

ПСИХОДЕПРИМИРУЮЩИЕ СРЕДСТВА

**Седативные
Анксиолитические (транквилизаторы)
Нейролептики**

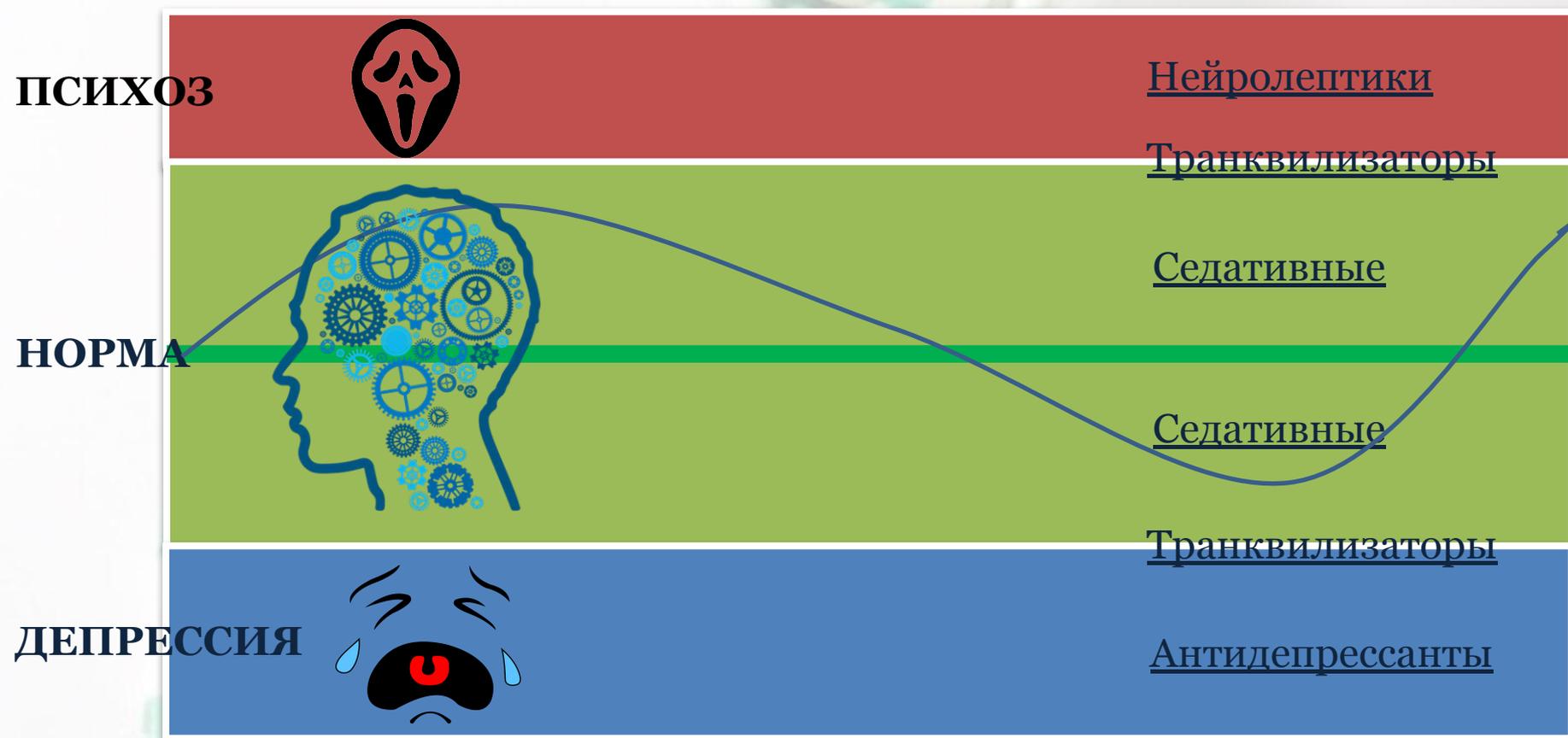
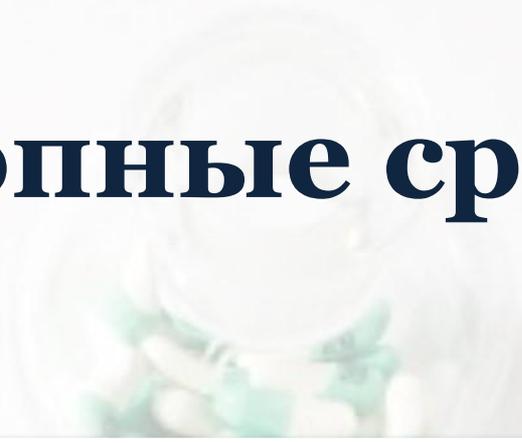


Курс «Фармакология»
Лекция №8

Таблица 3. Клиническая классификация психотропных средств

Классы	Подгруппы	Препараты
Психолептики	С преимущественно седативным действием	Хлорпромазин, левомепромазин, перициазин, хлорпротиксен, промазин и др.
	С мощным антипсихотическим (инцизивным) действием	Тиопроперазин, зуклопентиксол, трифлуоперадол, дроперидол, пипотиазин, галоперидол, трифлуоперазин и др.
	С преимущественно стимулирующим (дезингибирующим) действием	Сульпирид, амисульприд, карбидин, пимозид, метофеназин и др.
	Атипичные антипсихотики	Клозапин, кветиапин, оланзапин, рисперидон, сертиндол.
	Анксиолитики (транквилизаторы)	Бензодиазепины (диазепам, нитразепам, медазепам, феназепам и др.), гидроксизин, буспирон и др.
Психоаналептики	С преимущественно седативным действием	Тримипрамин, амитриптилин, доксепин, тразодон, миансерин, мirtазапин, флувоксамин и др.
	Сбалансированного действия	Мапротилин, досулепин, пиразидол, кломипрамин, сертралин, пароксетин, циталопрам и др.
	С преимущественно стимулирующим действием	Ингибиторы MAO (ниаламид, моклобемид и др.), ребоксетин, флуоксетин, дезипрамин, милнаципрам, имипрамин и др.
	Психостимуляторы (психотоники)	Амфетамины (фенамин и др.), сиднонимины (сиднофен, мезокарб), меридил, метилфенидат, кофеин и др.
	Нейрометаболические стимуляторы (ноотропы)	С седативными свойствами С психостимулирующими свойствами
Психодизлептики		Амид лизергиновой кислоты, псилоцибин, мескалин и др.
Тимоизолептики (нормотимики)		Соли лития, соли вальпроевой кислоты, карбамазепин, ламотриджин, топирамат, блокаторы кальциевых каналов.

Психотропные средства



Седативные средства



**Sedatio – успокоение
(успокаивающие средства).**

Механизм:

- 1)ослабление процессов возбуждения,**
- 2)усиление процессов торможения
→ нормализация**

**Эффекты: успокаивающий (седативный),
снотворный (облегчение наступления естественного сна),
спазмолитический,
противосудорожный (слабый),
потенцирование снотворных средств.**

**Нет миорелаксантного, атаксического (атаксия – скованность,
неподвижность),
не вызывают сонливости,
не развиваются явления психической и физической зависимости.**

Седативные средства

Бромиды

- натрия бромид (Natrii bromidum): пор., табл. 0,5, 1%, 2%, 3% р-р с фруктовым сиропом 100 мл,
- калия бромид: те же.

Показания: раздражительность, повышенная возбудимость, неврозы, нарушения сна, гипертоническая болезнь

Длительный прием → бромизм: насморк, конъюнктивит, кашель, хриплый голос, сыпь, головная боль, вялость, сонливость (NaCl 10-20 г/сут+3-5 л H_2O)



Седативные средства

Растительные средства

Препараты валерианы лекарственной пустырника

(*Valeriana officinalis*)

Rhizoma cum radicibus Valerianae

(настой 1:30, настойка (1:5, 70°),

брикеты →

экстракт валерианы густой.



Препараты

Leonurus quinquelobatus, *L. cardiaca*:

Herba Leonuri

(н-ка, жидкий экстракт,



**Препараты пиона уклоняющегося
(*Paeonia anomata*): T-ra Paeoniae**



**Препараты пассифлоры
(страстоцвет мясо-красный)
(*Passiflora incarnata*): Herba
Passiflorae → жидкий экстракт**



Комбинированные препараты:

Валокардин* , Корвалол фл. 15 мл (этиловый эфир бромизовалериановой кислоты, фенобарбитал, масло мяты перечной, хмель шишек масло, 3% этанол, Н₂О до 100 мл.

Валоседан (экстракт валерианы, н-ка хмеля, боярышника, левеня, барбитап-натрий.

Валосердин



Новопассит (жидкий экстракт из корневищ с корнями валерианы, травы мелиссы лекарственной, травы зверобоя продырявленного, листьев и цветков боярышника однопестичного или колючего, травы пассифлоры, соплодий хмеля обыкновенного, цветков бузины черной) 7,75 г и Гвайфенезин - 4,0 г в 100 мл

Персен® (Persen®)

Активные вещества: Экстракты валерианы 50 мг. мелиссы 25 мг. мяты перечной 25

Седативные средства

Показания

- Неврастения и невротические реакции, сопровождающиеся раздражительностью, тревогой, страхом, усталостью.
- "Синдром менеджера" (состояние постоянной психического напряжения).
- Бессонница (легкие формы).
- Головные боли, обусловленные нервным напряжением.
- Функциональные заболевания ЖКТ (диспептический синдром, синдром "раздраженного кишечника").
- Нейроциркуляторной дистония.
- Климактерический синдром.
- Зудящие дерматозы (экзема атопическая и себорейная, крапивница), обусловленные психологической нагрузкой.

Транквилизаторы (анксиолитические средства)

Tranquillare – успокаивать, делать безмятежным – ЛС, оказывающие успокаивающее действие при патологических состояниях, сопровождающихся страхом, эмоциональным напряжением, чувством тревоги невротического происхождения.

Анксиолитики (противотревожные, от лат. *anxius* – тревожный, *lysis* – устранение, растворение)

Атарактики (от греч. *ataraxia* – равнодушие, спокойствие духа)

Антифобические ср-ва (фобии – страхи)

Основные эффекты:

- подавление чувства страха,
- тревоги, напряженности при невротических состояниях,
- седативный,
- миорелаксанта́ный (центральный),
- умеренный снотворный,
- противосудорожный;
- потенцирование снотворных и анальгетических ср...



Транквилизаторы (анксиолитические средства)

Показания:

- невротические состояния = пограничные состояния (неврозы, неврастении, истерии), сопровождаемые чувством страха, тревоги, напряжения, мучительными переживаниями, возбуждением, бессонницей, раздражительностью;
- спастические состояния, обусловленные поражением спинного и головного мозга;
- миозиты, артриты, бурситы и др., сопряженные напряжением мышц;
- экземы, дерматиты с зудом и раздражительностью;
- лечение эпилепсии;
- лечение абстиненции при алкоголизме и наркомании;
- премедикация и после наркоза;
- судороги;
- аритмии.

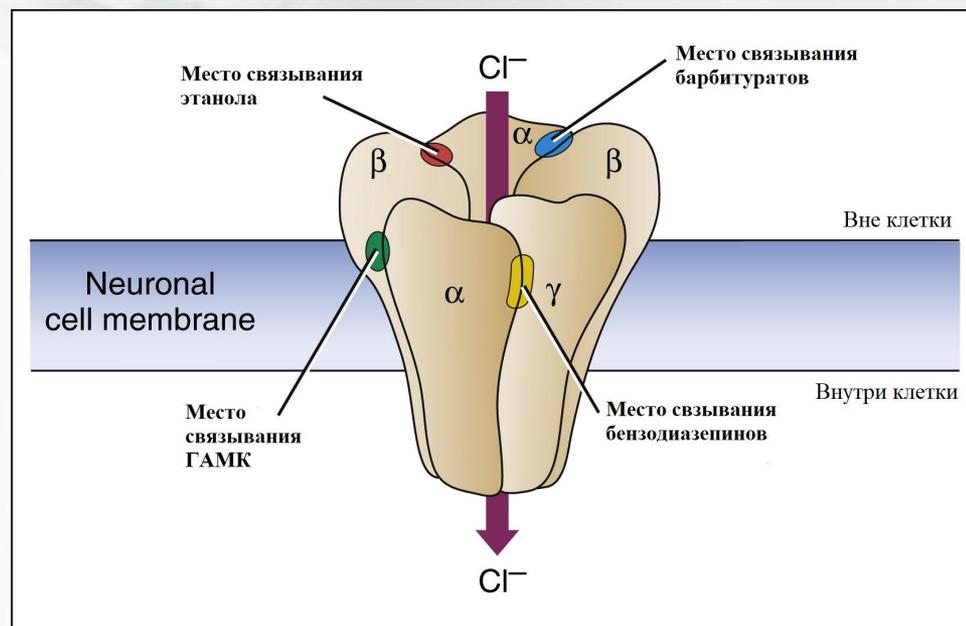


Механизм действия транквилизаторов

Взаимодействие с бензодиазепиновыми рецепторами, которые в свою очередь сопряжены с ГАМК-рецепторами.

Выделено несколько типов бензодиазепиновых рецепторов, для бензодиазепинов характерно:

- анксиолитическое
- седативное
- гипнотическое
- миорелаксантное
- противосудорожное действия



Анксиолитическое действие

Связано, в основном, с влиянием на бензодиазепиновые рецепторы миндалевидного комплекса лимбической системы.

Характерно для всех препаратов, но особенно - феназепам, дiazepam (сибазон, седуксен), хлордiazепоксид (хлзепид, элениум).

Седативный (успокаивающий) эффект

Связан с действием на другой тип бензодиазепиновых рецепторов, локализованных в ретикулярной формации ствола мозга, неспецифических ядрах таламуса.

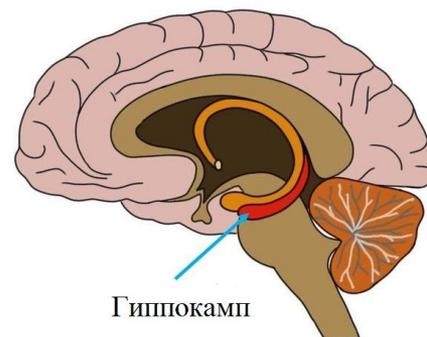
Наиболее выражен у феназепам, диазепам, лоразепам, но мало проявляется у мезапам, мидазолам.

Седация усиливается с увеличением дозы препаратов и при длительном лечении

Противосудорожный эффект

Связан с воздействием на рецепторы,
локализованные в гиппокампе

Диазепам, клоназепам, нитразепам являются
ведущими средствами противосудорожной
терапии.



Миорелаксантные свойства

Снижают тонус скелетной мускулатуры через свои рецепторы вставочных нейронов спинного мозга

Является положительным свойством, так как снижает настороженность, тревогу, помогает снять нервное беспокойство, как правило, сопровождающееся мышечным напряжением

Миорелаксация хорошо выражена у диазепама (сибазона, седуксена), слабо проявляется у оксазепама, медазепама

Гипнотический эффект

Связан с активацией бензодиазепиновых рецепторов ретикулярной формации

Наиболее выраженным снотворным эффектом обладают нитразепам, диазепам, феназепам.

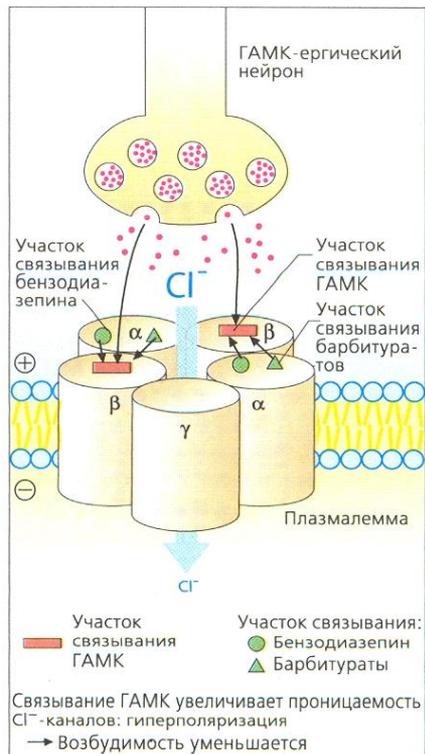


А. Действие бензодиазепинов

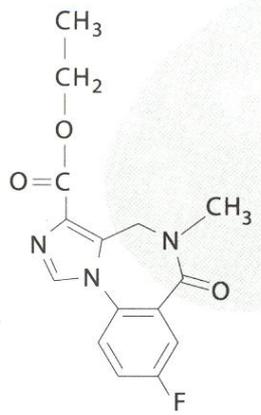


Противосудорожное, седативное, миолитическое действие

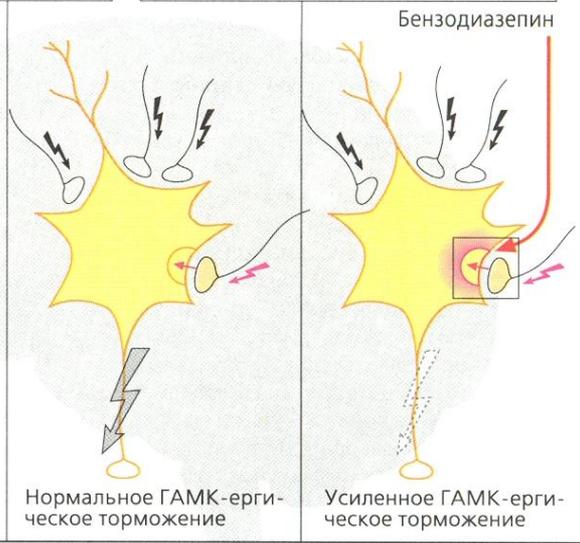
Анксиолитическое действие



Рецептор ГАМК_A со стереоспецифическим участком связывания



Флумазенил
Антагонист бензодиазепинов



Фармакокинетика

Диазепам (сибазон, седуксен),
хлордиазепоксид (хлозепид, элениум) имеют
высокую растворимость в жирах, поэтому
быстро и хорошо всасываются

оксазепам (нозепам, тазепам) -
малорастворимы в жирах

Большинство транквилизаторов, разрушаясь
(окисляясь) в печени, образуют активные
метаболиты (десметил-дiazепам),
циркулирующий в организме более 65 ч.

Лекарственная зависимость

- Транквилизаторы вызывают лекарственную зависимость (психическую и физическую)
- Длительный прием ведет к снижению краткосрочной памяти, процессов восприятия, способности переработки информации и принятия решений; возможна сонливость, головокружение, нарушение половой потенции, заторможенность.
- Транквилизаторы нельзя назначать водителям транспорта, диспетчерам и другим лицам, которые по роду своей деятельности должны обладать быстрой реакцией.
- После многократного применения часто возникает "синдром отмены" (нарушение сна, раздражительность, иногда судороги).
- Транквилизаторы не совместимы с алкоголем, который потенцирует их действие.
- Иногда возникает парадоксальная реакция (возбуждение, агрессия).

I. Производные бензодиазепина:

Диазепам (сибазон, седуксен, реланиум, валиум): табл. об. 1, 2, 5 мг, амп. 0,5%-1 мл

Феназепам (Phenazepam): табл. 0,5 мг, 1 мг и 2,5 мг

Хлордиазепоксид (хлзепид, элениум): табл/драже 5 мг, 10 мг, 25 мг, амп. 100 мг + 10 мл

Медазепам (мазепам), Лоразепам, Нозепам.

Молекулярные механизмы: усиление ГАМК-ергического торможения в ЦНС:

Бензодиазепины возбуждают бензодиазепиновые рецепторы (ω_1 -рецепторы) комплекса ГАМК-рецептор- Cl^- -канал \rightarrow конформационное изменение ГАМК-рецептора \rightarrow повышение чувствительности ГАМК-рецептора к ГАМК \rightarrow повышение входа Cl^- в клетку \rightarrow гиперполяризация мембран \rightarrow торможение активности нейронов.

Физиологические механизмы: подавление возбудимости лимбической системы, таламуса, гипоталамуса, которые регулируют эмоциональные реакции; подавление нервных связей между этими структурами и корой головного мозга.

Механизм миорелаксирующего действия не ясен, возможно, бензодиазепины угнетают спинальные рефлексы и нарушают их супраспинальную регуляцию.

Нежелательные эффекты: сонливость, головная боль, нарушение координации движений, памяти; развитие эйфории, психическая зависимость, привыкание, синдром отмены (тревога, бессонница,

II. Производные азаспиродекандиона:

Буспирон (Buspirone*) : табл. 5 и 10 мг



Механизм – частичный агонист 5-HT_{1A}-рецепторов мозга;

Уменьшает синтез и высвобождение серотонина, активность серотонинергических нейронов, в т.ч. в дорсальном ядре шва.

Селективно блокирует (антагонист) пре- и постсинаптические D₂-дофаминовые рецепторы и повышает скорость возбуждения дофаминовых нейронов среднего мозга.

Не обладает сродством к бензодиазепиновым рецепторам, не влияет на связывание ГАМК; не обладает седативной, противосудорожной и миорелаксирующей активностью.

Эффект развивается постепенно, проявляется через 7–14 дней и достигает максимума через 4 нед. Не оказывает отрицательного влияния на психомоторные функции, не вызывает толерантности, лекарственной зависимости и симптомов отмены. Не потенцирует действие алкоголя.

Применение

Генерализованное тревожное расстройство, паническое расстройство, синдром вегетативной дистонии, синдром алкогольной абстиненции (вспомогательная терапия), депрессия (вспомогательная терапия).

Разные

Бензоклидин (оксилидин): табл. 0,02, 0,05, амп. 2% и 5%-1 мл

Мебикар: табл. 0,3, Триоксазин: табл. 0,3

- Анксиолитическое действие слабое, угнетающее действие почти не выражено,
- Нет миорелаксирующего действия,
- Слабое или отсутствует противосудорожный эффект,
- Не вызывает сонливости.

Применение:

- неврозы,
- тревожно-депрессивные состояния,
- гипертоническая болезнь (снижение АД) ,
- невротические расстройства с адинамией, заторможенностью.
- Малые транквилизаторы («дневные» транквилизаторы).



Нейролептики (нейроплегики)

ЛС, оказывающие антипсихотическое действие (антипсихотические средства), устраняющие продуктивную симптоматику психозов (расстройства мышления, восприятия и психомоторное возбуждение)

Психозы (от греч. psyche – душа) — психические расстройства, характеризующиеся длительностью, устойчивостью и тотальностью проявлений.

В основе – чрезмерная активность мезолимбического пути, который связывает средний мозг с ядрами переднего мозга и оканчивается в вентральной области стриатума и лобной коре.

При психозах наблюдается перевозбуждение D_2 -рецепторов (продуктивные, или позитивные симптомы).

Одновременно наблюдается сниженная активность мезокортикальной дофаминергической системы и ее D_1 -рецепторов (развитие негативных симптомов шизофрении: апатия, ангедония – отсутствие удовольствий, эмоциональная тупость, сниженные мотивации).

Основные эффекты нейролептиков

- Антипсихотический – обусловлен блокадой D_2 -рецепторов мезолимбической системы;
- Противорвотный (антиэметический) (блокада рецепторов триггерной зоны рвотного центра);
- Транквилизирующий и седативный (блокада центральных H_1 -гистаминовых рецепторов и α -адренорецепторов восходящей ретикулярной формации ствола мозга);
- Гипотермический (угнетение центра терморегуляции и усиление теплоотдачи за счет расширения сосудов кожи);
- Каталептогенный (у некоторых),
- Антидепрессивный,
- Активизирующий (энергизирующий);
- Снижение тонуса скелетной мускулатуры (миорелаксантный);
- Потенцирование снотворных, анальгетиков, средств для наркоза.

Показания для нейролептиков

- Психиатрия – заболевания с галлюцинаторно-бредовым синдромом (шизофрения, МДП, паранояльный синдром, эпилепсия с психотическими расстройствами, алкогольный психоз, делирий);**
- Неврология – заболевания с повышенным мышечным тонусом (инсульт);**
- Акушерство – неукротимая рвота беременных;**
- Анестезиология – премедикация, искусственная гипотермия;**
- Хирургия – противорвотные средства после операций на брюшной полости;**
- Онкология – после лучевой и химиотерапии опухолей;**
- Дерматология – кожный зуд.**

Классификация нейролептиков

**Типичные и атипичные нейролептики
(способность вызывать лекарственный паркинсонизм за счет
блокады рецепторов дофамина экстрапирамидной системы)**

**Типичные нейролептики → влияют на позитивную симптоматику,
не влияют на негативную симптоматику,
не влияют на когнитивные нарушения
(познавательные процессы, память, логическое мышление),
вызывают экстрапирамидные расстройства (тремор,
двигательная заторможенность, мышечная
ригидность).**

**Атипичные нейролептики (препараты нового поколения) →
снимают продуктивную симптоматику,
устраняют негативную симптоматику,
влияют на когнитивные функции,
не вызывают экстрапирамидных расстройств.**

НЕЙРОЛЕПТИКИ

- Производные фенотиазина: аминазин, трифтазин, этаперазин, тиоридазин
- Производные тиоксантена: хлорпротиксен
- Производные бутирофенона: галоперидол, дроперидол
- Производные пиперазино-дибензодиазепина: клозапин
- Производные индола: резерпин, сульпирид (эглонил)

Типичные нейролептики

Производные фенотиазина

С алифатической цепью:

Хлорпромазин (аминазин): драже 25, 50 и 100 мг, амп. 2,5%-1мл, 2 мл, 5 мл и 10 мл.

Левомепромазин: табл., драже 25 мг, амп. 2,5%-1 мл.

Пиперазиновые производные:

Перфеназин (этаперазин): табл. об. 4, 6 и 10 мг

Трифлуоперазин (трифтазин): табл. об. 1, 5 и 10 мг, амп. 0,2%-1 мл.

Флуфеназин (фторфеназин, модитен): табл. 1, 2,5 и 5 мг, амп. 0,25%-1 мл

Флуфеназин-деканоат (модитен-депо): амп. 2,5%-1 мл (в/м 1 раз в 1-3 нед.)

Более мощные нейролептики с активирующим эффектом (при апатии, вялости, ступоре).

Пиперидиновые производные:

Тиоридазин: драже 10 мг, 25 мг, 100 мг, сусп. 0,2%

Пипотиазин.

Менее выраженные антипсихотические эффекты и экстрапирамидные расстройства.

Производные тиоксантена

Хлорпротиксен: табл., драже 15 и 50 мг, амп. 2,5%-1 мл (эффекты аминазина).

Производные бутирофенона:

Галоперидол (Haloperidolum): табл. 1,5 и 5 мг, амп. 0,5%-1 мл, фл. 0,2%-10 мл
Сильнее аминазина в 50-100 раз. Не вызывает депрессий, каталепсии, вялости, апатии, обладает активизирующим действием.

Дроперидол (Droperidolum): амп. 0,25%-5 мл и 10 мл.

Сильный и кратковременный эффект; купирование острых приступов психомоторного возбуждения; средство нейролептанальгезии; Таламонал (дроперидол+фентанил).

Производные дифенилбутилпиперидина

Пимозид: табл. 1 и 4 мг

Флуспирилен: амп. 4 мг – в/м 1 раз/нед.

Пенфлюридол: табл. 20 мг – 1 раз/нед.

По эффективности близки галоперидолу.

Производные индола

Дикарбин (карбидин): табл. об. 25 мг, амп. 1,25%-2 мл.

Умеренно выраженное антипсихотическое действие с антидперессивным эффектом. Применяют при шизофрении и невротических расстройствах с преобладанием в клинике депрессивно-бредовых состояний.

Атипичные нейролептики

(блокада 5-HT_{2A}-/D₂-рецепторов)

Блокада 5-HT_{2A}-рецепторов в нигростриатной и тубероинфундибулярной областях реципрокно повышает активность D₂-рецепторов → снижает выраженность экстрапирамидных расстройств,

Производные дибензодиазепина

Клозапин (азалептин, лепонекс): табл. 25 и 100 мг

сильнее блокирует D₄-рецепторы, слабо D₂-рецепторы, блокирует центральные М-холинорецепторы и α₁-адренорецепторы, не вызывает каталептогенного эффекта, не подавляет настроение

Оланзапин (Olanzapine*, зипрекс): табл. об. 5 и 10 мг, амп. 10 мг (в/м)

Блокирует 5-HT_{2A}-, D₁-, D₂-, D₃-, D₄-, М-, Н₁-, α₁-рецепторы.

Аналогичен галоперидолу по эффективности, но сильнее устраняет негативную симптоматику.

Производные бензизоксазола

Рисперидон : табл. 0,25 и 0,5, р-р 1 мг/30 мл.

Блокирует 5-HT_{2A}-, D₂-, Н₁-, α-рецепторы; не влияет на М-холинорецепторы (может вызвать экстрапирамидные расстройства). Применяют при резистентности к галоперидолу.

Производные бензамида

Амисульприд: табл. 0,1 и 0,2, табл. об. 0,4

Селективно, с высоким сродством блокирует D_2 -, D_3 -рецепторы, не обладает сродством к субтипам D_1 -, D_4 - и D_5 -рецепторы. Не имеет сродства к рецепторам серотонина, гистамина H_1 , альфа-адренергическим и холинергическим рецепторам. Не вызывает каталепсии. В меньшей степени вызывает экстрапирамидные побочные эффекты, что может быть связано с его преимущественной лимбической активностью.

Более эффективен для устранения когнитивных нарушений.

Новые нейролептики

Арипипразол:

- Арипипразол проявляет типичный антагонизм к допаминным рецепторам D_2 в мезолимбическом пути, обладая уникальным свойством частичного агонизма к тем же рецепторам в мезокортикальном пути.
- Проявляет антагонизм к серотониновым рецепторам $5HT_2A$ -подтипа и агонизм к $5HT_1A$ -рецепторам.
- Имеет наименьшее сродство среди всех атипичных средств к адренергическим (α_1), гистаминовым (H_1) и мускариновым (M_1) рецепторам.

Блонансерин – клинические испытания в РФ – антипсихотический эффект не связан с воздействием на дофаминергические рецепторы.

Механизм антипсихотического действия нейролептиков

Блокада D₂ рецепторов ответственна за:

- развитие антипсихотического
- вторичного седативного эффектов
- экстрапирамидных побочных явлений
- анальгезирующее
- антиэметическое (противорвотное)
- снижение содержания гормона роста и пролактина

Блокада D₃ вызывает:

- развитие стимулирующего (дезингибирующего) эффекта нейролептиков

Механизм антипсихотического действия нейролептиков

- Блокада серотониновых
 - 5HT_{1a}
 - стимулирующий (агонистический) эффект
 - 5HT_{2a}
 - редукция негативной симптоматики,
 - улучшение когнитивных функций,
 - регуляция сна за счет увеличения медленноволновой фазы,
 - угнетение агрессивности,
 - ослабление депрессивной симптоматики,
 - антимигренозное действие,
 - снижение риска экстрапирамидных побочных эффектов.
 - 5HT_{2c}
 - анксиолитический эффект,
 - усиление аппетита,
 - уменьшение пролактиновой реакции.
 - 5HT₃
 - уменьшение тошноты и рвоты,
 - усиление антипсихотического и анксиолитического действия.

Механизм антипсихотического действия нейролептиков

- Блокада M1 холинорецепторов
 - коррегирующее влияние на экстрапирамидные побочные явления
- Высокую тропность к мускариновым рецепторам имеют:
 - Тиоридазин (меллерил, сонапакс)
 - Хлорпротиксен (трускал)
 - клозапин (лепонекс)
 - оланзапин (зипрекса)
- Сильное холинергическое влияние может вызывать ухудшение когнитивных функций, в том числе мнестические расстройства, а также периферические побочные эффекты (синусовая тахикардия, сухость слизистых, нарушение аккомодации зрения, запоры, задержка мочи т.д.)

Механизм антипсихотического действия нейролептиков

Блокирующее действие на H1 гистаминовые рецепторы:

- седативный эффект
- увеличение аппетита
- антиаллергическое действие

Высокой антигистаминной активностью обладают:

- алимемазин (терален)
- прометазин (фенерган)



Механизм антипсихотического действия нейролептиков

Блокада центральных периферических альфа 1 и альфа 2 адренорецепторов:

- выраженный седативный эффект
- гипотензивное действие
- нейровегетативные побочные эффекты (тахикардия, головокружение)

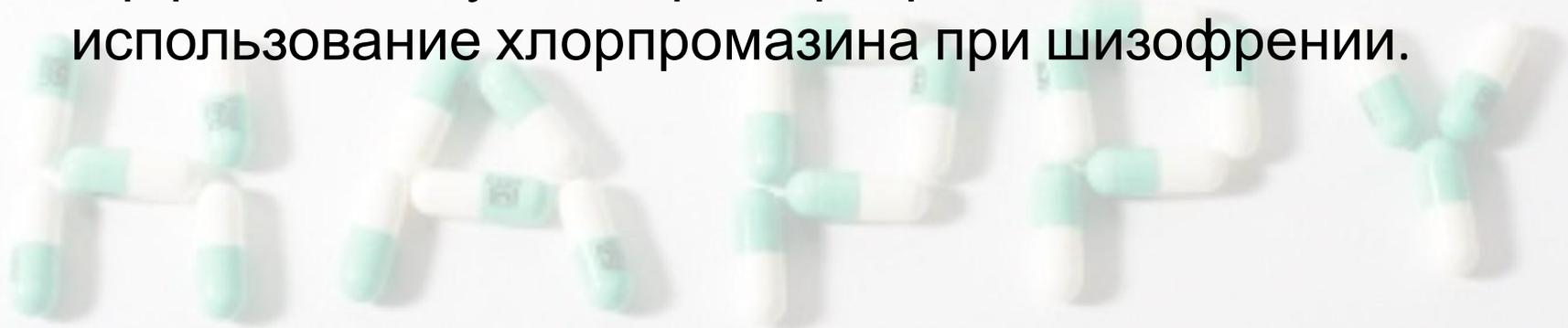
Выраженными антиадренергическими свойствами обладают:

- хлорпромазин
- хлорпротексен

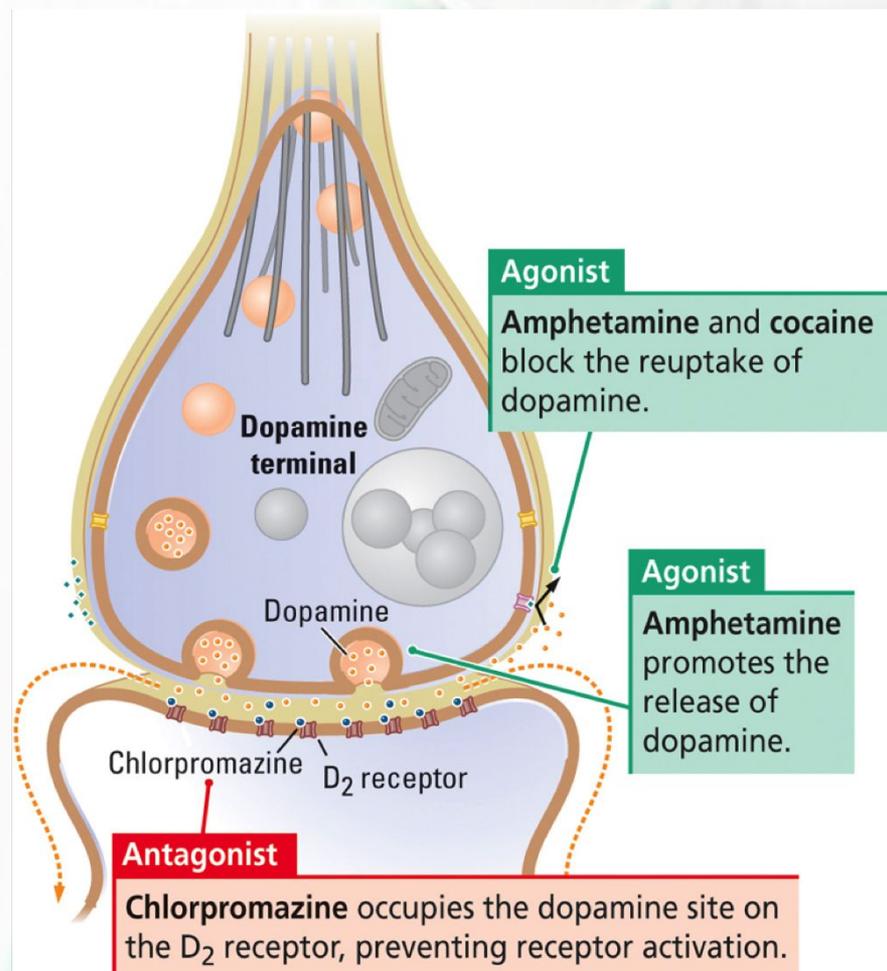
Хлорпромазин (аминазин)

Препарат был синтезирован как производное от фенотиазина (противопаразитарное средство).
Применялся для усиления действия наркоза в хирургии.

Психиатр Фрэнк Айд в декабре 1952 года первым в США начал широко применять хлорпромазин в качестве успокаивающего, исследуя его действие и побочные эффекты. Получил первое разрешение от FDA на использование хлорпромазина при шизофрении.



Хлорпромазин (аминазин)



Хлорпромазин (аминазин)

Основными особенностями хлорпромазина являются его антипсихотическое действие и способность влиять на эмоциональную сферу человека.

При помощи хлорпромазина удаётся купировать различные виды психомоторного возбуждения, ослаблять или полностью купировать бред и галлюцинации, уменьшать или снимать страх, тревогу, напряжение у больных психозами и неврозами.. – 1)
антипсихотическое действие



Хлорпромазин (аминазин)

2) Седативное и анксиолитическое действие. Хлорпромазин оказывает выраженное успокаивающее действие при эмоциональном, психическом и двигательном возбуждении у больных психическими заболеваниями; устраняет агрессию, беспокойство, страх, тревогу, вызывает состояние эмоционального безразличия. В связи с седативным действием хлорпромазин потенцирует действие средств для наркоза, снотворных средств, наркотических анальгетиков.

Седативное действие хлорпромазина связывают с блокадой гистаминовых H₁-рецепторов в ЦНС.

3) Центральное мышечно-расслабляющее действие. Хлорпромазин снижает тонус скелетных мышц в результате влияния на центры, регулирующие мышечный тонус.

Хлорпромазин (аминазин)

- 4) **Противорвотное действие.** Хлорпромазин блокирует D2-рецепторы триггер-зоны (пусковая зона) рвотного центра, которая расположена на дне IV желудочка мозга.
- 5) **Гипотермическое действие.** Хлорпромазин угнетает центры терморегуляции в гипоталамусе и способствует гипотермии при снижении температуры окружающей среды.
- 6) **Влияние на секрецию гормонов гипофиза.** Хлорпромазин блокирует D2-рецепторы и таким образом устраняет тормозное влияние дофамина на продукцию пролактина в передней доле гипофиза — уровень пролактина повышается. Прولاктин стимулирует развитие молочных желез, лактацию, а также угнетает продукцию гонадотропных гормонов (фолликулостимулирующего и лютеинизирующего).
- 7) **α-Адреноблокирующее действие.** Хлорпромазин блокирует α-адренорецепторы, что ведет к расширению кровеносных сосудов и снижению артериального давления. Как и другие α-адреноблокаторы, хлорпромазин может вызывать ортостатическую гипотензию.
- 8) **M-холиноблокирующее действие.** Хлорпромазин блокирует M-холинорецепторы и может уменьшать секрецию бронхиальных, пищеварительных желез, ослаблять моторику желудочно-кишечного тракта.

Хлорпромазин (аминазин)

Показания:

шизофрения и другие психозы,
острые галлюцинаторно-бредовые синдромы,
для купирования острого психомоторного возбуждения,
при выраженных тревоге, страхе, эмоциональном напряжении.
как противорвотное средство
как противоикотное средства



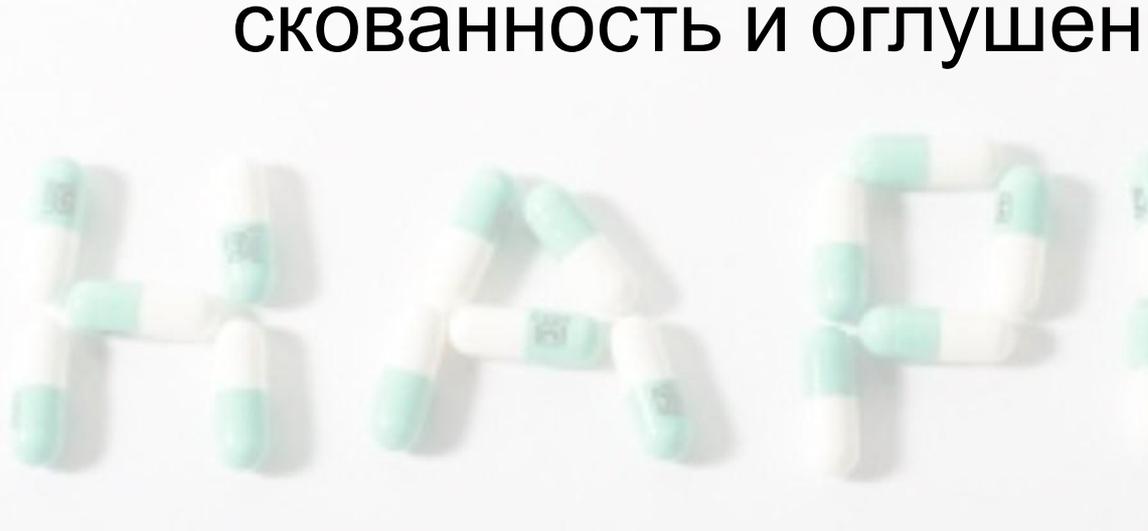
Левомепромазин (тизерцин)

близок по эффектам к аминазину, но обладает мощным анальгетическим и антигистаминным действием. Препарат применяют при невралгии тройничного нерва и неврите лицевого нерва.



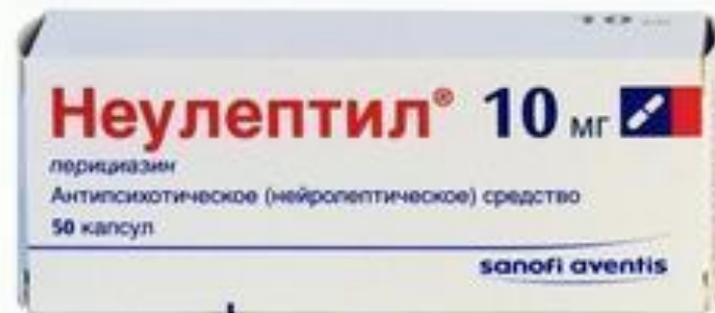
Трифлуоперазин (трифтазин)

сильнее аминазина по
антипсихотическому эффекту, но у него
менее выражены адренолитические
свойства и отсутствует способность,
присущая аминазину, вызывать
скованность и оглушение



Перициазин (неулептил)

обладает мягким успокаивающим действием,
снижает конфликтность, злобность,
агрессивность, нормализует поведенческие
реакции ("корректор поведения").



Хлорпротексен

сочетает успокаивающее и антипсихотическое действие с умеренным антидепрессивным эффектом. Редко вызывает экстрапирамидные расстройства.



Галоперидол

один из самых активных нейролептиков, обладает выраженным антипсихотическим действием, в 50 раз сильнее аминазина по противорвотному эффекту. Часто приводит к экстрапирамидным нарушениям (повышение мышечного напряжения, тремор).



Дроперидол



оказывает быстрое, сильное, но кратковременное действие, обладает выраженным болеутоляющим, противошоковым, противорвотным и антиаритмическим эффектами.

Применяется в анестезиологической практике с фентанилом (нейролептанальгезия). Иногда используется для купирования гипертонических кризов.

Сульпирид (Эглонил)

оказывает "регулирующее" действие: сочетает умеренную нейролептическую активность с антидепрессантными свойствами и слабым успокаивающим эффектом, однако при наличии у больных вялости и заторможенности, напротив, вызывает мягкую стимуляцию.





END

