

**В.Е. Петров**  
**В.Ю. Балабаньян**

# **ФАРМАКОЛОГИЯ**

**РАБОЧАЯ ТЕТРАДЬ ДЛЯ ПОДГОТОВКИ  
К ПРАКТИЧЕСКИМ ЗАНЯТИЯМ**

**Учебное пособие**

**3-е издание,  
переработанное и дополненное**

**Под редакцией профессора Р.Н. Аляутдина**

Министерство образования и науки РФ

Рекомендовано ГБОУ ДПО «Российская медицинская академия  
последипломного образования» в качестве учебного пособия для студентов  
учреждений высшего профессионального образования, обучающихся  
по специальности «Фармация»



Москва  
ИЗДАТЕЛЬСКАЯ ГРУППА  
«ГЭОТАР-Медиа»  
2019

# **ФАРМАКОЛОГИЯ**

## **РАБОЧАЯ ТЕТРАДЬ ДЛЯ ПОДГОТОВКИ К ПРАКТИЧЕСКИМ ЗАНЯТИЯМ**

студента (ФИО) \_\_\_\_\_

\_\_\_\_\_ группы \_\_\_\_\_ курса

**фармацевтического факультета**

\_\_\_\_\_ отделения

# СОДЕРЖАНИЕ

Предисловие.....	7
<b>Раздел 1. Общая рецептура.....</b>	<b>8</b>
Тема 1.1. Правила оформления рецептурного бланка. Правила выписывания лекарственных форм в рецептах. Анализ врачебного рецепта .....	8
<b>Часть I. ОБЩАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ.....</b>	<b>17</b>
<b>Раздел 2. Фармакокинетика.....</b>	<b>19</b>
Тема 2.1. Всасывание, распределение, депонирование, биотрансформация и выведение лекарственных веществ .....	19
<b>Раздел 3. Фармакодинамика .....</b>	<b>26</b>
Тема 3.1. Виды действия, механизмы действия, локализация действия, фармакологические эффекты лекарственных веществ. Факторы, влияющие на фармакодинамику и фармакокинетику.....	26
<b>Часть II. ЧАСТНАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ .....</b>	<b>33</b>
<b>Раздел 4. Средства, действующие на периферическую нервную систему .....</b>	<b>35</b>
Тема 4.1. Средства, действующие на афферентную часть периферической нервной системы .....	35
Тема 4.2. Средства, действующие на эфферентную иннервацию .....	40
<b>Раздел 5. Средства, действующие на центральную нервную систему .....</b>	<b>72</b>
Тема 5.1. Средства для общей анестезии (наркоза). Этиловый спирт. Аналептики. ....	72
Тема 5.2. Снотворные, противоэпилептические, противопаркинсонические средства .....	77
Тема 5.3. Болеутоляющие средства. Опиоидные (наркотические) анальгетики. Неопиоидные препараты центрального действия с анальгетической активностью. Анальгетики преимущественно периферического действия (нестероидные противовоспалительные средства) .....	86
Тема 5.4. Психотропные средства. Антипсихотические средства (нейролептики), антидепрессанты, антиманиакальные средства (соли лития).....	95
Тема 5.5. Психотропные средства (продолжение). Анксиолитические средства (транквилизаторы), седативные средства, психостимуляторы, ноотропные средства. ....	102
Заключительное занятие по разделу «Средства, действующие на центральную нервную систему».....	107
<b>Раздел 6. Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему .....</b>	<b>112</b>
Тема 6.1. Противоаритмические средства .....	112
Тема 6.2. Средства, применяемые при недостаточности коронарного кровообращения ...	120
Тема 6.3. Антигипертензивные средства. Гипертензивные средства (средства, применяемые при артериальной гипотензии) .....	130
Тема 6.4. Средства, применяемые при сердечной недостаточности. Кардиотонические средства .....	140

Тема 6.5. Вентротропные средства. Средства, применяемые при нарушениях мозгового кровообращения . . . . .	147
Тема 6.6. Антиатеросклеротические средства . . . . .	151
<b>Раздел 7. Мочегонные средства (диуретики) . . . . .</b>	<b>158</b>
Заключительное занятие по разделам «Средства, действующие на сердечно-сосудистую систему», «Мочегонные средства» . . . . .	166
<b>Раздел 8. Средства, влияющие на функции органов дыхания . . . . .</b>	<b>171</b>
Тема 8.1. Стимуляторы дыхания. Противокашлевые средства. Отхаркивающие средства. Средства, применяемые при бронхиальной астме . . . . .	171
<b>Раздел 9. Средства, влияющие на функции органов пищеварения . . . . .</b>	<b>180</b>
Тема 9.1. Средства, влияющие на аппетит. Средства, применяемые при язвенной болезни. Гастрокинетики. Противорвотные средства . . . . .	180
Тема 9.2. Средства, влияющие на моторную функцию кишечника. Средства, применяемые при нарушении экскреторной функции поджелудочной железы. Средства, влияющие на функцию печени . . . . .	187
<b>Раздел 10. Средства, влияющие на тонус и сократительную активность миометрия . . . . .</b>	<b>195</b>
<b>Раздел 11. Средства, влияющие на систему крови. . . . .</b>	<b>199</b>
Тема 11.1. Средства, влияющие на кроветворение . . . . .	199
Тема 11.2. Средства, влияющие на тромбообразование . . . . .	203
<b>Раздел 12. Средства, регулирующие процессы обмена веществ . . . . .</b>	<b>211</b>
Тема 12.1. Препараты гормонов пептидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов . . . . .	211
Тема 12.2. Препараты гормонов стероидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов. Гормональные контрацептивные средства. Анаболические стероиды . . . . .	221
<b>Раздел 13. Средства, влияющие на иммунные процессы и воспаление . . . . .</b>	<b>233</b>
Тема 13.1. Иммуностропные и противоаллергические средства . . . . .	233
Тема 13.2. Противовоспалительные средства . . . . .	241
<b>Раздел 14. Противомикробные и противопаразитарные средства . . . . .</b>	<b>247</b>
Тема 14.1. Антисептические и дезинфицирующие средства. . . . .	247
Тема 14.2. Антибиотики. Бета-лактамы. Гликопептидные антибиотики . . . . .	251
Тема 14.3. Антибиотики (продолжение). Макролиды, линкозамиды, тетрациклины, хлорамфеникол, аминогликозиды, полимиксины . . . . .	260
Тема 14.4. Синтетические антибактериальные средства. Противотуберкулезные средства. Противосифилитические средства . . . . .	267
Тема 14.5. Противогрибковые средства. Противовирусные средства . . . . .	274
Тема 14.6. Противопрозоидные средства. Противоглистные средства . . . . .	282
Заключительное занятие по разделу «Противомикробные и противопаразитарные средства» . . . . .	287

# РАЗДЕЛ 12

## СРЕДСТВА, РЕГУЛИРУЮЩИЕ ПРОЦЕССЫ ОБМЕНА ВЕЩЕСТВ

**NB!** Средства, регулирующие процессы обмена веществ, представлены следующими группами препаратов.

1. Препараты гормонов.
2. Препараты витаминов.
3. Средства, применяемые при ожирении.
4. Средства, применяемые при остеопорозе.
5. Средства, применяемые при подагре.

### Тема 12.1. Препараты гормонов пептидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов

**NB!** Гормоны выделяются эндокринными железами непосредственно в системный кровоток. Достигая с током крови тканей-мишеней, они стимулируют специфические рецепторы, что приводит к соответствующим метаболическим изменениям в тканях-мишенях. Система эндокринных желез представлена гипоталамусом, гипофизом и периферическими железами (щитовидная, паращитовидные, половые, кора надпочечников, островки поджелудочной железы).

Гипоталамус и передняя доля гипофиза (так называемая гипоталамо-гипофизарная система) регулируют выделение гормонов периферическими железами, а также пролиферацию в них секретирующих элементов. При увеличении в системном кровотоке концентрации гормонов периферических желез подавляется выделение рилизинг-гормонов гипоталамуса и тропных гормонов передней доли гипофиза (обратная отрицательная связь). Задняя доля гипофиза выделяет окситоцин и вазопрессин (антидиуретический гормон). Нарушения функции периферических эндокринных желез могут проявляться либо снижением (гипофункция), либо повышением (гиперфункция) их инкреторной активности. Для коррекции эндокринных расстройств могут быть использованы следующие принципы медикаментозного воздействия:

- заместительная терапия;
- стимулирующая (активирующая) терапия;
- подавляющая (супрессивная) терапия.

### ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

1. Классификация препаратов гормонов по химическому строению.
2. Препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза. Показания к применению.

**NB!** Препараты гормонов гипоталамуса представлены препаратами рилизинг-гормонов (либеринов) и препаратами статинов.

Препараты гормонов гипофиза представлены препаратами гормонов передней доли гипофиза (аденогипофиз) и препаратами гормонов задней доли гипофиза (нейрогипофиз).

3. Средства, применяемые при нарушениях функции щитовидной железы. Препараты гормонов щитовидной железы. Антитиреоидные средства.
4. Средства, применяемые при нарушениях обмена кальция. Препараты паращитовидных желез. Препараты С-клеток щитовидной железы.

**NB!** Обмен кальция и фосфора регулируют: паратгормон (вырабатывается паращитовидными железами) и кальцитонин (вырабатывается С-клетками щитовидной железы). Они оказывают на кальциевый обмен взаимно противоположное влияние: паратгормон увеличивает содержание кальция в плазме крови и снижает содержание кальция в костной ткани; кальцитонин увеличивает содержание кальция в костной ткани и снижает повышенный уровень кальция в плазме крови.

Недостаточное содержание кальция в костной ткани приводит к остеопорозу, который проявляется повышением хрупкости костей и, соответственно, увеличением риска переломов.

5. Средства, применяемые при сахарном диабете. Препараты инсулина. Синтетические противодиабетические средства для приема внутрь.

**NB!** Недостаточная продукция инсулина проявляется сахарным диабетом. Выделяют сахарный диабет 1-го типа (абсолютная инсулиновая недостаточность) и сахарный диабет 2-го типа (относительная инсулиновая недостаточность).

Препараты инсулина являются средствами заместительной терапии. Они эффективны при любом типе сахарного диабета. Синтетические противодиабетические средства эффективны только при сахарном диабете 2-го типа.

## ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ

- A. Препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза. Средства, подавляющие продукцию гормонов гипоталамуса и гипофиза.

Бромокриптин (парлодел)  
 Гозерелин (золадекс)  
 Гонадотропин хорионический (профази)  
 Даназол (дановал)  
 Десмопрессин (адиуретин СД)  
 Кломифен

Окситоцин  
 Октреотид (сандостатин)  
 Протирелин (рифатиринон)  
 Соматропин (сайзен)  
 Тетракозактид (синактен-депо)  
 Фоллитропин бета (пурегон)

- Б. Препараты гормонов щитовидной железы. Антитиреоидные средства.

Калия йодид  
 Левотироксин

Лиотиронин (трийодтиронин)  
 Тиамазол (мерказолил)

- В. Препараты, содержащие гормон паращитовидных желез. Препараты С-клеток щитовидной железы.

Кальцитрин  
 Миакальцик  
 Паратиреоидин

Г. Средства, применяемые при сахарном диабете.

Акарбоза (глюкобай) Глибенкламид (манинил) Гликлазид (диабетон) Глимепирид (амарил) Инсулин	Метформин (глюкофаж) Натеглинид (старликс) Пиоглитазон (актос) Ситаглиптин (янувия) Эксенатид (баета)
---	---

## ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ

### Задание 1

А. Укажите препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза и основные показания к их применению (табл. 12.1).

**Таблица 12.1. Препараты гормонов гипоталамуса и гипофиза**

Гормоны	Препараты	Показания
Тиротропин-рилизинг-гормон		
Гонадотропин-рилизинг-гормон		1. (при «пульсирующем» введении). 2. (при непрерывном введении)
Фолликулостимулирующий гормон		
Лютеинизирующий гормон		
АКТГ		
Соматостатин		1. 2.
Соматотропный гормон (гормон роста)		

**Примечания.** 1. При заполнении рубрики «Препараты» используйте препараты из списка лекарственных препаратов по теме. 2. При заполнении рубрики «Показания» используйте приведенный ниже перечень показаний:

- при акромегалии;
- для остановки кровотечений из варикозно расширенных вен пищевода;
- при карликовом росте;
- для диагностики и лечения гипотиреоза;
- при ановуляторном бесплодии и гипогонадизме;
- при злокачественных новообразованиях яичников и предстательной железы;
- при атрофии коры надпочечников, вызванной длительным применением глюкокортикоидов.

**NB!** Инкрецию гормона роста и пролактина тормозит дофамин.

Блокада эстрогеновых рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы кломифеном приводит к повышению инкреции гонадотропных гормонов (ФСГ и ЛГ).

Стимуляция гестагеновых рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы даназолом проводит к снижению инкреции гонадорелина и гонадотропных гормонов.

Б. Выберите из приведенного ниже списка основные показания к применению:

1) бромокриптина: \_\_\_\_\_;

2) кломифена: \_\_\_\_\_;

3) даназола: \_\_\_\_\_.

- Гипогонадизм гипоталамо-гипофизарного генеза.
- Эндометриоз.
- Паркинсонизм.
- Гиперпролактинемия и галакторея.
- Акромегалия.

### Задание 2

Дайте фармакологическую характеристику препаратов гормонов задней доли гипофиза (табл. 12.2).

**Таблица 12.2. Препараты гормонов задней доли гипофиза**

Гормоны	Препараты	Органы-мишени	Эффекты	Показания	Пути введения
Вазопрессин				1. 2.	1. 2.
Окситоцин					

**Примечание.** При заполнении рубрики «Эффекты» пользуйтесь следующим списком.

- Увеличение сократительной активности и тонуса миометрия.
- Увеличение реабсорбции воды и снижение диуреза.
- Увеличение тонуса кровеносных сосудов и повышение АД.

**NB!** Окситоцин действует только на беременную матку и тем сильнее, чем больше срок беременности. Это связано с увеличением плотности специфических рецепторов. Максимальная чувствительность миометрия к окситоцину проявляется непосредственно перед родами, в родах и сразу после них.

Окситоцин не влияет на тонус шейки матки, поэтому для стимуляции родов его следует применять либо при полном раскрытии цервикального канала, либо в комбинации с препаратами, снижающими тонус шейки матки.

### Задание 3

А. Дополните классификацию препаратов, применяемых при нарушениях функции щитовидной железы, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

1. Средства, применяемые при гипотиреозе: а) \_\_\_\_\_;

б) \_\_\_\_\_;

в) \_\_\_\_\_.



2. Средства, применяемые при гипертиреозе (анти tireоидные средства):

а) \_\_\_\_\_;

б) \_\_\_\_\_.

**NB!** Препараты нерадиоактивного йода (калия йодид и натрия йодид) эффективны как при гипотиреозе, так и при гипертиреозе. При гипотиреозе препараты йода применяют в качестве средств заместительной терапии в невысоких дозах (40 мг 1 раз в неделю), при этом наблюдается увеличение синтеза тиреоидных гормонов. При гипертиреозе препараты йода применяют в высоких дозах (160–180 мг) с целью подавления секреции тиролиберина и тиреотропного гормона по принципу обратной отрицательной связи.

При гипотиреозе широко используются комбинированные препараты, содержащие препарат гормона щитовидной железы и препарат йода (тиреокомб, йодтирокс).

Наиболее типичным побочным эффектом йодсодержащих препаратов является их способность вызывать признаки йодизма.

Б. Объясните механизм анти tireоидного действия тиамазола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.

1. Угнетение пероксидазы фолликулов щитовидной железы.
2. Снижение синтеза  $T_3$  и  $T_4$ .
3. Снижение йодирования предшественников тиреоидных гормонов.

В. Укажите механизм зобогенного действия тиамазола, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности, и укажите возможный путь коррекции этого побочного эффекта.

1. Снижение синтеза тиреоидных гормонов и их содержания в крови.
2. Увеличение объема щитовидной железы (нетоксический зоб).
3. Уменьшение стимуляции специфических рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы.
4. Увеличение выделения тиролиберина и тиреотропного гормона.

**NB!** Лечение гипертиреоза осуществляется хирургическими, фармакотерапевтическими методами и их комбинацией. Наиболее эффективными анти tireоидными средствами являются препараты радиоактивного йода ( $^{131}I$ ). Эти препараты разрушают фолликулы, т.е. вызывают медикаментозную деструкцию щитовидной железы. Ввиду радиоактивных свойств эти препараты применяются только в специализированных стационарах.

Г. Укажите характерные побочные эффекты препаратов, применяемых при нарушениях функции щитовидной железы (табл. 12.3).

**Таблица 12.3. Побочные эффекты тиреоидных и анти tireоидных средств**

Побочные эффекты	Левотироксин	Тиамазол	Пути коррекции (группа препаратов)
Токсическое действие на сердце (тахикардия, аритмия, приступы стенокардии)			
Беспокойство, бессонница			
Зобогенное действие			
Угнетение кроветворения			

**Задание 4**

Дайте фармакологическую характеристику препаратов, регулирующих обмен кальция (табл. 12.4).

**Таблица 12.4. Препараты кальцитонина и паратгормона**

Гормоны	Препараты	Эффекты				Показания к применению	Путь введения
		Всасывание $\text{Ca}^{2+}$ в кишечнике	Реабсорбция $\text{Ca}^{2+}$ в почках	Содержание $\text{Ca}^{2+}$ в костях	Уровень $\text{Ca}^{2+}$ в крови		
Паратгормон							
Кальцитонин							

**Примечание.** При заполнении таблицы пользуйтесь следующими обозначениями: «↑» — повышение; «↓» — понижение.

**Задание 5**

А. Дополните классификацию средств, применяемых при сахарном диабете, препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

1. Средства заместительной терапии: \_\_\_\_\_.
2. Гипогликемические средства, применяемые преимущественно при сахарном диабете 2-го типа.

Средства, стимулирующие выделение эндогенного инсулина: \_\_\_\_\_.

Производные сульфонилмочевины: а) \_\_\_\_\_;

б) \_\_\_\_\_;

в) \_\_\_\_\_.

Прандиальные регуляторы гликемии (меглитиниды): \_\_\_\_\_.

Инкретиномиметики: \_\_\_\_\_.

Ингибиторы ДПП-4 (дипептидилпептидазы 4-го типа): \_\_\_\_\_.

Средства, применяемые при инсулинорезистентности тканей.

Средства, способствующие утилизации глюкозы тканями и угнетающие глюконеогенез (бигуаниды): \_\_\_\_\_.

Средства, повышающие чувствительность тканей к инсулину (лиганды PPAR- $\gamma$ ), (тиазолидиндионы): \_\_\_\_\_.

Средства, препятствующие всасыванию глюкозы в кишечнике (ингибиторы  $\alpha$ -глюкозидазы): \_\_\_\_\_.

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

1. Стимуляция инсулиновых рецепторов.
2. Активация ферментов углеводного обмена.
3. Эндоцитоз димера инсулин + рецептор клетками инсулинзависимых тканей.
4. Усиление захвата и утилизации глюкозы тканями, активация синтеза гликогена.

**NB!** Препараты инсулина классифицируют:

- по источникам и способам получения (свиные, рекомбинантные человеческие);
- по степени очистки (монокомпонентные, монопиковые);
- по продолжительности действия и времени наступления эффекта (коротко- и быстродействующие, пролонгированного действия).

В. Укажите фармакологические свойства и показания к применению препаратов инсулина разных групп (табл. 12.5).

**Таблица 12.5. Сравнительная характеристика препаратов инсулина**

Группа	Скорость наступления эффекта (минуты, часы)	Продолжительность действия, ч	Лекарственная форма (раствор или суспензия)	Путь введения	Показания к применению
Быстро- и короткодействующие					
Средней продолжительности действия					
Длительного действия					

**Примечание.** При заполнении рубрики «Показания к применению» используйте следующие показания: 1) купирование гипергликемической комы; 2) систематическое лечение.

**NB!** Инсулиноterapia должна имитировать процесс выделения эндогенного инсулина. С этой целью подбираются индивидуальный режим дозирования и частота введения препаратов инсулина различной продолжительности действия.

Фармацевтической промышленностью производятся комбинированные препараты, содержащие короткодействующий инсулин и инсулин средней продолжительности действия. Короткодействующий компонент обеспечивает быстрое наступление гипогликемического эффекта, а пролонгированный обеспечивает достаточную продолжительность эффекта.

Г. Укажите основные симптомы гипогликемической комы и способы коррекции передозировки инсулина.

**NB!** Главным недостатком препаратов инсулина является невозможность их энтерального применения.

Д. Укажите механизмы действия гипогликемических средств для приема внутрь (табл. 12.6).

Таблица 12.6. Механизмы действия гипогликемических средств для приема внутрь

Механизм действия	Глибенкламид	Натеглинид	Пиоглитазон	Метформин	Акарбоза
Усиление инкреции эндогенного инсулина					
Увеличение количества и чувствительности инсулиновых рецепторов					
Уменьшение глюконеогенеза					
Увеличение утилизации глюкозы тканями					
Уменьшение всасывания глюкозы в кишечнике					

**Примечание.** Наличие эффекта обозначьте символом «+».

- Е. Объясните механизм увеличения инкреции инсулина под действием производных сульфонилмочевины, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.
1. Блокада АТФ-зависимых калиевых каналов  $\beta$ -клеток островков поджелудочной железы.
  2. Деполяризация мембран  $\beta$ -клеток.
  3. Открытие потенциалзависимых кальциевых каналов.
  4. Увеличение входа ионов кальция.
  5. Уменьшение выхода ионов калия.
  6. Усиление экзоцитоза эндогенного инсулина.
- Ж. Объясните механизм гипогликемического действия акарбозы, расположив приведенные ниже утверждения в логической последовательности.
1. Снижение всасывания моносахаридов в тонком отделе кишечника.
  2. Уменьшение превращения дисахаридов в моносахариды.
  3. Ингибирование кишечной  $\alpha$ -глюкозидазы.
  4. Снижение уровня глюкозы в плазме крови.
- З. Укажите побочные эффекты некоторых гипогликемических средств для приема внутрь (табл. 12.7).

Таблица 12.7. Побочные эффекты гипогликемических средств для приема внутрь

Побочные эффекты	Производные сульфонилмочевины	Бигуаниды	Акарбоза
Гипогликемия			
Повышение аппетита			
Снижение аппетита и массы тела			
Лактацидоз			
Метеоризм			

**Примечание.** Наличие эффекта обозначьте символом «+».

**NB!** Повышение аппетита расценивается как серьезный недостаток противодиабетических средств, поскольку фармакотерапия сахарного диабета проводится на фоне диетотерапии. Снижение аппетита и массы тела можно расценить как положительные качества, поскольку они позволяют применять соответствующие препараты при «диабете тучных». Метеоризм выражен тем сильнее, чем больше углеводов поступает в кишечник с потребляемой пищей. Таким образом, этот побочный эффект принуждает больных строго соблюдать бедную углеводами диету.

## ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

*Выберите правильные ответы.*

- При ановуляторном бесплодии применяют:  
1) даназол; 2) фоллитропин бета; 3) гозерелин; 4) октреотид; 5) кломифен.
- При эндометриозе применяют:  
1) гонадотропин хорионический; 2) даназол; 3) окситоцин; 4) тетракозактид.
- При атрофии коры надпочечников применяют:  
1) октреотид; 2) бромокриптин; 3) тетракозактид; 4) окситоцин.
- При акромегалии применяют:  
1) протирелин; 2) окситоцин; 3) бромокриптин; 4) десмопрессин; 5) октреотид.
- При галакторее применяют:  
1) соматропин; 2) октреотид; 3) бромокриптин; 4) окситоцин; 5) десмопрессин.
- При карликовом росте применяют:  
1) тетракозактид; 2) октреотид; 3) соматропин; 4) фоллитропин бета.
- Для стимуляции родов применяют:  
1) октреотид; 2) окситоцин; 3) миакальцик; 4) десмопрессин.
- При несахарном мочеизнурении применяют:  
1) кальцитрин; 2) десмопрессин; 3) инсулин; 4) паратиреоидин.

9. При остеопорозе применяют:  
1) кальцитрин; 2) тиамазол; 3) паратиреоидин; 4) миакальцик.
10. При тетании применяют:  
1) кальцитрин; 2) тиамазол; 3) паратиреоидин; 4) миакальцик.
11. При гипотиреозе применяют:  
1) тиамазол; 2) калия йодид; 3) кальцитрин; 4) левотироксин; 5) лиотиронин.
12. При гипертиреозе применяют:  
1) тиамазол; 2) калия йодид; 3) протирелин; 4) левотироксин; 5) лиотиронин.
13. При сахарном диабете 1-го типа применяют:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) десмопрессин; 4) метформин; 5) акарбозу.
14. При сахарном диабете 2-го типа применяют:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) десмопрессин; 4) метформин; 5) акарбозу.
15. При сахарном диабете 2-го типа применяют внутрь:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбозу.
16. Инкрецию эндогенного инсулина повышают:  
1) акарбоза; 2) глибенкламид; 3) эксенатид; 4) ситаглиптин.
17. Уменьшает глюконеогенез и увеличивает захват глюкозы мышечной тканью:  
1) натеглинид; 2) ситаглиптин; 3) пиоглитазон; 4) метформин; 5) глимепирид.
18. Препятствует всасыванию углеводов в кишечнике:  
1) натеглинид; 2) акарбоза; 3) пиоглитазон; 4) эксенатид; 5) глимепирид.
19. Снижает инсулинорезистентность тканей за счет взаимодействия с гамма-рецепторами, активируемыми пролифератором пероксисом (PPAR- $\gamma$ ):  
1) натеглинид; 2) акарбоза; 3) пиоглитазон; 4) инсулин.
20. Повышает аппетит:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) глибенкламид; 4) метформин; 5) акарбоза.
21. Понижает аппетит, а также вызывает снижение массы тела; может вызвать тошноту, рвоту и лактацидоз:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбоза.
22. Метеоризм и диарею вызывает:  
1) инсулин; 2) глимепирид; 3) натеглинид; 4) метформин; 5) акарбоза.

**Проведите анализ врачебных рецептов.**

А. Средство при гипотиреозе.

*Rp.: L-Thyroxini 0,00005  
D.t.d. N. 10  
S. По 1 таблетке 2 раза в день внутрь.*

Ваши замечания

Б. Препарат для остановки кровотечений из варикозно расширенных вен пищевода.

*Rp.: Otreotidi 0,001*

*D.t.d. N. 6*

*S. Содержимое флакона растворить в 2 мл воды. Закапывать в нос 2 раза в день.*

Ваши замечания

В. Противодиабетическое средство, не повышающее аппетит.

*Rp.: Glibenclamidi 0,005*

*D.t.d. N. 10 in tab.*

*S. По 1 таблетке 2 раза в день внутрь.*

Ваши замечания

### Ответы на тестовые задания

1 — 2, 3, 5. 2 — 2, 3 — 3. 4 — 3, 5. 5 — 3. 6 — 3. 7 — 2. 8 — 2. 9 — 1, 4. 10 — 3. 11 — 2, 4, 5. 12 — 1, 2. 13 — 1. 14 — 1, 2, 4, 5. 15 — 2, 3, 4, 5. 16 — 2, 3, 4. 17 — 4. 18 — 2. 19 — 1, 3. 20 — 1, 2, 3. 21 — 4. 22 — 5.

## Тема 12.2. Препараты гормонов стероидной структуры, их синтетических аналогов и антагонистов. Гормональные контрацептивные средства. Анаболические стероиды

**NB!** В основе химического строения стероидных гормонов лежит структура циклопентанопергидрофенантрена. Предшественником всех стероидных гормонов является прегненолон, синтезируемый из холестерина. Основные железы, синтезирующие и инкретирующие стероидные гормоны, — кора надпочечников и половые железы (яичники у женщин и яички у мужчин).

Синтез стероидных гормонов происходит по типу последовательного превращения предшественников. При этом в системный кровоток выделяется тот гормон, на котором остановился биосинтез. Так, кора надпочечников может инкретировать глюкокортикостероиды (пучковая зона), минералокортикостероиды (клубочковая зона) и половые гормоны (сетчатая зона). Яичники могут инкретировать эстрогены (*toeca interna* фолликулов) и гестагены (желтое тело). Яички инкретируют преимущественно андрогены.

Инкреция глюкокортикоидов и половых гормонов регулируется гипоталамо-гипофизарной системой. Инкреция же минералокортикоидов регулируется главным образом состоянием ренин-ангиотензиновой системы.

### ОСНОВНЫЕ ВОПРОСЫ ПО ТЕМЕ

1. Классификация препаратов глюкокортикоидов.
2. Свойства глюкокортикоидов (биологические и фармакологические эффекты).

**NB!** Биологические эффекты глюкокортикоидов проявляются их влиянием на все виды обмена (углеводный, белковый, жировой, водно-электролитный). Эти эффекты проявляются при физиологических концентрациях естественных глюкокортикоидов. Фармакологические эффекты глюкокортикоидов (противовоспалительный, иммуносупрессивный, противоаллергический, противошоковый и др.) наблюдаются при применении препаратов глюкокортикоидов в дозах, значительно превышающих физиологические концентрации этих гормонов. Указанные фармакологические эффекты определяют основную сферу клинического применения препаратов глюкокортикоидов. При этом физиологические эффекты приобретают характер побочных.

3. Механизмы противовоспалительного, иммуносупрессивного и противоаллергического действия препаратов глюкокортикоидов.

**NB!** Механизмы развития фармакологических эффектов препаратов глюкокортикоидов связаны с их влиянием на клеточный геном (репрессия или индукция соответствующих генов).

4. Показания к применению препаратов глюкокортикоидов.
5. Побочные эффекты препаратов глюкокортикоидов.

**NB!** Побочные эффекты препаратов глюкокортикоидов условно можно разделить на группы, связанные:

- с гормональным действием (влиянием на обмен веществ);
- с иммуносупрессивным действием;
- с обратной отрицательной связью.

6. Противопоказания к применению препаратов глюкокортикоидов.
7. Препараты минералокортикоидов. Свойства. Показания к применению. Побочные эффекты.

**NB!** Естественным минералокортикоидом является альдостерон. Его главное свойство — стимуляция реабсорбции ионов натрия и эквивалентных количеств воды (минералокортикоидное действие). Это действие связано со стимуляцией альдостероном специфических рецепторов дистальных извитых канальцев и собирательных трубочек, в результате чего на люминальных мембранах эпителиоцитов увеличивается количество натриевых каналов.

8. Классификация препаратов женских половых гормонов.
9. Показания к применению препаратов женских половых гормонов.
10. Побочные эффекты препаратов женских половых гормонов.
11. Противозачаточные средства для приема внутрь. Классификация. Особенности применения препаратов разных групп. Побочные эффекты.
12. Препараты заместительной терапии в постменопаузном периоде.
13. Препараты мужских половых гормонов. Свойства и применение. Побочные эффекты.
14. Препараты анаболических стероидов. Показания к применению. Побочные эффекты.
15. Антагонисты гормональных препаратов. Показания к применению.



**ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ ПО ТЕМЕ**

## А. Препараты глюкокортикоидов.

Беклометазон (бекотид)  
Бетаметазон (целестодерм-В, целестон)  
Будесонид (пульмикорт, апулеин)  
Гидрокортизона ацетат  
Дексаметазон  
Преднизолон

Триамцинолон (полькортолон, кеналог)  
Флуметазон (локакортен, лоринден)  
Флунизолид (ингакорт)  
Флуоцинолон (синафлан, флуцинар)  
Флутиказон (фликсотид, кутивейт)

## Б. Препараты минералокортикоидов.

Дезоксикортикостерона ацетат (ДОКСА)

Флудрокортизон

## В. Препараты женских половых гормонов.

Аллилэстренол (туринал)  
Гексэстрол (синэстрол)  
Оксипрогестерона капронат

Прогестерон  
Эстрадиола дипропионат  
Этинилэстрадиол

## Г. Противозачаточные средства для приема внутрь (коммерческие названия).

Антеовин  
Марвелон  
Постинор

Ригевидон  
Три-регол  
Эксклютон

## Д. Препараты заместительной терапии в постменопаузном периоде (коммерческие названия).

Гинодиан депо  
Климен

Климонорм  
Ливиал

## Е. Препараты мужских половых гормонов и анаболические стероиды.

Метилтестостерон  
Тестостерона пропионат

Тестостерона энантат (тестэнат)  
Нандролон (ретаболил)

## Ж. Антигормональные средства.

Аминоглутетимид  
Летрозол (фемара)  
Метирапон

Тамоксифен  
Финастерид (проскар)  
Ципротерон (андрокур)

**ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОПОДГОТОВКИ****Задание 1**

Дополните классификацию глюкокортикоидов препаратами из предложенного списка.

## 1. Препараты для системного (резорбтивного) применения.

Препараты естественных гормонов: \_\_\_\_\_.

Синтетические препараты: а) \_\_\_\_\_;  
б) \_\_\_\_\_;  
в) \_\_\_\_\_;  
г) \_\_\_\_\_.

## 2. Препараты для местного применения.

Препараты, применяемые наружно в виде мазей и кремов: а) \_\_\_\_\_;  
б) \_\_\_\_\_.Препараты, применяемые ингаляционно в виде аэрозолей: а) \_\_\_\_\_;  
б) \_\_\_\_\_.Препараты, применяемые в мазях и ингаляциях: а) \_\_\_\_\_;  
б) \_\_\_\_\_.

**NB!** Препараты для системного применения можно вводить внутрь, внутривенно, внутримышечно, в полость сустава, а также использовать наружно в мазях и каплях (глазных и ушных). Препараты для ингаляционного применения можно использовать в пульмонологии (при бронхиальной астме) и в аллергологии (при аллергических ринитах в виде назального спрея).

**Задание 2**

Укажите физиологические эффекты глюкокортикоидов (табл. 12.8).

**Таблица 12.8. Физиологические эффекты глюкокортикоидов**

Влияние глюкокортикоидов на:		Эффект	
Обмен веществ	Углеводный		
	Жировой		
	Белковый		
Водно-электролитный обмен	Na <sup>+</sup>		
	K <sup>+</sup>		
	Ca <sup>2+</sup>		
	H <sub>2</sub> O		
Сердечно-сосудистую систему	АД		
	Картину периферической крови	Лимфоциты	
		Нейтрофилы	
Гипоталамо-гипофизарную систему	Выделение АКТГ		

**NB!** Указанные эффекты глюкокортикоидов не имеют фармакотерапевтической ценности, поскольку не определяют сферу их применения.  
 Эти эффекты приобретают характер побочных при длительном применении препаратов глюкокортикоидов.

**Задание 3**

Укажите основные фармакологические эффекты препаратов глюкокортикоидов и объясните механизмы их возникновения (схема 12.1).



**Схема 12.1.** Основные фармакологические эффекты препаратов глюкокортикоидов и механизмы их возникновения

**NB!** В механизме противоаллергического действия препаратов глюкокортикоидов имеет место их способность стабилизировать мембраны тучных клеток. Это препятствует дегрануляции тучных клеток и выделению из них медиаторов аллергии.  
 Кроме того, препараты глюкокортикоидов обладают способностью увеличивать количество и чувствительность адренорецепторов. С этим связывают их бронхолитическое действие.

**Задание 4**

Укажите препараты глюкокортикоидов, применяемые по перечисленным ниже показаниям. При выполнении задания используйте препараты из классификации, применение которых является наиболее целесообразным.

А. Болезнь Аддисона (в сочетании с препаратами минералокортикоидов): \_\_\_\_\_.

Б. Коллагенозы: \_\_\_\_\_.

В. Реакция отторжения трансплантата: \_\_\_\_\_.

Г. Шок (анафилактический, ожоговый, травматический): \_\_\_\_\_.

### Задание 5

А. Из приведенного списка выберите побочные эффекты, связанные:

- с гормональным действием (влиянием на обмен веществ): \_\_\_\_\_;
- с иммуносупрессивным действием: \_\_\_\_\_;
- с обратной отрицательной связью: \_\_\_\_\_.

Побочные эффекты:

- 1) атрофия коры надпочечников;
- 2) перераспределение жировой ткани (лекарственный кушингоидизм);
- 3) остеопороз;
- 4) снижение сопротивляемости к инфекционным заболеваниям;
- 5) замедление репаративных процессов (изъязвления);
- 6) задержка натрия и воды, гипертензия, отеки;
- 7) гипергликемия (стероидный диабет);
- 8) уменьшение мышечной массы конечностей.

Б. Укажите, какие препараты глюкокортикоидов редко вызывают приведенные выше побочные эффекты. Объясните почему.

**NB!** При длительном (курсовом) применении препаратов глюкокортикоидов формируется (по принципу обратной отрицательной связи) индуцированная атрофия коры надпочечников. В связи с этим, отмена препаратов после курса должна производиться постепенно, с последующим назначением «поддерживающих» доз.

### Задание 6

Дополните классификацию препаратов женских половых гормонов препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

1. Препараты эстрогенов:
  - а) \_\_\_\_\_;
  - б) \_\_\_\_\_;
  - в) \_\_\_\_\_.
2. Препараты гестагенов:
  - а) \_\_\_\_\_;
  - б) \_\_\_\_\_;
  - в) \_\_\_\_\_.

### Задание 7

А. Дайте фармакокинетическую характеристику препаратов женских половых гормонов (табл. 12.9).

Таблица 12.9. Фармакокинетическая характеристика препаратов женских половых гормонов

Препарат	Пути введения (внутри, парентерально)	Продолжительность действия (небольшая/большая)
Эстрадиола дипропионат		
Этинилэстрадиол		
Гексэстрол		
Прогестерон		
Аллилэстринол		
Оксипрогестерона капро- нат		

Б. Выберите из приведенного ниже списка основные показания к применению (а–з):

- 1) эстрогенных препаратов: \_\_\_\_\_;
  - 2) гестагенных препаратов: \_\_\_\_\_.
- а) аменорея (нарушение менструального цикла);
  - б) задержка полового созревания;
  - в) бесплодие;
  - г) для контрацепции;
  - д) для заместительной терапии в постменопаузном периоде;
  - е) угрожающий выкидыш;
  - ж) рак предстательной железы;
  - з) профилактика остеопороза.

В. Выберите из приведенного ниже списка типичные побочные эффекты (а–е):

- 1) эстрогенных препаратов: \_\_\_\_\_;
  - 2) гестагенных препаратов: \_\_\_\_\_.
- а) повышение свертывания крови;
  - б) отеки;
  - в) нарушение функции печени;
  - г) тошнота, рвота;
  - д) бессонница, депрессия;
  - е) гирсутизм (рост волос по мужскому типу).

**NB!** Препараты гестагенов нередко применяют в комбинации с препаратами эстрогенов. К наиболее часто используемым группам комбинированных эстроген-гестагенных препаратов относятся: 1) противозачаточные эстроген-гестагенные средства для приема внутрь; 2) средства заместительной терапии в постменопаузном периоде.

## Задание 8

А. Дополните классификацию противозачаточных средств для приема внутрь препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

1. Комбинированные эстроген-гестагенные препараты.

Монофазные препараты а) \_\_\_\_\_;  
б) \_\_\_\_\_.

Двухфазные препараты: \_\_\_\_\_.

Трехфазные препараты: \_\_\_\_\_.

2. Гестагенные препараты.

Содержащие малые дозы гестагенов: \_\_\_\_\_.

Содержащие высокие дозы гестагенов (посткоитальные контрацептивы): \_\_\_\_\_  
\_\_\_\_\_.

**NB!** В основе противозачаточного действия комбинированных эстроген-гестагенных препаратов лежит обратная отрицательная связь.

Б. Укажите компоненты комбинированных эстроген-гестагенных препаратов, которые обуславливают основные механизмы противозачаточного действия (схема 12.2).



ЛГ — лютеинизирующий гормон  
ФСГ — фолликулостимулирующий гормон

**Схема 12.2.** Механизм действия эстроген-гестагенных противозачаточных средств

В. Решите ситуационную задачу.

**Ситуационная задача**

Пациентка, принимающая с целью контрацепции таблетки «Марвелон», стала отмечать следующие побочные эффекты: нарушение сна, раздражительность и депрессию, повышение артериального давления, болезненность и припухлость по ходу вен. С каким компонентом таблеток «Марвелон» могут быть связаны указанные побочные эффекты? Предложите, каким препаратом можно заменить таблетки «Марвелон».

**Задание 9**

Дополните классификацию средств заместительной терапии в постменопаузном периоде препаратами из списка лекарственных препаратов по теме.

1. Эстроген-гестагенные препараты: \_\_\_\_\_.
2. Эстроген-андрогенные препараты: \_\_\_\_\_.
3. Эстроген-антиандрогенные препараты: \_\_\_\_\_.
4. Препарат с эстрогенной, гестагенной и андрогенной активностью: \_\_\_\_\_.

**NB!** Препараты заместительной терапии при климаксе восполняют дефицит половых гормонов, уменьшая тем самым симптоматику климактерических расстройств со стороны сердечно-сосудистой и центральной нервной систем. Снижают риск развития остеопороза.

**Задание 10**

А. Дайте характеристику препаратов мужских половых гормонов и анаболических стероидов (табл. 12.10).

**Таблица 12.10. Фармакологическая характеристика препаратов мужских половых гормонов и анаболических стероидов**

Препарат	Пути введения (парентерально, под язык)	Продолжительность действия (небольшая/большая)
Тестостерона пропионат		
Тестостерона энантат		
Метилтестостерон		
Нандролон		

- Б. Выберите из приведенного ниже списка основные показания к применению анаболических стероидов (а–г): \_\_\_\_\_.
- а) замедленное образование костной мозоли;
  - б) задержка полового созревания;
  - в) рак молочной железы (у женщин);
  - г) мышечная дистрофия.

В. Объясните механизм развития мужского бесплодия при длительном применении препаратов андрогенов и анаболических стероидов.

### Задание 11

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

1. Средства, нарушающие синтез стероидных гормонов.

Неизбирательные ингибиторы синтеза стероидных гормонов: \_\_\_\_\_.

Ингибиторы синтеза глюкокортикоидов: \_\_\_\_\_.

Ингибиторы синтеза андрогенов (ингибиторы 5 $\alpha$ -редуктазы): \_\_\_\_\_.

Ингибиторы синтеза эстрогенов (ингибиторы ароматазы): \_\_\_\_\_.

2. Средства, блокирующие рецепторы стероидных гормонов.

Блокаторы рецепторов андрогенов: \_\_\_\_\_.

Блокаторы рецепторов эстрогенов: \_\_\_\_\_.

Б. Укажите основные показания к применению антигормональных средств (табл. 12.11).

**Таблица 12.11. Основные показания к применению антигормональных средств**

Препарат	Показания к применению			
	Синдром Иценко–Кушинга	Рак молочной железы	Рак предстательной железы	Доброкачественная гиперплазия предстательной железы
Аминоглутетимид				
Метирапон				
Тамоксифен				
Летрозол				
Ципротерон				
Финастерид				

**Примечание.** При заполнении таблицы используйте символ «+».

### ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ ДЛЯ САМОКОНТРОЛЯ

*Выберите правильные ответы.*

- При воздействии на обмен веществ препараты глюкокортикоидов вызывают:
  - 1) перераспределение жировой ткани; 2) гипергликемию; 3) отеки; 4) увеличение синтеза белка.
- Терапевтически ценные эффекты препаратов глюкокортикоидов:
  1. Противовоспалительный. 2. Иммунодепрессивный. 3. Противоаллергический. 4. Противошоковый. 5. Гипотензивный.



3. Показания к применению препаратов глюкокортикоидов:
  - 1) коллагенозы; 2) бронхиальная астма; 3) экзема; 4) реакция отторжения трансплантата; 5) сахарный диабет.
4. К препаратам глюкокортикоидов для резорбтивного применения относятся:
  - 1) дексаметазон; 2) флунизолит; 3) преднизолон; 4) триамцинолон; 5) флуоцинолон.
5. Местно в виде мазей применяют:
  - 1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флуметазон.
6. В ингаляциях применяют:
  - 1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флуметазон.
7. Как в виде мазей, так и в ингаляциях применяют:
  - 1) беклометазон; 2) флуоцинолон; 3) флунизолит; 4) флутиказон; 5) будесонид.
8. Флудрокортизон применяют:
  - 1) при коллагенозах; 2) в качестве противозачаточного средства; 3) при болезни Аддисона.
9. При аменорее применяют:
  - 1) прогестерон; 2) этинилэстрадиол; 3) гексэстрол; 4) бетаметазон.
10. Для контрацепции применяют:
  - 1) антеовин; 2) марвелон; 3) прогестерон; 4) постинор; 5) экслютон.
11. В качестве средств заместительной терапии в постменопаузном периоде применяют:
  - 1) климонорм; 2) три-регол; 3) ливиал; 4) гинодиан депо; 5) метирапон.
12. При мужском бесплодии применяют:
  - 1) метилтестостерон; 2) нандролон; 3) финастерид; 4) экслютон.
13. Для увеличения мышечной массы применяют:
  - 1) нандролон; 2) тамоксифен; 3) метирапон; 4) постинор.
14. При аденоме предстательной железы применяют:
  - 1) нандролон; 2) тамоксифен; 3) финастерид; 4) ливиал; 5) марвелон.

**Проведите анализ врачебных рецептов.**

- А. Глюкокортикостероидный препарат для лечения бронхиальной астмы.

*Rp.: Aerosolum «Becotid» N. 1*  
*D.S. По 2 ингаляции 4 раза в сутки.*

Ваши замечания

- Б. Противозачаточное средство для приема внутрь.

*Rp.: Tab. Tri-Regoli*  
*D.t.d.N. 10*  
*S. По 1 таблетке 3 раза в день внутрь*  
*в течение 3 дней.*

Ваши замечания

В. Препарат при аденоме предстательной железы.

*Rp.: Finasteridi 0,005*

*D.t.d.N. 10 in tab.*

*S. По 1 таблетке 1 раз в день внутрь.*

Ваши замечания

### Ответы на тестовые задания

**1** — 1, 2, 3. **2** — 1, 2, 3, 4. **3** — 1, 2, 3, 4. **4** — 1, 3, 4. **5** — 2, 4. **6** — 1, 3. **7** — 4, 5. **8** — 3. **9** — 1, 2, 3. **10** — 1, 2, 4, 5. **11** — 1, 3, 4. **12** — 1. **13** — 1. **14** — 3.