

***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 (холестаза), 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 (ИАНА-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

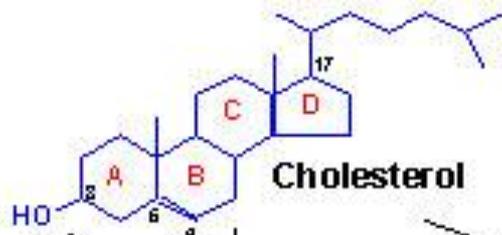
ГЛЮКОКОРТИКОИДЫ

- 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

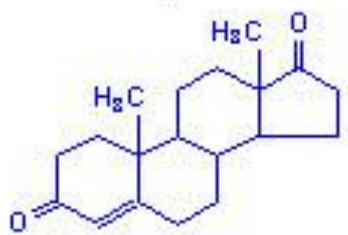
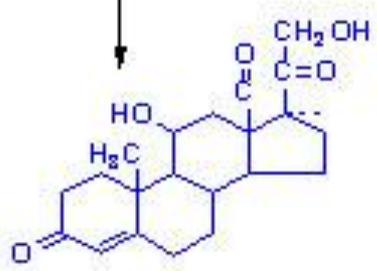
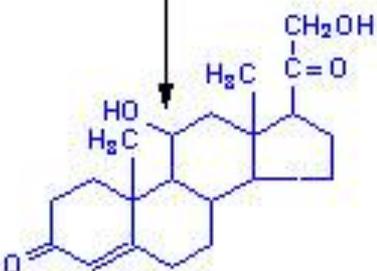
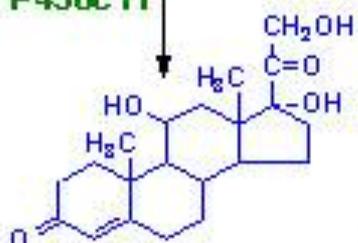
3 β -DH
 Δ^{14} -isomerase

Sulfotransferase

DHEA-S

11-deoxycortisol

P450c11



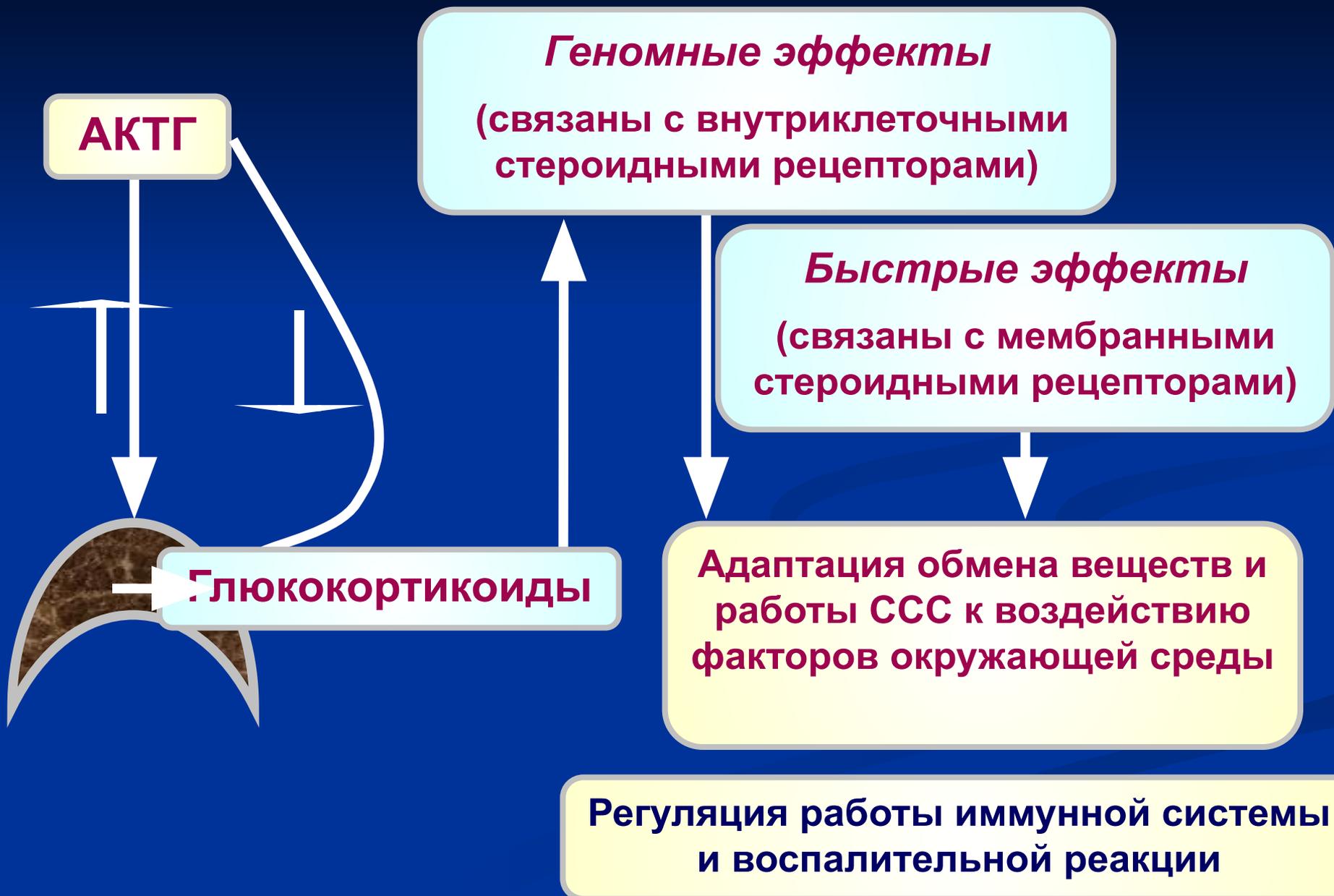
Cortisol

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

Иммуносупрессивная

Противоаллергическая

Противошоковая
терапия

Противовоспалительная

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

□ ПРЕДНИЗОН :

- в 4 раза активнее гидрокортизона

□ МЕТИЛПРЕДНИЗОН :

- 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
- ДИФфуЗНЫЙ ТОКСИЧЕСКИЙ ЗОБ
- ДИФфуЗНЫЙ 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)**

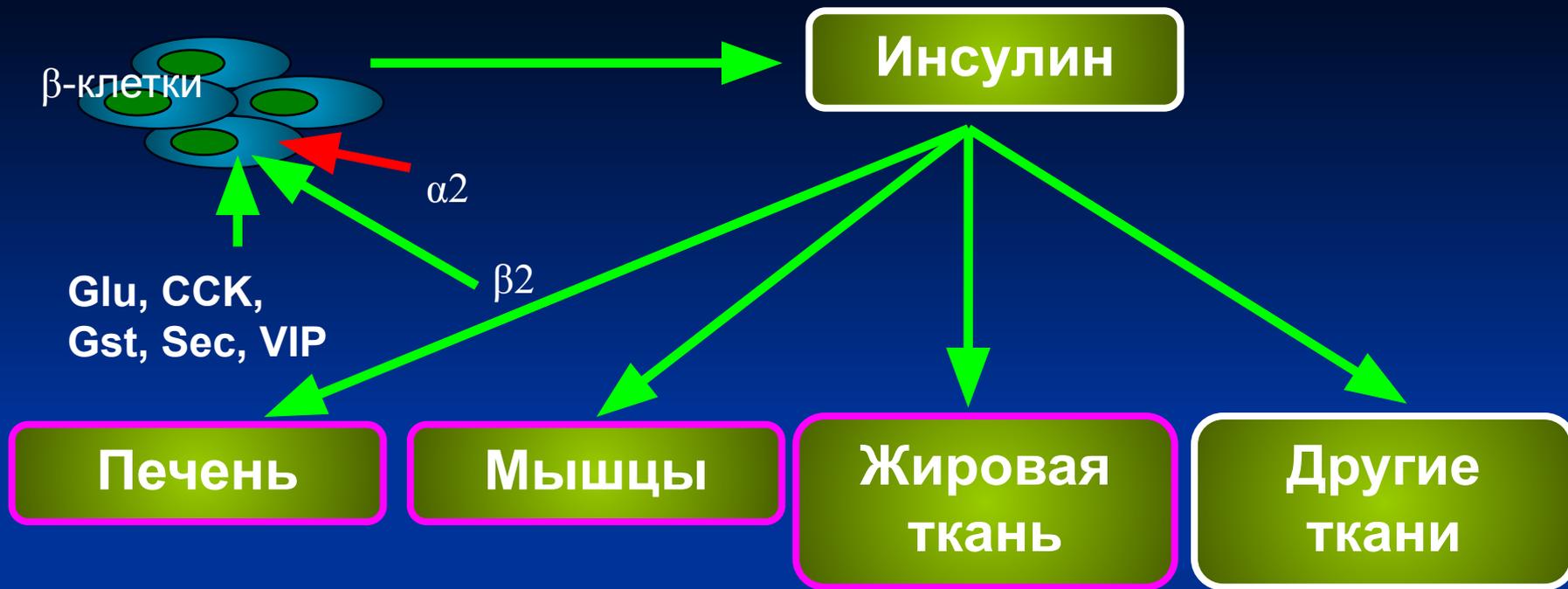
■ **начало – ч/з 30 мин – 1 ч**

■ **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

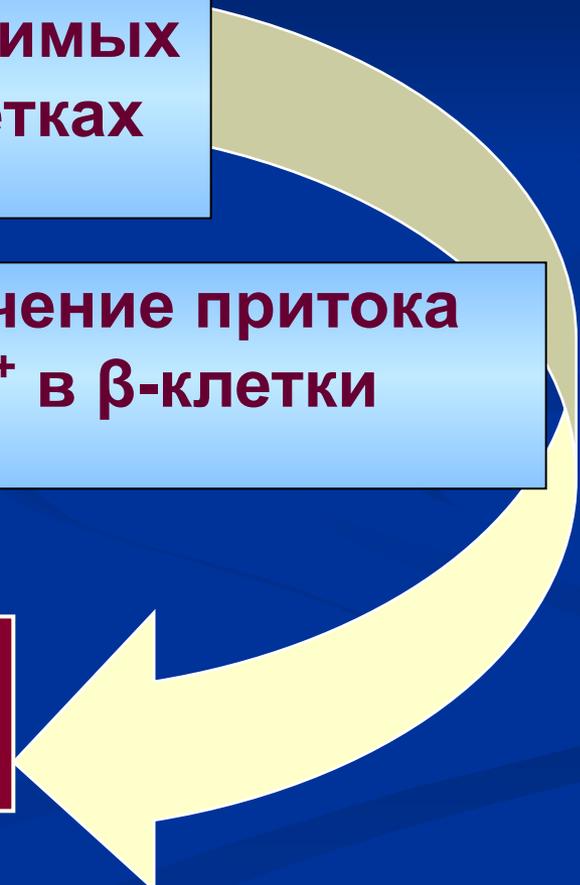
**ПРИ ↓ ФУНКЦИОНАЛЬНОЙ АКТИВНОСТИ β -
КЛЕТОК (ПРИ ДЕФИЦИТЕ ИНСУЛИНА) ЭТИ
ПРЕПАРАТЫ НЕЭФФЕКТИВНЫ**

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
СУЛЬФОНИЛМОЧЕВИНЫМИ 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 СЕНСАЙЗЕРЫ ТИАЗОЛИДИНДИОНЫ

- ПИОГЛИТАЗОН (АКТОС)
- РОСИГЛИТАЗОН (АВАНДИЯ)

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ:

- ✓ СЕЛЕКТИВНО СТИМУЛИРУЮТ ЯДЕРНЫЕ $PRAR$ γ -РЦ, КОТОРЫЕ РЕГУЛИРУЮТ ТРАНСКРИПЦИЮ ГЕНОВ

МОДУЛЯЦИЯ ТРАНСКРИПЦИИ ГЕНОВ, ОТВЕЧАЮЩИХ ЗА МЕТАБОЛИЗМ:

- УГЛЕВОДОВ
- ЖИРОВ

- $\downarrow\downarrow$ ИНСУЛИНОРЕЗИСТЕНТНОСТЬ, НО
- МАЛО $\downarrow\downarrow$ ГЛЮКОНЕОГЕНЕЗ В ПЕЧЕНИ
- $\uparrow\uparrow$ 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

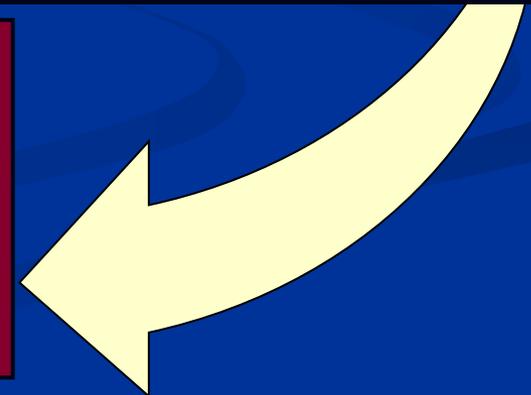
• НЕ ↑↑ СЕКРЕЦИЮ ИНСУЛИНА

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 ОТМЕМЫ – 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 ↑↑ % 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 ↓↓ % 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 D₃

- 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**