

Санкт-Петербургское государственное бюджетное профессиональное образовательное учреждение «Фельдшерский колледж»



Лекция по фармакологии №3
Лечебное дело 2 семестр

Препараты гормонов
(1 часть)

преподаватель, к.м.н.

Орлова Анна Владимировна

Гормоны - биологически активные вещества, вырабатываемые эндокринными железами или отдельными клетками в различных тканях (гистогормоны), гуморальные посредники ЦНС во влиянии на ткани и органы.

Особенно ярко проявляется роль гормонов при недостаточной (**гипофункция**) или повышенной функции (**гиперфункция**) желез.

Для **лечения** эндокринных заболеваний часто применяют гормональные средства (**заместительная, стимулирующая терапия**).

Нейрогормоны - это специфические пептиды гипоталамуса, синтезированные в специализированных нервных клетках.

К числу эндокринных органов относят:

- гипофиз,
- эпифиз,
- щитовидную железу,
- околощитовидные железы,
- надпочечники (мозговое и корковое вещество).

Поджелудочная железа - это железа смешанная (экзо- и эндокринной секреции).

Половые железы (гонады) обладают эндокринной активностью, вырабатывая половые гормоны — андрогены и эстрогены.

Для гормонов характерно:

- **дистантность действия;**
- **высокая биологическая активность;**
- **специфичность;**
- **кратковременность;**
- **влияние через специфические рецепторы;**
- **осуществление эффектов через вторые посредники.**

Классификация гормональных средств

- белковопептидные** (гормонопрепараты гипоталамуса, гипофиза, паращитовидных желез, тиреокальцитонин, препараты гормонов поджелудочной и вилочковой желез, а также гистогормоны),
- стероидные** (глюкокортикоиды, минералокортикоиды, андрогены, эстрогены, гестагены, стероидные анаболики)
- гормоны аминокислотного строения** (норадреналин, адреналин, тироксин, трийодтиронин).

Применение гормональных средств может происходить по 4-м основным направлениям:

1. Заместительная терапия:

- инсулин при сахарном диабете;
- минералокортикоиды при болезни Аддисона;
- глюкокортикоиды при атрофии надпочечников;
- половые гормоны при гипофункции половых желез.

2. Стимуляция функции периферических желез:

- АКТГ при атрофии коры надпочечников;
- блокаторы гипоталамо-гипофизарной системы (эстрогены и др.).

3. Подавление функции периферических желез:

- стимуляция рецепторов гипоталамо-гипофизарной системы (гормональные контрацептивы и др.).

4. При негормональных заболеваниях:

- глюкокортикоиды при воспалении и аллергии;
- половые гормоны при раке яичников, предстательной железы, молочных желез.

Некоторые гормонопрепараты нашли применение при лечении **неэндокринных заболеваний** (неспецифическая гормонотерапия).

В этом случае их вводят без учета эндокринного фона больного и в высоких дозах - в расчете на специфический эффект препарата.

Все остальные эффекты нежелательны и при длительном применении могут представлять опасность.

Шире других гормонопрепаратов для целей неспецифической гормонотерапии применяют препараты **глюкокортикоидов**.

Антигормональные средства либо препятствуют синтезу, выведению и активации гормонов, либо нарушают гипоталамо-гипофизарную регуляцию функции железы, либо блокируют рецепторы гормона.

Их применяют при гиперфункции железы и для паллиативного лечения гормонозависимых опухолей эндокринных желез и гормонозависимых тканей.

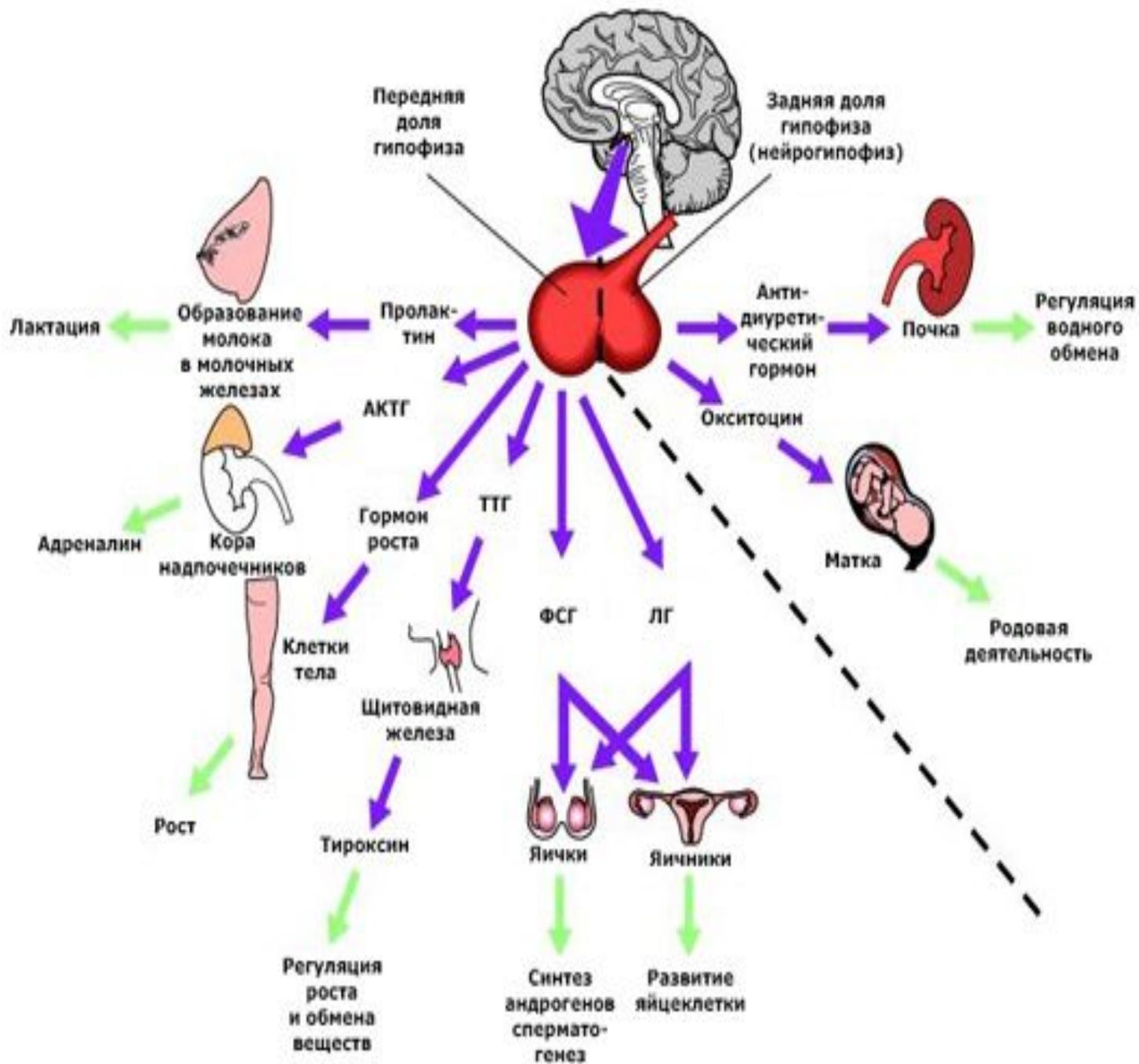
Классификация препаратов

1. Гормоны гипоталамуса
2. Гормоны гипофиза
3. Гормоны щитовидной и паращитовидной желез
4. Гормоны коркового вещества надпочечников
5. Гормоны поджелудочной железы
6. Половые гормоны

В гипофизе различают три доли: переднюю, среднюю и заднюю. Каждая из этих долей выделяет в кровь гормональные вещества.

Передняя доля гипофиза продуцирует ряд гормонов:

- адренокортикотропный гормон (АКТГ, стимулирует продукцию гормонов коры надпочечников),
- гормон роста,
- лактогенный гормон (стимулирует секрецию молока молочными железами в послеродовом периоде),
- тиреотропный гормон (ТТГ, стимулирует образование и выделение гормонов ЩЖ),
- два гонадотропных гормона - фолликулостимулирующий гормон и лютеинизирующий гормон (стимулируют активность половых желез).



Фолликулостимулирующий и лютеинизирующий гормоны не обладают половой специфичностью и продуцируются в организме как женщин, так и мужчин.

У женщин **фолликулостимулирующий** гормон стимулирует рост фолликулов яичника, у мужчин - сперматогенез.

Лютеинизирующий гормон в женском организме способствует наступлению овуляции, у мужчин - стимулирует продукцию мужских половых гормонов.

Задняя доля гипофиза продуцирует два гормона - окситоцин и вазопрессин (антидиуретический гормон).

Окситоцин стимулирует ритмические сокращения миометрия во время родов (см. главу **17, а**), а также способствует выделению молока молочными железами в послеродовом периоде.

Вазопрессин усиливает тонус гладких мышц кровеносных сосудов (и в связи с этим повышает артериальное давление), желудочно-кишечного тракта. Кроме того, вазопрессин стимулирует обратное всасывание (реабсорбцию) воды в почечных канальцах. В связи с этим задерживается выделение воды из организма. Наоборот, при недостаточности вазопрессина мочеотделение резко увеличивается (до **10-20** л в сутки), развиваются исхудание, сильная мышечная слабость. Заболевание носит название несахарного диабета (несахарное мочеизнурение).

Препараты гормонов передней доли гипофиза:

1. препараты гормона роста (**соматотропин – Сайзен, октреотид**)
2. Препараты лактогенного гормона (**пролактин, лактин**),
3. препараты тиреотропного гормона (**тиротропин**),
4. препараты, которые по своему действию соответствуют гонадотропным гормонам гипофиза
 - **гонадотропин менопаузный, Фоллитропин-бета (Пурегон)**, (соответствует фолликулостимулирующему гормону),
 - **гонадотропин хорионический (Прегнил)** (соответствует лютеинизирующему гормону).
5. Стимулируют кору надпочечников **Тетракозактид (Синактен-депо), Кортикотропин (АКТГ)**,

Октреотид (**Octreotide**)

Является синтетическим аналогом соматотропина. Имеет более пролонгированное действие.

Форма выпуска: Ампулы по **0,00005; 0,0001** и **0,0005** г; флаконы по **0,001** г.

Подкожно **0,0001-0,003** г, растворив в **5** мл растворителя.

Сандостатин ЛАР - октреотид пролонгированного действия.

Ланреотид - также синтетический аналог соматотропина, обладающий

еще более длительным действием. Вводят в/м **1** раз в **10-14** дней.

Антагонистом является **Бромокриптин** (дофаминомиметик), угнетающий избыточную продукцию гормона роста. Показан при акромегалии.

Кортикотропин (**Corticotropinum**)

Кортикотропин является препаратом АКТГ, выделен из гипофиза крупного рогатого скота, свиней и овец. Разработаны также генно-инженерные методы получения кортикотропина.

Форма выпуска:

Флаконы **10; 20; 30; 40** ЕД (внутримышечно **10-20** ЕД).

Фармэфекты:

- антиаллергическое;
- иммунодепрессивное;
- противовоспалительное; **10**
- антиколлагенозное действие (атрофия соединительной ткани);
- влияет на все виды обмена.

Тиротропин для инъекций (Thyrotropinum)

Показания к применению: дифференциальная диагностика гипотиреоза и опухолей щитовидной железы в сочетании с тиреоидином при гипофункции щитовидной железы диэнцефалогипофизарного генеза;

- **недостаточность функции гипофиза, гипофизарная кахексия; гипофизарный нанизм; адипозогенитальный синдром; церебрально-гипофизарное ожирение.**

Побочные эффекты: аллергические реакции.

Противопоказания: хроническая коронарная недостаточность; первичная тиреоидная микседема; токсический и узловой зоб; выраженный гипокортицизм.

Форма выпуска: Флаконы **5** мл (**10**ЕД); п/к, в/м - **1** раз в день – курс **5-7** дней, курсы повторяют с перерывом в **2-3** месяца.

Показания к применению:

- вторичная гиподисфункция коры надпочечников, предупреждение атрофии надпочечников и развития "синдрома отмены", после длительного лечения кортикостероидными препаратами;
- исследования гипоталамо-гипофизарно-надпочечниковой недостаточности;
- воспалительное нарушение мозгового кровообращения (хорея);
- паркинсонизм.

Побочные эффекты: повышение АД; отеки; тахикардия; усиление белкового обмена с отрицательным азотистым балансом; возбуждение, бессонница, психозы; нарушение менструального цикла; задержка рубцевания ран; обострение скрытых очагов инфекций; задержка роста у детей; проявления сахарного диабета, усиление гипергликемии и кетоз при имеющемся диабете.

Противопоказания: ГБ; выраженная СН; детский возраст; беременность; психозы; сахарный диабет; язвенная болезнь; болезнь Иценко - Кушинга; нефрит; острый эндокардит; активная форма туберкулеза; остеопороз; аллергические реакции на кортикотропин.

Лактин для инъекций (**Lactinum**)

Препарат пролактина

Показания к применению:

- усиление лактации в послеродовом периоде;
- некоторые формы бесплодия у лиц обоего пола.

Побочные эффекты:

- возможно из-за увеличения отдельных фолликулов, при разрыве которых возможно обильное кровотечение в брюшную полость;
- многоплодие;
- увеличение размеров яичек у мальчиков, задержка их опускания;
- угнетение гонадотропной функции гипофиза.

Форма выпуска: Флаконы - стерильный лиофилизированный порошок (по **100** и **200** ЕД);
в/м по **70-100** ЕД, растворив в воде для инъекций.

Препараты задней доли гипофиза:

- **Окситоцин,**
- **Вазопрессин**
- **Десмопрессин (Адиуретин)**
- **Терлипрессин (Реместил).**

Окситоцин, Oxytocinum.

При слабой родовой деятельности препарат вводят внутривенно капельно (**1** мл препарата в **500** мл **5%** раствора глюкозы) или одномоментно (**0,2** мл препарата в **20** мл **40%** раствора глюкозы). Последнее допускается лишь при полном раскрытии шейки матки.

Форма выпуска: ампулы по **1** мл (**5** ЕД).

Хранение: список Б; в защищенном от света месте.

Rp.: Oxytocini 1 ml (5 ЕД)

D.t.d.N. 12 in ampullis

S. Содержимое ампулы

растворить в **500** мл **5%**

раствора глюкозы. Вводить

внутривенно капельно.

Питуитрин, **Pituitrinum** - прозрачная жидкость.

Для усиления родовой деятельности препарат вводят под кожу или внутримышечно по **0,2-0,25** мл через **15-30** мин **4-6** раз. При несахарном диабете препарат вводят ежедневно по **1** мл (**5** ЕД).
Высшие дозы (для взрослых): разовая **10** ЕД, суточная **20** ЕД.
Форма выпуска: ампулы по **1** мл (**5** ЕД).
Хранение: список Б; в защищенном от света месте.

Гормоны щитовидной железы:

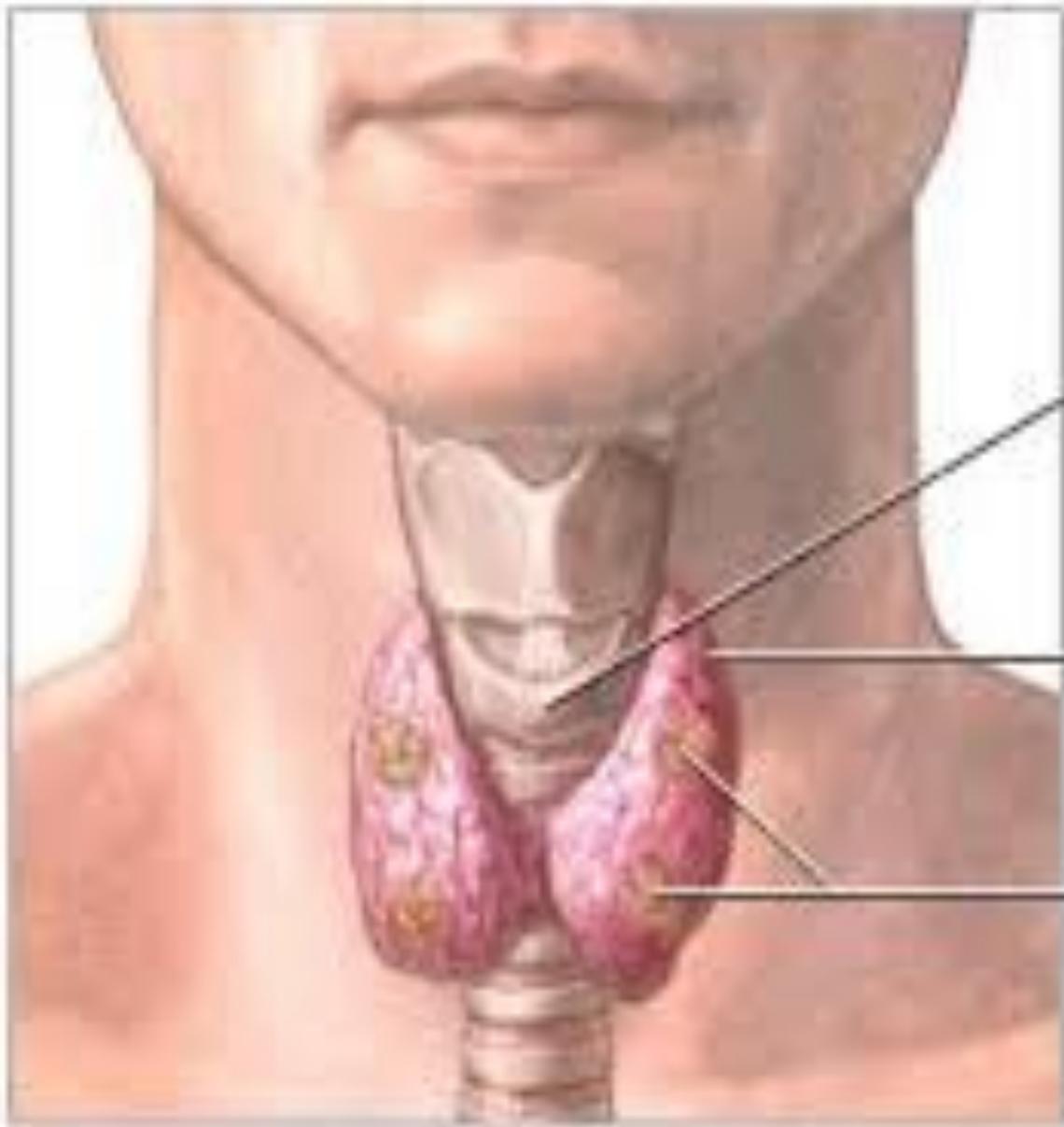
- **Тироксин (Т4)**
- **Трийодтиронин (Т3)**
- **Кальцитонин**

Тироксин и трийодтиронин оказывают выраженное стимулирующее влияние на белковый, углеводный и жировой обмен, повышая при этом возбудимость ЦНС и миокарда.

Кальцитонин снижает содержание кальция в крови и увеличивает его отложение в костной ткани.

РОЛЬ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

- ✘ Влияют на все виды обмена веществ, усиливая процессы метаболизма
- ✘ Необходимы для нормального роста и дифференциации тканей плода
- ✘ Влияют на половые железы, повышая лютеинизирующую и понижая фолликулостимулирующую функции гипофиза



Перстневидный
хрящ

Щитовидная
железа

Паращитовидные
железы

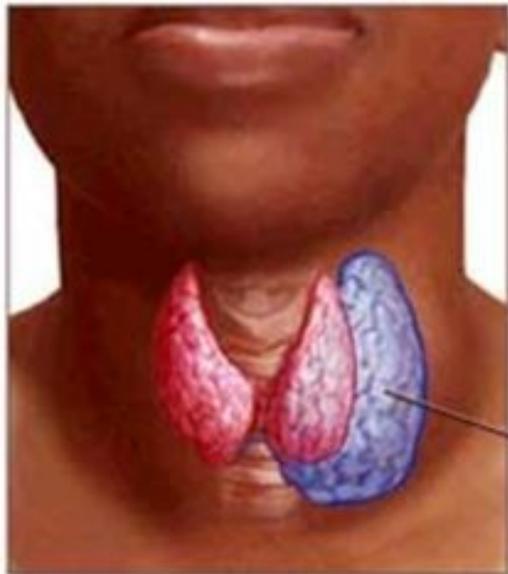
Врожденная недостаточность щитовидной железы (кретинизм) и недостаточность, возникшая в зрелом возрасте (**микседема**), сопровождаются ожирением, отеками, отставанием в психическом развитии.

Недостаточность щитовидной железы может развиваться также при недостатке в пище йода, который необходим для синтеза гормонов щитовидной железы. При этом наблюдается компенсаторное увеличение щитовидной железы (образуется зоб). Заболевание называется **эндемическим зобом**.

Для синтеза тиреоидных гормонов щитовидной железе необходим **йод**. Йод мы получаем с пищей.

Однако, часто в нашей пище йода бывает недостаточно. В этом случае может развиваться такое заболевание как йоддефицитный или эндемический **зоб**.

Гипертиреоз, как следствие наличия аденомы щитовидной железы



Гиперфункция щитовидной железы



При гиперфункции щитовидной железы (тиреотоксикоз, базедова болезнь) отмечаются увеличение щитовидной железы, похудание, легкая возбудимость, быстрая утомляемость, тахикардия, характерным симптомом является пучеглазие.

Продукция гормонов щитовидной железы стимулируется тиреотропным гормоном передней доли гипофиза.

Гипотиреоз

- Выпадение волос
- Неспособность ясно мыслить
- Зоб (увеличение железы)
- Замедленное сердцебиение
- Сильная усталость
- Чувствительность к холоду
- Сухая кожа
- Увеличение веса
- Отечность
- Проблемы с памятью
- Запор
- Нарушение менструального цикла
- Сильно выраженный пмс
- Депрессия, перепады настроения
- Боль в мышцах и суставах
- Высокий уровень холестерина



Гипертиреоз

- Выпадение волос
- Выпученность глаз
- Зоб (увеличение железы)
- Учащенное сердцебиение
- Дрожь
- Непереносимость жары
- Нарушения сна
- Потеря веса
- Одышка
- Диарея
- Повышенный аппетит
- Нарушение менструального цикла
- Мышечная слабость
- Потливость
- Чувство тревоги, нервозность
- Депрессия, перепады настроения

Препараты гормонов щитовидной железы:

***T4** – Левотироксин натрия (**L-**
тироксин)

***T3** - Лиотиронин
(Трийодтиронин)

***T3+T4** - Тиреоидин,

***Кальцитонин** – Кальцитонин
(Алостин, Вепрена)

Лечение и профилактика йоддефицитных состояний

- препараты йода - Калия йодид
(Йодомарин, Микройодид **100**,
Йодид **100**, Антиструмин, Йод
Витрум);

Антитиреоидные средства:

- Тиамазол (Мерказолил).

Тиреоидин (**Thyreoidinum**).

В нем имеется тироксин и в меньшем количестве трийодтиронин. Содержание органического йода до **0,23%**.

Показания: некоторые формы ожирения, гипоталамо-гипофизарные синдромы, когда наблюдается снижение секреции ТТГ и выявляется гипотиреоз, болезнь Шихепа, прогрессирующий отечный экзофтальм для подавления избыточной продукции ТТГ (экзофтальмического фактора) и др.

При передозировке тиреоидина возникают осложнения. Появляются симптомы тиреотоксикоза: сердцебиение, тремор, повышается артериальное давление, наблюдается потеря в весе.

Тиреоидин назначают детям до одного года при детском гипотиреозе в порошках по **0,005-0,01-0,02** г.

Доза для взрослых **0,1—0,2** г в таблетках **2—3** раза в день. При тяжелой форме гипотиреоза — **0,6** г в день.

Трийодтиронин (**Triiodthyroninum**).

Синонимы: **Lyothyronin, Thybon** и др.

Трийодтиронин обладает более активным биологическим действием и его соответственно назначают в меньших дозах.

Доза для детей по **5—10** мкг. Для взрослых **10—25** мкг. При микседематозной коме трийодтиронин применяют в больших дозах до **100** мкг. Лечение трийодтиронином должно проводиться под контролем пульса, АД, основного обмена, содержания холестерина в крови и исследования йода, связанного с белком.

Калия йодид, Kalii iodidum - бесцветные или белые кристаллы либо белый мелкокристаллический порошок.

Назначают внутрь в растворах и микстурах при эндемическом зобе и гипертиреозе по **0,001** г на прием, в качестве отхаркивающего по **0,3-0,5** г на прием **3-4** раза в день.

Входит в состав таблеток "Антиструмин" (содержат по **0,001** г калия йодида).

Хранение: в укупоренных банках оранжевого стекла

Терапевтическое действие при гиперфункции щитовидной железы оказывают и препараты йода, например калия йодид. Это вещество (назначается в дозе **0,001 г) угнетает продукцию тиреотропного гормона гипофиза.**

Таким образом, препараты йода эффективны и при недостаточности щитовидной железы (эндемический зоб) и при ее гиперфункции.

При неэффективности указанных препаратов и невозможности хирургического лечения при гиперфункции щитовидной железы применяют препарат **радиоактивного йода**, который разрушает фолликулы щитовидной железы и тем самым уменьшает избыточную продукцию гормонов.

Паращитовидные железы выделяют гормон, названный **паратгормоном**.

Паратгормон:

- повышает содержание кальция в крови и поддерживает его на определенном уровне, мобилизуя кальций из костной ткани
- облегчает всасывание кальция в тонком кишечнике и повышает его реабсорбцию в почечных канальцах.

При **избыточной продукции паратгормона** возникает разрежение костной ткани (остеодистрофия, сопровождающаяся костными деформациями, переломами).

При недостаточности паращитовидных желез применяют паратиреоидин.

Так как действие паратиреоидина развивается медленно (начало действия через **4-6 ч**), для быстрого устранения судорог при тетании применяют **препараты кальция - кальция хлорид или кальция глюконат**

Паратиреоидин, **Parathyreoidinum**

-прозрачная жидкость.

При недостаточности паращитовидных желез

препарат вводят под кожу или

внутримышечно по **1-4** мл в зависимости от тяжести состояния.

Высшие дозы (для взрослых): разовая **5** мл, суточная **15** мл.

Форма выпуска: ампулы по **1** мл (**20** ЕД).

Хранение: список Б; в защищенном от света месте.

Препараты гормонов коры надпочечников и их синтетических аналогов

Надпочечники - железы внутренней секреции, прилегающие к верхним полюсам почек (отсюда их название).

В надпочечниках различают мозговую (внутренний) слой и корковый (наружный) слой.

Мозговое вещество надпочечников продуцирует и выделяет в кровь **адреналин**,

кора надпочечников - гормоны, названные **кортикостероидами** (имеют стероидную структуру).

**Кортикостероиды представлены
тремя группами гормонов:**

1) Глюкокортикоиды (гидрокортизон);

2) минералокортикоиды;

3) половые гормоны.

**Половые гормоны (мужские и женские)
вырабатываются корой надпочечников по сравнению
с половыми железами в небольших количествах.**

Глюкокортикоиды

- оказывают влияние на углеводный обмен (стимулируют синтез гликогена в печени и повышают содержание глюкозы в крови)**
- вливают на белковый обмен, нарушая синтез белков и способствуя их превращению в углеводы**
- способны уменьшать кальцификацию костной ткани, в связи с чем при длительном их применении возможен остеопороз (разрежение костной ткани)**
- под влиянием глюкокортикоидов изменяется и жировой обмен, происходят изменения в распределении жира в организме (уменьшение отложения жира в области рук и ног и увеличение - на лице, шее, спине и животе)**
- подавляют развитие соединительной ткани, угнетают лимфоидную ткань и в связи с этим проявляют иммунодепрессивную активность.**

Важнейшими свойствами глюкокортикоидов являются их высокая противовоспалительная и противоаллергическая активность.

Кроме того, глюкокортикоиды также оказывают противошоковое и антитоксическое действие.

Производство глюкокортикоидов стимулируется АКТГ передней доли гипофиза. Глюкокортикоиды оказывают тормозящее влияние на продукцию АКТГ.

Основным естественным глюкокортикоидом считают **гидрокортизон**. Существует лекарственный препарат гидрокортизона, имеющий то же название. Синтетический заменитель гидрокортизона, **преднизолон** (дегидрогидрокортизон) примерно в **3** раза эффективнее гидрокортизона по противовоспалительному действию и в меньшей степени влияет на минеральный обмен (реже вызывает отеки). Еще более активным глюкокортикоидом является **дексаметазон**.

Эти препараты назначают при
недостаточности надпочечников (болезнь
Аддисона), поражениях соединительной
ткани - коллагенозах (системная красная
волчанка, склеродермия, узелковый
периартериит, дерматомиозит), ревматизме,
ревматоидных артритах, бронхиальной астме,
в качестве противошоковых средств (раствор
преднизолона вводят внутримышечно или
внутривенно) и при ряде других состояний.

Для лечения кожных заболеваний, в частности экзем, применяют глюкокортикоиды, которые плохо всасываются через кожу и не оказывают выраженного резорбтивного действия. К таким препаратам относятся синаflan (флуоцинолона ацетонид, входит в состав мазей "Синалар", "Флуцинар") и флуметазон (входит в состав мазей "Локакортен", "Лоринден С", "Локасален"). При лечении бронхиальной астмы ингаляционно применяют беклометазона дипропионат.

Побочные свойства ГКС

- 1) отеки,
- 2) повышение артериального давления,
- 3) гипергликемия (повышение содержания сахара в крови),
- 4) обострение язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки и даже изъязвление слизистой оболочки желудка,
- 5) обострение инфекционных заболеваний,
- 6) остеопороз (разрежение костной ткани),
- 7) нарушение жирового обмена, отложение жира в области лица ("луноподобное лицо"), шеи,
- 8) расстройства высшей нервной деятельности, протекающие иногда по типу психозов.
- 9) вызывают гипокалиемию, повышают свертываемость крови, вызывают лимфопению, эозинопению, нейтрофилию.

При резкой отмене глюкокортикоидов после систематического лечения возникает так называемый синдром отмены, проявляющийся в виде недостаточности надпочечников. Возникновение "синдрома отмены" объясняют следующим образом.

Препараты глюкокортикоидов, как и естественные глюкокортикоиды, тормозят продукцию АКТГ, который в обычных условиях стимулирует кору надпочечников. При снижении продукции АКТГ постепенно развивается недостаточность надпочечников, которая и проявляется после отмены глюкокортикоидных препаратов.

Дезоксикортикостерона ацетат,
Desoxycorticosteroni acetas - белый порошок, нерастворимый в воде.

Вводят внутримышечно по **0,005-0,01** г ежедневно или через день в зависимости от тяжести заболевания. Препарат также назначают сублингвально по **1** таблетке **1** раз в день или через день.

Высшие дозы (для взрослых): внутримышечно - разовая **0,01** г, суточная **0,025** г.

Формы выпуска: ампулы по **1** мл **0,5%** раствора в масле; таблетки по **0,005** г для сублингвального применения.

Хранение: список Б; в защищенном от света месте.

Преднизолон, Prednisolonum - белый порошок, нерастворимый в воде.

Назначают внутрь по **0,005-0,01** г. При кожных заболеваниях применяют в виде мази (**0,5%**).

Высшие дозы (для взрослых): внутрь - разовая **0,015** г, суточная **0,1** г.

Форма выпуска: таблетки по **0,001** и **0,005** г; **0,5%** мазь; выпускается растворимый препарат преднизолона для инъекций в ампулах по **0,025** г (разводят водой для инъекций) для внутривенного или внутримышечного введения.

Хранение: список Б; в защищенном от света месте.

Гидрокортизона ацетат, Hydrocortisoni acetas.

При кожных заболеваниях применяют мазь **1%**, в глазной практике - глазную мазь **0,5%**.

Гидрокортизона ацетат в стерильных микрокристаллических суспензиях вводят внутрь суставов по **0,005-0,025** г при артритах ревматического происхождения и др.

Формы выпуска: флаконы по **5** мл взвеси, содержащей **0,125** г гидрокортизона ацетата, **1%** мазь, **0,5%** глазная мазь.

Минералокортикоиды

Минералокортикоиды (альдостерон и дезоксикортикостерон) - гормоны коры надпочечников, влияющие на минеральный обмен, главным образом на обмен натрия и калия.

Эти гормоны способствуют реабсорбции (обратное всасывание) в почечных канальцах ионов натрия и секреции ионов калия. Таким образом, под влиянием минералокортикоидов в организме задерживается натрий и усиливается выделение из организма ионов калия.

При избыточной продукции минералокортикоидов возникают:

- 1) отеки, связанные с увеличением в организме количества натрия и задержкой воды;**
- 2) повышение артериального давления;**
- 3) гипокалиемия (уменьшение содержания в крови калия), которая обычно сопровождается мышечной слабостью и аритмиями.**

При недостатке минералокортикоидов



усиливается выделение натрия и воды почками, что приводит к обезвоживанию организма. Такое обезвоживание является одним из симптомов общей недостаточности надпочечников (болезнь Аддисона), которая может возникнуть при поражениях надпочечников.

Заместительная терапия:

— Дезоксикортон .

Естественный альдостерон не может использоваться для заместительной терапии, т.к. полностью метаболизируется при первом прохождении через печень и малодоступен.

В настоящее время в качестве лекарственного средства с высокой минералокортикоидной активностью, сравнимой с активностью альдостерона, широко применяют **флудрокортизон**.

Препараты инсулина и синтетические гипогликемические средства

Инсулин является гормоном поджелудочной железы и оказывает выраженное влияние на углеводный обмен. Инсулин способствует усвоению сахара (глюкозы) клетками тканей организма (мышечной, жировой), облегчая транспорт глюкозы через клеточные мембраны, стимулирует образование из глюкозы гликогена и отложение его в печени и других органах. В связи с этим инсулин снижает содержание сахара в крови. Инсулин стимулирует синтез белков и жиров и задерживает протеолиз и липолиз (расщепление белков и жиров).

При недостаточной продукции инсулина уровень сахара в крови повышается, появляется сахар в моче, увеличивается мочеотделение. Такое заболевание носит название сахарного диабета (сахарное мочеизнурение). При сахарном диабете, кроме углеводного обмена, нарушается также жировой и белковый обмен. Тяжелые формы сахарного диабета при отсутствии лечения заканчиваются летально; смерть наступает в состоянии гипергликемической комы (резкое повышение уровня сахара в крови, ацидоз, бессознательное состояние больного, запах ацетона изо рта, появление ацетона в моче и др.).

При функциональной недостаточности клеток поджелудочной железы, продуцирующих инсулин (встречается чаще всего у лиц пожилого возраста), для лечения сахарного диабета показаны средства, стимулирующие активность этих клеток (например, бутагид).

В случае неэффективности таких средств, при органических поражениях поджелудочной железы применяют препараты инсулина (заместительная терапия).

Препараты инсулина

а) короткого действия: Инсулин растворимый, **human biosynthetic** (Актрапид НМ, Хумулин регуляр), Инсулин растворимый, **human semisynthetic** (Пенсулин ЧР);

б) средней продолжительности действия: Инсулин-изофан, **human biosynthetic** (Протафан НМ пенфилл, Хумулин НПХ), Инсулин-цинка, **human biosynthetic** (Монотард НМ, Хумулин Л);

в) длительного действия: Инсулин - цинка, **human biosynthetic** (Ультратард НМ), Инсулин гларгин (Лантус);

г) комбинированного действия: Инсулин двухфазный, **human biosynthetic** (Микстард 30 НМ, Микстард 30 НМ пенфилл), Инсулин аспарт двухфазный (Ново-Микс 30 пенфилл, Ново-Микс 30 Флекс-Пен).

Препараты инсулина обычно вводят под кожу. Эффект начинается через **15-30** мин и достигает максимума через **2-3** ч. Общая продолжительность действия около **6** ч. При выраженном диабете инсулин вводят **3** раза в день: перед завтраком, обедом и ужином. **При диабетической коме** инсулин может быть введен внутривенно.

При передозировке инсулина содержание сахара в крови падает ниже допустимого уровня (возникает гипогликемия), появляются раздражительность, агрессивность, потливость, сильное чувство голода, может развиваться гипогликемический шок (потеря сознания, судороги, нарушения сердечной деятельности). При первых признаках гипогликемии больному следует съесть кусочек белого хлеба, печенье или сахар. В случае гипогликемического шока вводят внутривенно **40%** раствор глюкозы.

Инсулин **МОЖЕТ** **ВЫЗЫВАТЬ**
аллергические **реакции!**

**покраснение на месте введения,
крапивницу и др. В этом случае
целесообразно применить другой
препарат инсулина (например,
суинсулин).**

Инсулин для инъекций, Insulinum -
бесцветная жидкость, содержащая **40** или **80**
ЕД инсулина в **1** мл.

При лечении сахарного диабета инсулин
вводят под кожу или внутримышечно по
10-20 ЕД в зависимости от тяжести
заболевания **1-3** раза в сутки за **15-20** мин до
еды.

При диабетической коме инсулин вводят
внутривенно до **50** ЕД.

Форма выпуска: флаконы по **5** и **10** мл,
содержащие по **40** или **80** ЕД в **1** мл.

Хранение: список Б.

Для увеличения продолжительности действия инсулина применяют его препараты пролонгированного (удлиненного) действия. К таким препаратам относятся различные суспензии цинк-инсулина (длительность действия **10-24-36** ч), суспензия протамин-цинк-инсулина (длительность действия **24-36** ч). Вводят эти препараты под кожу или внутримышечно (вводить их внутривенно нельзя).

Синтетические гипогликемические средства

В 60-х годах были синтезированы вещества из группы производных сульфонилмочевины, обладающие способностью снижать уровень сахара в крови при назначении их внутрь.

Однако эти вещества оказались эффективными только при легких формах сахарного диабета, связанных с функциональной недостаточностью ("истощением") поджелудочной железы. Было установлено, что терапевтическая активность этих препаратов связана с их способностью стимулировать клетки, вырабатывающие инсулин (β -клетки островков Лангерганса). Поэтому при органических поражениях поджелудочной железы (разрушение клеток, продуцирующих инсулин) такие препараты неэффективны.

Пероральные гипогликемические средства:

а) ингибиторы α -глюкозидазы:

Акарбоза (Глюкобай);

б) бигуаниды: Метформин (Глюкофаж);

в) препараты сульфонилмочевины:

Бутамид, Глибенкламид (Манинил);

д) прандиальные регуляторы гликемии:

Репаглинид (Новонорм).

Бутамид, Butamidum - белый порошок, нерастворимый в воде. Назначают внутрь по **0,5-1 г 1-3** раза

в сутки.

Высшие дозы (для взрослых): разовая **1,5 г**, суточная **4 г**.

Форма выпуска: таблетки по **0,25 г** и **0,5 г**.

Хранение: список Б.

Бутамид назначают внутрь после еды **1-3** раза в день (наиболее активен он в первые **5-7** ч после приема, общая продолжительность действия около **12** ч). Чаще всего бутамид применяют при лечении больных старше **40-45** лет (в этом возрасте сахарный диабет обычно связан с функциональной недостаточностью поджелудочной железы).

Кроме бутамида, в практической медицине используют и другие производные сульфонилмочевины: **букарбан, хлорпропамид, цикламид, хлоцикламид.**

БЛАГОДАРЮ ЗА ВНИМАНИЕ!