

# Психотропные средства: нейролептики, антидепрессанты

Для студентов 2 курса «общая медицина»

Составитель: доцент Кадырова Д.М.

Алматы, 2017



*По данным экспертов ВОЗ, более 450 млн человек в мире страдают психическими или неврологическими расстройствами. В настоящий момент в мире насчитывается:*

- ◎ **120 млн.** человек с депрессией
- ◎ **37 млн.** с болезнью Альцгеймера
- ◎ **около 50 млн.** страдают эпилепсией
- ◎ **24 млн.** - шизофренией.

# СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ЦНС УГНЕТАЮЩЕГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ

## А) ОБЩЕГО (НЕИЗБИРАТЕЛЬНОГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ)

СРЕДСТВА ДЛЯ НАРКОЗА

СПИРТ ЭТИЛОВЫЙ

СНОТВОРНЫЕ НАРКОТИЧЕСКОГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ

## Б) ИЗБИРАТЕЛЬНОГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ

ПРОТИВОЭПИЛЕПТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

ПРОТИВОПАРКИНСОНОВЫЕ СРЕДСТВА

БОЛЕУТОЛЯЮЩИЕ (АНАЛЬГЕТИКИ)

НЕЙРОЛЕПТИКИ

ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ

СЕДАТИВНЫЕ СРЕДСТВА

**СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА  
ЦНС  
СТИМУЛИРУЮЩЕГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ**

**А) НЕИЗБИРАТЕЛЬНОГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ  
АНАЛЕПТИКИ**

**Б) ИЗБИРАТЕЛЬНОГО ТИПА ДЕЙСТВИЯ  
ПСИХОСТИМУЛЯТОРЫ  
НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА  
АНТИДЕПРЕССАНТЫ**

# ПСИХОТРОПНЫЕ СРЕДСТВА

Группа	
Вещества с психоседативным действием	Антипсихотические средства Анксиолитики Седативные средства
	Антидепрессанты
Вещества с психостимулирующим действием	Психостимуляторы Ноотропные средства Аналептики
Психотомиметики (галлюциногены)	ЛСД – 25, Мескалин. Марихуанна

# Шизофрения (от греческого «расщепление души»)

## Признаки

1. Потеря связи с реальностью
2. Галлюцинации
3. Бред
4. Нарушения мышления

## Позитивные

1. Бред
2. Галлюцинации
3. Причудливое поведение

## Негативные

1. Снижение мотивации
2. Эмоциональная индифферентность
3. Бледность речи
4. Снижение способности испытывать удовольствие

## Нарушения мышления

1. Снижение памяти
2. Способности логически мыслить
3. Решать проблемы











# Нейролептики

Основной эффект –  
антипсихотический

Механизм действия

1. Блокада D<sub>2</sub>-рецепторов мезолимбической системы, устранение позитивной симптоматики психозов (бред, галлюцинации).
2. Ряд нейролептиков – антагонисты 5-HT<sub>2</sub>-рецепторов, уменьшение негативной симптоматики и когнитивных нарушений.

# Седативное действие

Блокада центральных гистаминовых H1-рецепторов,  $\alpha$ -адренорецепторов

# Побочные эффекты

Экстрапирамидные нарушения –  
блокада дофаминергических  
рецепторов экстрапирамидной системы  
(лекарственный паркинсонизм)

# Классификация(по способности вызывать лекарственный паркинсонизм)

1. «Типичные»
2. «Атипичные»

# АНТИПСИХОТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА (нейролептики)

ГРУППЫ	ПРЕПАРАТЫ
<b>ТИПИЧНЫЕ</b>	
<i>1. Производные фенотиазина</i>	
А) Алифатические производные	Аминазин
Б) Пиперазиновые производные	Этаперазин, трифтазин, фторфеназин
В) Пиперидиновые производные	Тиоридазин, пипотиазин
<i>2. Производные бутирофенона</i>	Галоперидол, дроперидол
<i>3. Производные тиоксантена</i>	Хлорпротиксен
<b>АТИПИЧНЫЕ</b>	
<i>1. Производные дибензодиазепина</i>	Клозапин, оланзепин
<i>2. Производные бензизоксазола</i>	Рисперидон
<i>3. Производные сульфонилбензамида</i>	Сульпирид



# Аминазин

- Слабое антипсихотическое действие с преобладанием седативных свойств
- Оказывает общеугнетающее действие, чувство успокоения сменяется безразличием
- Потенцирует действие наркотических, снотворных средств, как наркотических, так и ненаркотических анальгетиков
- В больших дозах – снотворное действие (поверхностный сон)



# Аминазин

- Анксиолитическое действие (снижение страха, тревоги, беспокойства, психической напряженности)
- Центральное миорелаксирующее действие
- С одной стороны провоцирует судорожные приступы со скрытыми формами эпилепсии, с другой стороны уменьшается число повторных эпилептических приступов

# Аминазин

- Гипотермическое действие. Понижает даже нормальную температуру тела
- Противорвотное действие
- $\alpha$ -адренолитическая активность, расширяет сосуды. Снижает или извращает прессорную реакцию на адреналин,
  - М - холиноблокирующее

# Аминазин

- ⦿ Антигипертензивное действие
- ⦿ Противоаритмическое действие
- ⦿ Антигистаминное действие
- ⦿ Противовоспалительное действие, миотропное спазмолитическое, местноанестезирующее

# Аминазин продолжение

Повышает выделение пролактина и снижает выделение СТГ, блокирует овуляцию. Снижает продукцию гонадотропных гормонов

Уменьшает патологическое пристрастие к алкоголю

# Аминазин

## Применение

1. Шизофрения, другие психозы с агрессивностью, психомоторное возбуждение.
2. Маниакально-депрессивные психозы
3. Тревога, страх
4. Премедикация
5. Потенцирование наркоза
6. Купирование тяжелой рвоты, икоты

# Аминазин

## Побочные эффекты

1. Сонливость
2. Дезориентация
3. ↓ АД
4. Ортостатическая гипотензия
5. Нейроэндокринные нарушения (галакторея, аменорея, импотенция, гинекомастия)
6. Агранулоцитоз
7. Гемолитическая анемия
8. Фотосенсибилизация

# Продолжение

- 9. Экстапирамидные расстройства
- 10. Нейролептический синдром (повышение тонуса скелетных мышц, гипертермия, тахикардия)

# Пиперазиновые производные фенотиазина.

**Трифтазин(трифлуоперазин)- один из наиболее активных препаратов**

1. Умеренно активирующий эффект.
2. Более выраженное действие на продуктивную симптоматику психозов, чем аминазин.
3. Противорвотное действие - ↑ 20 раз, чем у аминазина.
4. Чаще вызывает экстрапирамидные расстройства.
5. Слабый адреноблокирующий эффект, гипотензивный, в меньшей степени влияет на эффект снотворных, наркотических средств, алкоголя.



# Трифтазин

## Применение

Бред с навязчивостью, неукротимая рвота

## Фторфеназин

1. Сильное антипсихотическое действие, активирующий компонент.
2. Слабое седативное, влияние на АД.
3. Частые экстрапирамидные расстройства .

# Производные бутерофенона

1. Антипсихотическая активность в 50-100 раз выше, чем у фенотиазиновых производных
2. Седативное, противорвотное действия.
3. Потенцируют действия наркотических, снотворных, алкоголя.
4. Выраженные экстрапирамидные расстройства.
5. Не влияют на АД, хорошо всасываются из ЖКТ, не оказывают холиноблокирующее действие.

# Галоперидол

Галоперидол – антипсихотическое средство с седативным эффектом.

## Применение

Острый бред, рвота.

Эффективен у больных, резистентных к другим нейролептикам.

# Дроперидол

- ◎ Дроперидол – сильное кратковременное антипсихотическое действие. В сочетании с фентанилом – таламонал – для нейролептанальгезии. для купирования острых приступов психомоторного возбуждения, гипертонического криза, купирования судорог

# Производные тиоксанта

## Хлорпротиксен

1. Уступает аминазину по выраженности антипсихотического эффекта
2. Седативный эффект
3. Выраженная противорвотная активность
4. Адреноблокирующая, холиноблокирующая, антидепрессивная активность
5. Потенцирует действие наркотических, снотворных, наркотических анальгетиков

# Хлорпротиксен

## Применение

- Психозы, в том числе алкогольные
- Противорвотное средство
- Невротические расстройства, нарушение сна

## Побочные эффекты

- Аналогичны аминазину, но менее выражены
- 2. Практически не вызывают экстрапирамидных расстройств, м-холиноблокирующая активность

# 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 D<sub>2</sub>, D<sub>4</sub>, 5-HT и МХР

*Проявляются:*

**Мышечной ригидностью** - ↑ тонуса  
скелетных мышц

**Тремором** – постоянное непроизвольное  
дрожание

**Гипокинезией** - скованностью движений



# Атипичные нейролептики

1. Реже и в меньшей степени вызывают экстрапирамидные расстройства и нейроэндокринные нарушения
2. Эффективны при терапии негативной и продуктивной симптоматики и ряда когнитивных нарушений.
3. В большей степени блокируют 5-HT<sub>2</sub> A-рецепторы, чем D<sub>2</sub>.



# Производные бензодиазепина

Клозапин ( эффективное средство с седативным эффектом), оланзапин

1. Блокируют D4 и 5-HT2-A-рецепторы
2. М-холинорецепторы
3.  $\alpha_1$ -адренорецепторы

## Применение

1. Шизофрения
2. Эффективность при резистентности к другим нейролептикам

## Побочные эффекты

Гранулоцитопения, диабетогенный, повышение аппетита и массы тела, сонливость, апатия

# Производное бензизоксазола

Рisperидон с активирующим компонентом

1. Блокирует 5-HT<sub>2A</sub> рецепторы, D<sub>2</sub>, Альфа-адренорецепторы и H<sub>1</sub> гистаминовые рецепторы
2. Практически не влияет на M-холинорецепторы
3. В малых дозах – атипичный нейролептик, в больших – типичный
4. Эффективен в лечении резистентных форм шизофрении

# Производное бензамида

## Сульпирид

Блокирует D<sub>2</sub> и D<sub>3</sub> рецепторы

1. Умеренная антипсихотическая активность, сочетается со слабыми антидепрессивными и стимулирующими свойствами
2. Выраженное противорвотное действие, в 140 раз ↑ чем у аминазина, цитопротекторный эффект(при язвенной болезни)

# Продолжение

- Применение: психозы с вялостью, заторможенностью, при алкогольных психозах, для лечения негативной симптоматики психозов

# Противопоказания к применению антипсихотических средств

- ⦿ 1. Болезнь Паркинсона
- ⦿ 2. Эпилепсия
- ⦿ 3. Глаукома
- ⦿ 4. Беременность
- ⦿ 5. Кормление грудью

# Антидепрессанты



Депрессиями страдает около 5% населения в мире.

- По данным ВОЗ 20-25% женщин и 7-12% мужчин хотя бы 1 раз в жизни перенесли депрессивный эпизод и 1/3 получила лечение.
- 67% всех самоубийств совершают больные, страдающие депрессией.
- 90% депрессий являются маскированными и больные не обращаются к врачу или предъявляют соматические жалобы.
- Эффективность АД при депрессиях составляет 60-70%.
- Обнаружена высокая эффективность АД при психосоматических заболеваниях (пептическая язва, нейродермит, анорексия, булимия, нарколепсия, мигрень, кардиалгия, онкологические боли, энурез, синдром дефицита внимания).

# Виды депрессии

- 1. Тревожная
- 2. Заторможенная

# Антидепрессанты

- ⦿ Улучшают пониженное настроение
- ⦿ Вызывают эмоциональный подъем



# Антидепрессанты

## ◎ Антидепрессивное действие

1. Седативное действие - общее успокоение, снижение напряженности, тревожности, уменьшение двигательного беспокойства

2. Стимулирующее – проявляется в активации психической деятельности, уменьшение двигательной заторможенности

# Классификация

по химическому строению

- Трициклические
- Четырехциклические

# Классификация

По механизму действия:

I. Средства, угнетающие  
нейрональный захват моноаминов:

1. Неизбирательного действия,  
блокирующие нейрональный захват  
серотонина и норадреналина

Имизин

Амитриптилин

# Классификация

Избирательного действия:

- а) блокирующие нейрональный захват серотонина:
  1. Пароксетин
  2. Флуоксетин
  3. Сертралин
- б) блокирующие нейрональный захват норадреналина: 1. Мапротилин

# Классификация

## II. Ингибиторы моноаминоксидазы.

### 1. Неизбирательного действия (ингибиторы МАО-А и МАО-В)

необратимого действия: **Ниламид**

### 2. Избирательного действия (МАО-А) : **Пиразидол** **Моклобемид**

### 3. Антидепрессанты из других групп: **Тианептин (коаксил)**

# Амитриптилин

## Фармакологические эффекты

- Антидепрессивный
- Седативный
- М – холиноблокирующий
- Альфа - адреноблокирующий
- Антигистаминный
- Анальгетический

## Фармакокинетика

- Хорошо всасывается
- Связывается с белками более 90

# Амитриптилин

## Показания к применению

- ⦿ Эндогенные депрессии
- ⦿ Тревожно – депрессивные
- ⦿ Хронические боли

# Имизин

## Фармакологические эффекты

- ⊙ Антидепрессивный
- ⊙ Стимулирующий
- ⊙ Седативный
- ⊙ М – холиноблокирующий, антигистаминный, альфа - адреноблокирующий( меньше, чем у amitriptiline)

Показание к применению

Депрессия в сочетании с астенией



# Мапротилин

**Механизм действия**

**Ингибирование обратного нейронального захвата норадреналина**

**Фармакологические эффекты**

- ⦿ Антидепрессивный
- ⦿ Анксиолитический
- ⦿ Седативный (умеренный)
- ⦿ М – холиноблокирующий (умеренный)
- ⦿ Альфа – адреноблокирующий (умеренный)

# Показания к применению

- Тревожно – депрессивные расстройства

## Побочные эффекты

- Сухость во рту
- Запор
- Задержка мочеиспускания
- Головная боль
- Парестезии
- Сонливость

# Избирательные ингибиторы нейронального захвата серотонина

Пароксетин

Механизм действия

- Ингибитор обратного захвата серотонина

Фармакологические эффекты

- Антидепрессивный, анксиолитические
- Седативный, слабовыраженный м – холиноблокирующий, антигистаминный

Показания к применению

- Тяжелые депрессивные расстройства

# Флуоксетин

- Фармакологические эффекты
- Антидепрессивный
- Психостимулирующий (незначительный)
- М – холиноблокирующий (незначительный)
- Альфа – адреноблокирующий и антигистаминный – отсутствуют
- Малотоксичный

# Сетрталин

## Фармакологические эффекты

- ⦿ Антидепрессивный
- ⦿ Седативный
- ⦿ Не влияет на периферическую иннервацию

# Ингибиторы моноаминоксидазы (необратимые

Ниаламид

Механизм действия

Блокирует MAO A и MAO B

Показания к применению

- Депрессия с астеническим синдромом (вялостью, заторможенностью)

Побочный эффект

- «Сырный криз»

# Ингибиторы моноаминоксидазы (обратимые)

Моклобемид

Механизм действия

- Блокирует MAO A

Фармакологические эффекты

- Тимоаналептический
- Психостимулирующий
- M – холиноблокирующий (слабый)

Показание к применению

- Депрессии с гипо – и анергетическими расстройствами
- действует кратковременно, не оказывает гепатотоксический эффект.

СЕРТОНИНЕРГИЧЕСКИЙ НЕЙРОН

АДРЕНЕРГИЧЕСКИЙ НЕЙРОН

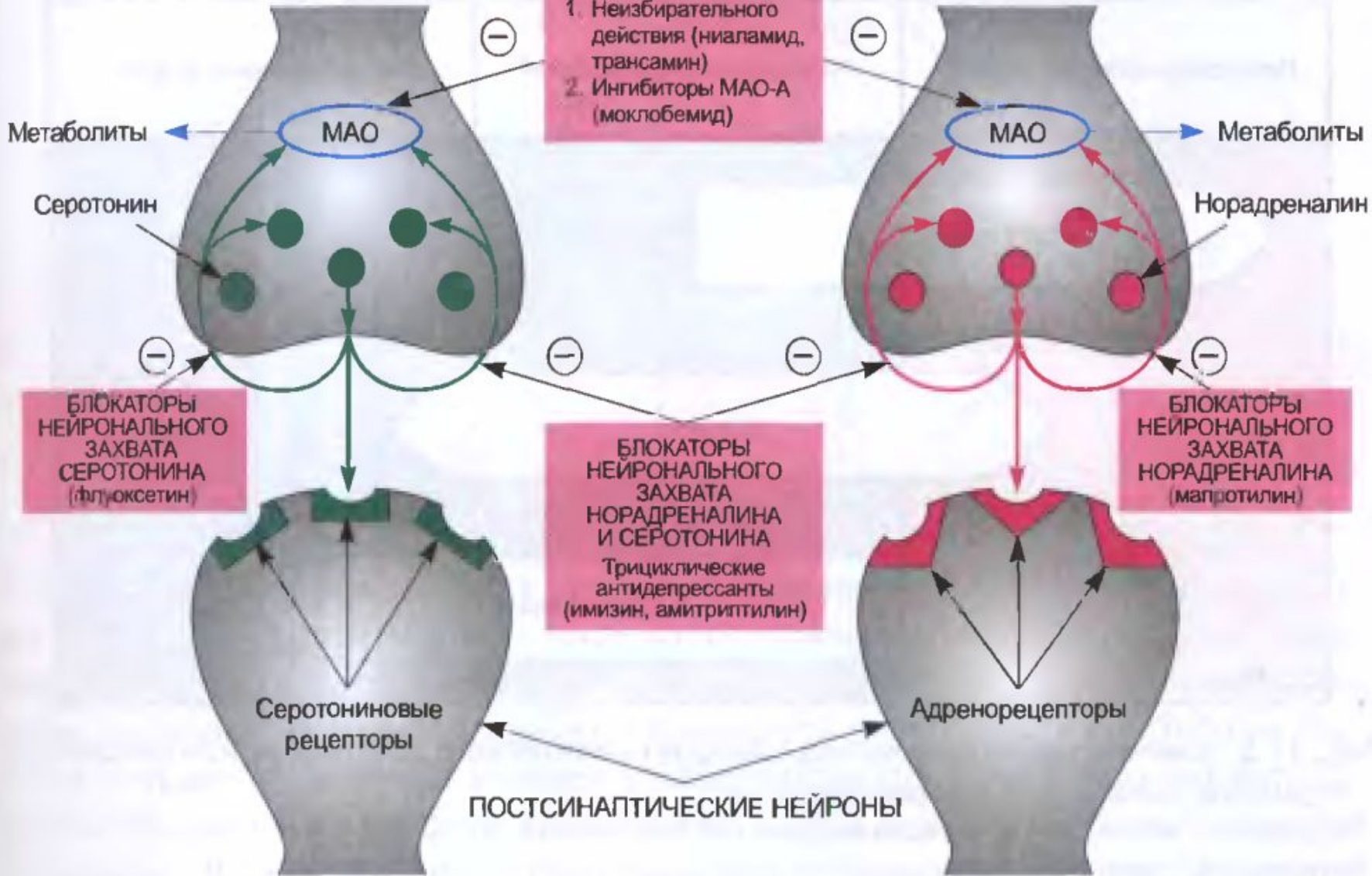
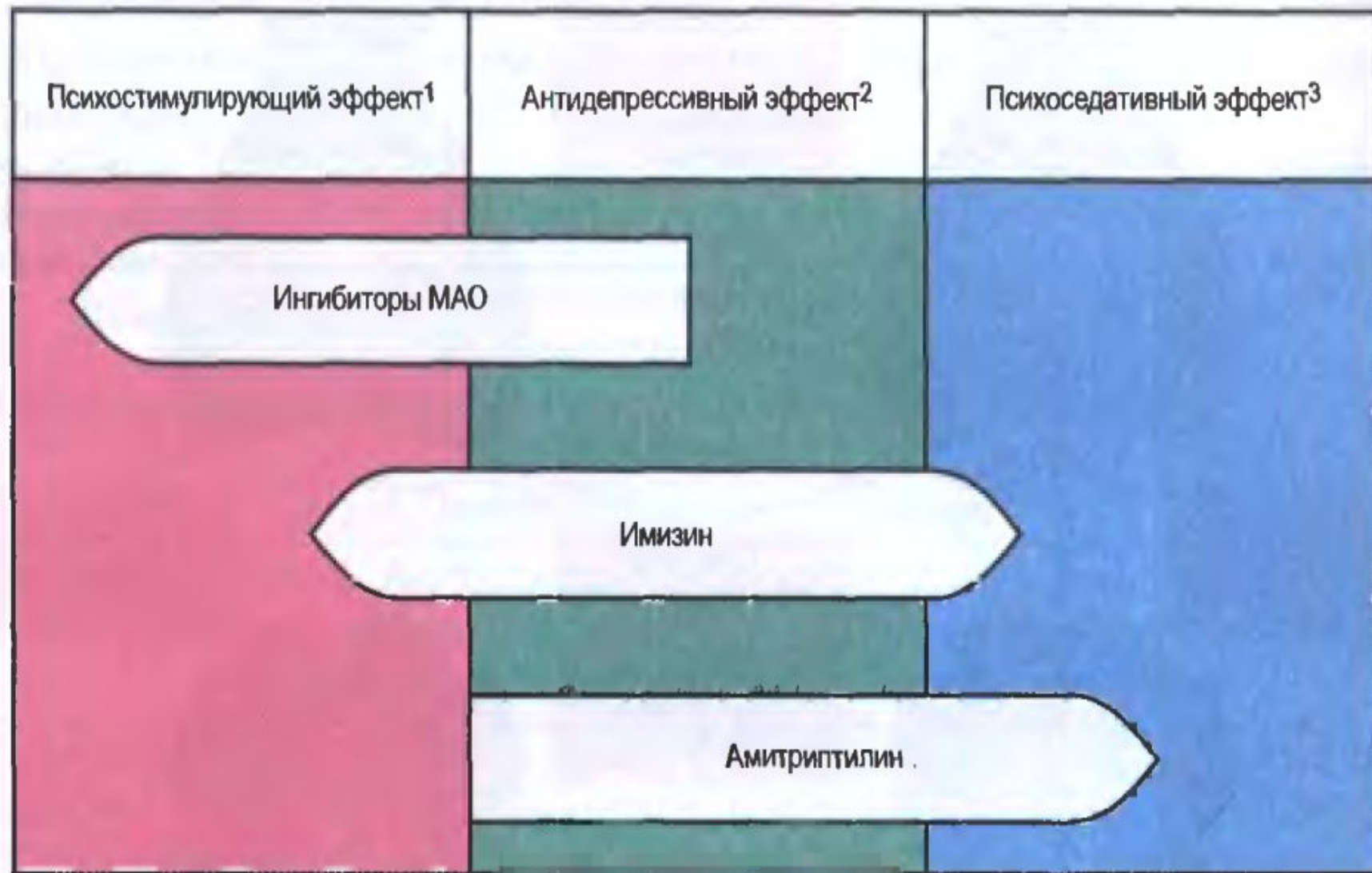


Рис. 11.1. Основная направленность действия антидепрессантов.





**Рис. 11.2.** Клиническая характеристика спектров психотропного действия антидепрессантов.

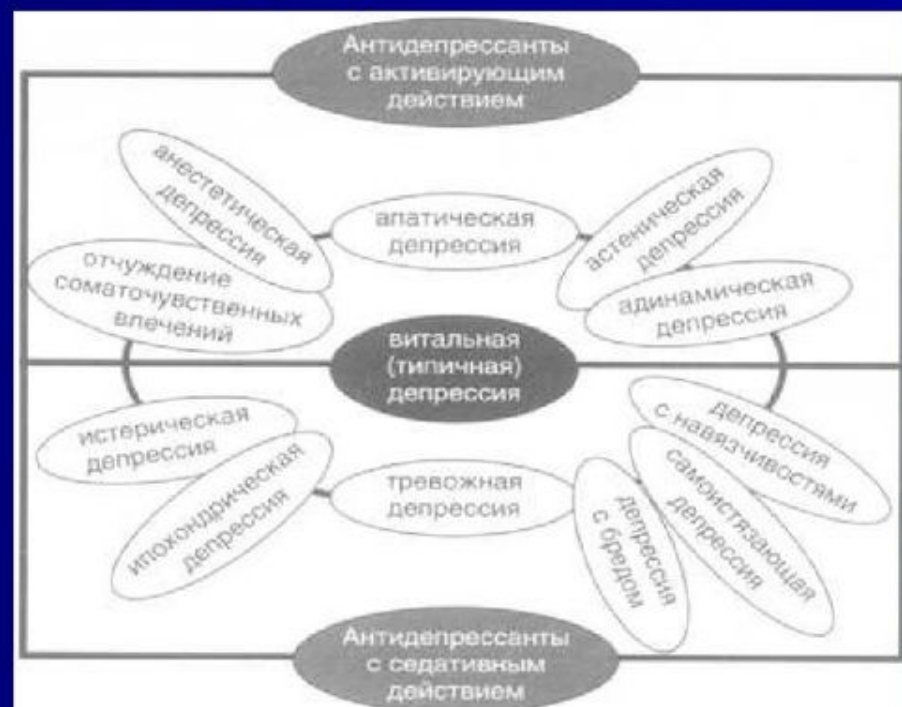
<sup>1</sup> Устранение психической заторможенности.

<sup>2</sup> Устранение пониженного («отрицательного») настроения.

<sup>3</sup> Устранение тревоги и страха.

## Показания к применению.

- Депрессивные состояния разной этиологии;
- психосоматические заболевания (ИБС, хронический болевой синдром);
- функциональный ночной энурез;
- фобии;
- анорексия;
- булимия;
- ночное апноэ;
- мигрень (с бета-АБ);





## **Побочные эффекты и осложнения.**

**1. Снижение АД и гипотензия** – трициклические АД - в начале терапии, ингибиторы МАО - на 2 неделе лечения, связано с уменьшением выделения НА.

### **2. Кардиомиопатии.**

*Нарушение АВ-проводимости (накапливаются в миокарде). Трициклические АД (имизин и amitриптилин) в высоких дозах обладают хинидиноподобным действием, нарушая проводимость и сократимость миокарда.*

### **3. Атропиноподобное действие:**

- сухость во рту - множественный кариес зубов, нарушение глотания,
- мидриаз и повышение ВГД, нарушение аккомодации,
- гиперпирексия,
- тахикардия,
- запор, задержка мочеиспускания и эякуляции,
- в тяжелых случаях делирий.

Чаще вызывают трициклические АД. Купируются АХЭС.

### **4. Лейкопения.**

**5. Нейротоксичность.** Головокружение сонливость, седация(амитриптилин), судороги



**5. «серотониновый синдром» вызывают селективные ингибиторы захвата серотонина (особенно в комбинации с неселективными ингибиторами МАО):**

- тошнота, диарея, колики из-за способности накапливать С. в стенке кишки,
- экстрапирамидные расстройства, тремор, гипертонус, миоклонические подергивания,
- повышение АД,
- при утяжелении состояния маниакальноподобное состояние, гиперактивность, нарушение сна,
- в финальной стадии- профузный пот, повышение температуры, маскообразное лицо, сердечно-сосудистая недостаточность и смерть.
- Не обладают М-ХБ действием.

**6. Терапевтическое действие;**

**7. гепатотоксичность** (неселективные ингибиторы МАО);

**8. аллергические реакции;**

**9.увеличение веса** (имизин).