликемического действия акарбозы, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Снижение всасывания моносахаридов в тонком отделе кишечника.

Уменьшение превращения дисахаридов в моносахариды.

Ингибирование кишечной α -глюкозидазы.

Снижение уровня глюкозы в плазме крови.

З. Укажите побочные эффекты некоторых гипогликемических средств для приема внутрь (табл. 12.7).

Таблица 12.7. Побочные эффекты гипогликемических средств для приема внутрь

Побочные эффекты	Производные сульфонилмочевины	Бигуаниды	Акарбоза
Гипогликемия			
Повышение аппетита			
Снижение аппетита и массы тела			
Лактацидоз			
Метеоризм			

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

NB! Повышение аппетита расценивается как серьезный недостаток противодиабетических средств, поскольку фармакотерапия сахарного диабета проводится на фоне диетотерапии. Снижение аппетита и массы тела можно расценить как положительные качества, поскольку они позволяют применять соответствующие препараты при «диабете тучных». Метеоризм выражен тем сильнее, чем больше углеводов поступает в кишечник потребляемой пищей. Таким образом, этот побочный эффект принуждает больных строго соблюдать бедную углеводами диету.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. При ановуляторном бесплодии применяют:

1) даназол; 2) фоллитропин бета; 3) гозерелин; 4) октреотид; 5) кломифен.

2. При эндометриозе применяют:

1) гонадотропин хорионический; 2) даназол; 3) окситоцин; 4) тетракозактид.

3. При атрофии коры надпочечников применяют:

1) октреотид; 2) бромокриптин; 3) тетракозактид; 4) окситоцин.

4. При акромегалии применяют:

1) протирелин; 2) окситоцин; 3) бромокриптин; 4) десмопрессин; 5) октреотид.

5. При галакторее применяют:

1) соматропин; 2) октреотид; 3) бромокриптин; 4) окситоцин; 5) десмопрессин.

6. При карликовом росте применяют:

1) тетракозактид; 2) октреотид; 3) соматропин; 4) фоллитропин бета.

7. Для стимуляции родов применяют:

1) октреотид; 2) окситоцин; 3) миакальцик; 4) десмопрессин.

8. При несахарном мочеизнурении применяют:

1) кальцитрин; 2) десмопрессин; 3) инсулин; 4) паратиреоидин.

9. При остеопорозе применяют:

1) кальцитрин; 2) тиамазол; 3) паратиреоидин; 4) миакальцик.

10. При тетании применяют:

1) кальцитрин; 2) тиамазол; 3) паратиреоидин; 4) миакальцик.

11. При гипотиреозе применяют:

1) тиамазол; 2) калия йодид; 3) кальцитрин; 4) левотироксин; 5) лиотиронин.

12. При гипертиреозе применяют:

1) тиамазол; 2) калия йодид; 3) протирелин; 4) левотироксин; 5) лиотиронин.

13. При сахарном диабете 1-го типа применяют:

1) инсулин; 2) глимепирид; 3) десмопрессин; 4) метформин; 5) акарбозу.

14. При сахарном диабете 2-го типа применяют:

1) инсулин; 2) глимепирид; 3) десмопрессин; 4) метформин; 5) акарбозу.

15. При сахарном диабете 2-го типа применяют внутрь:

1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбозу.

16. Инкрецию эндогенного инсулина повышают:

1) акарбоза; 2) глибенкламид; 3) эксенатид; 4) ситаглиптин.

17. Уменьшает глюконеогенез и увеличивает захват глюкозы мышечной тканью:

1) натеглинид; 2) ситаглиптин; 3) пиоглитазон; 4) метформин; 5) глимепирид.

18. Препятствует всасыванию углеводов в кишечнике:

1) натеглинид; 2) акарбоза; 3) пиоглитазон; 4) эксенатид; 5) глимепирид.

19. Снижает инсулинорезистентность тканей за счет взаимодействия с гамма-рецепторами, активируемыми пролифератором пероксисом (PPAR- γ):
1) натеглинид; 2) акарбоза; 3) пиоглитазон; 4) инсулин.

20. Повышает аппетит:
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) глибенкламид; 4) метформин; 5) акарбоза.

21. Понижает аппетит, а также вызывает снижение массы тела; может вызвать тошноту, рвоту и лактацидоз:
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбоза.

22. Метеоризм и диарею вызывает:
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбоза.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство при гипотиреозе.

Б. Препарат для остановки кровотечений из варикозно расширенных вен пищевода.

В. Противодиабетическое средство, не повышающее аппетит.

Ответы на тестовые задания

1-2,3,5. 2-2. 3-3. 4-3,5. 5-3. 6-3. 7-2. 8-2. 9-1,4. 10-3.
11-2,4,5. 12-1,2. 13-1. 14-1,2,4,5. 15-2,3,4,5. 16-2,3,4. 17-4. 18-2.
19-1,3. 20-1,2,3. 21-4. 22-5.

Тема 12.2. Препараты гормонов стероидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов. Гормональные контрацептивные средства. Анаболические стероиды

NB! В основе химического строения стероидных гормонов лежит структура циклопентанопергидрофенантрена. Предшественником всех стероидных гормонов является прегненолон, синтезируемый из холестерина. Основные железы, синтезирующие и инкретирующие стероидные гормоны, - кора надпочечников и половые железы (яичники у женщин и яички у мужчин).

Синтез стероидных гормонов происходит по типу последовательного превращения предшественников. При этом в системный кровоток выделяется тот гормон, на котором остановился биосинтез. Так, кора надпочечников может инкретировать глюкокортикостероиды (пучковая

зона), минералокортикостероиды (клубочковая зона) и половые гормоны (сетчатая зона). Яичники могут инкретировать эстрогены (toesa interna фолликулов) и гестагены (желтое тело). Яички инкретируют преимущественно андрогены.

Инкреция глюкокортикоидов и половых гормонов регулируется гипоталамо-гипофизарной системой. Инкреция же минералокортикоидов регулируется главным образом состоянием ренин-ангиотензиновой системы.

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация препаратов глюкокортикоидов.

Свойства глюкокортикоидов (биологические и фармакологические эффекты).

NB! Биологические эффекты глюкокортикоидов проявляются их влиянием на все виды обмена (углеводный, белковый, жировой, водно-электролитный). Эти эффекты проявляются при физиологических концентрациях естественных глюкокортикоидов. Фармакологические эффекты глюкокортикоидов (противовоспалительный, иммуносупрессивный, противоаллергический, противошоковый и др.) наблюдаются при применении препаратов глюкокортикоидов в дозах, значительно превышающих физиологические концентрации этих гормонов. Указанные фармакологические эффекты определяют основную сферу клинического применения препаратов глюкокортикоидов. При этом физиологические эффекты приобретают характер побочных.

Механизмы противовоспалительного, иммуносупрессивного и противоаллергического действия препаратов глюкокортикоидов.

NB! Механизмы развития фармакологических эффектов препаратов глюкокортикоидов связаны с их влиянием на клеточный геном (репрессия или индукция соответствующих генов).

Показания к применению препаратов глюкокортикоидов

Побочные эффекты препаратов глюкокортикоидов.

NB! Побочные эффекты препаратов глюкокортикоидов условно можно разделить на группы, связанные:

с гормональным действием (влиянием на обмен веществ);

с иммуносупрессивным действием;

с обратной отрицательной связью.

Противопоказания к применению препаратов глюкокортикоидов.

Препараты минералокортикоидов. Свойства. Показания к применению. Побочные эффекты.

NB! Естественным минералокортикоидом является альдостерон. Его главное свойство - стимуляция реабсорбции ионов натрия и эквивалентных количеств воды (минералокортикоидное действие). Это действие связано со стимуляцией альдостероном специфических рецепторов дистальных извитых канальцев и собирательных трубочек, в результате чего на люминальных мембранах эпителиоцитов увеличивается количество натриевых каналов.

Классификация препаратов женских половых гормонов.

Показания к применению препаратов женских половых гормонов.

Побочные эффекты препаратов женских половых гормонов.

Противозачаточные средства для приема внутрь. Классификация. Особенности применения препаратов разных групп. Побочные эффекты.

Препараты заместительной терапии в постменопаузном периоде.

Препараты мужских половых гормонов. Свойства и применение. Побочные эффекты.

Препараты анаболических стероидов. Показания к применению. Побочные эффекты.

Антагонисты гормональных препаратов. Показания к применению.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Препараты глюкокортикоидов.

Б. Препараты минералокортикоидов.

В. Препараты женских половых гормонов.

Г. Противозачаточные средства для приема внутрь (коммерческие названия).

Д. Препараты заместительной терапии в постменопаузном периоде (коммерческие названия).

Е. Препараты мужских половых гормонов и анаболические стероиды.

Ж. Антигормональные средства.

Задание 4.

Укажите препараты глюкокортикоидов, применяемые по перечисленным ниже показаниям. При выполнении задания используйте препараты из классификации, применение которых является наиболее целесообразным.

А. Болезнь Аддисона (в сочетании с препаратами минералокортикоидов):

Б. Коллагенозы:

В. Реакция отторжения трансплантата:

Г. Шок (анафилактический, ожоговый, травматический):

Задание 5

А. Из приведенного списка выберите побочные эффекты, связанные с гормональным действием (влиянием на обмен веществ):

с иммуносупрессивным действием:

с обратной отрицательной связью:

Побочные эффекты:

атрофия коры надпочечников;

перераспределение жировой ткани (лекарственный кушингоидизм);

остеопороз;

снижение сопротивляемости к инфекционным заболеваниям;

замедление репаративных процессов (изъязвления);

задержка натрия и воды, гипертензия, отеки;

гипергликемия (стероидный диабет);

уменьшение мышечной массы конечностей.

Б. Укажите, какие препараты глюкокортикоидов редко вызывают приведенные выше побочные эффекты. Объясните почему.

NB! При длительном (курсовом) применении препаратов глюкокортикоидов формируется (по принципу обратной отрицательной связи) индуцированная атрофия коры надпочечников. В связи с этим, отмена препаратов после курса должна производиться постепенно, с последующим назначением «поддерживающих» доз.

Задание 6

Дополните классификацию препаратов женских половых гормонов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты эстрогенов:

Препараты гестагенов:

Задание 7.

А. Дайте фармакокинетическую характеристику препаратов женских половых гормонов (табл. 12.9).

Таблица 12.9. Фармакокинетическая характеристика препаратов женских половых гормонов

Препарат	Пути введения (внутрь,	Продолжительность действия
	парентерально)	(небольшая/большая)
Эстрадиола		
дипропионат		
Этинилэстрадиол		
Гексэстрол		
Прогестерон		
Аллилэстринол		
Оксипрогестерона		
капронат		

Б. Выберите из приведенного ниже списка основные показания к применению (а-з):

эстрогенных препаратов:

гестагенных препаратов:

а) аменорея (нарушение менструального цикла); б) задержка полового созревания; в) бесплодие; г) для контрацепции; д) для заместительной терапии в постменопаузном периоде; е) угрожающий выкидыш; ж) рак предстательной железы; з) профилактика остеопороза.

В. Выберите из приведенного ниже списка типичные побочные эффекты (а-е):

эстрогенных препаратов:

гестагенных препаратов:

а) повышение свертывания крови; б) отеки; в) нарушение функции печени; г) тошнота, рвота; д) бессонница, депрессия; е) гирсутизм (рост волос по мужскому типу).

NB! Препараты гестагенов нередко применяют в комбинации с препаратами эстрогенов. К наиболее часто используемым группам комбинированных эстроген-гестагенных препаратов относятся: 1)

противозачаточные эстроген-гестагенные средства для приема внутрь; 2) средства заместительной терапии в постменопаузном периоде.

Задание 8

А. Дополните классификацию противозачаточных средств для приема внутрь препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Комбинированные эстроген-гестагенные препараты. Монофазные препараты

Двухфазные препараты:

Трёхфазные препараты:

Гестагенные препараты. Содержащие малые дозы гестагенов:

Содержащие высокие дозы гестагенов (посткоитальные контрацептивы):

NB! В основе противозачаточного действия комбинированных эстроген-гестагенных препаратов лежит обратная отрицательная связь.

Задание 11

А. Дополните классификацию антигормональных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, нарушающие синтез стероидных гормонов. Неизбирательные ингибиторы синтеза стероидных гормонов:

Ингибиторы синтеза глюкокортикоидов:

Ингибиторы синтеза андрогенов (ингибиторы 5 α -редуктазы):

Ингибиторы синтеза эстрогенов (ингибиторы ароматазы):

Средства, блокирующие рецепторы стероидных гормонов. Блокаторы рецепторов андрогенов:

А. Блокаторы рецепторов эстрогенов:

Б. Укажите основные показания к применению антигормональных средств (табл. 12.11).

Таблица 12.11. Основные показания к применению антигормональных средств

Препарат	Показания к применению			
	Синдром Иценко-Кушинга	Рак молочной железы	Рак предстательной железы	Доброкачественная гиперплазия предстательной железы

Аминоглютетими д				
Метирапон				
Тамоксифен				
Летрозол				
Ципротерон				
Финастерид				

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. При воздействии на обмен веществ препараты глюкокортикоидов вызывают:

1) перераспределение жировой ткани; 2) гипергликемию; 3) отеки; 4) увеличение синтеза белка.

2. Терапевтически ценные эффекты препаратов глюкокортикоидов:

1. Противовоспалительный. 2. Иммунодепрессивный. 3. Противоаллергический. 4. Противошоковый. 5. Гипотензивный.

3. Показания к применению препаратов глюкокортикоидов:

1) коллагенозы; 2) бронхиальная астма; 3) экзема; 4) реакция отторжения трансплантата; 5) сахарный диабет.

4. К препаратам глюкокортикоидов для резорбтивного применения относятся:

1) дексаметазон; 2) флунизолит; 3) преднизолон; 4) триамцинолон; 5) флуоцинолон.

5. Местно в виде мазей применяют:

1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флуметазон.

6. В ингаляциях применяют:

1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флуметазон.

7. Как в виде мазей, так и в ингаляциях применяют:

1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флутиказон; 5) будесонид.

8. Флудрокортизон применяют:

1) при коллагенозах; 2) в качестве противозачаточного средства; 3) при болезни Аддисона.

9. При аменорее применяют:

1) прогестерон; 2) этинилэстрадиол; 3) гексэстрол; 4) бетаметазон.

10. Для контрацепции применяют:

1) антеовин; 2) марвелон; 3) прогестерон; 4) постинор; 5) экслютон.

11. В качестве средств заместительной терапии в постменопаузном периоде применяют:

1) климонорм; 2) трирегол; 3) ливиал; 4) гинодиан депо; 5) метирапон.

12. При мужском бесплодии применяют:

1) метилтестостерон; 2) нандролон; 3) финастерид; 4) экслютон.

13. Для увеличения мышечной массы применяют:

1) нандролон; 2) тамоксифен; 3) метирапон; 4) постинор.

14. При аденоме предстательной железы применяют:

1) нандролон; 2) тамоксифен; 3) финастерид; 4) ливиал; 5) марвелон.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Глюкокортикостероидный препарат для лечения бронхиальной астмы.

Б. Противозачаточное средство для приема внутрь.

В. Препарат при аденоме предстательной железы.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3. 2-1,2,3,4. 3-1,2,3,4. 4-1,3,4. 5-2,4. 6-1,3. 7-4,5. 8-3. 9-1,2,3.
10-1,2,4,5. 11-1,3,4. 12-1. 13-1. 14-3.

Раздел 13. Средства, влияющие на иммунные процессы и воспаление

Тема 13.1. Иммуностропные и противоаллергические средства

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Иммуностимуляторы. Классификация. Механизмы действия. Показания к применению.

NB! Иммуностимуляторы - лекарственные средства, стимулирующие иммунный ответ организма. Основная сфера их применения - иммунодефицитные состояния, активация иммунной системы при хронических, рецидивирующих инфекционных и опухолевых процессах. При инфекционных заболеваниях иммуностимуляторы применяют совместно с противомикробными средствами.

Иммунодепрессанты. Классификация. Механизмы действия. Показания к применению. Побочные эффекты.

Группы средств, применяемые при аллергических реакциях немедленного и замедленного типов.

Механизм противоаллергического действия препаратов глюкокортикоидов. Применение. Побочные эффекты.

NB! Препараты глюкокортикоидов обладают иммуносупрессорным, противоаллергическим и противовоспалительным свойствами, в связи с чем их применяют при аллергических реакциях как немедленного, так и замедленного типов.

Стабилизаторы мембран тучных клеток. Механизм действия, применение.

NB! В тучных клетках синтезируются биологически активные вещества - «медиаторы гиперчувствительности немедленного типа» (гистамин, лейкотриены, серотонин и др.), выделение которых вызывает различные проявления аллергии (зуд, гиперемия, вазомоторный ринит и конъюнктивит, ангионевротический отек, бронхоспазм). Стабилизаторы мембран тучных клеток предупреждают указанные проявления аллергии, препятствуя дегрануляции тучных клеток.

Блокаторы рецепторов к медиаторам аллергии немедленного типа (антигистаминные средства, блокаторы серотониновых рецепторов, блокаторы лейкотриеновых рецепторов).

NB! Проявления реакций гиперчувствительности немедленного типа возникают в результате стимуляции медиаторами аллергии специфических рецепторов. Антигистаминные средства, блокаторы серотониновых и лейкотриеновых рецепторов предупреждают или устраняют соответствующие проявления аллергии немедленного типа.

Антигистаминные средства - блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов. Применение, побочные эффекты. Сравнительная характеристика отдельных препаратов.

NB! Антигистаминные средства, блокирующие H₁-рецепторы, различаются:

по химической структуре;

по продолжительности действия;
по способности вызывать седативный и снотворный эффекты.

8. Средства симптоматической терапии при аллергических реакциях.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

- А. Иммуностимуляторы.
- Б. Иммунодепрессанты.
- В. Препараты глюкокортикоидов.
- Г. Противоаллергические средства.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию иммуностимуляторов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Биогенные вещества.

Препараты пептидов вилочковой железы:

Препараты цитокинов:

Препараты интерферонов и интерфероногены:

Иммуностимуляторы микробного происхождения:

Иммуностимуляторы растительного происхождения: Синтетические средства:

Задание 2. Укажите механизмы действия иммуностимуляторов (табл. 13.1). Таблица 13.1. Механизмы действия иммуностимуляторов

Механизм действия	Рибомунил Тактивин Тилорон
-------------------	----------------------------------

Активация макрофагов, повышение продукции цитокинов

Стимуляция пролиферации Т-лимфоцитов

Интерфероногенная активность

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 3. Дополните классификацию иммунодепрессантов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Цитотоксические средства:

Препараты глюкокортикоидов:

Средства, нарушающие продукцию интерлейкина-2 (ингибиторы кальцинейрина):

Препараты моноклональных антител:

Задание 4. Укажите механизмы действия иммуносупрессантов (табл. 13.2).

Таблица 13.2. Механизмы действия иммуносупрессантов

Механизм действия			Азатиоприн Преднизолон	Циклоспорин	Базиликсимаб	Препараты моноклональных антител
	За счет					
	нарушения					
	синтеза ДНК					
Уменьшение	За счет					
пролиферации и	уменьшения					
дифференцировки	продукции					
T-лимфоцитов	ИЛ-2					
	За счет					
	блокады					
	рецепторов к					
	ИЛ-2					
Уменьшение пролиферации и						
дифференцировки В-лимфоцитов						

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 5. Укажите побочные эффекты иммунодепрессантов (табл. 13.3).

Таблица 13.3. Побочные эффекты иммунодепрессантов

Побочные эффекты	Азатиоприн	Преднизолон
	Циклоспорин	

Тошнота, рвота
 Угнетение миелоидного кроветворения
 Вторичная инфекция
 Синдром Иценко-Кушинга
 Гепатотоксическое действие
 Нефротоксическое действие

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 6. Дополните основные группы противоаллергических средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты глюкокортикоидов.

1.1. Препараты для системного (резорбтивного) применения.

Препараты естественных гормонов:

Синтетические препараты:

1.2. Препараты для местного применения.

Препараты, применяемые наружно в виде мазей и кремов:

Препараты, применяемые ингаляционно в виде аэрозолей:

Препараты, применяемые в мазях и ингаляциях:

Стабилизаторы мембран тучных клеток:

Блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов:

NB! Кроме препаратов перечисленных групп при аллергических реакциях немедленного типа применяются: блокатор серотониновых и гистаминовых рецепторов ципрогептадин, блокаторы лейкотриеновых рецепторов зафирлукаст, монтелукаст, пранлукаст.

При некоторых тяжелых проявлениях аллергии применяют средства симптоматической терапии: адреналин - при анафилактическом шоке; β₂-адреномиметики и метилксантины - при бронхоспазме.

Задание 7. Дайте сравнительную характеристику средств, стабилизирующих мембраны тучных клеток (табл. 13.4).

Таблица 13.4. Сравнительная характеристика средств, стабилизирующих мембраны тучных клеток

Параметры сравнения		Кромоглицева я	НедокромилКетоти фен
		кислота	
	Путь введения		
Фармакокинетические свойства	Кратность приема в		
	сутки		
	Профилактика бронхоспазма		
Показания к применению	Аллергический ринит		
	и конъюнктивит		
Другие фармакодинамические свойства	Блокада гистаминовых Н1-рецепторов		
	Седативное действие		

Примечание. Наличие эффекта обозначьте символом «+».

Задание 8. Дайте сравнительную характеристику блокаторов гистаминовых Н1-рецепторов, выполнив следующие задания.

А. Выпишите из приведенного списка антигистаминные средства с выраженным психоседативным действием:

и объясните правила приема этих препаратов (время суток, профессиональные ограничения).

Б. Выпишите антигистаминные средства с минимально выраженным психоседативным действием:

и объясните преимущества этих препаратов.

Выпишите антигистаминные средства, назначаемые: 3-4 раза в сутки:

2 раза в сутки:

1 раз в сутки:

Г. Выпишите антигистаминные средства, оказывающие М-холиноблокирующее действие:

и укажите противопоказания к их назначению.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

К иммуностимуляторам биогенного происхождения относятся:

1) левамизол; 2) рибомунил; 3) тактивин; 4) иммунал; 5) полиоксидоний.

Синтетические иммуностимуляторы:

1) интерферон-альфа; 2) полиоксидоний; 3) левамизол; 4) ронколейкин; 5) бронхомунал.

Иммуносупрессоры:

1) такролимус; 2) базиликсимаб; 3) тилорон; 4) циклоспорин; 5) азатиоприн.

Группы средств, применяемые при аллергических реакциях немедленного типа:

1) иммуностимуляторы; 2) стабилизаторы мембран тучных клеток; 3) глюкокортикостероиды; 4) блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов.

Стабилизаторы мембран тучных клеток:

1) кетотифен; 2) кромоглициевая кислота; 3) зафирлукаст; 4) недокромил; 5) ципрогептадин.

Препараты глюкокортикоидов для системного применения:

1) гидрокортизона ацетат; 2) дексаметазон; 3) беклометазон; 4) преднизолон; 5) триамцинолон.

Препараты глюкокортикоидов, применяемые ингаляционно в виде аэрозолей:

1) будесонид; 2) бетаметазон; 3) беклометазон; 4) флутиказон; 5) флунизолид.

8. Препараты глюкокортикоидов, применяемые наружно в виде мазей и кремов:

1) флуметазон; 2) флуоциналон; 3) будесонид; 4) флунизол.

Блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов с выраженным психоседативным действием:

1) дифенгидрамин; 2) лоратадин; 3) мебгидролин; 4) прометазин; 5) хлоропирамин.

Блокаторы гистаминовых H₁-рецепторов с минимально выраженным психоседативным действием:

1) клемастин; 2) лоратадин; 3) мебгидролин; 4) фексофенадин; 5) цетиризин.

Средства, стимулирующие образование интерферона:

1) тилорон; 2) левамизол; 3) ронколейкин; 4) тактивин; 5) рибомунил.

Для профилактики и лечения инфекционных заболеваний ЛОР-органов и дыхательных путей применяют:

1) бронхомунал; 2) тилорон; 3) рибомунил; 4) левамизол; 5) иммунал.

Для предупреждения реакции отторжения трансплантата применяют:

1) преднизолон; 2) базиликсимаб; 3) рапамицин; 4) циклоспорин; 5) ронколейкин.

Механизмы иммунодепрессивного действия глюкокортикоидов:

1) репрессия генов синтеза интерлейкинов-1, -2, -4; 2) репрессия генов синтеза ЦОГ-2; 3) индукция генов синтеза липокортина-1; 4) снижение пролиферации и дифференцировки Т- и В-клонов лимфоцитов; 5) снижение синтеза простагландинов группы Е.

Механизмы противоаллергического действия глюкокортикоидов:

1) индукция генов синтеза липокортина-1; 2) снижение синтеза лейкотриенов С₄, D₄, Е₄ и фактора активации тромбоцитов; 3) репрессия генов синтеза ЦОГ-2; 4) стабилизация мембран тучных клеток.

Уменьшают пролиферацию и дифференцировку Т-лимфоцитов за счет подавления продукции интерлейкина-2:

1)циклоспорин; 2) такролимус; 3) азатиоприн; 4) рапамицин; 5) базиликсимаб.

Определите лекарственные препараты.

Противоаллергическое средство. Стабилизирует мембраны тучных клеток и блокирует гистаминовые H1-рецепторы. Оказывает седативное действие. Применяется внутрь для предупреждения приступов бронхиальной астмы.

1.Кромоглициевая кислота. 2. Недокромил. 3. Кетотифен. 4. Ципрогептадин. 5. Клемастин.

Иммуностимулятор. Содержит рибосомы возбудителей инфекций ЛОР-органов и дыхательных путей. Применяется внутрь для профилактики и лечения ангины, фарингита, ринита, хронического бронхита.

1. Рибомунил. 2. Иммунал. 3. Тилорон. 4. Тактивин. 5. Бронхомунал.

Совместите.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Кромоглициевая кислота применяется для купирования приступов бронхиальной астмы, потому что кромоглициевая кислота препятствует взаимодействию гистамина с чувствительными к нему тканевыми рецепторами.

Глюкокортикоиды оказывают иммунодепрессивное действие, потому что глюкокортикоиды сенсibiliзируют адренорецепторы к катехоламинам.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Блокатор гистаминовых H1-рецепторов, не оказывающий седативного действия.

Б. Средство при отторжении почечного трансплантата.

В. Средство для купирования анафилактического шока.

Ответы на тестовые задания

1-2,3,4. 2-2,3. 3-1,2,4,5. 4-2,3,4. 5-1,2,4. 6-1,2,4,5. 7-1,3-5. 8-1, 9-1,4,5. 10-2,3,4,5. 11-1. 12-1,2,3,5. 13-1,2,3,4. 14-1,4. 15-1,2, 16-1,2,4. 17-3. 18-1. 19-Г. 20-Д. 21-В. 22-А. 23-Б. 24-неверно, неверно, связи нет. 25 - верно, верно, связи нет.

Тема 13.2. Противовоспалительные средства ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация противовоспалительных средств.

NB! Противовоспалительные средства представлены двумя основными группами: нестероидные противовоспалительные средства и стероидные противовоспалительные средства (препараты глюкокортикоидов).

Кроме того, выделяют медленно действующие противоревматоидные средства, противовоспалительные средства.

Нестероидные противовоспалительные средства. Классификация.

NB! Существуют следующие принципы классификации нестероидных противовоспалительных средств:

по химической структуре;

по избирательности в отношении разных изоформ циклооксигеназы.

Механизм противовоспалительного, болеутоляющего и жаропонижающего действия нестероидных противовоспалительных средств.

Показания к применению нестероидных противовоспалительных средств. Побочные эффекты и их коррекция

Стероидные противовоспалительные средства. Классификация, механизм действия, фармакологические эффекты, применение, побочные эффекты и их коррекция.

Медленно действующие противоревматоидные средства.

NB! Ревматоидный артрит - аутоиммунное заболевание, проявляющееся воспалительными и атрофическими изменениями в хрящевой ткани, которые приводят к нарушению функции и деформации суставов.

Ввиду прогрессирующего характера заболевания противовоспалительные средства (нестероидные и стероидные) являются недостаточно эффективными (они улучшают состояние больных, но не замедляют прогрессирование ревматоидного артрита). В качестве средств специфической (базисной) терапии ревматоидного артрита используются препараты, модифицирующие заболевание. Они представлены следующими препаратами:

метотрексат;

сульфасалазин;

4-аминохинолины (хлорохин, гидроксихлорохин);

препараты золота (натрия ауротиомалат, ауранофин);

D-пеницилламин.

Кроме того, в комплексной терапии ревматоидного артрита используют цитостатики, препараты антител к ФНО- α (фактор некроза опухолей α).

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Нестероидные противовоспалительные средства.

Б. Стероидные противовоспалительные средства (препараты глюкокортикоидов).

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ Задание 1

Дополните классификацию нестероидных противовоспалительных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Производные салициловой кислоты (салицилаты):

Производные индолуксусной кислоты:

Производные фенилуксусной кислоты:

Производные пропионовой кислоты:

Оксикамы:

Коксибы:

Задание 2. На схеме 13.1 отметьте действие стероидных и нестероидных противовоспалительных средств.

Задание 3

А. В табл. 13.5 совместите фармакологические эффекты нестероидных противовоспалительных средств с механизмами их возникновения.

Схема 13.1. Механизм действия противовоспалительных средств

Таблица 13.5. Фармакологические эффекты нестероидных противовоспалительных средств и механизмы их возникновения

Эффекты	Механизмы
---------	-----------

Противовоспалительный

Болеутоляющий

Жаропонижающий

Ульцерогенный

Бронхоспазм

Примечание. При заполнении таблицы впишите в строку соответствующие номера.

1. Угнетение синтеза простагландинов в очаге воспаления. 2. Угнетение синтеза простагландинов в центре терморегуляции. 3. Угнетение синтеза простагландинов в слизистой оболочке желудка. 4. Увеличение синтеза лейкотриенов.

Б. Объясните, с чем связано увеличение продукции лейкотриенов при применении нестероидных противовоспалительных средств.

В. Решите ситуационную задачу.

Г. Объясните механизм ульцерогенного действия нестероидных противовоспалительных средств и укажите пути коррекции.

Д. Решите ситуационную задачу.

Задание 4

А. Выпишите из списка лекарственных препаратов по теме избирательные ингибиторы циклооксигеназы-2:

Б. Объясните, в чем заключаются преимущества этих препаратов перед неизбирательными ингибиторами циклооксигеназы.

Задание 5. Дайте сравнительную характеристику нестероидных противовоспалительных средств и глюкокортикоидов (ГК) (табл. 13.6).

Таблица 13.6. Сравнительная характеристика нестероидных противовоспалительных средств и глюкокортикоидов

		Нестероидные	
Параметры сравнения		противовоспалительные средства	Г К
Эффекты	Противовоспалительный		
	Противоаллергический		
	Иммунодепрессивный		
	Жаропонижающий		
	Болеутоляющий		

Применение	Воспалительные заболевания опорно-		
	двигательного аппарата (артриты, миозиты)		
	Лихорадка		
	Аутоиммунные заболевания		
	Реакция отторжения трансплантата		
	Бронхиальная астма		
	Экзема, аллергический дерматит, псориаз		

Ульцерогенное действие

Окончание табл. 13.6

Параметры сравнения		Нестероидные	Г
		противовоспалительные средства	К
	Бронхоспазм		
Побочные эффекты	Азооспермия, снижение сократимости		
	миометрия		
	Снижение сопротивляемости к инфекциям		
	Атрофия коры надпочечников (при длительном применении)		
	Перераспределение жировой ткани		
	Нарушение функции почек		

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Нестероидные противовоспалительные средства:
диклофенак; 2) индометацин; 3) преднизолон; 4) триамцинолон; 5) мелоксикам.

2. Стероидные противовоспалительные средства:
целекоксиб; 2) кетопрофен; 3) будесонид; 4) флуметазон; 5) флунизолид.

3. Нестероидные противовоспалительные средства, избирательно угнетающие ЦОГ-2:
ацетилсалициловая кислота; 2) мелоксикам; 3) целекоксиб; 4) напроксен; 5) пироксикам.

4. Нестероидные противовоспалительные средства являются ингибиторами фермента:

циклооксигеназы; 2) фосфолипазы A₂; 3) 5-липоксигеназы; 4) простагландин-синтетазы.

5. Нестероидные противовоспалительные средства нарушают образование: 1) арахидоновой кислоты; 2) простагландинов; 3) лейкотриенов.

6. Стероидные противовоспалительные средства снижают активность фермента:

циклооксигеназы; 2) фосфолипазы A₂; 3) 5-липоксигеназы; 4) простагландин-синтетазы.

7. Стероидные противовоспалительные средства угнетают образование: арахидоновой кислоты; 2) простагландинов; 3) лейкотриенов; 4) липокортина.

8. Нестероидные противовоспалительные средства оказывают следующие эффекты:

противовоспалительный; 2) противоаллергический; 3) иммунодепрессивный; 4) жаропонижающий; 5) болеутоляющий.

9. Стероидные противовоспалительные средства оказывают следующие эффекты:

противовоспалительный; 2) противоаллергический; 3) иммунодепрессивный; 4) жаропонижающий; 5) болеутоляющий.

10. Нестероидные противовоспалительные средства применяют:

при воспалительных заболеваниях опорно-двигательного аппарата; 2) при лихорадке; 3) при реакции отторжения трансплантата; 4) при бронхиальной астме; 5) при экземе.

11. Стероидные противовоспалительные средства применяют:

при воспалительных заболеваниях опорно-двигательного аппарата; 2) при лихорадке; 3) при реакции отторжения трансплантата; 4) при бронхиальной астме; 5) при экземе; 6) при аутоиммунных заболеваниях.

12. Побочные эффекты нестероидных противовоспалительных средств:

язвенное действие; 2) бронхоспазм; 3) снижение сопротивляемости к инфекциям; 4) нарушение функции почек; 5) подавление сперматогенеза.

13. Побочные эффекты стероидных противовоспалительных средств: 1) язвенно-ульцерогенное действие; 2) бронхоспазм; 3) снижение сопротивляемости к инфекциям; 4) перераспределение жировой ткани; 5) атрофия коры надпочечников при длительном применении.

14. Для уменьшения ульцерогенного действия нестероидных противовоспалительных средств применяют:

1) синтетические аналоги простагландина E1; 2) ингибиторы 5-липоксигеназы; блокаторы лейкотриеновых рецепторов.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

15. Нестероидные противовоспалительные средства оказывают ульцерогенное действие, потому что нестероидные противовоспалительные средства нарушают образование простагландинов E2 и I2 в стенке желудка.

16. Ацетилсалициловая кислота может провоцировать бронхоспазм, потому что ацетилсалициловая кислота нарушает биосинтез простагландинов.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Противовоспалительное средство с антиагрегантной активностью.

Б. Стероидное противовоспалительное средство.

Избирательный ингибитор ЦОГ-2.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,5. 2-3,4,5. 3-2,3. 4-1. 5-2. 6-2. 7-1,2,3. 8-1,4,5. 9-1,2,3. 10-1, 11 - 1, 3, 4, 5, 6. 12 - 1, 2, 4, 5. 13 - 1, 3, 4, 5. 14 - 1. 15 - верно, верно, связь есть. 16 - верно, верно, связи нет.

Раздел 14. Противомикробные и противопаразитарные средства

NB! Для профилактики и лечения инфекционных заболеваний используют противомикробные средства - лекарственные вещества, оказывающие угнетающее влияние на микробные клетки.

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

антисептические и дезинфицирующие средства;

химиотерапевтические средства.

Тема 14.1. Антисептические и дезинфицирующие средства **ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ**

Понятие об антисептических и дезинфицирующих средствах.

NB! Антисептики - противомикробные средства широкого спектра действия. Их применяют для обработки кожи, слизистых оболочек, ожоговых и раневых поверхностей. Аналогичные препараты, используемые для обработки помещений, медицинских инструментов, аппаратуры, посуды, выделений больных, называют дезинфицирующими средствами. Таким образом, различие между антисептическими и дезинфицирующими средствами заключается в способе их применения.

Отличия антисептических средств от химиотерапевтических.

NB! Антисептические средства обладают:

универсальными противомикробными свойствами;

высокой токсичностью для человека. Химиотерапевтические средства обладают:

определенным спектром противомикробного действия;

относительно низкой токсичностью для человека.

Требования, предъявляемые к антисептическим средствам.

Классификация антисептических средств.

NB! Антисептические средства классифицируют в зависимости от их химического строения и происхождения.

Механизмы действия разных групп антисептических средств.

Применение антисептических средств.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию антисептических и дезинфицирующих средств препаратами из предложенного списка.

Галогенсодержащие соединения. Препараты хлора:
Препараты йода:

Окислители:

Кислоты и щелочи:

Соединения алифатического ряда:

Соединения ароматического ряда:

Соли металлов. Препараты ртути:

Препараты серебра:

Препараты цинка:

Производные нитрофурана:

Красители:

Детергенты:

Препараты растительного происхождения. Препараты зверобоя:

Препараты эвкалипта:

Задание 2. Укажите механизм противомикробного действия галогенсодержащих соединений, калия перманганата, борной кислоты, спирта этилового, раствора формальдегида, ртути дихлорида.

Б. Блокада сульфгидрильных групп ферментных систем микроорганизмов: _

Задание 3. Укажите препараты из списка, применяемые по показаниям.

А. Для обработки ран, кожи и слизистых оболочек:

Б. При инфекционных конъюнктивитах, кератитах, блефаритах:

В. Для обработки язвенных и ожоговых поверхностей:

Г. Для полоскания рта и горла при стоматитах и ангине:

Д. Для обработки рук хирурга и операционного поля:

Е. Для дезинфекции хирургических инструментов:

Ж. Для дезинфекции помещений и предметов ухода за больными:

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Галогенсодержащие соединения:

повидон-йод; 2) хлоргексидин; 3) калия перманганат; 4) хлорамин Б; 5) раствор йода спиртовой.

2. Антисептики из группы красителей:

бензалкония хлорид; 2) бриллиантовый зеленый; 3) метилтиониния хлорид; 4) этикридин; 5) цетилпиридиния хлорид.

3. Вызывают денатурацию белков микробной клетки:

калия перманганат; 2) спирт этиловый; 3) хлорамин Б; 4) формальдегид; 5) ртути дихлорид.

4. Блокируют сульфгидрильные группы ферментных систем микроорганизмов:

1) ртути дихлорид; 2) серебра нитрат; 3) хлоргексидин; 4) борная кислота.

5. Для обработки ран, кожи и слизистых оболочек применяют:

раствор йода спиртовой; 2) калия перманганат; 3) раствор аммиака; 4) бензалкония хлорид; 5) раствор перекиси водорода.

6. При инфекционных конъюнктивитах, кератитах, блефаритах применяют:

хлорамин Б; 2) борную кислоту; 3) серебро коллоидное; 4) серебра протеинат; этакридин.

7. Для полоскания рта и горла при стоматитах и ангине применяют:

нитрофурал; 2) раствор перекиси водорода; 3) калия перманганат; 4) цетилпиридиния хлорид; 5) хлорофиллипт.

8. Для обработки рук хирурга применяют:

цетилпиридиния хлорид; 2) раствор аммиака; 3) хлоргексидин; 4) серебра нитрат.

9. Для дезинфекции помещений и предметов ухода за больными применяют:

раствор перекиси водорода; 2) карболовую кислоту; 3) раствор формальдегида; 4) хлоргексидин; 5) повидон-йод.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Антисептик для полоскания горла при ангине.

Rp.: Sol. Nitrofurali Ваши замечания

D.S. Полоскать 3раза в сутки.

Б. Средство для обработки гнойных ран.

Rp.: Sol. Hydrogeniiperoxydi dilutae 5ml Ваши замечания

D.S. Наружно.

В. Средство при дерматитах.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4,5. 2-2,3,4. 3-1,2,3,4. 4-1,2. 5-1,2,4,5. 6-2,3,4. 7-1,2,3,5.
8-1,2,3. 9-2,3.

Тема 14.2. Антибиотики. Бета-лактамы. Гликопептидные антибиотики

NB! Антибиотики - одна из групп антибактериальных химиотерапевтических средств.

Антибактериальные химиотерапевтические средства (в отличие от антисептических средств) характеризуются низкой токсичностью для человека и избирательностью действия в отношении определенных микроорганизмов (каждая группа имеет определенный спектр действия).

При применении антибактериальных химиотерапевтических средств соблюдаются определенные правила (принципы химиотерапии). К ним относятся

выбор препарата с учетом чувствительности возбудителя инфекционного заболевания к химиотерапевтическому средству;

как можно более раннее применение химиотерапевтического средства;

применение ударных доз химиотерапевтических средств;

проведение полного курса химиотерапии;

комбинированное (при необходимости) применение химиотерапевтических средств.

Среди антибактериальных химиотерапевтических средств выделяют антибиотики и синтетические препараты.

NB! Характер антибактериального действия антибиотиков может быть бактерицидным или бактериостатическим.

Бактерицидный характер действия проявляется лизисом (деструкцией) бактериальных клеток.

Бактериостатический характер действия проявляется подавлением деления бактериальных клеток.

Характер антибактериального действия определяется механизмом действия.

Выделяют четыре основных механизма действия антибиотиков:

- нарушение синтеза клеточной стенки бактерий;
- нарушение проницаемости цитоплазматической мембраны бактерий;
- нарушение синтеза белка на рибосомах бактерий;
- нарушение синтеза бактериальной РНК.

NB! Под спектром действия понимают совокупность микроорганизмов, чувствительных к данному химиотерапевтическому средству.

Традиционно выделяют антибиотики:

действующие преимущественно на грамположительные бактерии;

действующие преимущественно на грамотрицательные бактерии;

широкого спектра действия.

Традиционные представления о спектрах действия не учитывают приобретенную резистентность микрофлоры, из-за которой ряд антибиотиков утратил значительную часть своего спектра.

Из-за этого применение большинства антибиотиков рассматривают в связи с их клинической эффективностью. В отношении конкретных возбудителей выделяют:

- препараты выбора (наиболее эффективные, наименее токсичные);
- препараты резерва (менее эффективные, более токсичные).

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Группы бета-лактамов антибиотиков

Механизм и характер антибактериального действия бета-лактамов антибиотиков.

NB! Бета-лактамы антибиотики нарушают синтез пептидогликана клеточной стенки бактерий, что приводит к лизису бактерий.

Клетки макроорганизма не содержат пептидогликана, в связи с чем бета-лактамы антибиотики малотоксичны для человека.

Пенициллины. Классификация.

NB! В основе классификации пенициллинов лежит способ их получения. Биосинтетические пенициллины - продукты жизнедеятельности грибов рода *Penicillium*. Полусинтетические пенициллины - продукты химической модификации биосинтетических пенициллинов.

Биосинтетические пенициллины (препараты бензилпенициллина). Классификация по продолжительности действия и кислотоустойчивости. Спектр действия. Применение.

Полусинтетические пенициллины. Классификация по спектру действия и химической структуре. Применение.

NB! Основным механизмом устойчивости к бета-лактамам антибиотикам является их ферментативная инактивация бета-лактамазами.

Бета-лактамазы могут продуцироваться как грамположительными, так и грамотрицательными бактериями, в связи с чем выделяют:

- бета-лактамазы грамположительных микроорганизмов;
- бета-лактамазы грамотрицательных микроорганизмов.

Синтезированы соединения, ингибирующие бета-лактамазы: клавулановая кислота, сульбактам, тазобактам.

Комбинированные препараты полусинтетических пенициллинов и ингибиторов бета-лактамаз. Их преимущества перед полусинтетическими пенициллинами.

Цефалоспорины. Классификация. Различия в спектре действия и устойчивости к бета-лактамазам среди цефалоспоринов разных поколений. Применение. Пути введения.

NB! Все цефалоспорины обладают широким спектром антибактериального действия. Наиболее широким спектром антибактериального действия обладают цефалоспорины IV поколения (он включает синегнойную палочку, протей и штаммы кокков, продуцирующие бета-лактамазу). Спектр действия цефалоспоринов III поколения несколько уже (эффективность в отношении синегнойной палочки характерна только для отдельных препаратов). Цефалоспорины II поколения неактивны в отношении синегнойной палочки, однако в сравнении с препаратами I поколения более активны в отношении грамотрицательных бактерий.

Карбапенемы. Препараты. Спектр действия. Взаимодействие с бета-лактамазами и дегидропептидазой почечных канальцев. Применение.

Монобактамы. Спектр действия. Применение.

Гликопептидные антибиотики. Механизм, характер и спектр антибактериального действия. Пути введения. Применение.

Побочное действие бета-лактамов и гликопептидных антибиотиков.

NB! Побочные эффекты антибиотиков можно разделить на четыре группы:

- связанные с влиянием на иммунную систему;
- связанные с химиотерапевтическим действием;
- связанные с органотропным (органотоксическим) действием;
- осложнения на путях введения (связанные с местнораздражающим действием).

Побочные эффекты, связанные с влиянием на иммунитет, чаще всего проявляются аллергическими реакциями немедленного и замедленного типов.

Побочные эффекты, связанные с химиотерапевтическим действием антибиотиков, проявляются дисбактериозом и реакцией обострения. Реакция обострения проявляется лихорадкой и является результатом массивного бактериолиза (характерна для антибиотиков с бактерицидным характером действия). Аллергия и дисбактериоз характерны для всех без исключения групп антибиотиков.

Побочные эффекты, связанные с органотропным действием, неодинаковы для разных групп антибиотиков и проявляются: действием на почки (нефротоксическое действие), печень (гепатотоксическое действие), слуховой анализатор (ототоксическое действие), нервную ткань (нейротоксическое действие) и др. Осложнения на путях введения могут возникать как при парентеральном (болезненность, флебит), так и при энтеральном (тошнота, рвота, диарея) введении антибиотиков.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Пенициллины (индивидуальные и комбинированные препараты).

Б. Цефалоспорины.

В. Карбапенемы и монобактамы (индивидуальные и комбинированные препараты).

Г. Гликопептидные антибиотики.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию пенициллинов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Биосинтетические пенициллины. Препараты короткого действия:

Препараты длительного действия (депо-пенициллины):

Полусинтетические пенициллины.

Препараты, действующие преимущественно на грамположительные бактерии и устойчивые к пенициллиназе (изоксазолиловые пенициллины):

Препараты широкого спектра действия, неустойчивые к пенициллиназе.

Аминопенициллины:

Карбоксипенициллины:

Уреидопенициллины:

Комбинированные препараты пенициллинов с ингибиторами бета-лактамаз:

Примечание. В клинической практике изоксазолиловые пенициллины называют «антистафилококковыми» пенициллинами. Препараты карбоксипенициллинов и уреидопенициллинов называют «антисинегнойными» пенициллинами. Комбинированные препараты пенициллинов с ингибиторами бета-лактамаз называют «ингибиторозащищенными» пенициллинами.

Задание 2. Объясните механизм бактерицидного действия пенициллинов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Ингибирование транспептидазы пептидогликана и эндогенного ингибитора муреингидролазы.

Лизис бактериальных клеток.

Нарушение прочности клеточной стенки бактерий.

Подавление образования и активация разрушения пептидогликана.

Задание 3. Дайте сравнительную характеристику препаратов пенициллинов (табл. 14.1).

Таблица 14.1. Сравнительная характеристика препаратов пенициллинов

Бензилпенициллин Бицилли Оксацилли Ампицилли
Азлоцилли

Параметры сравнения					
		а натриевая соль	н		
		1		н	н
	Преимущественно				
	грамположительны				
	е бактерии				
Спектр действ и	Широкий				
я					
	Действие на				
	синегнойную				
	палочку				

Устойчивость к
пеницилиназе

Путь введения (внутрь или
парентерально)

Продолжительность
действия

Окончание табл. 14.1

Задание 5. Дайте сравнительную характеристику антибиотиков, нарушающих синтез клеточной стенки бактерий (табл. 14.3).

Таблица 14.3. Сравнительная характеристика антибиотиков,
нарушающих синтез клеточной стенки бактерий

Параметры сравнения	Бензилпенициллин	Бицилли	ОксациллинАмпици		Азлоцил лин
	а	н	ллин	лли	
	натриевая соль	1			

	1.		1.	1.	1.	
Применение						
	2.		2.	2.	2.	

Примечание. При заполнении графы «Спектр действия», «Устойчивость к пеницилиназе» используйте символ «+». При заполнении графы «Продолжительность действия» используйте следующие временные параметры: а) 3-4 ч; б) 4-6 ч; в) 7 дней.

При заполнении графы «Применение» используйте буквенные индексы следующих показаний.

- А. Кишечные инфекции.
- Б. Сифилис
- В. Инфекции, вызываемые синегнойной палочкой.
- Г. Стафилококковые инфекции
- Д. Инфекции верхних дыхательных путей, пневмония.
- Е. Профилактика обострений ревматизма.

Задание 4. Дайте сравнительную характеристику цефалоспоринов (табл. 14.2).

Таблица 14.2. Сравнительная характеристика цефалоспоринов

Параметры сравнения	Цефалексин				Цефуросксим				Цефотаксим				Цефтазидин				Цефепим															
Поколение																																
Путь введения (внутри/парентерально)																																
Действие на синегнойную палочку																																
Нефротоксическое действие																																
Параметр	Бензилпенициллины				Оксациллы				Ампициллины				Цефепим				Тиенам				Азтреона				Ванкомицин							
Сравнения	Н				Н				Н				М				М				М				Н							
Спектр действия																																
Окончание табл. 14.3																																

Параметры сравнения		Бензилпенициллин		Оксацилин		Ампициллин		Цефепим		Тиенхам		Азтреонам		Ванкомицин	
Действие на синегнойную палочку															

	Инфекции
	мочевыводящих
	путей
	Кишечные
	инфекции
	Псевдомембранозный колит
Органо-токсическое	Нейротоксическое
	Нефротоксическое действие
	Ототоксичность

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+», при заполнении строки «Спектр действия» - обозначения «Гр+», «Гр», «Ш» (широкий).

ВВ! Псевдомембранозный колит - одно из осложнений антибиотикотерапии. Его вызывает токсин, выделяемый анаэробной неспорообразующей бактерией *Clostridium difficile*, размножение которой активизируется при подавлении нормальной флоры. Для лечения псевдомембранозного колита применяют химиотерапевтические средства, активные в отношении *Clostridium difficile*: ванкомицин, метронидазол и др. Ванкомицин при этом применяют внутрь.

Кроме того, ванкомицин активен в отношении метициллин-резистентных кокков, в связи с чем его применяют при тяжелых системных

инфекциях, вызванных этими возбудителями. При этом его вводят внутривенно. Внутривенное введение препарата возможно только в условиях стационара (ввиду выраженной органотоксичности).

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы

1. Бета-лактамы антибиотики:
ванкомицин; 2) азтреонам; 3) тиенам; 4) тикарциллин; 5) ампициллин.

2. Биосинтетические пенициллины длительного действия:
бензилпенициллина натриевая соль; 2) бензатина бензилпенициллин;
3) прокаина бензилпенициллин; 4) бициллин.

3. Пенициллины, действующие преимущественно на грамположительные бактерии:
бензилпенициллина натриевая соль; 2) оксациллин; 3) клоксацillin;
4) ампициллин; 5) пиперациллин.

4. Пенициллины широкого спектра действия:
бициллин 5; 2) азлоциллин; 3) амоксициллин; 4) тикарциллин; 5)
пиперациллин.

5. Пенициллины, действующие на синегнойную палочку:
оксациллин; 2) ампициллин; 3) азлоциллин; 4) пиперациллин; 5)
тикарциллин.

6. Пенициллины, устойчивые к пенициллиназе:
бензатина бензилпенициллин; 2) оксациллин; 3) клоксацillin; 4)
ампициллин; 5) азлоциллин.

7. Амоксициллин комбинируют с:
клавулановой кислотой; 2) сульбактамом; 3) циластатином; 4)
тазобактамом.

8. Цефалоспорины, действующие на синегнойную палочку:
цефалексин; 2) цефуроксим; 3) цефотаксим; 4) цефтазидим; 5)
цефепим.

9. Цефалоспорины для приема внутрь:
цефалексин; 2) цефаклор; 3) цефотаксим; 4) цефтазидим; 5) цефепим.

10. При сифилисе применяют:
бензилпенициллина натриевую соль; 2) бензатина бензилпенициллин;
3) прокаина бензилпенициллин; 4) оксациллин; 5) ампициллин.

11. При псевдомембранозном колите применяют:
тиенам; 2) азтреонам; 3) ванкомицин; 4) цефепим; 5) оксациллин.

12. Пенициллины могут вызывать:
аллергические реакции; 2) реакцию обострения; 3) дисбактериоз; 4)
поражения печени; 5) местно-раздражающее действие.

Определите лекарственные препараты.

13. Обладает широким спектром действия. Применяется при пневмониях, менингитах, сепсисе, инфекциях желудочно-кишечного тракта, мочевыводящих путей. Вводится внутримышечно и внутривенно. В состав препарата входит циластатин:

Меропенем. 2. Тиенам. 3. Азтреонам. 4. Амоксиклав.

14. Обладает широким спектром действия. Активен в отношении грамположительных и грамотрицательных бактерий, продуцирующих бета-лактамазы. Применяется при инфекциях дыхательных и мочевыводящих путей, костной ткани, суставов

1.Оксациллин. 2. Ампициллин. 3. Амоксиклав. 4. Азлоциллин. 5. Карбенициллин.

Совместите.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Бета-лактамы вызывают лизис бактериальных клеток, потому что бета-лактамы нарушают прочность клеточной стенки бактерий.

Бета-лактамы нарушают прочность клеточной стенки бактерий, потому что бета-лактамы нарушают синтез пептидогликана клеточной стенки бактерий.

Бета-лактамы нарушают синтез пептидогликана клеточной стенки бактерий, потому что бета-лактамы ингибируют транспептидазу пептидогликана.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для профилактики сезонных обострений ревматизма.

Б. Антибиотик из группы цефалоспоринов для парентерального введения.

В. Антибиотик для лечения стрептококковой инфекции.

Ответы на тестовые задания

1-2,3,4,5. 2-2,3,4. 3-1,2,3. 4-2,3,4,5. 5-3,4,5. 6-2,3. 7-1.
8-4,5. 9-1,2. 10-1,2,3. 11-3. 12-1,2,3,5. 13-2. 14-3. 15-А.
16-В. 17-А. 18-В. 19-Б. 20-А. 21 - верно, верно, связь есть. 22 -
верно, верно, связь есть. 23 - верно, верно, связь есть.

Тема 14.3. Антибиотики (продолжение). Макролиды, линкозамиды, тетрациклины, хлорамфеникол, аминогликозиды, полимиксины

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

NB! Рассматриваемые в этой теме группы антибиотиков различаются:

- по химической структуре;
- по спектру действия;
- по характеру действия;
- по механизму действия.

Макролиды. Классификация, спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Макролиды по происхождению подразделяют на биосинтетические (природные) и полусинтетические. В зависимости от количества атомов углерода в макроциклическом лактонном кольце выделяют 14-, 15- и 16-членные. 15-членные макролиды, соединения, содержащие атом азота, относят к азалидам.

Линкозамиды. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

Тетрациклины. Классификация, спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Тетрациклины по происхождению подразделяют на биосинтетические и полусинтетические, различающиеся главным образом по продолжительности действия.

Хлорамфеникол. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

Аминогликозиды. Классификация. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Аминогликозиды условно подразделяют на три поколения. Кроме того, иногда их классифицируют по активности в отношении синегнойной палочки и скорости развития устойчивости микроорганизмов.

Полимиксины. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Полимиксины представляют собой высокомолекулярные белковые соединения. Ввиду выраженной органотоксичности эти вещества применяют главным образом местно (для обработки ран, а также в каплях при инфекциях глаз и ЛОР-органов). В связи с тем, что они плохо всасываются из пищеварительного тракта, их можно назначать внутрь для санации кишечника перед хирургическими операциями.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

Макролиды и линкозамиды.

Б. Тетрациклины и хлорамфеникол.

Аминогликозиды.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию макролидов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Биосинтетические макролиды, содержащие 14-членное кольцо:

Полусинтетические макролиды, содержащие 14-членное кольцо:

Полусинтетические макролиды, содержащие 15-членное кольцо (азалиды):

Биосинтетические макролиды, содержащие 16-членное кольцо:

Задание 2. Объясните механизм и характер антибактериального действия макролидов и линкозамидов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Проникновение в бактериальную клетку (вследствие высокой липофильности).

Связывание с субъединицей 50S бактериальных рибосом.

Торможение роста полипептидных цепей.

Бактериостатическое действие.

Блокада процесса транслокации фрагментов пептидной цепи.

Нарушение образования бактериального белка.

NB! Избирательность антибактериального действия антибиотиков, нарушающих синтез белка на рибосомах бактериальных клеток, связана с различиями в биосинтетических процессах бактерий и клеток макроорганизма. Рибосомы бактерий включают в себя большую субъединицу (50S) и малую субъединицу (30S), в то время как рибосомы макроорганизма состоят из субъединиц 60S и 40S.

Задание 3. Дайте сравнительную характеристику макролидов, азалидов и линкозамидов (табл. 14.4).

Таблица 14.4. Сравнительная характеристика макролидов, азалидов и линкозамидов

		Макролиды и азалиды	Линкозамиды
Параметры сравнения			
Спектр действия	Гр ⁺ -микробактерии (кокки), а также бактериоиды		
	Гр ⁺ -микробактерии (кокки), а также <i>Helicobacter pylori</i> и внутриклеточные бактерии (хламидии, микоплазмы и легионеллы)		
Фармакокинетические параметры	Накопление в ткани легких и бронхов		
	Накопление в костной и суставной ткани		
Применение		1.	1.
		2.	2.

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

При заполнении графы «Применение» используйте буквенные индексы следующих показаний.

А. Бактериальные инфекции дыхательных путей (фарингит, тонзиллит, бронхит, пневмония).

Б. Стафилококковый остеомиелит.

Атипичные пневмонии (в том числе у ВИЧ-инфицированных).

Г. Стафилококковые инфекции кожи и мягких тканей.

Д. Эрадикация *Helicobacter pylori* при язвенной болезни.

NB! Макролиды и линкозамиды сравнительно редко вызывают органотоксические эффекты. Типичное осложнение при применении линкозамидов - псевдомембранозный колит.

Задание 4. Дополните классификацию тетрациклинов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Тетрациклины непродолжительного (6 ч) действия:

Тетрациклины продолжительного (12 ч) действия:

Задание 5. Объясните механизм и характер антибактериального действия тетрациклинов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Проникновение в бактериальную клетку (вследствие высокой липофильности).

Торможение роста полипептидных цепей.

Бактериостатическое действие.

Связывание с субъединицей 30S бактериальных рибосом.

Торможение процесса элонгации фрагментов пептидной цепи.

Нарушение образования бактериального белка.

Задание 6. Решите ситуационные задачи.

Задание 7. Объясните механизм и характер антибактериального действия хлорамфеникола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Проникновение в бактериальную клетку.

Торможение синтеза белка на рибосомах.

Бактериостатическое действие.

Связывание с субъединицей 50S рибосом и ингибирование пептидилтрансферазы.

Торможение процесса транспептидации.

Задание 8. Дополните классификацию аминогликозидов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Аминогликозиды I поколения:

Аминогликозиды II поколения:

Аминогликозиды III поколения:

Задание 9. Объясните механизм и характер антибактериального действия аминогликозидов, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Проникновение через цитоплазматическую мембрану бактерий путем кислородзависимого активного транспорта.

Связывание с субъединицей 30S бактериальных рибосом.

Нарушение проницаемости цитоплазматической мембраны.

Бактерицидное действие.

Торможение синтеза белка на рибосомах за счет угнетения элонгации.

NB! В связи с тем, что аминогликозиды проникают в бактериальные клетки путем кислородзависимого транспорта, они не действуют на анаэробные бактерии.

Задание 10. Дайте сравнительную характеристику некоторых антибиотиков широкого спектра действия (табл. 14.5).

Таблица 14.5. Сравнительная характеристика антибиотиков широкого спектра действия

Параметры сравнения		Стрептомицин Гентамицин Тетрациклин Хлорамфеникол
	Бактерицидный	
Характер		
действия	Бактериостати-	
	ческий	
	Парентерально	
Пути введения		
	Внутрь	

		1.	1.	1.
Применение	1.			
		2.	2.	2.
	1.	1.		
			1.	
Побочное действие	2.	2.		1.
			2.	
	3.	3.		

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

При заполнении графы «Применение» используйте буквенные индексы следующих показаний.

Туберкулез.

Б. Инфекции, вызываемые синегнойной палочкой.

Сепсис.

Г. Риккетсиозы (в том числе сыпной тиф).

Д. Холера, чума.

Е. Бактериальный менингит.

Ж. Сальмонеллезы (в том числе брюшной тиф).

При заполнении графы «Побочное действие» используйте буквенные индексы следующих побочных эффектов.

З. Ототоксическое и вестибулотоксическое действие.

И. Нарушение кроветворения.

К. Нефротоксическое действие.

Л. Нарушение нервно-мышечной передачи.

М. Гепатотоксическое действие.

Н. Нарушение формирования скелета.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. К макролидам относятся:

1) азитромицин; 2) кларитромицин; 3) клиндамицин; 4) эритромицин;
5) рокситромицин.

2. К линкозамидам относится:

1) клиндамицин; 2) мидекамицин; 3) рокситромицин; 4) линкомицин;
5) азитромицин.

3. К аминогликозидам относятся:

1) амикацин; 2) гентамицин; 3) метациклин; 4) неомицин; 5)
стрептомицин.

4. К тетрациклинам относятся:

1) доксициклин; 2) гентамицин; 3) метациклин; 4) тетрациклин; 5)
амикацин.

5. Нарушают проницаемость цитоплазматической мембраны и синтез
белка в бактериальной клетке:

1) азитромицин; 2) амикацин; 3) гентамицин; 4) неомицин; 5)
метациклин.

6. Бактерицидное действие оказывают:

1) эритромицин; 2) амикацин; 3) хлорамфеникол; 4) доксициклин; 5)
гентамицин.

7. Бактериостатическое действие оказывают:

1) линкомицин; 2) тетрациклин; 3) рокситромицин; 4) неомицин; 5)
клиндамицин.

8. Антибиотики широкого спектра действия:

1) эритромицин; 2) доксициклин; 3) хлорамфеникол; 4) стрептомицин;
5) линкомицин.

9. Антибиотики, применяемые только парентерально:

1) стрептомицин; 2) амикацин; 3) азитромицин; 4) гентамицин; 5)
хлорамфеникол.

10. Побочные эффекты аминогликозидов:

1) ототоксическое и вестибулотоксическое действие; 2) нарушение
кровообразования; 3) нефротоксическое действие; 4) нарушение нервно-
мышечной передачи; 5) гепатотоксическое действие.

11. Побочные эффекты тетрациклинов:

1) ототоксическое и вестибулотоксическое действие; 2) нарушение кроветворения; 3) нарушение формирования скелета; 4) нарушение нервно-мышечной передачи; 5) гепатотоксическое действие.

12. Побочные эффекты хлорамфеникола:

1) ототоксическое и вестибулотоксическое действие; 2) нарушение кроветворения; 3) нарушение нервно-мышечной передачи; 4) гепатотоксическое действие.

Совместите.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Макролиды нарушают процесс образования бактериального белка, потому что макролиды связываются с субъединицей 50S бактериальных рибосом.

Аминогликозиды неэффективны в отношении анаэробных бактерий, потому что аминогликозиды проникают через цитоплазматическую мембрану бактерий путем кислородзависимого активного транспорта. Проведите анализ врачебных рецептов.

Антибиотик-макролид при уретральном хламидиозе.

Б. Антибиотик для лечения дизентерии.

Антибиотик-аминогликозид при синегнойном сепсисе.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4,5. 2-1,4. 3-1,2,4,5. 4-1,3,4. 5-2,3,4. 6-2,5. 7-1,2,3,5.
8-2,3. 9-1,2,4. 10-1,3,4. 11-3,5. 12-2. 13-В. 14-А. 15-Д. 16-Г.
17-Б. 18-Е. 19 - верно, верно, связь есть. 20 - верно, верно, связь есть.

Тема 14.4. Синтетические антибактериальные средства. Противотуберкулезные средства. Противосифилитические средства

ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

Классификация синтетических антибактериальных средств.

ВВ! К синтетическим антибактериальным средствам относятся препараты различной химической структуры, обладающие бактериостатическим или бактерицидным действием.

Как правило, механизм их антибактериального действия связан с подавлением внутриклеточных биосинтетических процессов.

Синтетические антибактериальные средства классифицируют по химическому строению.

Фторхинолоны. Классификация, спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Хинолоновая структура характерна для ряда соединений, обладающих антибактериальной активностью. Так, к соединениям хинолонового ряда относятся: производное нафтиридина - кислота налидиксовая и производное хинолинкарбоновой кислоты - кислота оксолиниевая. Эти вещества действуют преимущественно на грамотрицательные бактерии и применяются при инфекциях мочевыводящих путей.

Введение атомов фтора в хинолоновый цикл приводит к расширению спектра действия и сферы применения фторхинолонов.

Сульфаниламиды. Классификация, спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Все сульфаниламиды обладают сходным механизмом и спектром антибактериального действия, но различаются по фармакокинетическим свойствам. В связи с этим выделяют препараты для местного и системного применения.

Традиционные представления о сульфаниламидах как о препаратах широкого спектра действия не учитывают приобретенную резистентность микрофлоры, из-за чего эти препараты утратили значительную часть своего спектра. Для расширения спектра за счет резистентных штаммов микроорганизмов сульфаниламиды комбинируют с триметопримом.

Оксазолидиноны. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Применение. Побочные эффекты.

NB! Оксазолидиноны - новая группа синтетических антибактериальных средств, нарушающих внутриклеточный синтез белка. Основным преимуществом оксазолидинонов является то, что при их применении не возникает перекрестной резистентности с антибиотиками, нарушающими синтез белка.

Производные нитрофурана. Классификация по применению. Спектр, характер и механизм антибактериального действия. Побочные эффекты.

NB! Антибактериальные средства из группы нитрофуранов представлены как химиотерапевтическими, так и антисептическими средствами. Механизм их антибактериального действия связан с нарушением синтеза бактериальной ДНК.

Производные 8-оксихинолина. Применение. Побочные эффекты.

Производные хиноксалина. Применение. Побочные эффекты.

Классификация противотуберкулезных средств по эффективности. Механизмы действия отдельных препаратов. Побочные эффекты и способы их коррекции.

NB! Возбудитель туберкулеза - палочка Коха (микобактерия туберкулеза). Противотуберкулезные средства представлены антибиотиками и синтетическими препаратами. Спектр действия синтетических противотуберкулезных препаратов включает только микобактерии (туберкулеза и лепры). В связи с длительным течением заболевания противотуберкулезные средства применяют не менее 6-12 мес. Этим обусловлена необходимость учета побочных эффектов противотуберкулезных средств и способов их коррекции.

Противосифилитические средства. Классификация. Побочные эффекты.

NB! Возбудитель сифилиса - бледная трепонема. Она чувствительна к биосинтетическим пенициллинам, цефалоспорином, тетрациклинам и макролидам. Кроме указанных антибиотиков, для лечения сифилиса применяют препараты висмута.

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

А. Фторхинолоны и оксазолидиноны.

Б. Сульфаниламиды.

В. Комбинированные препараты сульфаниламидов с триметопримом.

Ко-тримоксазол (бактрим, бисептол)

Г. Производные нитрофурана, 8-оксихинолина, хиноксолина.

Д. Противотуберкулезные средства.

Е. Противосифилитические средства.

ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

Задание 1. Дополните классификацию фторхинолонов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Монофторхинолоны:

Дифторхинолоны:

Задание 2. Дополните классификацию сульфаниламидов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Сульфаниламиды, применяемые для резорбтивного действия. Препараты непродолжительного действия (6-8 ч):

Препараты длительного действия (18-24 ч):

Препараты сверхдлительного действия (более 48 ч):

Сульфаниламиды, действующие в просвете кишечника:

Сульфаниламиды для местного применения:

Комбинированные препараты сульфаниламидов с триметопримом:

Задание 3. На схеме 14.2 отметьте действие: фторхинолонов (1), оксазолидинонов (2), сульфаниламидов (3), триметоприма (4).

Схема 14.2. Механизмы действия разных групп синтетических антибактериальных средств

Задание 4. Используя данные о механизмах действия (схема 14.2), объясните, с чем связана избирательность антибактериального действия: а) фторхинолонов; б) оксазолидинонов; в) сульфаниламидов.

Задание 5. Дайте сравнительную характеристику ципрофлоксацина, линезолида, сульфалена и котримоксазола (табл. 14.6).

Таблица 14.6. Сравнительная характеристика ряда синтетических антибактериальных средств

Параметры сравнения		Ципрофлоксацин	Котримоксазол
		Линезолид	Сульфален
Характер	Бактерицидный		
действия	Бактериостатический		
	Гр ⁺ -бактерии		
	Широкий		
Спектр действия	Активен в отношении синегнойной палочки		
	Активен в отношении		

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

NB! Показания к применению ряда синтетических антибактериальных средств определяются не только спектром действия, но и особенностями их фармакокинетики.

Задание 6

Укажите показания к применению приведенных ниже синтетических антибактериальных средств (табл. 14.7).

Таблица 14.7. Показания к применению некоторых синтетических антибактериальных средств

Показания	Названия препаратов
Только местно при конъюнктивитах	1.
Местно при стоматитах и ангине	1.
	1.
Главным образом при кишечных инфекциях	
	2.
	1.
Только при инфекциях мочевыводящих путей	2.

При инфекционных процессах различной органной локализации 1.

Препараты: ципрофлоксацин; линезолид; ко-тримоксазол; сульфакарбамид; фталилсульфатиазол; сульфацетамид натрия; нитроколин; нитрофурантоин; фуразолидон; нитрофурацол.

ВВ! Все фторхинолоны обладают широким спектром антибактериального действия. Отдельные представители группы различаются по преимущественному влиянию на определенные виды бактерий, а также по продолжительности действия.

Задание 7

Дополните классификацию противотуберкулезных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Антибиотики:

Синтетические средства:

Задание 8

А. Дайте фармакологическую характеристику некоторых противотуберкулезных средств (табл. 14.8).

Таблица 14.8. Фармакологическая характеристика некоторых противотуберкулезных средств

	Туберкулоцидное			
		Спектр	Путь	Характерные
			Механизм	
Препараты	(ТЦ) или	действия	введения	побочные
	туберкулостатическое		действия	
			(внутри, в/м) эффекты	
	(ТС) действие			
Рифампицин				
Изониазид				

Стрептомицин

Этамбутол

Примечание. При заполнении графы «Механизмы действия» используйте цифры следующих механизмов.

1. Нарушает синтез миколовых кислот клеточной стенки микобактерий.
2. Угнетение синтеза бактериальной РНК.
3. Угнетение синтеза бактериального белка.

При заполнении графы «Характерные побочные эффекты» используйте цифровые индексы следующих эффектов.

1. Нарушение функций печени.
2. Снижение слуха, вестибулярные расстройства.
3. Невриты.
4. Психические нарушения.
5. Нарушение зрения
6. Дисбактериоз.

Б. Укажите, какие препараты применяют для коррекции нейротоксического действия изониазида, и объясните механизм взаимодействия.

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

Выберите правильные ответы.

1. Антибактериальные средства из группы фторхинолонов:
 - 1) линезолид; 2) ломефлоксацин; 3) моксифлоксацин; 4) ципрофлоксацин.
2. Сульфаниламидные препараты:
 - 1) фталилсульфатиазол; 2) фуразолидон; 3) сульфален; 4) сульфацетамид натрия; 5) нитроксолин.

3. Антибактериальные средства из группы нитрофуранов:
1) нитроксолин; 2) нитрофурал; 3) нитрофурантоин; 4) фуразолидон; 5) хиноксидин.
4. Противотуберкулезные средства из группы антибиотиков:
1) изониазид; 2) пиразинамид; 3) рифампицин; 4) стрептомицин; 5) этамбутол.
5. При сифилисе применяют:
1) бензатина бензилпенициллин; 2) бензилпенициллина натриевую соль; 3) стрептомицин; 4) доксициклин; 5) азитромицин.
6. Действуют бактерицидно:
1) ципрофлоксацин; 2) линезолид; 3) сульфален; 4) ко-тримоксазол.
7. Действуют бактериостатически:
1) сульфадиметоксин; 2) моксифлоксацин; 3) сульфацетамид натрия; 4) линезолид.
8. Обладают широким спектром действия:
1) ципрофлоксацин; 2) ко-тримоксазол; 3) линезолид; 4) нитроксолин; 5) фуразолидон.
9. Действует преимущественно на грамположительные бактерии:
1) ломефлоксацин; 2) сульфален; 3) хиноксидин; 4) линезолид; 5) ципрофлоксацин.
10. Активен в отношении синегнойной палочки:
1) ко-тримоксазол; 2) ципрофлоксацин; 3) ломефлоксацин; 4) линезолид.
11. Активны в отношении микобактерий туберкулеза:
1) ломефлоксацин; 2) сульфален; 3) нитроксолин; 4) ципрофлоксацин.
12. При инфекциях мочевыводящих путей применяют:
1) линезолид; 2) сульфакарбамид; 3) нитроксолин; 4) нитрофурантоин; 5) нитрофурал.
13. При кишечных инфекциях применяют:
1) фталилсульфатиазол; 2) фуразолидон; 3) сульфацетамид натрия; 4) нитрофурал.

14. При пневмониях, бронхите применяют:
1) линезолид; 2) ко-тримоксазол; 3) ципрофлоксацин; 4) моксифлоксацин; 5) фталилсульфатиазол.

15. Побочные эффекты фторхинолонов:
1) судороги; 2) кристаллурия; 3) фотодерматозы; 4) нарушение формирования хрящевой ткани.

16. Побочные эффекты сульфаниламидов для резорбтивного применения:
1) аллергические реакции; 2) кристаллурия; 3) гематотоксичность; 4) ототоксичность.

Определите лекарственные препараты.

17. Синтетическое антибактериальное средство. Нарушает синтез бактериального белка за счет необратимого связывания с субъединицами 30S и 50S рибосом. Действует преимущественно на грамположительные бактерии, включая штаммы, устойчивые к макролидам и пенициллинам. Применяется при пневмониях, инфекциях кожи и мягких тканей.

1. Ципрофлоксацин. 2. Ко-тримоксазол. 3. Линезолид. 4. Сульфален.

18. Синтетическое антибактериальное средство. Нарушает обмен фолиевой кислоты. Действует бактерицидно. Препарат выбора при нокардиозе, пневмоцистной пневмонии. Применяется также при отитах, синуситах, пиелонефрите, простатите, инфекциях кожи и мягких тканей. Вызывает кожно-аллергические реакции, нарушения системы крови, кристаллурию.

1. Триметоприм. 2. Ко-тримоксазол. 3. Сульфадиметоксин. 4. Сульфален.

19. Синтетическое противотуберкулезное средство. Действует избирательно на микобактерии туберкулеза. Нарушает синтез миколовых кислот в клеточной стенке. При применении препарата возможно возникновение периферических невритов и психотических реакций.

1. Изониазид. 2. Пиразинамид. 3. Этамбутол. 4. Рифампицин.

Совместите.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Сульфаниламидный препарат для лечения бактериального конъюнктивита.

Б. Сульфаниламидный препарат сверхдлительного действия.

В. Синтетическое противотуберкулезное средство.

Ответы на тестовые задания

1-2,3,4. 2-1,3,4. 3-2,3,4. 4-3,4. 5-1,2,4,5. 6-1,4. 7-1,3,4. 8-1,2,4, 9-4. 10-2,3. 11-1,4. 12-2,3,4. 13-1,2. 14-1,2,3,4. 15-1,3,4. 16-1,2, 17-3. 18-2. 19-1. 20-В. 21-А. 22-Г. 23-Б. 24-Д.

Тема 14.5. Противогрибковые средства. Противовирусные средства
ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА Основные вопросы по теме
Классификация противогрибковых средств.

NB! Противогрибковые средства классифицируют по следующим принципам:

- происхождение (антибиотики, синтетические средства);
- клиническое применение (при системных микозах, дерматомикозах и кандидамикозе).

–

Средства, применяемые при дерматомикозах. Механизмы действия, особенности применения, побочные эффекты.

NB! К дерматомикозам относятся микроспория, трихофития и эпидермофития - грибковые поражения кожи и ее придатков (волос, ногтей), вызываемые патогенными грибами. При этих поражениях возможно применение противогрибковых средств в виде кремов и мазей, что позволяет снизить риск возникновения системных побочных эффектов.

ПРОТИВОВИРУСНЫЕ СРЕДСТВА

Основные вопросы по теме
Классификация противовирусных средств.

NB! Противовирусные средства классифицируют по следующим принципам:

- по происхождению (синтетические, биологические);
- по химической структуре;
- по тому, на какую стадию взаимодействия вируса с клеткой действуют;
- по механизму действия;
- по клиническому применению.

Противовирусные средства, применяемые при гриппе. Механизмы действия, особенности применения, побочные эффекты.

NB! Возбудители гриппа - РНК-содержащие вирусы (ортомиксовирусы). Выделяют вирусы гриппа типов А и В. При попадании в дыхательные пути эти вирусы продуцируют фермент - нейраминидазу, способствующую распространению вирусов по респираторному тракту. Процессы

депротеинизации вируса гриппа типа А связаны с участием вирусного М2-белка. В связи с указанными особенностями принципиальные возможности фармакотерапевтической коррекции инфекционного процесса при гриппе направлены на:

- ингибирование нейраминидазы;
- подавление функции М2-белка;
- стимуляцию выработки эндогенных интерферонов;
- применение препаратов интерферонов;
- подавление репликации вирусной РНК.

Противовирусные средства, применяемые при герпесе. Механизмы действия, особенности применения, побочные эффекты.

NB! Возбудители герпеса - ДНК-содержащие вирусы. Основной группой антигерпетических средств являются аналоги нуклеозидов. В зависимости от локализации и характера процесса при герпетической инфекции могут применяться лекарственные формы для местного применения (глазные капли, мази, кремы) или формы для резорбтивного действия (раствор для инъекций, таблетки).

Противовирусные средства, применяемые при ВИЧ-инфекции. Механизмы действия, особенности применения, побочные эффекты.

NB! ВИЧ относится к ретровирусам (РНК-содержащие вирусы). ВИЧ-протеаза (синтезируемая при попадании вируса в клетку хозяина) расщепляет полипротеин вируса на функциональные фрагменты (ферменты, структурные белки) и способствует образованию новых вирусных частиц. Обратная транскриптаза вируса способствует образованию копии ДНК на основе вирусной РНК. Эта ДНК, в свою очередь, может впоследствии служить матрицей для синтеза вирусной РНК и, соответственно, вирусных белков, поражающих Т-лимфоциты, что приводит к развитию иммунодефицита (СПИД). В связи с поражением Т-лимфоцитов снижается клеточный иммунитет. Это приводит к возникновению бактериальных, грибковых, вирусных инфекций, а также к развитию злокачественных новообразований.

Фармакотерапевтическая коррекция СПИДа предполагает:

- применение противовирусных средств, эффективных в отношении ВИЧ;
- применение антибактериальных, противогрибковых, противовирусных, противоопухолевых средств.

Средства, применяемые при цитомегаловирусной инфекции. Средства, применяемые при вирусном гепатите.

NB! Цитомегаловирусы относятся к ДНК-содержащим вирусам. Они вызывают ретиниты, пневмонии, поражения кишечника, инфекции новорожденных. В отношении цитомегаловирусов эффективны фоскарнет и ганцикловир, применяемые при ретинитах у больных СПИДом.

Гепаднавирусы (возбудители гепатита В и С) относятся к ДНК-содержащим вирусам. В отношении гепаднавирусов эффективны препараты интерферонов (интерферон- α -2b).

Задания для самоподготовки

Задание 1. Дополните классификацию противовирусных средств, применяемых при гриппе, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Ингибиторы вирусного белка М2:

Ингибиторы нейраминидазы:

Ингибиторы вирусной РНК-полимеразы:

Индукторы образования интерферонов:

Препараты интерферонов:

Задание 2. Решите ситуационную задачу.

Задание 3.

А. Объясните механизм действия ацикловира, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

Проникновение препарата в клетку.

Ингибирование трифосфатом вирусной ДНК-полимеразы.

Образование ди- и трифосфата под влиянием киназ клетки хозяина.

Образование монофосфата под влиянием вирусной тимидинкиназы.

Нарушение репликации вирусной ДНК.

Б. Объясните, почему ацикловир действует только на пораженные вирусом клетки.

Задание 4. Дополните классификацию средств, применяемых при ВИЧ-инфекции, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Ингибиторы обратной транскриптазы ВИЧ:

Ингибиторы ВИЧ-протеаз:

Тестовые задания для самоконтроля

Выберите правильные ответы.

1. Противогрибковые антибиотики:

1) амфотерицин В; 2) миконазол; 3) гризеофульвин; 4) нистатин; 5) натамицин.

2. Синтетические противогрибковые средства из группы азолов:

1) итраконазол; 2) кетоконазол; 3) тербинафин; 4) флуконазол; 5) клотримазол.

3. Нарушают проницаемость цитоплазматической мембраны грибов:

1) гризеофульвин; 2) амфотерицин В; 3) нистатин; 4) тербинафин; 5) флуконазол.

4. Нарушают синтез эргостерола за счет блокады 14-деметилазы ланостерина: 1) кетоконазол; 2) клотримазол; 3) миконазол; 4) тербинафин; 5) флуконазол.

5. Нарушает синтез эргостерола за счет блокады скваленэпоксидазы:

1) тербинафин; 2) клотримазол; 3) миконазол; 4) итраконазол; 5) флуконазол.

6. При системных микозах применяют:

1) амфотерицин В; 2) клотримазол; 3) флуконазол; 4) итраконазол; 5) тербинафин.

7. При дерматомикозах применяют:

1) гризеофульвин; 2) миконазол; 3) нистатин; 4) клотримазол; 5) тербинафин.

8. При кандидамикозе применяют:

1) нистатин; 2) натамицин; 3) ацикловир; 4) гризеофульвин; 5) флуконазол.

9. Внутривенно вводят только:

1) тербинафин; 2) амфотерицин В; 3) гризеофульфин; 4) нистатин; 5) натамицин.

10. Гепатотоксичность, гинекомастия могут возникать при применении:

1) тербинафина; 2) кетоконазола; 3) клотримазола; 4) миконазола.

11. Побочные эффекты амфотерицина В:

1) нефротоксичность; 2) гепатотоксичность; 3) нейротоксичность; 4) ототоксичность.

12. Депротейнизацию вируса угнетает:

1) ацикловир; 2) римантадин; 3) саквинавир; 4) зидовудин; 5) фоскарнет.

13. Репликацию вирусного генома угнетают:

1) ацикловир; 2) зидовудин; 3) осельтамивир; 4) рибавирин; 5) фоскарнет.

14. Синтез структурных белков вируса угнетает:

1) валацикловир; 2) зидовудин; 3) саквинавир; 4) римантадин; 5) ганцикловир.

15. Противовирусные средства, применяемые при гриппе:

1) римантадин; 2) осельтамивир; 3) ацикловир; 4) рибавирин; 5) арбидол.

16. Противовирусные средства, применяемые при герпесе:

1) ацикловир; 2) валацикловир; 3) зидовудин; 4) рибавирин; 5) осельтамивир.

17. Противовирусные средства, применяемые при ВИЧ-инфекции:

1) валацикловир; 2) зидовудин; 3) саквинавир; 4) римантадин; 5) рибавирин.

18. Средства, применяемые при цитомегаловирусной инфекции:

1) римантадин; 2) фоскарнет; 3) ацикловир; 4) ганцикловир; 5) рибавирин.

19. При вирусном гепатите применяют:

1) интерферон-альфа; 2) валацикловир; 3) зидовудин; 4) тилорон; 5) осельтамивир.

Совместите.

Проведите анализ врачебных рецептов.

А. Средство для лечения дерматомикозов.

Б. Средство для лечения поверхностного кандидамикоза.

В. Средство при герпетическом кератите.

Ответы на тестовые задания

1-1,3,4,5. 2-1,2,4,5. 3-2,3. 4-1,2,3,5. 5-1. 6-1,3,4. 7-1,2,4,5. 8-1,2,3,5. 9-2. 10-2,3,4. 11-1,3. 12-2. 13-1,2,4,5. 14-3. 15-1,2,4,5. 16-1,2,4. 17-2,3. 18-2,4. 19-1,4. 20-Д. 21-А. 22-Б. 23-В. 24-Г.

Тема 14.6. Противопротозойные средства. Противоглистные средства
ПРОТИВОПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА

Основные вопросы по теме:

Противопротозойные средства. Классификация по эффективности в отношении разных видов простейших.

NB! Ряд инфекционных процессов вызывают простейшие (protozoa). К протозойным инфекциям относятся: малярия, амебиаз (в том числе амебная дизентерия), токсоплазмоз, трипаносомозы (в том числе сонная болезнь), лейшманиоз, лямблиоз, трихомониаз. При некоторых протозойных инфекциях эффективны не только специфические противопротозойные средства, но и ряд антибактериальных препаратов.

Противомалярийные средства. Классификация по эффективности в отношении разных форм развития плазмодия и по применению.

NB! Фазы инфекционного процесса при малярии обусловлены циклом развития малярийного плазмодия. Так, инкубационный период (время между укусом комара и появлением клинических симптомов) обусловлен преэритроцитарным циклом развития плазмодия. Приступы малярии связаны с эритроцитарным циклом развития плазмодия. Параэритроцитарный цикл развития плазмодия при трехдневной малярии может обусловить рецидивы малярии. Инфекционно опасной малярией становится вследствие нахождения в крови гамет.

Противомалярийные средства, действующие на тканевые (преэритроцитарные и параэритроцитарные) формы плазмодия, называются гистошизотропными. Противомалярийные средства, эффективные в отношении эритроцитарных форм плазмодия, называются гематошизотропными, а эффективные в отношении половых форм плазмодия - гамонтотропными средствами.

Основные направления применения противомалярийных средств:
химиотерапия (проводится гематошизотропными средствами);
индивидуальная химиопрофилактика (проводится средствами, действующими на преэритроцитарные и эритроцитарные формы плазмодиев);
профилактика рецидивов (проводится средствами, действующими на параэритроцитарные формы плазмодиев);
общественная химиопрофилактика (проводится гамонтотропными средствами).

Противоамебные средства. Классификация по эффективности при разной локализации амёб.

Средства, применяемые при трихомониазе, лейшманиозе, лямблиозе и токсоплазмозе.

Лекарственные препараты по теме

А. Противомалярийные средства.

Б. Средства, применяемые при амёбиазе.

В. Средства, применяемые при лямблиозе, трихомониазе, токсоплазмозе, лейшманиозе.

Задания для самоподготовки

Задание 1. Дополните классификацию противомаларийных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Производные хинолина:

Производные пиримидина:

Тетрациклины:

Задание 2. Укажите основные показания к применению противомаларийных средств (табл. 14.10).

Таблица 14.10. Показания к применению противомаларийных средств

Показания к применению

Хлорохин Хинин Мефлохин Пириметамин Примахин

Лечение

Индивидуальная химио-профилактика

Профилактика рецидивов

Общественная химио-профилактика

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».

Задание 3

А. Дополните классификацию противоамебных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Препараты, эффективные при любой локализации амёб:

Препараты, эффективные при локализации амёб в просвете кишечника:

Препараты, эффективные при локализации амёб в просвете и стенке кишечника:

Препараты, эффективные при локализации амёб в стенке кишечника и печени:

Препараты, эффективные при локализации амёб в печени:

Б. Объясните механизм амебицидного действия тетрациклинов. Задание 4

А. Дополните классификацию противопрозоидных средств препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

Средства, применяемые при трихомониазе:

Средства, применяемые при лямблиозе:

Средства, применяемые при токсоплазмозе:

Средства, применяемые при лейшманиозе:

Б. Объясните механизм противопрозоидного действия метронидазола.
ПРОТИВОГЛИСТНЫЕ СРЕДСТВА Основные вопросы по теме

Противоглистные средства. Классификация по эффективности в отношении разных гельминтов, применение.

NB! Гельминтозы (глистные инвазии) могут возникать при заражении нематодами (круглыми червями), цестодами (ленточными червями), а также трематодами (сосальщиками).

По локализации гельминтозы принято разделять на кишечные и внекишечные.

Антигельминтные средства оказывают противопглистное действие за счет разных механизмов:

- паралича нервно-мышечной системы гельминтов;
- разрушения покровных тканей гельминтов;
- нарушения энергетических процессов гельминтов.

Лекарственные препараты по теме

Задание для самоподготовки

Дайте сравнительную характеристику некоторых антигельминтных средств (табл. 14.11).

Таблица 14.11. Сравнительная характеристика некоторых антигельминтных средств

Параметры сравнения	Мебендазол	Пирантел	Пиперазин	Левамизол	Празиквантел
---------------------	------------	----------	-----------	-----------	--------------

Паралич нервно-
Механизм мышечной системы действия гельминтов

Разрушение покровных тканей гельминтов

Нарушение энергетических процессов гельминтов Аскаридоз

Применение:

Энтеробиоз

Тениаринхоз

Трихоцефалез

Анкилостомидоз

Примечание. При заполнении таблицы используйте символ «+».
Тестовые задания для самоконтроля. Выберите правильные ответы.

Противомалярийные средства:

1) хлорохин; 2) примахин; 3) пириметамин; 4) метронидазол; 5) мефлохин.

Преэритроцитарные формы плазмодиев малярии подавляет:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Эритроцитарные формы плазмодиев малярии подавляют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Параэритроцитарные формы плазмодиев малярии подавляет:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Половые формы плазмодиев малярии подавляют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Для лечения (устранения клинических проявлений) малярии применяют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Для индивидуальной химиопрофилактики малярии применяют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Для профилактики рецидивов малярии применяют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

Для общественной химиопрофилактики малярии применяют:

1) мефлохин; 2) пириметамин; 3) примахин; 4) хинин; 5) хлорохин.

При кишечном амебиазе применяют:

1) метронидазол; 2) хиниофон; 3) хлорохин; 4) эметин; 5) доксициклин.

При внекишечном амебиазе применяют:

1) метронидазол; 2) хиниофон; 3) хлорохин; 4) эметин; 5) доксициклин.

При лямблиозе применяют:

1) метронидазол; 2) мепакрин; 3) пириметамин; 4) сульфален; 5) фуразолидон.

При трихомониазе применяют:

1) метронидазол; 2) тинидазол; 3) пириметамин; 4) сульфален; 5) фуразолидон.

При токсоплазмозе применяют:

1) метронидазол; 2) тинидазол; 3) пириметамин; 4) сульфален; 5) фуразолидон.

При кожном лейшманиозе применяют:

1) натрия стибоглюконат; 2) мепакрин; 3) сульфален.

16. При висцеральном лейшманиозе применяют:

1) метронидазол; 2) натрия стибоглюконат; 3) мепакрин; 4) сульфален.

При кишечных нематодозах применяют:

1) мебендазол; 2) левамизол; 3) пирантел; 4) пиперазин; 5) празиквантел.

При кишечных цестодозах применяют:

1) мебендазол; 2) левамизол; 3) пирантел; 4) пиперазин; 5) празиквантел.

Проведите анализ врачебных рецептов:

А. Средство, эффективное в отношении амеб любой локализации.

Б. Средство для лечения аскаридоза.

В. Средство для лечения энтеробиоза.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3,5. 2-2. 3-1,2,4,5. 4-3. 5-2,3. 6-1,2,4,5. 7-1,2,4,5. 8-3.
9-2, 10-1,2,4,5. 11-1,3,4. 12-1,2,5. 13-1,2,5. 14-3,4. 15-1,2. 16-2.
17-1, 2,3,4. 18-5.

Заключительное занятие по разделу «Противомикробные и противопаразитарные средства»

ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ Выберите правильные ответы.

1. Антибактериальные антибиотики:

1) пенициллин; 2) тетрациклины; 3) полимиксины; 4) полиены; 5) гликопептиды.

2. Синтетические антибактериальные средства:

1) ципрофлоксацин; 2) азитромицин; 3) фуразолидон; 4) нитроксолин; 5) ко-тримоксазол.

3. Синтез клеточной стенки бактерий нарушают:

1) бета-лактамы; 2) макролиды; 3) гликопептиды; 4) аминогликозиды.

4. Синтез белка на рибосомах бактерий нарушает:

1) азитромицин; 2) полимиксин В; 3) доксициклин; 4) хлорамфеникол; 5) линезолид.

5. Проницаемость цитоплазматической мембраны бактерий нарушают:

1) пенициллины; 2) монобактамы; 3) полимиксины; 4) карбапенемы; 5) азалиды.

6. Проницаемость цитоплазматической мембраны и синтез белка на рибосомах бактерий нарушают:

1) аминогликозиды; 2) цефалоспорины; 3) тетрациклины; 4) монобактамы; 5) хлорамфеникол.

7. Синтез бактериальной РНК нарушает:

1) стрептомицин; 2) азитромицин; 3) ванкомицин; 4) рифампицин; 5) клиндамицин.

8. Средства, нарушающие обмен фолиевой кислоты в бактериальной клетке:

1) сульфален; 2) моксифлоксацин; 3) фуразолидон; 4) триметоприм; 5) котримоксазол.

9. Нарушают суперспирализацию бактериальной ДНК за счет ингибирования ДНК-гиразы:

1) нитроксолин; 2) нитрофурантоин; 3) ломефлоксацин; 4) ципрофлоксацин; 5) моксифлоксацин.

10. Бактерицидное действие возникает вследствие нарушения:
- 1) синтеза клеточной стенки;
 - 2) синтеза белка;
 - 3) проницаемости цитоплазматической мембраны;
 - 4) синтеза РНК.
11. Бактериостатическое действие возникает вследствие нарушения:
- 1) синтеза клеточной стенки;
 - 2) синтеза белка;
 - 3) проницаемости цитоплазматической мембраны;
 - 4) синтеза РНК.
12. Бактерицидное действие проявляется:
- 1) лизисом бактериальных клеток;
 - 2) подавлением деления бактериальных клеток.
13. Антибиотики, действующие преимущественно бактерицидно:
- 1) бета-лактамы; 2) аминогликозиды; 3) гликопептиды;
 - 4) полимиксины; 5) макролиды.
14. Синтетические антибактериальные средства, действующие преимущественно бактерицидно:
- 1) цiproфлоксацин;
 - 2) линезолид;
 - 3) ко-тримоксазол;
 - 4) сульфадиметоксин;
 - 5) триметоприм.
15. Антибиотики, действующие преимущественно бактериостатически:
- 1) тетрациклины;
 - 2) макролиды;
 - 3) аминогликозиды;
 - 4) хлорамфеникол;
 - 5) линкозамиды.
16. Синтетические антибактериальные средства, действующие преимущественно бактериостатически:
- 1) сульфален;
 - 2) моксифлоксацин;
 - 3) линезолид;
 - 4) ко-тримоксазол;
 - 5) фталилсульфатиазол.
17. Действуют преимущественно на грамположительные бактерии:
- 1) биосинтетические пенициллины;
 - 2) цефалоспорины;
 - 3) полимиксины;
 - 4) оксазолидиноны.
18. Действуют преимущественно на грамотрицательные бактерии:
- 1) монобактамы;
 - 2) полусинтетические пенициллины;
 - 3) полимиксины;
 - 4) макролиды;
 - 5) линкозамиды.
19. Антибиотики широкого спектра действия:
- 1) цефалоспорины;
 - 2) аминогликозиды;
 - 3) тетрациклины;
 - 4) хлорамфеникол;
 - 5) линкозамиды.
20. Синтетические антибактериальные средства широкого спектра действия:
- 1) котримоксазол;
 - 2) нитроксилин;
 - 3) фуразолидон;
 - 4) линезолид;
 - 5) цiproфлоксацин.
21. Биосинтетические пенициллины применяют:
- 1) при сифилисе;
 - 2) при газовой гангрене;
 - 3) при сибирской язве;
 - 4) при стрептококковых инфекциях;
 - 5) при туберкулезе;
 - 6) при инфекциях, вызванных менинго- и пневмококками.

22. При стафилококковых инфекциях, устойчивых к биосинтетическим пенициллинам, применяют:

1) ампициллин; 2) оксациллин; 3) азлоциллин; 4) полимиксин; 5) азтреонам.

23. При инфекциях, вызванных синегнойной палочкой, применяют:

1) азлоциллин; 2) пиперациллин; 3) ванкомицин; 4) цефепим; 5) ципрофлоксацин.

24. При бактериальных инфекциях дыхательных путей применяют:

1) амоксициллин; 2) ко-тримоксазол; 3) моксифлоксацин; 4) цефотаксим; 5) хлорамфеникол; 6) азитромицин.

25. При кишечных инфекциях применяют:

1) эритромицин; 2) ампициллин; 3) фталилсульфатиазол; 4) ципрофлоксацин; 5) фуразолидон.

26. При инфекциях мочевыводящих путей применяют:

1) сульфакarbамид; 2) нитроксолин; 3) нитрофурантоин; 4) линезолид; 5) клиндамицин.

27. При стафилококковых инфекциях кожи и мягких тканей применяют:

1) азтреонам; 2) азитромицин; 3) цефепим; 4) эритромицин; 5) линкомицин.

28. При инфекциях, вызванных бактероидами, применяют:

1) метронидазол; 2) ципрофлоксацин; 3) ванкомицин; 4) гентамицин; 5) котримоксазол.

29. При сифилисе применяют:

1) бензатина бензилпенициллин; 2) азитромицин; 3) котримоксазол; 4) доксициклин; 5) цефтриаксон.

30. Тетрациклины применяют:

1) при туберкулезе; 2) холере; 3) бруцеллезе; 4) туляремии; 5) столбняке; 6) сыпном тифе.

31. В качестве противотуберкулезных средств применяют:

1) стрептомицин; 2) доксициклин; 3) рифампицин; 4) эритромицин; 5) ломефлоксацин.

32. Для эрадикации *Helicobacter pylori* применяют:

1) амоксициллин; 2) рокситромицин; 3) ванкомицин; 4) метронидазол; 5) кларитромицин.

33. Ототоксическое действие оказывают:

1) гентамицин; 2) доксициклин; 3) ванкомицин; 4) стрептомицин; 5) хлорамфеникол.

34. Гематотоксическое действие оказывают:

1) азитромицин; 2) хлорамфеникол; 3) ко-тримоксазол; 4) сульфален; 5) линезолид.

35. Нефротоксическое действие оказывают:

1) стрептомицин; 2) цефалексин; 3) амикацин; 4) полимиксин В; 5) клиндамицин.

36. Гепатотоксическое действие оказывают:

1) доксициклин; 2) цефтриаксон; 3) метациклин; 4) рифампицин; 5) хлорамфеникол.

37. Угнетающее влияние на нервно-мышечную передачу оказывают:

1) аминогликозиды; 2) макролиды; 3) тетрациклины; 4) рифампицин; 5) цефалоспорины.

38. Реакция обострения наиболее часто возникает при применении:

1) бактерицидно действующих антибиотиков; 2) бактериостатически действующих антибиотиков.

39. Противогрибковые антибиотики:

1) рифампицин; 2) амфотерицин В; 3) гризеофульвин; 4) нистатин; 5) ванкомицин.

40. Синтетические противогрибковые средства:

1) миконазол; 2) кетоконазол; 3) тербинафин; 4) натамицин; 5) итраконазол.

41. Противовирусные средства - аналоги нуклеотидов:

1) ацикловир; 2) римантадин; 3) ганцикловир; 4) рибавирин; 5) саквинавир.

42. Индукторы интерферона:

1) осельтамивир; 2) тилорон; 3) арбидол; 4) зидовудин; 5) саквинавир.

43. Противопротозойные средства:

1) метронидазол; 2) пириметамин; 3) сульфален; 4) тинидазол; 5) примахин

44. При амебиазе, трихомониазе, лямблиозе применяют:

1) мефлохин; 2) метронидазол; 3) примахин; 4) доксициклин; 5) тинидазол.

45. При лямблиозе и трихомониазе применяют:

1) метронидазол; 2) фуразолидон; 3) доксициклин; 4) тинидазол; 5) пириметамин.

46. Противоглистные средства:

1) левамизол; 2) мебендазол; 3) празиквантел; 4) пиперазин; 5) метронидазол.

Определите группы веществ и лекарственные препараты.

47. Нарушают синтез клеточной стенки бактерий. Действуют преимущественно на грамположительные микроорганизмы. Разрушаются пенициллиназой. Применяются для лечения сифилиса, стрептококкового фарингита, дифтерии, газовой гангрены, столбняка и профилактики сезонных обострений ревматизма. Могут вызывать реакции гиперчувствительности.

1. Биосинтетические пенициллины. 2. Полусинтетические пенициллины. 3. Гликопептиды. 4. Цефалоспорины. 5. Макролиды.

48. Нарушает синтез клеточной стенки бактерий. Обладает широким спектром действия. Неактивен в отношении синегнойной палочки. Разрушается пенициллиназой. Применяется при инфекциях верхних и нижних дыхательных путей, инфекциях мочеполовой системы, эрадикации *H. pylori*. Хорошо всасывается из ЖКТ, применяется только внутрь.

1. Оксациллин. 2. Ампициллин. 3. Амоксициллин. 4. Карбенициллин. 5. Амоксиклав.

49. Нарушает синтез клеточной стенки бактерий. Действует на грамположительные и грамотрицательные бактерии; эффективен в отношении синегнойной палочки, протей, штаммов кокков, продуцирующих бета-лактамазу. Вводится внутримышечно.

1. Цефазолин. 2. Цефалексин. 3. Цефуроксим. 4. Цефепим. 5. Цефаклор.

50. Действует бактерицидно, преимущественно на грамположительные бактерии. Эффективен в отношении метициллин-резистентных стафилококков. При тяжелых стафилококковых и стрептококковых инфекциях вводят внутривенно капельно, при псевдомембранозном колите - внутрь. Оказывает нефро- и ототоксическое действие.

1. Бензилпенициллина натриевая соль. 2. Оксациллин. 3. Тиенам. 4. Ванкомицин. 5. Цефотаксим.

51. Действуют бактерицидно, преимущественно на грамотрицательные бактерии. Применяют в основном местно при инфекциях глаз, ушей, кожи, а также для санации кишечника перед хирургическими операциями. Могут оказывать нейротоксическое и нефротоксическое действие.

1. Аминогликозиды. 2. Полимиксины. 3. Гликопептиды. 4. Монобактамы. 5. Карбапенемы.

52. Нарушают синтез белка на рибосомах бактерий. Действуют преимущественно бактериостатически. Активны в отношении кокков, гемофильной палочки, палочки дифтерии, бледной трепонемы, *H. pylori*, хламидий, микоплазм, уреоплазм. Применяют при инфекциях ЛОР-органов, дыхательных и мочевыводящих путей, кожи и мягких тканей.

1. Хлорамфеникол. 2. Аминогликозиды. 3. Макролиды. 4. Тетрациклины. 5. Линкозамиды.

53. Нарушают синтез белка на рибосомах бактерий. Действуют преимущественно бактериостатически. Активны в отношении кокков и бактериоидов. Хорошо проникают в костную ткань. Применяют при инфекциях ЛОР-органов, кожи и мягких тканей, стафилококковом остеомиелите. При применении часто возникает псевдомембранозный колит.

1. Хлорамфеникол. 2. Аминогликозиды. 3. Макролиды. 4. Тетрациклины. 5. Линкозамиды.

54. Антибиотик широкого спектра действия, нарушает синтез белка на рибосомах бактерий. Действует преимущественно бактериостатически. Применяют в качестве резервного препарата при бактериальном менингите, брюшном тифе, риккетсиозах, холере, сальмонеллезах. Угнетает кроветворение. Противопоказан новорожденным.

1. Хлорамфеникол. 2. Азитромицин. 3. Клиндамицин. 4. Доксициклин. 5. Гентамицин.

55. Синтетические антибактериальные средства широкого спектра действия. Являются антагонистами парааминобензойной кислоты и ингибиторами дигидроптероатсинтетазы. Применяются при токсоплазмозе, нокардиозе, бактериальных конъюнктивитах, при инфекциях кишечника, дыхательных и мочевыводящих путей. Вызывают аллергические реакции, кристаллурию, нарушения системы крови.

1. Фторхинолоны. 2. Сульфаниламиды. 3. Нитрофураны. 4. Оксазолидиноны.

56. Синтетические антибактериальные средства широкого спектра действия. Обладают малой терапевтической широтой и высокой токсичностью. Применяются при неэффективности других противомикробных средств. Назначают только взрослым.

1. Фторхинолоны. 2. Нитрофураны. 3. Производные хиноксалина. 4. Производные 8-оксихинолина. 5. Оксазолидиноны.

57. Нарушает репликацию ДНК микроорганизмов. Активен в отношении простейших и некоторых анаэробных бактерий. Применяется при протозойных инфекциях (амебиазе, трихомониазе, лямблиозе), инфекциях в зубоветеринарной практике, инфекциях тазовых органов, перитоните, при псевдомембранозном колите, для эрадикации *H. pylori* при язвенной болезни. Побочные эффекты: тошнота, рвота, металлический вкус во рту, нарушения системы крови, тетурамоподобная реакция при одновременном употреблении алкоголя.

1. Фуразолидон. 2. Метронидазол. 3. Нитроксолин. 4. Ципрофлоксацин. 5. Котримоксазол.

58. Действует избирательно на микобактерии (нарушает синтез миколевых кислот в клеточной стенке). Применяется внутрь или внутримышечно. Побочные эффекты: периферические невриты, бессонница, психотические реакции, реакции гиперчувствительности:

1. Изониазид. 2. Рифампицин. 3. Этамбутол. 4. Пиразинамид. 5. Стрептомицин.

59. Нарушает начальный этап синтеза эргостерола в цитоплазматической мембране грибов. Применяется внутрь и местно при дерматомикозах и поверхностном кандидамикозе. Побочные эффекты - тошнота, диарея, кожный зуд, головная боль.

1. Амфотерицин В. 2. Нистатин. 3. Гризеофульфин. 4. Кетоконазол. 5. Тербинафин.

60. Синтетический аналог тимидина. Активен в отношении ВИЧ. Препятствует образованию ДНК из вирусной РНК за счет блокады обратной транскриптазы вирионов. Применяется внутрь. Побочные эффекты: нарушения кроветворения, нарушения функций печени, бессонница, миалгии.

1. Ацикловир. 2. Ганцикловир. 3. Зидовудин. 4. Рибавирин. 5. Саквинавир.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3,5. 2-1,3,4,5. 3-1,3. 4-1,3,4,5. 5-3. 6-1. 7-4. 8-1,4,5. 9-3,4,5. 10-1,3,4. 11-2. 12-1. 13-1,2,3,4. 14-1,3. 15-1,2,4,5. 16-1,3,5. 17-1,4. 18-1,3. 19-1,2,3,4. 20-1,2,3,5. 21-1,2,3,4,6. 22-2. 23-1,2,4,5. 24-1,2,3,4,6. 25-2,3,4,5. 26-1,2,3. 27-2,3,4,5. 28-1,3. 29-1,2,4,5. 30-2,3,4,6. 31-1,3,5. 32-1,2,4,5. 33-1,3,4. 34-2,3,4. 35-1,2,3,4. 36-1,3,4. 37-1. 38-1. 39-2,3,4. 40-1,2,3,5. 41-1,3,4. 42-2,3. 43-1,2,4,5. 44-2,5. 45-1,2,4. 46-1-4. 47-1. 48-3. 49-4. 50-4. 51-2. 52-3. 53-5. 54-1. 55-2. 56-3. 57-2. 58-1. 59-5. 60-3.

Определите, верны ли следующие пары утверждений и есть ли связь между ними.

Антагонисты устраняют действие полных агонистов, потому что антагонисты обладают аффинитетом, но не обладают внутренней активностью.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4,5. 2-2,3,4,5. 3-1,2,4. 4-В. 5-Б. 6-А. 7-А. 8-В. 9-Б. 10-Г. 11-Б. 12 - В. 13 - А. 14- верно, верно, есть связь.

Ответы на тестовые задания

1-4. 2-4. 3-1. 4-4. 5-3. 6-2. 7-3. 8-Г. 9-В. 10-Б. 11-А. 12-верно, верно, есть связь. 13 - верно, верно, есть связь.

Ответы на тестовые задания

1-2,4. 2-1,3,4,5. 3-1. 4-1,2,3. 5-3. 6-Г. 7-А. 8-Б. 9-В. 10-верно, верно, есть связь. 11 - верно, верно, связи нет. 12 - верно, верно, есть связь.

ТЕМА 4.2.2. СРЕДСТВА, БЛОКИРУЮЩИЕ ХОЛИНЕРГИЧЕСКИЕ СИНАПСЫ

Ответы на тестовые задания

1-1,2,3,4,5.2-1,2,3,5.3-1,2,3,4.4-1,2.5-3.6-4.7-3.8-Б.9-В.10-А.

11 - верно, верно, есть связь. 12 - неверно, неверно, связи нет. 13 - верно, верно, связи нет.

Ответы на тестовые задания

1-1,2,4.2-2.3-1,2,3.4-3.5-1.6-Б.7-А.8-Д.9-Г.10-В.11-верно, верно, связи нет. 12 - верно, верно, есть связь. 13 - верно, неверно, связи нет.

Заключительное занятие по разделу «Средства, влияющие на эфферентную иннервацию»

Ответы на тестовые задания

1-3,5.2-4.3-1,2,4,6.4-2,4.5-2,3.6-1.7-2,4.8-1,2,4.9-4.10-1,2,4.

11-1,3,5.12-5.13-1,3.14-2,4,5.15-1,3.16-5.17-2.18-3,4.19-1,3,4,
5.20-2,4.21-2,4.22-1.23-3.24-2,4,5.25-2.26-1,4,5.27-3.28-2,
29-1.30-2,4.31-1.32-1,3,4.33-1,2.34-1,2.35-4.36-4.37-1,3.38-4,
39-1.40-3.41-1,3,4,5.42-2.43-2,4.44-4.45-2,4.46-1,3,5.47-1,2,
48-1.49-2.50-1,2.51-3.52-1,2,3.53-1,2,3,4.54-2.

Ответы на тестовые задания

1-1,3,6.2-2,4,5.3-6.4-5.5-2.6-1,2,3.7-1,2.8-1,4.9-2.10-1.11-
5.12-3.

СПИСОК ЛИТЕРАТУРЫ ДЛЯ ПОДГОТОВКИ К ЗАНЯТИЯМ

1. Карпова, С. В. Основы маркетинга : учебник для среднего профессионального образования / С. В. Карпова ; под общей редакцией С. В. Карповой. — Москва : Издательство Юрайт, 2023. — 383 с. — (Профессиональное образование). — ISBN 978-5-534-16682-8. — Текст : электронный // Образовательная платформа Юрайт [сайт]. — URL: <https://urait.ru/bcode/531482>

2. Коноплева, Е. В. Фармакология : учебник и практикум для среднего профессионального образования / Е. В. Коноплева. — 3-е изд., перераб. и доп. — Москва : Издательство Юрайт, 2023. — 428 с. — (Профессиональное образование). — ISBN 978-5-534-15989-9. — Текст : электронный // Образовательная платформа Юрайт [сайт]. — URL: <https://urait.ru/bcode/520597>

3. Майский, В. В. Фармакология с общей рецептурой : учебное пособие / В. В. Майский, Р. Н. Аляутдин. - 3-е изд., доп. и перераб. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2022. - 240 с.

4. Виноградов, В.М. Фармакология с рецептурой. Учебник / Е.Б. Каткова, Е.А. Мухин. - Санкт- Петербург: СпецЛит, 2023.

5. Аляутдин, Р. Н. Фармакология : учебник / Р. Н. Аляутдин, Н. Г. Преферанский, Н. Г. Преферанская ; под ред. Р. Н. Аляутдина. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2022 - 704 с.

6. Фармакология с общей рецептурой : 2023. - 464 с. : ил www.medcollegelib.ru

7. Пронченко, Г.Е. Путешествие в мир фармакогнозии / Пронченко Г.Е. ГЭОТАР-Медиа, 2022. - 176 с.

8. Гроссман, В.А. Фармацевтическая технология: учебное пособие / Гроссман В.А. 2012. - 320 с. :ил www.medcollegelib.ru

9. Кузнецова, Н.В. Клиническая фармакология: учебник / Н.В. Кузнецова. - 2-е изд., перераб. и доп. - М.: ГЭОТАР-Медиа, 2024. - 272 с.

10. Фармакология: учебник / под ред. Р.Н. Аляутдина. - 4-е изд., перераб. и доп. 2023. - 832 с.: ил www.medcollegelib.ru

11. Астафьев, В.А. Руководство к практическим занятиям по фармакологии / В.А. Астафьев, В.Н. Белоконь. - М.: «Медицина», 2024 – 176

12. Машковский, М. Д Лекарственные средства / М. Д. Машковский, 2023. – 371 с.

13. Перспективные лекарственные и пряно-ароматические растения / В. В. Титок, Л. В. Кухарева, И. Н. Тычина [и др.]. — Минск : Белорусская наука, 2023. — 288 с. — ISBN 978-985-08-3042-5. — Текст : электронный // Цифровой образовательный ресурс IPR SMART : [сайт]. — URL: <https://www.iprbookshop.ru/135982.html>. — Режим доступа: для авторизир. Пользователей

14. Ракшина, Н. С. Основы фармакологии : учебное пособие для СПО / Н. С. Ракшина. — Саратов : Профобразование, 2020. — 113 с. — ISBN 978-5-4488-0860-9. — Текст : электронный // Цифровой образовательный ресурс IPR SMART : [сайт]. — URL: <https://www.iprbookshop.ru/96560.html>. — Режим доступа: для авторизир. пользователей