

Психотропные средства

Нейролептики
антиманиакальные
транквилизаторы
седативные вещества

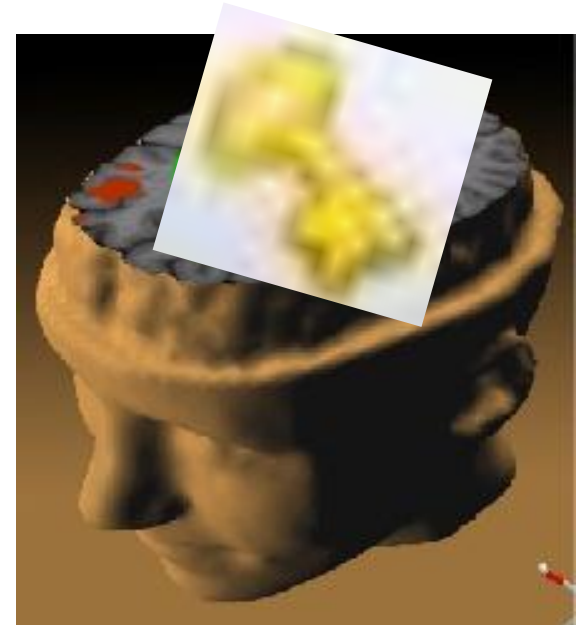
Лектор
Доцент каф. фармакологии
Капитоненко Т.А



Определение термина



- *Психотропными (ПТ)* называют вещества, оказывающие **специфическое** воздействие на психическую сферу деятельности человека: *они могут корригировать процессы мышления, эмоции и настроение, поведенческие реакции и т.д.*
- *Практическое использование:*
Психозы, неврозы. . . .
Стресс, ↓памяти, ↓обучаемости. . . .
- *Возникновению группы положило начало открытие хлорпромазина (аминазина) в 1952 году*



Классификация ПТ средств по основным показаниям к использованию



1. Вещества, используемые для лечения **психозов**
(**антипсихотические**)

- *Нейролептики*
- *Антидепрессанты*
- *Антиманиакальные*

2. Вещества, используемые при **неврозах** и пограничных с психозами состояниях – (**антиневротические**)

- *Транквилизаторы*

3. Вещества, используемые при сниженной психической, в том числе умственной деятельности –

- *Психостимуляторы*
- *Ноотропы*

Классификация ПТ средств по характеру общего действия на ЦНС



1. Вещества **психоседативного** действия –

- *Нейролептики Транквилизаторы Антидепрессанты*

2. Вещества **психоактивирующего** действия –

- *Психостимуляторы Антидепрессанты*

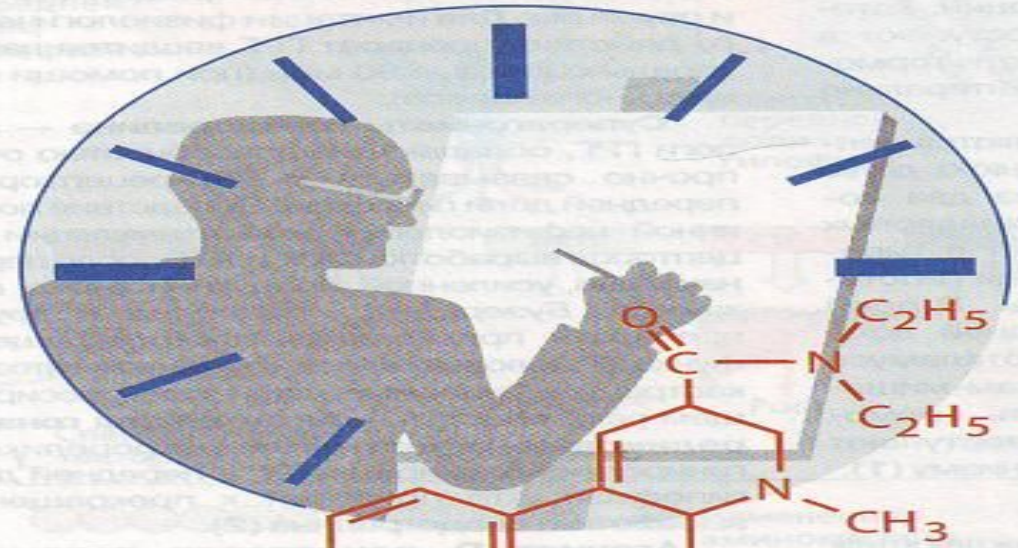
3. Не оказывают ни седативного ни активирующего действия – *Антиманиакальные вещества Ноотропы*

4. Вызывают дезорганизацию деятельности ЦНС – **психодизлептики, галлюциногены, эйфорианты:**

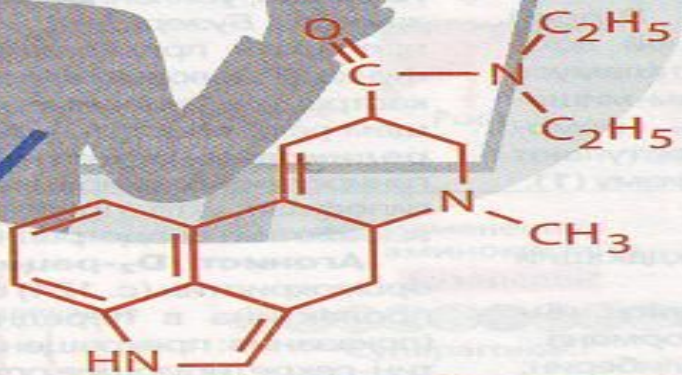
Пр-е индола (ЛСД-25, буфотенини, псилоцибин)

Пр-е каннабинола (гашиш, марихуана, анаша)

Алкалоиды – Атропин, мескалин, героин и др.



Диэтилаид
лизергиновой
кислоты,
0,0001г/70кг



Классификация нейролептиков (НЛ)



Типичные НЛ

1. Производные фенотиазина

- Аминазин (Хлорпромазин)
- Левомепромазин
- Трифтазин Фторфеназин Этаперазин
- Тиоридазин

2. Производные бутирофенона - Галоперидол

- Дроперидол

3. Производные тиоксантена - Хлорпротиксен

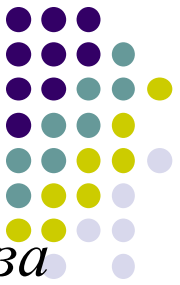
4. Производные бензамида - Сульпирид

Атипичные НЛ

1. Производные дибензодиазепина – Клозапин Оланзапин и др.



Специфические эффекты НЛ



- **Антипсихотический** – устраняют проявления психоза

- **Седативный**

- **Активирующий** (Трифтазин)

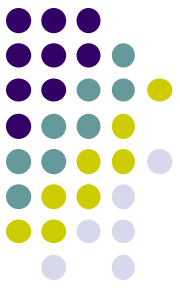
Психоз – нарушение рассудочной и ассоциативной деятельности мозга:

- расстройства восприятия – **галлюцинации**
- расстройства мышления – **бред**
- изменения эмоционального состояния, настроения, поведения

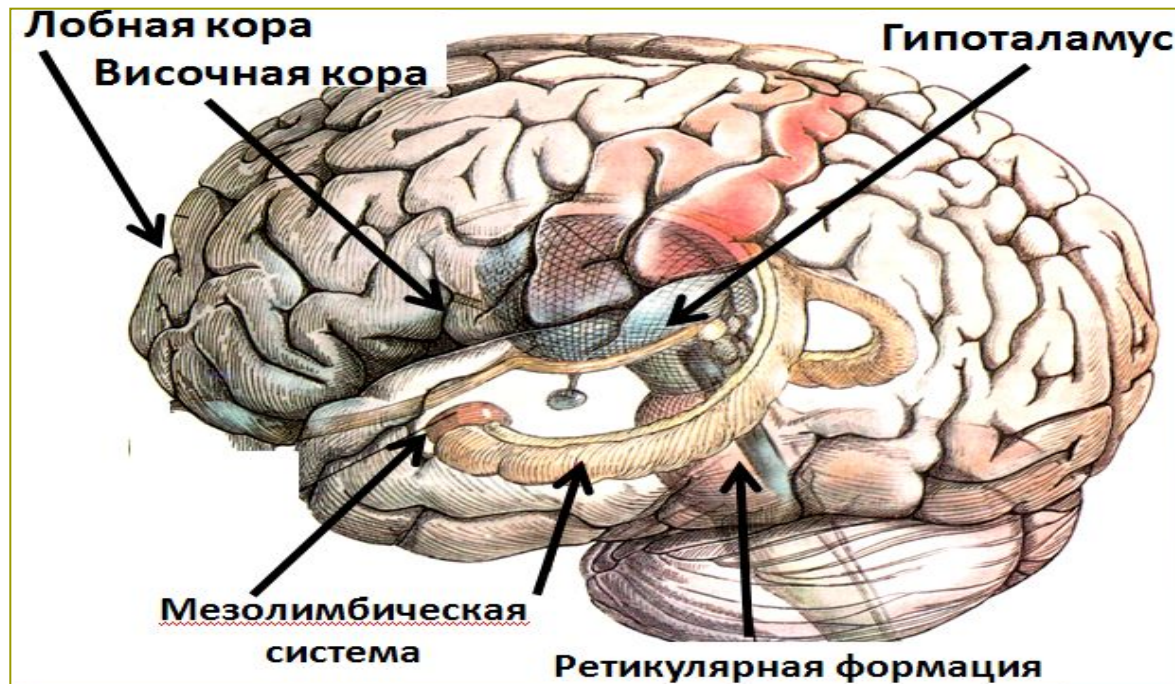
Психозы: о. алкогольный, о. инфекционный психоз, шизофрения

Дофамин

Д1, Д2 – постсинаптические Д3, Д4, Д5 – пресинаптические

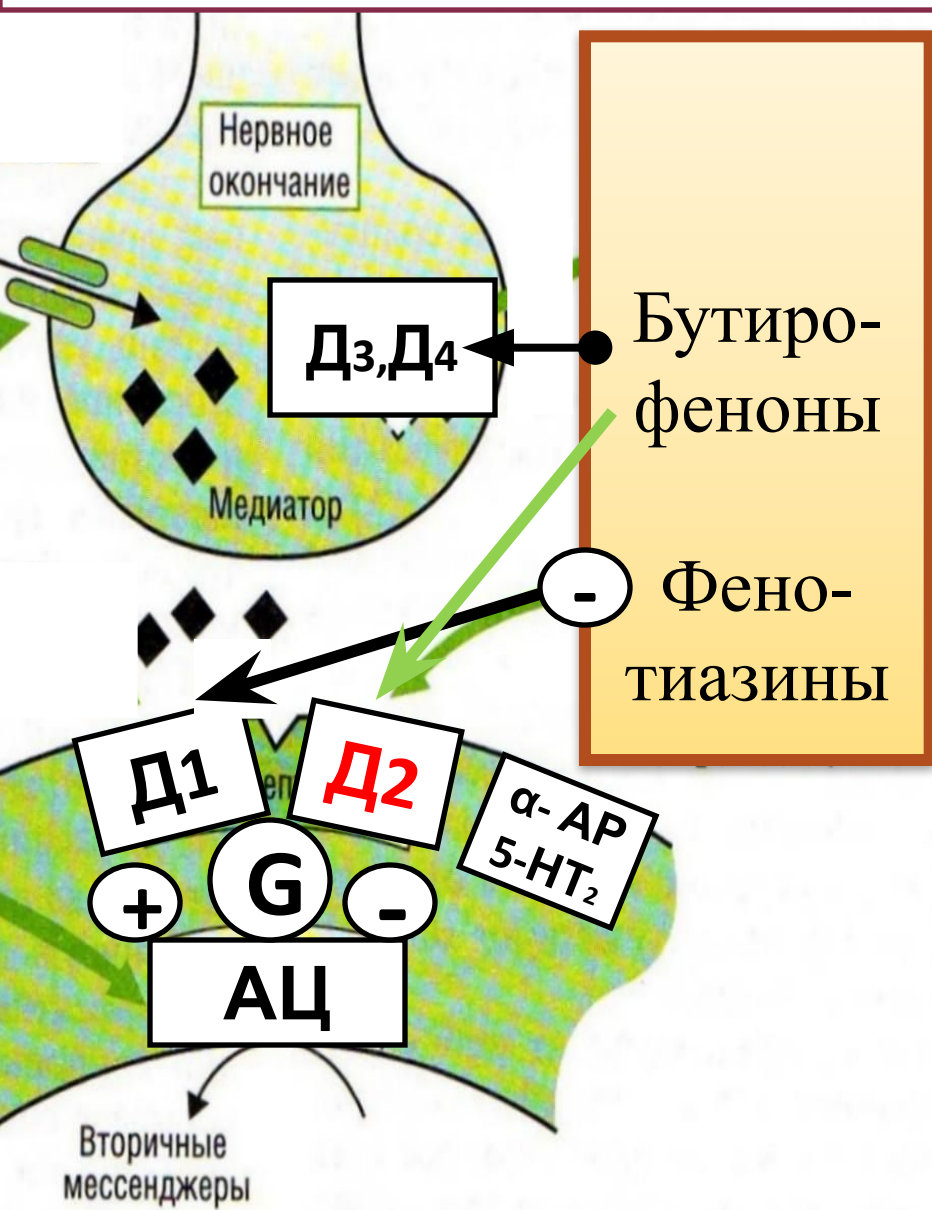


- 1) **Мезолимбический путь** (регуляция эмоций)
- 2) **Мезокортикальный путь** (регуляция мышления)
- 3) Гипоталамус (регуляция t° и эндокринных функций)
- 4) Экстрапирамидная система (регуляция двигательных функций)
- 5) Пусковая зона рвотного центра (ствол мозга – стимуляция рвотного центра)



Механизм антипсихотического действия НЛ

В мезолимбической и мезокортикальной системе блокируют D2R



Исчезновение галлюцинаций,
бреда, асоциальных черт,
нормализация поведения

По активности:

Галоперидол

Фторфеназин

Трифтазин

Клозапин

Сульпирид

Хлорпротиксен

Аминазин

Левомепромазин

Блокада рецепторов

Сухость во рту
Нарушение зрения
Затруднение мочеиспускания
Запор

Блокада МХР

Нейролептики

Блокада α AP,
H3R, 5P

Ортостатическая гипотаня
гипотермия

Седативный эффект

Блокада дофаминовых рецепторов

Антипсихотический эффект

Исчезновение бреда
галлюцинаций

**Кора
Мезолимбик**

Мезолимбический путь

Блокада D2 R

Нигро-стриатный путь

Полосатое тело

Экстрапирамидные нарушения
Лекарственный паркинсонизм

Гипофиз

↑ Пролактин

Эндокринные нарушения

Экстрапирамидные расстройства (лекарственный паркинсонизм)



Вызывают все типичные НЛ:
Галоперидол > трифтазин
> аминазин > фторфеназин >
тиоридазин > хлорпротиксен >
сульпирид

Корректор – Циклодол
(центральный МХЛ)

Не вызывают атипичные НЛ:
Клозапин (Азалептин) –
блокатор D₂, D₄, 5-HT и МХР

Проявляются:

Мышечной ригидностью - ↑ тонуса
скелетных мышц

Тремором – постоянное непроизвольное
дрожание

Гипокинезией - скованностью движений



Фенотиазины

Действие	Аминазин	Левомепромазин	Трифтазин
Антипсихотическое	+++	++	++++
Седативное	+++	++++	+
Активирующее	-	-	++



Неспецифические эффекты фенотиазинов

Эффекты	Аминазин	Левомепромазин	Трифтазин
Потенцирование наркотических ЛП, анальгетиков, этанола (НЛА) <i>таламонал</i>	+++	++++	+
Обезболивающий	-	+	-
Противорвотный, противоикотный (<i>этаперазон</i>)	++	++	++++
Жаропонижающий и гипотермический (<i>пойкилотермность</i>)	+++	++++	++
Гипотензивный	+++	++	++
Миорелаксантаый, п/аритмический, п/воспалительный. противоаллергический	+++	+++	++

Неспецифические эффекты НЛ

Показания



- В качестве **седативных** в премедикации **для** **потенцирования наркоза и обезболивающих средств** (**Таламонал: Дроперидол + Фентанил - для НЛА**)
- В качестве **противорвотных** при **лучевой болезни**, **противоопухолевой терапии, токсикозах беременности** (Галоперидол, Трифтазин, Этаперазин)
- В качестве **жаропонижающих** в литических коктейлях с ННА и Н1Б
- В качестве **гипотермических** в оперативной хирургии (**искусственная гибернация или криохирургия**)
- В качестве **гипотензивных** **при ГК** (Аминазин)

Побочные эффекты НЛ



Экстрапирамидные нарушения (*корректор – центральный МХЛ циклодол*)

Снижение эмоций, апатия, депрессия (Аминазин) – **нейролептический синдром**

Гормональные нарушения (*гинекомастии, галакторея, нарушение менструального цикла, импотенция, повышение массы тела*)

Ортостатическая гипотензия, коллапс (Аминазин)

Застойная желтуха

Сухость во рту, атония кишечника, тахикардия

Раздражение кожи, слизистых (Аминазин)

Аллергии

Лейко- и гранулоцитопении (Клозапин))

Антиманиакальные средства



Мании - болезненно повышенное возбужденное состояние, первая фаза маниакально – депрессивного психоза (МДП)

Препараты лития (**Лития карбонат**)

Механизм:

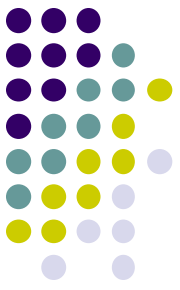
Li^+ является антагонистом Na^+ (нарушает процессы деполяризации)

Li^+ снижает высвобождение КА из нервных окончаний и повышает внутриклеточное депонирование НА

Выпускается в таб, эффект развивается медленно (клинические проявления только ч-з 2-3 недели

Передозировка- тремор, чувство усталости, сонливость

Транквилизаторы



Синонимы: **анксиолитики, атарактики, антифобические вещества**

*Это группа психотропных средств, избирательно корригирующих эмоциональную сферу: подавляют страх, агрессивность, тревогу, **вызывают эмоциональный комфорт***

По механизму действия выделяют:

- 1. Агонисты **бензодиазепиновых** рецепторов (бензодиазепины)*
- 2. Агонисты **серотониновых** рецепторов - Буспирон*
- 3. Разного механизма действия - Амизил, Метамизил, Мепротан, Триоксазин, Фенибут, Мебикар*

Классификация бензодиазепиновых транквилизаторов



1. Длительного действия (T50 24-48 часов)

Диазепам (Сибазон, Реланиум, Седуксен)

Феназепам

Хлозепид (Хлордiazепоксид, Элениум)

2. Средней длительности действия (T50 6-24 часа)

Мезапам (Рудотель) **Оксазепам** (Тазепам, Нозепам)

Нитразепам (Эуноктин, Радедорм)

3. Короткого действия (T50 меньше 6 часов)

Мидазолам (Дормикум) **Триазолам**

Эффекты транквилизаторов бензодиазепинового ряда



Анксиолитический

Седативный (нет у мезапама)

Сомнолентный, снотворный

Потенцирующий

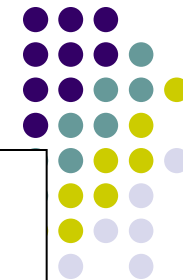
Миорелаксанта́нный

Противосудорожный

Амнестический (в/в)



Алlostерическое взаимодействие



ГАМК-ергическое нервное окончание

Снотворные средства

**Бензодиазепины
ДИАЗЕПАМ**

Барбитураты

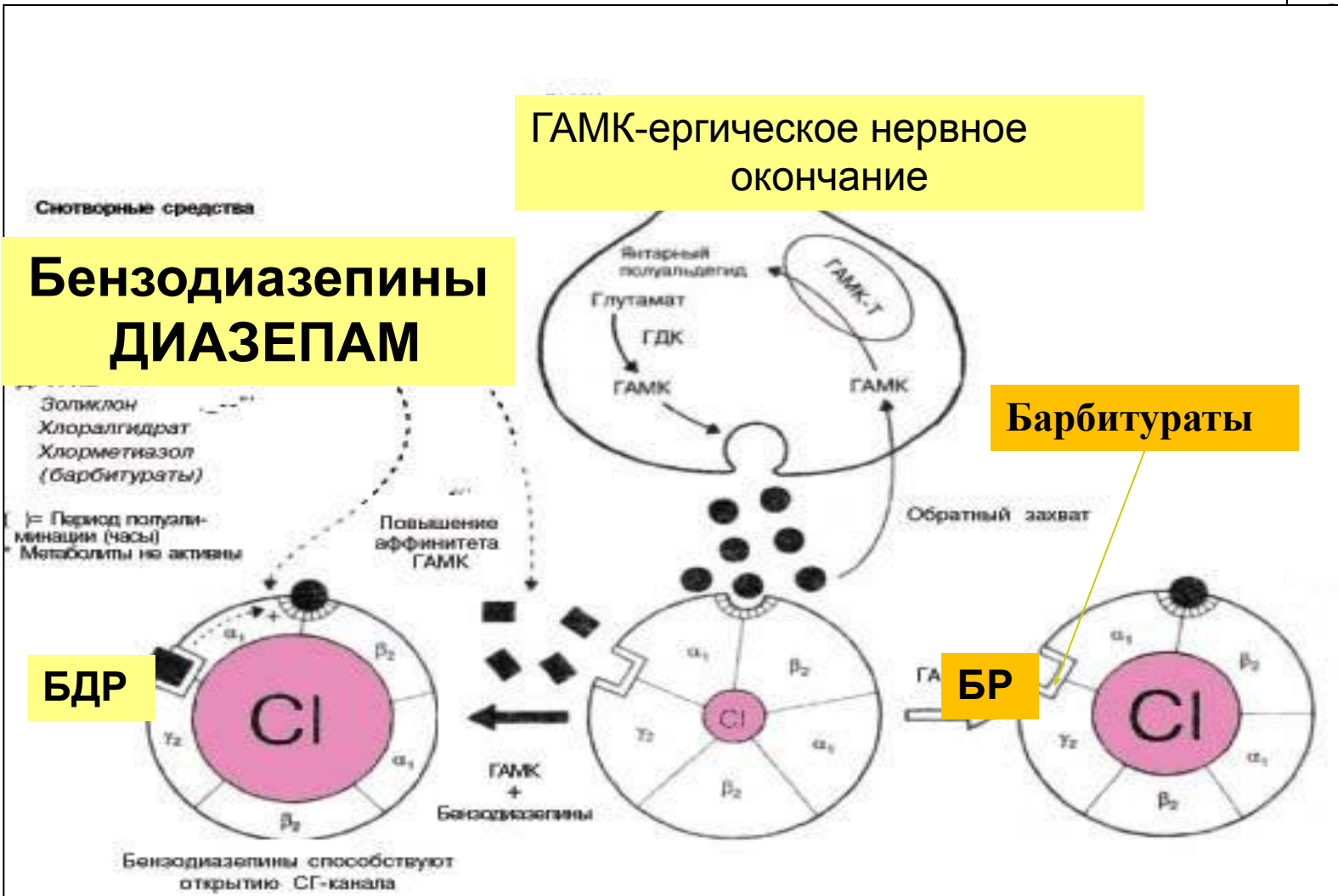
Золпидон
Хлоралгидрат
Хлорметиазол
(Барбитураты)

(t_{1/2}) = Период полуэлиминации (часы)
* Метаболиты не активны

БДР

БР

Бензодиазепины способствуют открытию Cl-канала



Флумазенил – блокатор БДР, антагонист БД транквилизаторов

Показания к использованию транквилизаторов



Анксиолитический эффект:

- **Неврозы, невротические реактивные состояния**
- **Экстремальные состояния (СТРЕСС)**
- **Приступы панических страхов, сомнамбулизм (снохождение)**
- **Купирование абстинентного синдрома**

Седативный эффект:

- **Бессонница, нарушение засыпания (*нитразепам*)**
- **Для потенцирования наркоза, анальгезии (*атаральгезия – в/в диазепам + морфин*)**

Миорелаксантный эффект:

- **Для купирования судорог (*Диазепам*)**
- **В комплексной терапии эпилепсии, хореи и др. судорожных заболеваний (*Клоназепам*)**

Побочные эффекты транквилизаторов



- ✓ Снижение скорости психомоторных реакций, дискоординация движений
- ✓ *Ослабление внимания, памяти, сонливость в дневное время, мышечная слабость*
- ✓ Снижение потенции, нарушение менструального цикла
- ✓ *Фетотоксичность (с-м “вялого плода”)*
- ✓ Развитие психической и физической зависимости

При передозировке – антидот **Флумазенил**

Седативные вещества

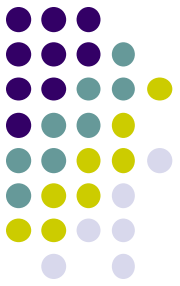
Бромиды: Калия бромид, Натрия бромид

Бромкамфора

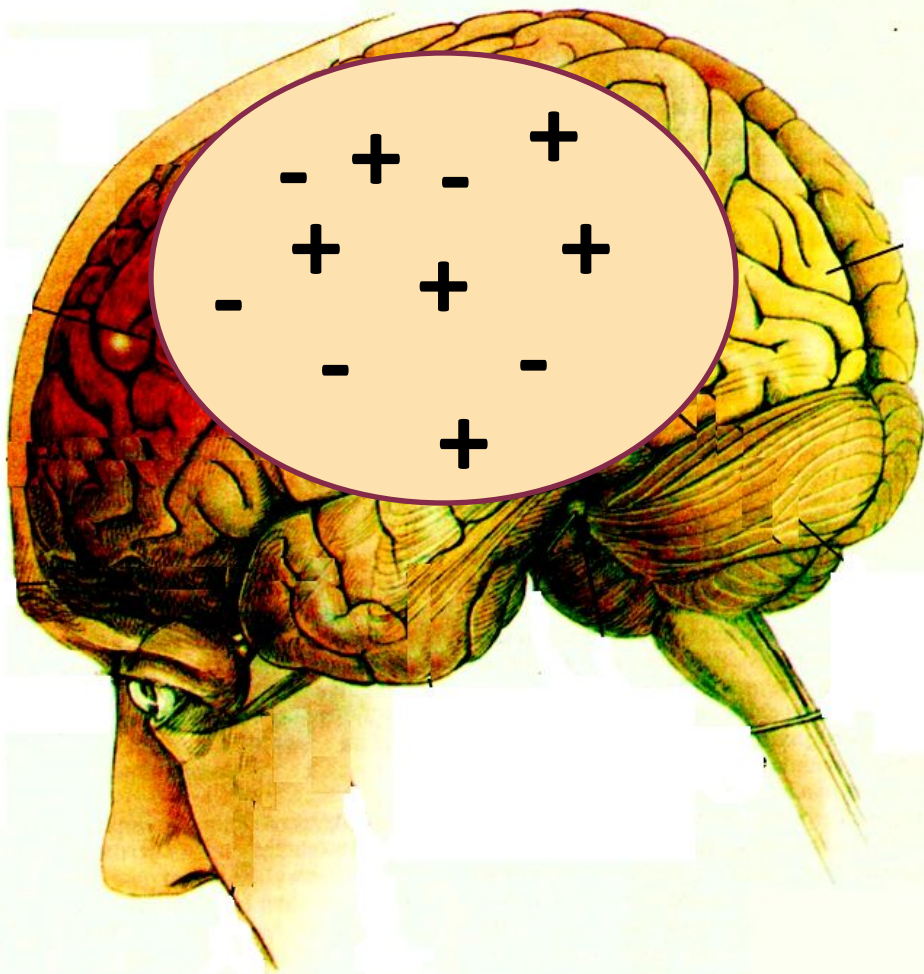
Препараты лекарственных растений: валерианы
пустырника, пассифлоры, пиона, ландыша, мяты перечной

Комплексные препараты:

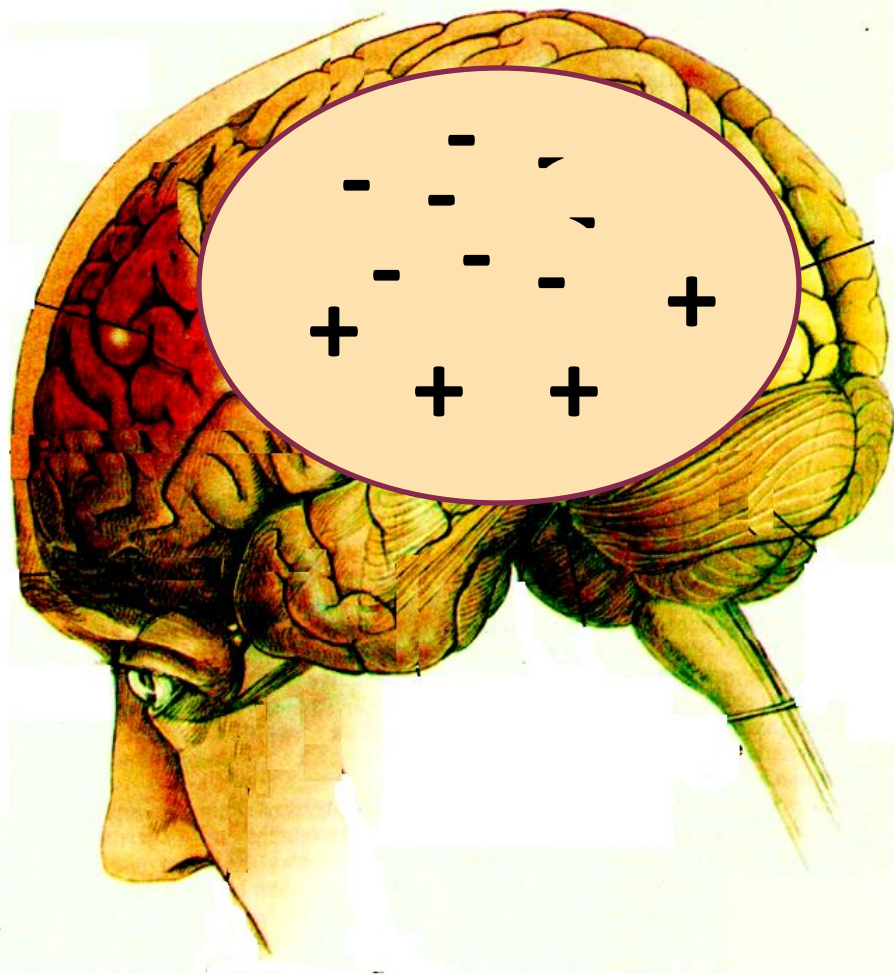
Валокордин, Валокормид, Корвалол



Влияние бромидов на процессы торможения



До введения
бромидов



После введения
бромидов

Бромиды



Известны в медицине с 1826г (И.П.Павлов)

Механизм: Усиливают в коре головного мозга процессы торможения; Облегчают выработку тормозных условных рефлексов и угасание возбуждающих рефлексов.

Дозирование в зависимости от типа ВНД

Эффективны при неврозах, нарушениях сна, вегето-сосудистых расстройствах, лечении эпилепсии

Кумулируют, накапливаются в межклеточной жидкости, вытесняют ионы Cl^-

Хроническая интоксикация (бромизм):

Общая заторможенность, ↓ памяти, кожные высыпания, кашель, насморк, конъюнктивиты

Помощь: отмена бромидов + обильное солёное питьё (до 3л в сутки)