

Фармакология кафедрасы

Эпилепсияға қарсы  
заттар

Тырысуға қарсы заттар

Досжанова Б.А.

# Эпилепсияға қарсы заттарды

---

қолданады:

- эпилепсия формаларының әр түрлерінде дамидын ұстамаларында байқалатын тырысулар немесе оларға сай эквиваленттердің (санының жоғалуы немесе бұзылуы, мінез-құлықтық және вегетативтік бұзылыстар және т.б.) алдын-алу үшін немесе азайту үшін (интенсивтілігіне және жиілігіне қарай)

# ЭПИЛЕПСИЯ ҰСТАМАСЫ



## Эпилепсияның тырысуы мен тырысуынсыз жүретін бірнеше формалары бар

- Үлкен тырысулық ұстамалар (grand mal)
- Психомоторлық ұстамалар
- Эпилепсияның кіші ұстамалары (petit mal)
- Миоклонус-эпилепсиясы

Эпилепсияның әр түрлі формаларын емдеуді белгілі бір эпилепсияға қарсы заттармен жүргізеді.

# Эпилепсия ұстамаларының түрлері





- Эпилепсияға қарсы заттар, әдетте олардың белгілі бір тырысулар түрлерінде немесе эквиваленттерде қолдану көрсеткіштеріне қарай жіктіледі
- Парциалды тырысулар
- Психомоторлық ұстамалар

Карбамазепин

Дифенин

Натрий  
вальпроаты

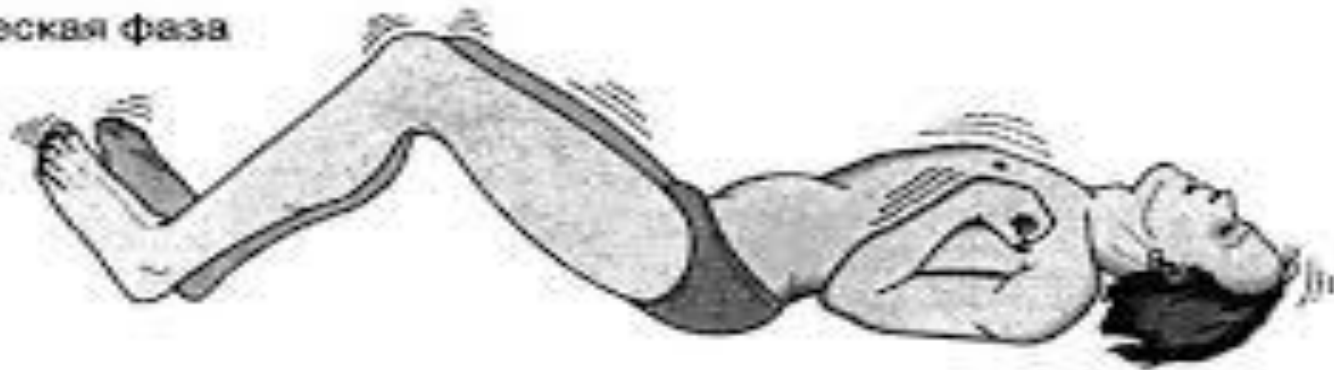
- Фенобарбитал
  - Гексамидин
  - Клоназепам
  - Габапептин
    - Хлоракон
- Ламотриджин

# Тырысу фазалары

Тоническая фаза



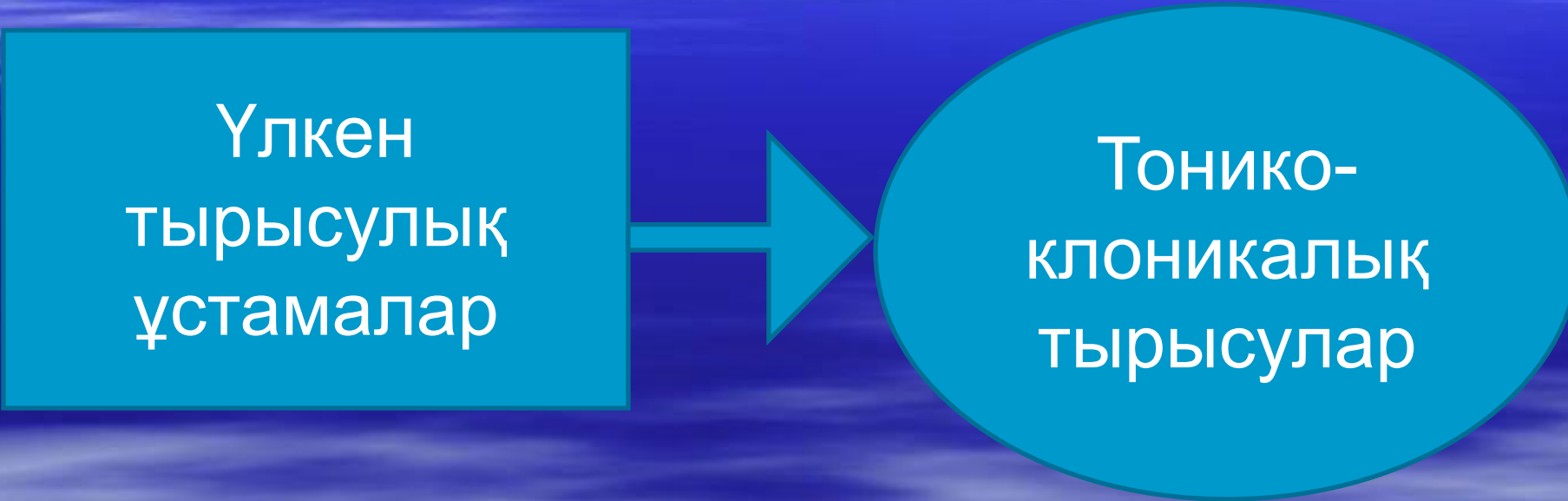
Клоническая фаза





# Таралған ( генерализацияланған) тырысулар

Үлкен  
тырысулық  
ұстамалар



Тонико-  
клоникалық  
тырысулар

Карбамазепин

Натрий вальпроаты

Фенобарбитал

Гексамидин

Ламотриджин

Дифенин

# Эпилепсиялық статус

- Диазепам
- Лоразепам
- Клоназепам
- Фенобарбитал-натрий
- Дифенин-натрий
- Наркозға арналған заттар

# Эпилепсияның кіші ұстамалары

Этосуксемид

Ламотриджин

Клоназепам

Триметин

Натрий  
вальпроаты

Миоклонус –эпилепсия

Натрий вальпроаты

Клоназепам

# Осы препараттардың әсер ету механизмдеріне байланысты жіктелуі

1) Натрий өзекшелерін тежейтін заттар

4) Қоздырғыш аминқышқылдарының орталық әсерлерін басатын заттар

2) Кальций өзекшелерін тежейтін заттар (Т-және L-түрлері)

3) ГАМК-ергиялық жүйені белсендендіретін заттар



- **Эпилепсияның үлкен тырысу ұстамаларының алдын алу үшін қолданылатын негізгі дәрілік заттар – карбамазепин, дифенин, натрий вальпроаты, фенобарбитал.**

Фенобарбитал (люминал) –  
барбитур қышқылының  
туындысы.

**Айқын ұйықтатқыш әсер көрсетеді.  
Эпилепсияны емдеу үшін оны  
сублингвалды түрде қолданады.**

Фенобарбиталдың әсер механизмі ГАМК-ергиялық жүйені белсендендіруіне байланысты

***Макромалекулярлы ГАМК<sub>A</sub>-  
рецепторлық кешенінің  
барбитуратты  
рецепторларына ықпал  
ету арқылы ГАМК-ның  
әсерін жоғарлатады.***

**Фенобарбиталдың эпилепсияда тиімділігі оның эпилептогенді ошақ нейрондарының қозғыштығына тежегіш әсер етуіне, сонымен қатар жүйкелік импульстердің таралуына байланысты болады.**

- **Препараттың тыныштандырғыш, ал кейде ұйықтатқыш әсерлері байқалуы мүмкін.**

**Фенобарбиталдың айқын кумуляцияға түсу қабілеттілігін ескерген жөн. Оны ұзақ қолданғанда бейімделу және дәрігерге тәуелділік тууы мүмкін.**

- ▣ Эпилепсияға қарсы аса таңдамалы қасиетке ие - гидантоин туындысы дифенин (фенитоин, дифенилгинтоин, дилантин). Ол натрий өзекшелерін тежеп, олардың инактивациялану уақытын ұзартады, сондай-ақ жоғарғы сапалы разрядтардың таралуына (генерациясына) және жайылуына кедергі жасайды. Соңғысы тырысу дамуының алдын алады.



# ДИФЕНИН АСҚАЗАН-ІШЕК ЖОЛДАРЫНАН ЖАҚСЫ СІҢЕДІ.

---

- Оның битотрансформациясы бауырда жүреді. Сонымен қатар дифенин фенобарбитал тәрізді бауырдың микросомалды ферменттерінің индукциясын шақырады. Ағзадан дифениннің өзгерген өнімдері және аздаған бөлігі өзгермеген түрінде бүйрек арқылы шығады. Препараттың қанның сары суында 50% төмендеуі 20-30 сағ ішінде жүреді.

## ФЕНОБАРБИТАЛДАН АЙЫРМАШЫЛЫҒЫ

- Дифенин ОЖЖ-не жалпы тежегіш әсер көрсетпейді (емдік мөлшерде ұйқышылдық шақырмайды, тыныштандырғыш әсері жоқ немесе аз байқалады).



Дифенинді қолданғанда нейрогендік  
бұзылыстар байқалуы мүмкін:

бастың айналуы

атаксия

дірілдеу

нистагм

диплопия

гиперпластикалық гингивит жиі болады.

Лоқсу, құсу шақыруы мүмкін.

Тері бөртпелері байқалады.



## **Гексамидин (примидон)**

**Пиримидин туындысы.**

**Химиялық құрылымы  
бойынша фенобарбиталға  
ұқсас.**

**Гексамидин фенобарбитал секілді  
белсенді емес, бірақ уыттығы  
төмен.**

**Ұйқышылдық (фенобарбиталға  
қарағанда аз дәрежеде), бастың  
айналуын, бастың ауыруын,  
лоқсу, атаксия, терілік себулер  
және басқа да жанама әсерлер  
шақыруы мүмкін.**



# *Эпилепсияға қарсы препарат топирамат (топамакс)*

- Топирамат сульфатпен алмасқан моносахарид болып табылады. Ол потенциалға тәуелді натрий өзекшелерін тежейді, сондай-ақ ГАМК-ның ГАМК<sub>A</sub>-рецепторларға әсерін күшейтеді деген мәлеметтер бар. Сонымен қатар ол глутаматтық (катион түрін) рецепторлардың белсенділігін әлсіретеді.

- **Жанама әсерлерінен**  
ОЖЖ-сі қызметінің  
бұзылуы ( атаксия, бастың  
айналуы, шаршау,  
ұйқышылдық)  
гепатотоксикалық әсер,  
уролитиаз және т.б болуы  
мүмкін.

## Эпилепциялық статус та (ұзақ тоқтамайтын үлкен тырысулық ұстамалар)

- ▣ Бензодиазепин туындылары  
дiazepamды (сибазон), лоразепамды  
және клоназепамды көк тамырға  
енгізу жақсы нәтиже береді.
- ▣ Олардың әсер механизмі ГАМК-  
ергиялық жүйені белсендендіруіне  
байланысты.

- Диафениннің және фенобарбиталдың натрий тұздарын парентералды енгізуге, сондай-ақ ингаляциялық және ингаляциялық емес наркозға арналған заттарды тағайындауға болады.

Психомоторлық  
ұстамаларда дифенин,  
гексамидин, сондай-ақ  
фенобарбитал тиімді.



- Соңғы жылдарда эпилепсияның осы түрінде тиімді, кең таралған препарат карбамазепин (стазепин; тегретол; финлепсин).
- Химиялық құрылымы бойынша ол дибензазепин туындысына жатады.



- Оның тырысуға қарсы белсенділігін натрий өзекшелерін тежеуімен байланыстырады.
- Бұл препараттың артықшылығы болып эпилепсияға қарсы қасиетінің психотропты әсерімен уйлесуі саналады.

# Карбамазепиннің жанама әсерлері

- Препаратты қабылдау аллергиялық реакциялардың, лейкопенияның немесе тромбоцитопенияның дамуын жоғарылады.

# Габалептин

- Психомоторлық ұстамаларды емдеу үшін ГАМК-ның жана аналогы- **ГАБАПЕПТИН** (нейронтин) ұсынылды. Оның әсер механизмі белгісіз. Препаратқа анксиолитикалық және ауыру сезімін басатын белсенділіктер тән.

# Этосуксимид

- Этосуксимид (суксилеп) сукцинимидтер тобына жатады.

Кальций өзекшелерінің Т-типтерін тежейді.

Эпилепсияның кіші ұстамаларының алдын алуда қолданылатын таңдаулы препарат болып табылады.

# ТРИМЕТИН

- **Триметин** (тирметадион, тридион) оксазолидин туындысына жатады.
- Ол жұлынның полисинаптикалық рефлекстерін тежеп, нейрондардың тұрақсыздығын төмендетеді.



- Кіші ұстамаларда *натрий вальпроаты* жиі қолданылады (төмен қара)



- Қіші ұстамаларда және эпилепсияның басқа да формаларында бензодиазепин туындысы **клоназепам** (*антелепсин*) айтарлықтай кеңінен қолданылады.

- Әсер механизмі және қасиеттері бойынша ол басқа бензодиазепиндік қосылыстарға ұқсас.

- Жаңа препараттардың бірі *ламотриджин* (ламиктал) болып табылады.

*Химиялық құрылымы бойынша бұл фенилтриазин туындысы.*

# Ламотриджин

- Оның әсер механизмін натрий өзекшелерін тежеумен, сондай-ақ пресинаптикалық ұштардан қоздырғыш амин қышқылдарының босап шығуын төмендетуімен байланыстырады.

# Ламотриджин

- Оны энтералдық жолмен енгізгенде толығымен сіңеді.
- Қанда максималды концентрациясы 2-2,5 сағ. Кейін байқалады.
- Ламотриджин ұзақ әсер етеді;  $t_{1/2}$  24 -30
- сағ.



- Миоклонус-эпилепсия  
медикаментозды емдеуге аса  
тұрақты.
- Әдетте бұл жағдайларда  
бензодиазепендер *клоназепам,*  
*дiazепам* (сибазон, седуксен) және  
*нитразепам* тиімді.



- Клоназепам минимальды жанама әсерлер шақыра отырып (ұйқышылдық, сирек атаксия, тәбеттің бұзылуы және байқалуы мүмкін), эпилепсияның көптеген түрлерінде оң әсер көрсететінін ескеру қажет.

# Натрий вольпроаты

- Эпилепсияның үлкен және кіші ұстамаларында белсенді натрий вальпроаты қолданылады.
- Оның психомоторлық ұстамаларда тиімділігі аз.

# Натрий вальпроаты

- Натрий вальпроатының тырысуға қарсы механизмі күрделі.
- Ол мыйда ГАМК-ның жинауына байланысты, өйткені натрий вальпроаты оның биотрансформациясын тежейді (ГАМК-трансаминазаны басады) және оның синтезін ынталандырады

# Эпилепсия кезіндегі алғашқы көмек

## Первая помощь при эпилептическом припадке



- Переверните больного на бок, что бы он не захлебнулся слюной.

- Следите, что бы больной не травмировал себя во время припадка.

- Вызовите скорую помощь