

*"Поясніть людям
значення слів і
половина непорозумінь
і суперечок зникнуть
самі собою"*

Декарт



Психотропні
засоби.
Невролептики.
Транквілізатори.
Седативні засоби.

План лекції

1. *Класифікація психотропних препаратів.*
2. *Седативні засобів. Класифікація та фармакологічна характеристика.*
3. *Транквілізатори. Класифікація транквілізаторів. Механізм транквілізуючої дії, поняття про бензодіазепінові рецептори. Поняття про атипові транквілізатори.*
4. *Фармакологічна характеристика транквілізаторів.*
5. *Загальна характеристика нейролептиків, класифікація за хімічною структурою.*
6. *Фармакологічні ефекти і механізми дії нейролептиків. Показання до застосування. Побічні ефекти.*
7. *Нормотиміки. Класифікація. Фармакодинаміка.*

Психотропні засоби – це засоби різного походження, які володіють здатністю відновлювати порушенні психичні функції: увагу, навчання і пам'ять, сприйняття, настрій і емоції, мислення



ПСИХОТРОПНІ ЗАСОБИ



з переважно
ДЕПРИМУЮЧИМ
(тормозним, пригнічуючим
типом дії)

- Седативні
- Транквілізатори
- Нейролептики
- Нормотиміки



з переважно
ЗБУДЖУЮЧИМ
(активуючим, стимулюючим
типом дії)

- Психостимулючі
- Антидепресанти
- Ноотропи
- Адаптогени



За даними експертів ВОЗ більш 450 млн чоловік у світі страждають на психічні або неврологічні розлади.

У теперішній момент у світі нараховують:

- 120 млн. чоловік із депресією
- 37 млн. чоловік з хворобою Альцгеймера
- біля 50 млн. страждають на епілепсію

Новые медицинские технологии.- 2001., №6.

СЕДАТИВНІ АБО ЗАГАЛЬНОЗАСПОКІЙЛИВІ ЗАСОБИ

(от лат. *sedatio* – заспокоєння)

– це лікарські засоби, які відновлюють функціональний стан ЦНС, шляхом послаблення надмірного збудження або посилення процесів послабленого гальмування в нервовій системі при астеничних та психоемоційних розладах, які попередній невротичній патології

Sedativa

Рослинного походження

а) монопрепарати з:

- Валеріаною
- Пустирником
- М'ятою
- Мелісою
- Пасіфлорою
- Хмелем
- Піоною

Неорганічної природи:

- NaBr
- KBr

Комбіновані засоби

- Корвалол (з м'ятою)
- Корвалдин (з м'ятою і хмелем)
- Валокордин (з м'ятою і хмелем)
- Валокармід (валеріана+лонджи+
+хміль+конваліія+ментол+NaBr)
- Бромкамфора
- Пертусин (чебрець +KBr)



б) комбіновані препарати рослинного походження.

- Збір заспокійливий (валеріана+м'ята+деревій+хміль)
- Персен (валеріана+м'ята+меліса)
- Ново-пасит (бузина+глод+зверобій+меліса+пасіфлора+хміль+валеріана)
- Фітосед (глод+пустирник+хміль+овес+меліса+кориандр+буркун)
- Санасон (валеріана+хміль)
- Нервогран (м'ята+меліса+ромашка+валеріана+деревій)
- Нервофлукс (лаванда+меліса+солодка+хміль+валеріана+помаранча)

Механізми седативної дії

Препарати рослинного походження:

знижують збудливість
нейронів активуючої
(пробуджуючої, збудливої,
стимулюючої) системи
головного мозку —
новоутворень ретикулярної
формації середнього мозку
та деяких ядер таламуса, що
призводить до обмеження
аферентної (висхідної)
імпульсації до кори
головного мозку

Броміди:

діють переважно на **кору великих півкуль**, посилюючи явища гальмування і спадний гальмівний контроль за діяльністю вищих емоціогенних і вищих вегетативних центрів мозку



ПОКАЗАННЯ ДО ПРИЗНАЧЕННЯ СЕДАТИВНИХ ЗАСОБІВ

- *Передневротичні розлади з підвищеною збудливістю і супроводжуваним коронарним спазмом, тривогою, почуттям страху, головним болем, втомою*
- *Безсоння*
- *Підвищена судомна готовність у дітей*
- *Гіпертиреоз*
- *Клімактеричні порушення*
- *Нейроциркуляторна дистонія*
- *Спазми гладкої мускулатури*





Транквілізатори

(від лат. *“tranquillo-are”* – робити спокійним, безтурботний)
або **АНКСІОЛІТИКИ** (від лат. *anxius* – тривожний,
охоплений страхом, тобто “протитурботні”), або
АТАРАКТИКИ (від лат. *ataraxia* – незворушність духу,
душевний спокій)

– лікарські засоби, які надають заспокійливу дію, але в малих терапевтичних дозах усувають внутрішню психоемоційну напругу, занепокоєння, почуття страху, ненависті та страху невротичної природи



Класифікація транквілізаторів

Похідні 1,4- бензодіазепіну

- діазепам (*валіум, реланіум, сибазон, седуксен*)
- хлордіазепоксид (еленіум)
- медазепам (*рудотель*)
- алпразолам (*ксанакс*)
- тофізопан (*грандаксин*)
- лоразепам (лорафен)
- гідазепам
- феназепам

Транквілізатори різних хімічних груп

- буспірон (*спітомін*)
- гідроксизин
- мебікар

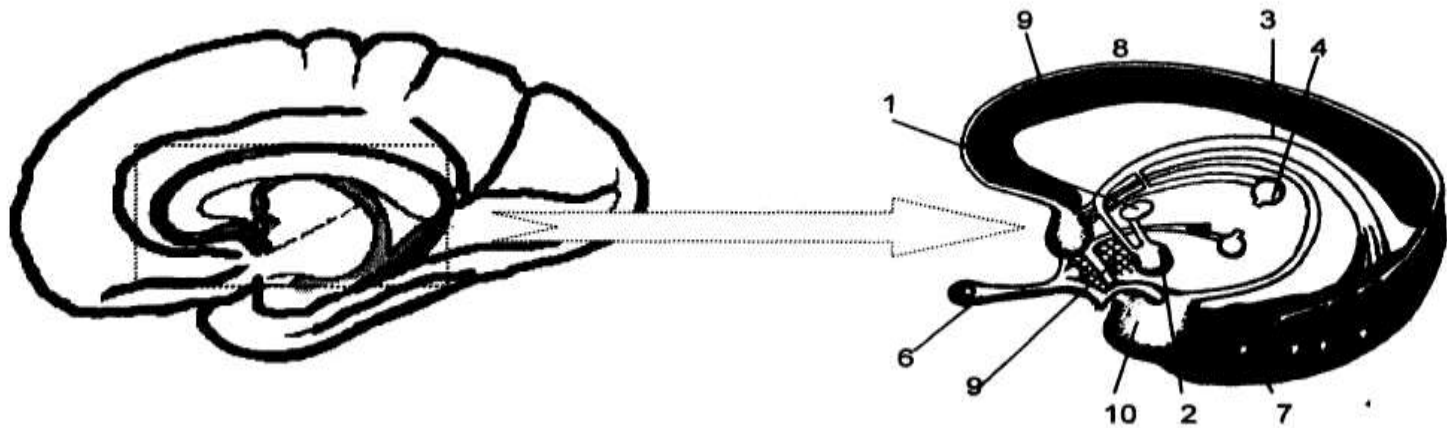


Рисунок Основні точки дії транквілізаторів і нейролептиків в утвореннях головного мозку, які беруть участь у формуванні емоцій:

Транквілізатори

Структури великого лімбічного кола:

(морфофункціональний субстрат внутрішнього психоемоційного стану – емоцій)

- 1 - ядра таламусу
- 2 - сосцеподібне тіло
- 3 - мозолисте тіло
- 4 - ствол мозку
- 5 - поясна звивина
- 6 - нюхова цибулина
- 7 - гіпокамп
- 8 – звід

Структури малого лімбічного кола:

- 9 - гіпоталамус
 - 10 - міндалеподібний комплекс
- (морфофункціональний субстрат зовнішнього психоемоційного стану – емоцій)*

Нейролептики

ТРАНКВІЛІЗАТОРИ

види дії на організм

Гіпноседативна

Вегетокоригуюча

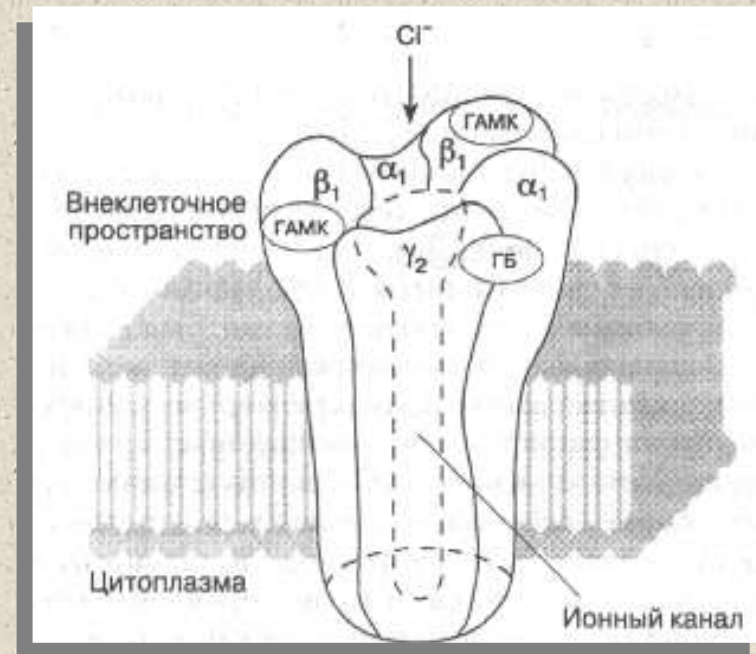
Протисудомна

Міорелаксуюча

Виражена
АНКСІОЛІТИЧНА
(протитривожна)

ГАМК_{A1} - високоафінні, не мають БД-сайта
ГАМК_{A2} - низькоафінні, мають БД-сайт
ГАМК_{A1} - рецептори – не мають БД-сайта

тобто, БД-рецептори є тільки
на БД-ГАМК_{A2}-рецепторному
комплексі



ЦБДР тільки в мозку

ПБДР на периферії і в мозку

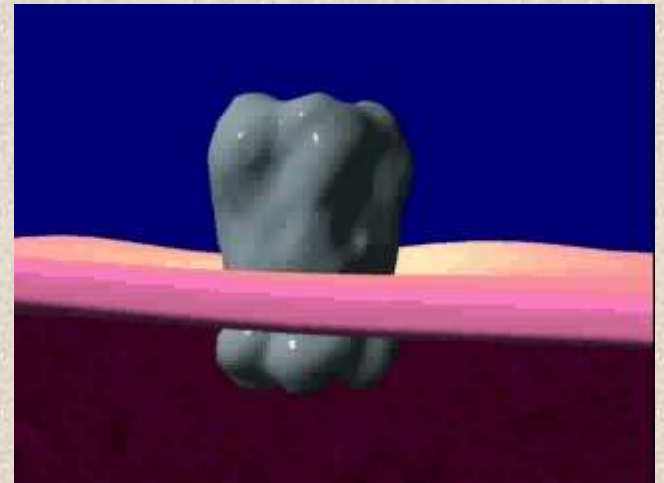
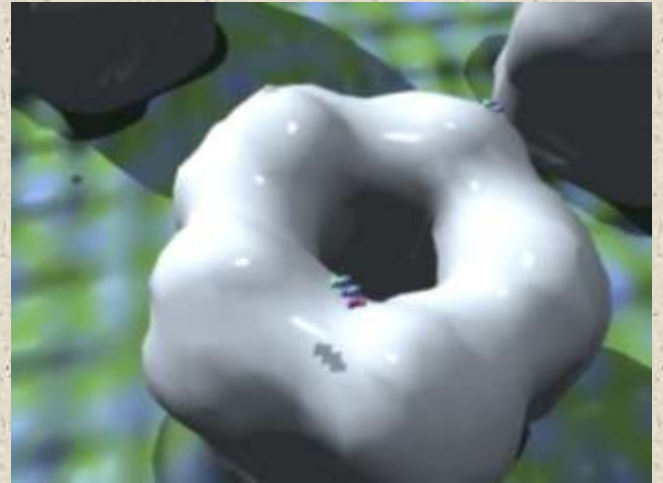
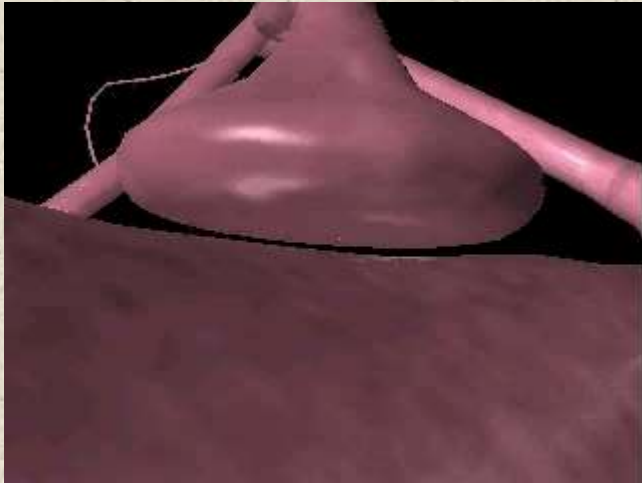
ПБДР в мозку

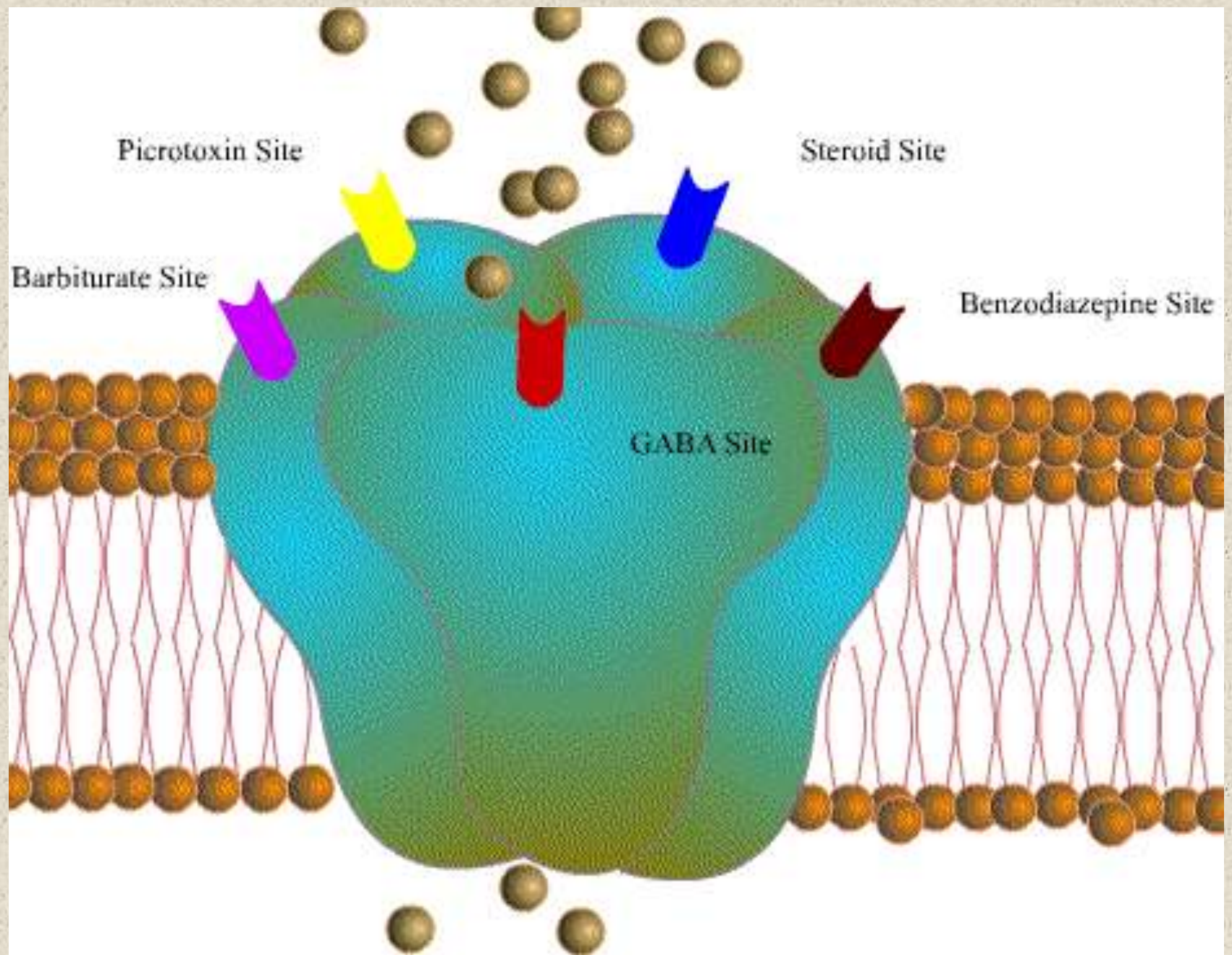
(зв'язані не стільки з нейрональними структурами, скільки з глією)

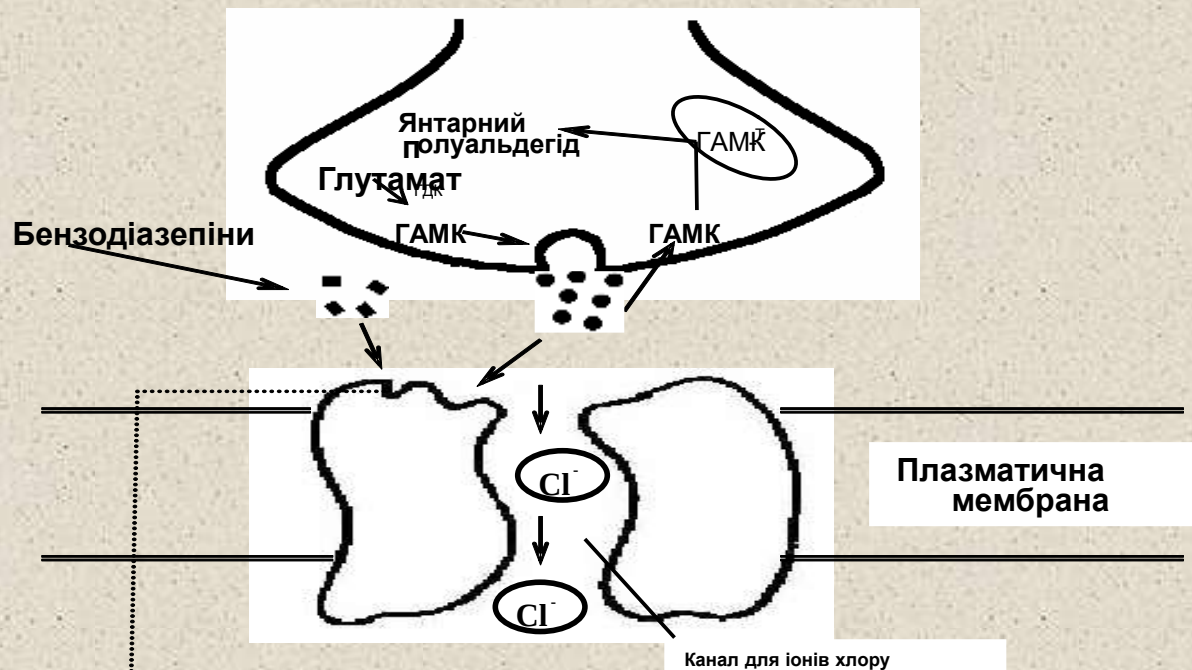
судомна
готовність мозку

анксіолітичний
або анксіогенний
ефекти

седативна
дія







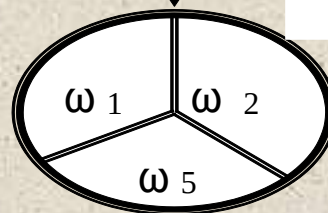
Рецептор на постсинаптичній мембрані =
 ГАМК - Cl^- - іонофорний комплекс

Гіпногенна дія

Точка додаєтків дії :

- ✓ Барбітуратів (наркозні, снодійні)
- ✓ Бензодіазепінів (наркозні, транквілізатори, протисудомні снодійні)
- ✓ ГАМК-тропні (наркозні, транквілізатори, снодійні, ноотропи)
- ✓ Похідні циклопіррону і імідазопіридину (снодійні : зопіклон = імован; золпідем = івадал, амбієн)

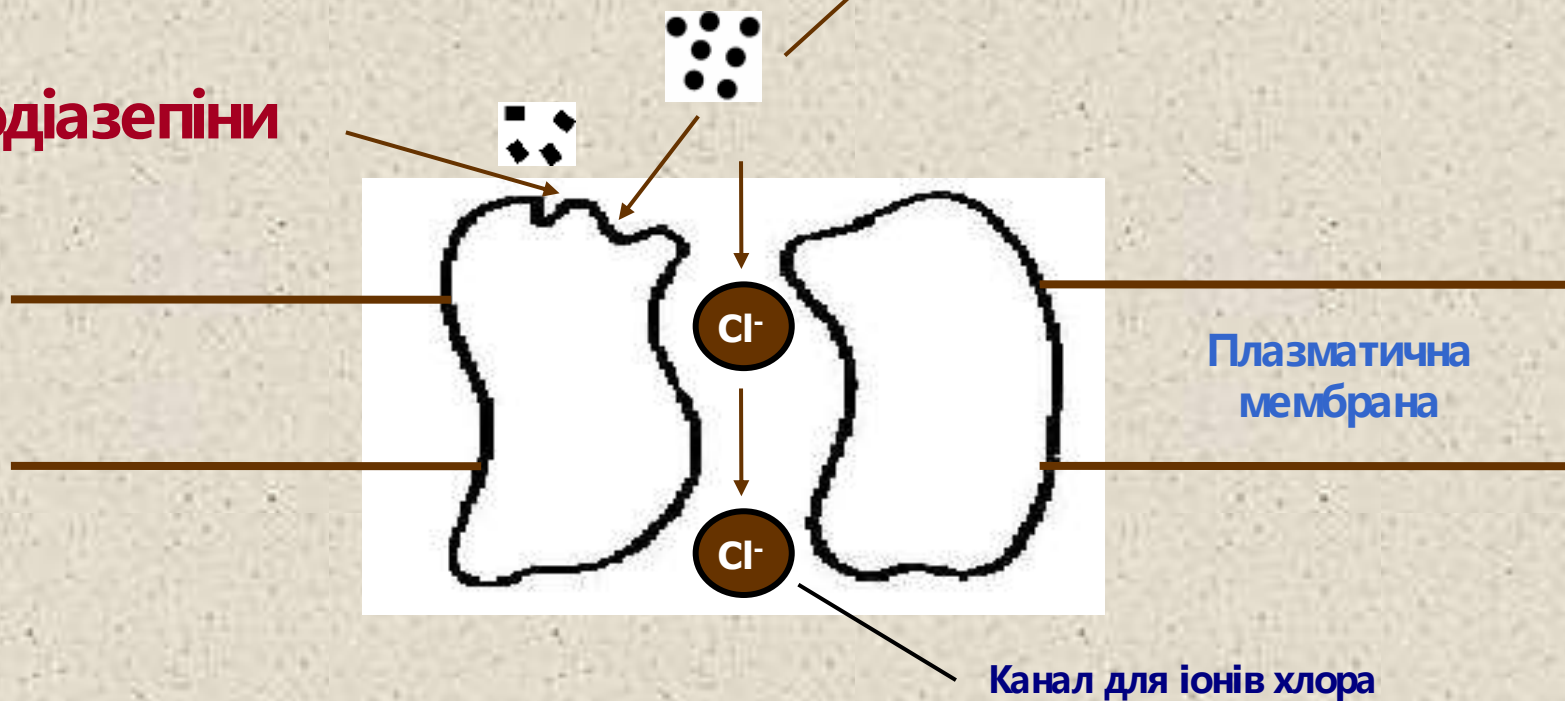
Підтипи БД сайта



Міорелаксуючі,
 протисудомні,
 седативні



Бензодіазепіни



**Рецептор на постсинаптичній мембрані –
це БД-ГАМК-Cl⁻-іонофорний комплекс**

Механізм анксіолітичної дії бензодіазепінов

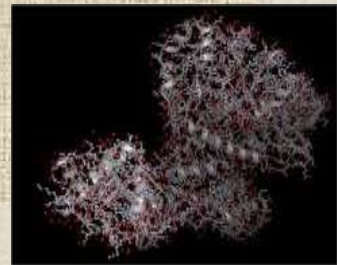
На *фізіологічному рівні* обумовлений здатністю знижувати активність нейронів в структурах великого лімбічного круга (*морфофункціональний субстрат внутрішнього психоемоційного стану – емоцій*), а також гальмувати активуючу систему ретикулярної формації ствола мозку

Нейрохімічні механізми дії БД зв'язаний з їх здатністю взаємодіяти з ГАМКа-БД-Cl⁻-іонофорним комплексом мембрани нейронів. Це призводить до відкриття хлорних каналів та входу (*вхід, вхід і ще раз вхід*) іонів хлору всередину клітини. У результаті цього збільшується «негативність» внутрішньої поверхні мембрани, тобто розвивається її гіперполяризація та знижується збудження нервових клітин

Механізм анксіолітичної дії бензодіазепінів

Небензодіазепінові транквілізатори
(*буспірон (спітомін), гідроксизин, мебікар*)
володіють вибірковою анксіолітичною дією, які
обумовлені гальмуванням **функціональної**
активності серотонінергічних нейронів
центрального сірого засобу біля
водопровідного простору и ядер шву

Це відбувається внаслідок активації
буспіроном ГАМКв-рецепторів, розташованих
пресинаптично й неспряжених з БД-
ділянками зв'язування



Показання до призначення **ТРАНКВІЛІЗАТОРІВ**

- Невротичні розлади, які супроводжуються почуттям страху і тривоги, безсонням і т.ін.
- Судомний синдром та епілепсія
- Мігрень
- Клімактеричні розлади
- Екзема, сверблячі дерматити
- Депресивні стани
- Лікування наркоманії та алкоголізму
- Потенціювання дії снодійних засобів та анальгетиків
- Премедикація перед хірургічними втручаннями



Побічні реакції транквілізаторів

- Сонливість, зниження уваги
- Головокружіння
- Нудота, запор
- Шкіряний свербіж
- Уповільнення нервово-м'язової реакції
- Порушення менструального циклу
- Звикання, пристрасть

Протипоказання до застосування транквілізаторів

- *Гострі захворювання печінки і нирок*
- *Вагітність, період лактації*
- *Міастенія*
- *Глаукома*
- *Дихальна недостатність*
- *Депресія*
- *Не слід призначати особам, робота яких потребує уваги та швидкої рухової реакції*



Психоз

(психотичний або афективний розлади)

– глибокий хворобливий стан психіки, що виявляється неадекватним відображенням реального світу *(свідомості, усвідомлення реальної дійсності)* з порушенням поведінки, зміною психічної діяльності *(мислення, емоцій, навчання, пам'яті)*, з виникненням галюцинацій, марення, психомоторних, афективних розладів, потьмарення свідомості тощо

НЕЙРОЛЕПТИКИ

(антипсихотичні засоби)

– група лікарських препаратів здатних редукувати психотичну або афективну симптоматику (*галюцинації, марення, аутизм*) та психомоторне збудження (*агресивність та імпульсивність*) і тим самим, уповільнювати темп розвитку психозу і викликати його регрес



НЕЙРОЛЕПТИКИ

```
graph TD; A[НЕЙРОЛЕПТИКИ] --> B[Типові]; A --> C[Атипові]
```

Типові

(які викликають екстрапірамідні розлади):

- **похідні фенотиазину**
хлорпромазин (*аміназин*)
левопромазин (*тизерцин*)
флуфеназин (*модитен депо*)
трифлуоперазин (*трифтазин*)
періциазин (*неулептил*)
тиоридазин (*ридазин, сонапакс*)
- **похідні тіоксантену**
хлорпротиксен (*труксал*)
флупентиксол (*флюанксол*)
цуклопентиксол (*клопіксол*)
- **Похідні бутирофенону**
галоперидол (*галопер, сенорм, транкодол*)
дроперидол

Атипові

(які не викликають екстрапірамідні розлади):

- **бензаміди**
сульпірид (*рестфул, еглоніл*)
амісульприд (*соліан*)
- **похідні дібензодіазепіну**
клозапин (*алемоксан, лепонекс*)
оланзапін (*зипрекса*)
кветиапін (*сероквель*)
- **производные бензиоксазола**
рисперидон (*рисполепт*)

Дофамінергичні системи мозку



Нейролептики (антипсихотичні засоби)



Види дії

1. **Chlorpromazinum**
(Аминазин)
2. **Droperidolum**
3. **Трифтазин**
4. **Галопервдол**
5. **Хлорпротиксен**
6. **Цуклопентиксол**
7. **Клозапін**
8. **Оланзапін**
9. **Фторфеназин**
10. **Сульпірид**
11. **Рісперидон**

1. **Антипсихотичний**
(основний)
2. **Седативний**
3. **Гіпотермічний**
4. **Гіпотензивний**
5. **Протиблювотний**
6. **Антигістамінний**
7. **Антианемічний**
8. **Потенційний на дію**
анальгетиків,
снодійних,
протисудомних

Механізми фармакологічної дії

1. Блокада D2-дофамінових рецепторів у мезолімбічній і мезокортикальній системах мозку
2. Гальмування активності нейронів ретикулярної формації ствола мозку та її адренорецепторів
3. Забезпечується порушенням теплопродукції (вплив на центр терморегуляції) і посиленням тепловіддачі (розширення периферичних судин)
4. Обумовлено розширенням периферичних судин (блокада α_1 -адренорецепторів) та пригніченням центральних механізмів регуляції судного тону (пригнічення адренергічних синапсів заднього гіпоталамусу і вазомоторного центру)
5. Пов'язано з пригніченням дофамінергічних рецепторів пускової зони блювотного центру

Закреп
Сухість у роті
Порушення зору
Ускладнене сечовипускання

Вплив на психіку

Антипсихотична та
седативна дія

Кора
Лимбічна система

Мезолімбічний
шлях

Блокада
М-холинорецепторів

Нейролептики

Блокада D₂-
дофамінових
рецепторів

Нігро-
стриарний
шлях

Базальні ганглії
(смугове тіло)

Блокада
α-адренорецеп-
торів

Тубероінфунди-
булярний шлях

Рухові
розлади

Гіпофіз

↑
Пролактин

Ендокринні
порушення

Блокада
серотонінових і
гістамінових
рецепторів

Паркінсонізм
Акінезія
Дискінезія
в тому числі
пізня

Гінекомастія
Галакторея
Порушення менструального
цикла
Імпотенція
Збільшення маси тіла

Ортостатична
гіпотензія
Гіпотермія

ПОКАЗАННЯ ДО ПРИЗНАЧЕННЯ НЕЙРОЛЕПТИКІВ

- Психози (*шизофренія, маніакально-депресивний психоз*)
- Невротичні розлади
- Премедикація (*підготовка до наркозу і операції*)
- Нестримна блювота
- Дерматози
- Гіпертермія
- Нейролептаналгезія
- Гіпертонічний криз





Манія

(одна з основних форм психозу)

– **хворобливий стан, який характеризується піднесеним, радісним або швидкозмінним** (незалежно від об'єктивних обставин) **настроєм**, прискоренням асоціативних процесів (мислення) аж до «скачки» ідей та думок, підсиленою (але не завжди продуктивною) діяльністю, розгальмуванням потягів.

Найбільш ядро і повно маніакальний синдром виражений при маніакально-депресивному психозі, рідко – **при шизофренії, екзогенних й органічних захворюваннях головного мозку та ін.**

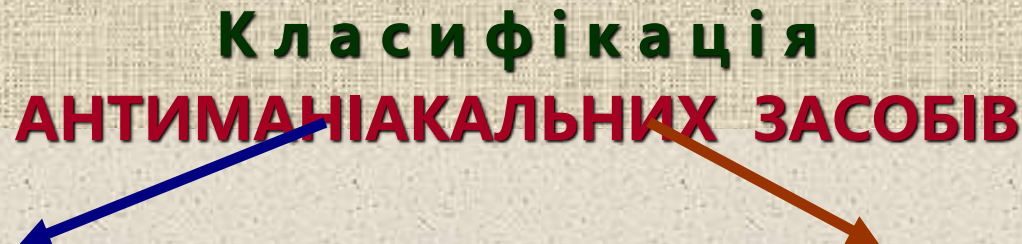
Найбільш багаточисельними (тяжкими для оточуючих) різновидами манії є: **манія величі, поєднання манії з маренням величі, весела манія, гнівлива манія, шалена манія, непродуктивна манія тощо**

АНТИМАНІАКАЛЬНІ ПРЕПАРАТИ

(засоби для лікування маній, нормотиміки
або «стабілізатори настрою»)

– це лікарські засоби, здатні запобігати змінам настрою у пацієнтів з біполярними афективними (*маніакально-депресивними*) розладами

Класифікація АНТИМАНІАКАЛЬНИХ ЗАСОБІВ



ПРЕПАРАТИ ЛІТІЮ:

- літію карбонат (*літосан, квілоніум, контемнол*)
- микаліт
- літію оксибутират

Препарати інших фармакологічних груп, які володіють нормотимічними властивостями:

- карбамазепін
- вальпроат
- клоназепам
- ніфедипін
- верапаміл

МЕХАНІЗМ НОРМОТИМІЧНОЇ ДІЇ ПРЕПАРАТІВ ЛІТІУ

Li⁺ є антагоністом Na⁺, що послаблює розвиток деполяризації мембрани та знижує збудливість нервових і м'язових клітин

препарати **літію** блокують активність інозитол-1-фосфатази, порушують утворення інозитолтрифосфату і діацилгліцеролу, які є внутрішньоклітинними медіаторами, що зумовлюють стимуляцію серотонінових (5HT₂-) рецепторів, α₁-адренорецепторів, M₁-холинорецепторів у мембрані нервових клітин зі збудженням нейронів. Синаптична взаємодія в мозку послаблюється, розвивається перед за все антиманіакальна дія



Стоматологічному хворому для пригнічення страху перед болем призначили психоседативний засіб. Який препарат найбільш ефективний в даному випадку?

- Діазепам
- Аміназин
- Настоянка валеріани
- Літію карбонат
- Натрію бромід

Хворому на шизофренію було призначено аміназин. Який з перерахованих фармакодинамічних ефектів є підставою для його призначення даному хворому?

- Антипсихотичний
- Гіпотермічний
- Гіпотензивний
- Протиблювотний
- Міорелаксуючий

Хворому на шизофренію призначено аміназин для купірування психічного стану. Вкажіть механізм дії препарату:

- **Блокада D2-дофамінових рецепторів**
- **Стимуляція опіїдних рецепторів**
- **Блокада ГАМК-рецепторів**
- **Стимуляція серотонінових рецепторів**

Машиною швидкої допомоги, доставлено хворого 49-ти років з алкогольним делірієм та зоровими галюцинаціями. Лікар призначив препарат, який блокує центральні норадренергічні й дофамінергічні рецептори, та є похідним бутирофену. Який невролептик призначив лікар?

- **Дроперидол**
- **Діазепам**
- **Етаперазин**
- **Аміназин**
- **Хлорпротиксен**

До кардіологічного відділення надійшов хворий з інфарктом міокарда. Для усунення болю було вирішено потенціювати дію фентанілу невролептиком. Який з перерахованих невролептиків найбільш придатний для проведення невролептаноальгезії?

- Дроперидол
- Сульпірид
- Галоперидол
- Аміназин
- Трифтазин

При щелепно-лицевій операції в стаціонарі, лікар-стоматолог для премедикації, з метою зменшення почуття страху та для потенціювання дії анестетиків, призначив хворому транквілізатор – похідне бензодіазепіну. Який з перерахованих засобів призначив лікар?

- Діазепам
- Дроперидол
- Атропіну сульфат
- Сульпірид
- Аміназин

Дорожче за здоров'я –
тільки лікування
Невідомий фармаколог

Дякую за увагу!

