

*"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).

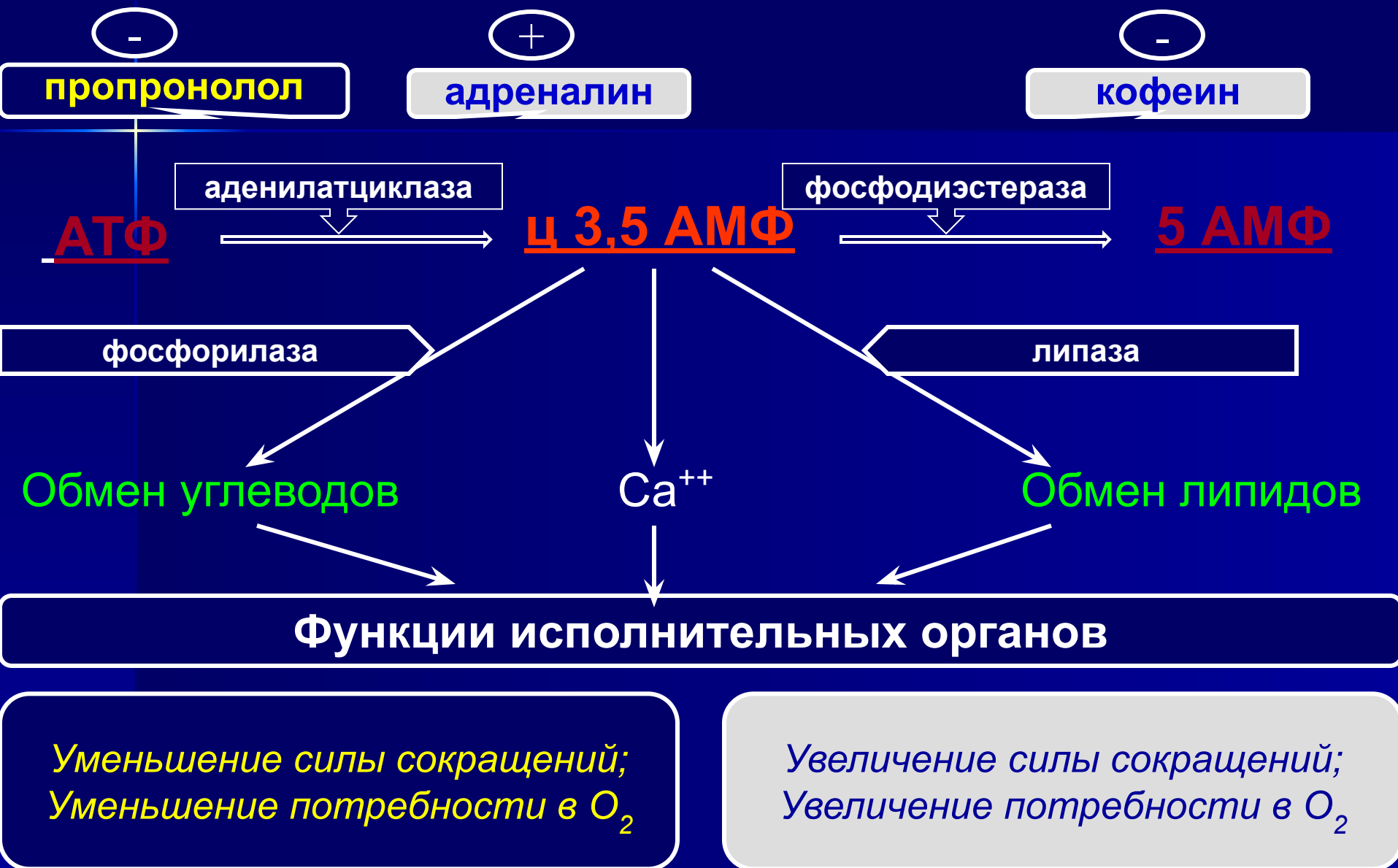
МЕХАНИЗМЫ ДЕЙСТВИЯ

■ 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



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.

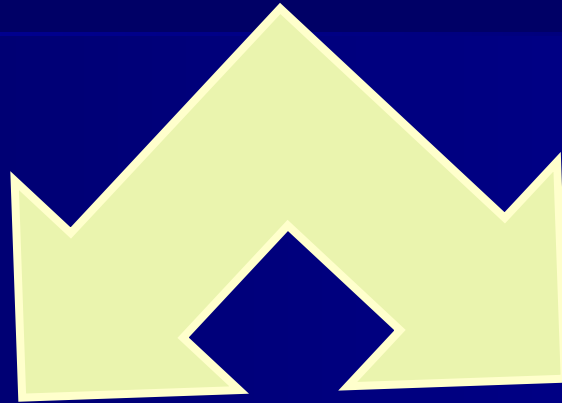
Классификация ноотропов

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)

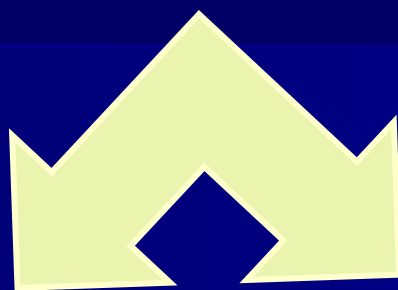
Нейрометаболические церебропротекторы (ноотропы)



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=АКТГ₄₋₁₀)
- НЕЙРОПСИХОТРОПНЫЕ СРЕДСТВА (нейролептики, транквилизаторы, противосудорожные, антидепрессанты, актопротекторы, адаптогены, психостимуляторы)
- ТИЛОВЫЕ ПРОТИВОЯДИЯ
- 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

α -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*);

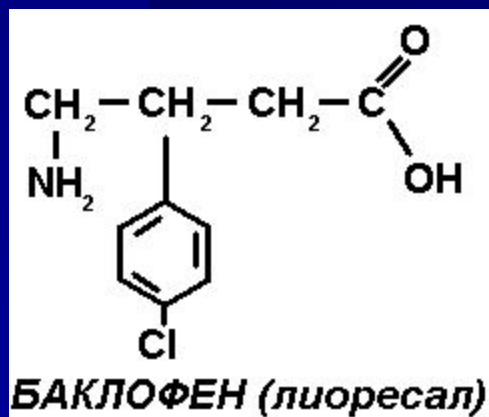
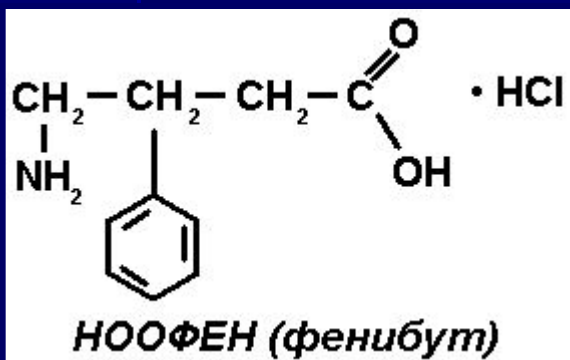
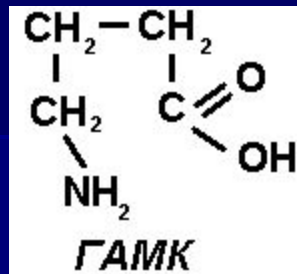
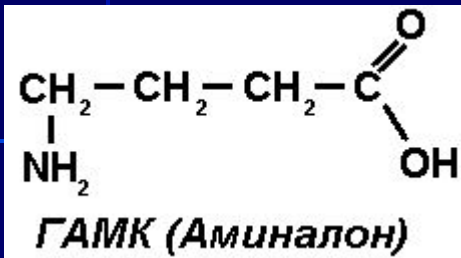
10. Вазовегетативное действие (*влияние на головную боль, головокружение, вегетативную неустойчивость при цереброастенических синдромах*);

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 O₂, 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



а также:

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

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

ПИРАЦЕТАМ

- ↑ уровень НА и количество β -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!