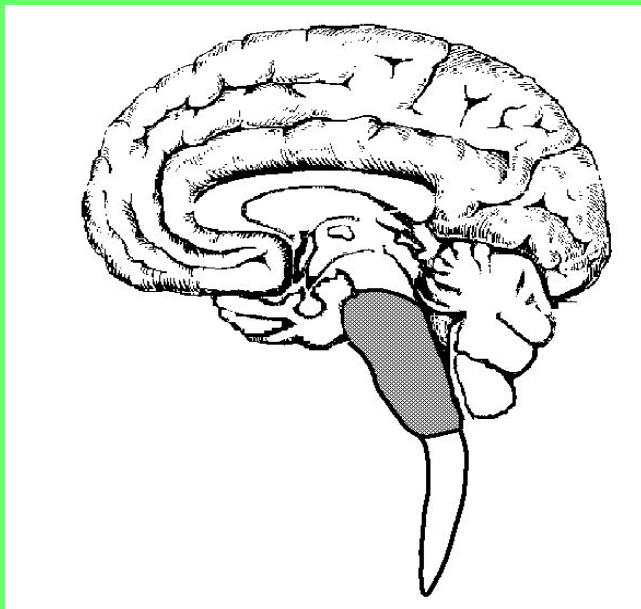


# ПРОТИВОПАРКИНСОНОВЫЕ СРЕДСТВА



Подготовила студентка 3 курса 13 группы  
Семёнова С.А.  
Преподаватель Кириллова А.В.

# ПРОТИВОПАРКИНСОНИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

**ОПРЕДЕЛЕНИЕ** - это лекарственные средства, применяемые для лечения **ЭКСТРАПИРАМИДНЫХ ДВИГАТЕЛЬНЫХ НАРУШЕНИЙ**

- G20 Болезнь Паркинсона
- G21 Вторичный паркинсонизм

**Болезнь Паркинсона** (дрожательный паралич) – заболевание, возникающее при поражении 70% и более базальных дофаминергических ганглиев.

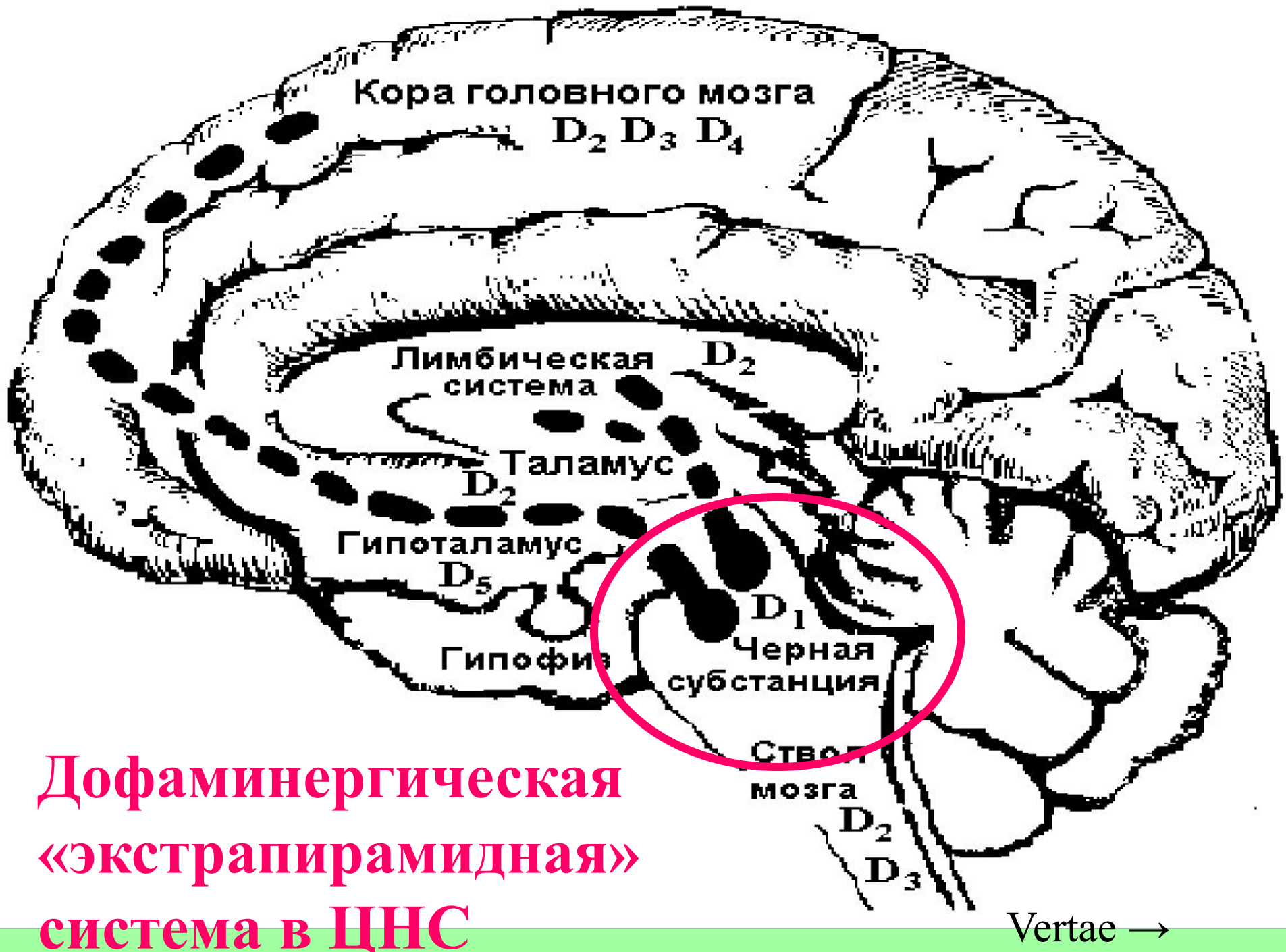
### Проявления заболевания:

**акинезия** (скованностью движений),  
**ригидность** (повышением тонуса мышц),  
**тремор** (дрожанием конечностей).

Паркинсонизм описан английским врачом Джеймсом Паркинсоном в XVIII веке, встречается у 1% населения до 60 лет и у 5% более старшего возраста.

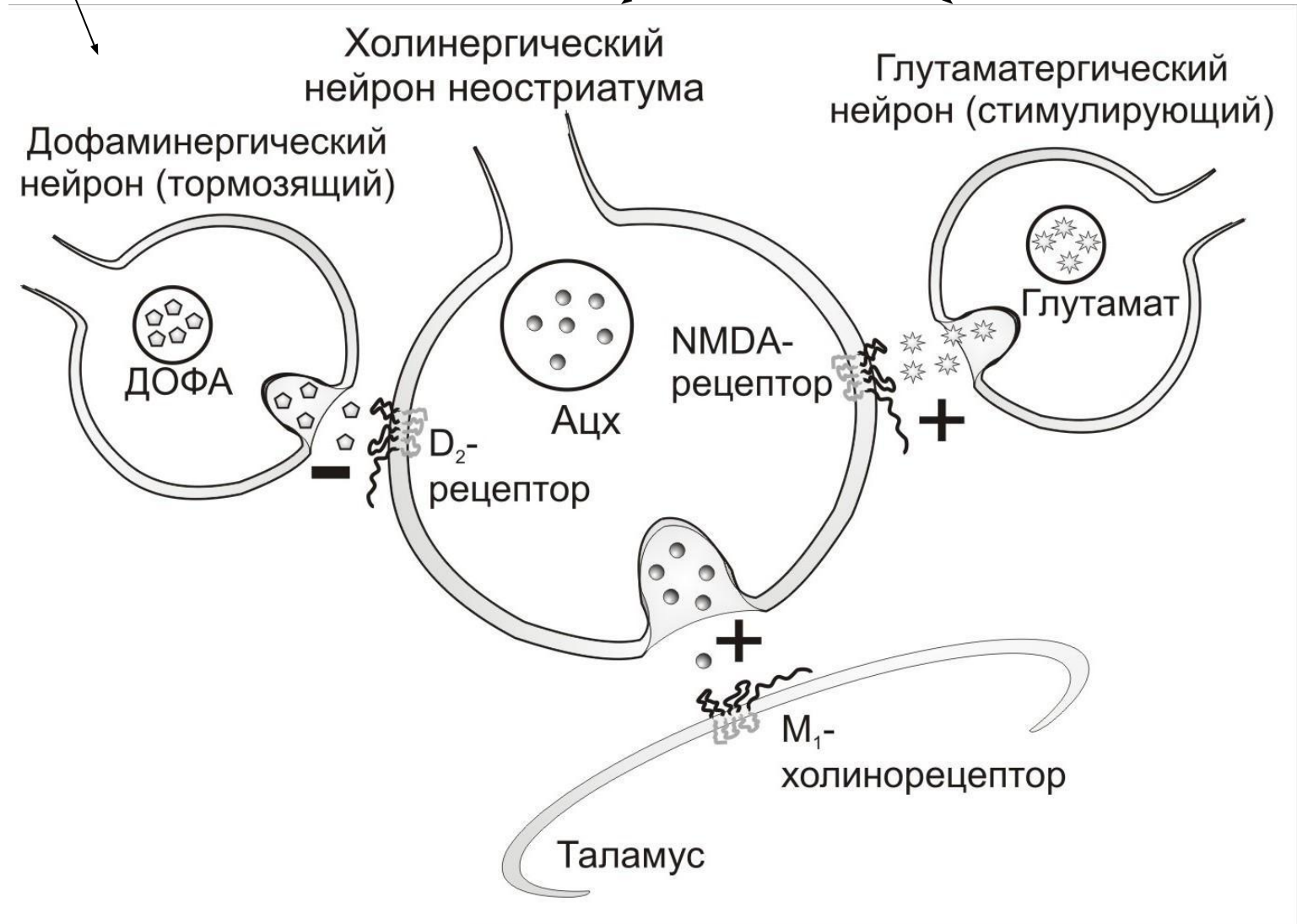
**Причина болезни П.**- аутосомно-доминантное наследование неполноценности ферментативных систем обмена катехоламинов в ЦНС (или свободные радикалы).

**Причина синдрома П.**– инфекции (энцефалит), травмы, НМК, интоксикации (СО, этанол), RW.



Хвостатое ядро  
+ Скорлупа =  
Неостриатум

Черное ядро



# Формы паркинсонизма:

- 1. Дрожательный** ( $\uparrow$  АХ, легкий) – постоянный тремор рук, головы при нормальном тоне мышц и сохранении темпа произвольных движений.
- 2. Ригидно-брадикинетический** ( $\downarrow$  дофамина, тяжелый) - повышение тонуса мышц, скованность произвольных движений вплоть до полной обездвиженности.
- 3. Дрожательно-ригидный** (смешанный) – тремор (4-8 Гц), усиливающийся при волнении, практически исчезающий во сне. К тремору постепенно присоединяется скованность.

**Леводопа** – непосредственный предшественник дофамина, способный проникать в мозг и устранять акинезию.

## **МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ -**

в неповрежденных дофаминергических нейронах:



В меньшей степени уменьшает ригидность, не влияет на тремор.

**ФАРМАКОКИНЕТИКА** - всасывается из ЖКТ за счет активного транспорта, в той же системе доставки (система транспорта аминокислот) через мембраны, что и в головном мозге. Поэтому белки пищи - снижают абсорбцию.

**В стенке кишечника и в печени** Леводопа подвергается интенсивному метаболизму декарбоксилазой ароматических аминокислот, что приводит к превращению в дофамин более 90% введенного препарата.

Образовавшийся в периферических тканях дофамин не проникает в мозг и вызывает ряд побочных эффектов.



# Побочные эффекты (встречаются часто):

- тошнота, рвота
- аритмии
- повышение АД
- тахикардия
- ортостатическая гипотензия
- тревога, двигательное беспокойство.

Значительная часть побочных эффектов связана с периферическим декарбоксилированием L-ДОФА. Применение **накома** и **мадопара** снижает выраженность побочных эффектов и увеличивает противопаркинсоническое действие ДОФА (**карбидопа** и **бенсеразид**, соответственно, не проникают в мозг и блокируют декарбоксилирование ДОФА на периферии).

**Селегилин** - селективный ингибитор МАО-В в ткани мозга. Этот фермент избирательно разрушает дофамин, не действуя на норадреналин и серотонин.

Селегилин, уменьшает разрушение дофамина в нейронах черной субстанции, что позволяет уменьшить дозу Леводопы в среднем на 30%.

**Показания:** тяжелые формы болезни и синдрома Паркинсона (за исключением лекарственного паркинсонизма).

**Побочные эффекты:** тошнота, гипотония, нарушение способности к концентрации внимания и спутанность сознания.

**Бромокриптин** - селективный агонист  $D_2$ -дофаминовых рецепторов.

**ФАРМАКОКИНЕТИКА** - хорошо всасывается (около 65-95%), период полуабсорбции - 20 мин. В результате первого прохождения через печень только 7% дозы поступает в кровь в неизмененном виде.

$T_{1/2}$  - 2-8 ч (50-70 ч для метаболитов).

Выведение - через печень, около 6% - через почки.

**Показания:** тяжелые формы болезни и синдрома Паркинсона, в том числе — лекарственный паркинсонизм.

**Тригексифенидил (циклодол).**

Оказывает центральное холиноблокирующее действие. Преимущественно уменьшает тремор и мышечную ригидность, слабо влияет на акинезию.

**Дифенилтропин, Бипериден** – близкие по свойствам с тригексифенидилом.

**Побочные эффекты** –

**периферические** - нарушения зрения, обострение глаукомы, сухость во рту, сердцебиение, задержка мочеиспускания

**центральные** - нарушения памяти и концентрации внимания, особенно у пожилых пациентов.