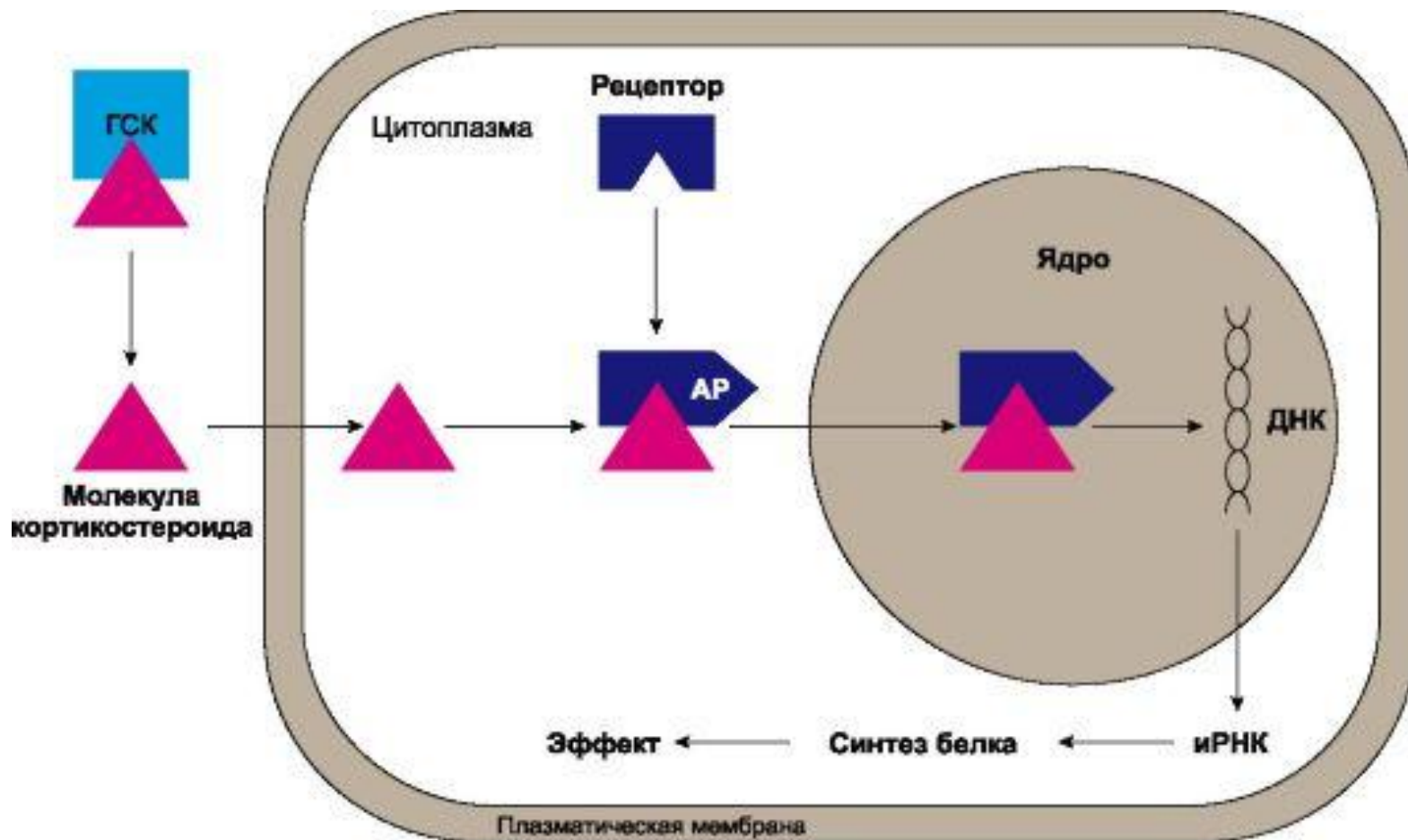


Гормональные препараты стероидного строения. Противовоспалительные средства. Средства, влияющие на миометрий.

Схема взаимодействия кортикостероидных гормонов с внутриклеточными рецепторами.



ГСК — глобулин, связывающий кортикостероиды
АР — активированный рецептор

Основные гормоны коры надпочечников, их препараты и синтетические аналоги

Кортикостероиды	Гормоны	Препараты
Глюкокортикоиды	Гидрокортизон Кортикостерон	Препараты естественных гормонов и их эфиров Гидрокортизон Гидрокортизона ацетат Синтетические препараты Преднизолон Дексаметазон Триамцинолон Синафлан (флуоцинолона ацетонид) Флуметазона пивалат Беклометазон
Минералокортикоиды	Альдостерон 11-Дезоксикортикостерон	Дезоксикортикостерона ацетат Дезоксикортикостерона триметилацетат

Половые гормоны, их препараты, синтетические аналоги и заменители, антагонисты

Группа	Эстрогены и их антагонисты	Гестагены и их антагонисты	Андрогены и их антагонисты
Естественные гормоны и продукты их превращения (стероиды)	Эстрадиол Эстрон Эстриол	Прогестерон Прегнандиол	Тестостерон Андростерон
Препараты половых гормонов и их аналогов (стероиды)	Эстрон Эстрадиола дипропионат Этинилэстрадиол	Прогестерон Прегнин Оксипрогестерона капронат	Тестостерона пропионат Тестостерон энантат Метилтестостерон
Синтетические средства с гормональной активностью (нестероидной структуры)	Синэстрол		
Антагонисты половых гормонов	Кломифена цитрат Тамоксифена цитрат*	Мифепристон (RU 486)	Ципротерона ацетат Флутамид Финастерид**

* Тамоксифен в разных тканях обладает либо антиэстрогенным действием (в грудной железе), либо эстрогенным (в костях и др.). Такие препараты называют *модуляторами эстрогенных рецепторов*. Кломифен во всех тканях обладает только антиэстрогенным действием.

** Ингибитор синтеза дигидротестостерона.

Классификация гормональных контрацептивов

1. Комбинированные эстроген-гестагеновые препараты (КОК):

- однофазные: Мерсилон, Силест, Марвелон, Новинет, Регулон.
- многофазные (двух-Антеовин, трех - Три-мерси, Триквилар, Тризистон, Три-регол).

2. Гестагеновые препараты

- Посткоитальные ("пожарные") ОК - Постинор
- мини-пили (Эксклютон, Микролют, Чарозетта).
- капсулы, подшивающиеся под кожу (Норплант, Импланон).
- Инъекционные гестагены (Депо-Провера)
- Внутриматочная гормональная система (Мирена).

Определить группы гормональных средств А и Б

Препараты Эффекты	А	Б
Противовоспалительно е и десенсибилизирующее действие		+++
Влияние на водно- солевой обмен (способность задерживать ионы натрия)	+++	+
Влияние на углеводный обмен (гипергликемия)	+	+++
Влияние на белковый обмен (катаболическое действие)	+	+++
Нейтрофилез, лимфоцитопения, эозинопения		+

Определить гормональные препараты А-В по показаниям к применению.

Показания Препараты	Болезнь Аддисона (первичная надпочечниковая недостаточность)	Коллагенозы, бронхиальная астма	Воспалительные и аллергические заболевания кожи и слизистых оболочек
А	+	+	+
Б			+
В	+		

Проанализируйте задачу.

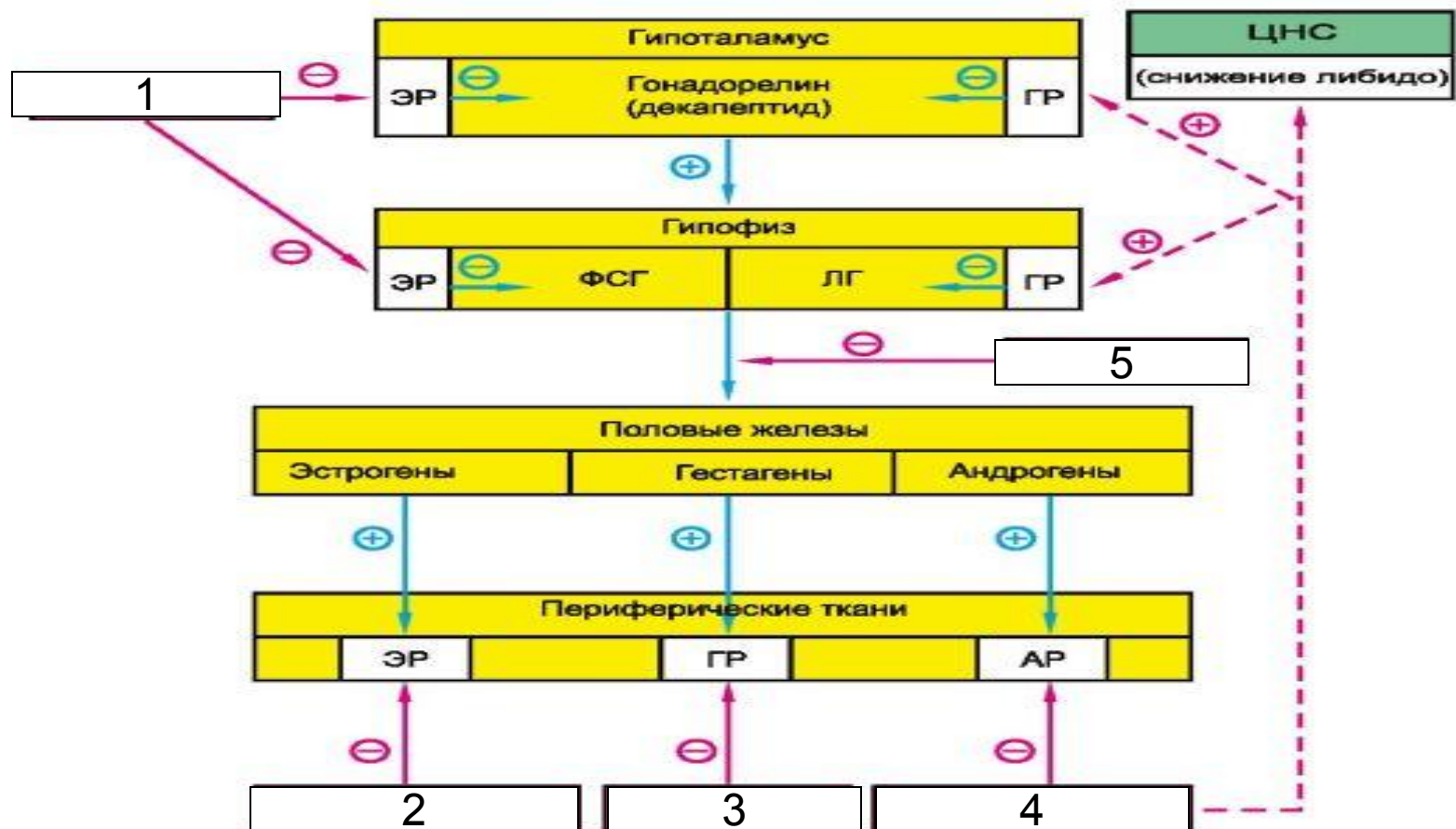
Больному А., страдающему ревматоидным артритом, в стадии обострения был назначен препарат. Больной принимал препарат в течение 3 недель, была достигнута ремиссия. Однако А. стал отмечать отеки, головные боли, боли в эпигастрии, сухость во рту, мышечную слабость. При обследовании выявлено повышение АД до 150/100 мм рт.ст., в общем анализе крови – лимфопения, в биохимическом анализе крови – уровень глюкозы 6,5 ммоль/л.

- Препарат из какой фармакологической группы принимал больной?
- Назовите препараты, относящиеся к данной группе.
- Каков главный эффект данного препарата у больного А.? Механизм этого эффекта.
- Какие нежелательные побочные эффекты проявились у больного?
- Какими еще эффектами обладают данные препараты?

Определить вещества А-В.

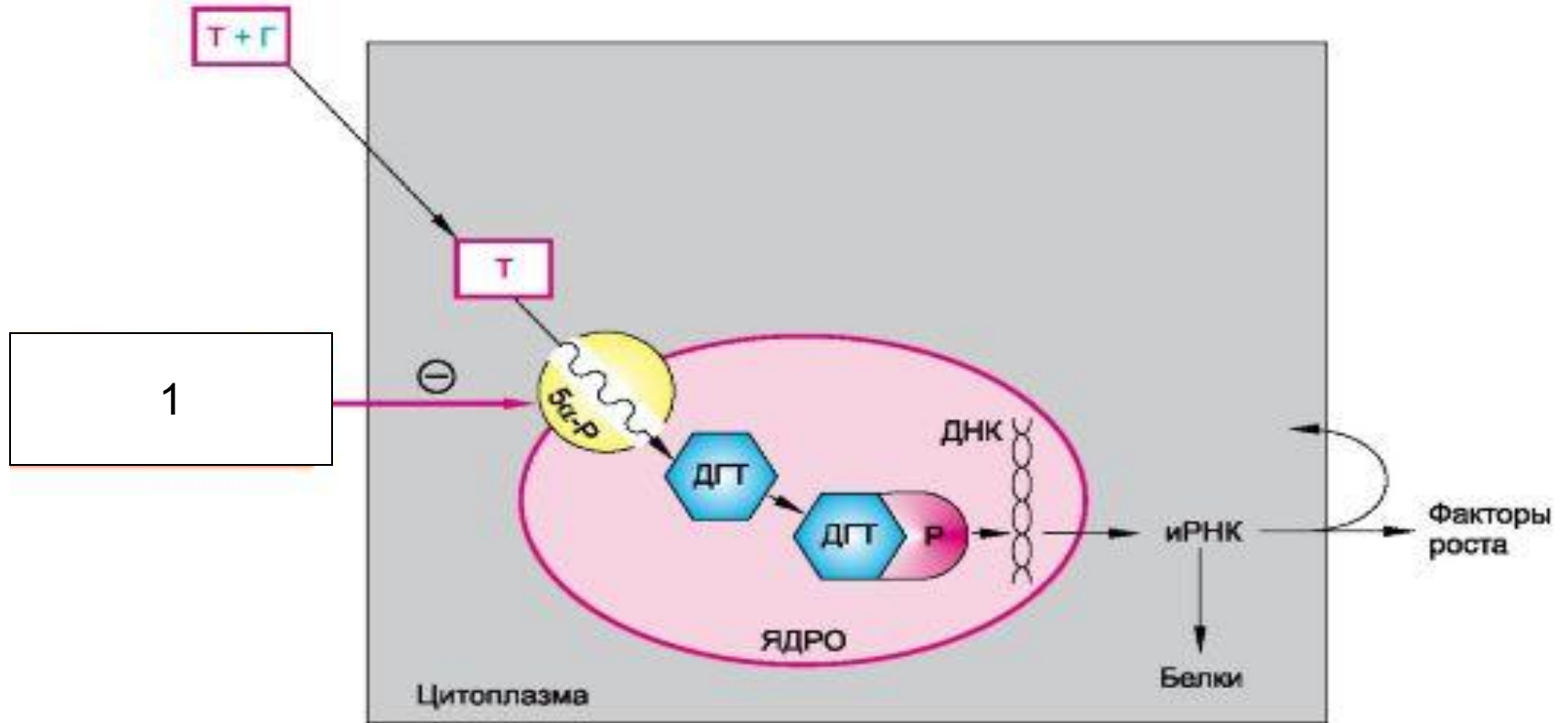
Свойства Вещества	Андрогенная активность	Эстрогенная активность	Анаболическая активность
А	+		+++
Б	++++		+++
В		+++	

Определите антагонисты половых гормонов (1-5)



- ⊖ — угнетающее (блокирующее) действие;
- ⊕ — стимулирующее действие;
- ЭР — эстрогенный рецептор;
- ГР — гестагенный рецептор;
- АР — андрогенный рецептор;
- ФСГ — фолликулостимулирующий гормон;
- ЛГ — лютеинизирующий гормон.

Определить препарат (1)



Клетка эпителия предстательной железы

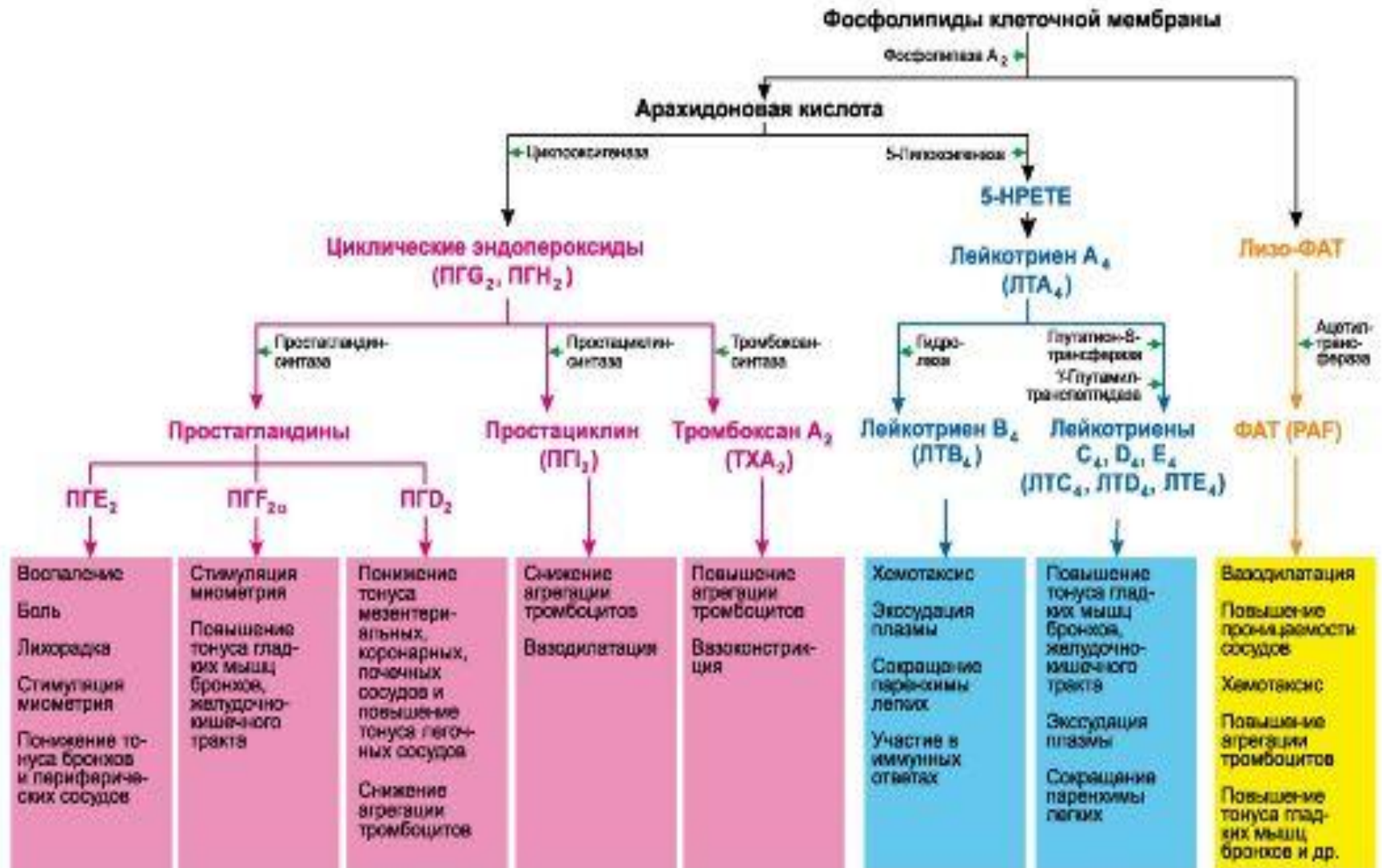
Т — тестостерон
ДГТ — дигидротестостерон
Г — α_2 -глобулин, связывающий половые гормоны (в плазме крови)

5 α -Р — 5 α -редуктаза
Р — андрогенный рецептор

Определите гормональный контрацептив А-В (марвелон, постинор, микролют).

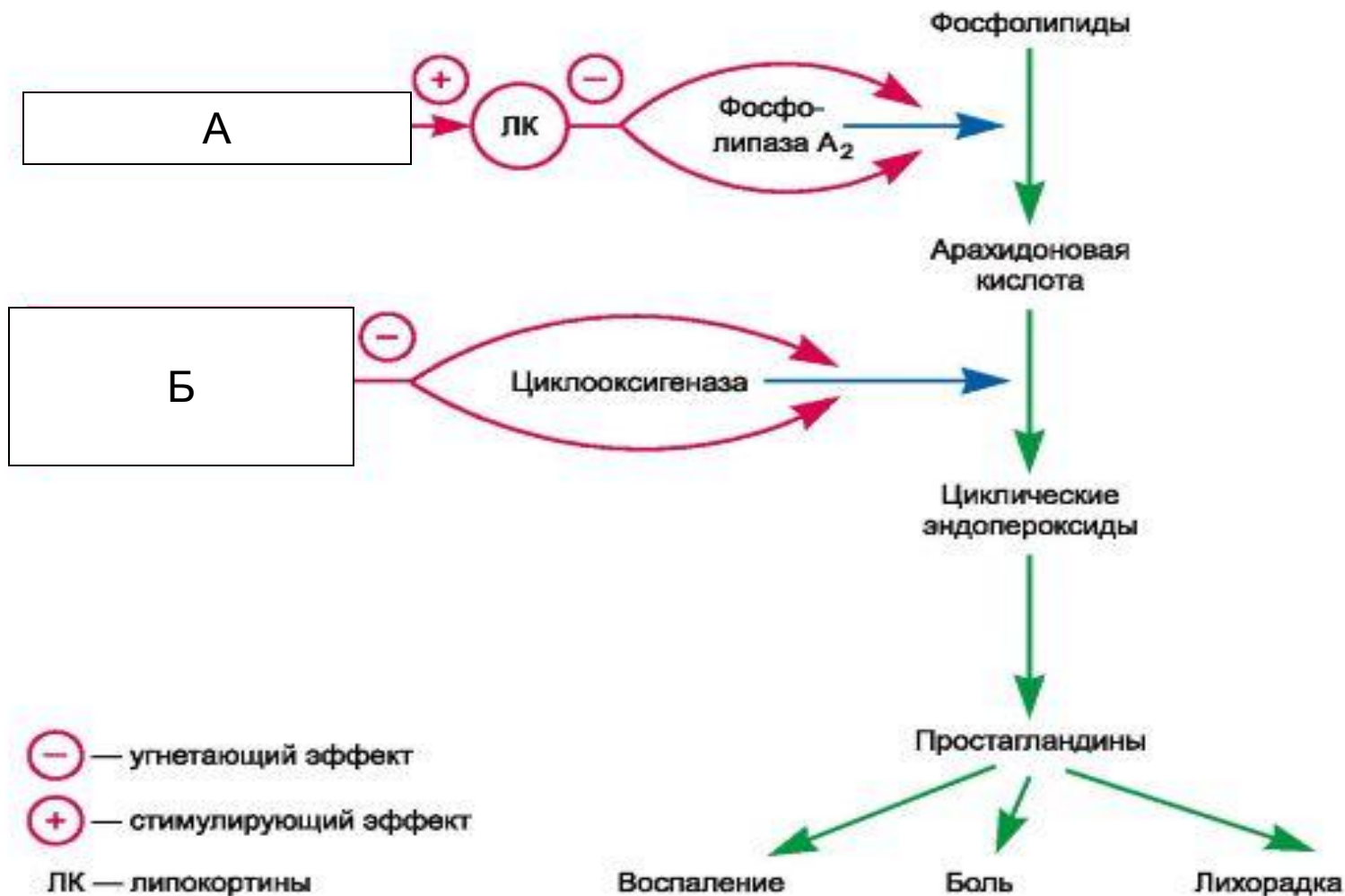
Препарат	Состав	Режим дозирования	Нежелательные эффекты
А	Этинилэстрадиол 0,03 мг, дезогестрел (гестагенный компонент) 0,15 мг	Ежедневно по 1 таблетке в течение 21 дня, затем перерыв 7 дней	Колебания массы тела, нарушение толерантности к глюкозе, тромбоэмболические осложнения
Б	Левоноргестрел (гестагенный компонент) 0,03 мг	Ежедневно по 1 драже без перерывов	Угревая сыпь, нарушения менструальной функции
В	Левоноргестрел 0,75 мг	1 таблетка после незащищенного полового акта, через 12 часов – 2я таблетка	Кровотечения из половых путей

Некоторые метаболиты арахидоновой кислоты и их основные эффекты.



Лейкотриены C₄, D₄ и E₄ являются основными биологическими компонентами МРСА (SPSA) — медленно реагирующей субстанции анафилактики. ФАТ (PAF) — фактор, активирующий тромбоциты

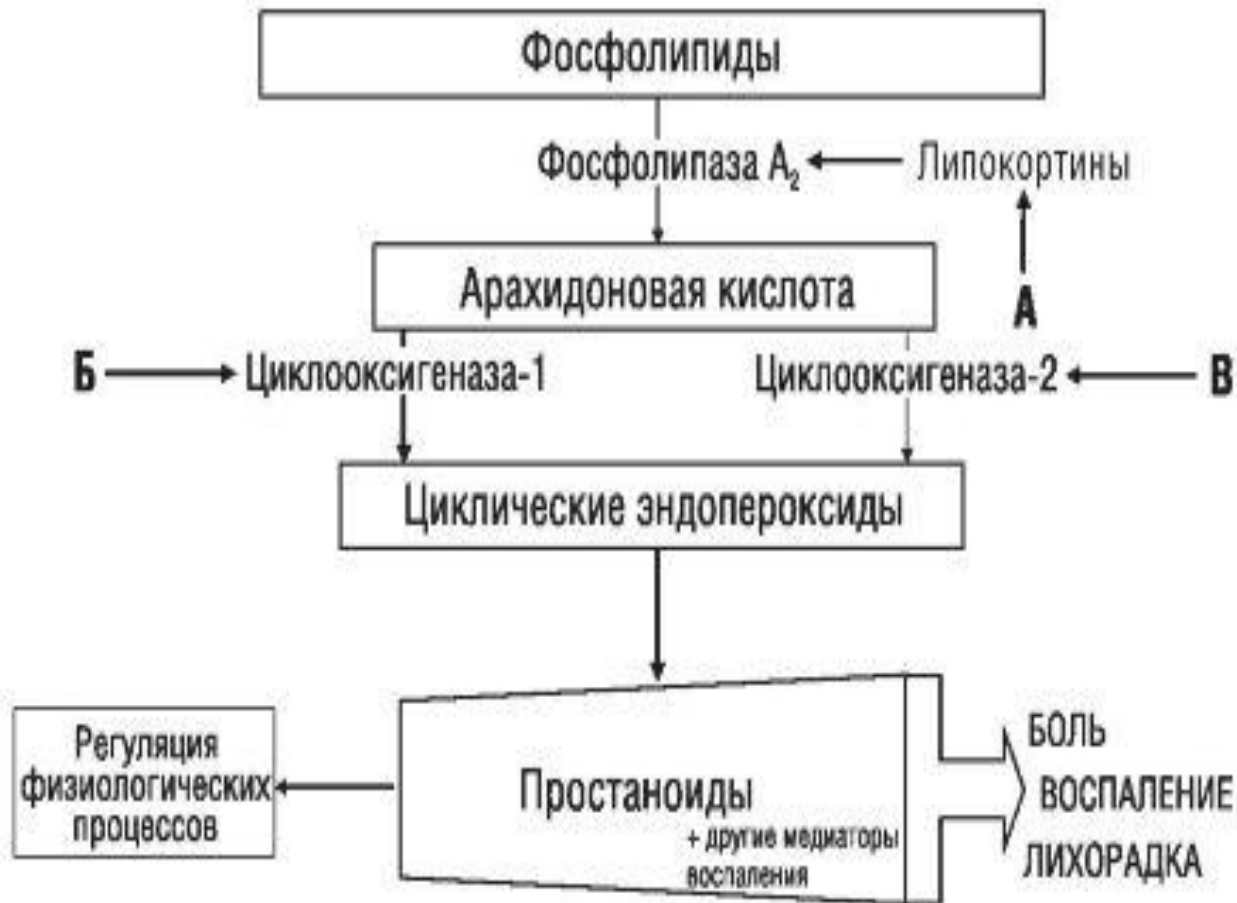
Определите противовоспалительные средства А-Б по их влиянию на биосинтез простагландинов.



Определите противовоспалительное средство А-Б (индометацин, преднизолон).

Препарат	Механизм противовоспалительного действия	Другие клинические эффекты	Нежелательные эффекты и осложнения
А	Ингибирует фосфолипазу A_2 , подавляя 3 фазы воспаления – альтерации, экссудации, пролиферации	Противоаллергический, иммунодепрессивный, противошоковый	Сахарный диабет, мышечная слабость, отеки, подавление иммунитета, перераспределение жировой ткани (лицо, верхняя половина туловища), синдром отмены
Б	Ингибирует ЦОГ, нарушая синтез простагландинов, подавляет фазы экссудации и пролиферации	Обезболивающий, жаропонижающий	Ульцерогенное действие, геморрагические осложнения, лейкопения, нарушение функции печени, почек

Указать направленность действия (А-В) гидрокортизона, кислоты ацетилсалициловой и целекоксиба



Определить противовоспалительные средства А-Б

Группы	Применение			
	хронические ревматические заболевания	бронхиальная астма	сенная лихорадка	подагра
А	+	+	+ [*]	+
Б	+			+

Определить противовоспалительные средства А-Б

Группы	Побочные эффекты				
	изъязвление слизистой оболочки ЖКТ	атрофия коры надпочечников	подавление иммунитета	нарушение обмена веществ	аллергические реакции
А	+	+	+	+	
Б	+				+

Задания по рецептуре.

- 1. Гормональный препарат, обладающий противовоспалительными свойствами (в мази).
- 2. Гормональный препарат, обладающий иммунодепрессивными свойствами (раствор для инъекций).
- 3. Гормональный препарат для лечения аутоиммунных заболеваний (в таблетках).
- 4. Препарат минералокортикоидов.
- 5. Антагонист минералокортикоидов.
- 6. Эстрогенный препарат.
- 7. Гормональное средство для сохранения беременности.
- 8. Гормональное контрацептивное средство.
- 9. Средство, обладающее андрогенной активностью.
- 10. Анаболическое стероидное средство.

Задания по рецептуре.

- 1. Нестероидное противовоспалительное средство.
- 2. Стероидное противовоспалительное средство (в таблетках).
- 3. Избирательный ингибитор ЦОГ-2.
- 4. Неизбирательный ингибитор ЦОГ-1 и ЦОГ-2.
- 5. Противовоспалительное средство - индуктор биосинтеза липокортинов.
- 6. Противовоспалительное средство с иммунодепрессивной активностью (раствор для инъекций).
- 7. Противовоспалительное средство с анальгетическим эффектом.
- 8. Противовоспалительное средство с жаропонижающим эффектом.
- 9. Противовоспалительное средство с антиагрегантной активностью.
- 10. Противовоспалительное средство с противоаллергической активностью.

Классификация средств, влияющих на миометрий.

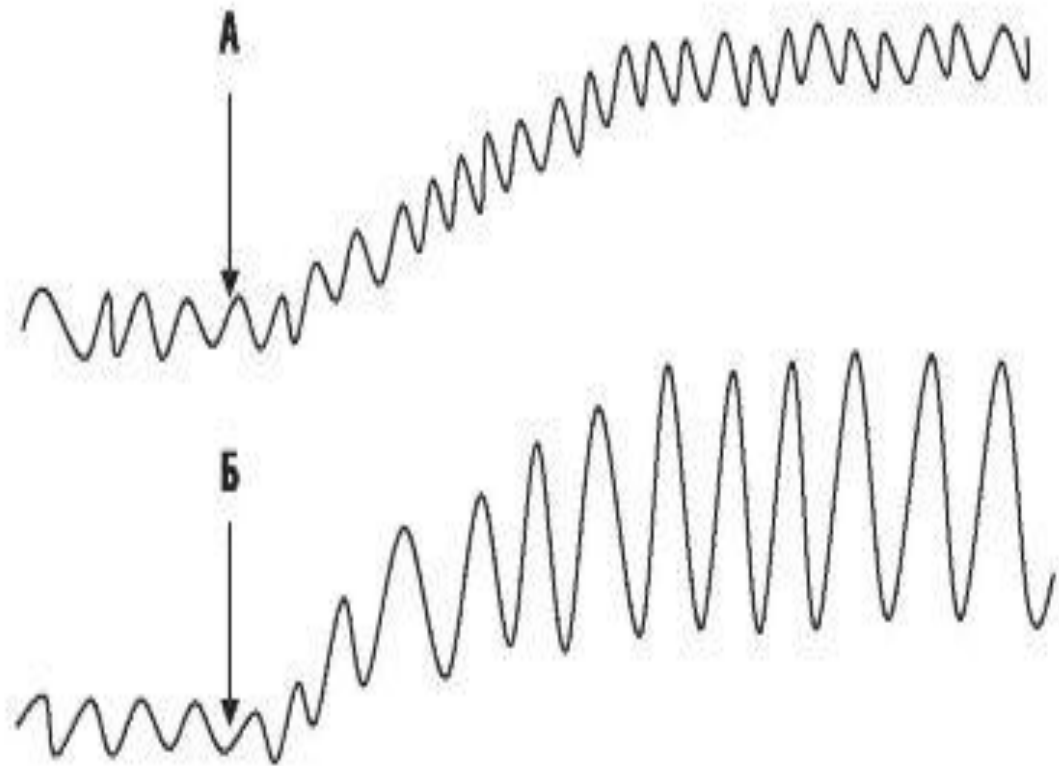
- **I. Средства, влияющие преимущественно на сократительную активность миометрия**
- Усиливающие сократительную активность *Гормоны и препараты задней доли гипофиза* Окситоцин Питуитрин *Препараты простагландинов*
- Динопрост (простагландин F2a) Динопростон (простагландин E2)
Ослабляющие сократительную активность (токолитические средства) *Вещества, стимулирующие преимущественно β_2 -адренорецепторы*
Фенотерол Сальбутамол *Средства для наркоза* Натрия оксибутират
Разные средства Магния сульфат
- **II. Средства, повышающие преимущественно тонус миометрия**
- *Препараты растительного происхождения (алкалоиды и препараты спорыньи)* Эргометрина малеат Экстракт спорыньи густой
- Эрготамина гидротартрат Эрготал *Синтетические средства*
Котарнина хлорид
- **III. Средства, понижающие тонус шейки матки**
- Атропина сульфат Динопрост Динопростон

Сравнительная характеристика алкалоидов спорыньи

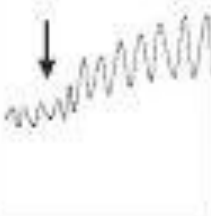

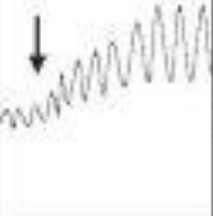

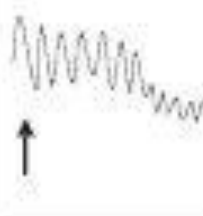
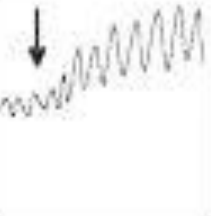

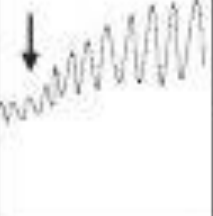

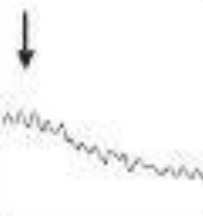




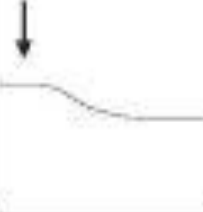
Алкалоид	Повышение тонуса миометрия	α -Адрено-блокирующие свойства	Спазм периферических сосудов (повреждение эндотелия)
Эргометрин	Высокая активность; быстрое развитие действия; эффективен при введении внутрь	Отсутствуют	Низкая активность
Эрготамин Эргозин Эргокриптин Эргокорнин	Высокая активность (особенно у эрготамина); значительный латентный период; при введении внутрь неэффективны	Выражены	Высокая активность (особенно у эрготамина)

Примечание. Эргометрин менее токсичен, чем эрготамин.

Определить препараты А и Б по их влиянию на тонус и сократительную активность миометрия



Определить препараты А-Д, влияющие на миометрий (эргометрин, динопростон, динопрост, сальбутамол, окситоцин)

Эффекты		Препараты				
		А	Б	В	Г	Д
I	Влияние на тонус и сократительную активность миометрия в поздние сроки беременности					
II	Влияние на тонус и сократительную активность небеременной матки					
III	Влияние на артериальное давление					

Задание по рецептуре.

Выписать:

- 1. Средство для стимуляции родов.
- 2. Средство, усиливающее сокращения миометрия и понижающее тонус мышц шейки матки.
- 3. Средство, ослабляющее сокращения миометрия.
- 4. Средство для остановки маточных кровотечений.