

**М.И. Лешихин, А.Н. Романова
Е.А. Романова**

**ВВЕДЕНИЕ
В ЛЕКАРСТВОВЕДЕНИЕ**

МИНИСТЕРСТВО ОБРАЗОВАНИЯ И НАУКИ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ
Федеральное государственное бюджетное образовательное
учреждение высшего профессионального образования
«Челябинский государственный педагогический университет»

**М.И. Лешихин, А.Н. Романова
Е.А. Романова**

ВВЕДЕНИЕ В ЛЕКАРСТВОВЕДЕНИЕ

Челябинск 2015

УДК 615 (021)
ББК 52. 81я 73
Л. 53

Лешихин, М.И.

Введение в лекарствоведение: учебное пособие / М.И. Лешихин, А.Н. Романова, Е.А. Романова. – Челябинск: Изд-во Челяб. гос. пед. ун-та, 2015. – 115 с.

ISBN 978-5-906777-60-7

Учебное пособие предназначено для студентов бакалавриата и магистратуры гуманитарных, социальных и естественнонаучных факультетов, изучающих учебные курсы биолого-медицинского блока: «Безопасность жизнедеятельности», «Основы медицинских знаний и здорового образа жизни», «Основы социальной медицины», «Культура здоровья», «Тьютор по здоровьесбережению», «Доврачебная помощь» и другие, а также для тех, кто заинтересован в собственном здоровье, здоровом образе жизни и его пропаганде среди учащихся и населения нашей области.

Рецензенты:

А.Г. Макаренко, д-р пед. наук, доцент

В.И. Павлова, д-р биол. наук, профессор

ISBN 978-5-906777-60-7

© Лешихин М.И., Романова А.Н.,
Романова Е.А., 2015

© Издательство Челябинского
государственного педагогическо-
го университета, 2015

ОГЛАВЛЕНИЕ

| | |
|---|----|
| ВВЕДЕНИЕ | 5 |
| 1. ОБЩИЕ ПРЕДСТАВЛЕНИЯ О ЛЕКАРСТВАХ | 9 |
| 1.1. Твердые лекарственные формы | 11 |
| 1.2. Жидкие лекарственные формы | 25 |
| 1.3. Мягкие лекарственные формы | 28 |
| 1.4. Лекарственные формы для инъекций | 32 |
| 1.5. Общие правила приема лекарственных средств | 32 |
| 2. ПОНЯТИЕ О ДОЗАХ. ДОЗЫ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ | 35 |
| 3. ЧТО ТАКОЕ РЕЦЕПТ? СОДЕРЖАНИЕ И СТРУКТУРА РЕЦЕПТА | 39 |
| 4. ЧТО ТАКОЕ СИНОНИМЫ? ЧЕМ СИНОНИМЫ ОТЛИЧАЮТСЯ ДРУГ ОТ ДРУГА | 44 |
| 5. ПУТИ ВВЕДЕНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ В ОРГАНИЗМ | 47 |
| 5.1. Энтеральный путь введения лекарственных средств в организм | 47 |

5.2. Парентеральный путь введения лекарственных средств (минуя желудочно-кишечный тракт) 50

| | |
|--|------------|
| 6. УЧЕНИЕ «О СУДЬБЕ» ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ В ОРГАНИЗМЕ..... | 52 |
| 6.1. Фармакокинетика | 52 |
| 6.2. Фармакокинетика | 60 |
| 6.3. Особенности действия лекарственных веществ | 63 |
| 7. ЛЕКАРСТВА НАШЕГО ОРГАНИЗМА | 90 |
| 8. БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ДОБАВКИ | 95 |
| 9. СРЕДСТВА МЕДИКАМЕНТОЗНОЙ ЗАЩИТЫ ПРИ ЧРЕЗВЫЧАЙНЫХ СИТУАЦИЯХ | 101 |
| КРАТКИЙ ТЕРМИНОЛОГИЧЕСКИЙ СЛОВАРЬ | 109 |
| БИБЛИОГРАФИЧЕСКИЙ СПИСОК | 113 |

ВВЕДЕНИЕ

Важное место в жизни человека занимают лекарства. К их помощи человек обращается постоянно. И вовсе не надо быть хроническим больным. Самый здоровый человек может простудиться, порезать палец, у него может заболеть голова или живот. И тут понадобятся лекарства. Современная клиническая медицина своими достижениями в значительной степени обязана лекарствам. Миллионам людей лекарства помогли избавиться от многих инфекционных и неинфекционных заболеваний, восстановить здоровье, сохранить жизнь. В медицинской практике используются десятки тысяч лекарственных средств. Изучением действия лекарств на организм человека и животных занимается **фармакология** (от греч. *pharmakon* – лекарство и *logos* – учение). В настоящее время фармакология изучает закономерности взаимодействия различных физиологических систем организма с лекарственными средствами и занимается разработкой и изысканием новых лекарственных средств. Основными разделами фармакологии являются *фармакодинамика* и *фармакокинетика*. Фармакодинамика изучает различные аспекты взаимодействия лекарственных средств с организмом, а фармакокинетика изучает движение лекарственных веществ в организме. Известный фармаколог М.Д. Машковский писал: «Значение знания механизмов действия лекарственных средств трудно переоценить. Оно способствует рационализации фармакотерапии, правильному выбору лекарственных средств, пони-

манию того, что врач делает своими лекарствами в организме больного». В разных клинических случаях задача лекарственных веществ различна: симптоматическая (прием маалокса при изжоге, нитроглицерина при стенокардии, анальгетика при приступе боли и т.п.); этиологическое лечение (прием антибиотика при инфекции и т.п.), патогенетическое (нейротропные, вазотропные, ноотропные и др. препараты). В то же время врач ставит задачу хотя бы приблизить состояние больного к здоровому и усилить аноцентрические механизмы у больного. Этому способствуют витамины, ферментные препараты, БАДы (биологически-активные добавки).

Но мы постоянно сталкиваемся с одним парадоксом: создав лекарства практически от всех болезней, человечество не стало здоровее и поэтому потребность в лекарствах только растет. Становится все больше и больше серьезных осложнений и побочных действий, вызываемых лекарствами. Почти у 20% людей, получающих лекарственные средства, возникают лекарственные осложнения. По мнению ВОЗ «лекарственная болезнь» – одна из серьезнейших проблем нашего времени. Причинами этого являются нерациональное применение лекарственных средств; необоснованность применения их там, где можно обойтись без сильных лекарственных препаратов; прием одновременно нескольких лекарственных препаратов.

В противоположность «лекарственной болезни» существует отрицание лекарственных препаратов – «химии» – и увлечение траволечением. Свобода покупки лекарственных веществ, трав и БАДов в аптеке диктуется объемом знаний человека о болезнях и способах помощи, а также уровнем тревожности больного человека. Это приводит к самолечению, процессу, когда исключаются правильная диагностика болезни, адекват-

ватное лечение, у больного создается неправильное отношение к болезни.

Мы можем констатировать, что лекарства, как и многое другое на этом свете, имеют свои плюсы и минусы, слабые и сильные стороны, которые определяют их пользу и вред, терапевтический эффект и риск осложнений.

К основным видам лекарственной терапии относятся:

1. Этиотропная терапия (от греч. *aetha* – причина и *tropo* – направляю), её еще называют каузальной (причинной). Она направлена на устранение или снижение действия причинного фактора болезни, например при инфекционных заболеваниях (так, антибиотики действуют на бактерии) или при отравлениях (антидоты вступают в прочную связь с различными токсическими веществами и ослабляют или полностью снимают токсический эффект).

2. Патогенетическая терапия (от греч. *pathos* – болезнь и *genesis* – происхождение) направлена на устранение или снижение молекулярных механизмов возникновения болезни и последующих клеточных механизмов развития болезни. Лечение подавляющего большинства немикробных и непаразитарных заболеваний осуществляется именно этим путем. Например: противовоспалительное действие аспирина (ацетилсалициловой кислоты) обусловлено подавлением синтеза простагландинов, которые вызывают развитие отеков, покраснение тканей и чувство боли при воспалительных реакциях.

К средствам патогенетической терапии следует отнести большую группу лекарственных препаратов заместительного действия (ферментные и гормональные препараты, витамины и препараты минерального происхождения, которые восполняют недостаток эндогенных веществ, например: железа, йода и т.д.).

Препараты заместительной терапии не влияют на причины болезни, но обеспечивают относительно нормальное существование организма. Например, инсулин не влияет на причину сахарного диабета, но обеспечивает нормальный обмен углеводов в организме человека.

3. Симптоматическая терапия направлена на устранение или ограничение отдельных проявлений болезни. Например, применение обезболивающих средств, при головной боли, употребление вяжущих средств, при поносах и т.д. Лекарственные препараты, устраняющие отдельные проявления болезни, не влияют на главный механизм болезни. К этому виду терапии следует отнести фитотерапию (лечение лекарственными растениями) и гомеопатию (система лечения, основанная на применении ничтожно малых доз ЛВ).

4. Профилактическое (превентивное) применение лекарственных средств имеет в виду предупреждение определенных заболеваний, например, инфекционных. С этой целью применяют дезинфицирующие вещества, различные вакцины и сыворотки, витамины и др.

Задачами данного пособия являются следующие:

- систематизировать знания студентов об основных понятиях и положениях современной фармакологии;
- повысить общекультурную компетенцию в области лекарствоведения и практического использования лекарственных средств;
- помочь студентам и магистрантам в повышении и укреплении профессиональных компетенций в таких дисциплинах, как «Основы медицинских знаний и здорового образа жизни», «Безопасность жизнедеятельности», «Социальная медицина» и другие.

1. ОБЩИЕ ПРЕДСТАВЛЕНИЯ О ЛЕКАРСТВАХ

Понятие «лекарство» (от древнегреческого *pharmakon*, что одновременно означало и яд и лекарство) появилось в V–IV веках до н.э.

Современное определение лекарства звучит следующим образом.

Лекарство – это сложная физико-химическая система, представляющая собой совокупность лекарственных веществ и фармацевтических факторов (лекарственных форм и технологий), призванная обеспечить при приеме максимальный терапевтический эффект при минимуме дозировки и без побочных действий. В повседневной жизни мы все лекарственные средства и лекарственные препараты называем лекарствами, или медикаментами, но в законодательстве РФ понятия «лекарство» и «медикамент» отсутствуют.

Федеральным законом от 22.06.98. №86-ФЗ «О лекарственных средствах» даны определения лекарственным средствам и лекарственным препаратам. Согласно данным определениям **лекарственные средства (ЛС)** – вещества, применяемые для профилактики, диагностики, лечения болезни, предотвращения беременности, полученные из крови, плазмы крови, а также органов, тканей человека или животного, растений, минералов методами синтеза или с применением биологических технологий. К лекарственным средствам относятся также вещества растительного, животного или синтетического происхождения, обладающие фармакологической активностью и предна-

значенные для производства и изготовления лекарственных средств (фармацевтические субстанции). Все лекарственные средства подразделяются на три группы:

1) список А (***Venena*** – яды), или группа А, в нее включены высокотоксичные и наркотические вещества;

2) список В (***Heroica*** – сильнодействующие), или группа Б, к ней относятся антибиотики, алкалоиды, снотворные и др.;

3) лекарственные препараты, отпускаемые без рецепта врача, чаще всего это готовые лекарственные средства (ГЛС) заводского производства.

Лекарственные препараты – дозированные лекарственные средства, готовые к употреблению.

Лекарственное вещество (ЛВ) – это химическое соединение или биологическое вещество, обладающее лечебными свойствами и используемое как лекарственное средство.

Лекарственная форма – это придаваемое лекарственному средству или лекарственному сырью состояние, удобное для применения и обеспечивающее максимальный лечебный или профилактический эффект. Классифицируются они в зависимости от внешнего вида, консистенции, способов применения, дозировки и т.д. (Рис.1).

Лекарственные формы бывают дозированные и не дозированные, для внутреннего и наружного применения, пролонгированного (продленного) или не пролонгированного действия.

Лекарственные формы обеспечивают широту спектра действия лекарственных средств, разнообразие путей введения их в организм и они должны соответствовать особенностям клинического течения заболевания.

Для каждого лекарственного препарата существует инструкция по применению. В ней указывается торговое название, например, Диротон®, его международное непатентованное название – лизиноприл – и лекарственная форма – таблетки.

Обязательно указывается активное вещество или несколько веществ и вспомогательные вещества, приводится описание лекарственной формы.

В инструкции есть указание на фармакотерапевтическую группу, описывается фармакодинамика и фармакокинетика данного лекарственного средства. Обязательно описываются показания и противопоказания к применению, возможные побочные действия, способы применения и дозы. В отдельных случаях показано взаимодействие данного лекарственного вещества с другими лекарственными средствами. Для сердечных, седативных, обезболивающих и некоторых других средств указывается влияние препарата на способность управлять автомобилем и другими механизмами. Точное следование инструкции обеспечивает успех лечения и высокий терапевтический эффект.

1.1. Твердые лекарственные формы

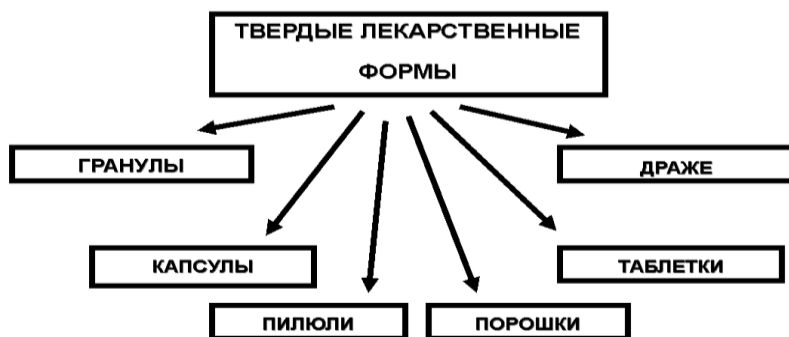


Рис. 1. Классификация твердых лекарственных форм

Таблетки (лат. *tabullettae* от *tabula* – доска) – это твердая дозированная лекарственная форма, получаемая прессованием порошков и гранул, содержащих одно или несколько лекарственных веществ (ЛВ) с добавлением или без добавления вспомогательных компонентов.

Таблетки относительно молодая лекарственная форма, которой чуть более ста лет. В Европе таблетки появились в 90-е годы XIX века и к середине XX века превратились в основную единицу фармакотерапии, захватив более 50 % объема всех отпускаемых из аптек лекарственных форм. По внешнему виду они представляют собой круглые или четырехугольные (с закругленными углами) пластинки с плоской или двояковыпуклой торцевой поверхностью. Размер таблеток от 3 до 25мм в диаметре, толщина в пределах 25–40 % от диаметра. Иногда таблетки бывают цилиндрической формы.

Достоинствами таблеток являются малый объем, возможность точного дозирования и маскировки неприятных органолептических свойств ЛВ, например, горького вкуса, локализация действия ЛВ, удобство хранения и др. К недостаткам следует отнести возможность механического разрушения или цементирования при хранении, затруднение при проглатывании у детей, наличие в оболочке таблетки вещества, которое может вызывать аллергическую реакцию (лактоза, сахар).

Классифицируют таблетки по разным признакам:

- по пути введения в организм: пероральные, оральные, вагинальные, уретральные;
- по наличию оболочки: покрытые оболочкой, непокрытые оболочкой;

– по признаку готовности к применению: готовые лекарственные формы, полуфабрикаты для приготовления растворов или суспензий;

– в зависимости от биофармацевтических и фармакокинетических свойств: обычные, с модифицированным высвобождением;

– по способу изготовления: прессованные (собственно таблетки) и формованные.

Кроме того таблетки бывают гомеопатические, ветеринарные, детские, делимые, разноцветные, цветные, капсулоподобные и маркированные.

Таблетки диаметром более 9 мм, имеют одну или две перпендикулярные друг другу риски (насечки), что позволяет разделить таблетку на две или четыре части и таким образом варьировать дозировку лекарственного средства. Такие таблетки называются делимыми.

Для приготовления раствора или суспензии, используются так называемые измельчаемые таблетки.

Покрытые таблетки покрывают оболочкой из одного или нескольких слоев вспомогательных веществ природного или синтетического происхождения, иногда с добавлением к веществам, образующим покрытие лекарственных или поверхностно-активных веществ. В зависимости от состава и способа нанесения различают покрытия: дражированные, пленочные, прессованные; а в зависимости от среды, в которой должно раствориться покрытие: гастросолюбильные (растворимые в желудке) и энтеросолюбильные (кишечнорастворимые).

Таблетки кишечнорастворимые (таблетки желудочно-резистентные), устойчивы в желудочном соке и высвобождают

лекарственное вещество или вещества в кишечном соке. Получают их путем покрытия желудочно-резистентной или кишечнорастворимой оболочкой, прессованием гранул и частиц, предварительно покрытых желудочно-резистентной или кишечнорастворимой оболочкой, прессованием лекарственных веществ в смеси с желудочно-резистентным наполнителем (дурулы) или наполнителем, устойчивым в кислой среде.

Существуют таблетки с пленочным покрытием. Они покрыты тонкой оболочкой (пленочкой), составляющей менее 10 % от массы таблетки. Покрытия пленочные могут быть растворимыми в воде (из растворов природной целлюлозы, полиэтиленгликолей, желатина и гуммиарабика и др.) и нерастворимыми в воде, или лаками (из некоторых высокомолекулярных соединений)

Таблетки с модифицированным высвобождением – покрытые или непокрытые – содержат специальные вспомогательные вещества (которые могут быть полученные по особой технологии), что позволяет программировать скорость или место высвобождения лекарственного вещества. Термин используется для обозначения таблеток с контролируемым высвобождением, таблеток с замедленным высвобождением, таблеток с постепенным высвобождением и др. Термин не используется для наименования таблеток, обозначаемых как таблетки-депо, таблетки имплантируемые, таблетки **ретард**, таблетки **рапид ретард**.

Таблетки **ретард** – это таблетки с пролонгированным (периодическим) высвобождением лекарственного вещества из запаса. Обычно представляют собой микрогранулы с лекарственным веществом, окруженные биополимерной матрицей

(основой). У этих таблеток послойно растворяются основа или микрогранулы, высвобождая очередную порцию лекарственного вещества.

Таблетки **рапид ретард** – это таблетки с двухфазным высвобождением, содержащие смесь микрогранул с быстрым и с пролонгированным высвобождением лекарственного вещества.

Капсула-спансула – капсула для внутреннего применения, содержащая смесь микродраже с различным временем высвобождения лекарственных веществ

Микродраже (*microdrageé*) – твёрдая дозированная лекарственная форма для внутреннего применения. Микродраже получают путём нанесения лекарственного средства и сахарного сиропа (как склеивающего компонента) на мелкий сахарный песок или путём суспензирования порошкообразного лекарственного средства в расплавленной смеси, покрывающей средств (например, воска или стеариновой кислоты). Микродраже имеют диаметр 30–50 мкм и могут быть покрытыми и непокрытыми. В зависимости от соотношения лекарственного и покрывающих веществ получают микродраже с различным временем освобождения лекарственного вещества; добавляя эмульгаторы (например, лецитин, твины), можно изменять скорость освобождения лекарственного вещества.

В зависимости от дозировки лекарственного вещества выделяют:

- Таблетки-мите (*mite*) – таблетки с минимальной дозировкой и слабо выраженным действием лекарственного вещества.
- Таблетки-семи (*semi*) – таблетки со средней дозировкой и средне выраженным действием лекарственного вещества.

- Таблетки-форте (forte) – таблетки с высокой дозировкой и сильно выраженным действием лекарственного вещества.

Таблетированные формы имеют широкий спектр применения.

Таблетки обычно хранят во флаконах или в конвалютах.

В зависимости от назначения и способа применения таблетки могут быть разных видов.

По способу применения выделяют:

1. Таблетки оральные (оромукозальные), которые предназначены для применения в полости рта. Они медленно растворяются в слюне, высвобождая ЛВ, которое оказывает местное (слизистая оболочка рта, глотки или желудка) или резорбтивное действие.

Различают такие виды оральных таблеток:

- буккальные (защечные), которые помещают между десной и внутренней поверхностью щеки, например, сустабуккал;

- таблетки сублингвальные (подъязычные) которые помещают под язык, например: валидол, глицин;

- таблетки для рассасывания (сосательные), которые медленно растворяются в слюнной жидкости, содержат вкусовые добавки, например: фарингосепт, пектусепт;

- таблетки жевательные предназначены для разжевывания перед глотанием. Содержат лекарственные вещества, которые оказывают действие на слизистую рта или желудочно-кишечного тракта, а также вкусовые добавки. К жевательным таблеткам относятся такие, как биофор, дисфлатил и др.

2. Таблетки пероральные предназначены для приема внутрь путем проглатывания. Они подразделяются по месту высвобождения ЛВ на растворимые в желудке и на кишечнорастворимые.

творимые. Принимают их целиком или после разделения, запивая водой. Высвобождение ЛВ в пищеварительном тракте происходит немедленно или через определенное время.

3. Таблетки вагинальные (суппозитории вагинальные прессованные) – таблетки для введения во влагалище, получаемые прессованием гранулированного порошка, который представляет собой переработанную жировую суппозиторную массу. Для лучшего введения могут иметь тонкую жировую оболочку, например, клотримазол. Кроме вагинальных нашли применение и прессованные уретральные и ректальные лекарственные формы.

4. Таблетки глазные (окулеты) имеют маленький размер, стерильны, предназначены для закладывания под нижнее веко, могут использоваться для приготовления глазных капель.

5. Таблетки имплантируемые (таблетки-депо, имплантат) – стерильные таблетки с пролонгированным высвобождением. Имеют форму маленького диска или цилиндра, вводятся под кожу.

Есть таблетки, которые не предназначены для непосредственного ввода в организм человека, например, шипучие таблетки, предназначенные для растворения или диспергирования лекарственного средства в воде непосредственно перед приемом; они содержат кислотные вещества и карбонаты или гидрокарбонаты, которые быстро реагируют в воде с выделением двуокси углерода.

Есть таблетки для приготовления капель, пасты, раствора. Таблетки для приготовления инъекционного раствора должны быть стерильными.

Отдельную группу составляют таблетки, применимые в детской практике (педиатрические).

Рассмотрим группу таблеток, покрытых оболочкой.

Таблетки покрытые оболочкой подразделяются на две группы: однослойные и многослойные. **Однослойные** бывают с нейтральной оболочкой, позволяющей нейтрализовать неприятный вкус или запах (горький вкус акрихина, запах рыбьего жира и т.д.), с пленочной оболочкой для защиты лекарственных веществ от разрушающего действия влаги, света и кислорода, кислотоустойчивой оболочкой для защиты лекарственного вещества от воздействия желудочного сока и пищевых ферментов и для защиты слизистой оболочки желудка. **Многослойные** состоят из двух слоев, имеющих разный состав. В одном случае оба слоя кислотоустойчивы, но растворяются они в разных отделах пищеварительного тракта, например, *панзенорм*: в желудке высвобождаются ферменты, расщепляющие белки и жиры, в кишечнике высвобождаются панкреатин и желчные кислоты и таким образом обеспечивается двустадийное переваривание пищи. В другом случае двуслойная оболочка может содержать одно лекарственное вещество, но растворение оболочек и выделение лекарственного вещества происходит в два этапа и в разное время, например, *левомицитин prolongatum*: первый слой растворяется сразу с выделением части лекарственного вещества, а второй слой (внутренний кислотоустойчивый) – в кишечнике в течение 6 часов, что обеспечивает постоянную концентрацию лекарственного вещества.

Надо знать некоторые правила рационального приема таблеток, покрытых оболочкой.

Такие таблетки нельзя делить, измельчать или разжевывать, так как при этом может, во-первых, наступить инактивация (разрушение) ЛВ, во-вторых, при измельчении таких таблеток возможно усиление раздражающего действия на слизистые желудка (диклофенак, трентал, ибупрофен, диазолин, ноотропил, пироксикам и др.), в третьих, при измельчении могут проявиться несвойственные данному ЛВ эффекты (например, либексин, дипрофен вызывают анестезию слизистой рта и языка, что может нарушить процесс глотания и испугать больного, а это просто побочный эффект, скрываемый оболочкой), в четвёртых, покрытые оболочкой, таблетки нельзя запивать спиртосодержащими жидкостями, например, пивом, или принимать сразу после употребления спиртных напитков, так как алкоголь растворяет оболочки и изменяет терапевтический эффект, аналогично действуют щелочные жидкости (раствор пищевой соды, молоко, минеральная вода).

Кишечнорастворимые таблетки надо принимать за 30–40 минут до еды, т.е. на пустой желудок, а покрытые оболочками препараты заместительной терапии (фестал, мезим, меркензим и др.) – непосредственно перед едой или вместе с пищей.

В аптеках есть таблетки **ретарды** (от английского *retard* – медленный). Таблетки **ретарды** – это пролонгированные (длительно действующие) лекарственные формы. К ним относятся сустак, нитронг, коринфар-ретард и др. Это средства с запрограммированным местом и временем высвобождения ЛВ. Основным способом получения таких лекарственных форм является микрокапсулирование ЛВ. Микрокапсулы – это мельчайшие частицы ЛВ, покрытые оболочками разной толщины и растворимости. Для получения таблеток микрокапсулы запрессовы-

вают в основу из твердого жира (воска). Соотношение микрокапсул с различными оболочками задает время и место высвобождения ЛВ. Принцип действия таблеток с микрокапсулами можно рассмотреть на примере сердечного средства – «сустак». В зависимости от толщины оболочки и ее растворимости часть ЛВ (нитроглицерин) высвобождается сразу же после приема во рту и оказывает действие через 10–15 минут, но большая часть таблетки растворяется в желудке и микрокапсулы попадают в кишечник, где они постепенно растворяются и обеспечивают поддерживающую дозировку нитроглицерина в крови в течение 3–4 часов.

Помимо таблеток пролонгированное действие за счет микрокапсулирования имеют и **капсулы-спансулы** (капсулы-ретарды), например, колдакт. Эти лекарственные формы содержат микрокапсулы одного или нескольких ЛВ с различными оболочками, помещенные в желатиновые капсулы. Крышечка капсулы может быть прозрачной, тогда внутри видны белые или цветные шарики – **микродраже**. Различные оболочки позволяют пролонгировать действие лекарственной формы до 12–24 часов или предотвратить взаимодействие ЛВ между собой.

Еще более сложной ретардной лекарственной формой является **рапид-ретард** (от англ. *rapid* – быстрый и *retard* – медленный). Такие таблетки (адалат-PP) обеспечивают быстро наступающий и длительно действующий эффект за счет содержащихся в них двух фаз: микронизированного порошка и микрокапсул с постепенным высвобождением ЛВ. Они дают лечебный эффект в течение 12–24 часов, при этом в крови или тканях организма поддерживается постоянная концентрация препарата длитель-

ное время, что позволяет избежать или уменьшить побочные действия, так как они всегда дозозависимые.

Каждая из описанных лекарственных форм содержит четкую программу высвобождения ЛВ и поэтому таблетки-ретарды, капсулы-спансулы нельзя делить, измельчать, разжевывать, их следует принимать только целиком.

Терапевтический эффект таких лекарственных форм обеспечивается не многократным приемом, а дозировкой.

Дозировка может обозначаться разными способами: цифрами содержания действующего вещества в граммах, миллиграммах или словами «mite» – (мало), «semi» – (средне) или «forte» – (много). Поэтому нельзя принимать 1/2 таблетки «forte» если выписано (назначено) «mite», но и две таблетки «mite» неэквивалентны одной таблетке «forte». Из-за невозможности деления таблетки-ретарды и капсулы-спансулы не рекомендуется назначать детям до 12 лет. При приеме их следует запивать небольшим количеством воды, чтобы обеспечит быстрое всасывание и действие первой дозы ЛВ.

Еще более сложными являются таблетки **дурулы** (durules), или **матрицы**, их также называют каркасные, или скелетные, таблетки. По строению их можно сравнить с губкой, поры которой заполнены ЛВ.

Высвобождение ЛВ не зависит от pH (кислотности) и наполнения пищеварительного тракта пищей, а определяется только скоростью диффузии, зависящей от величины пор матрицы. У таких таблеток каркас может быть жесткий или полужесткий.

Пустая матрица выводится из организма с калом без изменений и это не должно пугать или настораживать больного.

Таблетки-дурулы обладают пролонгированным действием. В аптеках в виде матричных таблеток представлены препараты теофиллина, хинидина и др.

Последним словом фармацевтической индустрии являются «терапевтические системы». В них пролонгированное до 24 часов и равномерное высвобождение ЛВ происходит под влиянием осмотических сил (направленного движения воды через полупроницаемую мембрану-оболочку внутрь таблетки), что позволяет уменьшить побочное действие ЛВ более чем на 30 %, такие таблетки называются **осмотически** действующими и этот признак отражается в названии препарата, например, осмоадалат.

Чаще всего фирма, производящая лекарственную форму, держит в секрете используемую технологию и просто указывает на этикетке «pro-longatum» (пролонгированная лекарственная форма, например, сальбутамол-prolongatum) и кратность приема (1–2 раза в сутки).

Основные обозначения модифицированных таблеток:

- retard – длительное и медленное действие;
- RR – rapid-retard – быстро наступающий длительный эффект;
- ретард – «mite» – малая доза лекарственного вещества;
- ретард – «forte» – большая доза лекарственного вещества;
- durulx (duro) – равномерное и длительное высвобождение ЛВ;
- HBS – осмо-таблетки, пролонгированное равномерное высвобождение ЛВ (до 24 часов);

- prolongatum – (или long) – длительное высвобождение ЛВ;
- MB – модифицированное высвобождение ЛВ;
- SR – (slow release) – медленное высвобождение ЛВ;
- S – (slow) – медленное высвобождение ЛВ;
- фильм – таблетированная лекарственная форма с запрограммированным высвобождением ЛВ, но без указания технологии производства.

Главное правило приема модифицированных таблеток: не делить, не разжевывать и не рассасывать.

Не соблюдение этого правила может привести к усилению побочного действия ЛВ, к резкому снижению терапевтического эффекта, так как механизм действия и длительность его обеспечивается порядком высвобождения ЛВ или же к возникает риск токсического эффекта от 3–4 кратного увеличения разовой дозы, поступающей сразу в организм

Следующими твердыми формами являются драже, гранулы, капсулы, порошки и пилюли.

Драже (dragee) – дозированная лекарственная форма, получаемая способом многократного наслаиваний лекарственных средств и вспомогательных веществ на гранулы (сахарные крупинки). В виде драже выпускают трудно таблетлируемые ЛВ и драже позволяет скрыть неприятный вкус ЛВ и уменьшить его раздражающее действие.

Драже нельзя делить, сосать, разжевывать, как и другие таблетки с оболочкой, и оно не рекомендуется детям. Примерами драже являются фестал, актовегин, синупрет и др.

Гранулы (granulae) – недозированная лекарственная форма, состоящая из однородных частиц лекарственных средств округлой, цилиндрической или неправильной формы размером

0,2–0,3 мм и предназначенная для приема внутрь. Гранулы дозируются ложками (чайными или столовыми) и рекомендуются для педиатрической практики. Из гранул делают растворы для приема внутрь, например, АЦЦ «АСС». Гранулы широко используются в гомеопатии.

Капсулы (capsulae) – дозированные порошкообразные, гранулированные, пастообразные или жидкие лекарственные средства, заключенные в оболочку из желатина, крахмала или другого биополимера. Капсулы могут быть твердыми и мягкими. Твердые – предназначены для дозирования порошков. Такие капсулы имеют цилиндрическую форму и состоят из двух половинок, свободно соединяемых и герметичных, например, ноотропил, колдакт. Мягкие капсулы применяются для дозирования жидких и пастообразных ЛВ, имеют округлую форму. Капсулы маскируют неприятный вкус и запах, например, рыбьего жира и их нельзя делить.

Порошки (pulveres) – это твердая лекарственная форма для внутреннего, наружного или инъекционного применения, состоящая из одного или нескольких измельченных веществ.

В порошках не выписывают гироскопические вещества, которые при взаимном смешивании образуют влажные массы и жидкости, легко разлагаются или дают взрывоопасные смеси.

Порошки обладают высокой фармакологической активностью, обусловленной степенью дисперсности (измельченности) ЛВ: чем тоньше порошок, тем быстрее и легче происходит всасывание растворимых и труднорастворимых ЛВ в кишечнике при приеме внутрь. Крупные порошки оказывают сильное раздражающее действие на раневые и ожоговые поверхности, слизистые и кожу. Поэтому для присыпки ран, ожоговых поверхно-

стей, кожи, для вдувания в уши, нос и горло следует применять мельчайшие порошки (пудру). Часто в домашних условиях для присыпки ран, гнойников, опрелостей используют слегка измельченные таблетки антибиотиков и сульфаниламидных препаратов. Этого делать нельзя.

Пилюли (pilulae) являются дозированной лекарственной формой для внутреннего употребления в виде шариков (проста-стронг). Назначают пилюли в основном при хронических заболеваниях, требующих проведения продолжительного курса лечения, а также для обеспечения относительно слабого дюрантного, т.е. более длительного лечебного действия. Пилюли широко используются в гомеопатии.

1.2. Жидкие лекарственные формы

Достаточно большое количество лекарств представляют собой жидкости. Эти жидкости состоят из растворителя и растворяемого вещества. В зависимости от агрегатного состояния ЛВ (твердое, жидкое, газообразное), степени измельчения ЛВ и характера их связи с дисперсионной средой жидкие лекарственные формы могут представлять собой истинные растворы низко или высокомолекулярных соединений, суспензии, эмульсии, аэрозоли и различные комбинации этих типов дисперсных систем.

Рассмотрим жидкие лекарственные формы более подробно.

Раствор (solutio) представляет собой жидкую лекарственную форму, полученную путем растворения одного или нескольких ЛВ в растворителе и предназначенную для инъекций,

внутреннего и наружного применения. В качестве растворителя используются дистиллированная вода, спирт этиловый, различные масла (оливковое, вазелиновое, подсолнечное и др.), глицерин, димексид, скипидар и многие другие вещества.

Водные растворы назначаются внутрь, наружно и для инъекций. Водные растворы, назначаемые внутрь, дозируются мерными стаканчиками (мензурками), чайными, десертными или столовыми ложками и каплями. В прямую кишку растворы вводят клизмами. Наружно водные растворы применяются для обработки ран, кожи и слизистых, ожоговых поверхностей, а также в виде компрессов, примочек, полосканий и спринцеваний. Водные растворы для инъекций (изотонический раствор 0,9 % NaCl) готовятся в особых условиях на дважды перегнанной дистиллированной воде.

Неводные растворы (спиртовые, масляные и др.) употребляются в основном наружно для обеззараживания кожных краев ран (спиртовый раствор йода), для растирания и предупреждения пролежней и т.д.

Капли (guttae) – это жидкие лекарственные средства, дозируемые каплями. Различают капли для наружного (капли для носа, ушные, зубные), например, отинум, длянос, пиносол – и внутреннего применения, например, валокардин. Особую группу составляют глазные капли: катахром, арутимол. Для отсчета капель применяются глазные пипетки.

Суспензии (suspensium) – жидкая лекарственная форма в которой твердое ЛВ взвешено в жидкости. Суспензия состоит из дисперсионной среды (вода, глицерин, растительные масла и т.д.) и дисперсной фазы (частиц твердых лекарственных веществ, практически не растворимых в данной жидкости). Назна-

чают суспензии для внутреннего применения (анацид, зовиракс и др.) и для инъекций (аваким, монотард и др.). ЛВ в виде суспензий обладает пролонгированным действием.

Эмульсии (emulsium) – однородная по внешнему виду лекарственная форма, состоящая из взаимно нерастворимых жидкостей, типа «масло-вода» и «вода-масло», в которые добавлены лекарственные вещества. Эмульсии предназначены для внутреннего, наружного (санорин в нос) и парентерального применения.

Настойки (tincture) – это спиртовые, спирто-водные или спирто-эфирные извлечения из растительного сырья, получаемые без нагревания. Они назначаются, в основном, внутрь и дозируются каплями: настойка зверобоя, жень-шеня, пустырника и др. Настойку календулы применяют наружно для лечения гнойных ран

Настои и отвары (infusa et decocta) – это водные вытяжки (извлечения) из сырья лекарственных растений. Настои готовят из листьев, цветков и травы лекарственных растений путем настаивания в горячей воде. Отвары приготавливаются из коры, подземных органов растений, плодов путем достаточно длительного кипячения в воде. Из листьев толокнянки (мочегонное средство) готовят отвар, так как листья этого растения плотные, кожистые. Настои и отвары назначаются внутрь и наружно (для полоскания горла, промываний, компрессов и т.д.). Отвары и настои – нестойкие лекарственные формы, поэтому их готовят перед употреблением и хранят не более 2–3 дней, принимают их столовыми ложками или стаканами.

Аэрозоли (aerosolum) – лекарственная форма, в которой жидкие или твердые лекарственные вещества находятся в газо-

образной среде под достаточно большим давлением. Широко используются в дерматологии и пульманологии, для лечения ожогов, в хирургической, гинекологической, терапевтической практике для лечения и профилактики бронхиальной астмы, стенокардии, ринитов, тонзиллитов и др. заболеваний.

Сиропы (sirupus) – достаточно сложные лекарственные формы, содержащие лекарственные вещества и корректирующие (улучшающие) вкус добавки (например, сахар и др.). Сиропы широко используются в педиатрической практике для лечения заболеваний верхних дыхательных путей (бронхоцин и др.), желудочно-кишечных заболеваний (дюфалак и др.).

Бальзамы (balsama) – это жидкие лекарственные формы получаемые из растений и обладающие ароматическим запахом. Применяются как общеукрепляющие средства (бальзам «Царский желудь», бальзам Караваева, бальзам Биттнера и др.).

1.3. Мягкие лекарственные формы

Мягкими лекарственными формами называют мази, суппозитории (свечи), пластыри и др.

Мази (unguenta) представляют собой мягкую лекарственную форму, которая предназначена для наружного применения и состоит из основы и равномерно распределенных в ней лекарственных веществ. Существует несколько классификаций мазей:

- по медицинскому назначению: мази местного действия (покровные, защитные и косметические) и общего действия (резорбтивные), например, финалгон;

- по месту нанесения: дерматологические, глазные, вагинальные, уретральные, для носа, ректальные и стоматологические (например, глазная мазь «Гидрокортизон», мазь ректальная «Доксипрокт» и др.);
- по консистенции: жидкие (линименты), мягкие (кремы), собственно мази, пасты и гели.

Лекарственные вещества, входящие в состав мази, представлены антибиотиками, сульфаниламидами, витаминами, гормонами, антигрибковыми веществами и т.д. В качестве мазевой основы используются вещества, способные образовывать на поверхности кожи или слизистых оболочек ровную не сползающую сплошную пленку. Такими веществами являются природные жиры (растительные масла, сало, гусиный жир, воск, ланолин, спермацет и др.) и искусственные (парафин, силикон, вазелин, полиэтиленоксид и др.).

Суппозитории (suppositoria) представляют собой твердую при комнатной температуре и расплавляющуюся при температуре тела дозированную лекарственную форму. Их часто называют **свечи**. В зависимости от особенностей полостей тела суппозиториям могут придавать различные геометрические очертания и размеры и различают суппозитории ректальные (неоанузол), вагинальные (неопенотран, оскарбон) и палочки. Ректальные вводят в прямую кишку, вагинальные – во влагалище, палочки – в мочеиспускательный, слуховой каналы, свищевые и раневые ходы.

Трансдермальные терапевтические системы. К ним относятся пластыри, диски и плёнки.

Пластыри (emplastra) – это лекарственная форма для наружного применения, которая обладает способностью после

размягчения при температуре тела прилипать к коже. Для удобства пользования их намазывают на специальную ткань или бумагу. В зависимости от медицинского назначения и глубины терапевтического действия пластыри подразделяются на *эпидерматические, эндерматические и диадерматические*.

Эпидерматические пластыри не содержат ЛВ и применяются в качестве перевязочного средства для фиксации повязок, сближения краев ран, предохранения кожи от различных опасных факторов внешней среды.

Эндерматические пластыри обязательно содержат ЛВ, например, антибактериального, кератолитического действия и применяются при заболеваниях кожных покровов (бактерицидный пластырь).

Диадерматические пластыри содержат целый ряд ЛВ, проникающих через кожу и оказывающих воздействие на глубоколежащие ткани. Они же обладают общим лечебным действием, например: депонит, дюгезик, климара.

Пленки (membranulas) – это преимущественно глазные пленки. Они содержат вещества растворимые в слезной жидкости: флореналь, атропина сульфат и др. применяется как глазные капли, но действуют 24 часа.

Диски представляют собой полимерные пластинки, в микропорах которых содержится активное лекарственное вещество. Наносятся на кожу или слизистые путем аппликации. Диски действуют с постоянной скоростью длительное время и обеспечивают постоянную концентрацию ЛВ.

Так **нитродиск**, содержащий нитроглицерин, поступает в течение 10-12 часов, исключает пиковые концентрации и деактивацию, биодоступность лекарственных веществ – 75 %.

Особое место занимают **имплантационные лекарственные формы**. Имплантация (от новолат. *implantatum* – посаженное) – это вшивание порции лекарственного вещества в ткани организма.

Имплантационные лекарственные формы – это стерильные капсулы, таблетки и пленки, которые имплантируются под кожу.

Самая известная имплантационная лекарственная форма «эспераль», вшиваемая в ткани, содержит средство для борьбы с алкоголизмом. Особенность этой лекарственной формы заключается в том, что лечение происходит независимо от воли пациента (отсюда расхожее «зашился, зашиться»). Из этой лекарственной формы высвобождение ЛВ происходит постепенно с постоянной скоростью и концентрацией.

В таких лекарственных формах в организм доставляют некоторые гормональные, противоопухолевые, противозачаточные и другие вещества. Имплантационные лекарственные формы избавляет пациента от боязни пропустить прием препарата, так как рассчитаны на продолжительное время, до 2-х и более месяцев. Это относится к пероральным противозачаточным средствам, которые женщины должны принимать ежедневно, не пропустив ни одного дня в цикле. Например, имплантируемые в ткани предплечья или бедра капсулы «норпланта» обеспечивают противозачаточный эффект в течение почти 12 месяцев. Для имплантации некоторых лекарственных средств используются специальные шприцы, что делает процедуру быстрой и безболезненной. Таким образом, в организм вводят золдекс – препарат для лечения рака предстательной железы у мужчин.

1.4. Лекарственные формы для инъекций

Инъекции осуществляют при необходимости парентерального введения лекарственных средств (подкожное, внутримышечное, внутривенное, внутриартериальное, спинномозговое, внутрисуставное, внутривнутрибрюшинное и др.).

Положительные стороны применения инъекционного введения ЛВ организм:

- 1) быстрый терапевтический эффект;
- 2) точность дозирования и абсолютная биологическая доступность лекарственного вещества, которое попадает в кровяное русло, минуя желудочно-кишечный тракт и печень; возможность локализованного воздействия ЛВ на пораженный орган;
- 3) возможность введения препарата пациенту в бессознательном состоянии;
- 4) инъекция часто единственная возможность введения некоторых препаратов (инсулин, гормоны, обезболивающие, антибиотики и др.).

К инъекционным лекарственным формам предъявляются особые требования. Они должны быть стерильны, не содержать посторонних механических примесей, обладать высокой стойкостью и не вызывать повышения температуры тела пациента – быть апиrogenными. Готовят их в особых стерильных условиях. Формы выпуска – ампулы, флаконы и шприц-тюбики.

1.5. Общие правила приема лекарственных средств

В аннотации к каждому лекарственному средству есть указание о правилах приема данного средства и надо неукосни-

тельно соблюдать эти правила, чтобы не нанести вреда собственному организму.

Существует несколько правил приема лекарств в зависимости от вида лекарственной формы.

Прежде чем принять лекарство внимательно изучите аннотацию или рекомендацию по условиям приема на упаковке. Если аннотации нет, а врач при назначении препарата не сказал об условиях приема (до или после еды, целиком или разжевать, чем запивать и т.д.), то следует помнить:

- таблетки, покрытые оболочками, следует принимать целиком, не разжевывать, не делить;
- капсулы, капсулы-спансулы надо принимать целиком, запивая небольшим количеством воды, желательно в положении стоя (они могут приклеиться к стенке пищевода);
- таблетки-ретарды также следует принимать целиком 1–2 раза в сутки, запивая небольшим количеством воды;
- не делить и не разжевывать таблетки, на упаковке которых есть надписи «film», «durulus», «slow», «prolongatum»;
- антацидные таблетки (снижающие кислотность желудочного сока, изжогу) перед употреблением следует измельчить и размешать с небольшим количеством воды или разжевать и запить 3–4 глотками воды;
- антибиотики, сульфаниламидные препараты, препараты, содержащие сердечные гликозиды, нельзя запивать молоком, т.к. могут образоваться комплексы, которые не усваиваются организмом;
- не следует запивать лекарства чаем или кофе: они содержат дубильные вещества, заметно снижающие действие лекарств;

- противоаллергические средства и препараты, снижающие давление, нельзя запивать соком (особенно грейпфрутовым), он препятствует разрушению лекарственных веществ в печени и может вызвать побочные действия (резкое снижение артериального давления, поражение печени и др.);

- не рекомендуется запивать лекарства минеральной водой, содержащиеся в ней ионы кальция, магния, натрия и др. могут взаимодействовать с ЛВ и снижать эффективность препарата.

В идеале лекарство лучше всего запивать половиной стакана кипяченой и охлажденной воды.

Вопросы для самоконтроля

1. Какие существуют виды лекарственной терапии? Характеристика этих видов.

2. Что такое лекарство, лекарственная форма, лекарственное вещество и лекарственный препарат?

3. Что должно быть в инструкции по применению лекарственного препарата?

4. Как подразделяются лекарственные формы? Характеристика основных групп лекарственных форм.

5. Почему таблетки самая используемая лекарственная форма?

6. Каковы основные и частные правила приема лекарственных препаратов?

2. ПОНЯТИЕ О ДОЗАХ. ДОЗЫ ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ

Лекарственные средства вводятся в организм человека в определенных количествах, называемых **дозами**.

Доза – это количество (концентрация) препарата, выраженная в весовых (г, мг), объемных единицах (мл) и единицах действия (ЕД) (рис. 2).

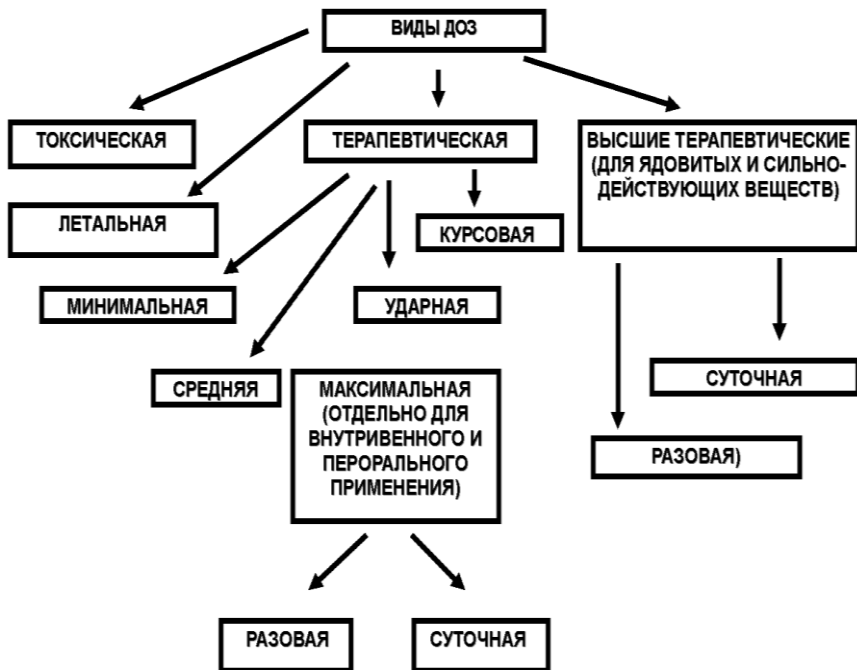


Рис. 2. Классификация доз

Минимальная (пороговая) терапевтическая доза – наименьшее количество препарата, которое оказывает необходимое фармакотерапевтическое действие. Средняя терапевтическая доза обуславливает фармакологический эффект средней степени, она составляет примерно до 1/2 или 1/3 максимальной дозы.

Максимальная (высшая) доза вызывает наибольший или предельный терапевтический эффект. Диапазон доз от пороговой до максимальной называют шириной специфического терапевтического действия. Диапазон доз характеризует безопасность лекарственного средства, чем выше ширина терапевтического действия, тем лекарство безопаснее. **Разовая, суточная и курсовая доза** – количество препарата на разовый прием, суточный и на весь курс лечения. **Ударная доза** назначается с целью создания высокой концентрации лекарственного вещества в организме, она в два раза превосходит среднюю терапевтическую дозу и вводится в организм при первом приеме препарата. Высшие суточные и разовые дозы устанавливаются для сильнодействующих и ядовитых веществ и определяются Государственной фармакопеей. **Токсическая доза** – количество препарата, вызывающее токсическое действие (отравление). **Летальная доза** – количество препарата, которое может вызвать летальный исход.

Индивидуальный выбор дозы зависят от тяжести заболевания. Общие правила сводятся к тому, что при легкой степени заболевания назначают малые дозы, при средней – средние, а при тяжелой – максимальные.

В аннотациях к лекарственному препарату и справочниках указываются дозы для взрослого человека (19–60 лет, массой 60 кг). Они являются усредненными и поэтому могут иметь отклонения в разных случаях.

Общее правило сводится к тому, что женщине дозы уменьшают до $1/2$ – $1/5$ дозы мужчины (у женщин меньше масса тела).

Больным старше 60 лет дозы ЛВ уменьшают до $1/2$ – $1/3$ дозы взрослого. Это обусловлено тем, что процессы выведения и разрушения лекарственных веществ в стареющем организме замедлены, поэтому в крови быстрее создается лечебная концентрация вещества при его пониженной дозе.

Значительно труднее ориентироваться в дозировании ЛВ детям. Они имеют разную массу тела и весьма значительную вариабельность в чувствительности. С учетом этого для детей составляются специальные таблицы для дозирования лекарственных препаратов на год жизни, на единицу поверхности тела и на 1 кг массы тела. Как правило, эти данные указываются в аннотации на препарат. Государственная фармакопея России рекомендует следующий расчет детской дозы по сравнению с дозой взрослого:

Таблица 1

Расчет детской дозы по сравнению с дозой взрослого

| Возраст | Дозировка |
|----------------|------------------|
| До 1 года | $1/24$ – $1/12$ |
| 1 год | $1/12$ |
| 2 года | $1/8$ |
| 3–4 года | $1/6$ |
| 5–6 лет | $1/4$ |
| 7 лет | $1/3$ |
| 10 лет | $3/4$ |
| 12 лет | Взрослая доза |

Здесь же четко прописаны высшие разовые и суточные дозы ядовитых, наркотических и сильнодействующих веществ и препаратов соответственно возрасту (детскому, взрослому и старческому).

Лекарственные средства дозируются в весовых единицах (г, мг, мкг,). В объемных единицах (мл, каплях. Одна капля для водного раствора равна 0,05 мл, т.е. 20 капель составляют 1 мл) и в единицах активности (МЕ-международная единица), или единицах действия (ЕД).

Настойки, экстракты, неогаленовые препараты для внутреннего применения дозируются по 20–40 капель на прием, именно в этом количестве они содержат среднюю разовую дозу.

Отвары и настои дозируются столовыми ложками (15 мл), десертными ложками (10 мл) или чайными ложками (5 мл), а в некоторых случаях стаканом или 1/2 стакана (например, витаминный чай).

Вопросы для самоконтроля

1. Что такое доза? Виды доз и их соотношение.
2. Каковы особенности подбора доз для детей, женщин и людей пожилого возраста?

3. ЧТО ТАКОЕ РЕЦЕПТ?

СОДЕРЖАНИЕ И СТРУКТУРА РЕЦЕПТА

Рецепт – это обращение врача к фармацевту об отпуске больному лекарства с указанием лекарственной формы, дозы и способа применения. Согласно законодательству право прописывания рецептов предоставляется лицам с высшим медицинским образованием – врачам, но в особых случаях такое право дано фельдшерам. В широком смысле термин «рецепт» представляет собой указание состава и способа приготовления какого-либо продукта, средства (например, кулинарный рецепт, рецепт косметического средства и т.д.).

В фармацевтическом понимании рецепт (от лат. *Receptum* – полученное) – это письменное предписание врача фармацевту об изготовлении и отпуске больному лекарства с указанием, как этим лекарством должен пользоваться больной. Рецепт – это важный юридический и финансовый документ. Юридическое значение рецепта заключается в том, что врач, выписавший рецепт, а значит, назначивший соответствующее лечение, несет определенную юридическую ответственность за здоровье больного. Рецепт позволяет проверить правильность приготовления и отпуска лекарства. Финансово-экономическое значение рецепта состоит в том, что он является отчетным документом по расходу аптекой лекарственных

препаратов; по нему определяется стоимость лекарства. Кроме того, для целого ряда препаратов (наркотических, спирта, сильнодействующих и т.д.) ведется строгий количественный учет. Ведется также учет медикаментов, отпускаемых по льготным и бесплатным рецептам.

Выписывание рецепта и отпуск по нему лекарств осуществляется согласно требованиям приказа Министерства здравоохранения РФ от 20 декабря 2012 г. №1175н «Об утверждении порядка назначения и выписывания лекарственных препаратов, а также форм рецептурных бланков на лекарственные препараты, порядка оформления указанных бланков, их учета и хранения». Выписывание и назначение лекарственных препаратов осуществляется медицинским работником по международному непатентованному наименованию, а при его отсутствии – группировочному наименованию. В случае отсутствия международного непатентованного или группировочного наименования лекарственного препарата лекарственный препарат назначается и выписывается по торговому наименованию. Рецепт пишется по специальной форме на бланках, которые подразделяются на обычные и специальные.

На всех рецептах должен стоять штамп лечебного учреждения с указанием его адреса.

Содержание рецепта подразделяется на девять частей, пятая, шестая и седьмая часть пишется на латинском языке, все остальные части на русском:

1. Надпись (*inscriptio*). Указывается название лечебного учреждения, его адрес, часто просто стоит штамп.

2. Имя больного (*nomen aegroti*). Обязательно указывается фамилия и инициалы больного и его возраст. Сведения о возрасте необходимы с целью контроля фармацевтом правильности назначения дозы ЛВ, зависящие от возраста больного.

3. Дата (*datum*). Число, месяц и год выдачи рецепта. Это важно в тех случаях, когда лекарство содержит ядовитое или сильнодействующее вещество. Такой рецепт действителен только определенное время.

4. Имя врача (*nomen medici*). Фамилия и инициалы врача, четко написанные от руки или проставленные штампом.

5. Обращение (*invocation*). В рецепте это обращение представлено словом «*recipe*» – возьми, которое пишется сокращенно *Rp*. Это обращение врача к фармацевту.

6. Перечень лекарственных веществ (*designation materiarum*). Это основные и вспомогательные лекарственные вещества в определенной последовательности. В начале прописывается главное вещество, а далее все остальные: вспомогательные, корригирующие и т.д. Но рецепт может быть выписан и на одно ЛВ.

7. Предписание (*subscription*). После перечня лекарственных препаратов врач указывает в какой лекарственной форме необходимо отпустить то или иное лекарство (таблетки, капсулы, раствор и т.д.). В предписании указывается число доз и фармацевтические операции (смешать, растворить ЛВ и выдать такое-то количество доз): *da tales doses № 10* или *20*.

8. Обозначение (*signature*) сигнатура. Эта часть рецепта представляет собой указание больному способа и порядка при-

ема лекарства, его хранения и прочее. Обозначение пишется не на латинском, а на русском языке – языке, понятном больному.

9. Подпись врача (*subscription medicī*) и личная печать.

При необходимости экстренного отпуска лекарства больному в верхней части рецептурного бланка врач пишет «*cito*» (быстро) или «*statim*» (немедленно).

На специальных бланках выписываются рецепты на наркотические, психотропные, сильнодействующие и ядовитые вещества, а так же больным, имеющим право на льготное оплачивание стоимости лекарств. Выписанные рецепты на наркотические средства действительны 5 дней, на сильнодействующие и ядовитые вещества 10 дней, на все прочие 1–2 месяца.

Следует отметить, что при выписывании рецептов общеприняты латинские сокращения.

Наиболее распространенные латинские сокращения

aa (*ana*) – поровну

Ac (*Acidum*) – кислота

amp. (*ampulla*) – ампула

Aq. (*Aqua*) – вода

But. (*Butyrum*) – масло
(твердое)

D. (*Da*) – выдай

D.t.d. (*Da tales doses*) – дай
таких доз

D.S. (*Da Signa*) – дай, обозначь

Dec. (*decoctum*) – отвар

Emuls (*Emulsum*) – эмульсия

Empl (*Emplastrum*) – пластырь

Extr (*Extractum*) – экстракт

f. (*fiat*) – образуется

fol. (*folium*) – лист

gtts. (*guttas*) – капель

in amp. (*in ampullis*) – в ампулах

in tab. (in tabulettis) – в таб-
летках
Inf. (Infusum) – настой
Lin. (Unimentum) – лини-
мент
Liq. (Liquor) – жидкость
M. (Misce) – смешай
M.D.S. (Misce Da/Signa) –
смешай, дай, обозначь
M.f. (Misce ut fiat) – смешай,
чтобы образовалось
ml – миллиметр
mucil (mucilage) – слизь
n (numero) – число
ol. (oleum) – масло
pil. (pilula) – пилюля
pulv. (pulvis) – порошок
q.s. (quantum satis) – сколь-
ко потребуется

rad. (radix) – корень
Rp. (recipe) – возьми
Rep. (Repete) – повтори
rhiz. (rhizoma) – корневище
s (signa) – обозначь
sem. (semen) – семя
sicc. (siccus) – сухой
simpl. (simplex) – простой
sir. (sirupus) – сироп
sol. (solution) – раствор
steril. (sterilisa, sterilisetur) –
простерилизуй
supp. (suppositorium) – суп-
позиторий
Tab. (tabuletta) – таблетка
T-ra, (Tinct-Tinctura) –
настойка
Ung. (unguentum) – мазь

4. ЧТО ТАКОЕ СИНОНИМЫ? ЧЕМ ОТЛИЧАЮТСЯ СИНОНИМЫ ДРУГ ОТ ДРУГА?

Лекарства, содержащие одно и то же действующее вещество. Но производимое в разных странах и разными фармацевтическими фирмами под разными названиями, называются **синонимами** (от греч. *synonymos* – одноимённый, слово, совпадающее по смыслу с другим). Например, синонимами являются:

- эднит (Венгрия) – энам (Индия) – ренитек (США) – эналаприл (Россия);
- эффералган (Франция) – панадол (Англия) – парацетамол (Россия) и т.д.

Разобраться в названиях лекарств и их составе поможет фармацевт или провизор в аптеке, но что купить, должен решать пациент.

Все лекарства делятся на несколько групп по уровню разработки и производства.

Первая группа – **патентованные (оригинальные)** лекарства. Обозначаются маленькой латинской буквой «**R**» в кружочке над названием, например, **Иммунал**[®] или буквами **ТМ** (от английского «**Trade Mark**» – производственная марка), например, Глюкагон[™]. Это означает, что данные лекарства разработаны, исследованы и производимы известными фирмами, закрепившими свое авторское право национальными и международными патентами. В известной степени это знак качества и доверия.

Конкуренцию оригинальным препаратам составляют препараты – **дженерики**, объединенные во вторую группу лекарств,

обращающихся на фармацевтическом рынке. Это воспроизведенные лекарства, они содержат то же действующее вещество, используются для лечения тех же заболеваний, что и оригинал, но более дешевые и могут иметь другое название. Дженерики можно разделить на две группы:

1. **Лицензионные дженерики**, т.е. законные (легитимные), производимые по лицензии фирмы-патентодержателя. На упаковке таких лекарств может быть надпись «**Произведено по лицензии фирмы X**». Такие надписи, например, есть на упаковках препаратов панзенорм, эднит и др.

2. **Нелицензионные (пиратские)** воспроизведенные препараты. Это, по сути, подделки, но достаточно высокого уровня.

Что же подделывают? По данным Росздравнадзора чаще всего подделывают *желудочно-кишечные* препараты (фестал, мезим, мотилиум, смекта и др.), *противовоспалительные* (терафлю, упсарин УПСА, реопирин и др.), *антибиотики и другие противомикробные средства* (бисептол, ламизил, клафоран, сумамед, трихопол, дифлюкан и др.), *сердечно-сосудистые* препараты (валокардин, коринфар, капеотен, новопассит, панангин, трентал и др.), *гормональные* (постинор, тиреотом, трийодтиронин, флуцинар, фторокорт и др.), *спазмолитики* (ношпа, баралгин, темпалгин), препараты для лечения *эректильной дисфункции* (виагра), *гепатопротекторы* (эссенциале форте), *ноотропные и неврологические* средства (ноотропил, кавинтон, стугерон, церебролизин и др.), *антигистаминные* средства (супрастин, тавегил, пипольфен и др.), *противоопухолевые* и другие. Доля подделок оставляет около 30 % от ввозимых в Россию лекарств.

По определению ВОЗ, **фальсифицированным (поддельным, контрафактным) лекарственным средством является**

продукт, преднамеренно и противоправно снабженным этикеткой, неверно указывающей подлинность препарата и/или изготовителя. Ежегодно из аптек изымают несколько тысяч серий поддельных препаратов. Для рядового потребителя, пока государство не обеспечит безопасность продаваемых лекарств можно дать несколько простых советов:

- Упаковка должна быть склеена аккуратно, на коробке должно быть чётко указаны все данные: срок годности, номер серии, страна-изготовитель. Если вас смущает что-либо, откажитесь от покупки.

- Воздержитесь от приобретения лекарств на улице с рук, на рынке и через рекламу в Интернете.

- Цена лекарств достаточно высока, рынок не может позволить себе снизить цену в 2–3 раза. Так что если вам предлагают очень дешёвый препарат ни в коем случае не берите его.

- Остерегайтесь передвижных аптечных киосков и лотков, в разовых точках велик шанс приобрести фальсифицированный продукт.

- Покупайте медицинские препараты в крупных аптеках. Вернуть лекарство в аптеку нельзя, а вот предъявить претензии на вызвавшее качество можно и в аптеку и в контролирующие органы, адреса и номера телефонов которых по указанию Минздрава должны быть вывешены на видном месте в каждой аптеке.

Вопросы для самоконтроля

1. Как подразделяются лекарственные средства по уровню разработки и производства?

2. Что считается фальсификатом лекарственного средства?

5. ПУТИ ВВЕДЕНИЯ ЛЕКАРСТВЕННЫХ СРЕДСТВ В ОРГАНИЗМ

Применение лекарственных средств для профилактических или лечебных целей начинается с их введения в организм человека или с нанесения на кожу и слизистые оболочки. От путей введения зависит скорость терапевтического эффекта, его продолжительность.

Пути введения подразделяются на две основные группы: энтеральный (через желудочно-кишечный тракт) и парентеральный (минуя желудочно-кишечный тракт).

Выбранный путь введения лекарств определяет:

- скорость наступления терапевтического действия;
- продолжительность действия;
- степень активности лекарств, т.е. биодоступность;
- степень выраженности главного и побочного действия;
- возможность токсического действия;
- схему лечения (кратность, время и длительность приема препаратов).

5.1. Энтеральный путь введения лекарственных средств в организм

Самый распространенный и простой путь введения – через рот (per os). Преимуществами этого способа являются удоб-

ства и достаточная точность дозирования, однако при всей простоте он не лишен некоторых недостатков, таких как трудность, а подчас невозможность применения этого способа в педиатрии, особенно у детей младшего возраста, или в бессознательном состоянии больного и др. Другими способами являются введение ЛВ через прямую кишку (ректально), за щеку (трансбукально) и под язык (сублингвально). Особенности этих способов является их простота и доступность.

Основные правила при использовании перорального введения лекарственных средств:

1. Соблюдение времени приема лекарств и рекомендаций о приеме («до еды», «после еды» или «во время еды»), что позволяет снизить риск нежелательного взаимодействия и трансформации лекарственных веществ.

2. Не следует запивать лекарственные средства минеральной водой, молоком, чаем, кофе, фруктовым соком так как находящиеся в них ионы Ca, Mg, Al, Fe, а также кофеин и дубильные вещества замедляют всасывание препарата, снижают его активность до 50 %.

3. Не следует совмещать прием лекарств с приемом алкоголя (растворяются оболочки таблеток, нарушается запрограммированное высвобождение лекарственных веществ и создается токсическая доза лекарственных веществ) и молока (снижается действие сердечных гликозидов, антибиотиков, сульфаниламидов).

4. Ограничить прием пищи, богатой животными жирами и большим количеством белка (мясо, рыба, молочные продук-

ты, кондитерские изделия), так как угнетается скорость всасывания лекарственных веществ.

Всасывание (абсорбция) ЛВ частично будет происходить в желудке. Однако подавляющее количество ЛВ всасывается в тонком кишечнике. Механизмы всасывания сложны и их несколько: *пассивная диффузия* – через мембраны клеток, *фильтрация* – через поры мембран, *активный транспорт* – с помощью активных переносчиков, расположенных в клеточных мембранах, и *пиноцитоз*.

Всасывание из тонкого кишечника происходит относительно медленно. Этот процесс зависит от состояния слизистой кишечника, pH среды, содержимого кишечника и его моторики. Из тонкого кишечника ЛВ поступает в печень, где частично инактивируется, и лишь затем – в общий кровоток. В том случае, если ЛВ разрушается в желудке под действием ферментов или кислоты, лекарственный препарат должен иметь кислотоустойчивую оболочку.

Некоторые лекарственные препараты в форме таблеток (подъязычных и щечных) вводят только перорально, без последующего проглатывания, так как слизистая оболочка рта хорошо пропускает растворимые в воде и липидах ЛВ. При введении ЛВ под язык (сублингвально) всасывание происходит сравнительно быстро, вещество поступает в кровь, минуя печень, и не контактирует со средой желудка и кишечника. Сублингвально назначают ЛВ с высокой активностью, например, сердечные средства, содержащие нитроглицерин. Щечно (трансбукально) применяют некоторые гормональные препараты.

В двенадцатиперстную кишку препараты вводят с помощью зонда, например, желчегонные средства, и это позволяет быстро создать высокую концентрацию ЛВ.

При введении ЛВ через прямую кишку (ректально) вещество поступает в кровоток, минуя печень, и не подвергается действию ферментов пищеварительного тракта. Ректально лекарственные средства назначают в суппозиториях (свечах) и иногда в виде крема и клизм (объемом 50 мл). Лекарственные вещества из прямой кишки поступают в организм больного почти с такой же скоростью в общий кровоток, как при внутримышечном введении.

5.2. Парентеральные пути введения лекарственных средств (минуя желудочно-кишечный тракт)

Парентеральный путь включает ингаляционный, трансдермальный (через кожу) и инъекционный способы введения ЛВ в организм. Инъекционный способ подразделяется на внутривенный, внутримышечный, подкожный, внутрисосудистый (внутриартериальный и внутриортеальный) и через оболочки мозга (субкципитальный, субдуральный и субарахноидальный).

Преимуществом парентеральных путей является высокая биодоступность ЛВ в организме, 100 %, быстрота наступления фармакотерапевтического эффекта, точность дозирования лекарственных веществ и возможность преодолевать различные барьеры, например, гематоэнцефалический, плацентарный и др.

Из парентеральных путей наиболее распространенным является введение лекарственных веществ под кожу, в мышцу и в вену, т.е. инъекционно. У этих способов введения есть и несколько существенных недостатков: относительная сложность, болезненность процедуры, необходимость особой стерильности и умения совершать манипуляции.

Аэрозоли и некоторые газообразные и летучие соединения (эфирные масла и т.д.) вводятся ингаляционным путем. Ингаляционный способ введения лекарств также не лишен некоторых недостатков, основным из которых являются опасность прямого воздействия препарата на слизистые оболочки дыхательных путей и их возможное воспаление. Достаточно обширная группа препаратов назначается **интраназально**, и всасывание ЛВ происходит через слизистую оболочку носа.

Местное применение: для получения локального эффекта на поверхность кожи или слизистых оболочек наносится лекарственное средство в виде мази, крема, спиртового раствора и т.д. Электрофорез основан на переносе ЛВ с поверхности кожи в глубоко лежащие ткани с помощью гальванического тока.

После абсорбции вещества попадают в кровь и распределяются по всем тканям организма, этот процесс зависит от растворимости ЛВ в липидах, связи с белками и др. факторов. Определенное влияние на распределение оказывают биологические барьеры. К ним относятся стенки капилляров, клеточные мембраны, гематоэнцефалический и плацентарный барьеры. Большая часть лекарства в первое время после всасывания попадает в органы и ткани, наиболее активно кровоснабжающиеся (печень, сердце, почки, легкие и др.), мышцы, жировая ткань,

кожные покровы и слизистые оболочки насыщаются ЛВ медленно, постепенно.

Лекарственные вещества, циркулирующие в организме, могут частично связываться и образовывать клеточные и внеклеточные депо. Например, жировая ткань является депо для липофильных соединений – средств для наркоза. Продолжительность нахождения лекарственных веществ в депо варьирует в очень широких пределах. Так, например, многие сульфаниламиды образуют стойкие комплексы с белками плазмы и это обеспечивает их продолжительное (более 24 часов) действие. Длительно задерживаются в организме тяжелые металлы, что влияет на их токсические свойства.

Вопросы для самоконтроля

1. Какие основные пути введения лекарственных средств в организм человека, какие у них достоинства и недостатки?
2. Каковы особенности парентерального введения лекарственных средств в организм человека?

6. УЧЕНИЕ О «СУДЬБЕ» ЛЕКАРСТВЕННЫХ ВЕЩЕСТВ В ОРГАНИЗМЕ

Термин «судьба лекарственных веществ в организме» обозначает любые изменения, движения (фармакокинетику) вещества и изменения его молекулярного строения и метаболизма после введения в организм, т.е. фармакодинамику.

6.1. Фармакокинетика

Фармакокинетическую схему судьбы лекарств в организме можно выразить следующей схемой (рис. 4):

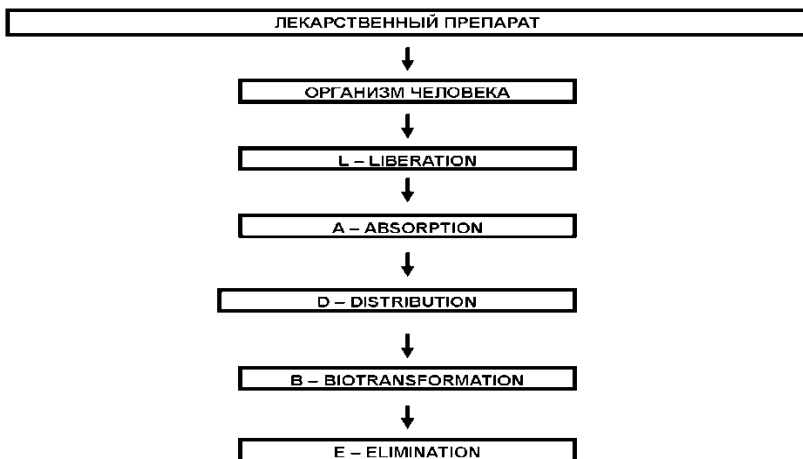


Рис. 4. Движение лекарственных веществ в организме человека

L (liberation) – высвобождение лекарственного вещества из лекарственной формы;

A (absorption) – всасывание высвободившегося лекарственного вещества;

D (distribution) – распределение лекарственного вещества в органах, тканях и жидкостях организма;

B (biotransformation) – разрушение, связывание с белками крови, соединение с рецепторами и т.д.

E (elimination) – выделение метаболитов и лекарственного вещества из организма.

Движение лекарственных веществ на этапе D–B вызывает различные фармакологические (терапевтические) эффекты.

Фармакокинетика (*pharmacokinetics* – лекарство, *kinetics* – двигать) изучает:

- абсорбцию-всасывание лекарств;
- транспортировку и распределение лекарственных веществ;
- биотрансформацию превращение лекарственных веществ;
- выведение из организма лекарственных веществ или продуктов их биотрансформации.

L – Высвобождение лекарственных веществ из лекарственной формы

Это первый этап фармакокинетической схемы превращения лекарственных средств. Лекарственная форма определяет:

- степень и характер трансформации лекарств;
- степень сохранения биологической активности;
- выраженность побочного действия;

- продолжительность действия;
- скорость наступления лечебного эффекта.

Модификация лекарственных форм (продолгованные, ретардные формы, трансдермальные терапевтические системы и др.) позволяет:

- активно влиять на реализацию фармакокинетической схемы лекарств;
- программировать и прогнозировать действие лекарств по всем параметрам.

Пути введения лекарства определяет скорость наступления терапевтического действия.

А – Абсорбция (всасывание) лекарственных веществ

После высвобождения из лекарственной формы лекарственные вещества проникают через различные биологические барьеры во внутриклеточное пространство органов и тканей.

Поступление лекарств в общий кровоток является обязательным для получения системного воздействия на организм (резорбтивного) и предполагает преодоление различных барьеров биологических мембран клеток. Проникновение ЛВ через мембраны осуществляется с участием различных механизмов; фильтрации, простой диффузии (пассивный транспорт), пиноцитоза и активного транспорта.

Механизм всасывания обуславливается физико-химическими свойствами и особенностями лекарственного препарата или способом введения лекарства в организм. Например: лекарственные вещества введение через рот всасываются путем пассивной диффузии, а липофильные вещества хорошо проникают через мембраны за счет быстрого растворения в липидах мембран.

D – Распределение лекарственных веществ в органах, тканях и жидкостях организма происходит:

- с различной скоростью;
- с различной равномерностью:
- равномерно;
- неравномерно;
- депонировано.

Накапливание (депонирование) лекарственных веществ осуществляется в различных тканях, а именно:

- костной;
- жировой;
- соединительной.

Различается скорость распространения лекарств по организму, она может быть очень быстрой (в крови, межклеточной жидкости), медленной (в стекловидном теле, костях) и умеренной (в мышцах, тканях и органах с интенсивным кровоснабжением).

B – Биологическая трансформация лекарственных веществ в организме

Лекарственные средства являются для организма чужеродными соединениями и в целях их детоксикации, т.е. снижения активности и выведения из организма, подвергаются биологической трансформации.

Биологическая трансформация – это совокупность физико-химических и биохимических превращений лекарств, способствующих инактивации молекул лекарственных веществ и превращения их в соединения, пригодные для выведения из организма.

В неизменном виде выделяются главным образом:

- высокогидрофильные ионизированные соединения;
- и из липофильных веществ – средства для ингаляционного наркоза.

Наиболее интенсивная биотрансформация лекарственных веществ происходит в клетках печени, ЖКТ, почек и крови.

Биологическая трансформация лекарственных веществ осуществляется путем химических превращений или биосинтетических процессов, с последующим выведением полученных веществ.

В зависимости от типа реакции, происходящих при биотрансформации выделяют конъюгацию и метаболическую трансформацию.

Метаболическая трансформация – это химические превращения, когда в результате химических реакций окисления, гидролиза, восстановления или дезаминирования образуются метаболиты.

Конъюгация – это биосинтетический процесс присоединения к молекулам ЛВ или их метаболитам эндогенных соединений (ацетатов, сульфатов, соединений глюкуроновой кислоты или глицина) с образованием конъюгатов.

Процессы биотрансформации (рис. 5) лекарств происходят с участием ряда ферментов, основными из которых являются микросомальные ферменты печени, которые участвуют в превращении липофильных веществ в гидрофильные, которые легко выводятся из организма и немикросомальные ферменты локализирующиеся в кишечнике, плазме крови и других системах, они трансформируют гидрофильные вещества, сульфаниламиды, производные салициловой кислоты и др.

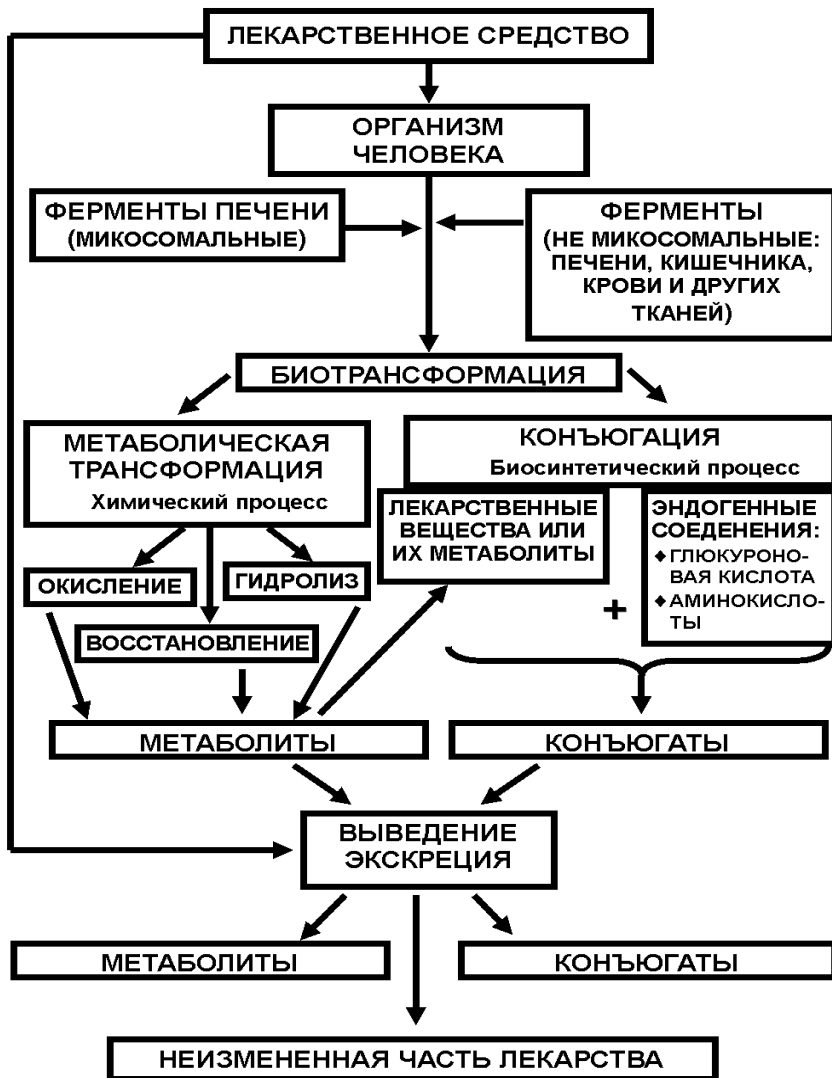


Рис.5. Биотрансформация лекарственных веществ в организме и их выведение из организма

Е – Выделение метаболитов и лекарственных веществ из организма

ЛВ выводятся из организма в виде метаболитов и конъюгатов, но могут выводиться и в неизменном виде.

Пути выведения ЛВ из организма разнообразны и зависят от агрегатного состояния и летучести соединения.

Из печени ЛВ выводятся в виде метаболитов или, не изменяясь (тетрациклин), поступают в желчь и выводятся с калом. Под влиянием ферментов и бактериальной микрофлоры кишечника лекарственные вещества могут превращаться в другие соединения и вновь поступать в печень.

С мочой лекарственные вещества выводятся путем клубочковой фильтрации и канальцевой секреции и при этом большое значение имеет их реабсорбция в канальцах почек.

Газообразные и многие летучие соединения (средства для ингаляционного наркоза) выделяются через легкие.

Отдельные препараты выводятся из организма через слюнные железы (йодиды и др.), слезные железы (антибиотики), потовые железы и железами кишечника и желудка (никотин, органические кислоты и др.).

В период активной лактации молочные железы выделяют большое количество веществ, которые получает кормящая мать (снотворные, болеутоляющие, этиловый спирт, никотин, многие наркотики и т.д.). С грудным молоком все эти вещества могут попасть в организм ребенка и нанести его здоровью значительный ущерб.

6.2. Фармакодинамика

Фармакодинамика (*pharmacopon* – лекарство, *dynamis* – сила) изучает:

- механизмы действия лекарственных веществ;
- биологические эффекты лекарств (главное действие, побочное и т.д.);
- факторы, влияющие на реализацию фармакотерапевтического воздействия лекарств на организм.

Под термином «**механизм действия**» понимается способ взаимодействия лекарственных веществ со специфическими участками связывания их в клетках и организме человека. Нужный фармакологический эффект достигается воздействием лекарственных веществ на различные точки приложения – эффекторы: рецепторы, ионные каналы, ферменты, гены и т.д.

Получение необходимого фармакологического действия возможно с помощью нескольких препаратов, обладающих различными механизмами действия. При этом в организме не происходит каких-либо новых биохимических реакций или физиологических процессов. В современной фармакологии для описания действия лекарственных веществ принята концепция «мишени» для каждого препарата. Таковыми мишенями являются рецепторы, гены, ферменты, ионные каналы и другие транспортные системы.

Рецепторы (от лат. *recipere* – получать) встроены в мембраны клеток и вступают во взаимодействие с определенными веществами, синтезируемыми в организме. Классификация рецепторов основана на химической природе тех веществ с которыми они реагируют. Например, рецепторы, чувствитель-

ные к норадреналину и адреналину, называются адренорецепторы и т.д.

Все фармакологически активные вещества можно разделить на две группы: средства, возбуждающие рецепторы, их называют миметики (от англ. *mimetic* – подражатель) и средства, блокирующие рецепторы – блокаторы.

По разным каналам (нервным волокнам, кровеносным сосудам) в рецепторы поступают сигналы, которые или блокируют или активируют рецепторы. В качестве непосредственных передатчиков сигналов выступают медиаторы или гормоны. Известно, что для каждого рецептора существует свой медиатор или гормон и рецептор может специфически реагировать только с определенным веществом. Это свойство называется избирательностью или селективностью. Рецепторы могут вступать во взаимодействие с веществами, вводимыми в организм из вне, т.е. с лекарственными веществами, и тогда возникает определенный эффект.

Сродство лекарственного вещества и рецептора, приводящее к образованию комплекса лекарство-рецептор, называется **аффинитетом**. Связываясь с рецептором, лекарственное вещество может выполнять роль агониста или антагониста.

1. **Агонисты** – вещества, похожие на естественные, синтезируемые в организме медиаторы и гормоны. Агонисты легко взаимодействуют с рецепторами. К их числу относятся опиаты (морфин, фентанил и др.), которые вызывают облегчение боли.

2. **Антагонисты** (от греч. *antagonisma* – спор, соперничество), они связываются с рецепторами и препятствуют действию внутренних медиаторов или гормонов. Наглядным примером антагонистического действия является применение антигиста-

минных препаратов (супрастина, димедрола, кларитина и др.), которые блокируют гистаминовые рецепторы и не дают гистамину запустить аллергическую реакцию.

Одной из «мишеней» для лекарственных веществ являются ионные каналы для ионов кальция, калия, магния и др., а так же транспортные системы, ферменты и гены.

Ионные каналы – это поры в клеточных мембранах, через которые различные ионы поступают в клетку или выводятся из нее. Лекарственные вещества способны изменять проводимость ионных каналов. Например, местные обезболивающие средства (новокаин, лидокаин и др.) закрывают ионный натриевый канал и предотвращают поступление натрия в клетки, что способствует блокированию передачи нервного возбуждения и тем самым снимается ощущение боли. Блокаторами кальциевых ионных каналов являются препараты группы *верапамина*, которые используются для лечения ишемической болезни сердца.

Ферменты – это сложные специфические белки, являющиеся биокатализаторами, активирующими биохимические процессы и реакции в организме. В практике широко используются лекарства угнетающие или снижающие активность ферментов. Например, противовоспалительные нестероидные средства (ацетилсалициловая кислота, анальгин, ибупрофен и др.) ингибируют фермент циклооксигеназу и тем самым снижают биосинтез активных медиаторов воспалительной реакции простагландинов.

Гены – перспективные «мишени» для лекарственных веществ. Считается, что с помощью избирательно действующих лекарственных веществ можно влиять на функции определенных генов.

6.3. Особенности действия лекарственных веществ

Лекарственные средства оказывают на организм человека многообразное и сложное действие, которое зависит от большого количества факторов: химической природы, свойств ЛВ, дозы, путей введения в организм, возраста больного, условий внешней среды (загрязнение химическими веществами, искажение её физических параметров) и т.д. (рис. 6).

1. Местное действие. Это действие вещества на месте его введения до всасывания в общий кровоток, при этом реакция организма может развиваться как на месте введения, так и вдали от него. Местное действие может быть раздражающим, прижигающим, вяжущим, обволакивающим, анестезирующим и т.д.

2. Резорбтивное действие. Резорбтивным или общим (от лат. *resorbeo* – поглощать) называется действие лекарственного вещества после всасывания в кровь и распределения его по всему организму. Примером такого действия является сон, развивающийся после приема снотворного средства, общий наркоз после вдыхания паров эфира или закиси азота и др.

3. Рефлекторное действие – это эффект, который реализуется в результате рефлекса, возникающего благодаря воздействию лекарственного вещества на нервные рецепторы на месте введения или после всасывания. Например, при вдыхании паров нашатырного спирта при обмороке нашатырь оказывает местное раздражающее действие на окончания тройничного нерва, а он вызывает рефлекторное возбуждение дыхательного центра, что улучшает мозговое кровообращение и тем самым прерывает обморок.

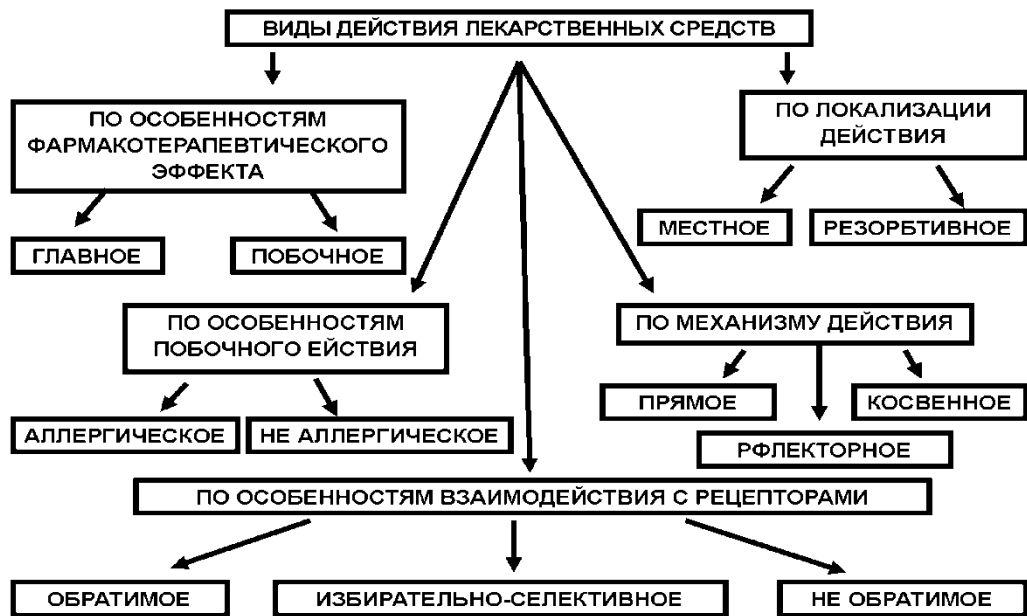


Рис.6. Основные виды действия лекарственных средств на организм человека

4. Прямое и косвенное действие. Под *прямым*, или *первичным*, действием понимают результат непосредственного влияния вещества на орган или ткань: например, сердечные гликозиды наперстянки действуют на сердечную мышцу. Они усиливают её сокращение, в результате у больного, страдающего от сердечной недостаточности, улучшается кровообращение. *Косвенное*, или *вторичное*, действие – это ответ организма на первичные изменения, вызванные ЛВ, но разграничить первичные или вторичные реакции очень сложно. Так, например, действие наперстянки, средства от сердечного недомогания, является первичным. Она не применяется как мочегонное средство и у здорового человека не вызывает увеличение диуреза, но у больного, страдающего заболеваниями сердца с отеком тканей, улучшение кровообращения приводит к уменьшению отеков и усиленному выделению жидкости почками. Диуретический эффект в данном случае будет вторичным.

5. Обратимое и необратимое действие. Если действие лекарственного вещества проходит бесследно через определенное время, то такое его действие называется *обратимым*, например, наркотическое действие спирта. *Необратимым* называют такое действие ЛВ, которое вызывает стойкие, необратимые изменения, например, прижигающее действие.

6. В случае, когда ЛВ действует на большинство клеток и тканей организма приблизительно одинаково говорят об **общеклеточном действии** вещества (наркотические вещества и др.).

7. Если лекарственное вещество действует на ограниченную группу клеток, то говорят об **избирательном (селективном) действии** (обезболивающее действие морфина).

8. Главное и побочное действие.

Главное действие – действие препарата, которое обеспечивает необходимый лечебный (терапевтический эффект). Побочное действие – действие препарата, которое проявляется одновременно с главным, но приводит к нежелательным или не используемым для лечения фармакологическим эффектам. Например, при неправильном применении антибиотиков формируются устойчивые к ним формы микроорганизмов, может развиваться осложнение аллергического характера. Это побочное действие, которого следует избегать. Более подробно это действие будет рассмотрено дальше. Хорошо известный препарат ацетилсалициловая кислота (аспирин) имеет главное действие жаропонижающее, противовоспалительное, болеутоляющее, побочное действие – раздражение слизистой желудка с образованием язв, снижение слуха и аллергические реакции.

Факторы, влияющие на реализацию фармакотерапевтического действия лекарственных средств:

- особенности лекарственных средств;
- особенности приема и путей введения лекарственных средств;
- особенности организма человека.

Рассмотрим каждый из факторов более подробно.

Основные фармакотерапевтические параметры лекарственных препаратов, на которые влияют особенности лекарственных средств, в частности их форма:

1. Биодоступность (степень активности) лекарственных препаратов:
 - мази и пластыри – до 75 %;
 - аэрозольные и инъекционные препараты – 100 %.
2. Продолжительность действия:

- капсулы-ретарды, дурулы – 12–24 часа;
- капсулы-спансулы – 8–10 часов;
- обычные прессованные таблетки – 5–6 часов;
- импланты – до 12 месяцев.

3. Скорость наступления действия:

- обычные прессованные таблетки – через 15–20 минут;
- суппозитории – через 15–12 минут;
- инъекционные формы – с момента введения;
- аэрозоли в момент введения.

4. Побочные действия: прессованная таблетка ацетилсалициловой кислоты (аспирин) агрессивно действует на слизистую желудка, вызывая раздражение, эрозию, язву. Возможно кровотечение из-за побочного антиагрегантного действия ЛВ;

Особенности организма, влияющие на реализацию фармакотерапевтических свойств лекарств:

- индивидуальные особенности биоритмов организма;
- генетический полиморфизм;
- исходное функциональное состояние организма;
- исходные показатели физического статуса (возраст, пол, масса тела).

Таким образом, понятно, что действие лекарственных средств в одних и тех же дозах при одной и той же патологии у разных людей может проявиться по-разному. Действие лекарственных средств может зависеть от биоритмов человека.

Ритмичность – это основное свойство живого организма, включающее ритм дыхания, сердечные сокращения, менструальные циклы, гормональное развитие, чередование сна и бодрствования и т.д.

Биоритмы организма – это ритм изменений параметров функционального состояния, диапазон колебаний физиологиче-

ских функций, амплитуда концентрации в крови биологически активных веществ и др. Они сформировались как ответная реакция организма на воздействие различных факторов: погоднометеорологических (температура воздуха, атмосферное давление, влажность), гелиофизических (магнитные бури, солнечная активность, ионизация воздуха), социальных (режим производственной и учебной деятельности, режим сна и бодрствования)

В свою очередь биоритмы подразделяются на:

1. **Инфраниантные ритмы** – ритмы длительностью больше суток, например, менструальные циклы у женщин. Сюда же относят **сезонные ритмы**.

2. **Ультрадиантные ритмы** – ритмы длительностью меньше суток, например: концентрация внимания, изменение болевой чувствительности, регуляция АД, пищеварение, процессы выделения и секреции, цикличность фаз, чередующихся на протяжении 6–8-ми часового нормального сна у человека.

3. **Циркадиантные (околосуточные) ритмы** являются видоизменением суточного ритма с периодом в 24 часа, протекают в константных условиях и принадлежат к свободно текущим ритмам. Это ритмы с не определенными внешними условиями периода. Они врожденные, эндогенные, то есть обусловлены свойствами самого организма.

Достоверно установлены биоритмы более 300 функций и процессов в организме.

Функция биоритмов – обеспечить необходимую скорость и полноту биохимических реакций – материальную основу всех проявлений жизнедеятельности человека.

Классическим примером изменения скорости физиологических и иных процессов являются биоритмы основных систем органов, например:

- образования важнейших медиаторов, ответственных за работу центральной нервной системы и реализацию важнейших функций организма: ацетилхолин и адреналин активируются в утренние часы (одновременно с активацией гормональных функций), у серотонина наблюдаются колебания в течении суток с уменьшением концентрации более чем на 50% относительно среднесуточной величины.

- изменения биоритмов эндокринной и мочевыделительной систем (утром и днём высокая активность, вечером и ночью активность снижается).

Для организации человека, характерны некоторые колебания биоритмов (рис. 7). Так, частота пульса (ЧСС) может варьироваться от 10 до 15 ударов в минуту (в покое: без психического и физического напряжения). Артериальное давление в течение суток может изменяться от 10 до 15 мм рт. ст. (в покое). Амплитуда колебаний температуры тела в норме может составлять 1–1,1° С (наиболее стабильный показатель).

Суточные колебания можно выразить следующим образом:

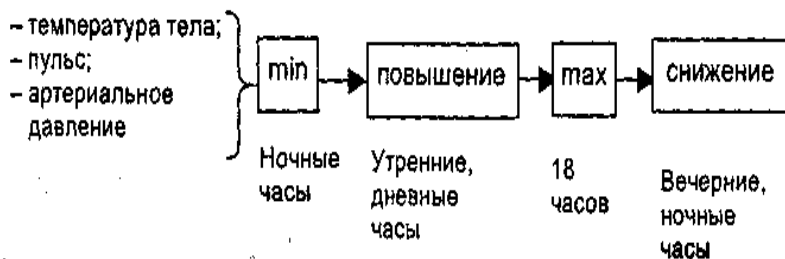


Рис. 7. Суточные колебания некоторых параметров организма человека

Разбалансирование биоритмов приводит к формированию патологии, которая может обусловить следующие процессы:

1. Учащение приступов (бронхиальной астмы и стенокардии в ночные часы; эпилепсии в момент засыпания или пробуждения, а также перехода фаз сна и изменения активности мозга).

2. Повышение риска (инсультов, гипертонических кризов, нарушения сердечного ритма (переход фазы медленного сна в фазу быстрого сна около 4–5 часов утра).

3. Сезонные обострения (язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки – весна; гипертония – зима; психические расстройства – ранняя осень (до выпадения снега) и весна (период таяния снега)).

4. Сезонные заболевания:

- период цветения – респираторные и кожные аллергии;
- простудные заболевания – холодный период;

Использование закономерностей биоритмов организма при выборе лекарственных средств и определение схемы лечения позволяет: повысить фармакотерапевтическую активность препаратов; определить целесообразную дозировку и часы приема лекарств; предупредить возникновение осложнений и рецидивов заболевания; предупредить возникновение острой и формирование хронической патологии; предупредить сезонные заболевания. Действие лекарственных средств тоже зависит от биоритмов.

Так, прием «гистамина» в 23 часа, его эффективность увеличивает более чем в 2 раза (полиатрит, аллергии и др.).

Противоопухолевые средства наиболее активны при введении в 5 утра (это время интенсивного роста опухолевых клеток).

Гипотензивные средства следует принимать на ночь (снижается риск приступов острой сердечной недостаточности).

Противоязвенные препараты лучше принимать весной для предупреждения рецидивов язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки.

Мочегонные средства принимают утром (предупреждают активное обратное всасывание воды).

Витаминные препараты и минералы рекомендуется принимать посезонно (для предупреждения нарушений функций организма и авитаминозов).

К некоторым лекарственным средствам, например, антибиотикам группы пенициллина и другим, у ряда людей может быть наследственно обусловленная повышенная чувствительность – идиосинкразия (от греч. *idios* – своеобразный, *syncrasic* – смешанный). Внешние проявления наблюдаются такие же, как при типичной аллергической реакции: кожные высыпания (крапивница), повышенная температура тела. Но может возникнуть и тяжелое состояние, при котором наступает падение артериального давления, спазм бронхов (анафилактический шок). Такое явление обусловлено тем, что некоторые ферменты, отвечающие за метаболизм лекарственных веществ, являются неполноценными и не могут выполнять свои функции в полном объеме.

Имеется зависимость действия лекарственных средств от особенностей пола и массы тела человека.

Считается, что женский организм более чувствителен к лекарствам, чем мужской. При этом имеют значение особые периоды физиологических изменений (менструация, беременность и т.д.). Кроме того, у женщин, например, повышена чувствительность к некоторым соединениям (никотин и др.).

Существуют некоторые особенности действия лекарств на плод во время беременности женщины и на детей раннего возраста.

Поверхность плаценты определяет величину общего кровотока и количество транспортируемых через сосуды пуповины лекарственных веществ. 40–50 % крови поступает через сосуды пуповины в организм плода, минуя печень, поэтому значительная часть лекарств не подвергается биотрансформации и содержится в повышенных концентрациях в крови плода. Количество жировой ткани увеличивается с возрастом (1 % от массы тела при недоношенности и 15 % – при рождении в срок), что влияет на всасываемость лекарств. Большое количество воды в тканях ребенка обуславливает большой объем распределения некоторых препаратов (дигитоксин, антибиотики), расчет которых ведется на 1 кг массы тела.

Возможные побочные действия лекарств на плод человека, детей раннего возраста в связи с особенностями их развития.

Местные анестетики вызывают брадикардию, депрессию новорожденных.

Салицилаты (аспирин и др.) нарушают свертываемость крови.

Сульфаниламиды вызывают желтуху новорожденных, гемолитическую анемию.

Тетрациклин приводит к желтому окрашиванию зубов и нарушению процессов формирования костной ткани, гепатиту.

Стрептомицин поражает слуховые нервы.

Дифенин приводит к врожденным аномалиям.

Барбитураты вызывают асфиксию плода, депрессию новорожденных.

Средства, усиливающие секрецию желез слизистой носа, бронхиальных и других, могут привести к нарушению дыхания у детей младшего возраста.

Для детей раннего возраста:

– установлены высшие разовые и суточные дозы для ядовитых и сильнодействующих веществ (Государственная фармакопея);

– на все остальные лекарства рекомендовано расчет дозы производить как $1/20$ дозы взрослого на каждый год жизни ребенка или на 1 кг массы тела рассчитывается определенная группа препаратов;

– введены ограничения, вплоть до запрета назначения, на целый ряд препаратов, особенно действующих на ЦНС, снотворные и др.

Действия лекарств на взрослый организм тоже имеют свои особенности.

Действие на людей пожилого и старческого возраста

С возрастом увеличивается гетерогенность реакций на лекарственные вещества (физико-химические взаимодействия), что обуславливает изменение некоторых фармакокинетических процессов:

– ухудшается абсорбция витаминных препаратов и лекарств, покрытых защитной пленкой, требующих активного транспорта для проникновения через клеточные мембраны (абсорбция лекарств, проникающих путем пассивной диффузии не снижается);

– нарушается процесс распределения лекарств в организме ввиду, изменения количества жировой ткани, уменьшения содержания воды, уменьшения кровоснабжения отдельных органов (но эта реакция очень индивидуальна);

– замедляется выведение некоторых лекарств ввиду снижения функции почек (гломерулярной фильтрации и экскреторной функции канальцев). Это особенно важно для препаратов с малой шириной терапевтического действия – сердечных гликозидов, некоторых антибиотиков, мочегонных средств и др.

– возрастает опасность и вероятность побочных эффектов ввиду снижения компенсаторных реакций различных систем и одновременного приема нескольких препаратов. Могут иметь место спутанность сознания при приеме антидепрессантов, резкое снижение давления при введении гипотензивных средств и др.

Действие лекарств на людей среднего возраста

Дозирование, правила приема и показания к применению лекарств в этой группе проводятся в соответствии с требованиями Государственной Фармакопии, с фактическим состоянием больного и его индивидуальными особенностями.

Общее состояние организма может повлиять на действия лекарственных средств.

Зависимость действия лекарственных средств от состояния организма

При заболеваниях печени и, как следствие, нарушении процессов биотрансформации лекарственных средств:

– замедляется скорость наступления фармакологического эффекта;

– увеличивается продолжительность действия;

– усиливается побочное действие, вплоть до отравления;

При нарушении выделительной функции почек и, как следствие, нарушении выведения лекарственных веществ, их метаболитов и конъюгатов происходит накопление лекарственных веществ в организме – кумуляция, что приводит к увеличению продолжительности действия и усилению побочного действия, вплоть до токсического.

При функциональном нарушении пищеварительных желез и, как следствие, нарушении выработки пищеварительных ферментов:

– некоторые лекарственные вещества разрушаются;

– нарушается синтез витаминов и т.д.

При нарушении перистальтики ЖКТ замедляется скорость наступления лечебного эффекта, так, как лекарственное средство продвигается с пищевым комком.

Особенности действия ЛС при различных схемах приема препаратов

Схема приема препарата может предполагать длительный или повторный прием или одновременный прием нескольких лекарственных средств (**полипрагмазия**). Особенности действия в этих случаях могут проявляться в виде привыкания, ку-

муляции, синергизма, антагонизма, несовместимости, сенсibilизации, идиосинкразии, зависимости и других эффектах.

Синергизм (от греч. *synergism* – совместно действующий) – взаимодействие ЛВ, которое сопровождается усилением конечного эффекта. Синергизм проявляется в двух формах – суммирования и потенцирования эффектов. *Суммированный*, или *аддитивный* (от лат. *addition* – прибавление), эффект наблюдается при простом сложении эффектов каждого из ЛВ, например, при одновременном применении эфира и хлороформа для наркоза. *Потенцирование* представляет собой такое явление, когда общий фармакологический эффект двух или более веществ превышает сумму эффектов этих веществ. Например, наркотические анальгетики (морфин, промедол и др.) потенцируют действие средств для наркоза (фторотан, эфир и др.).

Комбинации лекарственных средств используют для предупреждения отрицательных (побочных) явлений. Так, при применении тетрациклина для предупреждения авитаминоза дополнительно назначают витамины, а для предупреждения кандидамикоза (грибкового заболевания), вызываемого дрожжами, – противогрибковые средства (нистатин и др.).

Антагонизм (от греч. *antagonism* – борьба, спор) это способность одного ЛВ в той или иной степени уменьшать эффект другого. Сами вещества, обладающие таким свойством, называются *антагонистами*. Антагонизм широко используется для лечения отравлений и лекарственных осложнений. Можно выделить химический, физический и функциональный антагонизм.

Физический антагонизм возникает в результате адсорбции вещества на поверхности адсорбента (активированного угля, белой глины, белков и др.). Классическим примером химиче-

ского антагонизма является адсорбция токсинов активированным углем. Поглощая яды на своей поверхности, активированный уголь препятствует их всасыванию в кишечнике и тем самым ослабляет или полностью снимает токсическое действие ядовитых веществ. *Химический* антагонизм наступает при химическом взаимодействии веществ и последующем образовании фармакологически неактивных продуктов. Химически действующие антагонисты называются **антидотами** (от греч. *anti* – против и *dotos* – данный или от лат. *antidotum* – противоядие). Например, при отравлении солями тяжелых металлов применяют *антидот «Унитиол»*. Примером антагонизма является связывание кислот щелочами (применение антацидов при повышенной кислотности желудочного сока). *Функциональный* антагонизм реализуется через действие веществ-антагонистов на функциональные системы организма. Функциональными антагонистами, например, являются средства, возбуждающие ЦНС (кофеин), и вещества, её угнетающие (морфин).

Как известно, лекарственные средства назначаются врачом для получения определенного терапевтического эффекта, и это называется *основным действием*. Однако наряду с желательными эффектами практически все ЛВ обладают неблагоприятными видами действия, т.е. *побочными действиями*, к которым относятся аллергические реакции, токсические эффекты, сывороточная болезнь, привыкание и т.д.

В последнее время практически во всех странах наблюдается увеличение числа случаев осложнений при приеме лекарственных средств. Осложнения, возникающие в процессе лекарственного лечения и после его окончания, клинически разнообразны и степень тяжести отрицательных явлений фар-

макотерапии очень широка: от кратковременного ощущения боли после инъекции, появления различных дерматитов и воспалений слизистых оболочек до быстро нарастающего шока, стойких поражений различных органов и систем организма, иногда приводящих к летальному исходу. Скорость возникновения отрицательных явлений при фармакотерапии также разнообразна. Эти реакции могут возникать при внутреннем и ингаляционном введении через считанные секунды, при внутримышечном, подкожном и других через несколько минут, но могут проявиться через несколько часов или даже недель от начала лечения. В большинстве случаев такая отложенная реакция не отмечается при первом приеме лекарства или проведении первого курса лечения. В это время происходит *сенситизация* организма, однако при повторном приеме или курсе лечения этим препаратом отрицательные реакции могут проявиться довольно быстро.

Повторное введение одного и того же лекарственного средства может вызвать **привыкание** (толерантность). Оно возникает при приеме снотворных, слабительных, сосудорасширяющих, болеутоляющих и других средств. Для получения нужного результата лечащий врач вначале увеличивает дозу лекарства (это не безопасно), а затем заменяет препарат на другой.

Во многих случаях привыкание – первый шаг к пристрастию. Под пристрастием понимают непреодолимое влечение человека к определенному веществу, желание принимать его как можно чаще для получения вполне определенного эффекта – *эйфории* (от греч. *eu* – хорошо и *phero* – переносу). Пристрастие развивается к морфину, героину, кокаину, многим психотропным и снотворным средствам, алкоголю. Подобное пристрастие и привыкание издавна называется *наркоманией*.

При повторном введении некоторых ЛВ возникает **кумуляция** (от лат. *cumulatio* – увеличение, скопление). Она может быть *материальной* (химической) и *функциональной* (физиологической) При материальной кумуляции ЛВ накапливаются в органах и тканях, что приводит к усилению их действия. И если доза не уменьшается, то и отравлении. Материальная кумуляция характерна для сердечных гликозидов наперстянки, бромидов, некоторых спотворных средств, солей тяжелых металлов. Функциональная кумуляция развивается при повторном введении вещества, когда эффект от предыдущего введения полностью не закончился и постепенно в организме накапливаются функциональные нарушения. Примером этого является хроническое отравление алкоголем (алкоголизм).

Сенсибилизация (от *sensibilis* – чувствительный) – процесс приобретения организмом повышенной чувствительности к повторно принимаемым препаратам, особенно белковой природы. По своему генезису сенсибилизация относится к аллергическим реакциям и проявляется в виде крапивницы, волдырей на коже, спазма бронхов, отеков слизистых, опуханий суставов.

Идиосинкразия (от греч. *idios* – своеобразный и *synkrosis* – смешение) – это повышенная, наследственно обусловленная чувствительность людей к определенным ЛВ. Связана она с наследственной недостаточностью некоторых ферментов (энзимой), участвующих в превращении ЛВ в организме. Идиосинкразия проявляется бурными аллергическими реакциями при приеме даже очень малых доз лекарственных средств.

В дозах, превышающих терапевтические, лекарственные вещества вызывают **токсические эффекты**, т.е. отравления. Они проявляются в виде серьезных нарушений различных функции органов и систем организма (снижение или полная потеря слу-

ха, слепота в результате поражения зрительного нерва, поражение печени и почек, нарушение процессов кроветворения, угнетение жизненно важных центров продолговатого мозга и др.) и даже смерти пациента. Причинами отравления являются:

1. случайность – нарушение правил хранения и применения ЛС;
2. преднамеренность – применение данного средства с целью самоубийства или убийства;
3. медицинские ошибки – передозировка, неправильное назначение препарата, одновременное назначение нескольких мало совместимых ЛС.

Формы отравления – острая, подострая, хроническая. Острая форма возникает при назначении и приеме ударных доз ЛВ в результате чего развиваются нарушения деятельности ЦНС, сердечно-сосудистой системы, желудочно-кишечного тракта, развивается гипоксия. Подострая форма возникает при неоднократном приеме ЛС и накоплении токсических веществ в организме. Это связано с кумуляцией ЛВ, например, сердечных гликозидов. Хроническая форма развивается при длительном приеме высоких доз ЛВ в течение 6–7 и более дней.

Токсические свойства разной степени отмечены у нескольких тысяч препаратов. Условно можно выделить такие группы лекарств с выраженными токсическими свойствами:

- 1) нейролептики (*нейро-* и греч. *lepsikos* – вбирающий) – психотропные вещества, снижающие психическое возбуждение (аминазин, терален, трифтазин, галоперидол и др.);
- 2) транквилизаторы (фран. *tranquilliser* – успокаивать) – психотропные вещества с противотревожным действием (диазепам, нитрозепама, феназепама и др.);

3) антидепрессанты – лекарственные средства, устраняющие признаки депрессии, улучшающие настроение (гептрал, флуоксетин и др.);

4) снотворные, вызывающие состояние близкое к естественному сну (зопиклон, нитрозепам и др.);

5) гипертензивные средства, повышающие артериальное давление, т.е. сосудосуживающие (нафтизин и др.)⁴

6) гипотензивные средства, снижающие артериальное давление (клофелин, энап, диротон и др.);

7) наркотические анальгетики, болеутоляющего действия. Подразделяются на природные (опий, морфин и др.) и синтетические (фентанил, промедол и др.). Все они вызывают привыкание;

8) не наркотические анальгетики – жаропонижающие (парацетомол) и

нестероидные противовоспалительные средства (аспирин, ибупрофен и др.);

9) витамины – А, С, D, E, фолиевая кислота, поливитамины.

Профилактика лекарственных отравлений заключается в том, что необходимо соблюдать предписания врача, правила хранения препаратов, соблюдать сроки годности и реализации ЛС, сохранять этикетки и надписи на упаковках, не превышать назначенную дозу и не заниматься самолечением.

Дисбактериоз – нарушение естественного состава микрофлоры кожи, слизистых оболочек ротовой полости и других органов. Это состояние развивается в результате угнетения и гибели сапрофитной (полезной) микрофлоры под влиянием антибиотиков. В результате размножаются патогенные грибы и возникают *кандидозы*. Эффективная профилактика сводится к

ограниченному применению антибиотиков широкого спектра действия.

Тератогенное (от греч. *teratos* – урод) действие лекарственных средств на плод. Структурные и функциональные дефекты развития плода возникают, как правило, в первые 2–3 месяца внутриутробного развития. Примерно у 3 % новорожденных отмечаются врожденные уродства, большая часть которых обусловлена эндогенными (хромосомными) факторами, а остальные являются результатом действия экзогенных факторов, в том числе и действие лекарственных средств. Внимание к возможному тератогенному действию ЛВ привлекла трагедия, связанная с применением *талидомида* – успокаивающего и снотворного средства, широко применявшегося в ФРГ и других странах мира в 60-е годы прошлого столетия. Талидомид обладал хорошо выраженным тератогенным действием. В период активного применения его беременными женщинами родилось несколько тысяч детей с различными аномалиями: листообразными конечностями, полным отсутствием верхних конечностей (амелия), аномалиями развития желудочно-кишечного тракта и др. В опытах на животных установлено, что целый ряд широко употребляемых лекарственных средств вызывает уродства у плода. К таким средствам относятся: витамины А, D, К в больших дозах, антибиотики, гормоны, алкоголь, наркотики, никотин и др. Профилактика нарушений развития плода заключается в воздержании женщины от приема лекарственных средств в первые месяцы беременности, полного отказа от алкоголя, табака.

Эмбриотоксическое действие лекарственных средств может развиваться в первые недели оплодотворения. Эмбриотоксическое действие обычно наступает при приеме больших доз

лекарственных средств, когда они переходят в слизистую оболочку матки, а затем попадают в эмбрион. Но возможно неблагоприятное воздействие ЛВ на плод и на более поздних стадиях беременности. Например, антибиотики группы тетрациклина отрицательно влияют на развитие костей у плода. Многие химические вещества проходят через плаценту, и поэтому фармакотерапию беременным следует проводить по строгим показаниям и избегать самолечения.

Мутагенное (от лат. *mutation* – изменение, перемена и греч. *genos* – род, происхождение), генетическое, действие может возникнуть вследствие применения лекарственных средств женщиной, иногда мужчиной в период гонадогенеза и эмбриогенеза. Мутагенные эффекты ЛВ стойко закрепляются в биологическом отношении и передаются по наследству. Мутагенный эффект вызывают те вещества, которые активно взаимодействуют с генами, т.е. с ДНК.

Из того, что сказано о побочных действиях лекарственных средств, взаимодействии их в организме, дозах и др., можно сделать следующий вывод: необходимо избегать так называемого самолечения, которое наносит огромный ущерб здоровью людей; при приеме лекарственных препаратов руководствоваться советами опытных специалистов, четко придерживаться схем лечения, внимательно изучать аннотации к лекарственным препаратам.

Побочное действие лекарственных средств может быть не аллергической и аллергической природы.

К не аллергическим побочным эффектам относятся следующие реакции организма, возникающие при приеме терапевтических средств:

- органотоксическое (нефротоксическое, гепатотоксическое и нейротоксическое);
- ототоксическое (поражение 8-ой пары черепномозговых нервов с возникновением тугоухости различной степени тяжести, вплоть до полной глухоты);
- тератогенное (развитие врожденных аномалий);
- мутагенное (повреждение генетического аппарата);
- эмбриогенетическое (приводит к отторжению плода и самопроизвольному выкидышу);
- канцерогенные (способность вызывать развитие злокачественных опухолей);
- диспептическое (вызывает нарушение микрофлоры кишечника).

К побочным эффектам аллергического происхождения относятся реакции, которые происходят из-за индивидуальной несовместимости лекарственного средства и организма. Лекарственное средство действует как антиген. В организме происходит накопление антител и при повторном введении лекарств в организм они взаимодействуют с антителами и формируют специфические ответные реакции – аллергические.

Лекарственная аллергия протекает по типу хорошо известных аллергических реакций, возникающих вследствие попадания в организм различных аллергенов. Она возникает в процессе приема лекарственных средств и имеет приобретенный характер (рис. 8).

Этот вид аллергии включает целую группу реакций и заболеваний - крапивница, дерматит, отёк Квинке, бронхиальная астма, анафилактический шок, сывороточная болезнь и целый ряд других.

Все лекарственные вещества и препараты можно разделить на две группы: полные антигены – лекарственные белковые препараты (сыворотки, плазма крови, вакцины и др.) и неполные антигены (гаптены), последние являются химическими соединениями различного молекулярного веса. Гаптены достаточно легко соединяются с белками крови, слизистых оболочек, мышц, кожи и образуют очень своеобразные комплексные соединения и превращаются в полные антигены, вызывающие образование антител. К таким лекарственным средствам относятся полусинтетические пенициллины, ПАСК, сульфаниламиды, эуфиллин, новокаин, дикаин, солутан и др.

Аллергическая реакция к ЛС может проявиться по немедленному (через несколько минут или до 1,5 часов от начала контакта с аллергеном), замедленному (через сутки или более), смешанному типу.

Лекарственная аллергия часто характеризуется острым течением заболевания (с лихорадкой или без нее) и может возникать в любом органе и системе. Однако чаще всего она проявляется на кожных покровах с наличием сильного зуда. Многие вопросы лекарственной аллергии до сих пор не выяснены. Например, нет точного ответа на вопрос о том, почему лекарственная аллергия возникает у 10–15 % людей. Вероятно, это связано с тем, что она бывает чаще всего у людей, склонных к сенсibilизации.

Выделяют следующие виды аллергических реакций:

1. Реакции анафилактические и атопические:

- кожный синдром, крапивница, нейродермит, отёк Квинке, атопический дерматит;
- аллергический ринит, блефарит, конъюнктивит;

– бронхиальный синдром: ларингит, трахеит, астматический бронхит, бронхиальная астма;

– сердечно-сосудистый синдром: анафилактический шок,

2. Реакции цитолитические:

– кожный синдром: эритродермия, токсидермия;

– гематологический синдром: лейкоцитоз, анемии, лимфоцитоз, эозинофилия;

3. Реакции иммунных комплексов: сывороточная болезнь.

4. Гиперчувствительность замедленного типа:

– кожный синдром: дерматит, экзема;

– сердечно-сосудистый синдром: аллергический миокардит;

– желудочно-кишечный синдром: аллергические гепатит, гастрит, панкреатит;

– почечный синдром: аллергический нефрит;

– сочетанные синдромы: кожный-бронхолегочный, кожно-конъюнктивальный.

Взаимодействие лекарственных веществ – чрезвычайно сложный процесс, о характере которого трудно судить даже специалисту. Поэтому врачи назначают больным только хорошо известные и проверенные комбинации лекарственных средств. Люди, занимающиеся самолечением, очень часто принимают одновременно несколько лекарственных препаратов, о комбинированном действии которых зачастую не имеют ни малейшего представления, и этим наносят непоправимый ущерб своему здоровью.

Могут ли быть несовместимые сочетания ЛВ? Разумеется, могут. Различают два вида несовместимости лекарственных средств: фармакологическую и фармацевтическую.

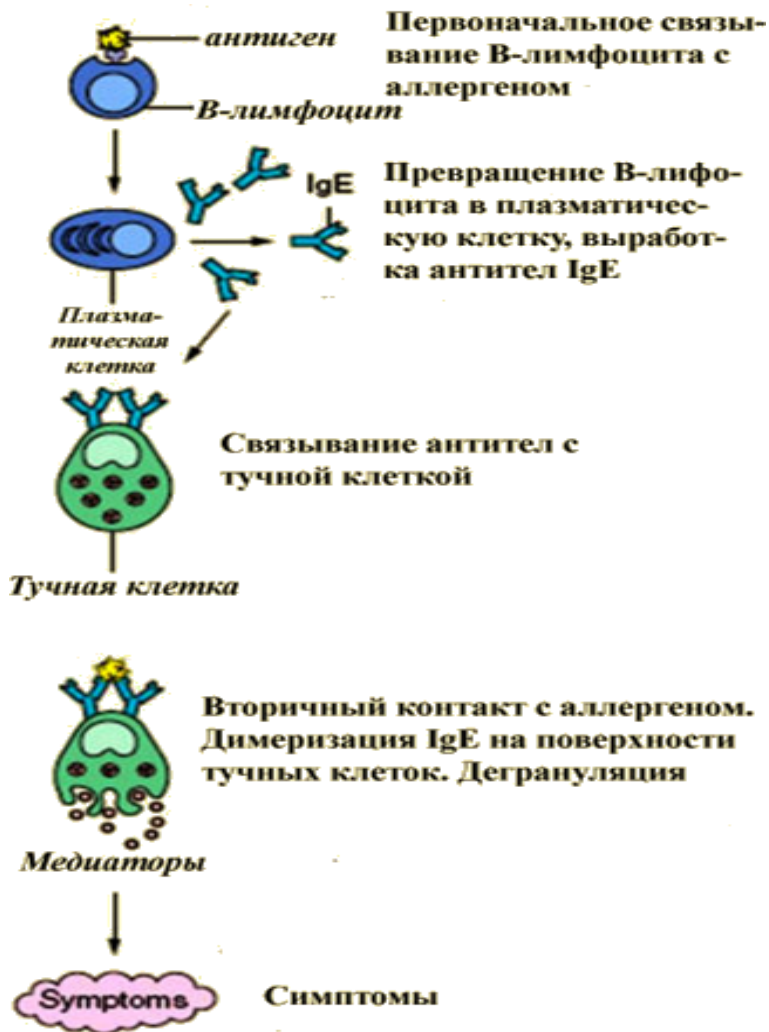


Рис. 8. Механизм развития аллергической реакции

Фармакологическая несовместимость возникает при применении двух или более ЛВ, изменяющих деятельность тканей и органов в противоположных направлениях. В основе та-

кой несовместимости лежат разные виды антагонизма. Например, несовместимо применение снотворных средств с препаратами, возбуждающими ЦНС. Надо знать, что алкоголь (этиловый спирт) при совместном применении изменяет свойства более 100 ЛВ. При этом могут возникнуть некоторые эффекты (табл. 2).

Таблица 2

Эффекты совместного применения алкоголя и ЛВ

| Сочетания | Результат |
|---|--|
| Алкоголь+ аспирин | Язва желудка |
| Алкоголь + кофеин, эфедрин, теофедрин | Гипертонический криз |
| Алкоголь + мочегонные, гипотензивные средства | Резкое падение артериального давления |
| Алкоголь + парацетамол | Токсическое поражение печени |
| Алкоголь + инсулин, сахароснижающие препараты | Резкое падение уровня глюкозы в крови, гипогликемическая кома |
| Алкоголь + нейролептики, противовоспалительные и обезболивающие | Инттоксикация, сонливость |
| Алкоголь + снотворное, транквилизаторы | Инттоксикация, мозговая кома |
| Алкоголь + антибиотики, сульфаниламиды | Отсутствие лечебного эффекта, непереносимость лечебных средств |
| Алкоголь + нитроглицерин | Усиление болевого синдрома, падение давления |
| Алкоголь + антигистаминные препараты (димедрол и др.) | Проявления аллергии, депрессия, усиливают сонливость |

Приводим список лекарственных средств несовместимых с алкоголем:

- Психотропные (меняют состояние психики) препараты: аминазин, эфедрин, кодеин, тазепам, глицин, радедорм, реланиум.
- Болеутоляющие: баралгин, темпалгин, солпадеин.
- Противоаллергические, антигистаминные препараты: димедрол, пи-польфен, супрастин, тавегил, диазолин и др.
- Средства от простуды и кашля: кодтерпин, солутан, колдрекс, терафлю, фервекс.

Фармацевтическая несовместимость может возникнуть при одновременном применении нескольких ЛВ в виде смесей, при этом могут возникнуть прямые физические и химические взаимодействия, которые делают невозможным применение таких смесей. Характерными признаками физической и химической несовместимости являются изменение цвета препарата, образование осадка в растворе или выделение газов. Эти признаки свидетельствуют об опасности применения такой импровизированной смеси. Например, несовместимы в химическом отношении соли кислот и оснований, при их смешении образуются осадки.

Вопросы для самоконтроля

1. Что такое главное и побочное действие ЛС?
2. Каковы особенности побочных действий ЛС на организм человека?
3. Основные механизмы действия ЛС?
4. Рассмотрите механизм развития аллергической реакции.

7. ЛЕКАРСТВА НАШЕГО ОРГАНИЗМА

Мы уже отметили, что существует множество определенных здоровья. Но каким бы полным и исчерпывающим не было бы определение здоровья, в нем всегда присутствует слово «болезнь», и получается, что понятия «здоровье» и «болезнь» неразделимы. Наше здравоохранение занимается лечением больных, а не охраной здоровья здоровых людей.

В одном из первых изданий «Словаря русского языка» С.И. Ожегова, вышедшем в 1949 г., дано следующее определение: «Здоровье – правильная, нормальная деятельность всего организма». Это ненаучное определение здоровья, оно перекликается с другим ненаучным определением: здоровье – это такое состояние организма, которое позволяет сохранить здоровье. Многие болезни проходят самостоятельно, естественным образом. В доантибиотическую эру от пневмонии и других инфекционных заболеваний погибали далеко не все больные. Даже в период самых страшных эпидемий чумы, холеры, черной оспы и др. значительное число людей не болели и выживали, ухаживали за больными и хоронили умерших. Пандемии гриппа уносят много жизней, но подавляющая масса людей не имеет ни каких признаков заболевания. Около 40 % случаев заболевания инфарктом миокарда «немые», остаются в виде рубцов, диагностируются ретроспективно через много лет на аутопсии (посмертном вскрытии). Из этого следует, что больной может выздороветь и без лечения. Всех больных пытаются лечить в

силу одной веской причины: медицина пока не располагает мерой индивидуального прогноза. Существует несколько мифов современной медицины:

Миф 1. Болезни проходят благодаря своевременному лечению, и поэтому всех больных надо лечить.

Миф 2. Заболевший человек должен обязательно обратиться к врачу за помощью.

Миф 3. Пациент должен добросовестно выполнять все рекомендации лечащего врача.

Миф 4. Если пациент предъявляет «соматические» жалобы, его болезнь имеет органическую природу.

К врачу обращаются далеко не все заболевшие. Одни болеют, но к врачам на прием не ходят, другие, например, ипохондрики, непрерывно лечатся (это смысл их жизни), третьи, считающие себя абсолютно здоровыми (гипертония как молчащая проблема здоровья), внезапно умирают. Пациент обратился к врачу, получил определенные назначения и рекомендации. Их выполняет, от силы, треть обратившихся. По собственной инициативе лечение прекращают, субъективно почувствовав улучшение, подавляющее большинство пациентов. Это говорит о низком уровне самоохранительного поведения. В российской ментальности, к сожалению, авторитет врача принижен, многие рекомендации опровергаются «кухонным консилиумом» с участием знакомых и родственников под огромным влиянием телевизионной рекламы и различных около медицинских программ, а так же достаточно сомнительной литературы.

Мы должны помнить, что граница между здоровьем и болезнью подчас условна и индивидуальна. Один человек банальный насморк возводит в ранг мировой трагедии и требует всеобщего внимания, забот и разнообразных лекарств, болеет

долго и упорно и получает комплекс осложнений. Другой же, узнав об очень серьезном или даже неизлечимом сегодня заболевании, собирает волю в кулак, продолжает активную деятельность, живет полнокровной жизнью и даже выздоравливает назло всякой статистике. Гиппократ произнес очень интересную фразу: *«Каждый человек болеет только той болезнью, которой может болеть»*.

Сейчас мы можем объяснить, почему при многих тяжелых заболеваниях у человека повышается температура, вырабатываются антитела, иммуноглобулины, простогландины и другие очень сложные химические соединения, позволяющие нашему организму восстанавливать здоровье. Оказывается, в организме человека скрыта целая фармацевтическая лаборатория, вырабатывающая свои собственные лекарства. Известный врач академик Р.В. Петров писал: «Первыми лекарствами, выделенными из организма и примененными в медицине, были защитные белки-антитела, вырабатываемые иммунной системой».

Человек постоянно контактирует с микроорганизмами, как полезными, так и очень опасными, вызывающими многие заболевания. Но организм человека умеет бороться с опасными бактериями. Главным механизмом этой борьбы является *иммунная* система человека.

Иммунитет (от лат. *immunitas* – освобождение, избавление) – невосприимчивость, устойчивость организма к инфекциям и чужеродным структурам, способность защищаться от них, а также избавляться от собственных клеток и структур, утративших нормальные функции, от мутантных и изношенных клеток, образовавшихся в процессе метаболизма токсических веществ. Иммунитет является одним из главных компонентов гомеостаза и ответной реакцией на воздействие болезнетворного агента – ан-

тигена. Антигены – любые чужеродные вещества или ставшие ими структуры самого организма, вызывающие иммунный ответ. Их подразделяют на следующие группы:

- Эндогенные антигены (аутогены) образуются в организме из собственных тканей при ожогах, травмах, инфекциях и т.д.

- Экзогенные антигены привнесены извне, микроорганизмы, вирусы и т.п.

- Аллергены – это антигены, вызывающие аллергию, это различные белки.

- Изоантигены – это агглютиногены, определяющие группу крови.

- Резус-фактор генетически присущий организму.

Антигены вызывают образование *антител*. Антитела (АТ) – сложные специфические белки, которые образуются клетками лимфоидных органов позвоночных при введении антигенов. Сейчас известно, что антитела представляют собой *иммуноглобулины* (Ig) сыворотки крови человека или животных. Иммуноглобулины подразделяются на пять классов: IgM, IgG, IgA, IgE, IgD. Строение и свойства их сильно различаются:

- IgM – наиболее ранний класс АТ, обнаруживаемый при попадании антигена в организм. Наличие IgM указывает на начало острого инфекционного процесса.

- IgG – основной класс АТ (более 75 % всех Ig), защищающий организм от вирусов, бактерий и токсинов.

- IgA секретируется на поверхности эпителиев, присутствует в слюне, молоке, слезах, выделяется на поверхность слизистых оболочек и способствует усилению их защитных свойств. На долю этого АТ приходится до 20 %.

- IgE направлен преимущественно против различных нематод (гельминтов) и синтез его усиливается при глистных инвазиях.

- Биологическая роль IgD окончательно не установлена, но известно, что его обнаруживают у больных бронхиальной астмой, системной красной волчанкой и различными иммунодефицитами.

Имуноглобулины (гаммаглобулины) из человеческой крови в виде сывороток применяют для лечения кори, полиомиелита, коклюша, вирусного гепатита, скарлатины, оспы и др. инфекционных заболеваний. Например, в практике широко используется препарат *«имуноглобулин человеческий нормальный»*.

В человеческом организме были обнаружены вещества, способные стимулировать и активизировать все внутренние резервы защиты – **лимфокины**. Сейчас их известно несколько десятков, а в медицинской практике применяются интерфероны и интерлейкины. *Интерлейкин 2 человеческий рекомбинатный*, используется для лечения септических состояний, некоторых злокачественных новообразований, *имуноглобулин альфа* – для лечения вирусных гепатитов, лейкоза, вирусных инфекций и др., *интерферон бета-1 а* – для лечения рассеянного склероза, *интерферон бета-1 b* – для лечения врожденных и приобретенных иммунодефицитов.

В человеческом организме постоянно образуются белки, гормоны, ферменты и др. вещества, позволяющие бороться со многими болезнями.

Вопросы для самоконтроля

1. Как организм человека может бороться с болезнью?
2. Охарактеризовать иммунитет и его особенности.

8. БИОЛОГИЧЕСКИ АКТИВНЫЕ ДОБАВКИ

Впервые БАДы появились в широкой практике в 60-е годы XX столетия в США. Первоначально они были достаточно простыми комплексами из витаминов и минеральных веществ. Впоследствии в их состав стали включать различные компоненты растительного и животного происхождения, в том числе и экзотические.

БАДы – биологически активные добавки к пище – это концентраты природных натуральных биологически активных веществ, выделенные из пищевого сырья растительного, животного и минерального происхождения или полученные путем химического синтеза веществ, идентичных природным. БАДы, согласно закону РФ «О качестве и безопасности пищевых продуктов», относятся к пищевым продуктам, т.е. источникам макро- и микронутриентов и природных биологически активных веществ растительного и животного происхождения.

Пища должна обеспечивать организм человека энергией и самыми разнообразными веществами, необходимыми для нормальной жизнедеятельности. Качественный и количественный состав пищи – основа обеспечения всех физиологических потребностей нашего организма. Но, к сожалению, составить такую сбалансированную диету, которая полностью компенсирует потребности организма в макро- и микроэлементах, витаминах, аминокислотах и других биологически активных веществах, крайне сложно. В рационе современного человека масса рафи-

нированных продуктов, в муке и хлебе почти нет пищевых волокон и витаминов, но даже доступные картофель, свекла и др. овощи могут содержать нитраты и другие загрязнители. Можно сказать, что наше питание далеко от идеального и частично его можно скорректировать с помощью БАДов. Биологически активные добавки к пище призваны дополнить рацион активными веществами, позволяющими сохранить здоровье или предупредить развитие заболевания. Естественно, что БАДы не могут избавить от всех болезней, но нет сомнения, что их применение может способствовать профилактике ряда заболеваний, например, диабета, йодной недостаточности, анемии и др.

Согласно современной классификации все БАДы делятся на два класса: нутрицевтики (источники пищевых веществ) и парафармацевтики (источники физиологически (терапевтически) активных веществ).

К **нутрицевтикам** относятся БАДы, содержащие белки, аминокислоты, углеводы, высшие жирные кислоты, витамины, пищевые волокна. Эти БАДы широко используются для организации диетического питания, питания спортсменов, коррекции веса, для наращивания мышечной массы и т.д.

Парафармацевтики, строго говоря, не являются лекарственными препаратами, хотя содержат биологически активные вещества, например: флавоноиды, алкалоиды те же витамины и др. Эти вещества стимулируют и регулируют многие функции органов и систем организма. И именно это приближает БАДы к лекарственным средствам и обуславливает особое обращение с ними.

Необходимо отметить, что и те и другие проходят определенные уровни контроля действия на организм человека, например, на токсичность, но никогда не проходят стадию кли-

нического эксперимента. Кроме того, одной из особенностей парафармацевтиков является то, что они являются аналогами уже известных растительных или фармацевтических средств, которые уже прошли все стадии клинической проверки (например, проантоцианидин, который может быть получен как побочный продукт при производстве некоторых синтетических материалов и является составной частью сока красной смородины и аналогом унитиола).

Рассмотрим некоторые области применения БАДов и остановимся на проблемах безопасности. Одним из важнейших компонентов БАДов являются витамины. Они совершенно необходимы для нормальной жизнедеятельности организма человека, их дефицит приводит к возникновению авитаминозов. Но при этом не всегда учитываются неблагоприятные последствия при использовании витаминов в высоких и сверхвысоких дозах, не принимается во внимание взаимодействие их с другими компонентами БАДов и препаратами, применяемыми одновременно с БАДами. Например, известно, что витамин А (токоферол) обладает тератогенным свойством, поэтому беременным женщинам не рекомендуется применять его в дозах выше 10000 МЕ. В случае использования в период беременности БАД в составе которого имеется витамин А в допустимых дозах, все равно есть риск превышения дозы, если женщина не информирована о том, что ей следует избегать других дополнительных источников поступления витамина.

Многие биодобавки содержат вещества адаптогенного и тонизирующего действия, которые стимулируют защитные свойства организма, повышают общую устойчивость и жизненный тонус, физическую и умственную работоспособность, снижают отрицательное действие стрессов и окружающей среды.

Таковыми свойствами обладают препараты, получаемые из таких растений, как аралия, заманиха, золотой корень, женьшень, левзея, пион, лимонник, элеутерококк и др., а так же из органов животных (панты марала), цветочной пыльцы, прополиса и т.д. В БАДах вышеперечисленные компоненты содержатся в комплексах с витаминами, пищевыми волокнами и др. веществами. Применять такие БАДы рекомендуется только после консультации с врачом.

В состав многих БАДов входят морские водоросли (ламинария, фукус, спирулина, аскофиллум и др.). Это прекрасные источник легко усвояемого белка, углеводов и различных минеральных веществ, главным из которых является йод, необходимый для нормальной работы щитовидной железы. БАДы, обогащенные йодом, широко используются для профилактики эндемической недостаточности йода. Водоросли ускоряют выведение радионуклидов, солей тяжелых металлов и ряда токсинов из организма, они стимулируют иммунитет и поэтому могут быть рекомендованы как профилактическое средство людям, живущим на загрязненных территориях.

Большую роль в позитивном действии БАДов играют пищевые волокна. Основными видами пищевых волокон являются целлюлоза, лигнин, гемицеллюлоза. Они не усваиваются организмом, но придают ощущение сытости, поэтому их рекомендуют в состав диет, направленных на снижение массы тела. В рационе человека их должно быть не менее 30–50 г в сутки. Современные технологии обработки пищевого сырья ведут к практически полному разрушению пищевых волокон. А они нужны не только для того, чтобы чувствовать себя сытым, пищевые волокна способствуют нормализации уровня холестерина в крови, стабилизации уровня сахара, влияют на работу желудочно-

кишечного тракта, являются сорбентами многих токсических веществ и соединений, например: тяжелых металлов, радионуклидов и т.д. Пищевые волокна применяются для профилактики рака прямой кишки, сахарного диабета, запоров, ожирения и т.д. Одним из важнейших источников пищевых волокон являются отруби. В состав БАДов, применяемых для коррекции веса, входит МКЦ (микрористаллическая целлюлоза). Некоторые БАДы наряду с пищевыми волокнами содержат цеолиты – минералы, являющиеся отличными сорбентами. Они способствуют выведению из организма низкомолекулярных опасных веществ (метан, сероводород): ионов тяжелых металлов, радионуклидов и др. соединений.

Эффективными биодобавками являются те, которые содержат пивные дрожжи, сою, яичные желтки. Указанные продукты содержат лецитин – пластический материал для клеточных мембран, нервной ткани, сосудов головного мозга. Пивные дрожжи содержат комплекс витаминов (особенно группу В), микроэлементы, белки и др. вещества, они нормализуют пищеварение, обмен веществ, активизируют иммунную систему, помогают выводить из организма ионы тяжелых металлов, радионуклиды и различные токсины. Применяют БАДы с яичным желтком, соей и пивными дрожжами при витаминной недостаточности, белковом голодании, малокровии, снижении иммунитета, для профилактики здоровья в экологически неблагоприятных районах.

Большую группу БАДов составляют лечебно-профилактические чаи. Чайями их называют не потому, что они содержат листья чая, а потому, что их заваривают похожим образом. По эффекту такие БАДы приближаются к лекарственным препаратам, изготовленным из лекарственных растений, и поэтому

они внесены в реестр лекарственных средств и применять их следует под контролем врача, соблюдая все противопоказания. Различают лечебно-профилактические чаи для нормализации пищеварения, обмена веществ, нормализации массы тела, профилактики некоторых заболеваний и т.д.

К БАДам предъявляется целый ряд требований. Они не должны иметь серьезных побочных эффектов, содержать наркотические (эфедрин и др.), ядовитые (хром, селен, мышьяк, кобальт и др.) и сильнодействующие вещества. Хром может входить в состав биодобавок для коррекции веса, но в больших дозах он вызывает поражение почек. Запрещено использовать в БАДах различные алкалоиды, которые могут вызвать привыкание и зависимость от них.

Сейчас в Российской Федерации разрешено использование нескольких тысяч БАДов. Реклама биодобавок обещает людям замедление старения, быстрое снижение веса, победу над раком и многое другое. Это все вызывает у потребителя эффект завышенных ожиданий и в конце концов подрывает доверие к БАДам и даже медицине в целом.

Сегодня БАДы и другие пищевые добавки вошли в нашу жизнь. Это требование времени и экологии, вызванное необходимостью компенсации несбалансированного питания и профилактики заболеваний. Но ждать от БАДов чуда не следует. Просто их надо грамотно и продуманно использовать.

Вопросы для самоконтроля.

1. Что такое парафармацевтики?
2. Что такое нутрицевтики?
3. Какую опасность могут представлять БАДы для человека?

10. СРЕДСТВА МЕДИКАМЕНТОЗНОЙ ЗАЩИТЫ ПРИ ЧРЕЗВЫЧАЙНЫХ СИТУАЦИЯХ

Медицинские средства защиты при чрезвычайных ситуациях – это медицинские препараты, перевязочный материал и специальные средства, предназначенные для предупреждения или снижения эффекта воздействия поражающих (негативных) факторов и профилактики осложнений.

К медицинским средствам защиты относятся обезболивающие, радиозащитные (радиопротекторы, комплексоны, адсорбенты, адаптогены, стимуляторы ЦНС и кроветворения и антигеморрагические препараты), антибактериальные средства (антибиотики, сульфаниламидные препараты, дезинфицирующие средства), медицинские рецептуры от ОВ (антидоты и специальные химические рецептуры нейтрализующие отравляющие вещества) и различные перевязочные средства.

Медицинские средства защиты делятся на коллективные и индивидуальные. К коллективным средствам защиты принадлежат бортовые аптечки, которыми комплектуются все автомобили и боевые машины, санитарные сумки, имеющиеся в подразделениях ГО, и комплекты медицинского имущества, предназначенные для оказания медицинской помощи в очагах поражения. Санитарная сумка имеет набор медикаментов, достаточный для оказания первой медицинской помощи 15–20 раненым и пораженным.



Рис.9 . Аптечка индивидуальная

К индивидуальным средствам защиты относятся индивидуальная аптечка (АИ-2), пакет индивидуальный перевязочный и индивидуальный противохимический пакет (ИПП-8 или ИПЛ-10).

Аптечка индивидуальная (АИ-2) предназначена для оказания само- и взаимопомощи при чрезвычайных ситуациях и в очагах массового поражения. Аптечка (рис. 9) представляет собой пластмассовый футляр оранжевого цвета, размером 9,5x8,5x2 см, массой около 100 гр.

Внутри футляр разделен на 7 гнезд, в которых размещены разноцветные пеналы разной формы и шприц-тюбик, содержащие лекарственные средства.

Разная форма пеналов позволяет находить их на ощупь в темноте.

Гнездо № 1. В нем находится шприц-тюбик с 2% раствором промедола, мощного противоболевого средства. Промедол применяют при переломах, ожогах, обширных ранах. При использовании необходимо шприц-тюбик извлечь из гнезда и,

взяв его за основание правой рукой, а левой – за ребристый ободок канюли, энергичным вращательным движением продвинуть её до упора по ходу часовой стрелки. Снять защитный колпачок, защищающий иглу и, держа шприц-тюбик иглой вверх, выдавить из него воздух до появления капельки жидкости на кончике иглы. Не касаясь иглы руками, резким колющим движением ввести ее в мягкие ткани бедра, предплечья или наружного верхнего квадранта ягодицы (в экстренных случаях укол делают через одежду). Сильно сжимая тюбик пальцами, выдавить из него содержимое, а затем извлечь иглу, не разжимая пальцы, чтобы в тюбик обратно не всосалась жидкость. Использованный тюбик приколоть к одежде на видном месте. Это будет сигнал врачу о том, что пострадавший получил противоболевое средство.

Гнездо № 2. В нем размещен круглый пенал красного цвета с таблетированным антидотом (противоядием) против нервно-паралитических ОВ – тареном (6 таблеток). При угрозе отравления принимают одну таблетку под язык, при появлении признаков отравления необходимо принять еще одну таблетку тарена. Повторный прием препарата возможен только через 5-6 часов.

Гнездо № 3. В нем находится большой круглый пенал белого цвета с противобактериальным средством 2 (15 таблеток сульфадиметоксина). Препарат применяют при желудочно-кишечных расстройствах, возникающих после облучения: в первые сутки – 7 таблеток на прием, в последующие двое суток – по 4 таблетки.

Гнездо № 4. В нем размещены два восьмигранных пенала розового цвета с радиозащитным средством № 1 цистамином (по 6 таблеток в пенале). Цистамин уменьшает количество сво-

бодных радикалов, ионизированных и возбужденных молекул, образующихся в тканях при облучении. За 30–40 минут до облучения следует принять 6 таблеток. При новой угрозе облучения или продолжающемся облучении через 4 часа принять еще 6 таблеток.

Гнездо № 5. В нем находятся два четырехгранных пенала без окраски, в которых находится противобактериальное средство № 1 – антибиотик тетрациклина гидрохлорид, по 5 таблеток в каждом пенале. Содержимое первого пенала принимают при угрозе бактериального заражения или при заражении. 5 таблеток из следующего пенала принимают через 6 часов.

Гнездо № 8. В нем находится четырехгранный пенал белого цвета с йодистым калием (радиозащитное средство № 2, всего 10 таблеток). Это средство следует принимать по одной таблетки в день в течение 10 дней после выпадения радиоактивных осадков, особенно при употреблении в пищу свежего молока. Этот препарат предупреждает поражение щитовидной железы радиоактивным изотопом йода-131. Молоко коз и коров, пасшихся на зараженной территории, может быть источником поступления этого изотопа в организм человека.

Гнездо № 7 (круглый пенал синего цвета). В нем находится этаперазин (5 таблеток). Препарат применяется при проявлении первичной реакции на облучение для предупреждения рвоты, а также при черепно-мозговых травмах.

Детям до 8 лет средства медикаментозной защиты из АИ-2 дают на один прием $1/4$ дозы взрослого, детям от 8 до 15 лет – $1/2$ дозы взрослого.



Рис. 10. Индивидуальный противохимический пакет

Противоболоеое и радиозащитное средство № 2 дается в полной дозе. **Индивидуальный противохимический пакет** (рис. 10). ИПП-8, ИПП-10 предназначены для обеззараживания отравляющих веществ, попавших на открытые участки тела, одежду и индивидуальные средства защиты, например, противогаз.

Пакет состоит из флакона с дегазирующей жидкостью и ватно-марлевых тампонов.

Обнаружив капли ОВ на одежде, коже или предметах необходимо:

- вскрыть пакет и смочить один из тампонов дегазирующей жидкостью;
- протереть тампоном открытые участки тела (шею, руки, лицо и др.);
- смочить жидкостью еще один тампон и протереть манжеты, воротник и другие части одежды, прилегающие к открытым участкам кожи;

– обильно смочить еще один тампон и промокательными движениями пропитать одежду до кожи в местах попадания капель ОВ и обработать маску противогаза, если он применялся.

Если вид ОВ (АХОВ) не установлен и нет индивидуального противохимического пакета дегазацию можно провести следующим образом. Кожные покровы, одежда, предметы и материалы обрабатываются щелочным раствором 5 % аммиака, а затем хлорактивным раствором, например, 10 % раствором хлорамина или 5 % раствором дихлорамина или хлорно-известковым молоком (1 часть извести на 9 частей воды).

Пакет перевязочный индивидуальный (рис.11).



Рис. 11. Пакет перевязочный индивидуальный

Состоит из двух ватно-марлевых подушечек размером 32x17,5 см, (одна подушечка пришита на конце бинта, а другая свободно передвигается по бинту), бинта шириной 10 см и длиной 7 м, есть безопасная булавка. Перевязочный материал пакета стерильный, он завернут в пергаментную бумагу и поме-

щен в чехол из прорезиненной ткани. Внутренняя сторона чехла также стерильна. Чехол используется для наложения герметичных повязок. На чехле напечатаны правила пользования пакетом. Используется пакет для перевязки ран, наложения окклюзионной повязки при открытом пневмотораксе.

Отправляясь в путешествие или на отдых следует взять с собой аптечку. Заболеть мы можем всегда, даже во время самого приятного путешествия, и надо быть готовым оказать первую медицинскую помощь самому себе и другому человеку, попавшему в беду. Собирая аптечку надо положить в нее самое необходимое.

1. Пластырь. Либо обычный в рулоне, либо бактерицидный, который хорошо обеззараживает мелкие ранки, порезы.

2. Перевязочный материал (бинт, марля, вата). Лучше взять стерильный бинт или ИПП. Марля необходима для обработки ран и всевозможных хозяйственных нужд. Вата – обязательное приложение к бинтам и дезинфицирующим средствам: йоду, зеленке, перекиси водорода и др. Вата нужна и для компрессов, если в них возникает необходимость.

3. Антисептические средства: раствор йода в ампулах, перекись водорода (можно в виде таблеток гидропирита), зеленка и др. Данными средствами обрабатывают ранки, ссадины и царапины.

4. Раствор аммиака (нашатырный спирт). Применяется для возбуждения дыхания и выведения из обморочного состояния. Для чего осторожно подносят шарик ваты, смоченный аммиаком к носу пострадавшего.

5. Кровоостанавливающий жгут. Такой жгут продают в аптеке, и его обязательно надо иметь в аптечке.

6. Лекарства. Их должно быть несколько групп. Совершенно необходимы болеутоляющие и жаропонижающие, например: анальгин, пенталгин, аспирин, парацетамол. Нужны желудочно-кишечные препараты: смекта, регидрон, гастал для снятия изжоги. Сердечные и успокаивающие: валидол, валокордин, таблетки валерианы и др. Если вы постоянно принимаете определенный препарат или возможно обострение хронического заболевания, иметь в аптечке свое лекарство совершенно необходимо.

7. Дезинфицирующие средства. Для обеззараживания воды можно использовать активированный уголь в таблетках, полисорб, перманганат калия (марганцовка).

Аптечку лучше всего упаковать в коробку и хранить в легкодоступном месте.

Вопросы для самоконтроля.

1. Что такое средства индивидуальной защиты?
2. Что входит в состав аптечки индивидуальной (АИ-2)?
3. Каков состав аптечки путешественника?

КРАТКИЙ ТЕРМИНОЛОГИЧЕСКИЙ СЛОВАРЬ

Абсорбция – всасывание.

Абстиненция – синдром отмены препарата в случае формирования зависимости к нему.

Агонизм – способность лекарственного вещества при взаимодействии с рецептором стимулировать его.

Активный транспорт – один из механизмов проникновения лекарственных веществ в клетку.

Антагонизм – способность лекарственного вещества угнетать стимуляцию рецептора.

Аптека – учреждение для изготовления, отпуска и хранения лекарственных препаратов.

Аффинитет – сродство лекарственного вещества к рецептору.

Базисное лекарственное вещество – это вещество, входящее в состав лекарственного препарата, обеспечивающее его главное фармакотерапевтическое действие.

Биодоступность – отношение количества неизменного лекарственного вещества, достигшее кровяного русла после биотрансформации, к общему количеству его, введенного в организм.

Биоритмы – суточные, сезонные колебания физиологических функций организма.

Биотрансформация – совокупность физико-химических, биохимических превращений лекарственных веществ.

Вспомогательные вещества – вещества, которые вводятся в лекарственные препараты для коррекции вкуса, запаха или формообразования.

Главное действие лекарств – действие, которое обеспечивает необходимый (требуемый) лечебный эффект.

Детоксикация – комплекс медицинских мероприятий по освобождению организма от токсического воздействия препарата.

Дженерик – лекарственный препарат (лекарство), изготовленный по лицензии.

Доза – количество лекарственного средства на один прием.

Зависимость лекарственная – болезненное пристрастие к определенному средству, ведущее к хроническому отравлению.

Интоксикация лекарственная – отравление организма при приеме завышенных доз лекарства.

Конъюгация – биосинтетический процесс присоединения к молекуле лекарственного вещества или его метаболиту эндогенных соединений.

Кумуляция = накопление лекарственного вещества в организме.

Лекарственная интоксикация – отравление.

Лекарственная форма – форма (таблетки, драже и т.д.), придаваемая лекарственным средствам для получения оптимального лечебного эффекта.

Лекарственное средство – одно или комбинация нескольких лекарственных веществ, применяемых для лечения или профилактики заболеваний.

Лекарственный препарат – лекарственное средство, приготовленное в определенной лекарственной форме.

Медиаторы – вещества, которые высвобождаются из нервных окончаний и действуют на рецепторы.

Несовместимость фармакологическая – неадекватная реакция на введение в организм одновременно нескольких лекарств с усилением побочных эффектов и проявления токсического действия.

Несовместимость фармацевтическая – изменение свойств лекарств в процессе хранения или смешивания их в растворе.

Парентеральное введение лекарств – введение в организм, минуя желудочно-кишечный тракт.

Патогенетическая терапия – применение лекарств для устранения механизма заболевания.

Полипрагмазия – одновременное неоправданное назначение большому множеству лекарственных средств.

Превентивная (профилактическая) терапия – применение лекарств с целью предупреждения развития заболевания.

Привыкание – значительное понижение чувствительности организма к лекарству, требующее увеличения его дозы.

Резорбтивное действие – действие лекарственного вещества после попадания его в общий кровоток.

Рефлекторное действие – действие, которое проявляется изменением состояния нервных центров или исполнительных органов, результат местно-раздражающего действия рецепторов.

Рецепт – письменное обращение врача в аптеку об отпуске лекарственного средства в соответствующей лекарственной форме и дозировке пациенту.

Симптоматическая терапия – прием лекарственных препаратов для снижения или полного устранения проявления симптомов определенного заболевания.

Синергизм – одна из реакций организма на комбинированное влияние двух и более лекарств, характеризуется тем, что это действие превосходит действие, проявляемое каждым ингредиентом в отдельности.

Толерантность – привыкание при приеме лекарственных препаратов, т.е. снижение пороговой чувствительности к препарату.

Фармакогенетика – направление фармакологии, изучающее действие лекарств в зависимости от генетического полиморфизма.

Фармакодинамика – раздел фармакологии, изучающий совокупность эффектов, вызываемых лекарственными веществами и средствами, механизм и локализацию их.

Фармакокинетика – раздел фармакологии, изучающий процессы поступления лекарственных веществ в организм, процессы распределения, биотрансформации и выведения из организма этих лекарственных веществ.

Фитотерапия – способ лечения и профилактики заболеваний с использованием лекарственных растений.

Хронофармакологил – изучение действия лекарственных веществ и препаратов в зависимости от суточных и сезонных биоритмов организма.

БИБЛИОГРАФИЧЕСКИЙ СПИСОК

1. Блинова, Н.Н. Лекарства хорошие и плохие / Н.Н. Блинова. – Ростов н/Д: Феникс, 2002. – 160 с.
2. Богданова, Т.Ф. Общая фармакология: пособие для медицинских лицеев и колледжей / Т.Ф. Богданова, Е.Е. Соколова. – Ростов н/Д: Феникс, 2009. – 175 с.
3. Гаевой, М.Д. Фармакология с рецептурой: учебник / М.Д. Гаевой, В.И. Петров, Л.М. Гаевая. – М.: ИКЦ МарТ; Ростов-н/Д, 2007. – 448 с.
4. Иванов, В.П. Общая и медицинская экология: учебник / В.П. Иванов, О.В. Васильева, Н.В. Иванов. – Ростов н/Д: Феникс, 2010. – С. 358–460.
5. Кудрин, А.И. Фармакология: учебник / А.И. Кудрин. – М.: Медицина, 1991. – 446 с.
6. Медицинский энциклопедический словарь / под ред. В.И. Бородулина. – М.: Изд. дом «Оникс XXI век», 2002. – 704 с.
7. Пилат, Т.Л. Биологически активные добавки к пище (теория, производство, применение) / Т.Л. Пилат, А.А. Иванов. – М.: Аввалон, 2002. – 710 с.
8. Полный справочник фармацевта. – М.: Эксмо. 2006. – 768 с.
9. Тутельян, В.А. Практические рекомендации по выбору БАД к пище. Сборник алгоритмов выбора Бад к пище при раз-

личных расстройствах жизнедеятельности организма / В.А. Тутельян – М.: Ремедиум, 2010. – 152 с.

10. Тутельян, В.А. Микронутриенты в питании здорового и больного человека / В.А. Тутельян, В.Б. Спиричев. – М.: Колос, 2002. – 424 с.

11. Харкевич, А.А. Фармакология: учебник / А.А. Харкевич. – М.: Медицина, 1980. – 416 с.

12. Интернет. Википедия.

Учебное издание

Лешихин Михаил Иванович
Романова Александра Николаевна
Романова Елена Алексеевна

ВВЕДЕНИЕ В ЛЕКАРСТВОВЕДЕНИЕ

Учебно-практическое пособие

Работа рекомендована РИСом ЧГПУ

Протокол № 7, пункт 9, 2014 г.

Редактор Л.Н. Корнилова

ISBN 978-5-906777-60-7

Издательство ЧГПУ

454080 г. Челябинск, пр. Ленина, 69

Подписано в печать 05.06. 2015

Формат 60x84/16

Тираж 100 экз. Объем 6 уч.-изд. л.

Заказ №

Отпечатано с готового оригинала-макета в типографии ЧГПУ

454080 г. Челябинск, пр. Ленина, 69