

# Классификация лекарственных средств М.Д.

## Машковского

### 1. Лек. ср-ва, действующие на нервную систему:

1.1. Лек. ср-ва, действующие преимущественно в области чувствительных (афферентных) нервных окончаний;

1.2. Лек. ср-ва, действующие преимущественно на периферические нейромедиаторные процессы;

1.3. Лек. ср-ва, действующие преимущественно на центральную нервную систему.

### 2. Ср-ва, действующие на исполнительные органы:

2.1. Ср-ва, действующие на дыхательную систему

2.2. Ср-ва, действующие на пищеварительную систему

2.3. Ср-ва, действующие на сердечно-сосудистую систему

2.4. Ср-ва, усиливающие выделительную функцию почек

2.5. Ср-ва, влияющие на мускулатуру матки

2.6. Ср-ва, влияющие на кровообразование и регулирующие агрегатное состояние крови

2.7. Препараты, корригирующие процессы иммунитета

### 3. Ср-ва, регулирующие метаболические процессы:

3.1. Гормональные препараты и их синтетические аналоги

3.2. Витамины и ферменты

3.4. Атигипоксанты и антиоксиданты

### 4. Противомикробные, противовирусный и противопаразитарные ср-ва

### 5. Препараты для лечения онкологических заболеваний

### 6. Рентгеноконтрастные и некоторые другие диагностические ср-ва

### 7. Препараты различных фармакологических групп

# Лек. ср-ва, действующие на периферическую нервную систему:

## 1. Лек. ср-ва, действующие преимущественно в области чувствительных (афферентных) нервных окончаний:

- 1.1. Ср-ва, понижающие чувствительность нервных окончаний;
- 1.2. Ср-ва, стимулирующие рецепторы слизистых оболочек, кожи и подкожных тканей;
- 1.3. Слабительные ср-ва;
- 1.4. Отхаркивающие ср-ва.

## 2. Лек. ср-ва, действующие преимущественно на периферические нейромедиаторные процессы:

- 2.1. Ср-ва, действующие на периферические холинергические процессы;
- 2.2. —« —« —« —« адренергические —« —«;
- 2.3. Дофамин и дофаминергические препараты;
- 2.4. Гистамин и антигистаминные препараты;
- 2.5. Серотонин, серотонинергические и антисеротониновые препараты

**КЛАССИФИКАЦИЯ СРЕДСТВ,  
ВЛИЯЮЩИХ  
НА АФФЕРЕНТНУЮ ИННЕРВАЦИЮ**

**Ср-ва, понижающие чувствительность нервных окончаний;**

**МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ**

**ВЯЖУЩИЕ,**

**ОБВОЛАКИВАЮЩИЕ,**

**АНТАЦИДНЫЕ,**

**АДСОРБИРУЮЩИЕ**

**Ср-ва, стимулирующие рецепторы слизистых оболочек,**

**КОЖИ И ПОДКОЖНЫХ ТКАНЕЙ (РАЗДРАЖАЮЩИЕ)**

**ЭФИРНЫЕ МАСЛА**

**ГОРЕЧИ**

# ***МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ***

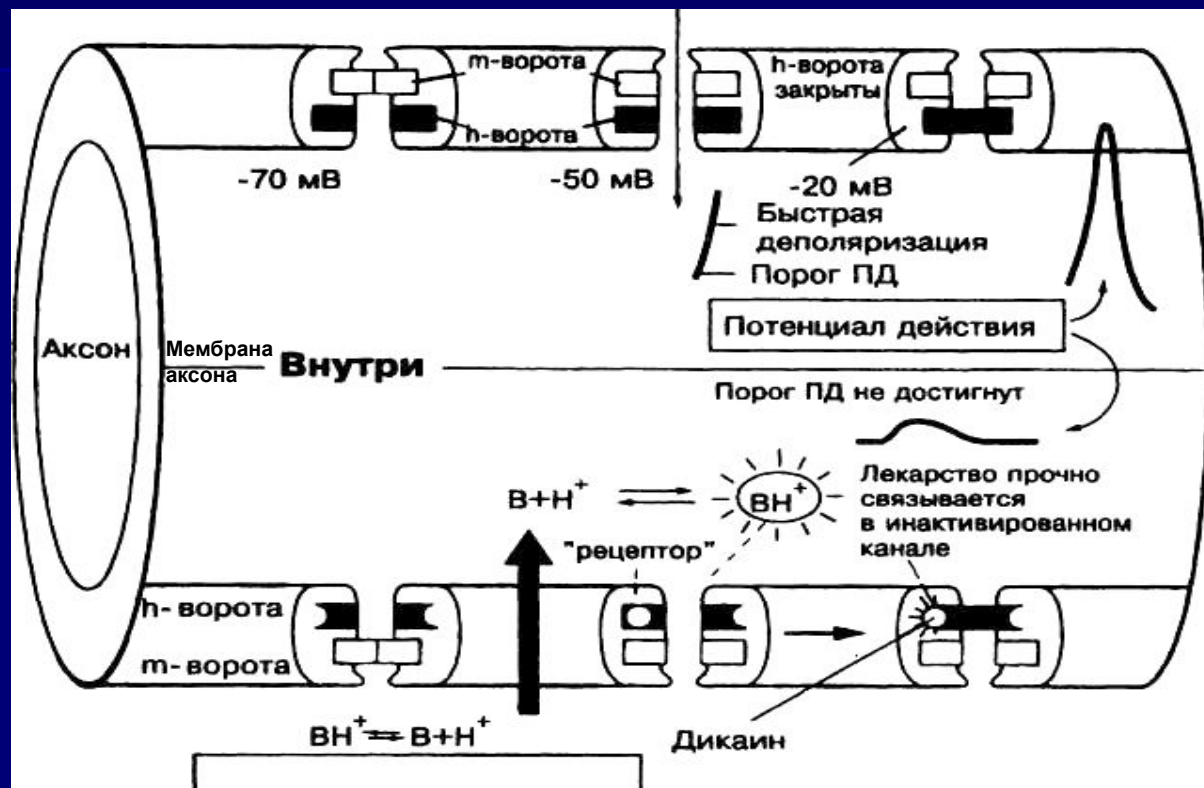
## ■ ***Механизм действия***

Снижают проницаемость мембран для ионов  $\text{Na}^+$  и  $\text{K}^+$ , препятствуют образованию потенциала действия; тормозят выделение нейромедиаторов; изменяют поверхностное натяжение мембранных фосфолипидов.

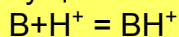
# Механизм действия местных анестетиков

## Местные анестетики

АМИДЫ	$pK_a$
Лидокаин	7,9
Тримекаин	7,9
Бупивакаин	8,1
Н	
ЭФИРЫ	
Кокаин	8,9
Анестезин	
Дикаин	8,5
Новокаин	
ин	8,9



Большинство местных анестетиков — слабые основания, которые могут существовать в ионизированной (протонной) форме



Соотношение между этими двумя формами

определяется по формуле **Гендерсона-Хассельбаха**:

$$\log \frac{BH^+}{B} = pK_a - pH$$

например: 8,4-7,4=1

Следовательно, преобладает ионизированная форма (10:1)

# МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ

- Сложные эфиры пара-аминобензойной кислоты (ПАБК)  
Новокаин (Прокаин); Анестезин (Бензокаин); Дикаин (Тетракаин);
- Сложные эфиры бензофуурокарбоновой кислоты  
Бензофуурокаин
- Замещённые амиды ацетанилида  
Артикаин (Ультракаин); Лидокаин (Ксилокаин); Бупивакаин (Маркаин); Тримекаина г/х; Бумекаина г/х (Пиромекаин)
- Комбинированные средства  
Лидокатон (лидокаин + эpineфрин); Ультракаин Д-С (артикаин + эpineфрин); Павестезин (папаверина г/х + анестезин)

# МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ

- Средства для поверхностной анестезии  
Кокаин, Дикаин, Анестезин, Бумекаин  
(пиромекаин)
- Средства для инфильтрационной и проводниковой анестезии  
Новокаин, Тримекаин, Бупивакаина г/д,  
Артикаин
- Средство для всех видов анестезии  
Лидокаин (ксикаин)

# МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ

## ■ Механизм действия

Снижают проницаемость мембран для ионов  $Na^+$  и  $K^+$ , препятствуют образованию потенциала действия; тормозят выделение нейромедиаторов;  
изменяют поверхностное натяжение мембранных фосфолипидов.

## ■ Фармакологические эффекты

Местноанестезирующий,  
антиаритмический;  
гипотензивный;  
центральный анальгезирующий;  
спазмолитический .

## ■ Показания к применению

Инфильтрационная, терминальная, проводниковая, спинномозговая, люмбальная анестезия .

Перитонит, плеврит, панкреатит, почечная и печёночная колики.  
Тахикардия. Гастралгии, спазмы гладкой мускулатуры желудка и кишечника.



# ВЯЖУЩИЕ, ОБВОЛАКИВАЮЩИЕ, АНТАЦИДНЫЕ, АДСОРБИРУЮЩИЕ

## Механизм действия

- Вызывают осаждение белков с образованием альбуминатов, что снижает раздражающее действие на афферентные нервные окончания слизистой оболочки ЖКТ,
- Обволакивают афферентные нервные окончания;
- Нейтрализуют свободную HCl желудочного сока;
- Адсорбируют химические вещества на своей поверхности.

## Фармакологические эффекты

- Обволакивающий;
- адсорбирующий;
- вяжущий;
- слабый противовоспалительный;
- антацидный;
- потогонный;
- цитопротекторный, антибактериальный .

**ВЯЖУЩИЕ,**  
**ОБВОЛАКИВАЮЩИЕ,**  
**АНТАЦИДНЫЕ**

- **РАСТИТЕЛЬНОГО ПРОИСХОЖДЕНИЯ:** Кора дуба; Трава зверобоя; Лист шалфея; Цветы ромашки; Трава череды; Соплодия ольхи; Танин; Танальбин; Рамазулан.
- **СОЛИ МЕТАЛЛОВ:**  
Гидроокись алюминия; Алюмаг; Маалокс; Алюминия фосфат (Фосфалюгель); Викаир; Викалин; Висмута субцитрат (Де-нол); Ксероформ; Магния окись; Анацид; Свинца ацетат.

# АДСОРБИРУЮЩИЕ

- **Уголь активированный (Карболен, сорбекс);**
- **Карболонг;**
- **Энтеросгель.**

# РАЗДРАЖАЮЩИЕ

## ЭФИРНЫЕ МАСЛА

### ■ Механизм действия

Раздражают окончания афферентных нервов, рефлекторно расширяют артериолы и капилляры

### ■ Фармакологические эффекты

Местнораздражающий, отвлекающий, противовоспалительный, анальгезирующий, спазмолитический, седативный, антисептический.

### ■ Показания к применению и взаимозаменяемость

Невралгии; миалгии, артралгии; мигрень; заболевания органов дыхания; стенокардия. В качестве успокаивающего.

# РАЗДРАЖАЮЩИЕ

- ЭФИРНЫЕ МАСЛА

Ментол;

Валидол;

Мята перечная;

Семя горчицы;

Лист эвкалипта.

- ГОРЕЧИ

Трава полыни;

Корень одуванчика;

Трава золототысячника;

Корневища аира.

# РАЗДРАЖАЮЩИЕ

## ГОРЕЧИ

- Механизм действия

Раздражают вкусовые рецепторы, рефлекторно увеличивают секрецию желудочного сока.

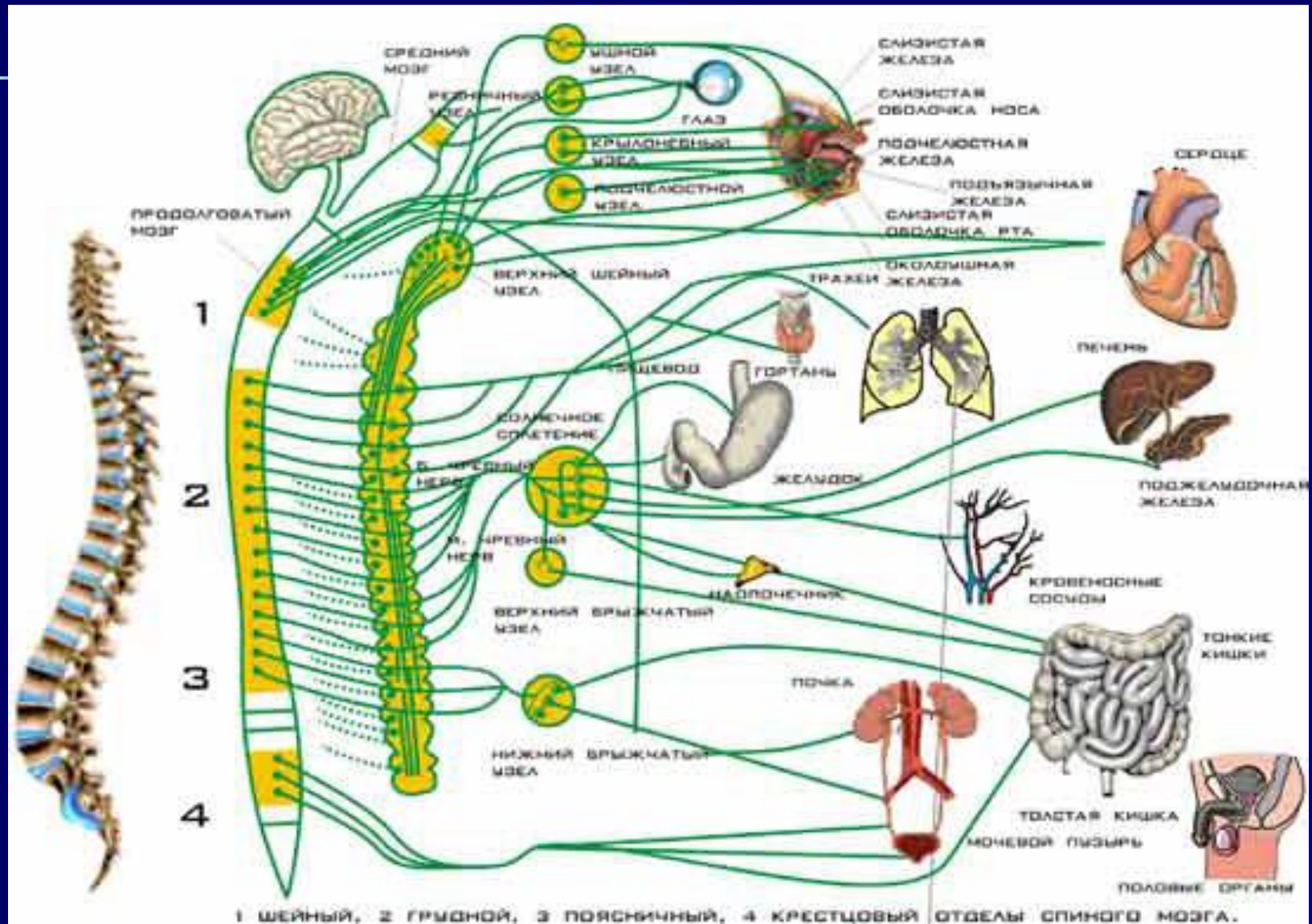
- Фармакологические эффекты

Повышают аппетит, улучшают пищеварение

- Показания к применению Нарушения аппетита, гастриты с пониженной кислотностью

- ***Лек. ср-ва, действующие преимущественно на периферические нейромедиаторные процессы;***

# Холинергическая и адренергическая иннервации





# Эффекты влияния парасимпатической и симпатической нервной систем на органы

Орган, функции и показатели работы органа	Изменения состояния органов при возбуждении вегетативной нервной системы	
	Парасимпатический отдел	Симпатический отдел
<p><b>Сердце:</b>            Частота сокращений            Сила сокращений            Проводимость</p>	Снижается, остановка сердца Уменьшается Замедляется (атриовентрикулярная блокада)	Повышается
<p><b>Сосуды:</b>            Кожи, слизистых оболочек;            Скелетных мышц, сердца</p>	Не инервированы Суживаются	Суживаются Расширяются
<p><b>Бронхи:</b>            Тонус гладких мышц            Секреция желез</p>	Повышается (бронхоспазм) Повышается	Снижается Снижается

<i>Орган, функции и показатели работы органа</i>	<i>Изменения состояния органов при возбуждении вегетативной нервной системы</i>	
	<i>Парасимпатический отдел</i>	<i>Симпатический отдел</i>
<u><i>Желудок и кишечник:</i></u> Перистальтика Тонус сфинктеров  Секреция желез	Повышается Уменьшается Усиливается (главных, обкладочных)	Снижается Повышается Повышается (добавочных)
<u><i>Желчный пузырь и протоки:</i></u>	Сокращаются	Расслабляются
<u><i>Мочевой пузырь:</i></u> Стенка сфинктер	Сокращаются Расслабляются	Расслабляются Сокращаются
<u><i>Глаз:</i></u> Мышца радиальная Мышца концентрическая Цилиарная мышца  <u><i>Слюнные железы</i></u>	Не инервирована Сокращается (зрачок суживается) Сокращается (близкое видение) Повышается(секреция жидкой слюны)	Сокращается (зрачок расширяется) Не инервирована Расслабляется (дальнее видение) Повышается (секреция густой слюны)

# Функция холинергического синапса

Этап 1. Синтез ацетилхолина в нервном окончании:

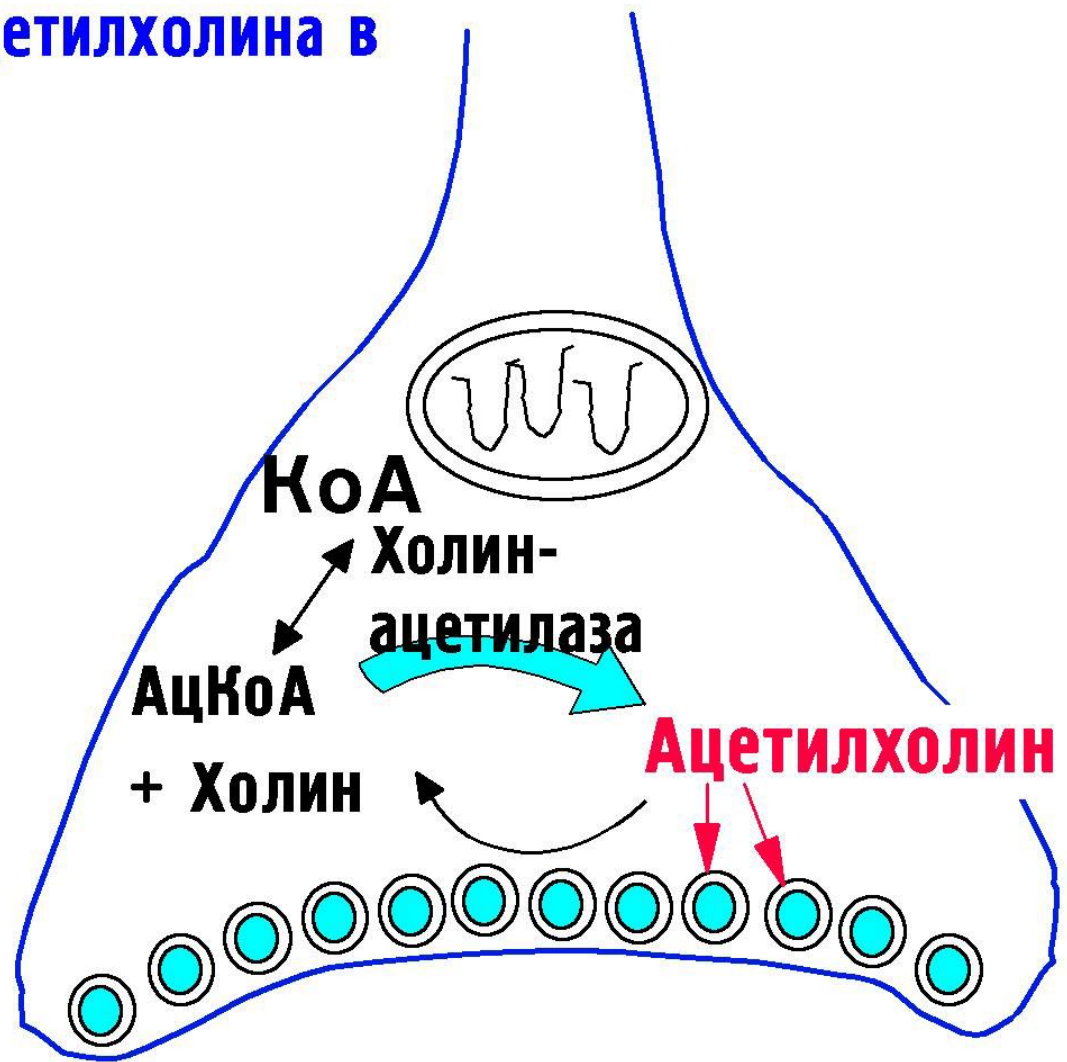
▶ Ацетилкоэнзим-А + холин = Ацетилхолин

Холин-ацетилаза



# Функция холинергического синапса

Этап 2. Накопление ацетилхолина в везикулах:



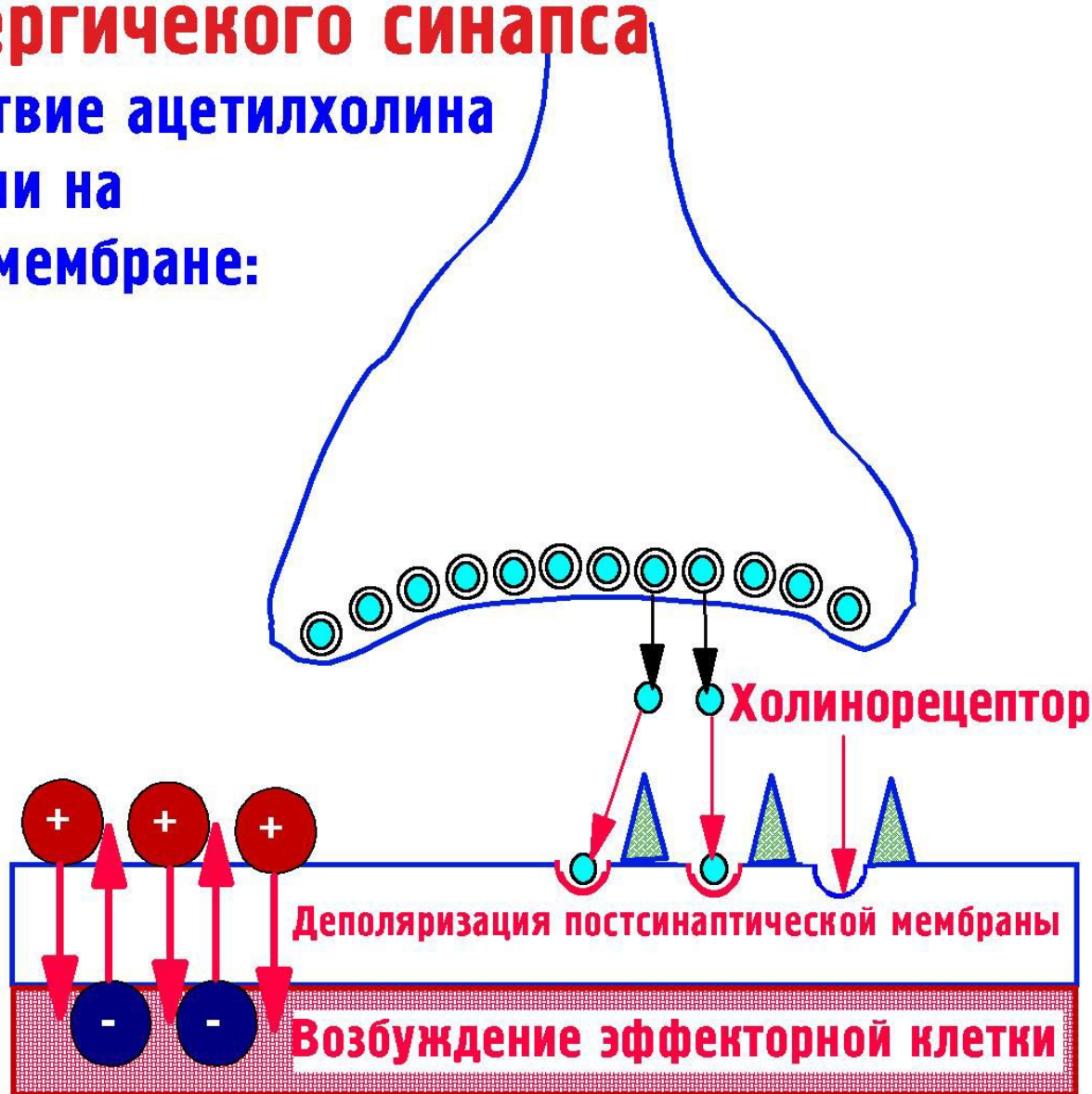
# Функция холинергического синапса

Этап 3. Выделение ацетилхолина из везикул в синаптическую щель под влиянием нервного импульса:



# Функция холинергического синапса

Этап 4. Взаимодействие ацетилхолина с холинорецепторами на постсинаптической мембране:

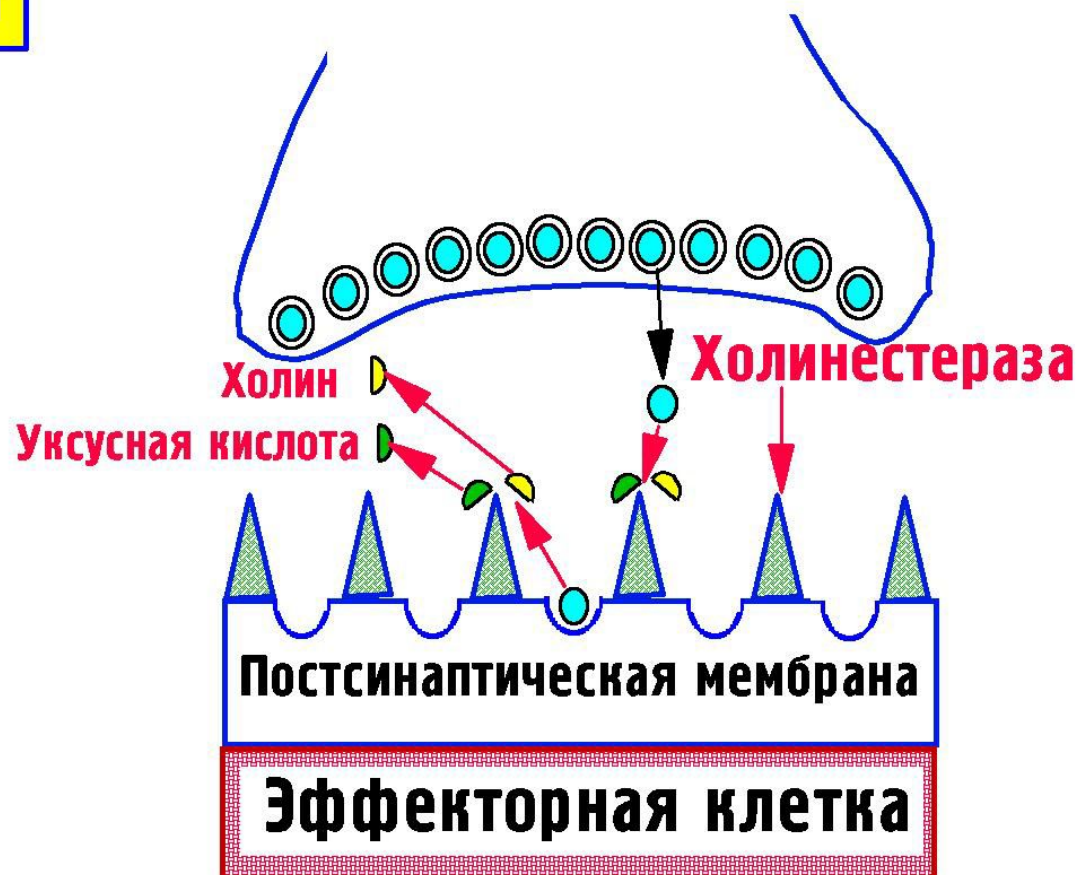


# Функция холинергического синапса

## Этап 5. Гидролиз ацетилхолина холинэстеразой:

▶ Ацетилхолин = Холин + Уксусная кислота

Холинэстераза



# Подтипы холинорецепторов:

**М-холинорецепторы (мускариночувствительные)** получили название от их агониста - яда мухомора - алкалоида **мускарина**:

- ▶ **M<sub>1</sub>-холинорецепторы** в вегетативных ганглиях и ЦНС;
- ▶ **M<sub>2</sub>-холинорецепторы** постсинаптические в сердце (регулируют его функцию) и пресинаптические (уменьшают выделение ацетилхолина в синаптическую щель);
- ▶ **M<sub>3</sub>-холинорецепторы** в гладких мышцах, большинстве экзокринных желез и кровеносных сосудах.

**Н-холинорецепторы (никотинчувствительные)** получили название от их агониста - алкалоида табака **никотина**.

- ▶ **N<sub>n</sub>-холинорецепторы** вегетативных ганглиев;
- ▶ **N<sub>m</sub>-холинорецепторы** скелетных мышц.



# Классификация холинергических средств

1. Холиномиметики - средства возбуждающие или способствующие возбуждению холинорецепторов:

- ▶ М-Н-холиномиметики:

- прямого действия;

- непрямого действия (антихолинэстеразные средства);

- ▶ М-холиномиметики;

- ▶ Н-холиномиметики;

2. Антихолинергические средства (холиноблокаторы, холинолитики) - средства, блокирующие холинорецепторы:

- ▶ М-холиноблокаторы;

- ▶ Н-холиноблокаторы:

- ганглиоблокаторы;

- периферические миорелаксанты (курареподобные средства);

- ▶ Центральные холинолитики.

# Средства, влияющие на холинергические процессы

- 1. На М- и Н-холинорецепторы
  - М,Н-холиномиметики
    - Ацетилхолин      Карбахолин
  - Антихолинэстеразные средства
    - Физостигмина салицилат,      Прозерин
- Пиридостигмин, Галантамина гидробромид,
  - Оксазил,      Армин
  - М,Н-холиноблокаторы
    - Циклодол

# Прямые М-Н-холиномиметики

## 1. Ацетилхолин:

- ▶ Естественный медиатор парасимпатической нервной системы. Быстро разрушается холинэстеразой и действует только 5-15 минут после подкожного введения.

## 2. Карбохолин:

- ▶ Синтетический препарат, действует 1-1,5 часа.



В связи с очень кратковременным действием используются в экспериментальной практике. При необходимости получить М- и Н-холиномиметический эффект в клинике используются не прямые М-Н-холиномиметики - антихолинэстеразные средства.

# Непрямые М-Н-холиномиметики (антихолинестеразные средства)

## 1. По обратимости ингибирования холинестеразы:

### ▶ Обратимого действия:

→ **ПРОЗЕРИН [неостигмин], ПИРИДОСТИГМИН, ОКСАЗИЛ [амбеноний], ДИСТИГМИН, ГАЛАНТАМИН, ФИЗОСТИГМИН, ЭДРОФОНИЙ**

### ▶ Необратимого действия (используются только в глазных каплях при глаукоме):

→ **ФОСФАКОЛ, АРМИН**



К антихолинестеразным средствам необратимого действия также относятся **сельскохозяйственные пестициды - ДИХЛОФОС, ХЛОРОФОС, КАРБОФОС и др. и боевые отравляющие вещества - ЗАРИН, ЗОМАН, ТАБУН и др.**

# Непрямые М-Н-холиномиметики (антихолинестеразные средства)

## Механизм действия:

- ▶ ингибирование холинестеразы тормозит расщепление ацетилхолина, что ведет к его накоплению в синаптической щели и увеличению времени его взаимодействия с холинорецепторами.

## Фармакологические эффекты:

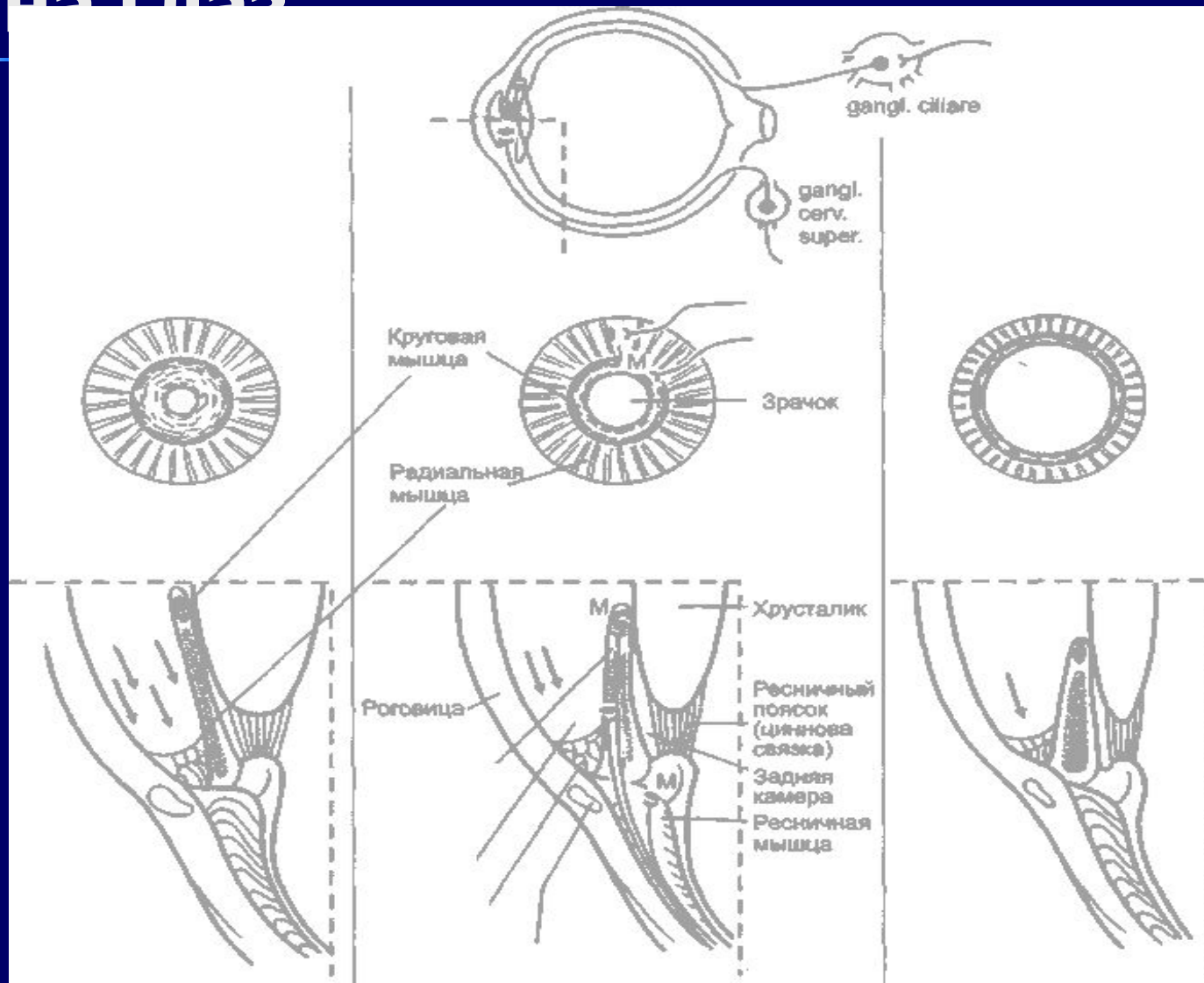
- ▶ связанные с возбуждением М-холинорецепторов:
  - в ЦНС (только третичные амины):
    - Кора больших полушарий - повышение умственной работоспособности;
    - Ретикулярная формация - уменьшение сонливости;
    - Лимбическая система - эмоциональное возбуждение;
    - Центр блуждающего нерва - усиление холинергических влияний на внутренние органы.

# АНТИХОЛИНЭСТЕРАЗНЫЕ СРЕДСТВА

## Фармакологические эффекты:

- Сужение зрачка, ↓ внутриглазного давления, спазм аккомодации;
- ↑ тонуса гладких мышц бронхов, ЖКТ, желче- и мочевыводящих путей, матки, ↑ секреции бронхиальных, пищеварительных, потовых желез;
- ↑ тонуса поперечно-полосатой мускулатуры;
- ↓ проводимости в миокарде, ↓ автоматизма и силы сердечных сокращений, брадикардия; расширение сосудов скелетных мышц и органов малого таза, снижение АД;
- ↑ ганглионарной передачи импульсов и выделения адреналина в кровь из надпочечников;
- улучшение нервно-мышечной передачи.

# Действие веществ, влияющих на холинергическую иннервацию, на глаз



# АНТИХОЛИНЭСТЕРАЗНЫЕ средства

## Показания к применению :

- Глаукома,
- атония кишечника, желчного и мочевого пузыря,
- миастения,
- приступы пароксизмальной тахикардии, парезы и параличи,
- слабость родовой деятельности(5),
- антидоты при отравлениях миорелаксантами (декураризация), и М-холиноблокаторами.



# антихолинэстеразные средства

- Побочные эффекты :

Спазм бронхов, кишечника, боль в животе, гиперсаливация, понос, брадикардия, понижение АД, подергивание скелетных мышц, общая слабость.

- Противопоказания:

Бронхиальн. астма, стенокардия, органические заболевания сердца, атеросклероз, гипертиреоз, эпилепсия

# **Непрямые М-Н-холиномиметики (антихолинэстеразные ср-ва)**

## **Симптомы отравления сельскохозяйственными фосфорорганическими пестицидами из группы ингибиторов холинэстеразы:**

### **▶ общие симптомы:**

- потеря сознания;
- сильный запах яда изо рта при пероральном отравлении;

### **▶ связанные с возбуждением М-холинорецепторов:**

- сужение зрачков (миоз);
- на ранних стадиях - повышение, затем снижение артериального давления, брадикардия
- бронхоспазм, неукротимые рвота и понос (больной испачкан рвотными и каловыми массами), перистальтика кишечника слышна на расстоянии;
- обильное потоотделение: "больной купается в собственном поте";

### **▶ связанные с возбуждением Н-холинорецепторов:**

- фибриллярные подергивания скелетных мышц, провоцируемые шлепками по конечностям; клонические судороги.

# Непрямые М-Н-холиномиметики (антихолинэстеразные ср-ва)

## Лечение отравлений сельскохозяйственными фосфорорганическими пестицидами из группы ингибиторов холинэстеразы:

### ▶ общая дезинтоксикация:

- промывание желудка, очистительная клизма;
- внутривенные инфузии дезинтоксикационных растворов (неогемодез, 5% раствор глюкозы - более 1,5 литров), форсированный диурез (сильные быстродействующие диуретики - фуросемид внутривенно);

### ▶ специфические антидоты:

- М-холиноблокаторы (атропина сульфат 1-9 мл) - индивидуальный подбор дозы до исчезновения сужения зрачков;
- реактиваторы холинэстеразы (дипироксим [тримедоксим], изонитрозин, аллоксим);

### ▶ симптоматические средства:

- барбитураты и диазепам для устранения судорог;
- сердечные гликозиды для восстановления функции сердца;
- бронхолитики для устранения бронхоспазма.