

*"Объясните людям  
значение слов и половина  
недоразумений и споров  
исчезнут сами собой"*

Декарт

**Лекция на тему:**

**Психостимуляторы, ноотропы,  
аналептики, адаптогены**

Психотропные средства – это ЛС различного происхождения, обладающие способностью **восстанавливать** нарушенные психические функции – внимание, обучение и память, восприятие, настроение и эмоции, мышление

## Психотропные средства

с преимущественно  
**ДЕПРИМИРУЮЩИМ**  
(тормозным, угнетающим  
типом действия)

- Седативные;
- Транквилизаторы;
- Нейролептики;
- Нормотимики.

с преимущественно  
**ВОЗБУЖДАЮЩИМ**  
(активирующим,  
стимулирующим  
типом действия)

- **Аналептики**
- **Психостимуляторы**
- **Ноотропы**
- **Адаптогены**
- **Антидепрессанты**

# АНАЛЕПТИКИ (оживляющие, пробуждающие)

—

*нейротропные средства, обладающие способностью пробуждать (“оживлять”), усиливать, восстанавливать функции жизненно важных органов и систем :*

- нервная система,*
- сердечно - сосудистая система,*
- система дыхания*

# Классификация аналептиков:

- центрального действия: Кофеин-натрия бензоат, Бемегрид, Этимизол;
- периферического действия – Никотин, Лобелин, Цитизин (Cytitonum),;
- смешаного действия – Камфора, Сульфокамфокаин, Кордиамин

# МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ АНАЛЕПТИКОВ

- **центрального действия** – непосредственно возбуждают жизненно важные центры продолговатого мозга (сосудодвигательные и дыхательный);
- **периферического действия** – рефлекторно через N-холинорецепторы синокаротидной зоны (каротидный синус) возбуждают центры продолговатого мозга;
- **смешанного действия** – проявляют как непосредственное, так и рефлекторное действие (с хеморецепторов сосудов) на жизненно важные центры продолговатого мозга.

# **ПОКАЗАНИЯ К НАЗНАЧЕНИЮ аналептиков**

- Острые отравления нейротропными средствами депримирующего типа действия;
- В комплексе реанимационных мероприятий при утоплении, удушении, поражении электрическим током, отравлении угарным газом;
- острые и хронические расстройства кровообращения; шок, коллапс, асфиксия;
- острая и хроническая сердечная недостаточность;
- никотиновая зависимость: отвыкание от курения (облегчение симптомов – для лобесила, табекса), а также снятие абстинентного синдрома при отказе от курения (никоретте, табекса).

# НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ИЛИ ПОБОЧНЫЕ

## ЭФФЕКТЫ аналептиков

- *Повышенная возбудимость ЦНС,*
- *беспокойство, бессонница,*
- *гипертензия, эпилепсия,*
- *повышенная судорожная готовность мозга;*
- *при длительном применении возможно привыкание, диспепсические явления (бемегрид, этимизол).*
- *При введении масляных растворов камфоры под кожу возможно развитие инфильтрата;*
- *сульфокамфокаин противопоказан при идиосинкразии к новокаину, бемегрид – при психомоторном возбуждении.*

**Психотропные средства** – это ЛС различного происхождения, обладающие способностью **восстанавливать** нарушенные психические функции – внимание, обучение и память, восприятие, настроение и эмоции, мышление

# Психотропные средства

с преимущественно  
**ДЕПРИМИРУЮЩИМ**  
(тормозным, угнетающим  
типом действия)

- Седативные;
- Транквилизаторы;
- Нейролептики;
- Нормотимики.

с преимущественно  
**ВОЗБУЖДАЮЩИМ**  
(активирующим,  
стимулирующим  
типом действия)

- Аналептики
- Психостимуляторы
- Ноотропы
- Адаптогены
- Антидепрессанты

# ПСИХОСТИМУЛЯТОРЫ (психоактиваторы, психотоники)

- лекарственные средства, которые обладают способностью
  - ▣ стимулировать ЦНС,
  - ▣ активировать психическую и физическую работоспособность,
  - ▣ повышать уровень бодрствования и мотивации,
  - ▣ уменьшать усталость и утомление, сонливость,
  - ▣ улучшать настроение.

# Классификация психостимуляторов:

- Производные пурина и имидазола: кофеин-бензоат натрия, этимизол;
- Сиднонимины: сиднокарб (мезокарб)
- Фенилалкиламины: амфетамина сульфат (фенамин, экстази, перветин)

Амфетамины подобны другим галлюциногенам (диэтиламина лизергиновая кислота = ЛСД, мескалин, псилоцибин, фенциклидин или “ангельская пыль”, кокаина гидрохлорид, тетрагидроканнабинол и др.).

**N.B.!**

исключены из списка ЛС, т.к. вызывают состояние, имитирующее психозы (“психозомиметики”, “психодислептики”), и вызывающие злоупотребление (abuse).

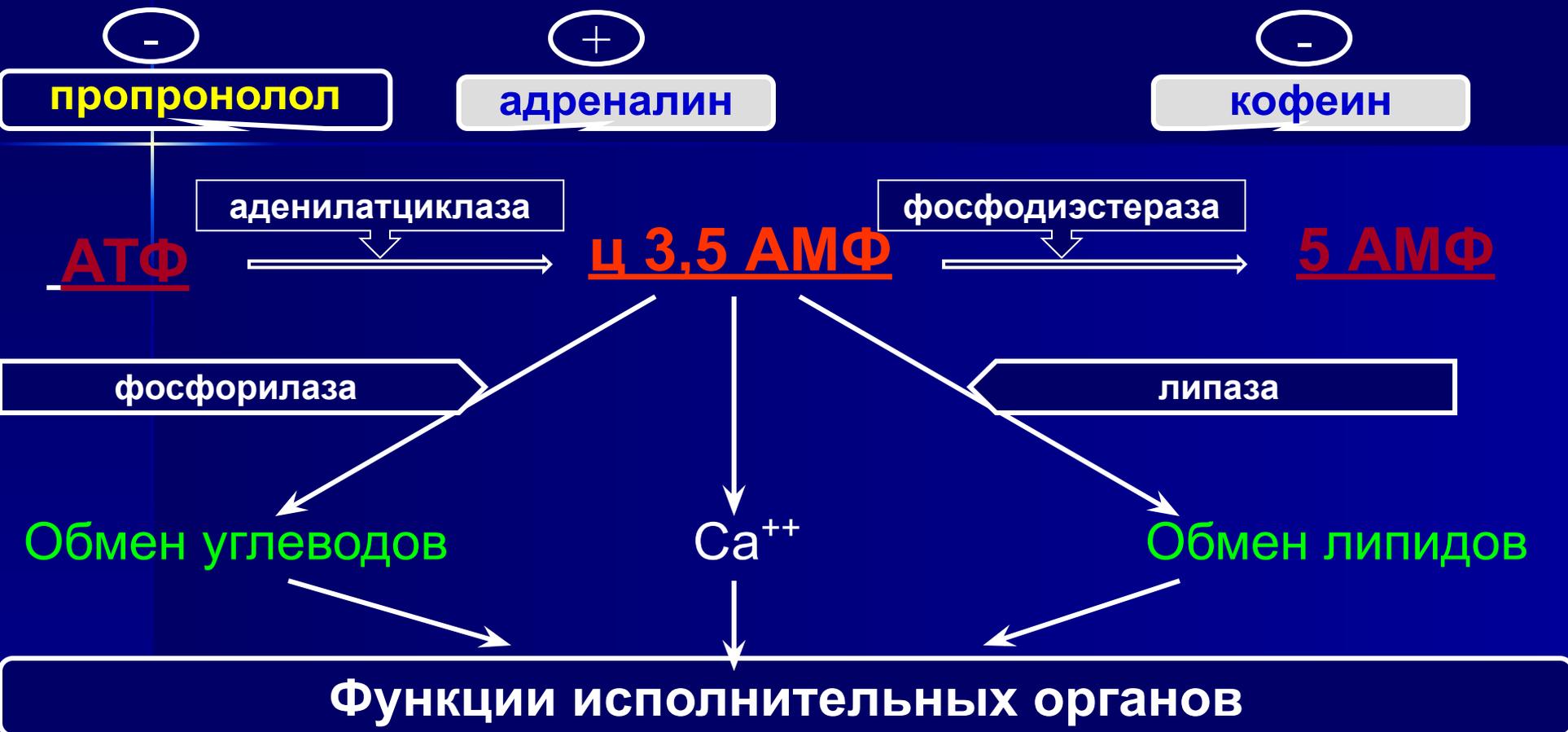
# МЕХАНИЗМЫ ДЕЙСТВИЯ

■ Производные пурина (кофеин) - усиливаются процессы гликолиза, повышаются метаболические процессы в органах и тканях. Кроме того, кофеин блокирует тормозные пуриновые рецепторы в ЦНС, вследствие этого повышается активность нейронов, активизируется умственная и физическая работоспособность; стимулируется сердечно-сосудистая система, активизируются дыхательные функции (частота и глубина дыхания), возбуждается секреция и моторика ЖКТ, увеличивается диурез, проявляется иммуномодулирующее действие.

■ фенилалкиламины – проявляют не прямое дофаминомиметическое и адреномиметическое действие – способствуют высвобождению в ЦНС моноаминов, угнетают их обратный захват, а также угнетают MAO, тем самым стимулируют корковые и стволовые структуры, а также таламус и ядра среднего мозга;

■ сиднониминны – главным образом вызывают активацию норадренергических рецепторов головного мозга, выражено блокируют MAO, с чем связано тимолептическое действие.

# Механизм действия кофеина



*Уменьшение силы сокращений;  
Уменьшение потребности в O<sub>2</sub>*

*Увеличение силы сокращений;  
Увеличение потребности в O<sub>2</sub>*

# *Показания к назначению психостимуляторов*

- для повышения психической и физической работоспособности,*
- при депрессии,*
- при астенических состояниях,*
- при энурезе у детей,*
- при патологической сонливости, усталости, утомлении.*

## НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ или ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

- при применении сиднокарба иногда - *появление раздражительности, беспокойства, снижение аппетита;*
- при длительном использовании - *возможны тяжелые нервно-психические расстройства;*
- Кофеин при длительном применении может вызывать диарею, тошноту, боли в желудке, головную боль, тахикардию, аритмии, психическую зависимость (теизм).

## Психостимуляторы противопоказаны:

- при повышенной возбудимости,
- бессоннице,
- выраженной гипертонии и атеросклерозе,
- при органических заболеваниях мозга,
- при патологии сердечно-сосудистой системы,
- у людей преклонного возраста,
- при глаукоме,
- фобии,
- заболеваниях печени.

Некоторые истины нужно повторять часто и долго, не забываясь о том, что можно надоесть ...

Н.И. Пирогов

**НООТРОПНЫЕ ПРЕПАРАТЫ** (“noos” – мышление, разум; “tropos” – стремящийся (С. Giurgea, 1972) или **НЕЙРОМЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ЦЕРЕБРОПРОТЕКТОРЫ**

- это лекарственные средства, обладающие способностью

восстанавливать нарушенные мнестические и мыслительные функции,

снижать неврологические дефициты, а также

защищающие мозг и повышающие резистентность

организма к экстремальным воздействиям

(гипоксия → ишемия, травма мозга и пр.)

Ноотропы не оказывают выраженного психостимулирующего или седативного действия, не вызывают специфических изменений биоэлектрической активности мозга. Вместе с тем они в той или иной степени стимулируют передачу возбуждения в центральных нейронах, облегчают передачу информации между полушариями головного мозга, улучшают энергетические процессы и кровоснабжение мозга, повышают его устойчивость к гипоксии. Наиболее важным проявлением их действия является активация интеллектуальных и мнестических функций, антигипоксическая активность. Для повышения физической работоспособности ноотропы эффективны только в комбинации с актопротекторами и психостимуляторами или у ослабленных и астенизированных лиц.

**НООТРОПНЫЕ ПРЕПАРАТЫ** – нейротропные средства, обладающие способностью **восстанавливать** (усиливать) когнитивную (познавательную) функцию мозга, улучшать обучение, восстанавливать память, стимулировать активное бодрствование сознания, а также повышать устойчивость организма к неблагоприятным факторам окружающей среды.

# Классификация ноотропов

I. Ноотропные препараты с доминирующим мнестическим эффектом (cognitive enhancers) или «истинные» ноотропы:

## 1. Пирролидоновые ноотропы (рацетамы),

преимущественно метаболитного действия: **пирацетам, оксирацетам, анирацетам, прамицетам, этирацетам, дипрацетам, ролзирацетам, небрацетам, изацетам, нефирацетам, детирацетам, ...**

2. Холинергические вещества: усиление синтеза ацетилхолина и его выброса (холин хлорид, фосфатидилсерин, лецитин, ацетил-L-карнитин, цитиколин, производные аминопиридина, и др.); агонисты холинергических рецепторов (оксотреморин, бетанехол, спиропиперидины, хинуклеотиды ; ингибиторы ацетилхолинэстеразы (физостигмин, такрин, амиридин, галантамин, метрифонат, велнакрин малеат и др.);

# *Классификация ноотропов*

- *3. Нейропептиды: эбиратид, семакс, церебролизин, ноопент*
- *4. Агонисты и коагонисты NMDA-рецепторов: нооглютил, мемантин, милацемид, глицин*
- *5. Агонисты AMPA-рецепторов :*  
*модафинил, риталин, донепезил*
- *6. Агонисты дофаминовых-рецепторов :*  
*проноран*

# Классификация ноотропов

**II. Ноотропные препараты смешанного типа с широким спектром эффектов («нейропротекторы»):**

**5. Активаторы метаболизма мозга** - карнитин, эфиры гомопантотеновой кислоты, ксантиновые производные пентоксифиллина, пропентофиллин, тетрагидрохинолины и др.

**6. Церебральные вазодилататоры или вазотропные средства:** винкамин, винпоцетин, ницерголин, винконат, виндебумол и др.

**7. Антагонисты кальция:** нимодипин, циннаризин, флунаризин и др.

**8. Антиоксиданты:** мексидол, тиотриазолин, карнозин, мелатонин.

# Классификация ноотропов

## □ 9. *Вещества, влияющие на систему ГАМК:*

гаммалон, пантогам, пикамилон, дигам, никотинамид, фенибут, фенотропил, натрия оксибутират, нейробутал и др.

## □ 10. Вещества разных групп: этимизол, оротовая кислота, метилглюкооротат, оксиметацил, беглимин, нафтидрофурил, цереброкраст, женьшень, лимонник и др.

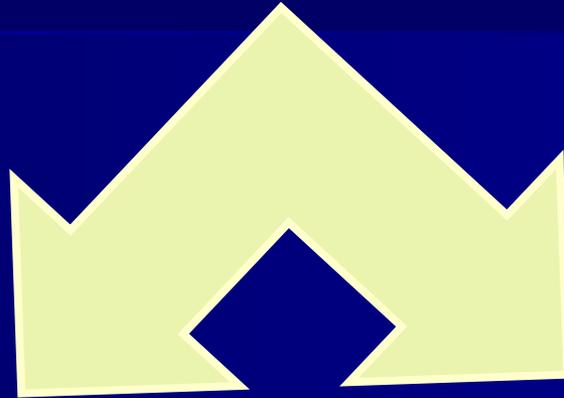
## Классификация ноотропов

### III. Ноотропные препараты на основе фиксированных комбинаций:

11. На основе пирацетама- Тиоцетам (пирацетам 0,2+тиотриазолин 0,05); Олатропил (пирацетам 0,25+аминалон 0,125); Ороцетам (пирацетам 0,4+оротат0,1); Фезам(пирацетам 0,4+циннаризин 0,025) ; Диапирам (пирацетам 0,4+диазепам 0,005)

12. На основе мелатонина - Бинотропил(мелатонин 0,002+аминалон 0,25); Апик(мелатонин 0,003+пиридоксин 0,01); Юкалин ( мелатонин 0,003+экстракт валерианы 0,01)

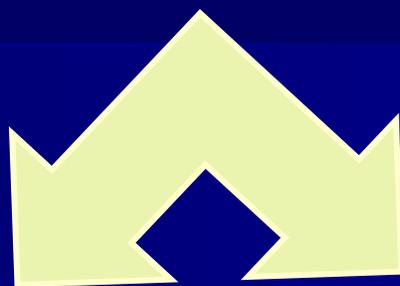
# Нейрометаболические церебропротекторы (ноотропы)



Прямое избирательное  
действие на когнитивные  
функции

Непрямое, косвенное, не  
первостепенное, но с  
важным ноотропным  
эффектом

# Прямое избирательное действие на КОГНИТИВНЫЕ функции



С преимущественно  
седативными  
свойствами

- ПИКАМИЛОН (никотиноил-ГАМК)
- ПАНТОГАМ (кальция гомопантенат)
- ФЕНИБУТ(НООФЕН)

С преимущественно  
психостимулирующими  
свойствами

- ПИРАЦЕТАМ (ноотропил)
- ПИРИТИНОЛ (пиридитол, энцефабол)
- АЦЕФЕН (меклофеноксат)
- АМИНАЛОН (ГАМК)
- ДЕМАНОЛ (деанол ацеглюмат)
- СЕМАКС
- НООГЛЮТИЛ

## Непрямое, косвенное, не первостепенное, но с важным ноотропным эффектом

- ЦЕРЕБРОАНГИОПРОТЕКТОРЫ
- АХ-ЭРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА (амиридин, галантамин, глиатилин, цитиколин)
- ДА-ЭРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА
- АНТИОКСИДАНТЫ (мексидол, корвитин, тиотриазолин...)
- НЕЙРОАМИНОКИСЛОТЫ: агонисты и антагонисты (глицин, рилузол)
- НЕЙРОПЕПТИДЫ И ИХ АНАЛОГИ (церебролизин, семакс=АКТГ<sub>4-10</sub>)
- НЕЙРОПСИХОТРОПНЫЕ СРЕДСТВА (нейролептики, транквилизаторы, противосудорожные, антидепрессанты, актопротекторы, адаптогены, психостимуляторы)
- ТИЛОВЫЕ ПРОТИВОЯДЯ
- ВИТАМИННЫЕ ПРЕПАРАТЫ
- ГОМЕОПАТИЧЕСКИЕ ПРЕПАРАТЫ (церебрум композитум)

# Цереброваскулярные средства как не прямые церебропротекторы (ноотропы)

## ЦЕРЕБРОАНГИОТРОТЕКТОРЫ:

- ЦИННАРИЗИН (стугерон, вертизин)
- НИМОДИПИН (нимотоп, немотан)
- ФЛУНАРИЗИН
- НИКОТИНОЛ+ГАМК = пикамилон
- ВИНПОЦЕТИН (кавинтон, винпотон)
- ВИНКАМИН (винканор)
- ПАПАВЕРИН
- НАФТИДРОФУРИЛ (нафтилюкс)
- КСАНТИНОЛА НИКОТИНАТ (компламин)
- ПЕНТОКСИФИЛЛИН (агапурин, трентал)
- НИЦЕРГОЛИН (сермион, нилогрин)
- ГИНКО БИЛОБА (танакан, мемоплант, билибил)
- ИНСТЕНОН (комб: этамиван+этофиллин+гексобендин)
- ВАЗОБРАЛ (комб: дигидроэргокриптин + кофеин)

Антагонисты  $Ca^{2+}$   
каналов ГМК сосудов  
мозга

Спазмолитическое  
действие

$\alpha$ -АБ +  $ST_3$ -блокатор

Метаболическое,  
антиоксидантное,  
противогипоксическое

А также: церебролизин, глицин, мемантин, пирацетам

# *Показатели клинической активности ноотропов*

- 1. Ноотропное действие (влияние на задержку развития или нарушения высших корковых функций, уровень суждений и критических возможностей, укрепление кортикального контроля субкортикальных уровней активности);*
- 2. Мнемотропное действие (влияние на память, обучаемость);*
- 3. Антиастеническое действие (влияние на слабость, вялость, явления психической и физической астении);*
- 4. Психостимулирующее действие (влияние на апатию, аспонтанность, бедность побуждений, психическую инертность, психомоторную заторможенность);*
- 5. Седативное (транквилизирующее) действие (влияние на раздражительность, эмоциональную возбудимость);*

# *Показатели клинической активности ноотропов*

**6. Антидепрессивные свойства**

**7. Действие, повышающее уровень бодрствования, ясность сознания** (*влияние на состояние угнетенного и помраченного состояния*);

**8. Антиэпилептическое действие** (*влияние на эпилептическую пароксизмальную активность*);

**9. Адаптогенное действие** (*влияние на толерантность к различным факторам, в том числе и к медикаментам*);

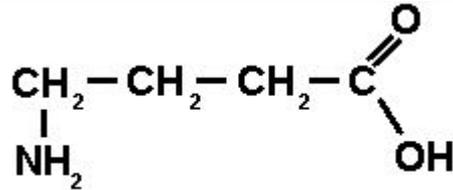
**10. Вазовегетативное действие** (*влияние на головную боль, головокружение, вегетативную неустойчивость при цереб्रोастенических синдромах*);

**11. Антипаркинсоническое действие** (*влияние на экстрапирамидные паркинсонические расстройства – гипокинетогипертонический синдром*);

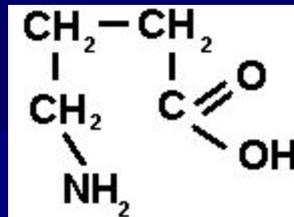
# *Показатели клинической активности ноотропов*

- 12. Антидискинетическое действие** (*ослабление экстрапирамидных дискинетических расстройств*);
- 13. Антигипоксическое действие** (*↑ устойчивость к недостатку O<sub>2</sub>, защита поврежденных клеток мозга*);
- 14. Антиоксидантные свойства** (*↓ образования продуктов окислительной модификации макромолекул, ↑ активности ферментов антиоксидантной защиты*);
- 15. Нейротрофическое действие** (*генная экспрессия нейроростовых факторов: GNF, BDNF, NT 3, NT 4/5 ...*);
- 16. Действие на процессы нейроаптоза** (*индукторы, ингибиторы*);
- 17. Нейроиммуноцитокиническое действие.**

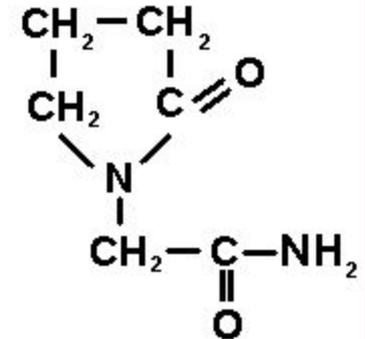
# ГАМК и ее аналоги



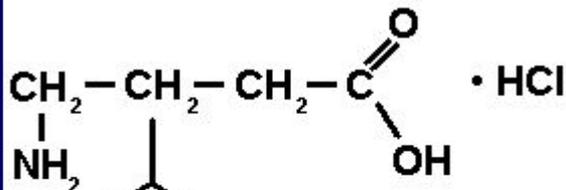
ГАМК (Аминалон)



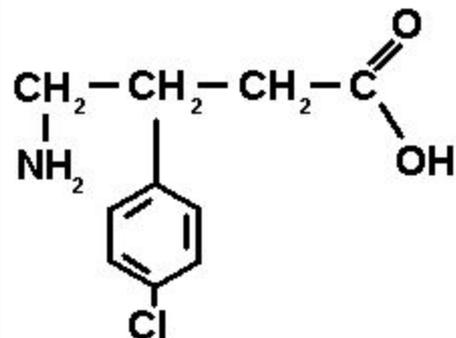
ГАМК



ПИРАЦЕТАМ



НООФЕН (фенибут)



БАКЛОФЕН (лиоресал)

а также:

- натрия оксибутират;
- пантогам (остатки ГАМК и пантотеновой кислоты);
- пикамилон (сочетание ГАМК и никотиновой кислоты)

Thiocetatum (тиотриазолин + пирацетам)  
цинаризин + пирацетам = фезам, нейро-норм

## **ПИРАЦЕТАМ**

- ↑ уровень НА и количество  $\beta$ -АР в ткани мозга;
- ↑ уровень АХ и плотность ХР;
- ДА «±»;
- Глу «±»;
- ГАМК «±».
- ↑ РНК, синтез белка, макромолекулы памяти S-100;
- «+» - мембрано-стабилизирующая активность;
- ↑ текучесть мембран в клетках мозга
- ↓ агрегацию тромбоцитов

## ПИРАЦЕТАМ

- «+» - стресспротекторное действие;
- ↑ поведение, обучение, физическую выносливость при 2-х суточной депривации сна,  $H_2O$ ;
- ↓ повреждение слизистой оболочки желудка;
- Восстанавливает массу надпочечников;
- ↑ массу тимуса;
- Сохраняет структуру клеток коры ГМ и мозжечка;
- Устраняет стрессорные нарушения в печени, миокарде, эритроцитах, костной ткани.

## ПИРАЦЕТАМ

### В эффекторных органах:

- ↑ энергетический обмен (аэробный и анаэробный);
- ↑ синтез белка, обмен аминокислот;
- ↓ СРО и сохраняет активность антиоксидантных ферментов;
- Нормализирует  $K^+-Na^+$  насос и стабилизирует фосфолипиды мембран.

## ПИРАЦЕТАМ

*Нейропротекция на начальных этапах ишемического каскада:*

- Увеличивает утилизацию глюкозы и экстракцию кислорода в анаэробных условиях;*
- Увеличивает высвобождение и обратный захват нейромедиаторов (глутамата и др.);*
- Уменьшает вазоспазм, не оказывая вазорасширяющего действия, не снижает АД;*
- Уменьшает адгезию эритроцитов к эндотелию сосудов;*
- Нормализует вязкость крови.*

## ПИРАЦЕТАМ

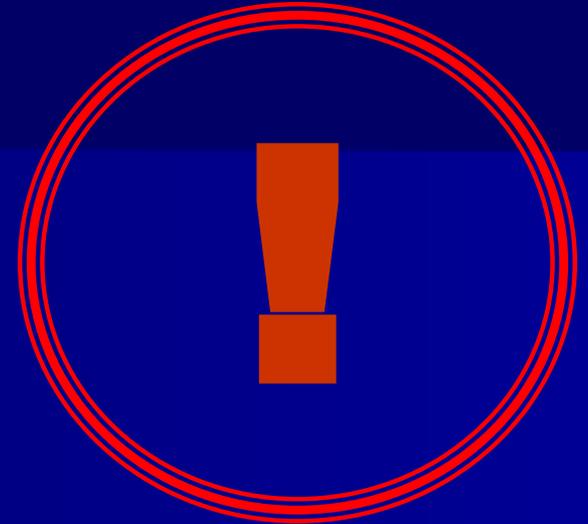
### *Коррекция последствий ишемического каскада:*

- Ускоряет конверсию АДФ в АТФ и способствует более быстрому восстановлению концентрации АТФ;*
- Увеличивает активность аденилат-киназы (фермента, участвующего в синтезе АТФ в анаэробных условиях;*
- Снижает перекисное окисление липидов и образование свободных радикалов, а также способствует их элиминации;*

# ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ рацетамных ноотропов

## ПИРАЦЕТАМ

- ↑ раздражительность,  
возбудимость, нарушение сна;
- диспепсические явления;
- учащение приступов  
стенокардии;
- Головокружение, головная  
боль;
- Повышение судорожной  
готовности;
- Усиление лактат-ацидоза и  
цитотоксического отека в  
острый период ОНМК



«Достаточно часто учет  
**ПРОТИВОПОКАЗАНИЙ** и  
возможных  
**НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫХ**  
эффектов ЛС важнее  
знаний показаний к его  
назначению»

# ПОКАЗАНИЯ К НАЗНАЧЕНИЮ НООТРОПОВ

- В восстановительном периоде ОНМК и ЧМТ показана эффективность пирацетама, холина альфосцерата, глицина, церебролизина;
- В детской практике показаниями к назначению являются задержка психического развития, умственная отсталость, последствия перинатального повреждения ЦНС, ДЦП, синдром дефицита внимания;
- Некоторые ноотропы используют для коррекции нейролептического синдрома (деанола ацеглумат, пиритинол, пантогам, гомопантенная кислота), заикания (фенибут, пантогам), гиперкинезов (баклофен, фенибут, гопантенная кислота, мемантин), расстройств мочеиспускания (никотиноил-ГАМК, пантогам), нарушений сна (глицин, фенибут, гинкго Билоба), для профилактики укачивания (фенибут, ГАМК);
- В офтальмологии (в составе комплексной терапии) применяют никотиноил-ГАМК (открытоугольная глаукома, сосудистые заболевания сетчатки и желтого пятна), гинкго Билоба (старческая дегенерация желтого пятна, диабетическая ретинопатия).

# ПОКАЗАНИЯ К НАЗНАЧЕНИЮ

Лечить лекарствами  
нужно тогда, когда  
нельзя не лечить.

Б.Е. Вотчал

- Деменция различного генеза (сосудистая, сенильная, при б-ни Альцгеймера);
- Хроническая цереброваскулярная недостаточность;
- Психоорганический синдром;
- Последствия нарушения мозгового кровообращения, ЧМТ, интоксикации, нейроинфекции;
- Интеллектуально-мнестические расстройства (нарушения памяти, концентрации внимания, мышления);
- Астенический, астено-депрессивный и депрессивный синдром;
- Невротические и неврозоподобные расстройства;
- Вегетососудистая дистония;
- Хронический алкоголизм (энцефалопатия, психоорганический синдром, абстиненция);
- Для улучшения умственной работоспособности.

**АДАПТОГЕНЫ** – лекарственные средства растительного и животного происхождения, которые выступают **модуляторами приспособительных (адаптационных) функций организма к неблагоприятным факторам окружающей среды.**

**Классификация:**

- **растительного происхождения:** препараты женьшеня (*Tinctura Ginseng*), элеутерококка (*Extractum Eleutherococci fluidum*), родиолы розовой («золотой корень»), китайского лимонника (*Tinctura Schizandrae*), заманихи, аралии, левзеи и т.д. ;
- **животного происхождения** – пантокрин (*Pantocrinum*).

# ВИДЫ ДЕЙСТВИЯ адаптогенов НА ОРГАНИЗМ

- ▣ общетонизирующее (преимущественно комплексы биологически активных веществ из левзеи, китайского лимонника, заманихи, аралии),
- ▣ адаптационные эффекты с общетонизирующими свойствами (препараты женьшеня, элеутерококка, родиолы розовой и др.).

# ПОКАЗАНИЯ К НАЗНАЧЕНИЮ

## адаптогенов

- Для повышения работоспособности здоровых людей, которые работают в экстремальных условиях окружающей среды,
- при статических и динамических нагрузках у спортсменов,
- при производственных нагрузках на органы чувств (слух, зрение);
- у людей преклонного возраста при быстром статическом утомлении.
- Профилактика заболеваний инфекционной и неинфекционной этиологии, в период реконвалесценции.
- Лечение астенических состояний, неврастении; гипотонии; повышенной сонливости; вегетососудистой дистонии, сексуальной дистонии.
- Необходимо иметь в виду, что адаптогены являются прежде всего профилактическими средствами, т.е. их эффект проявляется при длительном систематическом применении.

# НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ или ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ адаптогенов

- *Повышают возбудимость ЦНС; бессонница; головная боль, гипертензия.*
- *Адаптогены растительного происхождения противопоказаны при гипертонической болезни, повышенной возбудимости ЦНС, бессоннице.*
- *Пантокрин не следует применять при значительном повышении артериального давления, выраженном атеросклерозе, органических заболеваниях сердца, стенокардии.*



*Жизнь прекрасна!*