

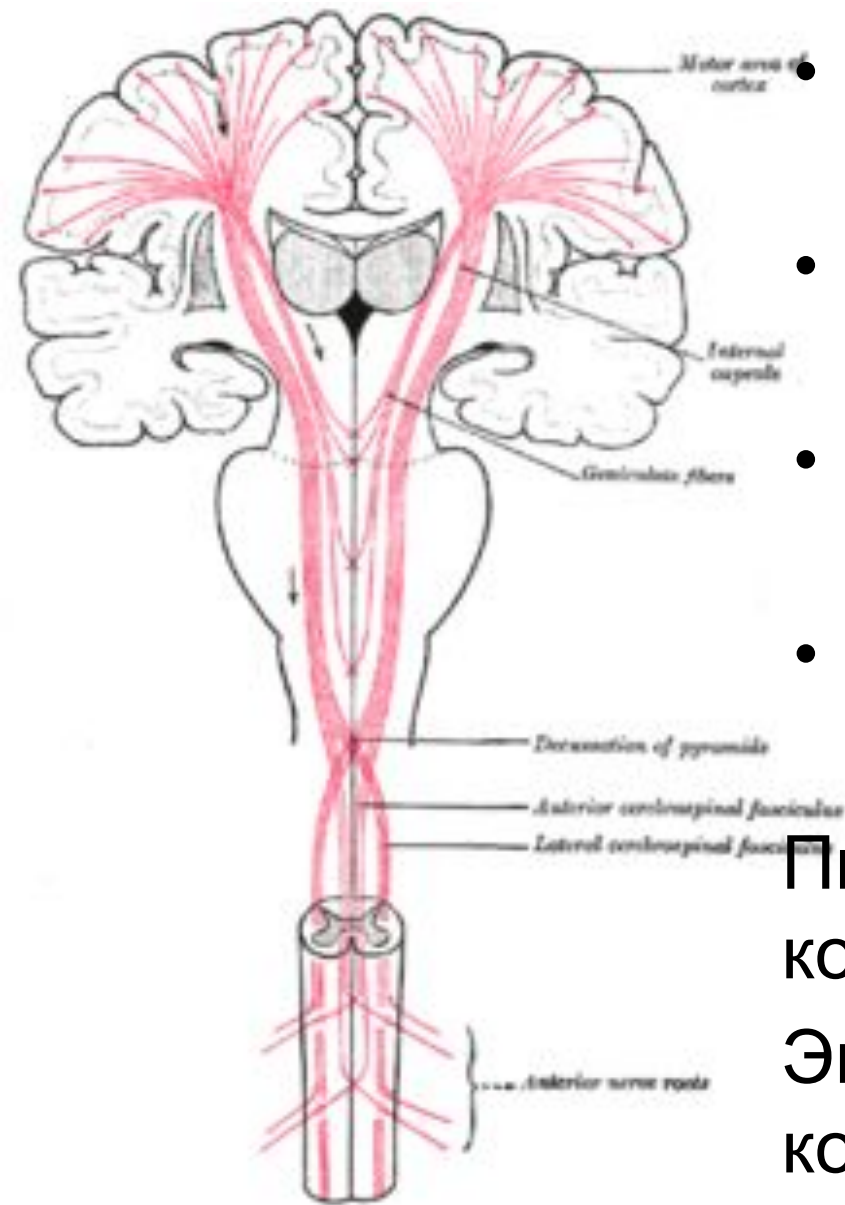
# Противопаркинсонические средства (лекарственные средства для лечения болезни Паркинсона и паркинсонизма)

тезисы лекции  
кафедры фармакологии с  
курсом фармации ФДПО

# Паркинсонизм

- ПЕРВИЧНЫЙ, ИДИОПАТИЧЕСКИЙ (БОЛЕЗНЬ ПАРКИНСОНА) – МЕДЛЕННО ПРОГРЕССИРУЮЩЕЕ ДЕГЕНЕРАТИВНОЕ ЗАБОЛЕВАНИЕ ЦНС
  - > 60 ЛЕТ – 1%
  - > 85 ЛЕТ – 4%
  - БОЛЕЗНЬ ПОЖИЛЫХ И ПРЕСТАРЕЛЫХ,
  - ПРИЧИНА - СТАРЕНИЕ МОЗГА
- ВТОРИЧНЫЙ (ЛЕКАРСТВЕННЫЙ, ТОКСИЧЕСКИЙ, ТРАВМАТИЧЕСКИЙ, ОПУХОЛЕВЫЙ И Т.Д.)

# Пирамидная нервная система



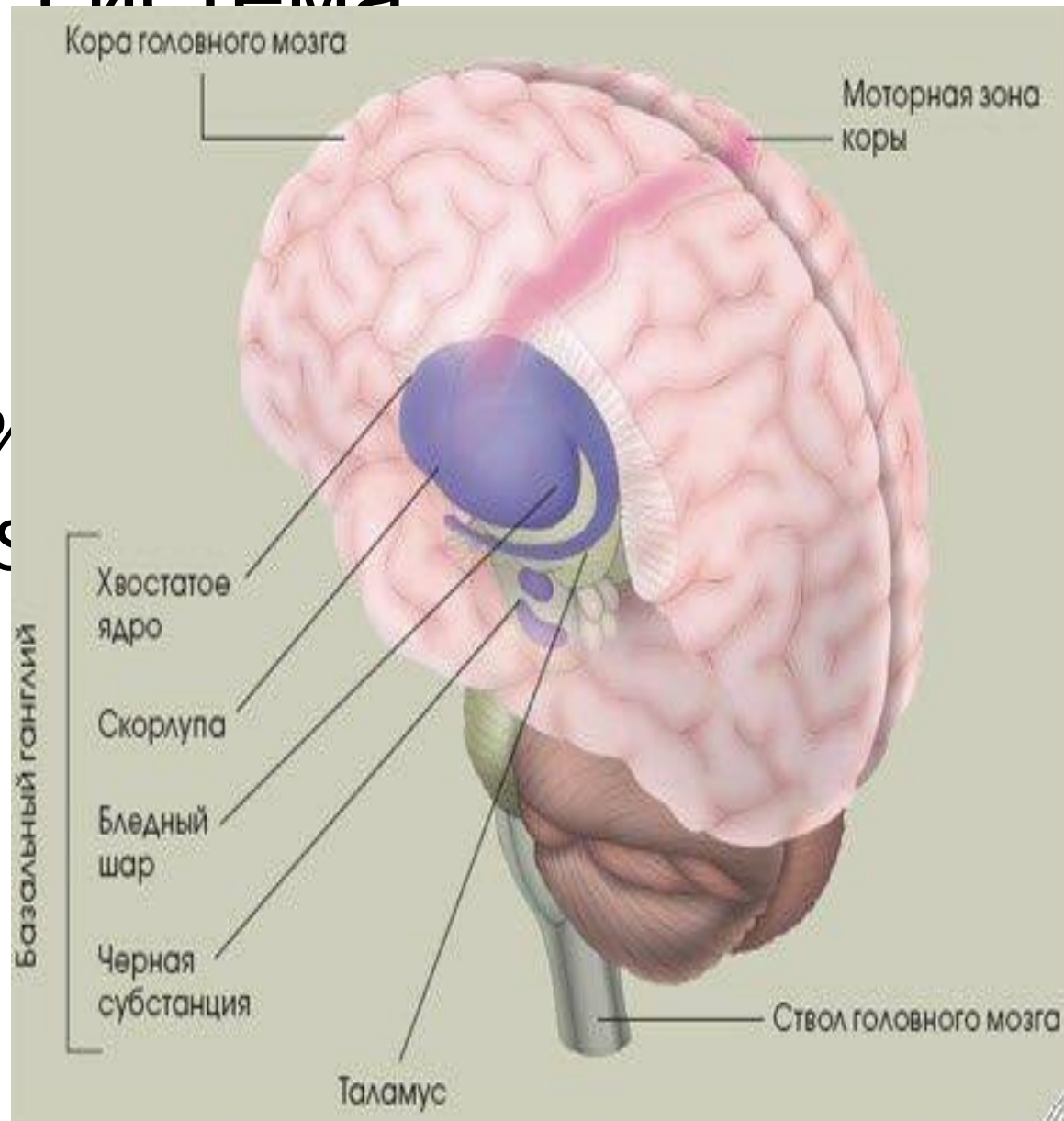
- Пирамидальные клетки в коре
- Отходящие нервные волокна до спинного мозга
- Коллатерали с волокнами экстрапирамидной НС
- Перекрест в стволе мозга

Пирамидная НС задает команды мышцам

Экстрапирамидная НС координирует их работу

# Экстрапирамидная нервная система

- НЕДОСТАТОК ДОФАМИНА
- ПОТЕРЯ 60-80% НЕЙРОНОВ В S



# Патология экстрапирамидной НС



Нарушение качества движений, их синхронизованности



- Нарушение способности человека принимать оптимальную для намеченного действия позу
- Нарушение соотношения тонуса мышц-сгибателей и разгибателей
- Нарушается плавность движения, соразмерность движений во времени и

# Клиническая картина

## **ДВИГАТЕЛЬНЫЕ НАРУШЕНИЯ**

**ТРЕМОР** («счет монет»), пропадает в  
движении

**ГИПОКИНЕЗИЯ** (скованность,  
замедленные движения)

**МЫШЕЧНАЯ РИГИДНОСТЬ** (поза  
«просителя», с-м «зубчатого колеса»)

**ПОСТУРАЛЬНАЯ  
НЕУСТОЙЧИВОСТЬ** (сложно начать /  
закончить движение)

## **Вегетативные нарушения:**

потливость, слюноотделение,  
истощение или ожирение.

## **Психические расстройства:**

депрессия, утомляемость,  
сонливость, нарушения  
ориентировки, страх, бессонница,  
повторение одних и тех же  
вопросов.

Прогноз

Без лечения –  
иммобилизация через  
10 лет





# Фармакологическое лечение



[www.blog.wallpapers.blogspot.com](http://www.blog.wallpapers.blogspot.com)

ВОСПОЛНЕНИЕ  
ДЕФИЦИТА  
ДОФАМИНА

- **ВВЕСТИ ДОФАМИН**
- АКТИВИРОВАТЬ  
РЕЦЕПТОРЫ  
ДОФАМИНА

ПОДАВЛЕНИЕ  
ХОЛИНЕРГИЧЕСКОЙ  
ПЕРЕДАЧИ

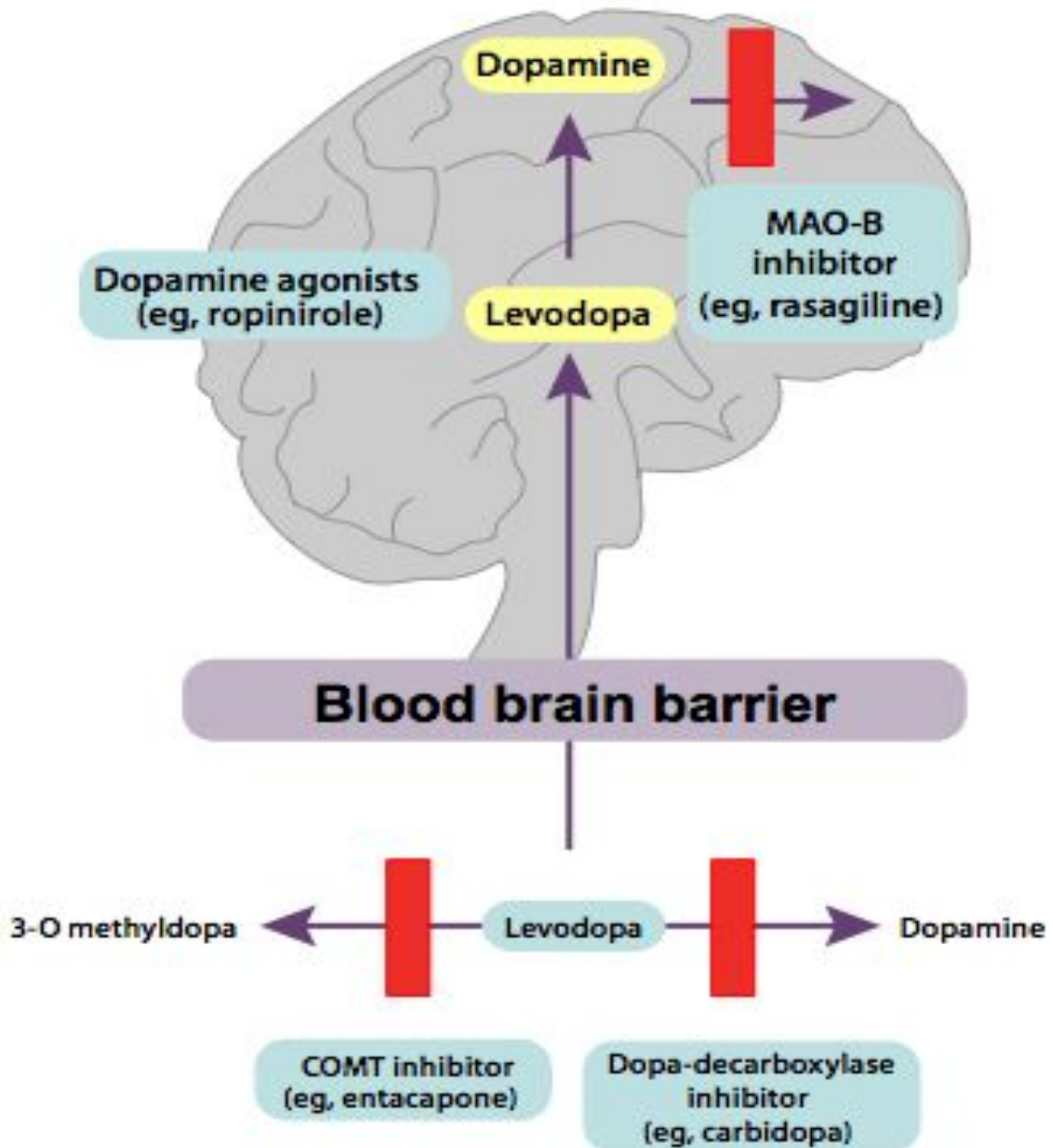
- ЗАБЛОКИРОВАТЬ  
ХОЛИНОРЕЦЕПТОР  
Ы

# Леводопа

Дофамин не проникает через ГЭБ, поэтому использовать его для лечения паркинсонизма нерационально

Левовращающий изомер ДОФА (L-ДОФА) в незначительном количестве (1-2%) проникает через ГЭБ, в мозге из него под воздействием ДОФА-декарбоксилазы образуется дофамин. Тот взаимодействует с собственными D2-рецепторами в экстрапирамидной нервной системе, в результате чего уменьшаются симптомы паркинсонизма.

С целью повышения доставки леводопы в мозг ее назначают вместе с синтетическими добавками (карбидопа, бенсеразид), способными подавлять периферический метаболизм леводопы – в результате снижается образование дофамина в кишечнике и печени, и наоборот, повышает образование дофамина в мозге.



# ЛЕВОДОПА:

Преимущества:

- САМОЕ ЭФФЕКТИВНОЕ СРЕДСТВО
- Эффективны в отн. гипокинезии и ригидности

ПОЗДНЕЕ  
НАЗНАЧЕНИЕ  
ПРЕПАРАТА



Недостатки:

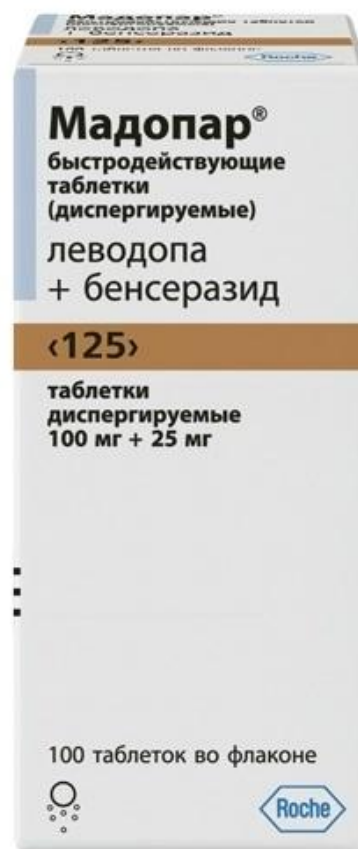
ЧАСТО ТОШНОТА, РВОТА, АРИТМИИ, ПАДЕНИЕ АД, боль в животе, психозы, депрессия, потливость, приливы, пораж. печени и крови, сыпь

ДВИГАТЕЛЬНЫЕ НАРУШЕНИЯ:

- ИСТОЩЕНИЕ КОНЦА ДОЗЫ
- СИНДРОМ ВКЛ-ВЫКЛ
- НАСИЛЬСТВЕННЫЕ ДВИЖЕНИЯ
- УВЕЛИЧЕНИЕ РИСКА НА 10% ЗА ГОД ТЕРАПИИ

# Прием леводопы

- Лечение начинают с малых доз – 100-150 мг
- Титруют дозу каждые 3-5 дней до миним. эффективн.
- Принимать без пищи (на раннем этапе можно во время еды, + метоклопрамид)



# ПРЕПАРАТЫ ЛЕВОДОПЫ

ЛЕВОДОПА +  
БЕНСЕРАЗИД

МАДОПАР

ЛЕВОДОПА +  
КАРБИДОПА

ДУОДОПА,  
ТИДОМЕТ,  
СИНДОПА,  
СТАЛЕВО,  
НАКОМ

Таблетки, диспергируемые таблетки,  
различные дозировки

# Фармакологическое лечение



[www.blog.wallpapers.blogspot.com](http://www.blog.wallpapers.blogspot.com)

ВОСПОЛНЕНИЕ  
ДЕФИЦИТА  
ДОФАМИНА

- ВВЕСТИ ДОФАМИН
- **АКТИВИРОВАТЬ  
РЕЦЕПТОРЫ  
ДОФАМИНА**

ПОДАВЛЕНИЕ  
ХОЛИНЕРГИЧЕСКОЙ  
ПЕРЕДАЧИ

- ЗАБЛОКИРОВАТЬ  
ХОЛИНОРЕЦЕПТОР  
Ы

# Агонисты D-рецепторов

Эрголиновые (I п):

- **БРОМОКРИПТИН**  
(БРОМОКРИПТИН,  
ПАРЛОДЕЛ)
- **КАБЕРГОЛИН**  
(БЕРГОЛАК,  
АГАЛАТЕС,  
ДОСТИНЕКС)

Неэрголиновые (II п):

- **ПИРИБЕДИЛ**  
(ПРОНОРАН)
- **ПРАМИПЕКСОЛ**  
(ПРАМИПЕКСОЛ,  
МИРАПЕКС,  
ОПРИМЕЯ)
- **РОПИНИРОЛ**  
(РОЛЬПРИНА,  
РЕКВИП)
- **РОТИГОТИН**  
(НЬЮПРО)

Таблетки, пролонгированные таблетки,  
пластырь



# Агонисты D-рецепторов

## Преимущества:

- в меньшей степени вызывают двигательные нарушения
- их назначение перед лечением леводопой снижает уровень двигательных нарушений, вызванных леводопой
- также применяют вместе с леводопой

## Недостатки:

- эффективность уступает леводопе
- чаще вызывают тошноту, сонливость, запоры, психозы

# Препараты, блокирующие работу ферментов, разрушающих дофамин

- Ингибиторы MAO Б:  
СЕЛЕГИЛИН (ЮМЕКС)  
РАЗАГИЛИН (АЗИЛЕКТ)
- Ингибиторы КОМТ:  
ЭНТАКАПОН  
(вместе с леводопой  
входит в состав  
СТАЛЕВО)
- НАЗНАЧАЮТ САМЫМ  
МОЛОДЫМ ПАЦИЕНТАМ (отсрочка прим.  
леводопы)
- АНТИДЕПРЕССИВНОЕ ДЕЙСТВИЕ
- УСТУПАЮТ В ЭФФЕКТИВНОСТИ ЛЕВОДОПЕ
- ЛЕКАРСТВЕННЫЕ ВЗАИМОДЕЙСТВИЯ

# Ингибиторы обратного интра-нейронального захвата дофамина

- АМАНТАДИН (Мидантан, Неомидантан)
- СЛОЖНЫЙ, КОМПЛЕКСНЫЙ МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ
- ЗНАЧИТЕЛЬНО УСТУПАЕТ В ЭФФЕКТИВНОСТИ
- ВЫЗЫВАЕТ ПСИХОЗЫ, ГАЛЛЮЦИНАЦИИ – ПЕРЕИЗБЫТОК ДОФАМИНА

# Фармакологическое лечение



[www.blog.wallpapers.blogspot.com](http://www.blog.wallpapers.blogspot.com)

ВОСПОЛНЕНИЕ  
ДЕФИЦИТА  
ДОФАМИНА

- ВВЕСТИ ДОФАМИН
- АКТИВИРОВАТЬ  
РЕЦЕПТОРЫ  
ДОФАМИНА

ПОДАВЛЕНИЕ  
ХОЛИНЕРГИЧЕСКОЙ  
ПЕРЕДАЧИ

- **ЗАБЛОКИРОВАТЬ  
ХОЛИНОРЕЦЕПТОР  
Ы**

# Центральные холинолитики (М-холинолитики)

- **БИПЕРИДЕН** (АКИНЕТОН, БЕЗАК, МЕНДИЛЕКС)
- **ТРИГЕКСИФЕНИДИЛ** (ЦИКЛОДОЛ)

## Преимущества:

- Влияют на тремор
- Снижают слюнотечение
- Используются при паркинсонизме

## Недостатки:

- Слабо влияют на ригидность, акинезию, постуральную нестабильность
- Вызывают сухость во рту, нарушение зрения, слабость, нарушения мочеиспускания, ухудшение когнитивной функции

# Фармакологическое лечение



[www.blog.wallpapers.blogspot.com](http://www.blog.wallpapers.blogspot.com)

ВОСПОЛНЕНИЕ  
ДЕФИЦИТА ДОФАМИНА

ПОДАВЛЕНИЕ  
ХОЛИНЕРГИЧЕСКОЙ  
ПЕРЕДАЧИ

**ВЛИЯЕТ НА  
МЫШЕЧНУЮ  
РИГИДНОСТЬ И  
ГИПОКИНЕЗИЮ**

**ВЛИЯЕТ НА  
ТРЕМОР**

# Дополнительное лечение

Медикаментозные средства:  
антидепрессанты,  
ноотропы

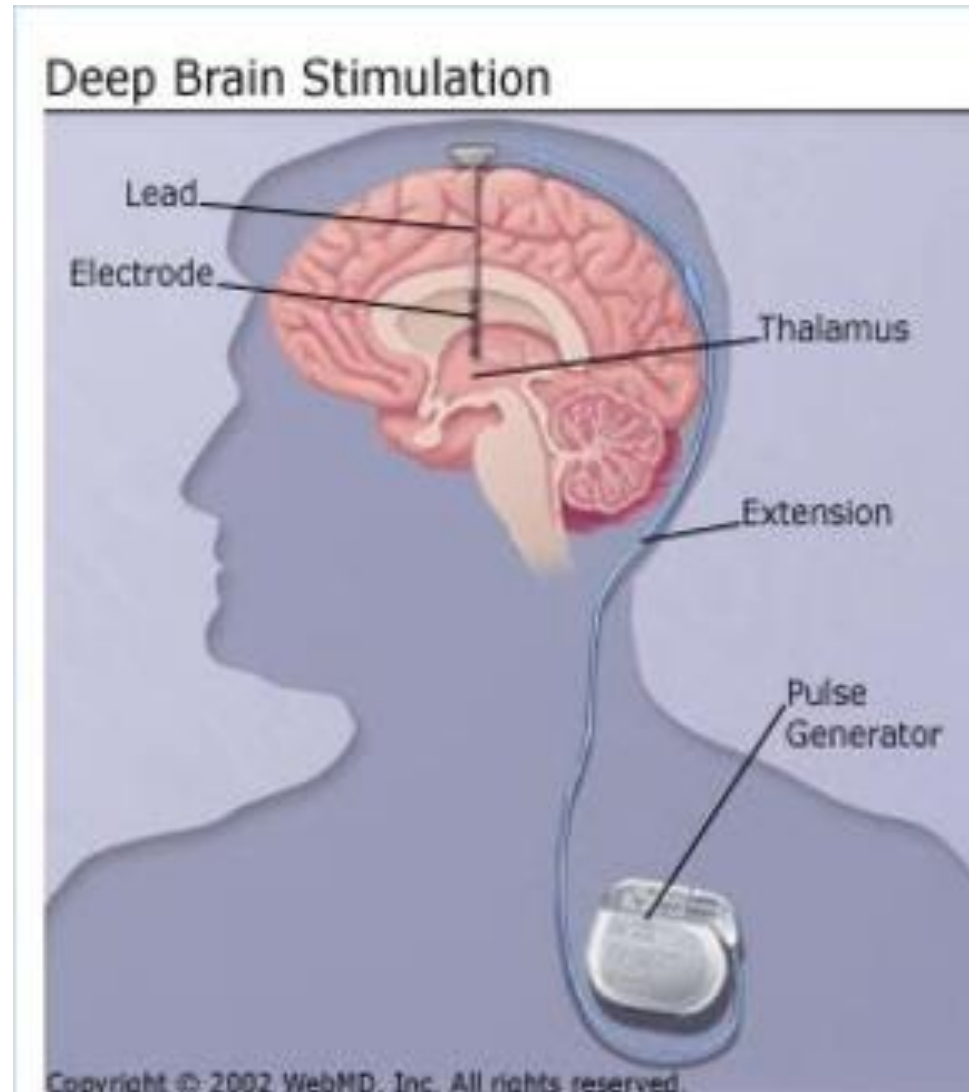
РАНС, иглоукалывание



ЛФК-упражнения на растяжение мышц,  
поддержание гибкости и тренировку  
координации движений

# Хирургическое лечение

- ТАЛАМОТОМИЯ,  
ПАЛЛИДОТОМИЯ
- НЕЙРОСТИМУЛЯЦИЯ
- ПЕРЕСАДКА  
СТВОЛОВЫХ  
КЛЕТОК
- ВАКЦИНИРОВАНИЕ







Папа Римский Иоанн Павел 2, Мао Цзэдун,  
Ясер Арафат, Сальвадор Дали, Мохаммед Али,  
Робин Уильямс, Майкл Джей Фокс.