



Лекарственные
средства



Лекарственные средства — фармакологические средства (вещества или смеси веществ), прошедшие клинические испытания и разрешенные к применению для профилактики, диагностики и лечения заболеваний уполномоченным на то органом страны в установленном порядке, полученные из крови, плазмы крови, а также органов, тканей человека или животных, растений, минералов, методом синтеза или с применением биотехнологий.

История



- Уже в глубокой древности люди пытались спасти свою жизнь, используя различные природные лекарственные вещества. Чаще всего это были растительные экстракты, но применялись и препараты, которые получали из сырого мяса, дрожжей и отходов животных. Первые ученые инстинктивно чувствовали, что во многих живых организмах находятся вещества, которые могут помочь в борьбе с болезнями, но лишь по мере развития химии люди убедились, что лечебный эффект таких веществ заключается в избирательном воздействии на организм определенных химических соединений. Прошло еще какое-то время, и такие соединения стали получать в лабораториях путем синтеза.



Paul Ehrlich

- **Пауль Эрлих (1854—1915)**, немецкий бактериолог и химик еврейского происхождения, считается основателем современной химиотерапии. В 1891 г. он разработал теорию применения химических соединений для борьбы с инфекционными заболеваниями.

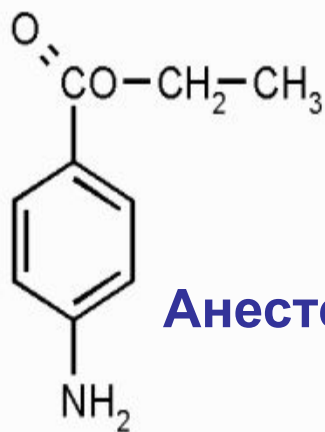
Гомеопатические лекарственные средства



В ряде стран эти средства регулируются по разному — либо как категория «Лекарственные средства», либо как «Пищевые продукты и добавки», либо как «средства нетрадиционной медицины». В настоящее время на этот счёт нет устоявшегося мнения международных организаций, согласованного с национальными органами управления здравоохранением.

• В Российской Федерации гомеопатические препараты подлежат такому же законодательному регулированию как и обычные лекарства. В 2010 г. начата работа по пересмотру статуса отдельных типов препаратов, в частности — гомеопатических препаратов.

Местноанестезирующие средства

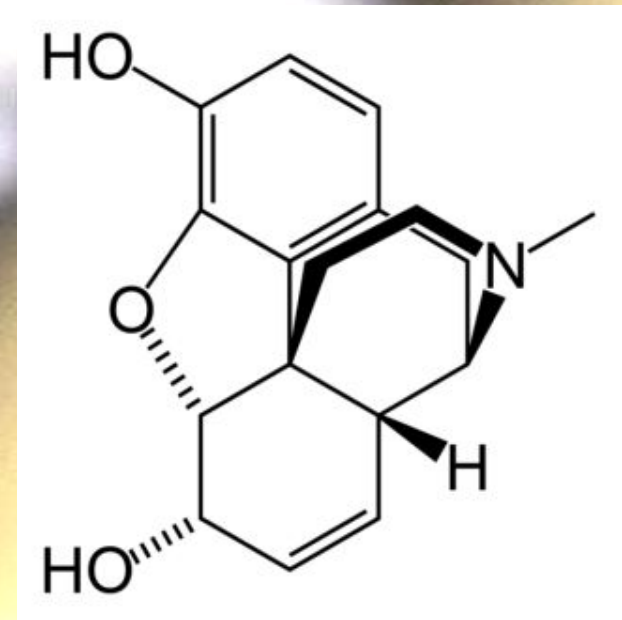


Анестезин



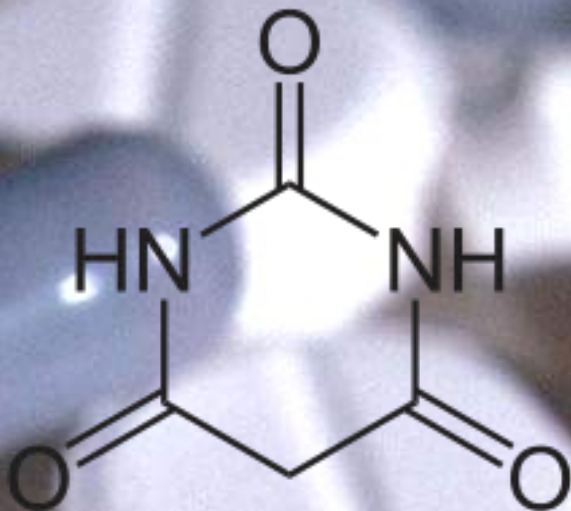
Новокаин

- Большое практическое значение имеют синтетические анестезирующие (обезболивающие) вещества, полученные на основе упрощения структуры кокаина. К ним относятся анестезин, новокаин, дикаин. Кокаин – природный алкалоид, полученный из листьев растения кока, произрастающего в Южной Америке. Кокаин обладает анестезирующим свойством, но вызывает привыкание, что осложняет его использование. В молекуле кокаина анестезиоморфная группировка представляет собой метилалкиламино-пропиловый эфир бензойной кислоты.



- Позднее было установлено, что лучшим действием обладают эфиры парааминобензойной кислоты. К таким соединениям относятся анестезин и новокаин. Они менее токсичны по сравнению с кокаином и не вызывают побочных явлений. Новокаин в 10 раз менее активен, чем кокаин, но примерно в 10 раз и менее токсичен. Главенствующее место в арсенале обезболивающих средств веками занимал морфин – основной действующий компонент опия. Он использовался еще в те времена, к которым относятся первые дошедшие до нас письменные источники. Основные недостатки морфина – возникновение болезненного пристрастия к нему и угнетение дыхания. Хорошо известны производные морфина – кодеин и героин.

Снотворные средства

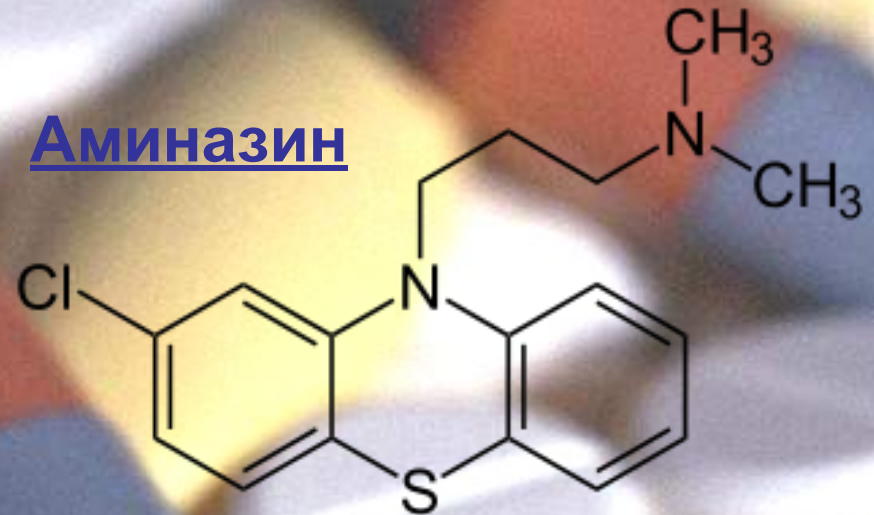


- **Вещества, вызывающие сон, относятся к разным классам, но наиболее известны производные барбитуровой кислоты (полагают, что ученый, получивший это соединение, назвал его по имени своей приятельницы Барбары). Все барбитураты угнетают нервную систему. Амита́л обладает широким спектром успокоительного воздействия. У некоторых пациентов этот препарат снимает торможение, связанное с мучительными, глубоко спрятанными воспоминаниями. Некоторое время даже считалось, что его можно использовать как сыворотку правды. Организм человека привыкает к барбитуратам при частом их употреблении как успокаивающих и снотворных средств, поэтому люди пользующиеся барбитуратами, обнаруживают, что им нужны все большие дозы. Самолечение этими препаратами может принести значительный вред здоровью.**



- **Трагические последствия может иметь сочетание барбитуратов с алкоголем. Совместное их действие на нервную систему гораздо сильнее действия даже более высоких доз в отдельности. В качестве успокаивающего и снотворного средства широко используется димедрол. Он не является барбитуратом, а относится к простым эфирам. Димедрол – активный противогистаминный препарат. Он оказывает местноанестезирующее действие, однако в основном применяется при лечении аллергических заболеваний.**

Психотропные средства



Все психотропные вещества по их фармакологическому действию можно разделить на две группы:

1) Транквилизаторы – вещества, обладающие успокаивающими свойствами. В свою очередь транквилизаторы подразделяются на две подгруппы:

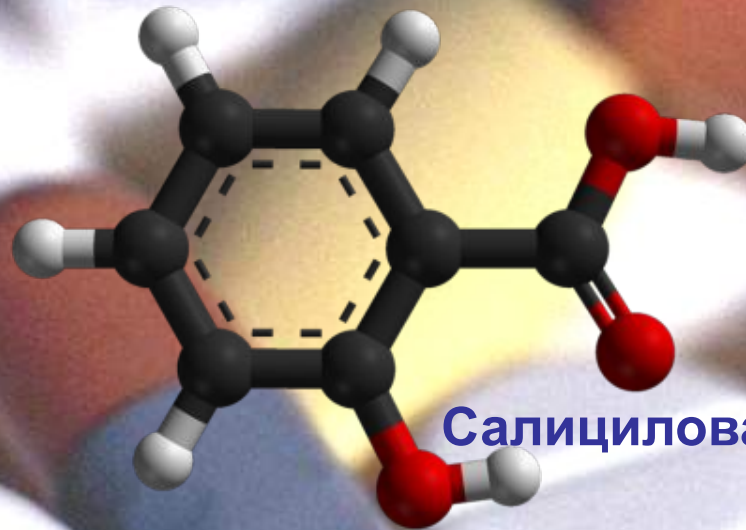
- Большие транквилизаторы (нейролептические средства). К ним относятся производные фенотиазина. Аминазин применяется как эффективное средство при лечении психических больных, подавляя у них чувство страха, тревоги, рассеянность.

- Малые транквилизаторы (атарактические средства). К ним относятся производные пропандиола (мепротан, андаксин), дифенилметана (атаракс, амизил) вещества, имеющие различную химическую природу (дiazepam, элениум, феназепам, седуксен и др.). Седуксен и элениум применяются при неврозах, для снятия чувства тревоги. Хотя токсичность их невелика, наблюдаются побочные явления (сонливость, головокружение, привыкание к препаратам). Их не следует применять без назначения врача.



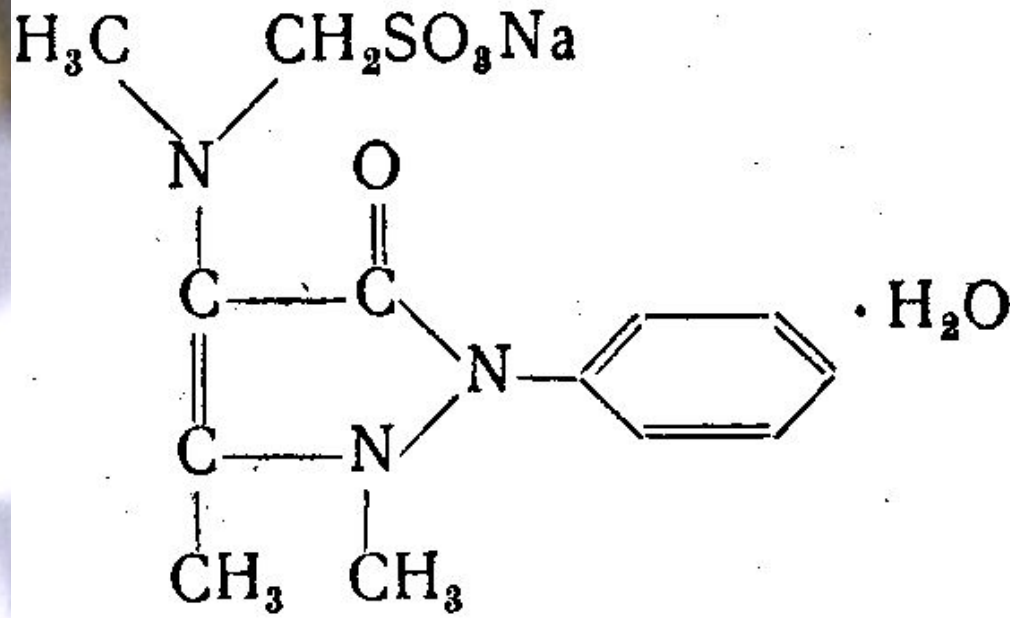
•2) Стимуляторы – вещества, обладающие антидепрессивным действием (фторацизин, индопан, трансамин и др.)

Анельгезирующие, жаропонижающие и противовоспалительные средства



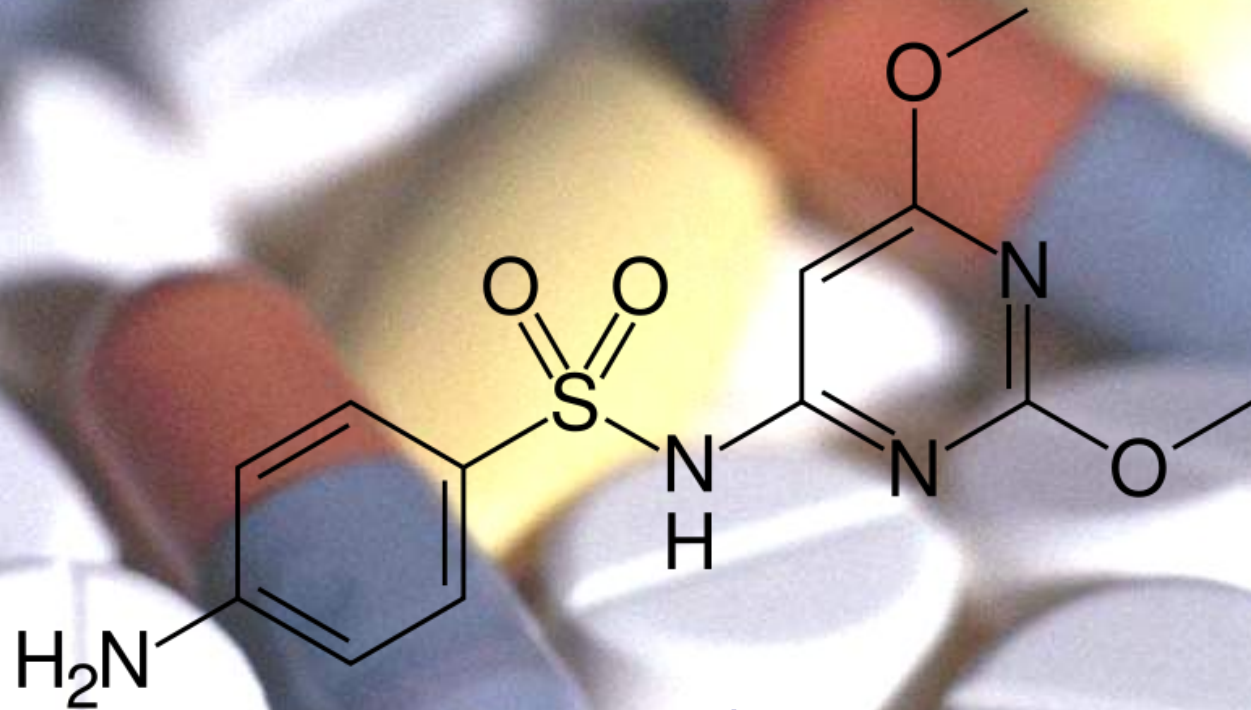
Салициловая кислота

- Крупная группа лекарственных препаратов – производные салициловой кислоты (орто-гидроксibenзойной). Ее можно рассматривать как бензойную кислоту, содержащую в орто-положении гидроксил, либо как фенол, содержащий в орто-положении карбоксильную группу. Салициловая кислота – сильное дезинфицирующее средство. Ее натриевая соль применяется как болеутоляющее, противовоспалительное, жаропонижающее средство и при лечении ревматизма. Из производных салициловой кислоты наиболее известен ее сложный эфир- ацетилсалициловая кислота, или аспирин. Аспирин – молекула, созданная искусственно, в природе он не встречается.

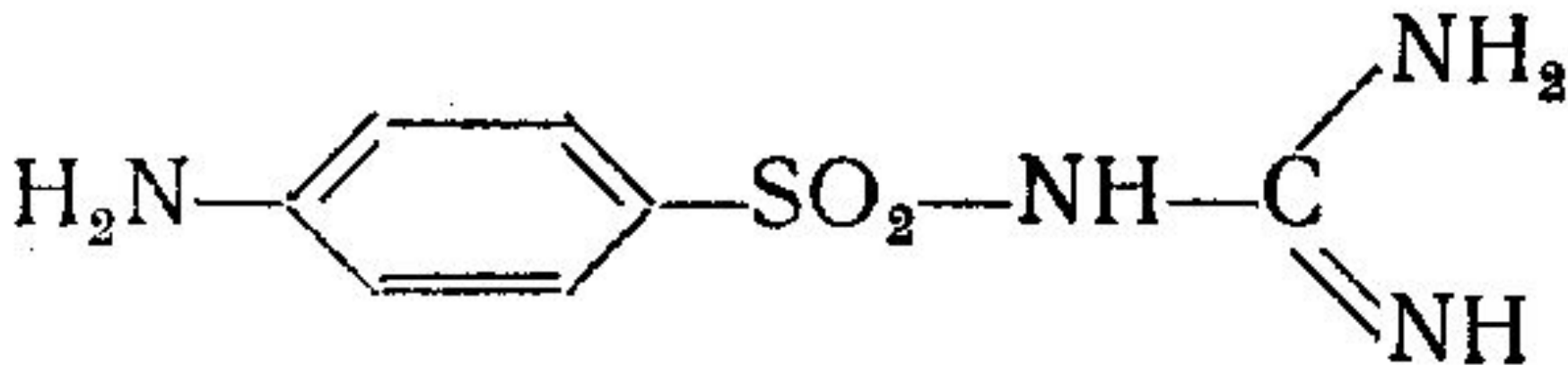


- Ацетилсалициловая кислота обладает противовоспалительным, жаропонижающим и болеутоляющим действием. Лекарственные вещества были получены за счет взаимодействия карбоксильной группы салициловой кислоты с различными реагентами. Например, при действии аммиака на метиловый эфир салициловой кислоты остаток метилового спирта заменяется аминогруппой и образуется амид салициловой кислоты – салициламид. Он используется как противовоспалительное и жаропонижающее средство. В отличие от ацетилсалициловой кислоты салициламид в организме с большим трудом подвергается гидролизу. Распространенными жаропонижающими и болеутоляющими средствами являются производные фенилметилпиразолона – амидопирин и анальгин. Анальгин обладает небольшой токсичностью и хорошими терапевтическими свойствами.

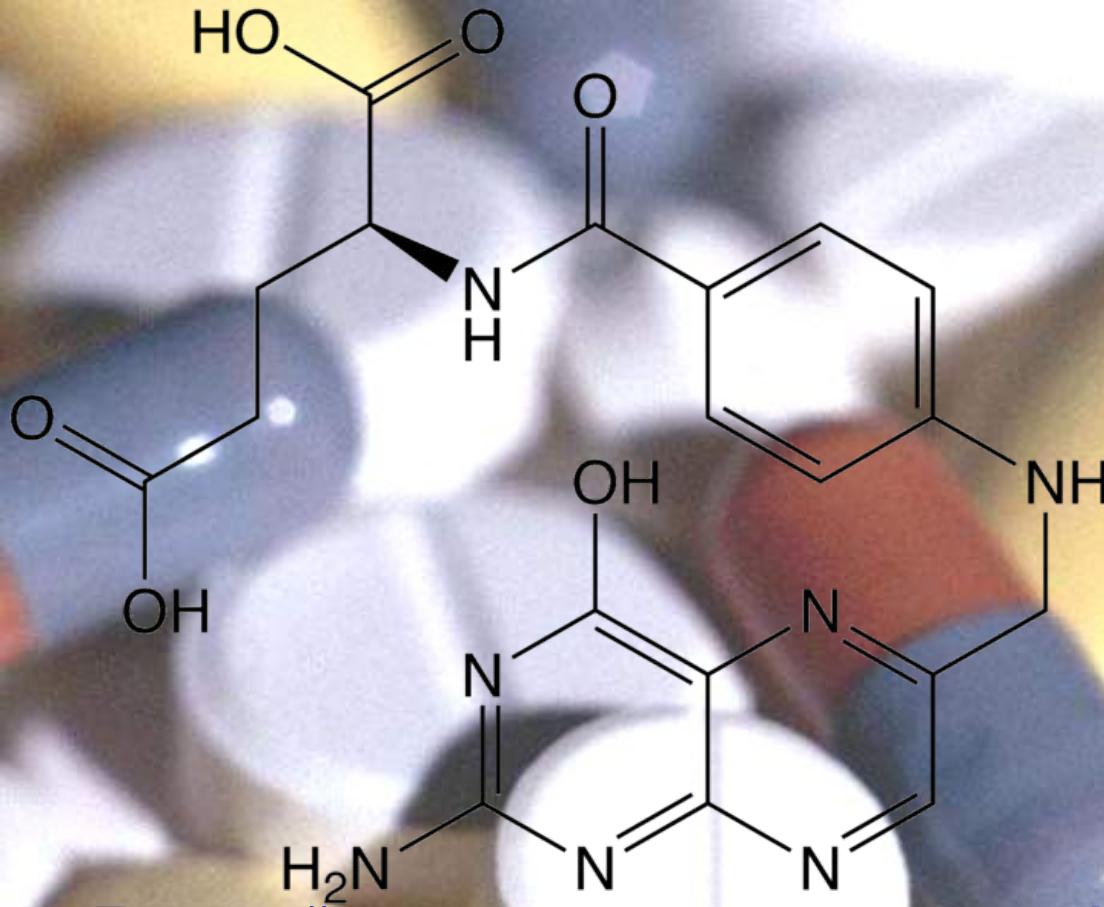
Противомикробные средства



В 30-х годах 20 века широко распространились сульфаниламидные препараты (название произошло от амида сульфаниловой кислоты). В первую очередь это пара-аминобензолсульфамид, или просто сульфаниламид (белый стрептоцид). Это довольно простое соединение – производное бензола с двумя заместителями – сульфамидной группой и аминогруппой. Он обладает высокой противомикробной активностью. Было синтезировано около 10 000 различных его структурных модификаций, но лишь около 30 его производных нашли практическое применение в медицине. Существенный недостаток белого стрептоцида – малая растворимость в воде. Но была получена его натриевая соль – стрептоцид, растворимый в воде и применяющийся для инъекций.

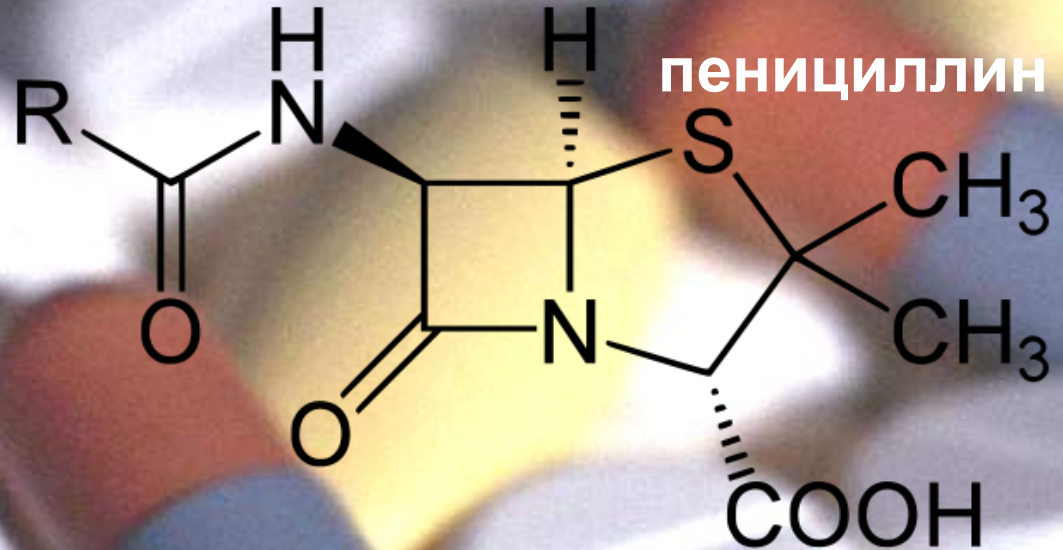


Сульгин – это сульфаниламид, у которого один атом водорода сульфамидной группы замещен на остаток гуанидина. Он применяется для лечения кишечных инфекционных заболеваний (дизентерии). С появлением антибиотиков бурное развитие химии сульфаниламидов спало, но полностью вытеснить сульфаниламиды антибиотикам не удалось. Механизм действия сульфаниламидов известен. Для жизнедеятельности многих микроорганизмов необходима пара-аминобензойная кислота. Она входит в состав витамина – фолиевой кислоты, которая для бактерий является фактором роста. Без фолиевой кислоты бактерии не могут размножаться.

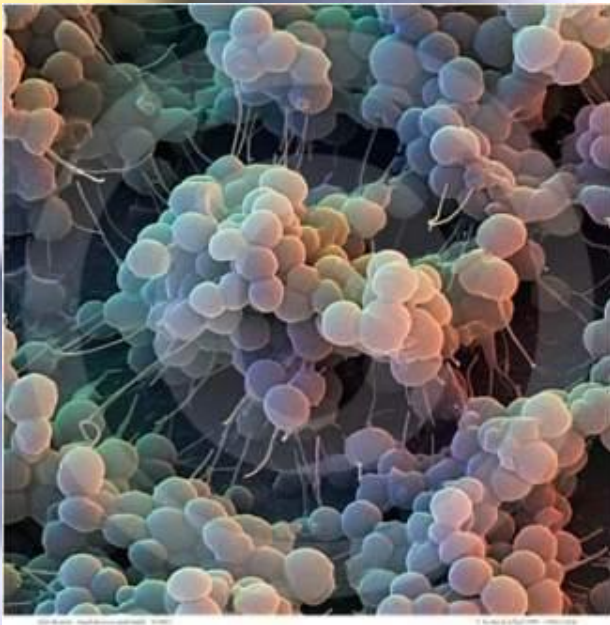


По своей структуре и размерам сульфаниламид близок к пара-аминобензойной кислоте, что позволяет его молекуле занять место последней в фолиевой кислоте. Когда мы вводим в организм, зараженный бактериями, сульфаниламид, бактерии, “не разобравшись”, начинают синтезировать фолиевую кислоту, используя вместо аминокислоты стрептоцид. В результате синтезируется “ложная” фолиевая кислота, которая не может работать как фактор роста и развитие бактерий приостанавливается. Так сульфаниламиды “обманывают” микробов.

Антибиотики

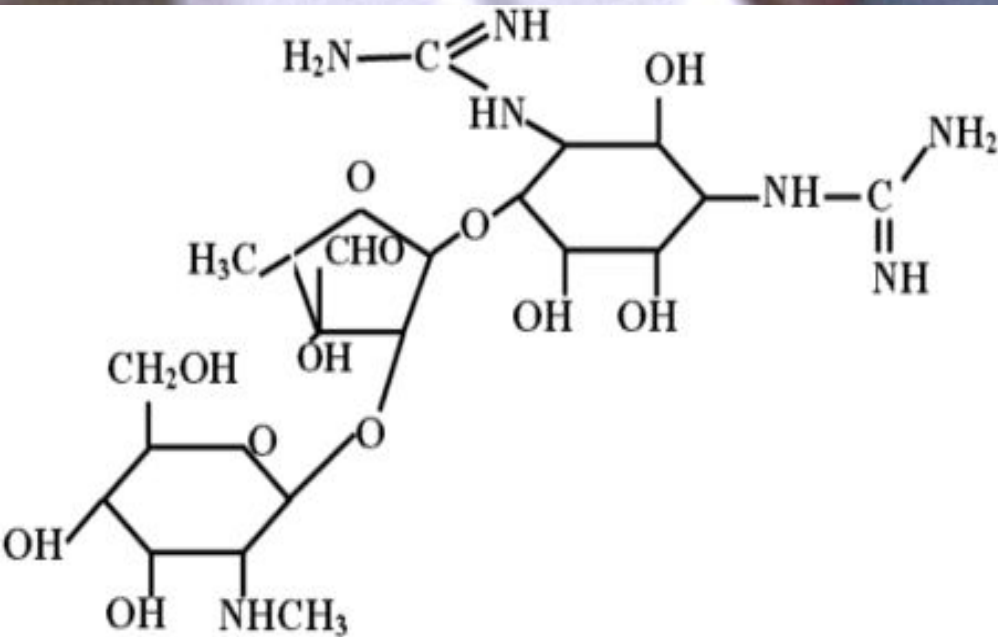


- Обычно антибиотиком называют вещество, синтезируемое одним микроорганизмом и способное препятствовать развитию другого микроорганизма. Слово “антибиотик” состоит из двух слов: от греч. anti – против и греч. bios – жизнь, то есть вещество, действующее против жизни микробов. В 1929 г. случайность позволила английскому бактериологу Александру Флемингу впервые наблюдать противомикробную активность пенициллина. Культуры стафилококка, которые выращивались на питательной среде, были случайно заражены зеленой плесенью. Флеминг заметил, что стафилококковые палочки, находящиеся по соседству с плесенью, разрушались. Позднее было установлено, что плесень относится к виду *Penicillium notatum*. В 1940 году удалось выделить химическое соединение, которое производил грибок. Его назвали пенициллином. В 1941 году пенициллин был опробован на человеке как препарат для лечения болезней, вызываемых стафилококками, стрептококками, пневмококками и др. микроорганизмами.



В настоящее время описано около 2000 антибиотиков, но лишь около 3% из них находят практическое применение, остальные оказались токсичными. Антибиотики обладают очень высокой биологической активностью. Они относятся к различным классам соединений с небольшим молекулярным весом. Антибиотики различаются по своей химической структуре и механизмом действия на вредные микроорганизмы. Например, известно, что пенициллин не дает возможности бактериям производить вещества, из которых они строят свою клеточную стенку. Нарушение или отсутствие клеточной стенки может привести к разрыву бактериальной клетки и выливанию ее содержимого в окружающее пространство. Это может также позволить антителам проникнуть в бактерию и уничтожить ее. Пенициллин эффективен только против грамположительных бактерий.

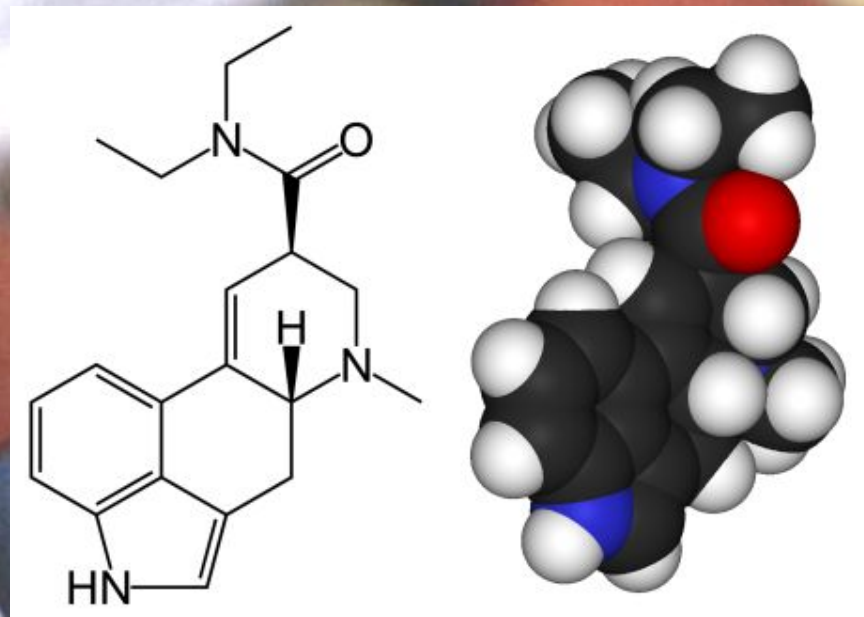
- Стрептомицин эффективен и против грамположительных и грамотрицательных бактерий. Он не позволяет бактериям синтезировать специальные белки, нарушая таким образом их жизненный цикл. Стрептомицин вместо РНК вклинивается в рибосому и все время путает процесс считывания информации с мРНК. Существенным недостатком стрептомицина является чрезвычайно быстрое привыкание к нему бактерий, кроме того, препарат вызывает побочные явления: аллергию, головокружение и т.п. К сожалению, бактерии постепенно приспосабливаются к антибиотикам и поэтому перед микробиологами постоянно стоит задача создания новых антибиотиков.



Стрептомицин

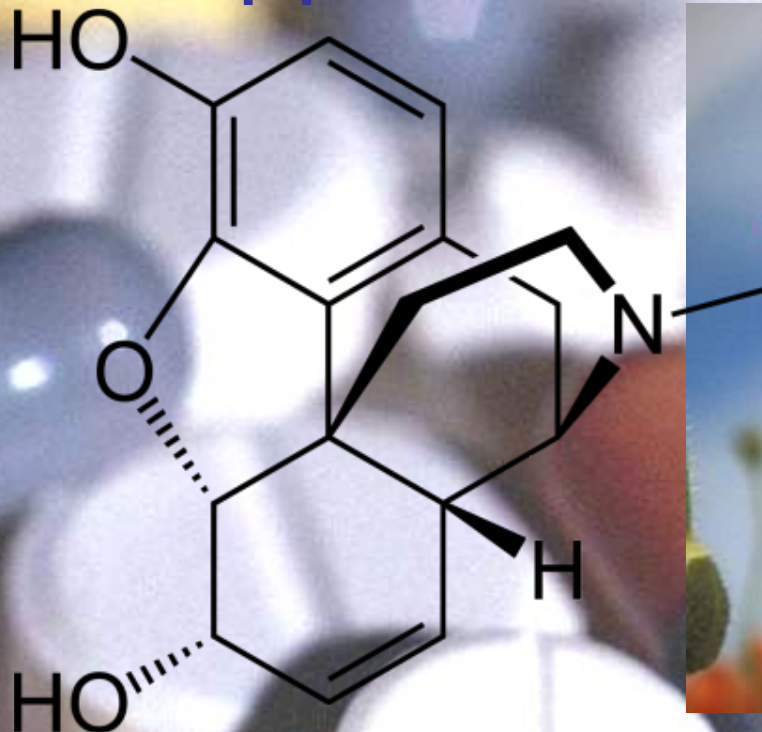


Алкалоиды



- В 1943 году швейцарский химик А. Гофман исследовал различные вещества основного характера, выделяемые из растений – алкалоиды (т. е. подобные щелочам). Однажды химик случайно взял в рот немного раствора диэтиламида лизергиновой кислоты (ЛСД), выделенного из спорыньи, - грибка, растущего на ржи. Через несколько минут у исследователя появились признаки шизофрении – начались галлюцинации, сознание помутилось, речь стала бессвязной. “Я чувствовал, что плыву где-то вне своего тела, описывал впоследствии свое состояние химик. – Поэтому я решил, что умер“. Так Гофман понял, что он открыл сильнейший наркотик, галлюциноген. Оказалось, что достаточно 0,005 мг ЛСД попасть в мозг человека, чтобы вызвать галлюцинации. Многие алкалоиды принадлежат к ядам и наркотикам.

морфин



• С 1806 года был известен морфин, выделяемый из сока головок мака. Это хорошее обезболивающее средство, однако при длительном применении морфина у человека вырабатывается к нему привыкание, организму требуются все большие дозы наркотика. Таким же действием обладает сложный эфир морфина и уксусной кислоты – героин. Алкалоиды – весьма обширный класс органических соединений, оказывающих самое различное действие на организм человека. Среди них и сильнейшие яды (стрихнин, бруцин, никотин), и полезные лекарства (пилокарпин – средство для лечения глаукомы, атропин – средство для расширения зрачков, хинин – препарат для лечения малярии).

кофеин



- К алкалоидам относятся и широко применяемые возбуждающие вещества – кофеин, теобромин, теофиллин. Кофеин содержится в зернах кофе (0,7 – 2,5%) и в чае (1,3 – 3,5%). Он обуславливает тонизирующее действие чая и кофе. Теобромин добывают из шелухи семян какао, в небольшом количестве он сопутствует кофеину в чае, теофиллин содержится в чайных листьях и кофейных зернах. Интересно, что некоторые алкалоиды являются противоядиями по отношению к своим собратьям. Так, в 1952 г. из одного индийского растения был выделен алкалоид резерпин, который позволяет лечить не только людей, отравившихся ЛСД или другими галлюциногенами, но и больных, страдающих шизофренией.



- Большое количество химических веществ служит для изготовления самых разнообразных протезов. Производятся протезы челюстей, зубов, коленных чашечек, суставов конечностей из разных химических материалов, которые успешно применяются в восстановительной хирургии для замены костей, ребер и пр. Химические заводы выпускают для медицинских целей трубки, шланги, ампулы, шприцы, белково-витаминные и другие напитки, кислород, перевязочный материал, аптечную посуду, оптику, красители, больничную мебель и многое другое. Успехи химии, внедрение ее продуктов в медицину открывают безграничные возможности для преодоления ряда заболеваний, в первую очередь вирусных и сердечнососудистых.