

Психотропные препараты. Нейролептики»



Психотропные препараты – это вещества, которые оказывают влияние на психические функции, эмоциональное состояние и поведение. Они применяются при психических, невротических, неврозоподобных расстройствах и других нарушениях в работе ЦНС, сопровождающихся беспокойством, напряжением, страхом и тревогой.

К психотропным средствам относятся:

- средства, угнетающие функции ЦНС (нейролептики, транквилизаторы, седативные)
- средства, возбуждающие ЦНС (психостимуляторы, антидепрессанты, ноотропные средства)



АНТИПСИХОТРОПНЫЕ СРЕДСТВА (НЕЙРОЛЕПТИКИ)

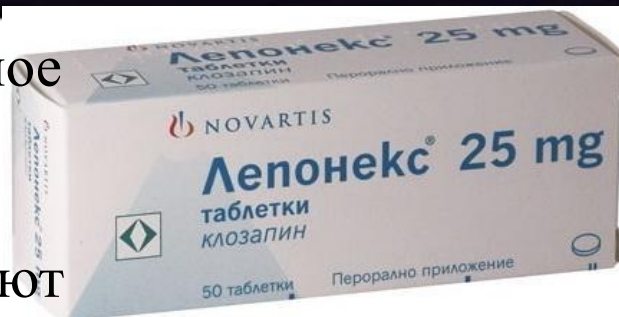
Нейролептики (от греч. *neuro* – жила, волокно, нерв, нейрон; *leptos* – мягкий, нежный, т.е. мягко действующий на нервную систему).

Нейролептики – это психотропные средства, способные на фоне ясного сознания вызывать угнетение эмоционально – волевой и психической активности. В результате у больного возникает особое чувство покоя, ослабевает внутреннее напряжение, уменьшается или исчезает психомоторное возбуждение, наступает заторможенность с характерным безразличием к окружающему и своему заболеванию.

Основной фармакологический эффект всех нейролептиков – **антипсихотический.**



Нейролептики оказывают выраженное угнетающее влияние на нервную и психическую деятельность человека без нарушения сознания. Они обладают транквилизирующим (успокаивающим) и антипсихотическим действиями



Психоз – болезненное расстройство психики, проявляющееся неадекватностью отражения реального мира с нарушением поведения, изменением психической деятельности, возникновением несвойственных нормальной психике явлений.

шизофрении

аффективные нарушения (мании, депрессии)

органические психозы

Галлюцинации – расстройства восприятия в виде ощущений или образов, возникающих без реального раздражителя (для больных – реальность).

Бред – совокупность идей, суждений, не соответствующих действительности, полностью овладевающих сознанием больного и не корректирующиеся при убеждении и разъяснении.



Лимбическая система отвечает за психоэмоциональную активность; лобные доли коры – связь с внешним миром; в общей работе участвует и восходящая часть ретикулярной формации. При психозах нарушается взаимодействие между этими отделами. Причина – нарушение баланса нейромедиаторов. В развитии и поддержании психических нарушений важная роль принадлежит избытку катехоламинов и прежде всего дофамина (ДА), который обеспечивает работу экстрапирамидной системы, контроль эмоциональных реакций, поведение и некоторые интеллектуальные функции.

Механизм действия:

Большинство являются конкурентными антагонистами дофамина в ЦНС.



Фармакологические эффекты:

Оказывают выраженное влияние на ЦНС и периферию.

1. Антипсихотический – способность устранять симптоматику психозов: нарушение восприятия, мышления, общение с внешним миром (бред, галлюцинации, патологически измененное, агрессивное поведение).

Блокада ДА-рецепторов ,в результате происходит снижение эффектов медиатора. Возможно угнетение пресинаптических ДА-рецепторов, в результате снижается высвобождение медиатора и его обратного захвата. Проявляется только у больных.

Сильное антипсихотическое действие: галоперидол, дроперидол, зуклопентиксол, флупентиксол, трифтазин, флуфеназин



2. **Нейролептический** (сильный седативный эффект).

Замедление психической реакции и двигательной активности, снижение инициативы, сонливость, психическая подавленность, снижение настроения. Пониженная реакция на внешние и внутренние раздражители (больные и здоровые). В больших дозах – гипнотический эффект: поверхностный легко прерываемый сон.

Сильное нейролептическое (седативное) действие: аминазин, левомепромазин, алимемазин



3. Центральное противорвотное действие.

Угнетаются ДА-рецепторы триггерной(пусковой) зоны гипоталамуса.

Сильное противорвотное действие: трифтазин, галоперидол, дроперидол, пимозид, флуфеназин.



4. **Потенцирование действия веществ, угнетающих ЦНС** (наркотические, снотворные, анальгетики, противосудорожные и др.)

5. **Гипотензивный эффект**

Центральное α -АБ действие на сосудодвигательный центр и центры гипоталамуса, периферическое – непосредственно на сосуды.

Возможно возникновение рефлекторной тахикардии (аминазин, левомепромазин, хлорпротиксен).

6. **Гипотермический (центральный эффект).**

Повышается теплоотдача и снижается теплообразование. Понижают нормальную температуру тела. Могут использоваться при операциях на сердце (снижение обменных процессов, повышение устойчивости к гипоксии сердца и мозга).

7. Многие вещества могут оказывать **M-холинолитическое действие.**



Применение:

1. Психозы (шизофрения, маниакально-депрессивные, алкогольные, старческие и др.), психомоторные возбуждения (обострение психических заболеваний);
2. Нарушение поведения у детей и взрослых, различные расстройства психики, пограничные состояния (психопатия, агрессивность, повышенная возбудимость);
3. В хирургической практике, для подготовки и проведения операций (потенцирование наркоза, снижение температуры тела);
4. Как противорвотные и противоикотные средства, для лечения заикания.



Побочные эффекты

1. Экстрапирамидные нарушения по типу паркинсонизма и спастичность.

Лечат эти проявления центральными М-холинолитиками (циклодол и др.)

По частоте экстрапирамидных нарушений

Производные бутирофенона > производные фенотиазина > производные тиоксантена > «атипичные» нейролептики (нет этого побочного эффекта)

2. Злокачественный нейролептический синдром – возникает редко, сопровождается подъёмом температуры до 41°C, помутнением сознания вплоть до комы и смертью в течение 3-4 дней. Профилактика ежедневная температурометрией 2 р в день.



3. Со стороны ЖКТ – сухость во рту, запоры, тошнота (М-ХЛ).
нарушения со стороны печени

4. Тахикардия (реже брадикардия), аритмии, снижение АД
вплоть до коллапса.

5. Офтальмологические осложнения (помутнение роговицы
или хрусталика

6. Агранулоцитоз, гемолитическая анемия.

7. Аллергические реакции.

8. Эндокринные нарушения:

а) Повышение количества пролактина за счет
дофаминолитического действия (аменорея у женщин;
гинекомастия у мужчин);

б) Снижение выработки гормонов – АКТГ, СТГ, ТТГ, ГТГ;

в) Снижение выработки половых гормонов – импотенция,
бесплодие.



Классификация нейролептиков по химической структуре:

1. Производные фенотиазина;
2. Производные бутирофенона;
3. Производные тioxантена;
4. Препараты различной химической структуры («атипичные» нейролептики).



1. Производные фенотиазина

АМИНАЗИН (МНН: ХЛОРПРОМАЗИН)

Биодоступность 30% за счет метаболизма при первом прохождении через печень. Длительность действия около 6 часов. Умеренное антипсихотическое действие и выраженный седативный, отчетливый противорвотный эффект.

ПД: раздражение кожи, слизистых, дерматиты, фотосенсибилизация.

ТИЗЕРЦИН (МНН: ЛЕВОМЕПРОМАЗИН)

Более сильное седативное и адrenomолитическое действие, чем у аминазина.

ТЕРАЛИДЖЕН (МНН: АЛИМЕМАЗИН)

Мягкое седативное, противотревожное и антигистаминное действия. Широко применяется детей и пожилых людей.



ТРИФТАЗИН (МНН: ТРИФЛУОПЕРАЗИН)

Высокая антипсихотическая активность, сильное противорвотное д-е; слабое седативное, мало потенцирует эффекты наркотических и снотворных средств.

МОДИТЕН ДЕПО (МНН: ФЛУФЕНАЗИН)

Сильный нейролептик пролонгированного действия. В организме создается депо препарата, из которого активное начало медленно поступает в кровь.

СОНАПАКС (МНН: ТИОРИДАЗИН)

Слабое антипсихотическое и выраженное стимулирующее действие. Антидепрессивное действие.

Показания: психозы, неврозы.

НЕУЛЕПТИЛ (МНН: ПЕРИЦИАЗИН)

умеренная активность, нормализует поведение, тормозит повышенную возбудимость ЦНС, хорошо переносится.



2. Производные бутирофенона мощное антипсихотическое д-е, сильное противорвотное д-е, быстрый лечебный эффект.

Побочные действия: дают частые, разнообразные и сильно выраженные экстрапирамидные нарушения. Мало влияют на другие функции организма.

ГАЛОПЕРИДОЛ (МНН)

Оказывает быстрое и длительное действие, не дает выраженного седативного эффекта, не понижает АД.

ДРОПЕРИДОЛ (МНН)

Оказывает быстрое, но не продолжительное действие (20-30 минут). Седативный, противорвотный, противошоковый эффекты. Понижает АД, устраняет аритмии.

Показания: нейролептаналгезия в сочетании с фентанилом (1 часть фентанила и 50 частей дроперидола); для потенцированного наркоза



3. Производные тиоксантина

ХЛОПРОТИКСЕН (МНН)

Фармакологические эффекты: антипсихотический, седативный, антидепрессивный, нормализует настроение и поведение больных, холинолитическое д-е, противорвотное д-е.

Нет побочного действия на печень и кровь, менее выражены экстрапирамидные нарушения.

Показания: психозы, психо-невротические состояния.

КЛОПИКСОЛ (МНН: ЗУКЛОПЕНТИКСОЛ)

По структуре близок к хлорпротиксену. Оказывает антипсихотическое и седативное д-я.

Показания: начальные формы психозов.

ФЛЮАНКСОЛ (МНН: ФЛУПЕНТИКСОЛ)

Последнее поколение, высокая активность.

Антипсихотическое, антидепрессивное,, анксиолитическое действие.

Форма выпуска: таблетки, ампулы (масляный раствор).



4. Препараты различной химической структуры **(«атипичные» нейролептики)**

Данные препараты редко вызывают экстрапирамидные расстройства, свойственные «классическим» нейролептикам.

АЗАЛЕПТИН, **ЛЕПОНЕКС** (МНН: КЛОЗАПИН)

СЕРОКВЕЛЬ (МНН: КВЕТИАПИН)

Высокая антипсихотическая активность. Экстрапирамидный синдром возникает редко (клозапин) и часто (кветиапин).

Механизм действия: тормозит выделение дофамина в синаптическую щель. Выраженное центральное М-ХЛ и α_1 -АБ.

Побочные эффекты: гипотензия, тахикардия, агранулоцитоз.



ЭГЛОНИЛ (МНН: СУЛЬПИРИД)

ТИАПРИДАЛ (МНН: ТИАПРИД)

Умеренное антипсихотическое, антидепрессивное, стимулирующее и противорвотное д-я. Экстрапирамидный синдром возникает редко (сульпирид) и часто (тиаприд).

Показания: сульпирид – алкогольный абстинентный синдром; тиаприд – лечение героиновой и опишной наркоманий.

РИСПЕРИДОН (МНН)

Высокоактивен, длительное д-е. **Индуктор ф. печени.**

ПД: паркинсонизм; часто снижение АД, тахикардия, АВ-блокада.

САФРИС (МНН: АЗЕНАПИН)

ПД: тревога, сонливость; паркинсонизм; брадикардия,

ЗИПРЕКСА (МНН: ОЛАНЗАПИН)

ПД: сонливость; гипотензия, экстрапирамидные расстройства.



Список использованной литературы:

Фармакология : учебник / Р.Н. Аляутдин, Н.Г.

Преферанский, Н.Г. Преферанская; Под ред. Р.Н. Аляутдина. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2016.

Фармакология: учебник /Н.И.Федюкевич, Э.Д.Рубан-Ростов на/Д: Феникс, 2017.

Справочник «Регистр лекарственных средств России®»
режим доступа: [http:// www.rlsnet.ru](http://www.rlsnet.ru)

