

***ГОРМОНАЛЬНЫЕ
ПРЕПАРАТЫ***

ГОРМОНАЛЬНЫЕ ПРЕПАРАТЫ –
вещества, полученные из желез внутренней
секреции животных, или их синтетические
аналоги, которые оказывают специфическое
влияние на обмен веществ и функции
некоторых органов

АНТИГОРМОНАЛЬНЫЕ СРЕДСТВА –
синтетические вещества, тормозящие
образование и выделение гормонов или
вступающие с ними в конкурентные
отношения

КЛАССИФИКАЦИЯ ПО ХИМИЧЕСКОМУ СТРОЕНИЮ

- ВЕЩЕСТВА БЕЛКОВОГО И ПЕПТИДНОГО СТРОЕНИЯ:
 - ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ГИПОТАЛАМУСА, ГИПОФИЗА, ПАРАЩИТОВИДНОЙ И ПОДЖЕЛУДОЧНОЙ ЖЕЛЕЗ, КАЛЬЦИТОНИН
- ПРОИЗВОДНЫЕ АМИНОКИСЛОТ:
 - ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ, ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЭПИФИЗА
- СТЕРОИДНЫЕ СОЕДИНЕНИЯ:
 - ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ И ПОЛОВЫХ ЖЕЛЕЗ

✱ **Стероидные гормоны, их аналоги и антагонисты**

ПРЕПАРАТЫ МУЖСКИХ ПОЛОВЫХ ГОРМОНОВ И ИХ СИНТЕТИЧЕСКИЕ АНАЛОГИ

АНДРОГЕНЫ

- ТЕСТОСТЕРОН (СМЕСЬ ЭФИРОВ) (ТЕСТЭНАТ, ОМНАДРЕН, ТЕТРАСТЕРОН)
- МЕТИЛТЕСТОСТЕРОН (МЕТИЛТЕСТОСТЕРОН)
- МЕСТЕРОЛОН (ПРОВИРОН)
- ДРОСТАНОЛОН (МЕДРОТЕСТРОН, МЕТИЛДИГИДРОТЕСТОСТЕРОНА ПРОПИОНАТ)

АНДРОГЕНЫ

У МУЖЧИН:

- ▣ **ИНТЕРСТИЦИАЛЬНЫМИ КЛЕТКАМИ ЯИЧЕК (6 мг/сут)**
- ▣ **СЕТЧАТОЙ ЗОНОЙ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ**

ВЫРАБАТЫВАЮТСЯ

У ЖЕНЩИН:

- ▣ **ФОЛЛИКУЛЯРНЫМИ КЛЕТКАМИ ФОЛЛИКУЛОВ (0,3 мг/сут)**
- ▣ **СЕТЧАТОЙ ЗОНОЙ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ**

СИНТЕЗ АНДРОГЕНОВ СТИМУЛИРУЮТ ГОНАДОТРОПНЫЕ ГОРМОНЫ ПЕРЕДНЕЙ ДОЛИ ГИПОФИЗА:

- **ЛЮТЕИНИЗИРУЮЩИЙ (ЛГ)**
- **ФОЛЛИКУЛОСТИМУЛИРУЮЩИЙ (ФСГ)**

ВЫСВОБОЖДЕНИЕ ЛГ И ФСГ РЕГУЛИРУЕТСЯ ГОНАДОТРОПИН-РЕЛИЗИНГ ГОРМОНАМИ ГИПОТАЛАМУСА:

- **ФОЛЛИБЕРИНОМ**
- **ЛЮЛИБЕРИНОМ**

АНДРОГЕНЫ

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

□ **АНДРОГЕННЫЙ:**

- *рост и развитие половых органов*
- *стимуляция их деятельности*
- *проявление вторичных половых признаков*
- *обеспечение эректильной функции*

□ **АНАБОЛИЧЕСКИЙ:**

- *поддержание мышечной массы*
- *стимуляция синтеза органоспецифических белков в почках, печени, сальных и потовых железах*
- *поддержание плотности костной ткани*

□ **АНТИГОНАДОТРОПНЫЙ:**

- *подавление секреции гонадотропинов*

АНДРОГЕНЫ

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

□ РЕПРОДУКТИВНЫЙ:

- поддержание сперматогенеза

□ ПСИХОФИЗИОЛОГИЧЕСКИЙ:

- обеспечение полового влечения (либидо)
- формирование стереотипа полового поведения, настроения
- психостимулирующее действие

□ ГЕМОПОЭТИЧЕСКИЙ:

- ↑ выработки эритропоэтина в почках
- ↑ эритропоэза в красном костном мозге

АНДРОГЕНЫ

У ЖЕНЩИН:

□ МАЛЫЕ ДОЗЫ - ↑ образование гонадотропных гормонов гипофиза

□ БОЛЬШИЕ ДОЗЫ - блокируют образование гонадотропных гормонов гипофиза:

- ↓ функции яичников
- атрофия эндометрия
- ↓ функции молочных желез

**ДЛИТЕЛЬНОЕ ВВЕДЕНИЕ АНДРОГЕНОВ ПРИВОДИТ
К**

СНИЖЕНИЮ ФУНКЦИИ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ

Когда нужны препараты андрогенов ?

У МУЖЧИН:

- заместительная терапия при первичном и вторичном гипогонадизме:
 - задержка полового созревания
 - эндокринная импотенция
 - гипопитуитаризм
 - евнухоидизм
 - посткастрационный синдром
 - олигоспермия
- мужской климакс
- импотенция
- бесплодие (при нарушении сперматогенеза)

Когда нужны препараты андрогенов ?

У ЖЕНЩИН:

- остеопороз
- рак молочной железы, рак яичников (у женщин до 60 лет)
- дисфункциональные маточные кровотечения (у пожилых женщин)
- миома матки
- эндометриоз
- климактерический синдром (совместно с эстрогенами)
- предменструальный синдром

Фармакологические препараты андрогенов

■ Тестостерон пропионат и другие эфиры (ципионат, энантат)	Вводится внутримышечно	Эффект длится от 2 дней до 2 недель
■ Метилтестостерон	Вводится внутрь	Эффект длится несколько часов
■ Местеролон (Провирон)	Вводится внутрь	Эффект длится несколько часов

Андрогены – побочные эффекты

У женщин :

Вирилизация, аменорея, атрофия молочных желез, маточные кровотечения

В препубертантном периоде :

Вирилизация, преждевременное половое созревание, преждевременное окостенение эпифизов костей

У мужчин :

Феминизация, повышение либидо, частые эрекции, нарушение сперматогенеза

Гепатотоксичность (холестаз), задержка натрия и воды, карцинома печени

АНДРОГЕНЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Рак предстательной железы или грудной железы у мужчин
- Гинекомастия
- ДГПЖ с задержкой мочеиспускания
- Печеночная и/ или почечная недостаточность
- Гиперкальциемия
- СН, СД, ИМ в анамнезе
- Распространенный атеросклероз
- Беременность, лактация
- Индивидуальная непереносимость

Когда нужно устранить эффекты андрогенов ?

- ❑ РАК ПРЕДСТАТЕЛЬНОЙ ЖЕЛЕЗЫ
- ❑ АДЕНОМА ПРЕДСТАТЕЛЬНОЙ ЖЕЛЕЗЫ
- ❑ ПАТОЛОГИЧЕСКОЕ ПОВЫШЕНИЕ ПОЛОВОЙ АКТИВНОСТИ
- ❑ АНДРОГЕНИЗАЦИЯ ТЯЖЕЛОЙ СТЕПЕНИ У ЖЕНЩИН
- ❑ ИДИОПАТИЧЕСКОЕ ПРЕЖДЕВРЕМЕННОЕ ПОЛОВОЕ СОЗРЕВАНИЕ У ДЕТЕЙ

АНТИАНДРОГЕНЫ

БЛОКАТОРЫ АНДРОГЕННЫХ РЕЦЕПТОРОВ

- **БИКАЛУТАМИД (КАСОДЕКС)**
- **НИЛУТАМИД (АНАНДРОН)**
- **ФЛУТАМИД (НИФТОЛИД)**
- **ЦИПРОТЕРОН (АНДРОКУР)**

ИНГИБИТОРЫ 5 α -РЕДУКТАЗЫ

- **ФИНАСТЕРИД (ПРОСКАР, АЛЬФИНАЛ)**

АНТИАНДРОГЕНЫ

ОКАЗЫВАЮТ АНТИАНДРОГЕННОЕ
ДЕЙСТВИЕ, ОБУСЛОВЛЕННОЕ:

БЛОКАДОЙ РЦ
АНДРОГЕНОВ В
ПРОСТАТЕ И
ГИПОТАЛАМУСЕ

УГНЕТЕНИЕМ
5 α – РЕДУКТАЗЫ

- ↓ СПЕРМАТОГЕНЕЗ
- ↓ ЛИБИДО
(ИМПОТЕНЦИЯ)
- ↓ ПРОДУКЦИЯ
АНДРОГЕНОВ

НАРУШАЕТСЯ
ПРЕВРАЩЕНИЕ
ТЕСТОСТЕРОНА В
ДЕГИДРОТЕСТОСТЕРОН

СНИЖАЕТСЯ ПРОДУКЦИЯ:

- ГОНАДОТРОПНЫХ ГОРМОНОВ (ФСГ И ЛГ)
- ТЕСТОСТЕРОНА

АНТИАНДРОГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Гинекомастия, галакторея, мастодиния
- Нарушение сперматогенеза
- Снижение либидо, импотенция
- Задержка жидкости, отеки
- Тромбоэмболии
- Подкожные кровоизлияния
- Зуд

АНТИАНДРОГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- *Нарушение функции печени и/ или почек*
- *Интерстициальный легочный синдром*
- *Волчаночноподобный синдром*
- *Метгемоглобинемия*
- *Нарушение аккомодации*
- *Подавление овуляции*
- *Снижение функции надпочечников у детей*

АНТИАНДРОГЕНЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **ВЫРАЖЕННЫЕ НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ И/ ИЛИ ПОЧЕК**
- **БЕРЕМЕННОСТЬ**
- **ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ**
- **РАК ПРЕДСТАТЕЛЬНОЙ ЖЕЛЕЗЫ**
(ФИНАСТЕРИД)

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

- НАНДРОЛОН (РЕТАБОЛИЛ, ФЕНОБОЛИН)
- МЕТАНДИЕНОН (МЕТАНДРОСТЕНОЛОН,
НЕРОБОЛ)
- МЕТАНДРИОЛ (МЕТИЛАНДРОСТЕНДИОЛ)

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДЫ – синтетические аналоги андрогенов

ОБЛАДАЮТ:

- **МАКСИМАЛЬНОЙ АНАБОЛИЧЕСКОЙ АКТИВНОСТЬЮ**
- **МИНИМАЛЬНОЙ АНДРОГЕННОЙ АКТИВНОСТЬЮ**

ОСНОВНОЕ СВОЙСТВО – УСИЛЕНИЕ СИНТЕЗА БЕЛКА, В РЕЗУЛЬТАТЕ:

ОКАЗЫВАЮТ ПОЛОЖИТЕЛЬНОЕ ВЛИЯНИЕ НА АЗОТИСТЫЙ ОБМЕН:

- вызывают задержку азота в организме
- ↓ выведение почками мочевины
- задерживают в организме калий, серу, фосфор
- ↑ содержание кальция в костях

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ АНАБОЛИЧЕСКИХ СТЕРОИДОВ:

- ПОВЫШЕНИЕ АППЕТИТА
- УВЕЛИЧЕНИЕ МЫШЕЧНОЙ МАССЫ
- УЛУЧШЕНИЕ РЕГЕНЕРАТОРНЫХ ПРОЦЕССОВ
- УСКОРЕНИЕ КАЛЬЦИНАЦИИ КОСТЕЙ
- УЛУЧШЕНИЕ ОБЩЕГО СОСТОЯНИЯ

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОКАЗАНИЯ

- КАХЕКСИЯ, АСТЕНИЯ*
- ИНФЕКЦИОННЫЕ И ДР. ЗАБОЛЕВАНИЯ,
СОПРОВОЖДАЮЩИЕСЯ ПОТЕРЕЙ БЕЛКА*
- РЕКОНВАЛЕСЦЕНИЯ ПОСЛЕ ТЯЖЕЛЫХ ТРАВМ,
ОПЕРАЦИЙ, ОЖОГОВ*

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОКАЗАНИЯ

□ В ЭНДОКРИНОЛОГИИ:

- *межуточно-гипофизарная недостаточность*
- *хроническая недостаточность надпочечников*
- *токсический зоб*
- *диабетические ангиопатии (ретинопатии, нефропатии)*
- *стероидный диабет*
- *гипофизарная карликовость*

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОКАЗАНИЯ

□ В ТЕРАПИИ:

- *хроническая коронарная недостаточность*
- *инфаркт миокарда*
- *миокардиты*
- *ревматические поражения сердца*
- *атеросклеротический кардиосклероз*
- *язвенная болезнь*
- *хронические заболевания почек, сопровождающиеся потерей белка и азотемией (гломерулонефрит)*
- *хронические заболевания легких*

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОКАЗАНИЯ

□ В ПЕДИАТРИИ:

- задержка роста
- анорексия
- пониженное питание

□ А ТАКЖЕ:

- остеопороз
- большие переломы
- пластические операции на костях
- миопатии, мышечные дистрофии
- прогрессирующая миопия, старческая дегенерация сетчатки
- экзема, псориаз
- хронические анемии
- зуд при хронической билиарной обструкции

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

□ Связанные с андрогенной активностью анаболических стероидов:

- **у женщин** - вирилизация (гирсутизм, менструальные нарушения, огрубение голоса), гиперкальциемия (тошнота, рвота, утомляемость)
- **у мужчин** – раздражение мочевого пузыря, мастодиния, гинекомастия, приапизм, снижение сексуальной функции, в пожилом возрасте – гипертрофия и/ или карцинома предстательной железы
- **у детей** - ускорение созревания скелета и прекращение роста (применяют короткие курсы по 2 – 4 нед)

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Прогрессирование атеросклероза
- Железодефицитная анемия
- Периферические отеки
- Диспептические нарушения
- Нарушения функции печени (преходящая желтуха, лейкомоидный синдром, гипокоагуляция, холестатический гепатит, гепатонекроз)
- Нарушения либидо
- Судороги
- Нарушения сна

АНАБОЛИЧЕСКИЕ СТЕРОИДНЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Рак предстательной железы
- Острый и хронический простатит
- Острые заболевания печени
- Декомпенсированный сахарный диабет
- Беременность, лактация
- Пубертатный возраст

ЖЕНСКИЕ ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

✓ ЭСТРОГЕНЫ

✓ АНТИЭСТРОГЕНЫ

✓ ГЕСТАГЕНЫ

ЖЕНСКИЕ ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

ЭСТРОГЕНЫ

- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ (МИКРОФОЛЛИН)
- ЭСТРИОЛ (ОВЕСТИН)
- ЭСТРАДИОЛ (ПРОГИНОВА, ЭСТРАДИОЛА ДИПРОПИОНАТ)
- ФОСФЭСТРОЛ
- ПОЛИЭСТРАДИОЛА ФОСФАТ (ЭСТРАДУРИН)

АНТИЭСТРОГЕНЫ

- КЛОМИФЕН (КЛОСТИЛБЕГИТ)
- ТАМОКСИФЕН (НОЛВАДЕКС, ЗИТАЗОНИУМ)

ЖЕНСКИЕ ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

ГЕСТАГЕНЫ

- ПРОГЕСТЕРОН
- ГИДРОКСИПРОГЕСТЕРОНА КАПРОАТ
(ОКСИПРОГЕСТЕРОНА КАПРОНАТ)
- МЕДРОКСИПРОГЕСТЕРОН (ДЕПО-ПРОВЕРА)
- ЭТИСТЕРОН (ПРЕГНИН)
- НОРЭТИСТЕРОН (НОРКОЛУТ)
- АЛЛИЛЭСТРЕНОЛ (ТУРИНАЛ)
- ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ (МИКРОЛЮТ, МИРЕНА,
ПОСТИНОР)
-

ЭСТРОГЕНЫ

ОБРАЗУЮТСЯ

У ЖЕНЩИН:

- В ЯИЧНИКАХ
- КОРЕ НАДПОЧЕЧНИКОВ
- ПЛАЦЕНТЕ

У МУЖЧИН:

- В ЯИЧКАХ (15%)
- ИЗ ТЕСТОСТЕРОНА (35%)
- ИЗ ЭСТРОНА (50%)

**ДЛЯ МУЖЧИН И ЖЕНЩИН ХАРАКТЕРЕН
ВНЕГОНАДНЫЙ ПУТЬ ОБРАЗОВАНИЯ ЭСТРОГЕНОВ –
В ЖИРОВОЙ ТКАНИ,
ЗНАЧЕНИЕ КОТОРОГО УВЕЛИЧИВАЕТСЯ
С ВОЗРАСТОМ И НАРАСТАНИЕМ МАССЫ ТЕЛА**

**СИНТЕЗ ЭСТРОГЕНОВ РЕГУЛИРУЕТСЯ
ГИПОТАЛАМО-ГИПОФИЗАРНОЙ СИСТЕМОЙ**

ЭСТРОГЕНЫ

ОСНОВНАЯ ФУНКЦИЯ ЭСТРОГЕНОВ

ОБЕСПЕЧЕНИЕ:

- овуляции
- оплодотворения
- сохранения и развития беременности, родов
- полового поведения (ч/з ЦНС)

**ЭСТРОГЕНЫ ДЕЙСТВУЮТ СТРОГО
ВЗАИМОСВЯЗАННО С ПРОГЕСТИНАМИ И
ГОНАДОТРОПИНАМИ ЛГ И ФСГ**

ЭСТРОГЕНЫ

□ В ЭМБРИОНАЛЬНОМ ПЕРИОДЕ:

- контролируют дифференцировку женских половых органов

□ В ПУБЕРТАТНОМ ПЕРИОДЕ:

- стимулируют развитие вторичных половых признаков

□ В РЕПРОДУКТИВНОМ ПЕРИОДЕ:

- активируют рост фолликулов, железистого эпителия матки и эпителия влагалища
- при беременности обеспечивают рост протоков молочных желез, ↑ мышечную массу миометрия, обеспечивая ее сократимость во время родов

ЭСТРОГЕНЫ

ЭСТРОГЕНЫ ТАКЖЕ:

□ ОБЕСПЕЧИВАЮТ ПОЛОВОЕ ПОВЕДЕНИЕ

□ ОБЛАДАЮТ СЛАБЫМ АНАБОЛИЧЕСКИМ ДЕЙСТВИЕМ:

- влияют на метаболизм костной ткани, снижая резорбцию
- задерживают в организме азот, натрий

ЭСТРОГЕНЫ

ЭСТРОГЕНЫ ТАКЖЕ:

- **ОБЛАДАЮТ СЛАБОЙ ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНОЙ АКТИВНОСТЬЮ**
- **ВЛИЯЮТ НА СИНТЕЗ ФАКТОРОВ СВЕРТЫВАНИЯ КРОВИ В ПЕЧЕНИ**
- **КОНТРОЛИРУЮТ ОБМЕН ЛИПИДОВ**
- **ВЛИЯЮТ НА СИНТЕЗ АНГИОТЕНЗИНА**
- **ОБЛАДАЮТ ИММУНОРЕГУЛЯТОРНЫМ ДЕЙСТВИЕМ**

Когда нужны препараты эстрогенов ?

У ЖЕНЩИН:

- заместительная терапия в перименопаузальном и постменопаузальном периоде
- некоторые формы бесплодия
- гипофункция яичников
- дисфункциональные маточные кровотечения
- профилактика и лечение остеопороза в постменопаузе
- контрацепция

У МУЖЧИН:

- остеопороз
- андрогензависимый рак предстательной железы

Эстрогены – наиболее значимые побочные эффекты

- Повышение частоты карцином эндометрия, шейки матки, молочной железы
- Тромбозы, тромбофлебиты
- Развитие холестатической желтухи, гепатотоксичность
- Психические нарушения (депрессия), мигрень

ЭСТРОГЕНЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- **ОСТРЫЕ И ХРОНИЧЕСКИЕ ЗАБОЛЕВАНИЯ ПЕЧЕНИ**
- **ТРОМБОФЛЕБИТ, ТРОМБОЭМБОЛИЧЕСКИЕ ЗАБОЛЕВАНИЯ**
- **ЭСТРОГЕНЗАВИСИМЫЙ РАК (МОЛОЧНОЙ ЖЕЛЕЗЫ, ЭНДОМЕТРИЯ, ШЕЙКИ МАТКИ)**
- **ФИБРОМИОМА МАТКИ**
- **ЭНДОМЕТРИОЗ**
- **МАТОЧНЫЕ КРОВОТЕЧЕНИЯ НЕЯСНОГО ГЕНЕЗА**
- **БЕРЕМЕННОСТЬ**
- **ГРУДНОЕ ВСКАРМЛИВАНИЕ**

ЖЕНСКИЕ ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

АНТИЭСТРОГЕНЫ

- КЛОМИФЕН (КЛОСТИЛБЕГИТ)
- ТАМОКСИФЕН (НОЛВАДЕКС, ЗИТАЗОНИУМ)

АНТИЭСТРОГЕНЫ

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ОБУСЛОВЛЕН СПОСОБНОСТЬЮ СВЯЗЫВАТЬСЯ С РЕЦЕПТОРАМИ ЭСТРОГЕНОВ

В МАЛЫХ ДОЗАХ:

☐ ↓ Содержание циркулирующих эстрогенов

☐ ↑ Секрецию гонадотропинов

☐ Индуцируют овуляцию

☐ Тормозят прогрессирование эстрогензависимых опухолей

☐ Блокируют рц эстрогенов

В БОЛЬШИХ ДОЗАХ:

☐ ↓ Секрецию гонадотропинов

АНТИЭСТРОГЕНЫ

~~КОЛОМИФЕН~~

- ✓ Ановуляторное бесплодие
- ✓ Дисфункциональные маточные кровотечения
- ✓ Аменорея
- ✓ Галакторея
- ✓ Андрогенная недостаточность у мужчин
- ✓ Олигоспермия

АНТИЭСТРОГЕНЫ

ПОКАЗАНИЯ ТАМОКСИФЕН

- ✓ Рак молочной железы (у женщин в менопаузе)
- ✓ Рак эндометрия
- ✓ Рак грудной железы (у мужчин после кастрации)
- ✓ Рак предстательной железы
- ✓ Меланома
- ✓ Рак почек

АНТИЭСТРОГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- *Тошнота, рвота, диарея*
- *Тромбоцитопения*
- *Нарушения зрения*
- *Кожный зуд, дерматит*
- *Депрессия*
- *Замедление скорости реакций*
- *Приливы жара*
- *Отеки*

АНТИЭСТРОГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

□ У мужчин:

- болезненность в области яичек

□ У женщин:

- образование кист яичников
- дисменорея, меноррагия
- боли в области молочных желез
- боли в нижнем отделе живота
- возникновение многоплодной беременности

АНТИЭСТРОГЕНЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

КЛОМИФЕН

- ❑ НАРУШЕНИЕ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ
- ❑ ПАТОЛОГИЯ ЗРЕНИЯ
- ❑ КИСТЫ ЯИЧНИКОВ
- ❑ ОРГАНИЧЕСКИЕ ЗАБОЛЕВАНИЯ ЦНС
- ❑ МАТОЧНЫЕ КРОВОТЕЧЕНИЯ
- ❑ БЕРЕМЕННОСТЬ

ТАМОКСИФЕН

- ❑ БЕРЕМЕННОСТЬ
- ❑ ТРОМБОФЛЕБИТ

ЖЕНСКИЕ ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

ГЕСТАГЕНЫ

- ПРОГЕСТЕРОН
- ГИДРОКСИПРОГЕСТЕРОНА КАПРОАТ
(ОКСИПРОГЕСТЕРОНА КАПРОНАТ)
- МЕДРОКСИПРОГЕСТЕРОН (ДЕПО-ПРОВЕРА)
- ЭТИСТЕРОН (ПРЕГНИН)
- АЛЛИЛЭСТРЕНОЛ (ТУРИНАЛ)
- ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ (МИКРОЛЮТ, МИРЕНА,
ПОСТИНОР)
- НОРЭТИСТЕРОН (ЭСТРАДУРИН)

ГЕСТАГЕНЫ

ПРОГЕСТЕРОН – ГОРМОН ЖЕЛТОГО ТЕЛА:

- Способствует развитию нормального эндометрия
- Обеспечивает разрыв созревшего фолликула
- Способствует переходу слизистой оболочки матки из фазы пролиферации в секреторную фазу
- После оплодотворения – в состоянии, необходимое для развития оплодотворенной яйцеклетки
- Обеспечивает сохранение беременности
- Стимулирует развитие концевых элементов молочной железы

ГЕСТАГЕНЫ

ПРОГЕСТЕРОН – ГОРМОН ЖЕЛТОГО ТЕЛА:

- Увеличивает запасы жира
- Повышает утилизацию глюкозы
- Способствует накоплению в печени гликогена
- Повышает выработку альдостерона
- Увеличивает выведение азота с мочой
- В малых дозах повышает, а в больших – подавляет продукцию гонадотропных гормонов гипофиза
- Тормозит овуляцию

Фармакологические препараты гестагенов

Прогестерон	Вводится внутрь, парентерально, местно	
Гидроксипрогестерона капроат	Вводится парентерально	
Медроксипрогестерон	Вводится внутрь, парентерально	
Этистерон	Сублингвально	19-нортестостерон
Норэтистерон	Внутри	
Аллилэстренол	Внутри	
Левоноргэстрел	Внутри	

ГЕСТАГЕНЫ

ПОКАЗАНИЯ

- Угрожающий или привычный выкидыш на ранних сроках беременности
- Дисфункциональные маточные кровотечения
- Предменструальный синдром
- Эстрогензависимые опухоли (рак молочной железы, эндометрия)
- Гиперплазия эндометрия
- Эндометриоз
- Аденома и рак предстательной железы

ГЕСТАГЕНЫ

ПОКАЗАНИЯ

- Мастодиния, мастопатия
- Полименорея
- Бесплодие
- Подавление овуляции и овуляторных болей
- Пероральная контрацепция (в комбинации с эстрогенами)

ГЕСТАГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Слабость, сонливость, головная боль, депрессия, дисфория
- Задержка жидкости в организме, отеки, ↑ АД
- Увеличение массы тела
- Дисфункциональные маточные кровотечения
- Диспептические расстройства
- Холестатический гепатит
- Снижение либидо

ГЕСТАГЕНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- *Сокращение менструального цикла*
- *Промежуточное кровотечение*
- *Тромбофлебиты, тромбоэмболии*
- *Тромбоз вен сетчатки*
- *Галакторея, мастодиния*
- *Алопеция*
- *Гирсутизм*
- *Болезненность в месте инъекций*

ГЕСТАГЕНЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- ГЕПАТИТ, ПЕЧЕНОЧНАЯ НЕДОСТАТОЧНОСТЬ
 - СКЛОННОСТЬ К ТРОМБОЗАМ
 - ОСТРАЯ СЕРДЕЧНАЯ НЕДОСТАТОЧНОСТЬ
 - НАРУШЕНИЕ ОБМЕНА ВЕЩЕСТВ
- ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ

ГОРМОНАЛЬНЫЕ КОНТРАЦЕПТИВЫ

□ КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ (КГК)

- НИЗКОДОЗИРОВАННЫЕ КГК
- СТАНДАРТНО ДОЗИРОВАННЫЕ КГК

□ ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

- ПЕРОРАЛЬНЫЕ КОНТРАЦЕПТИВЫ
- ПАРЕНТЕРАЛЬНЫЕ КОНТРАЦЕПТИВЫ
- ВНУТРИМАТОЧНЫЕ КОНТРАЦЕПТИВЫ

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

□ ЧТО ОБЕСПЕЧИВАЮТ ЭСТРОГЕНЫ:

- ↓ высвобождения гонадолиберинов гипоталамуса
- ↓ высвобождения ФСГ и ЛГ гипофиза
- ↓ синтеза половых гормонов в яичниках
- предотвращение овуляции (ановуляторные циклы)

□ ИЗМЕНЕНИЕ ФИЗИКО-ХИМИЧЕСКИХ СВОЙСТВ ШЕЕЧНОЙ СЛИЗИ:

- ↑ вязкость шейечной слизи
- ↓ кол-во шейечной слизи
- нарушается движение сперматозоидов

□ ЧТО ОБЕСПЕЧИВАЮТ ПРОГЕСТИНЫ:

- ↓ высвобождения гонадолиберинов, ФСГ, ЛГ
- нарушение функции желтого тела
- ↓ толщина эндометрия, ↓ активность эндометрия
- невозможность имплантации бластоцисты

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОД ВОЗДЕЙСТВИЕМ КОНТРАЦЕПТИВОВ:

□ У ЗДОРОВЫХ ЖЕНЩИН:

- предотвращается нежелательная беременность

□ ПРИ ПАТОЛОГИИ:

- восстанавливается регулярный менструальный цикл
- реже возникают дисменорея, меноррагии
- реже возникает предменструальный синдром
- ↓ частота внематочной беременности
- ↓ риск воспалительных заболеваний органов малого таза
- ↓ риск развития рака эндометрия, яичников, доброкачественных опухолей молочной железы

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

Низкодозированные

- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ГЕСТОДЕН (ЛОГЕСТ)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ДЕЗОГЕСТРЕЛ (НОВИНЕТ)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+НОРЭЛГЕСТРОМИН (ЕВРА)

Стандартно дозированные

- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ДИЕНОГЕСТ (ЖАНИН)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ДРОСПИРЕНОН (ЯРИНА)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ГЕСТОДЕН (ФЕМОДЕН, ЛИНДИНЕТ 30)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ (МИКРОГЕНОН, МИНИЗИСТОН, РИГЕВИДОН, ТРИКВИЛАР, ТРИ-РЕГОЛ, ТРИЗИСТОН)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ДЕЗОГЕСТРЕЛ (МАРВЕЛОН, РЕГУЛОН)
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ+ЦИПРОТЕРОН (ИАНАЕ-35)

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

**Низкодозированные КГК содержат
20 мкг этинилэстрадиола**

- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + ГЕСТОДЕН 75 мкг (ЛОГЕСТ,
ЛИНДИНЕТ 20)**
- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + ДЕЗОГЕСТРЕЛ 150 мкг
(МЕРСИЛОН, НОВИНЕТ)**
- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + НОРЭЛГЕСТРОМИН 150 мкг
(ЕВРА, ТТС – на 7 сут)**

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

**Низкодозированные КГК содержат
20 мкг этинилэстрадиола**

- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + ГЕСТОДЕН (ЛОГЕСТ, ЛИНДИНЕТ 20)**
- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + ДЕЗОГЕСТРЕЛ (МЕРСИЛОН, НОВИНЕТ)**
- **ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + НОРЭЛГЕСТРОМИН (ЕВРА)**

ПОКАЗАНЫ:

- **ВСЕМ ЖЕНЩИНАМ ДЕТОРОДНОГО ВОЗРАСТА, В ТОМ ЧИСЛЕ ИМЕЮЩИМ РИСК СОСУДИСТЫХ ЗАБОЛЕВАНИЙ**

НЕ РЕКОМЕНДУЮТСЯ:

- **ЖЕНЩИНАМ СТАРШЕ 50 ЛЕТ**

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

**Стандартно дозированные КГК содержат
этинилэстрадиола:**

- 30 - 35 мкг в монофазных препаратах**
- 30 - 40 мкг в трехфазных препаратах**
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ 30 мкг + ДИЕНОГЕСТ 2 мг (ЖАНИН)**
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ 30 мкг + ДРОСПИРЕНОН 2 мг (ЯРИНА)**
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ 30 мкг + ГЕСТОДЕН 75 мкг
(ФЕМОДЕН, ЛИНДИНЕТ 30)**
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ 30 мкг + ДЕЗОГЕСТРЕЛ 150 мкг
(МАРВЕЛОН, РЕГУЛОН)**
- ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ 35 мкг + ЦИПРОТЕРОН 2 мг
(ИАНА-35)**

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ЭТИНИЛЭСТРАДИОЛ + ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ

МИКРОГЕНОН	30 мкг + 150 мкг
МИНИЗИСТОН	30 мкг + 125 мкг
РИГЕВИДОН	30 мкг + 150 мкг
ТРИКВИЛАР	30 мкг + 50 мкг 40 мкг + 75 мкг 30 мкг + 125 мкг
ТРИ-РЕГОЛ	30 мкг + 50 мкг 40 мкг + 75 мкг 30 мкг + 125 мкг
ТРИЗИСТОН	30 мкг + 50 мкг 40 мкг + 75 мкг 30 мкг + 125 мкг

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН- ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

□ ЭСТРОГЕНЗАВИСИМЫЕ:

- *Тромбоэмболии, тромбозы*
- *Головная боль, нервозность, раздражительность, головокружение*
- *Задержка жидкости, отеки, повышение АД*
- *Мастопатия, увеличение молочных желез*
- *Повышение массы тела*
- *Нарушения липидного и углеводного обмена*

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН- ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

□ ЭСТРОГЕНЗАВИСИМЫЕ:

- *Холестатический гепатит*
- *Возрастание риска рака печени у курящих женщин*
- *Нарушение функции щитовидной железы*

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН- ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- **ГЕСТАГЕНЗАВИСИМЫЕ:**
 - **Вирилизация (гирсутизм, акне)**
 - **Депрессии**
 - **Снижение полового влечения (либидо)**
 - **Увеличение массы тела**
 - **Нарушения менструального цикла (нерегулярный), маточные кровотечения**
 - **Гепатотоксичность**

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН- ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

□ АБСОЛЮТНЫЕ:

- Тромбоэмболические заболевания
- Гормональнозависимые опухоли
- Прогрессирующие заболевания печени
- Сосудистые заболевания головного мозга
- Инфаркт миокарда
- Выраженная гиперлипидемия
- Беременность

КОМБИНИРОВАННЫЕ ЭСТРОГЕН-ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

□ ОТНОСИТЕЛЬНЫЕ:

- ✓ Заболевания печени и желчного пузыря
- ✓ Артериальная гипертензия
- ✓ Сахарный диабет
- ✓ Хронические заболевания почек
- ✓ Эпилепсия
- ✓ Фибромиома матки
- ✓ Курение

ГЕСТАГЕННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

Пероральные контрацептивы

- **ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ 30 мкг (МИКРОЛЮТ)**

Парентеральные контрацептивы

- **МЕДРОКСИПРОГЕСТЕРОН (МЕДРОКСИПРОГЕСТЕРОН-ЛЕНС (150 мг 1р/ 3 мес в/м), ДЕПО-ПРОВЕРА (15% 1 мл 1 р/ 3 мес в/м))**

Внутриматочные контрацептивы

- **ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ (МИРЕНА 20 мкг/ 24 ч (5лет))**

Экстренная контрацепция

- **ЛЕВОНОРГЕСТРЕЛ (ЭСКАПЕЛ (1,5 мг), ПОСТИНОР (0,75 мг))**

В чем преимущество гестагенных контрацептивов?

- Могут применяться при склонности к тромбозам
- Могут применяться у женщин старшей возрастной группы
- Могут применяться у курящих женщин
- Могут применяться у женщин с сердечно-сосудистой патологией

В чем недостаток гестагенных контрацептивов?

- Менее надежны в плане предохранения от нежелательной беременности

ГОРМОНЫ КОРЫ НАДПОЧЕЧНИКОВ (КОРТИКОСТЕРОИДЫ)

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

- ГИДРОКОРТИЗОН
- КОРТИЗОН (КОРТИКОСТЕРОН)

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

- АЛЬДОСТЕРОН
- ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

ПОЛОВЫЕ ГОРМОНЫ

- АНДРОСТЕРОН
- АНДРОСТЕНДИОН
- ЭСТРОН
- ПРОГЕСТЕРОН

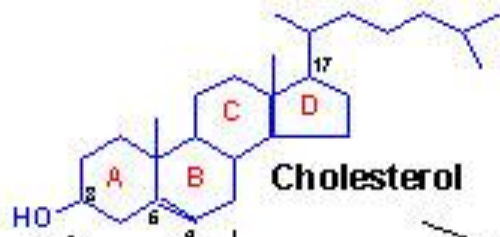
ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

- ГИДРОКОРТИЗОН
- КОРТИЗОН (КОРТИКОСТЕРОН)

- ✓ *синтезируются в пучковой зоне*
- ✓ *активно влияют на углеводный и белковый обмен*
- ✓ *но менее активны в отношении водного и солевого обмена*

ПРЕПАРАТЫ:

- ПРЕДНИЗОН
- ПРЕДНИЗОЛОН
- МЕТИЛПРЕДНИЗОЛОН
- ФЛУДРОКОРТИЗОН
- ДЕКСАМЕТАЗОН
- БЕТАМЕТАЗОН
- ТРИАМЦИНОЛОН



Zona fasciculata

Zona glomerulosa

Zona reticularis

P450ssc

P450ssc

P450ssc

Pregnenolone

Pregnenolone

Pregnenolone

P450c17

3 β -DH
 Δ^{14} -isomerase

3 β -DH
 Δ^{14} -isomerase

P450c17

17-OH pregnenolone

Progesterone

Progesterone

17-OH pregnenolone

3 β -DH
 Δ^{14} -isomerase

P450c21

11-deoxycorticosterone

17,20 lyase

17-OH progesterone

11-deoxycorticosterone

Corticosterone

Dehydroepiandrosterone (DHEA)

P450c21

P450c11

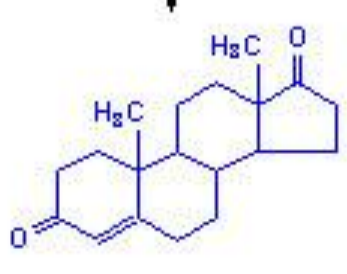
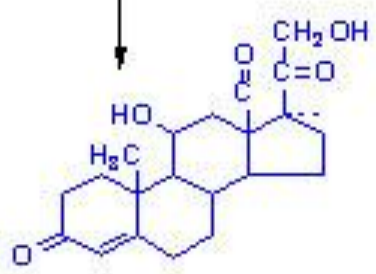
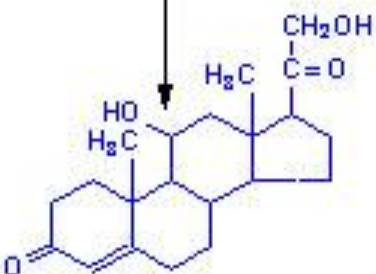
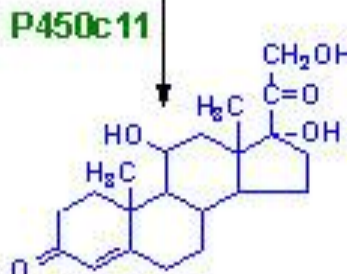
aldosterone
synthase

3 β -DH
 Δ^{14} -isomerase

Sulfotransferase

DHEA-S

11-deoxycortisol



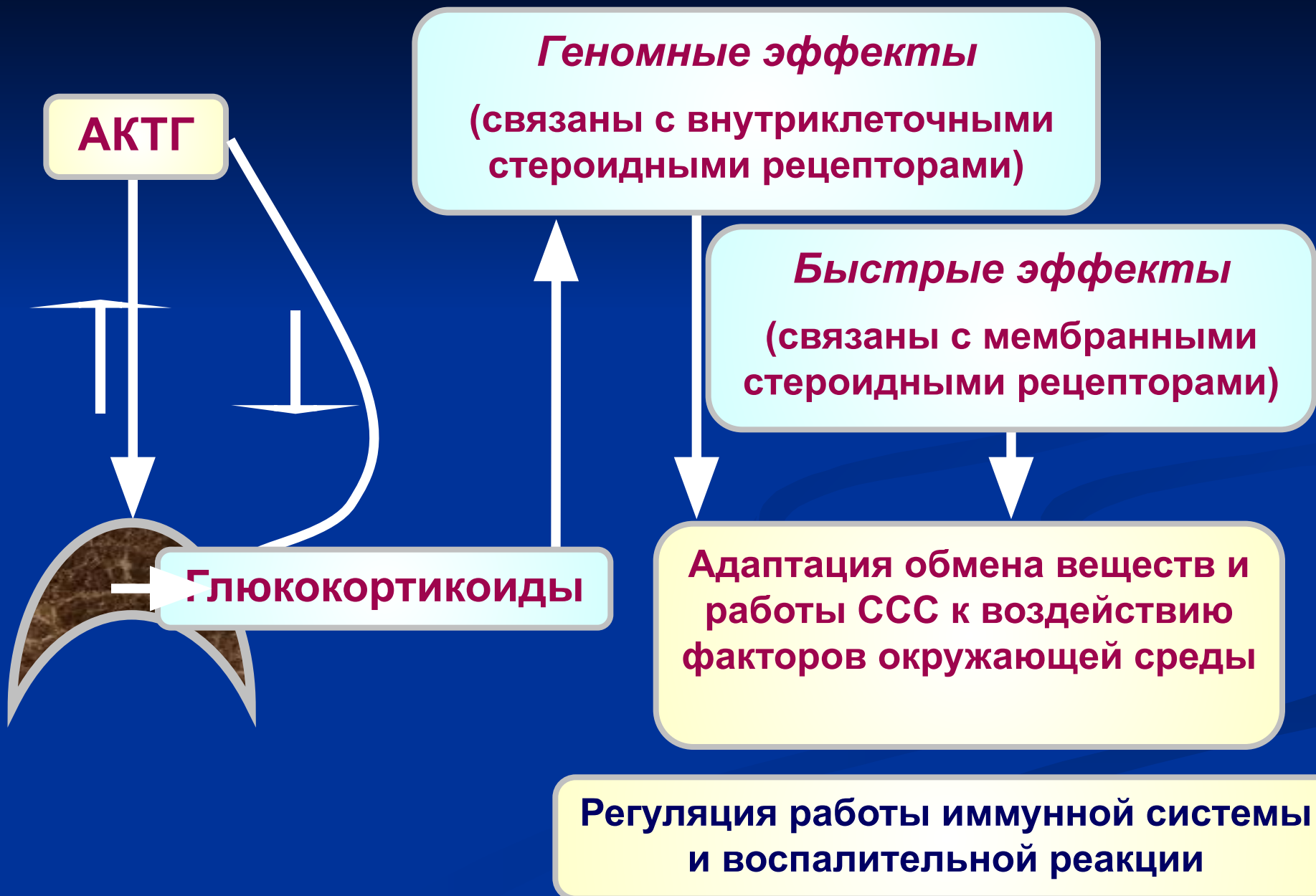
Cortisol

Corticosterone

Aldosterone

Androstenedione

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ



ВЛИЯНИЕ НА ОБМЕННЫЕ ПРОЦЕССЫ
Мобилизация механизмов, направленных
на увеличение содержания глюкозы и
других энергетических субстратов в крови
(контринсулярный эффект)

Углеводный обмен

- ↑↑ содержания глюкозы в крови
- ↓ захвата глюкозы тканями
- ↑↑ глюконеогенеза в печени

Мобилизация механизмов, направленных на увеличение содержания глюкозы и других энергетических субстратов в крови (контринсулярный эффект)

Белковый обмен

- ↓↓ синтеза белков
- ↑↑ распада белков
- ↓ содержания глобулинов в плазме крови
- но в печени ↑↑ синтез белка

ВЛИЯНИЕ НА ОБМЕННЫЕ ПРОЦЕССЫ

Липидный обмен

- ↑↑ липолиза
- ↑ уровня жирных кислот
- перераспределение жировой ткани
- гиперхолестеринемия

ВЛИЯНИЕ НА ОБМЕННЫЕ ПРОЦЕССЫ

Водно-электролитный обмен

- задержка в организме Na^+ и воды
- активное выведение ионов K^+
- $\uparrow\uparrow$ массы тела
- \downarrow всасывания Ca^{2+} с пищей
- \uparrow экскреции Ca^{2+} с мочой
- $\downarrow\downarrow$ аккумуляции кальция в костной ткани
(остеопороз)

Повышение эффективности работы сердечно-сосудистой системы в условиях стресса

- ↑↑ АД
- ↑ экспрессию и чувствительность адренорецепторов к катехоламинам в сердце и сосудах
- ↑↑ прессорного действия ангиотензина II
- ↓ проницаемость капилляров
- ↑ сократимость миокарда

Противовоспалительный эффект

- Угнетают все три фазы воспаления: альтерации, экссудации, пролиферации
- Препятствуют синтезу провоспалительных цитокинов (IL-1, TNF, IL-8), устраняют их эффекты
- Являются основными физиологическими антагонистами хемокинов, препятствуют их синтезу

Противовоспалительный эффект

- Блокируют фосфолипазу A2 и тормозят “арахидоновый каскад”, - образование провоспалительных простагландинов (ПГЕ2) и лейкотриенов (ЛТВ4)
- Препятствуют экспрессии молекул адгезии

Противоаллергический эффект

- стабилизируют мембрану тучных клеток
- ↓ количество эозинофилов
- ↓ % гистамина в тканях (↓ выброс из тучных клеток и ↑ активность гистаминазы печени)
- ↓ выброс брадикинина

Противоаллергический эффект

- ↓ ФЛ А2, в результате чего ↓ образование арахидоновой кислоты, а, следовательно, и ЛТ, ФАТ – основных медиаторов аллергии
- ↓ выброс медиаторов аллергии тучными клетками
- препятствуют развитию IgE-опосредованных реакций

Иммуносупрессивный эффект

- ↓ миграцию стволовых клеток из костного мозга
- ↓ пролиферацию В-лимфоцитов и синтез ими Ig, т.е. ↓ антителогенез, в результате чего ↓ гуморальный иммунный ответ
- нарушают взаимодействие Т- и В-лимфоцитов
- ↓ функцию Мф – в результате ↓ неспецифический иммунный ответ

Иммуносупрессивный эффект

- ↓ Т–звено иммунного ответа (↓ кол-во Т-хелперов)
- тормозят выброс цитокинов: ИЛ-1, ИЛ-2 (участвуют в пролиферации лимфоцитов), γ-ИНФ из Лф и Мф
- ↓ транспорт Лф к месту антигенной стимуляции

Влияние на кровь

- **эозинопения**
- **лимфоцитопения**
- **↑↑ пролиферацию эритроцитов**
- **↑↑ число тромбоцитов**
- **↑↑ число нейтрофилов**

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

Обладают также:

- *противошоковым*
- *антитоксическим действием*

**В высоких дозах ГК обладают
цитостатическим и цитотоксическим
эффектом**

**Наиболее чувствительны к действию
ГК быстроделаящиеся ткани
(в первую очередь лимфоидная)**

ВЛИЯНИЕ НА СИСТЕМУ ГИПОТАЛАМУС – ГИПОФИЗ – НАДПОЧЕЧНИКИ

- угнетение вследствие механизма отрицательной обратной связи
Выработка ГК регулируется гормонами гипоталамуса и передней доли гипофиза по принципу обратной связи:
- ↓ уровня ГК в плазме крови ведет к ↑ продукции АКТГ гипофиза, в результате чего ↑ функция коры надпочечников, т.е. ↑ выработка ГК
- ↑ уровня ГК в крови ведет, соответственно, наоборот, к ↓ образования АКТГ

Следовательно длительное введение в организм ГК может привести:

- *к угнетению и атрофии коры надпочечников*
- *к ↓ образования гонадотропных и тиреотропного гормонов гипофиза*

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

ПРИМЕНЕНИЕ В МЕДИЦИНЕ

Заместительная
терапия при
надпочечниковой
недостаточности

Фармакодинамическая
терапия

Противоопухолевая

Противошоковая
терапия

Иммуносупрессивная

Противовоспалительная

Противоаллергическая

ПРИМЕНЕНИЕ В МЕДИЦИНЕ

- В качестве противовоспалительных, противоаллергических препаратов их применяют при лечении :
 - Бронхиальной астмы
 - Аутоиммунных заболеваний (СКВ, РА, гломерулонефрит, неспецифический язвенный колит, тяжелые заболевания кожи, глаз и т.д.)
 - Вирусных и токсических гепатитов
 - Острого панкреатита

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

ПРИМЕНЕНИЕ В МЕДИЦИНЕ

- ❑ В качестве иммунодепрессантов их применяют при:
 - Трансплантации для предупреждения отторжения трансплантатов, а также для купирования РТПХ
 - В онкологии – при лимфопролиферативных заболеваниях в качестве средств, угнетающих образование лимфоцитов
- ❑ В качестве противошоковых средств ГК применяют при urgentных состояниях, СДР

Природные глюкокортикоиды (кортизон и гидрокортизон) используют для заместительной терапии при надпочечниковой недостаточности (болезнь Аддисона – Бирмера)

В клинике применяют **синтетические препараты**, т. к. они меньше влияют на водно-солевой обмен и, следовательно, меньше вызывают побочных эффектов:

Системные ГК

- Преднизолон
- Метилпреднизолон
- Бетаметазон
- Дексаметазон
- Триамцинолон
- Флудрокортизон
- Дезоксикортон

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

Топические ГК

Ингаляционные ГК

- Триамцинолон
- Беклометазон
- Будесонид
- Флунизолид
- Флутиказон

ГК для наружного применения

- Дексаметазон
- Мометазон
- Будесонид
- Флутиказон
- Преднизолон
- Гидрокортизон
- Метилпреднизолона ацепонат

□ ПРЕДНИЗОЛОН :

- в 4 раза активнее гидрокортизона

□ МЕТИЛПРЕДНИЗОЛОН :

- в 5 раз активнее гидрокортизона

□ ФЛУДРОКОРТИЗОН :

- в 12 раз активнее гидрокортизона по ГК активности
- в 125 раз активнее гидрокортизона по минералокортикоидной активности
- применяют при:
 - первичной надпочечниковой недостаточности
 - гипоальдостеронизме

□ ДЕКСАМЕТАЗОН :

- высокая ГК-ая активность
- незначительная минералокортикоидная активность

□ БЕТАМЕТАЗОН :

- применяется местно

□ ТРИАМЦИНОЛОН :

- по ГК-ому действию аналогичен метилпреднизолону
- но не задерживает Na^+ в организме

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- **СВЯЗАННЫЕ С УГНЕТЕНИЕМ ПРОДУКЦИИ АКТГ:**
 - Вторичная надпочечниковая недостаточность
 - Обострение основного заболевания после отмены
- **СВЯЗАННЫЕ С ГОРМОНАЛЬНОЙ АКТИВНОСТЬЮ:**
 - Стероидный Кушингоид
 - Стероидный диабет
 - Стероидный остеопороз
 - Нарушение процессов регенерации, стероидные язвы
 - Иммуносупрессия
 - Гипертензия
 - Глаукома

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

При длительном применении -
угнетение функции коры надпочечников

Как избежать?

- *преимущество – топическим препаратам*
- *короткий курс - оптимальные дозы*
- *учитывать суточные ритмы выработки ГК*
- *отмена постепенная с переходом на интермиттирующий режим*
- *контроль* уровня глюкозы, АД, диуреза, массы тела

Глюкокортикоиды – пульс - терапия

Мини – пульс: 100 – 200 мг преднизолона или метилпреднизолона 3 – 5 дней с переходом на короткий интермиттирующий курс

Пульс: 1000 – 2000 мг преднизолона или метилпреднизолона 3 дня в вену капельно

Чем опасна пульс-терапия:

Неврологические нарушения

Коллапс и (или) внезапная смерть

Диссеминация инфекции

Гипертонический криз

ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Сахарный диабет
- Психические заболевания
- Эпилепсия
- Язвенная болезнь
- Выраженный остеопороз
- Тяжелая артериальная гипертензия

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

- АЛЬДОСТЕРОН
- ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

- ✓ синтезируются в клубочковой зоне
- ✓ влияют в основном на обмен электролитов и воды
- ✓ относительно мало - на углеводный и белковый обмен

ПРЕПАРАТЫ:

- ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

• ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

□ *Вызывает:*

- задержку натрия, воды
- усиливает выведение калия, магния, водорода

□ *В результате этого:*

- повышается гидрофильность тканей
- повышается ОЦК
- повышается АД

□ *А также:*

- повышает тонус и работоспособность мышц

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

• ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

ПОКАЗАНИЯ

- Болезнь Аддисона (первичная надпочечниковая недостаточность)
- Гипокортицизм (временное снижение функции коры надпочечников)
- Миастения
- Астения, адинамия, общая мышечная слабость
- Гипохлоремия
- Диэнцефально-гипофизарная недостаточность
- Первичная гипотония с ортостатическими нарушениями

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

• ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Отеки
- Повышение АД
- Запоры
- Анорексия
- Нарушение сердечной деятельности из-за гипокалиемии
- Гипокалиемический алкалоз

МИНЕРАЛОКОРТИКОИДЫ

• ДЕЗОКСИКОРТИКОСТЕРОН

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **Гипертоническая болезнь**
- **Сердечная недостаточность**
- **Атеросклероз**
- **Заболевания почек**
- **Цирроз печени**

✱ Производные аминокислот

**✱ ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ
ЖЕЛЕЗЫ**

✱ ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЭПИФИЗА

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФУНКЦИИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

Преимуществом этих препаратов является их эффективность при пероральном применении

**✓ ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ
ЖЕЛЕЗЫ**

✓ АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

✓ ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФУНКЦИИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

- ЛЕВОТИРОКСИН НАТРИЙ (L-ТИРОКСИН)
- ЛИОТИРОНИН (ТРИЙОДТИРОНИН)
- ТИРЕОИДИН

КОМБИНИРОВАННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

- ЛЕВОТИРОКСИН НАТРИЙ + ЛИОТИРОНИН (ТИРЕОТОМ)
- ЛЕВОТИРОКСИН НАТРИЙ + ЛИОТИРОНИН + КАЛИЯ
ЙОДИД (ТИРЕОКОМБ)
- ЛЕВОТИРОКСИН НАТРИЙ + КАЛИЯ ЙОДИД
(ЙОДТИРОКС)

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФУНКЦИИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

- ТИАМАЗОЛ (МЕРКАЗОЛИЛ)
- ПРОПИЛТИОУРАЦИЛ (ПРОПИЦИЛ)

РЕДКО ПРИМЕНЯЮТ

- ДИЙОДТИРОЗИН
- ЛИТИЯ КАРБОНАТ
- КАЛИЯ ПЕРХЛОРАТ
- РАДИОАКТИВНЫЙ ЙОД

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

- КАЛИЯ ЙОДИД

ГОРМОНЫ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

ЩИТОВИДНАЯ ЖЕЛЕЗА ПРОДУЦИРУЕТ ДВА ГОРМОНА:

- **L-ТИРОКСИН**
- **ТРИЙОДТИРОНИН**

Недостаток гормонов щитовидной железы:

□ В раннем возрасте ведет к :

- задержке роста
- соматическим нарушениям
- олигофрении (кретинизму)

□ В более позднем возрасте:

- к замедлению обмена веществ (микседеме)

ГОРМОНЫ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ



Активация
транскрипции
генов ключевых
ферментов

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- ↑↑ глюконеогенез
- ↑↑ гликогенолиз
- ↑↑ синтез и катаболизм белков
 (“белкового оборота”)
- ↑↑ теплопродукция
- ↑↑ потребление O_2 тканями

ГОРМОНЫ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ



Активация
транскрипции
генов ключевых
ферментов

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- ↑↑ сократимость миокарда, ↑↑ ЧСС
- ↑↑ потребность сердца в O_2
- ↑↑ эритропоэз
- ↑↑ дыхательный центр
- ↑↑ метаболизм кортизола

ГОРМОНЫ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ



- Обеспечение роста, регенерации, репарации тканей
- ↑↑ чувствительности к симпатическим эффектам, одновременно, стресс-протекторный эффект
- Регуляция психических процессов
- Регуляция сердечной деятельности
- Регуляции почечного кровотока
- Регуляция ремоделирования кости

ГИПОТИРЕОИДИЗМ



Дефицит тиреоидных гормонов
(конгенитальный гипотиреоз, тиреоидит Хашимото, диффузный токсический зоб)



Препараты тиреоидных гормонов

ГИПЕРТИРЕОИДИЗМ ТИРЕОТОКСИКОЗ



Избыток тиреоидных гормонов
(аденома щ. железы, диффузный токсический зоб, аутоиммунный)



Антитиреоидные препараты

ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

ПОКАЗАНИЯ

□ В КАЧЕСТВЕ ВОЗМЕЩАЮЩЕЙ ТЕРАПИИ ПРИ ВРОЖДЕННОЙ ИЛИ ПРИОБРЕТЕННОЙ НЕДОСТАТОЧНОСТИ ФУНКЦИИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ:

- ГИПОТИРЕОЗ
- ДИФFUЗНЫЙ ТОКСИЧЕСКИЙ ЗОБ
- ДИФFUЗНЫЙ НЕТОКСИЧЕСКИЙ ЗОБ
- ХРОНИЧЕСКИЙ АУТОИММУННЫЙ ТИРЕОИДИТ (болезнь Хашимото)
- УЗЛОВОЙ ЗОБ С ЯВЛЕНИЯМИ ГИПОТИРЕОЗА
- РАК ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

□ В БОЛЕЕ ВЫСОКИХ ДОЗАХ - ДЛЯ СНИЖЕНИЯ ВЫРАБОТКИ ТИРЕОТРОПНОГО ГОРМОНА (ТТГ) В ГИПОФИЗЕ (при избыточной тиреотропной активности гипофиза)

ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Повышение ЧСС, аритмии, у пожилых пациентов возможно обострение ИБС***
- Повышение АД***
- Повышенная возбудимость, потливость***
- Снижение веса***
- Диспептические расстройства***
- Аллергические реакции на тиреоидин (наличие йодных и белковых примесей)***

ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- НЕКОМПЕНСИРОВАННЫЙ ТИРЕОТОКСИКОЗ
- НЕЛЕЧЕННАЯ НАДПОЧЕЧНИКОВАЯ НЕДОСТАТОЧНОСТЬ
- ОСТРЫЙ ИНФАРКТ МИОКАРДА

ОТНОСИТЕЛЬНЫЕ

- НАРУШЕНИЯ РИТМА СЕРДЦА
- НЕСТАБИЛЬНАЯ СТЕНОКАРДИЯ
- МИОКАРДИТЫ

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФУНКЦИИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА (ТИРЕОСТАТИКИ)

- ТИАМАЗОЛ (МЕРКАЗОЛИЛ)
- ПРОПИЛТИОУРАЦИЛ (ПРОПИЦИЛ)

РЕДКО ПРИМЕНЯЮТ

- ДИЙОДТИРОЗИН
- ЛИТИЯ КАРБОНАТ
- КАЛИЯ ПЕРХЛОРАТ
- РАДИОАКТИВНЫЙ ЙОД

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

ПОКАЗАНИЯ

- ❑ **ГИПЕРТИРЕОЗ ИЛИ ТИРЕОТОКСИКОЗ, которые могут быть следствием:**
 - аденомы щитовидной железы
 - диффузного токсического зоба
 - аутоиммунного процесса
- ❑ **ПОСЛЕОПЕРАЦИОННЫЕ РЕЦИДИВЫ ТИРЕОТОКСИКОЗА**
- ❑ **УЗЛОВОЙ ЗОБ**

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

ПОКАЗАНИЯ

ПРИМЕНЯЮТ:

- *кратковременно* – при подготовке пациентов к тиреоидэктомии
- *длительно* – при консервативном лечении

РЕЗУЛЬТАТ ПРИМЕНЕНИЯ:

- **БЛОКАДА ОБРАЗОВАНИЯ ТИРЕОИДНЫХ ГОРМОНОВ**

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- **Лейкопения, агранулоцитоз**
- **Тромбоцитопения**
- **Зобогенный эффект**
- **Медикаментозный гипотиреоз**
- **Дерматит**
- **Гепатотоксичность**
- **Диспепсия, потеря вкусовой**

АНТИТИРЕОИДНЫЕ СРЕДСТВА

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Лейкопения или гранулоцитопения
- Беременность, лактация
- Узловые формы зоба (кроме случаев тяжелого прогрессирующего течения, когда исключена возможность операции)
- Индивидуальная непереносимость

Нельзя сочетать с лекарственными препаратами, которые могут вызвать лейкопению (например, сульфаниламиды)

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

- КАЛИЯ ЙОДИД

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- Компенсируют дефицит йода
- Стимулируют синтез и высвобождение ТТГ
- Предупреждают накопление радиоактивного йода в щитовидной железе, обеспечивают ее защиту от радиации
- Препятствуют развитию гиперплазии щитовидной железы

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

ПОКАЗАНИЯ

- **ЭНДЕМИЧЕСКИЙ ЗОБ**
- **ПРОФИЛАКТИКА ЗАБОЛЕВАНИЙ,
ВЫЗЫВАЕМЫХ ДЕФИЦИТОМ ЙОДА:**
 - **ЭНДЕМИЧЕСКИЙ ЗОБ**
 - **ЗОБ ДИФФУЗНЫЙ ЭУТИРЕОИДНЫЙ**
 - **ПРИ БЕРЕМЕННОСТИ**
 - **СОСТОЯНИЕ ПОСЛЕ РЕЗЕКЦИИ ЗОБА**

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ **НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ**

На фоне длительной терапии –
явления йодизма:

- ✓ головная боль
- ✓ кожная сыпь
- ✓ гиперемия слизистой оболочки полости рта,
глотки, желудка
- ✓ металлический привкус во рту
- ✓ болезненность десен, зубная боль
- ✓ ринит, конъюнктивит, бронхит
- ✓ йодная лихорадка
- ✓ йодные угри

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Тиреотоксикоз (при дозах ≥ 300 мкг/сут)
- Гипотиреоз (при дозах ≥ 1 мг/сут)

Эффект ослабляют антитиреоидные препараты

ЙОДСОДЕРЖАЩИЕ ПРЕПАРАТЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **Гиперфункция щитовидной железы**
выраженная или скрытая, в т.ч.:
 - **диффузный зоб**
 - **узловой токсический зоб**
- **Токсическая аденома и др.**
доброкачественные опухоли щитовидной
железы

★ Вещества белкового и пептидного строения:

★ ПРЕПАРАТЫ ГОРМОНОВ ГИПОТАЛАМУСА

★ ГИПОФИЗА

★ ПОДЖЕЛУДОЧНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

★ ПАРАЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ

★ КАЛЬЦИТОНИН

**ПРЕПАРАТЫ ПОДЖЕЛУДОЧНОЙ
ЖЕЛЕЗЫ И СИНТЕТИЧЕСКИЕ
САХАРОСНИЖАЮЩИЕ СРЕДСТВА**

САХАРНЫЙ ДИАБЕТ

**Сахарный диабет
I типа**

160,3 члк/ 100 000

- аутоиммунный
- идиопатический

**Абсолютная
недостаточность
инсулина**

Сахарный диабет

II типа

500 члк/ 100 000

**Повышение
резистентности к
инсулину**

**Относительная
недостаточность
инсулина**

Другие виды диабета

***В основе терапии СД I типа
лежит пожизненная
инсулиноterapia,
цель которой – полноценное
обеспечение процессов
жизнедеятельности***

ИНСУЛИНЫ

КЛАССИФИКАЦИЯ

По происхождению:

- Бычий
- Свиной
- Человеческий (биомодифицированный или рекомбинантный)

КЛАССИФИКАЦИЯ

По длительности действия:

■ *Ультракороткого*

■ **инсулин аспарт**

■ **инсулин лизпро**

■ **начало – ч/з 15 мин**

■ **длительность – 3-4 ч**

■ *Быстрого действия*

■ **инсулин растворимый (члк генно-инженерный)**

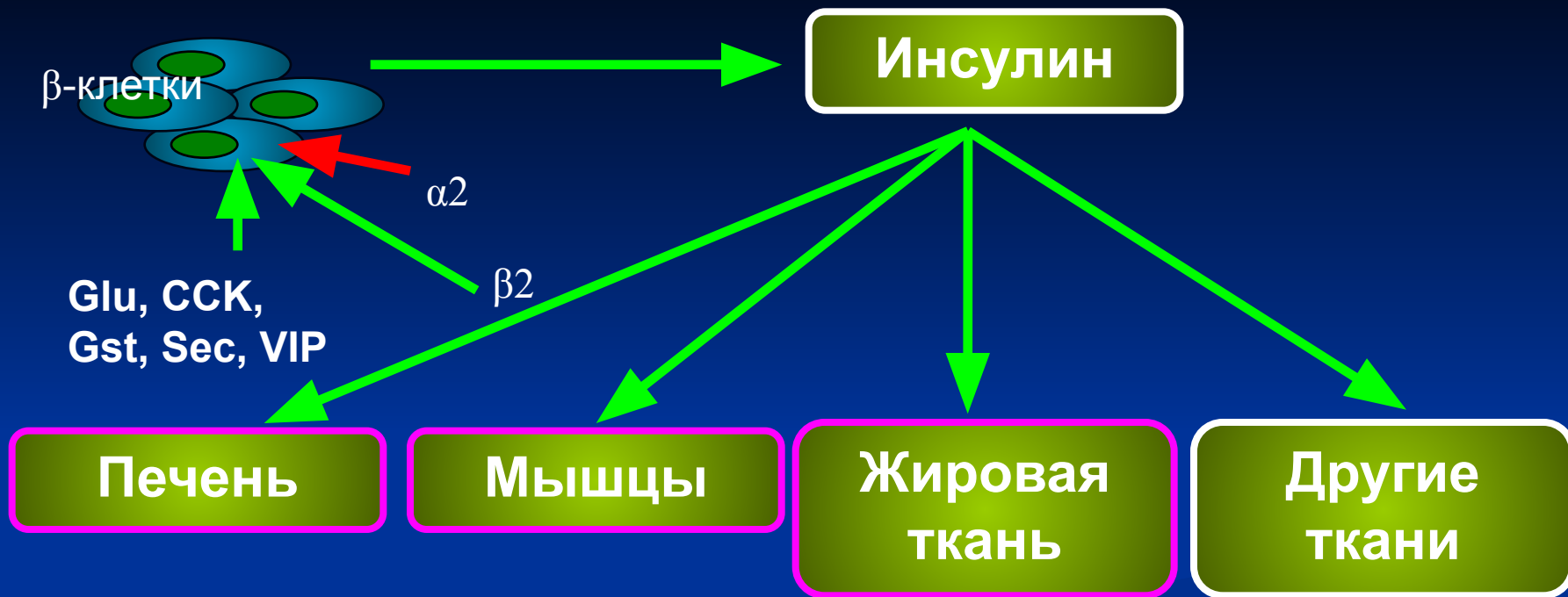
■ **начало – ч/з 30 мин – 1 ч**

■ **длительность – 6-8 ч**

КЛАССИФИКАЦИЯ

- **Средней продолжительности**
- **инсулин-цинка комбинированного суспензия**
- **инсулин-изофан (члк генно-инженерный, полусинтетический)**
- **начало – ч/з 1- 2,5 ч**
- **длительность – 14-20 ч**

- **Аналоги члк инсулина продолжительного действия**
- **инсулин детемир**
- **инсулин-гларгин**
- **начало – ч/з 1 – 1,5 ч**
- **длительность – 22-26 ч**



Стимуляция захвата клетками глюкозы и других нутриентов

Торможение распада углеводов, жиров, белков

Анаболизм >> Катаболизм

■ **ВЛИЯНИЕ НА:**

Метаболизм глюкозы

- ↑↑ утилизацию глюкозы тканями
- ↓↓ эндогенную продукцию глюкозы
- ↓↓ гликемии

Метаболизм жиров

- ↓↓ липолиз
- ↓↓ уровня жирных кислот
- ↑↑ липогенез (превращение свободных жирных к-т и глицерола в триглицериды)

■ ВЛИЯНИЕ НА:

Обмен белков

- ↑↑ синтез белков
- ↓↓ процессы протеолиза

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ИНСУЛИНОВ

- Инсулинозависимый сахарный диабет
- Сахарный диабет у тех больных, у кого диета в сочетании с пероральными сахароснижающими средствами не обеспечивает компенсации диабета, а также в тех случаях, когда имеются противопоказания к назначению таблетированных средств
- Осложнения сахарного диабета - кетоацидоз, гиперосмолярная кома, диабетическая гангрена конечностей, диабетическая нефропатия независимо от типа сахарного диабета

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ИНСУЛИНОВ

- Сахарный диабет, отягощенный тяжелой соматической патологией - острым инфарктом миокарда, инсультом, пневмонией, травмой, операцией
- Беременность у больных сахарным диабетом
- Состояния после панкреатэктомии
- Кахексия после травм, ожогов и пр.

ОСНОВНЫЕ ПРИНЦИПЫ ИНСУЛИНОТЕРАПИИ

- **суточная потребность в инсулине – 0,6 – 0,8 ЕД/**

1кг массы тела

- **потребность в инсулине ↑↑ при:**

- **стрессе**
- **инфекциях**
- **операциях**

- **потребность в инсулине ↓↓ при:**

- **ХПН**
- **физических нагрузках**

ОСНОВНЫЕ ПРИНЦИПЫ ИНСУЛИНОТЕРАПИИ

- **имитация базальной секреции инсулина**
(инсулины средней продолжительности или длительного действия)
- **введение перед каждым приемом пищи**
инсулина короткого или ультракороткого действия (из расчета на 1 ХЕ)
- ***препараты выбора- генно-инженерные***
инсулины человека

ОСНОВНЫЕ ПРИНЦИПЫ ИНСУЛИНОТЕРАПИИ

- **обязательное соблюдение диетических рекомендаций**
- **дозирование физической нагрузки**
- **изменение доз инсулина при изменении потребности в нем**

*Как достичь высокой эффективности
инсулинов, меньшего числа побочных
эффектов, желаемой
продолжительности?*

- **Использовать генно-инженерные инсулины человека**
- **Использовать инсулины высокой степени очистки (монокомпонентные, обозначаемые МС)**

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ ИНСУЛИНОТЕРАПИИ

- гипогликемическое состояние, возникающее при передозировке инсулина или при низком содержании углеводов в пище, употреблении алкоголя, чрезмерной физической нагрузке
- аллергические реакции:
 - местные - зуд, папула, местный отек
 - системные - анафилактический шок, отек

Квинке

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ ИНСУЛИНОТЕРАПИИ

- **инсулиновые липодистрофии, которые чаще встречаются у женщин**
- **преходящие нарушения рефракции глаза
(возникает в самом начале инсулинотерапии)**
- **резистентность к действию инсулина**
- **преходящие отеки нижних конечностей**

Как **уменьшить** уровень **глюкозы** без **инсулина**?

- ↓ **потребление углеводов и жиров** (диета)
- ↑ **продукцию инсулина** (производные сульфонилмочевины, меглитиниды)
- ↑ **чувствительность тканей к инсулину** (бигуаниды, тиазолидиндионы)
- ↓ **гликогенолиз** и ↑ **расщепление глюкозы по анаэробному пути** (бигуаниды)
- ↓ **всасывание глюкозы в кишечнике** (ингибиторы глюкозидазы)

*Преимуществом этих препаратов является их
эффективность при пероральном применении*

ПЕРОРАЛЬНЫЕ САХАРОСНИЖАЮЩИЕ СРЕДСТВА

КЛАССИФИКАЦИЯ ПЕРОРАЛЬНЫХ САХАРОСНИЖАЮЩИХ СРЕДСТВ

По химическому строению

ПРОИЗВОДНЫЕ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

I поколение

- ТОЛБУТАМИД (БУТАМИД)
- КАРБУТАМИД (БУКАРБАН)
- ХЛОПРОПАМИД (ДИАБЕНЕЗ)

II поколение

- ГЛИБЕНКЛАМИД (МАНИНИЛ)
- ГЛИКЛАЗИД (ДИАБЕТОН)
- ГЛИПИЗИД (МИНИДИАБ)
- ГЛИКВИДОН (ГЛЮРЕНОРМ)
- ГЛИМЕПИРИД (АМАРИЛ)

КЛАССИФИКАЦИЯ ПЕРОРАЛЬНЫХ САХАРОСНИЖАЮЩИХ СРЕДСТВ

По химическому строению

МЕГЛИТИНИДЫ

- РЕПАГЛИНИД (НОВОНОРМ)
- НАТЕГЛИНИД (СТАРЛИКС)

БИГУАНИДЫ

- МЕТФОРМИН (ГЛИФОРМИН)
- ФЕНФОРМИН (ДИБОТИН)
- БУФОРМИН (ГЛИБУТИД)

ТИАЗОЛИДИНДИОНЫ

- ПИОГЛИТАЗОН (АКТОС)
- РОСИГЛИТАЗОН (АВАНДИЯ)

КЛАССИФИКАЦИЯ ПЕРОРАЛЬНЫХ САХАРОСНИЖАЮЩИХ СРЕДСТВ

По химическому строению

ИНГИБИТОРЫ α -ГЛЮКОЗИДАЗ

- АКАРБОЗА (ГЛЮКОБАЙ)
- МИГЛИТОЛ

КОМБИНИРОВАННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

- ГЛИБЕНКЛАМИД + МЕТФОРМИН (ГЛИБОМИД)

ДРУГИЕ СРЕДСТВА, СПОСОБСТВУЮЩИЕ СНИЖЕНИЮ ГЛЮКОЗЫ В КРОВИ

- ОРЛИСТАТ (КСЕНИКАЛ)
- СИБУТРАМИН (МЕРИДИА)

По основному механизму действия

I. ЛС, ↑↑ СЕКРЕЦИЮ ИНСУЛИНА (СЕКРЕТОГОГИ):

- Производные сульфонилмочевины
- Меглитиниды

II. ЛС, ↑↑ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ ТКАНЕЙ К ИНСУЛИНУ (СЕНСИТАЙЗЕРЫ):

- Бигуаниды
- Тиазолидиндионы

III. ЛС, НАРУШАЮЩИЕ ВСАСЫВАНИЕ УГЛЕВОДОВ В КИШЕЧНИКЕ:

- Акарбоза
- Миглитол

ЛС, ↑↑ СЕКРЕЦИЮ ИНСУЛИНА (СЕКРЕТОГОГИ)

ПРОИЗВОДНЫЕ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

I ПОКОЛЕНИЕ

- ТОЛБУТАМИД (БУТАМИД)
- КАРБУТАМИД (БУКАРБАН)
- ХЛОРПРОПАМИД (ДИАБЕНЕЗ)

II ПОКОЛЕНИЕ

- ГЛИБЕНКЛАМИД (МАНИНИЛ)
- ГЛИКЛАЗИД (ДИАБЕТОН)
- ГЛИПИЗИД (МИНИДИАБ)
- ГЛИКВИДОН (ГЛЮРЕНОРМ)
- ГЛИМЕПИРИД (АМАРИЛ)

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ПРОИЗВОДНЫХ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

□ ↑ ВЫБРОС ИНСУЛИНА ЗА СЧЕТ:

- активации β -клеток поджелудочной железы
- ↑ чувствительности β -клеток к глюкозе

□ ↑ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ КЛЕТОК-МИШЕНЕЙ К ИНСУЛИНУ

□ ↓ СЕКРЕЦИЮ ГЛЮКАГОНА

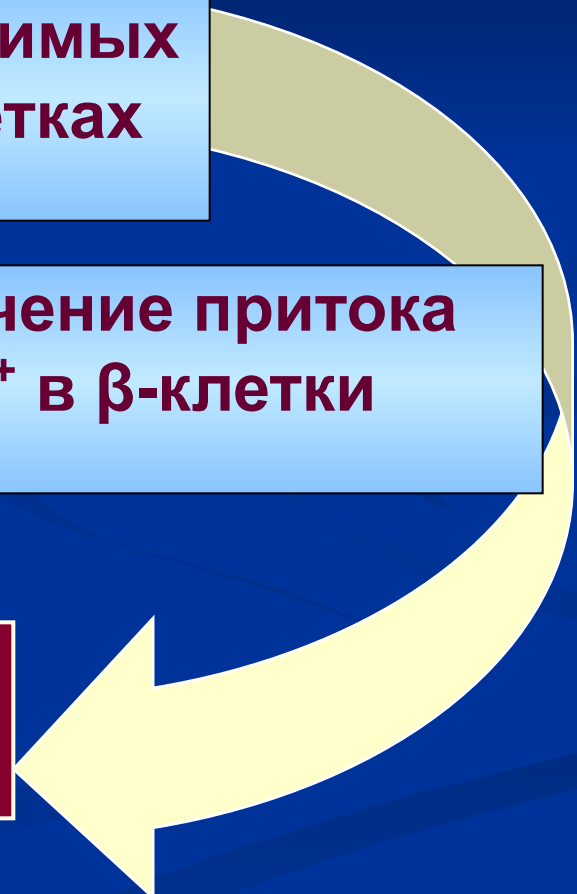
**ПРИ ↓ ФУНКЦИОНАЛЬНОЙ АКТИВНОСТИ β -
КЛЕТОК (ПРИ ДЕФИЦИТЕ ИНСУЛИНА) ЭТИ
ПРЕПАРАТЫ НЕЭФФЕКТИВНЫ**

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ПРОИЗВОДНЫХ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

**Блокада АТФ-зависимых
K⁺-каналов в β-клетках**

**Увеличение притока
Ca²⁺ в β-клетки**

**УВЕЛИЧЕНИЕ
СЕКРЕЦИИ ИНСУЛИНА**



ПРОИЗВОДНЫЕ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

ПОКАЗАНИЯ:

✓ *САХАРНЫЙ ДИАБЕТ (СД) 2 ТИПА*

(при невозможности компенсации одной диетой в сочетании с физическими нагрузками)

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- ❑ СД I ТИПА
- ❑ НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ/ ПОЧЕК (КК < 30 мл/мин)
- ❑ БЕРЕМЕННОСТЬ
- ❑ ЛАКТАЦИЯ
- ❑ ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ

ПРОИЗВОДНЫЕ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ:

- ГИПОГЛИКЕМИЧЕСКИЕ РЕАКЦИИ
- ↑ МАССЫ ТЕЛА
- ГЧ К АЛКОГОЛЮ (тетурамоподобный эффект)
- ГИПОНАТРИЕМИЯ
- ДИСПЕПСИЯ
- АЛЛЕРГИЧЕСКИЕ РЕАКЦИИ
- ФОТОДЕРМАТОЗ
- ЗАДЕРЖКА ЖИДКОСТИ
- НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ/ ПОЧЕК
- ЛЕЙКОПЕНИЯ, ТРОМБОЦИТОПЕНИЯ, АГРАНУЛОЦИТОЗ
- АПЛАСТИЧЕСКАЯ, ГЕМОЛИТИЧЕСКАЯ АНЕМИИ
- АТЕРОГЕННОЕ ДЕЙСТВИЕ

ПРАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ (МЕГЛИТИНИДЫ)

**ПОСТПРАНДИАЛЬНАЯ
ГИПЕРГЛИКЕМИЯ –
повышение уровня
глюкозы крови после еды**

**ПОДЖЕЛУДОЧНАЯ
ЖЕЛЕЗА:
выброс инсулина
(ранний пик)**

У БОЛЬНЫХ:

- **САХАРНЫМ ДИАБЕТОМ**
- **С НАРУШЕННОЙ ТОЛЕРАНТНОСТЬЮ К ГЛЮКОЗЕ**

ОТСУТСТВИЕ ОТВЕТА НА ГИПЕРГЛИКЕМИЮ

ПРАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ (МЕГЛИТИНИДЫ)

- ↑↑ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ β-КЛЕТОК К СТИМУЛЯЦИИ ГЛЮКОЗОЙ

- ↑↑ СЕКРЕЦИЯ ИНСУЛИНА В ОТВЕТ НА ↑↑ ГЛИКЕМИИ

**НОРМАЛИЗУЮТ
ПОСТПРАНДИАЛЬНЫЙ
УРОВЕНЬ ГЛЮКОЗЫ В
КРОВИ**

- ВОССТАНАВЛИВАЕТСЯ РАННЯЯ ФАЗА СЕКРЕЦИИ ИНСУЛИНА

- НЕ РАЗВИВАЕТСЯ ГИПЕРИНСУЛИНЕМИЯ ВСЛЕДСТВИЕ КОРОТКОГО ПЕРИОДА ДЕЙСТВИЯ

ПРАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ

РЕПАГЛИНИД (Repaglinide) НОВОНОРМ

ОТЛИЧИТЕЛЬНЫЕ СВОЙСТВА

- ПРОИЗВОДНОЕ БЕНЗОЙНОЙ КИСЛОТЫ
- ПРЕДУПРЕЖДАЕТ ПОДЪЕМ ГЛИКЕМИИ ПОСЛЕ ЕДЫ
- НЕ ВЫЗЫВАЕТ ЗАМЕТНУЮ ГИПОГЛИКЕМИЮ
- ХОРОШО СОЧЕТАЕТСЯ С МЕТФОРМИНОМ
- ***ВОССТАНАВЛИВАЕТ РАННЮЮ ФАЗУ СЕКРЕЦИИ ИНСУЛИНА β -КЛЕТКАМИ***
- ***ПРИМЕНЯЮТ ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ СД II ТИПА У ПОЖИЛЫХ БОЛЬНЫХ***
- НЕ РЕКОМЕНДУЕТСЯ В ВОЗРАСТЕ ДО 18 ЛЕТ И СТАРШЕ 75 ЛЕТ

ПАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ

НАТЕГЛИНИД (Nateglinide) СТАРЛИКС

КОНКУРЕНТНОЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЕ
СО СПЕЦИФИЧЕСКИМИ
СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИННЫМИ РЦ
МЕМБРАН КЛЕТОК (SUR I)

- ЗАКРЫТИЕ АТФ-ЗАВИСИМЫХ K^+ -КАНАЛОВ L-ТИПА
- ПОСТУПЛЕНИЕ Ca^{2+} В КЛЕТКИ
- ЭКЗОЦИТОЗ СЕКРЕТОРНЫХ ГРАНУЛ, СОДЕРЖАЩИХ ИНСУЛИН

УСИЛИВАЕТ ВЫБРОС ИНСУЛИНА
 β -КЛЕТКАМИ

ПАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ

НАТЕГЛИНИД (Nateglinide) СТАРЛИКС

**ЭФФЕКТ ЯВЛЯЕТСЯ
ГЛЮКОЗОЗАВИСИМЫМ:**

- ✓ ПО МЕРЕ СНИЖЕНИЯ % ГЛЮКОЗЫ В КРОВИ – СНИЖАЕТСЯ СЕКРЕЦИЯ ИНСУЛИНА
- ✓ ПРИЕМ ПИЩИ ИЛИ ИНФУЗИЯ ДЕКСТРОЗЫ ПРИВОДИТ К ПОВЫШЕНИЮ СЕКРЕЦИИ ИНСУЛИНА

**ПРЕДУПРЕЖДАЕТ РАЗВИТИЕ
ГИПОГЛИКЕМИИ**

ПАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ

НАТЕГЛИНИД (Nateglinide) СТАРЛИКС

ПОКАЗАНИЯ:

□ СД II ТИПА (ПРИ НЕВОЗМОЖНОСТИ КОМПЕНСАЦИИ ОДНОЙ ДИЕТОЙ В СОЧЕТАНИИ С ФИЗ. НАГРУЗКАМИ)

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- СД I ТИПА**
- КЕТОАЦИДОЗ**
- КОМА**
- ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ**
- НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ/ ПОЧЕК**
- БЕРЕМЕННОСТЬ**
- ЛАКТАЦИЯ**

ПАНДИАЛЬНЫЕ РЕГУЛЯТОРЫ ГЛИКЕМИИ

НАТЕГЛИНИД (Nateglinide) СТАРЛИКС

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

- **ГИПОГЛИКЕМИЯ (РЕДКО)**
- **ТРАНЗИТОРНОЕ ПОВЫШЕНИЕ АКТИВНОСТИ ФЕРМЕНТОВ ПЕЧЕНИ**
- **СЫПЬ**
- **ЗУД**
- **КРАПИВНИЦА**

ИНСУЛИНОВЫЕ СЕНСИТАЙЗЕРЫ

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

- **МЕТФОРМИН (ГЛИФОРМИН)**
- **ФЕНФОРМИН (ДИБОТИН)**
- **БУФОРМИН (ГЛИБУТИД)**

**СНИЖАЮТ УРОВЕНЬ ГЛЮКОЗЫ В КРОВИ
ЗА СЧЕТ:**

- **↑↑ УТИЛИЗАЦИИ ГЛЮКОЗЫ ТКАНЯМИ**
- **↓↓ ГЛЮКОНЕОГЕНЕЗА В ПЕЧЕНИ**

↓↓ ИНСУЛИНОРЕЗИСТЕНТНОСТЬ

ИНСУЛИНОВЫЕ СЕНСИТАЙЗЕРЫ

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

- **МЕТФОРМИН (ГЛИФОРМИН)**
- **ФЕНФОРМИН (ДИБОТИН)**
- **БУФОРМИН (ГЛИБУТИД)**

- **ДЕЙСТВУЮТ В ПРИСУТСТВИИ ЭНДОГЕННОГО ИНСУЛИНА**
- **ЭФФЕКТИВНЫ ЛИШЬ ПРИ НАЛИЧИИ ФУНКЦИОНИРУЮЩИХ ОСТРОВКОВЫХ КЛЕТОК ПЖ**

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

МЕТФОРМИН (*Metformin*) ГЛИФОРМИН

ОТЛИЧИТЕЛЬНЫЕ СВОЙСТВА

- НЕ СТИМУЛИРУЕТ СЕКРЕЦИЮ ИНСУЛИНА
- НЕ ВЫЗЫВАЕТ ГИПОГЛИКЕМИЮ
- РЕДКО ВЫЗЫВАЕТ ЛАКТАТ-АЦИДОЗ
- СНИЖАЕТ УРОВЕНЬ ЛИПИДОВ, ХС И ТГ В КРОВИ
- ОКАЗЫВАЕТ ФИБРИНОЛИТИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ
- СПОСОБСТВУЕТ СНИЖЕНИЮ МАССЫ ТЕЛА

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

МЕТФОРМИН (Metformin) ГЛИФОРМИН

ЛЕЧЕНИЕ:

- СД ТИПА II (ОСОБЕННО В СОЧЕТАНИИ С ОЖИРЕНИЕМ)
- СИНДРОМА ПОЛИКИСТОЗА ЯИЧНИКОВ С ИНСУЛИНОРЕЗИСТЕНТНОСТЬЮ

ПОКАЗАНИЯ

ПРОФИЛАКТИКА РАЗВИТИЯ СД У ЛИЦ:

- С ОЖИРЕНИЕМ
- С ГИПЕРГЛИКЕМИЕЙ НАТОЩАК
- С НАРУШЕНИЕМ ТОЛЕРАНТНОСТИ К ГЛЮКОЗЕ

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

МЕТФОРМИН (Metformin) ГЛИФОРМИН

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- ❑ СД I ТИПА
- ❑ ДИАБЕТИЧЕСКАЯ КОМА
- ❑ НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПЕЧЕНИ/ ПОЧЕК
- ❑ СОСТОЯНИЯ, СОПРОВОЖДАЮЩИЕСЯ ГИПОКСИЕЙ (ИМ, ОНМК, ДН, АНЕМИЯ И ДР.)
- ❑ ЛАКТАТ-АЦИДОЗ В АНАМНЕЗЕ
- ❑ ХРОНИЧЕСКИЙ АЛКОГОЛИЗМ
- ❑ ОПЕРАТИВНОЕ ВМЕШАТЕЛЬСТВО
- ❑ БЕРЕМЕННОСТЬ, ЛАКТАЦИЯ

БИГУАНИДЫ (ПРОИЗВОДНЫЕ ГУАНИДИНА)

МЕТФОРМИН (Metformin) ГЛИФОРМИН

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

- ДИСПЕПСИЯ, АНОРЕКСИЯ
- МЕГАЛОБЛАСТИЧЕСКАЯ АНЕМИЯ
- ЛАКТАТ-АЦИДОЗ

ПРЕДОСТЕРЕЖЕНИЯ:

- ✓ ПРИ ИСПОЛЬЗОВАНИИ ЙОДСОДЕРЖАЩИХ КОНТРАСТНЫХ ВЕЩЕСТВ ПРЕПАРАТ ВРЕМЕННО ОТМЕНЯЮТ
- ✓ КОНТРОЛЬ СОДЕРЖАНИЯ ЛАКТАТА – НЕ МЕНЕЕ 2 р/год И ПРИ ПОЯВЛЕНИИ БОЛЕЙ В МЫШЦАХ
- ✓ ПРИ ПОВЫШЕНИИ УРОВНЯ ЛАКТАТА ПРЕПАРАТ ОТМЕНЯЮТ

ИНСУЛИНОВЫЕ СЕНСИТАЙЗЕРЫ ТИАЗОЛИДИНДИОНЫ (ГЛИТАЗОНЫ)

- ПИОГЛИТАЗОН (АКТОС)
- РОСИГЛИТАЗОН (АВАНДИЯ)

*ПОВЫШАЮТ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ ТКАНЕЙ -
МИШЕНЕЙ К ИНСУЛИНУ:*

- ▣ ↓↓ ИНСУЛИНОРЕЗИСТЕНТНОСТЬ ТКАНЕЙ
- ▣ ↑↑ ЗАХВАТ ГЛЮКОЗЫ
- ▣ ↓↓ ВЫБРОС ГЛЮКОЗЫ ИЗ ПЕЧЕНИ
- ▣ ↓↓ СОДЕРЖАНИЕ ГЛЮКОЗЫ И ИНСУЛИНА В КРОВИ
- ▣ ↓↓ УРОВЕНЬ ТРИГЛИЦЕРИДОВ, ↑↑ % ЛПВП И ХС

ИНСУЛИНОВЫЕ СЕНСИТАЙЗЕРЫ ТИАЗОЛИДИНДИОНЫ

- ПИОГЛИТАЗОН (АКТОС)
- РОСИГЛИТАЗОН (АВАНДИЯ)

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ:

- ✓ СЕЛЕКТИВНО СТИМУЛИРУЮТ ЯДЕРНЫЕ $PPAR \gamma$ -РЦ, КОТОРЫЕ РЕГУЛИРУЮТ ТРАНСКРИПЦИЮ ГЕНОВ

МОДУЛЯЦИЯ ТРАНСКРИПЦИИ ГЕНОВ, ОТВЕЧАЮЩИХ ЗА МЕТАБОЛИЗМ:

- УГЛЕВОДОВ
- ЖИРОВ

- ↓↓ ИНСУЛИНОРЕЗИСТЕНТНОСТЬ, НО
- МАЛО ↓↓ ГЛЮКОНЕОГЕНЕЗ В ПЕЧЕНИ
- ↑↑ МАССУ ТЕЛА

ИНСУЛИНОВЫЕ СЕНСИТАЙЗЕРЫ ТИАЗОЛИДИНДИОНЫ, ГЛИТАЗОНЫ

- ПИОГЛИТАЗОН (АКТОС)
- РОСИГЛИТАЗОН (АВАНДИЯ)

ПРЕДОТВРАЩАЮТ:

- РАЗВИТИЕ ГИПЕРГЛИКЕМИИ НАТОЩАК И ПОСЛЕ ПРИЕМА ПИЩИ
- ГЛИКОЗИЛИРОВАНИЕ Hb
- ТОРМОЗЯТ РАЗВИТИЕ НАРУШЕНИЙ ФУНКЦИИ ПОЧЕК
- ↓↓ ВЫДЕЛЕНИЕ ПРЕДШЕСТВЕННИКОВ ИНСУЛИНА, ЧТО СНИЖАЕТ РИСК РАЗВИТИЯ ЗАБОЛЕВАНИЙ ССС

ЛС, НАРУШАЮЩИЕ ВСАСЫВАНИЕ ГЛЮКОЗЫ В КИШЕЧНИКЕ

- АКАРБОЗА (ГЛЮКОБАЙ)
- МИГЛИТОЛ

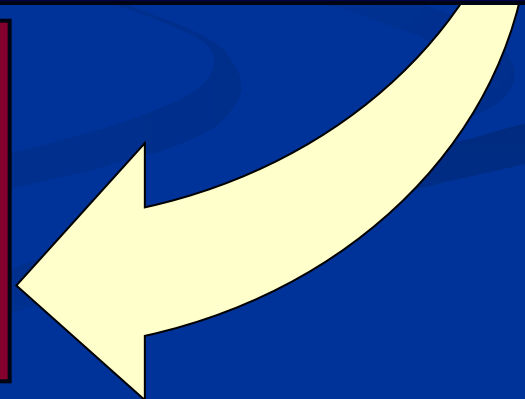
• НЕ ↑↑ СЕКРЕЦИЮ ИНСУЛИНА

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ:

✓ *ИНГИБИРУЮТ КИШЕЧНЫЕ α-ГЛЮКОЗИДАЗЫ
(ферменты энтероцитов тонкой кишки)*

• ↓↓ **ФЕРМЕНТАТИВНОЕ ПРЕВРАЩЕНИЕ
ДИ-, ОЛИГО- И ПОЛИСАХАРИДОВ ДО
МОНОСАХАРИДОВ**

- ↓↓ **ОБРАЗОВАНИЕ И ВСАСЫВАНИЕ
МОНОСАХАРИДОВ ИЗ КИШЕЧНИКА**
- ↓↓ **ПОСТПРАНДИАЛЬНАЯ
ГИПЕРГЛИКЕМИЯ**



ИНГИБИТОРЫ α -ГЛЮКОЗИДАЗ

- АКАРБОЗА (ГЛЮКОБАЙ)
- МИГЛИТОЛ

ПОКАЗАНИЯ:

□ СД II ТИПА:

- НЕЭФФЕКТИВНОСТЬ ДИЕТОТЕРАПИИ ≥ 6 мес
- НЕЭФФЕКТИВНОСТЬ ПРОИЗВОДНЫХ СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫ НА ФОНЕ НИЗКОКАЛОРИЙНОЙ ДИЕТЫ

□ СД I ТИПА (в составе комбинированной терапии)

ИНГИБИТОРЫ α -ГЛЮКОЗИДАЗ

• АКАРБОЗА (ГЛЮКОБАЙ)

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

- $\uparrow\uparrow$ ГАЗООБРАЗОВАНИЕ В КИШЕЧНИКЕ
- БОЛИ В ЭПИГАСТРИИ, ТОШНОТА, ДИАРЕЯ
- $\uparrow\uparrow$ АКТИВНОСТИ ПЕЧЕНОЧНЫХ ТРАНСАМИНАЗ
- КИШЕЧНАЯ НЕПРОХОДИМОСТЬ
- ЖЕЛТУХА, ГЕПАТИТ
- КОЖНАЯ СЫПЬ, ГИПЕРЕМИЯ, ЭКЗАНТЕМА, КРАПИВНИЦА
- ОТЕКИ

ИНГИБИТОРЫ α -ГЛЮКОЗИДАЗ

• АКАРБОЗА (ГЛЮКОБАЙ)

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- ДИАБЕТИЧЕСКИЙ КЕТОАЦИДОЗ
- ЦИРРОЗ ПЕЧЕНИ
- ВОСПАЛИТЕЛЬНЫЕ ЗАБОЛЕВАНИЯ КИШЕЧНИКА
- КРУПНЫЕ ГРЫЖИ ГРУДНОЙ СТЕНКИ
- ПОВЫШЕННОЕ ГАЗООБРАЗОВАНИЕ
- ЯЗВЕННЫЙ КОЛИТ
- КИШЕЧНАЯ НЕПРОХОДИМОСТЬ
- СТРИКТУРЫ И ЯЗВЫ КИШЕЧНИКА
- ХПН
- БЕРЕМЕННОСТЬ, ЛАКТАЦИЯ

ДРУГИЕ СРЕДСТВА, СПОСОБСТВУЮЩИЕ СНИЖЕНИЮ УРОВНЯ ГЛЮКОЗЫ В КРОВИ

- **ОРЛИСТАТ (КСЕНИКАЛ)**
- **СИБУТРАМИН (МЕРИДИА)**

***СНИЖЕНИЕ МАССЫ ТЕЛА –
НЕОБХОДИМЫЙ КОМПОНЕНТ
ЛЕЧЕНИЯ СД II ТИПА***

**ИНДЕКС МАССЫ ТЕЛА (ИМТ) –
ПОКАЗАТЕЛЬ ДЛЯ ОЦЕНКИ ОЖИРЕНИЯ**

$$\text{ИМТ кг/м}^2 = \text{МТ в кг} / \text{рост в м}^2$$

Ожирение
ИМТ ≥ 30 кг/м²

Избыточная масса тела
ИМТ 25 – 29,9 кг/м²

**СНИЖЕНИЕ МАССЫ ТЕЛА –
НЕОБХОДИМЫЙ КОМПОНЕНТ
ЛЕЧЕНИЯ СД II ТИПА**

ЛС для лечения ожирения
периферического действия,
ингибитор липаз

ОРЛИСТАТ (КСЕНИКАЛ)

- Селективно угнетает желудочно-кишечные липазы ПЖ
- Образует ковалентную связь с активным сериновым участком желудочной и панкреатической липаз
- Действует в просвете желудка и кишечника
- Блокирует всасывание жиров
- Эффект продолжительный

↓↓ **ПОСТУПЛЕНИЕ ЖИРОВ В ОРГАНИЗМ
ЗА СЧЕТ НЕВСОСАВШИХСЯ
ТРИГЛИЦЕРИДОВ (30%)**

СНИЖЕНИЕ МАССЫ ТЕЛА

ОРЛИСТАТ (КСЕНИКАЛ)

ОСОБЕННОСТИ:

- ПРЕПАРАТ МЕСТНОГО ДЕЙСТВИЯ**
- ВОЗДЕЙСТВУЕТ НА МЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ПРОЦЕССЫ В ОРГАНИЗМЕ**
- ДАЖЕ В ВЫСОКИХ ДОЗАХ НЕ ВЛИЯЕТ НА АКТИВНОСТЬ ДРУГИХ ФЕРМЕНТОВ ЖКТ, ПЕЧЕНИ, ПЖ**
- ПРИМЕНЯЕТСЯ ВО ВРЕМЯ ЕДЫ (3 р/ д)**
- ПОСЛЕ ОТМЕНЫ – АКТИВНОСТЬ ЛИПАЗ ВОССТАНАВЛИВАЕТСЯ**
- ПРАКТИЧЕСКИ НЕ ВСАСЫВАЕТСЯ**
- МЕТАБОЛИЗИРУЕТСЯ В СТЕНКЕ КИШЕЧНИКА**

ОРЛИСТАТ (КСЕНИКАЛ)

- ЭФФЕКТ ПРОЯВЛЯЕТСЯ Ч/З 8-12 нед
- ЭФФЕКТ СОХРАНЯЕТСЯ ПРИ ПРОДОЛЖЕНИИ ЛЕЧЕНИЯ И/ ИЛИ СОБЛЮДЕНИИ ГИПОКАЛОРИЙНОЙ ДИЕТЫ

- ↓ УРОВЕНЬ ОБЩЕГО ХОЛЕСТЕРИНА
- ↓ УРОВЕНЬ ЛПНП
- ↓ УРОВЕНЬ ТГ
- ↓ УРОВЕНЬ НЬ А_{1с}, ГЛЮКОЗЫ ПЛАЗМЫ
НАТОЩАК
- ↓ САД, ↓ ДАД

СНИЖАЕТ:

- МАССУ ТЕЛА
- ФАКТОРЫ РИСКА СЕРДЕЧНО-СОСУДИСТЫХ ЗАБОЛЕВАНИЙ

СИБУТРАМИН (МЕРИДИА)

- Анорексигенное средство, усиливающее чувство насыщения
- Селективный ингибитор обратного захвата серотонина и норадреналина

**АКТИВАЦИЯ
СИМПАТОАДРЕНАЛОВОЙ
СИСТЕМЫ**

**ТЕРМОГЕННЫЙ ЭФФЕКТ
(↑ РАСХОДА ЭНЕРГИИ, В
т.ч. В ПОКОЕ)**

**БЛОКАДА ОБРАТНОГО
ЗАХВАТА СЕРОТОНИНА
И НОРАДРЕНАЛИНА В
ГИПОТАЛАМУСЕ**

- ❑ **УСИЛЕНИЕ ЧУВСТВА
НАСЫЩЕНИЯ**
- ❑ **СНИЖЕНИЕ АППЕТИТА**

**СНИЖЕНИЕ МАССЫ
ТЕЛА**

СИБУТРАМИН (МЕРИДИА)

- ЛС центрального действия
- ↓↓ аппетит
- ↑↑ термогенез
- ↓↓ массу тела
- нормализует углеводный и липидный обмены

МЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ

□ СНИЖАЕТ УРОВНИ:

- триглицеридов, холестерина ЛПНП
- инсулина
- мочевой кислоты

□ ПОВЫШАЕТ УРОВЕНЬ:

- холестерина ЛПВП

□ ПОВЫШАЕТ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ ТКАНЕЙ К ИНСУЛИНУ

СИБУТРАМИН (МЕРИДИА)

**У БОЛЬНЫХ СД II ТИПА
ОБЕСПЕЧИВАЕТ:**

- ▣ ↑↑ КОНТРОЛЯ ГЛИКЕМИИ
- ▣ ↑↑ ЧУВСТВИТЕЛЬНОСТИ К ИНСУЛИНУ
- ▣ ↓↓ УРОВНЯ ГЛЮКОЗЫ НАТОЩАК
- ▣ ↓↓ РИСКА ПОЗДНИХ ОСЛОЖНЕНИЙ СД
- ▣ ↓↓ МАССЫ ТЕЛА
- ▣ УЛУЧШЕНИЕ ЛИПИДНОГО ПРОФИЛЯ

Снижение массы
тела



Снижение уровня
Hb A_{1c}

СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ГИПОГЛИКЕМИИ

ГЛЮКАГОН (Glucagon) ГЛЮКАГЕН 1 мг гипокит

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ:

□ ФИЗИОЛОГИЧЕСКИЙ АНТАГОНИСТ ИНСУЛИНА

□ ОКАЗЫВАЕТ ДЕЙСТВИЕ:

- гипергликемическое

- спазмолитическое

□ ↑↑ ГЛИКОГЕНОЛИЗ

□ ↑↑ ГЛЮКОНЕОГЕНЕЗ

□ ↑↑ ВЫСВОБОЖДЕНИЕ КАТЕХОЛАМИНОВ

□ ↑↑ СОКРАТИМОСТЬ МИОКАРДА И ЧСС

СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ГИПОГЛИКЕМИИ

ГЛЮКАГОН
(*Glucagon*)

- Активация глюконеогенеза

- Рц мембран клеток органов-мишеней

- активация аденилатциклазы
- ↑ уровня цАМФ

- стимуляция фосфорилазы (расщепляет гликоген до гл-1-фосфат)

- Угнетение гликогенсинтетазы (усиление гликогенолиза)

**ГИПЕРГЛИКЕМИЧЕСКОЕ
ДЕЙСТВИЕ**

СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ГИПОГЛИКЕМИИ

**ГЛЮКАГОН
(Glucagon)**

**Активация
глюкагоновых рц II типа**

■ ↑↑ % инозитолтрифосфата в
клетке

■ ↓↓ % Ca^{2+} в клетке

**СПАЗМОЛИТИЧЕСКОЕ
ДЕЙСТВИЕ**

СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ГИПОГЛИКЕМИИ

ГЛЮКАГОН (Glucagon) ГЛЮКАГЕН 1 мг гипокит

**Стимулирует
выброс
катехоламинов**

• + инотропное
действие

• + хронотропное действие

ПОКАЗАНИЯ:

- ✓ **Гипогликемия**
- ✓ **Гипогликемическая кома**
- ✓ **Отравление БАБ, БКК**
- ✓ **Обструкция пищевода инородными телами**

СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ГИПОГЛИКЕМИИ

ГЛЮКАГОН (Glucagon) ГЛЮКАГЕН 1 мг гипокит

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ:

- **Гиперчувствительность**
- **Феохромоцитома**
- **Инсулинома**
- **Сахарный диабет**

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

- Кальцитонин (Кальцитрин, Миакальцик, Сибакальцин)
- Паратиреоидин
- Терипаратид (Форстео)
- Дигидротахистерол (Тахистин)

Гормоны, регулирующие фосфорно-кальциевый обмен

Ca²⁺

PTH

Ингибирование остеобластов и активация ремоделирования
Усиление реабсорбции Ca в почках
Активация образования кальцитриола и увеличение реабсорбции Ca и фосфатов в кишечнике

Кальцитонин

Ингибирование остеокластов и снижение ремоделирования
Усиление транспорта Ca и фосфатов в кость
Угнетение COX1/2 и биосинтеза арахидонатов

Фармакологические препараты:

PTH – в настоящее время клинического применения практически нет

Кальцитонин – миакальцик, кальцитрин, сибакальцин и др.

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

КАЛЬЦИТОНИН

- **ПЕПТИДНЫЙ ГОРМОН**
- **ВЫРАБАТЫВАЕТСЯ ПАРАФОЛЛИКУЛЯРНЫМИ КЛЕТКАМИ ЩИТОВИДНОЙ ЖЕЛЕЗЫ**
- **ЯВЛЯЕТСЯ АНТАГОНИСТОМ ПАРАТИРЕОИДНОГО ГОРМОНА**
- **УЧАСТВУЕТ В РЕГУЛЯЦИИ ОБМЕНА КАЛЬЦИЯ В ОРГАНИЗМЕ**

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

**ОСНОВНОЙ ЭФФЕКТ КАЛЬЦИТОНИНА -
ТОРМОЖЕНИЕ РЕЗОРБЦИИ КОСТИ ЗА СЧЕТ:**

- ▣ ПЕРВИЧНОГО УГНЕТЕНИЯ АКТИВНОСТИ
ОСТЕОКЛАСТОВ**
- ▣ ↓ КОЛ-ВА ОСТЕОКЛАСТОВ**
- ▣ ↑ АКТИВНОСТИ ОСТЕОБЛАСТОВ**
- ▣ ↑ ПЕРЕХОДА Ca^{2+} И ФОСФАТОВ ИЗ КРОВИ В
КОСТНУЮ ТКАНЬ**
- ▣ ↓ СОДЕРЖАНИЕ Ca^{2+} В КРОВИ**

ПОКАЗАНИЯ

- ❑ **Болезнь Педжета** (деформация бедренных и большеберцовых костей, позвоночника и черепа с выраженным гиперостозом, утолщением и искривлением костей)
- ❑ **Злокачественный остеолиз** (спонтанное прогрессирующее рассасывание одной или нескольких костей)
- ❑ **Остеопороз (климактерический, стероидный и т.д.)**
- ❑ **Гипервитаминоз Д**
- ❑ **Асептический некроз головки бедренной кости**
- ❑ **Травматический и лучевой остеомиелит**
- ❑ **Зональная патологическая перестройка костей у спортсменов**
- ❑ **Пародонтоз**

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

Под влиянием кальцитонина происходит:

- ✓ замедление резорбции костной ткани
- ✓ улучшается субъективное состояние больных
- ✓ ослабевают или исчезают боли

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Аллергические реакции
- Гиперемия лица
- Артралгии
- Отеки
- Неприятный привкус во рту

При парентеральном введении:

- Диарея, тошнота, рвота
- Гриппоподобные симптомы
- Расстройства зрения
- Полиурия

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

При интраназальном введении:

- Ринит
- Эрозии
- Сухость и/ или отек слизистой оболочки носа
- Чиханье
- Синусит
- Носовое кровотечение

КАЛЬЦИТОНИН

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Гиперчувствительность
- Гипокальциемия
- Беременность, лактация
- Детский возраст

ПЕРЕДОЗИРОВКА

проявляется признаками гипокальциемии:

- ✓ парестезии
- ✓ мышечные подергивания и др.

ЛЕЧЕНИЕ:

- ✓ парентеральное введение кальция глюконата

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

ТЕРИПАРАТИД (ФОРСТЕО)

- АНАЛОГ ПАРАТИРЕОИДНОГО ГОРМОНА
- РЕГУЛИРУЕТ Ca^{2+} И ФОСФОРНЫЙ МЕТАБОЛИЗМ В КОСТНОЙ ТКАНИ И ПОЧКАХ
- ПОВЫШАЕТ АКТИВНОСТЬ ОСТЕОБЛАСТОВ
- СТИМУЛИРУЕТ ОБРАЗОВАНИЕ НОВОЙ КОСТНОЙ ТКАНИ

*Снижает риск возникновения новых
переломов на 65%*

□ Действие

- Является активным фрагментом эндогенного человеческого паратгормона
- Представляет собой последовательность из 84 аминокислотных остатков
- Связывается с рецепторами паратгормона и оказывает такое же действие на костную ткань и почки, как и паратгормон
- Стимулирует формирование костной ткани посредством прямого влияния на остеобласты
- Опосредованно:
 - ↑↑ всасывание Ca^{2+} в кишечнике
 - ↑↑ канальцевую реабсорбцию Ca^{2+} в почках
 - ↑↑ выведение фосфатов почками

□ Действие

- Через 2 ч после введения терипаратида наблюдается кратковременное $\uparrow\uparrow$ % сывороточного Ca^{2+} , которое достигает максимальных значений через 4-6 ч и возвращается к исходному уровню в течение 16-24 ч
- Может наблюдаться транзиторная фосфатурия и незначительное кратковременное $\downarrow\downarrow$ % фосфора в сыворотке крови

□ *Действие*

- Ежедневное 1кр введение терипаратида стимулирует образование новой костной ткани на трабекулярной и кортикальной (периостальной и/или эндостальной) поверхностях костей с преимущественной стимуляцией активности остеобластов
- Процессы минерализации происходят без признаков токсического действия на клетки костной ткани, а сформированная костная ткань имеет нормальное строение (без образования ретикулофиброзной костной ткани и фиброза костного мозга)

ТЕРИПАРАТИД

На фоне лечения **терипаратидом** ↑↑ МПКТ всего тела на 5-10% (в т.ч. поясничного отдела позвоночника, шейки бедренной кости и бедренной кости)

Терипаратид снижает риск развития переломов независимо от возраста, исходного уровня костного метаболизма или величины МПКТ

Применение

П/к в область бедра или живота, 20 мкг 1 раз в день
Максимальная продолжительность лечения - 18 мес

ПОКАЗАНИЯ

□ У ЖЕНЩИН:

- лечение остеопороза в постменопаузальном периоде

□ У МУЖЧИН:

- лечение первичного остеопороза или остеопороза, обусловленного гипогонадизмом

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- Боль в конечностях, мышечные судороги
- Анемия
- Гиперхолестеринемия
- Депрессия, головная боль, головокружение, ишиас
- Одышка, боль в грудной клетке
- Тошнота, рвота
- Тахикардия, снижение АД
- Недержание мочи, полиурия

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ**
- **ПРЕДШЕСТВУЮЩАЯ ГИПЕРКАЛЬЦИЕМИЯ**
- **ТЯЖЕЛАЯ ХПН**
- **МЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ЗАБОЛЕВАНИЯ КОСТЕЙ**
- **ЛУЧЕВАЯ ТЕРАПИЯ КОСТЕЙ СКЕЛЕТА**
- **МЕТАСТАЗЫ В КОСТИ**
- **ОПУХОЛИ КОСТЕЙ В АНАМНЕЗЕ**
- **БЕРЕМЕННОСТЬ, ЛАКТАЦИЯ**

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

***ПАРАТИРЕОИДИН - препарат, получаемый из
околощитовидных желез крупного рогатого
скота***

***Действующим началом является
паратгормон***

ПРЕПАРАТЫ ЩИТОВИДНОЙ И ОКОЛОЩИТОВИДНЫХ ЖЕЛЕЗ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

ПАРАТИРЕОИДИН

ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

- Усиление всасывания кальция в кишечнике***
- Повышение реабсорбции кальция в почках***
- Мобилизация кальция из костей***
- Активация гидроксилазы в почках, которая переводит кальцидиол в кальцитриол – активный гормоноподобный метаболит витамина Д (1,25 – дигидрооксивитамин Д3)***

ПАРАТИРЕОИДИН

ПОКАЗАНИЯ

- ✓ Используют при гипопаратиреозе
 - ✓ Применяют с препаратами кальция
 - ✓ При этом необходимо контролировать уровень кальция в крови

ПРИ ПЕРЕДОЗИРОВКЕ ФОРМИРУЕТСЯ ГИПЕРКАЛЬЦИЕМИЯ:

- общая слабость, вялость
- тошнота, рвота

В ТЯЖЕЛЫХ СЛУЧАЯХ:

- мышечная атония
- летаргия
- кома

ДРУГИЕ ПРЕПАРАТЫ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН

БИСФОСФОНАТЫ

I ПОКОЛЕНИЕ

- ЭТИДРОНОВАЯ К-ТА
- КЛОДРОНОВАЯ К-ТА

II ПОКОЛЕНИЕ

- ПАМИДРОНОВАЯ К-ТА
- АЛЕНДРОНОВАЯ К-ТА

III ПОКОЛЕНИЕ

- ИБАНДРОНОВАЯ К-ТА
- ЗОЛЕДРОНОВАЯ К-ТА

Снижают риск переломов:

- *тел позвонков на 62%*
- *невертебральных переломов – на 69%*

Повышают МПК у 70% больных

БИСФОСФОНАТЫ

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ

- НАРУШАЮТ ФУНКЦИЮ ОСТЕОКЛАСТОВ
- ВЫЗЫВАЮТ АПОПТОЗ ОСТЕОКЛАСТОВ
- НАРУШАЮТ ДИФФЕРЕНЦИРОВКУ ОСТЕОКЛАСТОВ
- В ЗОНЕ РЕЗОРБЦИИ КОСТИ ↑↑ КОЛ-ВО ОСТЕОБЛАСТОВ
- БЛОКИРУЮТ АПОПТОЗ ОСТЕОБЛАСТОВ И ОСТЕОЦИТОВ
- ↑↑ ОБРАЗОВАНИЕ НОВОЙ КОСТИ
- ↑↑ МЕХАНИЧЕСКУЮ ПРОЧНОСТЬ КОСТИ, ТОЛЩИНУ ТРАБЕКУЛ
- УЛУЧШАЮТ МИКРОАРХИТЕКТониКУ КОСТИ
- *ДОЗОЗАВИСИМОЕ ТОРМОЖЕНИЕ КОСТНОЙ РЕЗОРБЦИИ*
- *ПОВЫШЕНИЕ МПК КОСТНОЙ ТКАНИ*

Бисфосфонаты

↓↓ всасывание:

- пища, антациды
- соли Ca^{2+} , Fe^{2+}

Всасывание:

- желудок
- ТОНКИЙ К-К
1 – 10%

20 -50%

Костная
ткань

Не метаболизируются

Выводятся почками

БИСФОСФОНАТЫ

Соли Ca^{2+}
1 -1,5 г/сут

Витамин Д
500 МЕ

ПОВЫШЕНИЕ
ЭФФЕКТИВНОСТИ
ЛЕЧЕНИЯ

ПРИМЕНЕНИЕ

- **АЛЕНДРОНОВАЯ К-ТА** – 70 мг*1 раз/нед или 10 мг/ежедн
- **ИБАНДРОНОВАЯ К-ТА** – 150 мг*1 раз/мес, T/2 – 1 год

БИСФОСФОНАТЫ

ПОКАЗАНИЯ:

- Лечение всех форм остеопороза*
- Терапия гиперкальциемии*
- Остеолитические состояния при злокачественных опухолях и mts в кости*

БИСФОСФОНАТЫ

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ:

▪ ЖКТ:

- ТОШНОТА, РВОТА, ДИСПЕПСИЯ
- АБДОМИНАЛЬНЫЕ БОЛИ
- ИЗЪЯЗВЛЕНИЯ СЛИЗИСТОЙ ПИЩЕВОДА И ЖЕЛУДКА

▪ БОЛИ:

- ГОЛОВНАЯ БОЛЬ
- МЫШЕЧНАЯ БОЛЬ

▪ КОЖНЫЕ АЛЛЕРГИЧЕСКИЕ РЕАКЦИИ

▪ ТРАНЗИТОРНОЕ ↑↑ t ТЕЛА

▪ ПОВРЕЖДЕНИЯ ПОЧЕК – при в/в введении

БИСФОСФОНАТЫ

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **БЕРЕМЕННОСТЬ, ЛАКТАЦИЯ**
- **ВЫРАЖЕННЫЕ НАРУШЕНИЯ ФУНКЦИИ ПОЧЕК**
(КК менее 30 мл/мин)
- **ГИПОКАЛЬЦИЕМИЯ**
- **ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ**

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

- АЛЬФАКАЛЬЦИДОЛ
- КАЛЬЦИПОТРИОЛ
- КАЛЬЦИТРИОЛ
- ХОЛЕКАЛЬЦИФЕРОЛ

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

КЛАССИФИКАЦИЯ

I. ЛС, обладающие умеренной активностью:

- нативный витамин Д₃ (ХОЛЕКАЛЬЦИФЕРОЛ)
- нативный витамин Д₂ (ЭРГОКАЛЬЦИФЕРОЛ)
- аналог витамина Д₂ (ДИГИДРОТАХИСТЕРОЛ)

II. ЛС, обладающие высокой активностью (активные метаболиты витамина Д₃):

- КАЛЬЦИТРИОЛ
- АЛЬФАКАЛЬЦИДОЛ
- КАЛЬЦИПОТРИОЛ

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

**МЕТАБОЛИТ
ВИТАМИНА Д₃**

**ЦП рц Д₃ ядро
ДНК**

**↑↑ транскрипции генов в кл-
мишенях**

СИНТЕЗ СПЕЦИФИЧЕСКИХ БЕЛКОВ:

- К-К: СВЯЗЫВАЮЩИЙ БЕЛОК
- КОСТН. ТКАНЬ: ОСТЕОКАЛЬЦИН,
ОСТЕОПОНТИН + СИНТЕЗ НЕСПЕЦ. БЕЛКОВ
(ЩФ, КОЛЛАГЕН И ДР.)

**РЕГУЛИРУЮЩЕЕ ВЛИЯНИЕ ВИТАМИНА Д₃ НА
ФОСФОРНО-КАЛЬЦИЕВЫЙ ОБМЕН**

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ:

- ↑↑ всасывание Ca^{2+} в кишечнике
- ↑↑ реабсорбцию Ca^{2+} в почках
- ↑↑ % Ca^{2+} в крови
- способствуют образованию костной ткани
- изменяют секрецию паратгормона и ТТГ
- ↑↑ синтез ИЛ-1
- ↓↓ образование γ -глобулина и ИЛ-2
- ↑↑ нервно-мышечную проводимость, сократимость, координацию
- ↓↓ боли при остеохондрозе

ФАРМАКОКИНЕТИКА

Витамин Д

Регуляция: СТГ, ПТГ

Печень

кальцидиол

Почки

кальцитриол

Патология печени,
почек

Нарушение
образования активных
форм вит. Д3

Использование активных метаболитов вит. Д3

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ РЕАКЦИИ

- **ГИПЕРКАЛЬЦИЕМИЯ**
- **ГИПЕРФОСФАТЕМИЯ**
- слабость, сонливость, недомогание
- головная боль
- тахикардия
- боли в эпигастрии, сухость во рту, тошнота
- запоры, диарея
- боли в мышцах, суставах
- редко: ↑↑АЛТ, ↑↑ АСТ, ↑↑АПВП

ПРЕПАРАТЫ ВИТАМИНА Д₃

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- **ГИПЕРКАЛЬЦИЕМИЯ**
- **ГИПЕРФОСФАТЕМИЯ**
- **ГИПЕРМАГНИЕМИЯ**
- **ГИПЕРЧУВСТВИТЕЛЬНОСТЬ**