

УДК 615.03  
ББК 52.8я2  
А60

Во внутреннем оформлении использованы иллюстрации:  
Ph-HY, Alila Medical Media, Art of Science, TimeLineArtist, IM Vector Studio,  
medicalstocks, Blamb, Sakurra, Teeradej, VectorMine, cono0430, Designua, Ali DM,  
Olha Pohrebnyak, aipicte / Shutterstock / FOTODOM  
Используется по лицензии от Shutterstock / FOTODOM

**Аляутдин, Ренад Николаевич.**  
А60 Фармакология может быть доступной : иллюстрированное пособие для  
врачей и тех, кто хочет ими стать / Ренад Аляутдин. — Москва : Эксмо,  
2024. — 368 с. : ил. — (Настольный медицинский справочник).

ISBN 978-5-04-175359-7

В книге представлена информация по всем разделам общей и частной фармакологии. Описаны препараты, включенные в учебную программу по фармакологии, а также даны сведения о новейших лекарствах и установленных в настоящее время механизмах их действия.

УДК 615.03  
ББК 52.8я2

ISBN 978-5-04-175359-7

© Аляутдинов Р.Н., текст, 2024  
© ООО «Издательство «Эксмо», 2024

# Содержание

---

---

<b>ВВЕДЕНИЕ.....</b>	<b>7</b>
<b>ОБЩАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ.....</b>	<b>15</b>
ФАРМАКОКИНЕТИКА.....	17
Механизмы всасывания ЛС.....	17
Дозы лекарственных веществ.....	32
Повторное введение лекарственных веществ.....	33
ФАРМАКОДИНАМИКА.....	36
Типы мишеней для ЛС.....	43
Рецепторы.....	44
Ферменты как мишень для ЛС.....	48
Транспортные системы как мишень ЛС.....	49
НАЗНАЧЕНИЕ И ДОЗИРОВАНИЕ ЛС.....	50
Побочное действие ЛС.....	51
<b>ЧАСТНАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ.....</b>	<b>53</b>
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА НЕРВНУЮ СИСТЕМУ (НЕЙРОТРОПНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА).....	55
Лекарственные средства, влияющие на вегетативную нервную систему.....	56
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, РЕГУЛИРУЮЩИЕ ФУНКЦИИ ПАРАСИМПАТИЧЕСКОЙ НЕРВНОЙ СИСТЕМЫ.....	59
М-холиномиметики.....	61
Н-холиномиметики.....	63
М, Н-холиномиметики.....	63
Антихолинэстеразные средства.....	63
ЛС, УГНЕТАЮЩИЕ ХОЛИНЕРГИЧЕСКУЮ ПЕРЕДАЧУ.....	67
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, РЕГУЛИРУЮЩИЕ ФУНКЦИИ СИМПАТИЧЕСКОЙ НЕРВНОЙ СИСТЕМЫ.....	72
Адреномиметики, симпатомиметики.....	72
Адреноблокаторы, симпатолитики.....	72
Адреномиметики.....	74

## СОДЕРЖАНИЕ

---

Адреноблокаторы .....	78
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, УСТРАНЯЮЩИЕ БОЛЕВОЙ СИНДРОМ .....	81
МЕСТНЫЕ АНЕСТЕТИКИ .....	83
ОБЩИЕ АНЕСТЕТИКИ (СРЕДСТВА ДЛЯ НАРКОЗА) .....	89
АНАЛЬГЕЗИРУЮЩИЕ СРЕДСТВА (АНАЛЬГЕТИКИ) .....	94
Опиоидные (наркотические) анальгетики .....	96
Неопиоидные анальгетики центрального действия.....	102
СНОТВОРНЫЕ СРЕДСТВА .....	104
Бензодиазепины .....	105
Небензодиазепиновые агонисты ВZ-сайта.....	108
Барбитураты и ЛП других фармакологических групп .....	109
ПРОТИВОЭПИЛЕПТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА.....	112
ПРОТИВОПАРКИНСОНИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА .....	120
АНКСИОЛИТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА .....	126
АНТИДЕПРЕССАНТЫ.....	129
АНТИПСИХОТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА (НЕЙРОЛЕПТИКИ).....	135
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ОРГАНЫ ДЫХАНИЯ.....	140
Противокашлевые средства .....	140
Отхаркивающие и муколитические средства .....	142
Средства для лечения бронхиальной астмы.....	145
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА СЕРДЕЧНО-СОСУДИСТУЮ СИСТЕМУ .....	157
АНТИГИПЕРТЕНЗИВНЫЕ СРЕДСТВА.....	157
ЛС, снижающие активность ренин-ангиотензин- альдостероновой системы .....	159
Ингибиторы ангиотензинпревращающего фермента.....	160
Блокаторы ангиотензиновых рецепторов .....	162
Тиазидные диуретики .....	164
Блокаторы кальциевых каналов .....	166
Бета-адреноблокаторы .....	168
Антигипертензивные средства разных фармакологических групп .....	170
СРЕДСТВА, ПРИМЕНЯЕМЫЕ ПРИ ИШЕМИЧЕСКОЙ БОЛЕЗНИ СЕРДЦА .....	174

## СОДЕРЖАНИЕ

---

АНТИАРИТМИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА.....	181
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ СЕРДЕЧНОЙ НЕДОСТАТОЧНОСТИ.....	195
Лекарственные средства, применяемые при сердечной недостаточности .....	195
ДИУРЕТИКИ .....	201
ГИПОЛИПИДЕМИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА .....	206
Принципы гиполипидемической терапии .....	208
СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА СИСТЕМУ КРОВИ .....	213
Антиагреганты.....	213
Антикоагулянты.....	219
ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ЖЕЛУДОЧНО-КИШЕЧНЫЙ ТРАКТ.....	223
Противорвотные средства.....	223
Лекарственные средства, применяемые при язве желудка .....	225
Слабительные средства.....	232
Антидиарейные средства .....	236
СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ТОНУС И РИТМИЧЕСКИЕ СОКРАЩЕНИЯ МАТКИ.....	238
Средства, снижающие тонус матки (токолитические средства) ...	241
Средства, повышающие тонус матки (утеротонические средства) .....	243
ФАРМАКОЛОГИЯ ГОРМОНАЛЬНЫХ ПРЕПАРАТОВ И ИХ АНТАГОНИСТОВ.....	245
Лекарственные средства при нарушениях функции щитовидной железы.....	245
Лекарственные средства, применяемые для лечения сахарного диабета .....	251
Гормональные средства стероидной структуры .....	260
Половые гормоны.....	271
ПРОТИВОВОСПАЛИТЕЛЬНЫЕ СРЕДСТВА .....	277
Нестероидные противовоспалительные средства .....	280
Противоподагрические средства.....	286
ИММУНОДЕПРЕССИВНЫЕ СРЕДСТВА (ИММУНОДЕПРЕССАНТЫ).....	288
ХИМИОТЕРАПЕВТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА .....	291
Принципы химиотерапии инфекционных заболеваний .....	291
АНТИБИОТИКИ.....	293

## СОДЕРЖАНИЕ

---

Ингибиторы синтеза клеточной стенки.....	295
Пенициллины.....	296
Цефалоспорины.....	297
Карбапенемы — имипенем, меропенем .....	298
Ингибиторы синтеза муреинового мономера (фосфомицин) .....	299
Гликопептиды.....	299
Ингибиторы синтеза белков .....	299
Макролиды .....	300
Линкозамиды.....	301
Тетрациклины.....	301
Аминогликозиды.....	302
Антибиотики, нарушающие целостность клеточной мембраны...	303
Антибиотики, нарушающие синтез нуклеиновых кислот.....	304
Побочные эффекты антибиотиков.....	308
Устойчивость к антибактериальным препаратам .....	310
СИНТЕТИЧЕСКИЕ	
АНТИБАКТЕРИАЛЬНЫЕ ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА.....	311
АНТИПРОТОЗОЙНЫЕ СРЕДСТВА .....	315
Противомалярийные средства.....	316
ЛС для лечения других протозойных заболеваний.....	318
ПРОТИВОГРИБКОВЫЕ СРЕДСТВА.....	321
АНТИГЕЛЬМИНТНЫЕ СРЕДСТВА .....	327
ПРОТИВОВИРУСНЫЕ СРЕДСТВА.....	333
Лекарственные средства, действующие на адсорбцию вириона.....	334
Лекарственные средства, угнетающие проникновение вириона.....	335
Лекарственные средства, действующие на депротенинизацию.....	335
Лекарственные средства, нарушающие экспрессию и репликацию вирусного генома .....	335
Блокаторы вирусной протеазы .....	337
Лекарственные средства, нарушающие сборку и выход вирионов.....	337
Лекарственные средства для лечения COVID-19 .....	338
ПРОТИВООПУХОЛЕВЫЕ СРЕДСТВА.....	341
Основные химиотерапевтические средства .....	343
<b>АЛФАВИТНЫЙ УКАЗАТЕЛЬ .....</b>	<b>348</b>

# Введение

---

*При анализе зубных камней неандертальцев, живших в пещере Эль-Сидрон 50000 лет назад, выяснилось, что их диета включала тысячелистник и ромашку, горькие на вкус растения с небольшой питательной ценностью. По итогам более раннего исследования той же группы было определено, что у неандертальцев в Эль-Сидроне был ген вкуса горьких веществ. Неандертальцы сочли бы эти растения горькими, поэтому вполне вероятно, что эти травы были выбраны по причинам, отличным от вкуса. Невозможно точно сказать, с какой целью неандертальцы ели побеги тысячелистника и ромашки, но сегодня люди используют их как лекарственные растения.*

Фармакология — это фундаментальная наука, которая вышла на передний план современной медицины за счет грандиозных успехов и достижений XX–XXI века в области сохранения здоровья и спасения жизней людей. Фармакология изучает лекарственные средства (ЛС) и их влияние на жизненные процессы. ЛС — это вещества или их комбинации, которые применяют для лечения, диагностики и профилактики заболеваний. К ЛС относятся фармацевтические субстанции и лекарственные препараты.

Время возникновения фармакологии как науки во многом зависит от точки зрения самого читателя. ЛС, созданные на основе растений, тканей животных, минералов, описаны в древнем Египте, Китае, Центральной Азии в 2000-х годах до нашей эры. Хорошо известен вклад в развитие лекарственной терапии Гиппократ, Цельса,

Авиценны. Тем не менее существует мнение, что фармакология — наука очень молодая, существующая менее 150 лет, и она появилась благодаря возможности выделять чистые соединения и использовать научные методы исследований. Ниже приведены некоторые важнейшие вехи в развитии фармакологии и имена великих ученых, совершивших эти открытия.

Таблица 1. Развитие фармакологии с течением времени

<b>Веха, событие в развитии фармакологии</b>	<b>Год</b>	<b>Автор открытия</b>	<b>Примечание</b>
Создание токсикологии как науки	1493-1541	Парацельс (Филипп Ауреол Теофраст Бомбаст фон Гогенхайм)	Парацельс емко охарактеризовал суть фармакологии и токсикологии: <i>allein die Dosis macht, dass ein Ding kein Gift ist</i> (Доза определяет яд)
Синтез нитроглицерина. Создание первого эффективного ЛС для лечения стенокардии	1846-1858	Асканьо Собrero Альфред Филд	А. Собrero, создатель нитроглицерина, не видел практического применения для своего изобретения, так как это вещество было взрывоопасным и вызывало головную боль. Однако А. Нобель создал на основе нитроглицерина динамит, а доктор Филд с успехом применил его у 68-летней пациентки со стенокардией. А. Нобелю в пожилом возрасте также был прописан нитроглицерин, но он не верил в его эффективность и считал это шарлатанством
Начало эры общей анестезии в хирургии. Успешное применение диэтилового эфира для наркоза	1846	Уильям Мортон	Проведение первой хирургической операции под эфирным наркозом. Через год были успешно использованы в хирургии и стоматологии закись азота и хлороформ
Открытие и выделение инсулина, первого и главного ЛС для лечения сахарного диабета	1923	Фредерик Бантинг Чарлз Бест Джон Маклеод	Доктор Ф. Бантинг эксперименты по выделению инсулина проводил со студентом Чарлзом Бестом. Они вместе вводили себе полученный инсулин. Однако студента не включили в число нобелевских лауреатов

## ВВЕДЕНИЕ

Веха, событие в развитии фармакологии	Год	Автор открытия	Примечание
Открытие пенициллина	1929	Александр Флеминг	Иногда открытие пенициллина Флемингом называют случайностью, произошедшей благодаря его неорганизованности. Это не так. В 1922 году А. Флеминг открыл антибактериальные свойства лизоцима, фермента, содержащегося во многих тканях
Создание первого противоопухолевого препарата	1942	Луис Гудман Альфред Гилман	Прообразом для создания первого противоопухолевого препарата был отравляющий газ иприт. На его основе был синтезирован цитостатик циклофосамид
Начало эры психотропных средств	1952	Анри Лобари Фрэнк Айд	А. Лобари использовал в своей практике анестезиолога новый препарат хлорпромазин и заметил у него необычные свойства. В своей статье Лобари советовал коллегам исследовать этот препарат по новым показаниям. Психиатр Ф. Айд применил хлорпромазин для лечения психоза у пациента с шизофренией и получил блестящий результат
Создание бета-адреноблокаторов	1964	Джеймс Блек	Пропранолол, бета-блокатор, используемый и в настоящее время, был создан после серии неудач благодаря упорству исследователей

**Наименования ЛП.** Лекарственные средства имеют несколько типов наименований. Как правило, это **международное непатентованное наименование (МНН)**, торговое наименование и химическое наименование. МНН ЛС — уникальное наименование фармацевтической субстанции, рекомендованное Всемирной организацией здравоохранения (ВОЗ). Будучи уникальными именами, МНН должны различаться по звучанию и написанию и их нельзя путать с другими общеупотребительными именами (в качестве примера приведу МНН ЛП амоксициллин). Важная особенность системы МНН заключается в том, что названия фармакологически родственных веществ демонстрируют свое родство с использованием общей «основы» в наименовании. Так, например, ЛП группы



пенициллина имеют в конце наименования сочетание «-циллин» (амоксициллин, ампициллин, оксациллин); блокаторы ангиотензиновых рецепторов — «-сартан» (валсартан, телмисартан).

**Торговое наименование ЛС** — наименование лекарственного средства, присвоенное его разработчиком (одно из торговых наименований амоксициллина — амоксил).

**Химическое наименование ЛС** — название, которое присваивается в соответствии с требованиями Международного союза по чистой и прикладной химии (IUPAC); химическое наименование амоксициллина [2S[2альфа5альфа,6бета(S\*)]]-6-[[Амино-(4гидроксифенил) ацетил] амино]-3,3-диметил-7-оксо-4-тиа-1-азабицикол [3.2.0] гептан-2карбоновая кислота.

**Создание лекарственных средств.** Источниками получения ЛС являются лекарственные растения (так получают морфин, сердечные гликозиды, атропин), ткани и органы животных (ферментные препараты панкреатин, гидролизат белков мозга церебролизин), продукты жизнедеятельности человека (гонадотропин хорионический получают из мочи беременных женщин), микроорганизмы (антибиотики), генномодифицированные микроорганизмы (продуценты инсулинов, других белковых препаратов), химический синтез низко- и высокомолекулярных соединений.

От идеи создания ЛС до его регистрации проходит около 10 лет. Вначале определяется мишень для ЛС, которую, как правило, открывают патофизиологи или молекулярные биологи. Долгое время для создания экспериментальной молекулы будущего лекарства использовали и до сих пор используют известные эндогенные соединения и на основе их структуры создаются новые лекарственные препараты. Так, например, по аналогии с молекулой гистамина были созданы ангистаминные средства — блокаторы гистаминовых рецепторов. В настоящее время, когда структура многих белков в организме известна, формулу нового лекарства рассчитывают с помощью компьютерных программ (*in silico*): посредством моделирования создается молекула, которая будет взаимодействовать с активными центрами белковой мишени. После завершения химического синтеза начинается доклинический этап исследований на моделях *in vivo*, а сейчас все чаще — на клеточных моделях

*in vitro*, с целью выяснения механизма действия и эффективности. Важное значение имеет оценка безопасности будущего лекарства. После трагедии, связанной с применением талидомида в 1961 году ВОЗ учредила Программу по международному мониторингу за безопасностью ЛС. Талидомидовая трагедия положила начало международному фармакологическому надзору. В период с 1956 по 1961 год ЛС «Талидомид» было разрекламировано как идеальное седативное средство, в том числе для беременных. Это лекарство было разрешено в 56 странах. Однако талидомид обладал способностью вызывать врожденные уродства, то есть обладал так называемым тератогенным действием. В тот период времени родились от 8 до 12 тысяч младенцев с деформациями конечностей. Сейчас установлено, что талидомид является антагонистом эндотелиального фактора роста, стимулирующего рост сосудов. Блокада фактора роста приводила к тому, что наиболее длинные сосудистые ветви, расположенные в конечностях, не формировались, а значит, не формировались и сами конечности. Но тогда об этом никто не знал.

Согласно международным требованиям ЛС до его регистрации исследуют вначале на животных или клеточных моделях *in vitro*. На этом этапе оценивают различные виды токсического действия (тератогенность, эмбрио-, генотоксичность, канцерогенез и т. д.). Затем проводят клинические исследования (КИ) в 3 этапа: 1-я фаза исследования проводится на 20–100 здоровых испытуемых с целью изучения переносимости ЛС, его фармакокинетики, на этой стадии могут быть обнаружены часто возникающие нежелательные реакции. Во второй фазе КИ участвуют несколько сотен пациентов с заболеванием, для лечения которого было создано ЛС. На этом этапе оценивается, эффективно ли новое лекарство. Третья фаза КИ проводится на контингенте, насчитывающем до нескольких тысяч пациентов, с целью определения эффективности ЛС (его пользы) и его безопасности, т. е. способности вызывать нежелательные воздействия (оценка степени риска). В том случае, если соотношение польза/риск оптимально и превышает этот показатель у ранее существовавших средств, новое ЛС получает право на жизнь.

Если ЛП проходит все этапы дорегистрационных клинических исследований, почему в процессе гражданского оборота ЛП возникают новые побочные действия? Дело в том, что

при клиническом дорегистрационном исследовании ЛП на нескольких тысячах пациентов невозможно выявить побочные эффекты, которые встречаются редко, однако могут быть очень опасными (часто это гепатотоксичность, нефротоксичность). В связи с этим исследование безопасности ЛП проводится на протяжении всей его жизни. С этой целью уполномоченные органы страны и производители отслеживают сообщения о нежелательных реакциях на ЛС в научной литературе, социальных сетях, а также предлагают врачам, провизорам, пациентам информировать о таких случаях, заполнив специальное извещение о побочном действии.

### Вопросы

- 1. Кроме термина «ЛС», употребляются термины «фармацевтическая субстанция» и «лекарственный препарат». Как они соотносятся между собой?**

*Фармацевтическая субстанция — это тип лекарственного средства в виде одного или нескольких обладающих фармакологической активностью действующих веществ вне зависимости от природы происхождения, предназначенных для производства, изготовления лекарственных препаратов. Именно фармацевтическая субстанция определяет эффективность ЛС.*

*Лекарственные препараты (ЛП) — это ЛС в виде лекарственных форм — таблеток, капсул, растворов, мазей и т. д.*

- 2. Часто в прессе можно встретить понятия «ЖНВЛП», «орфанные лекарственные препараты». Что это такое?**

*ЖНВЛП — перечень жизненно необходимых и важнейших лекарственных препаратов, утверждаемый Правительством Российской Федерации, обеспечивающих приоритетные потребности здравоохранения.*

*Орфанные лекарственные препараты — это ЛП, предназначенные исключительно для диагностики или патогенетического лечения (лечения, направленного на механизм развития заболевания, но не симптомов) редких (орфанных) заболеваний. Список*

орфанных заболеваний формируется Министерством здравоохранения России.

**3. Какая разница между оригинальным и воспроизведенным ЛП (генериком или дженериком)?**

Оригинальный лекарственный препарат — лекарственный препарат с новым действующим веществом, который зарегистрирован первым в Российской Федерации или в других государствах на основании результатов доклинических исследований лекарственных средств и клинических исследований лекарственных препаратов, подтверждающих его качество, эффективность и безопасность. Оригинальный лекарственный препарат имеет патентную защиту, максимальный срок которой может составлять 20 лет. В течение этого времени ни одна другая компания не может производить или продавать этот ЛП.

Когда оригинальное ЛС теряет эксклюзивность, появляется возможность подать заявку на регистрацию и производство этого ЛС другими производителями. Воспроизведенный ЛП (генерик) имеет эквивалентный оригинальному ЛП качественный и количественный состав действующих веществ в эквивалентной лекарственной форме. Он намного дешевле оригинального, поскольку второму производителю не нужно возмещать затраты на открытие новой молекулы, разработку, доклинические и клинические исследования этого ЛП.



# ОБЩАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ

Общая фармакология изучает основные закономерности взаимодействия организма и ЛС, характерные для всех лекарств, и подразделяется на два основных раздела: фармакокинетику и фармакодинамику.

**Фармакокинетика** изучает факторы, определяющие концентрацию лекарств в жидкостях и тканях организма во времени и включает такие процессы, как всасывание, распределение, метаболизм и выведение лекарств (сокращенно ADME), то есть фармакокинетика — это то, что организм делает с лекарством.

**Фармакодинамика** изучает механизмы действия ЛС, влияние лекарств на рецепторы-мишени и ткани. Если коротко, то фармакодинамика — это то, что лекарство делает с организмом.

