

ВЕЩЕСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ ПРЕИМУЩЕСТВЕННО НА ЦНС

Препараты, влияющие на ЦНС, были одними из первых средств, открытых нашими древними предками, и до сих пор остаются одними из наиболее часто используемых средств. Такие вещества, как **кофеин, никотин, этиловый спирт**, потребляются очень широко в мире, в том числе и в нашей стране.



ЛС, влияющие на ЦНС

ЛС, угнетающие функции ЦНС

ЛС, возбуждающие функции ЦНС

Средства для наркоза

Снотворные

Наркотические анальгетики

Аналептики

ингаляционные

неингаляционные

Противосудорожные средства

Психостимуляторы

Антидепрессанты

Психотропные средства

Противоэпилептические

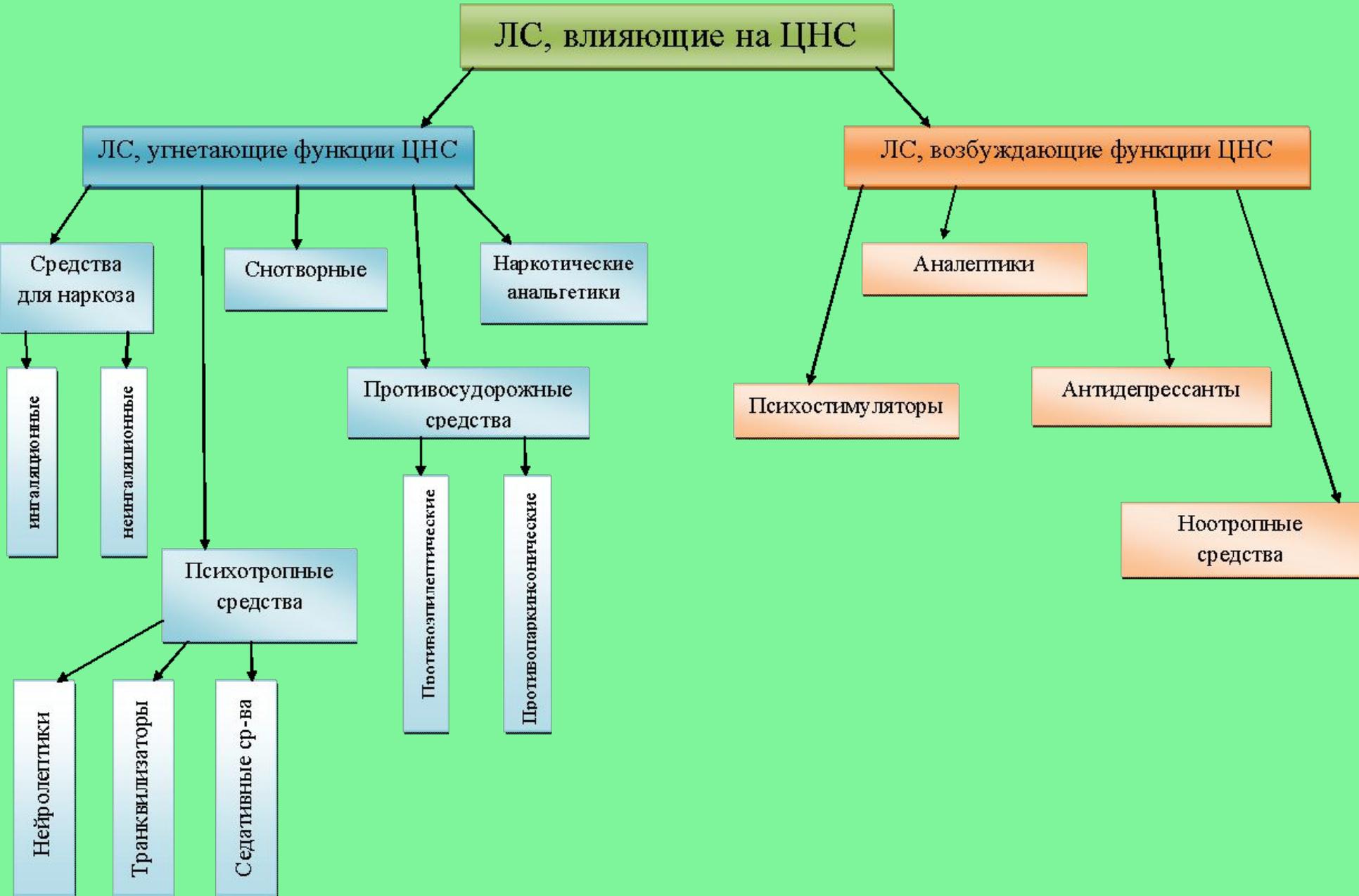
Противопаркинсонические

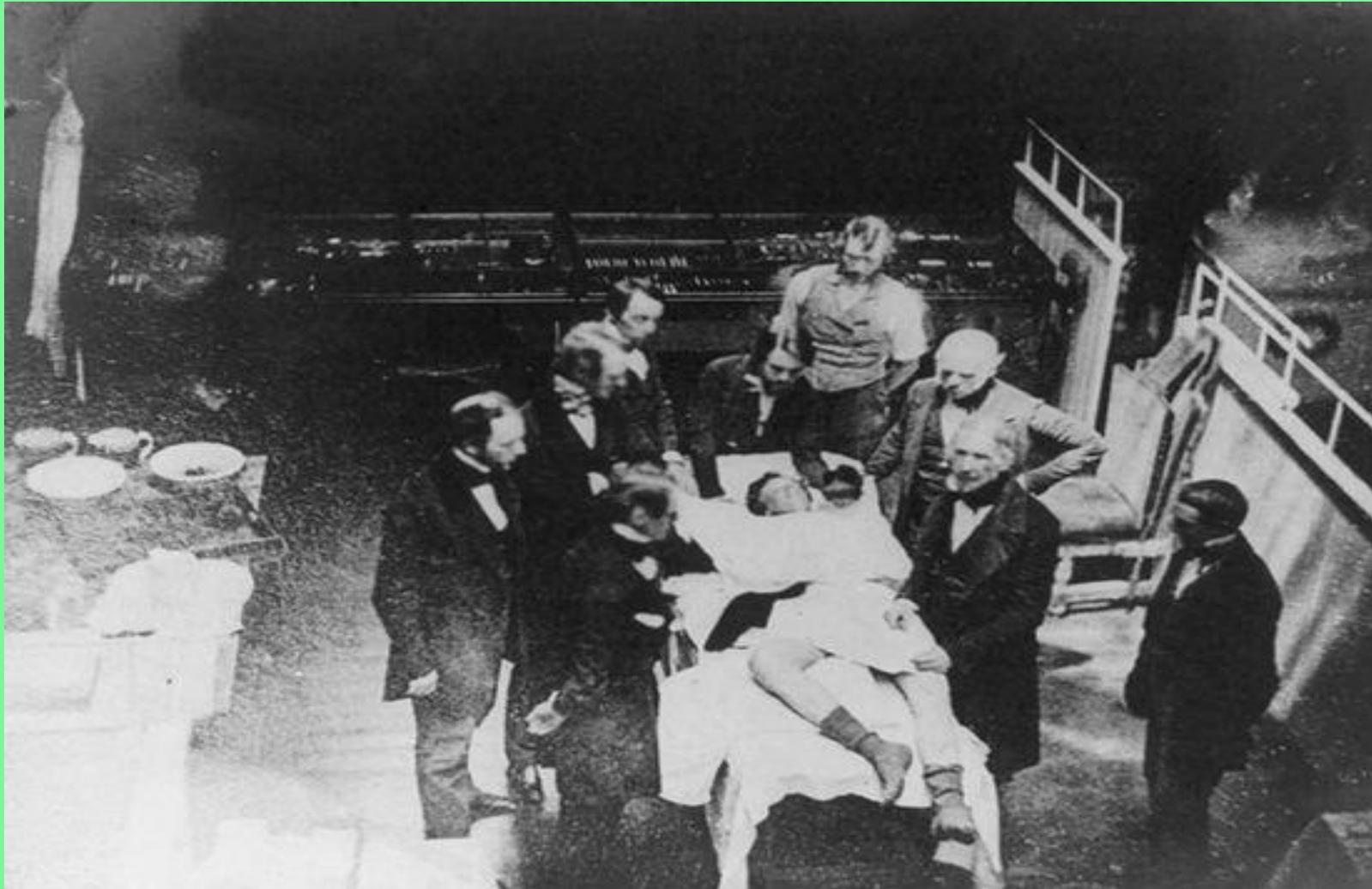
Ноотропные средства

Нейролептики

Транквилизаторы

Седативные ср-ва

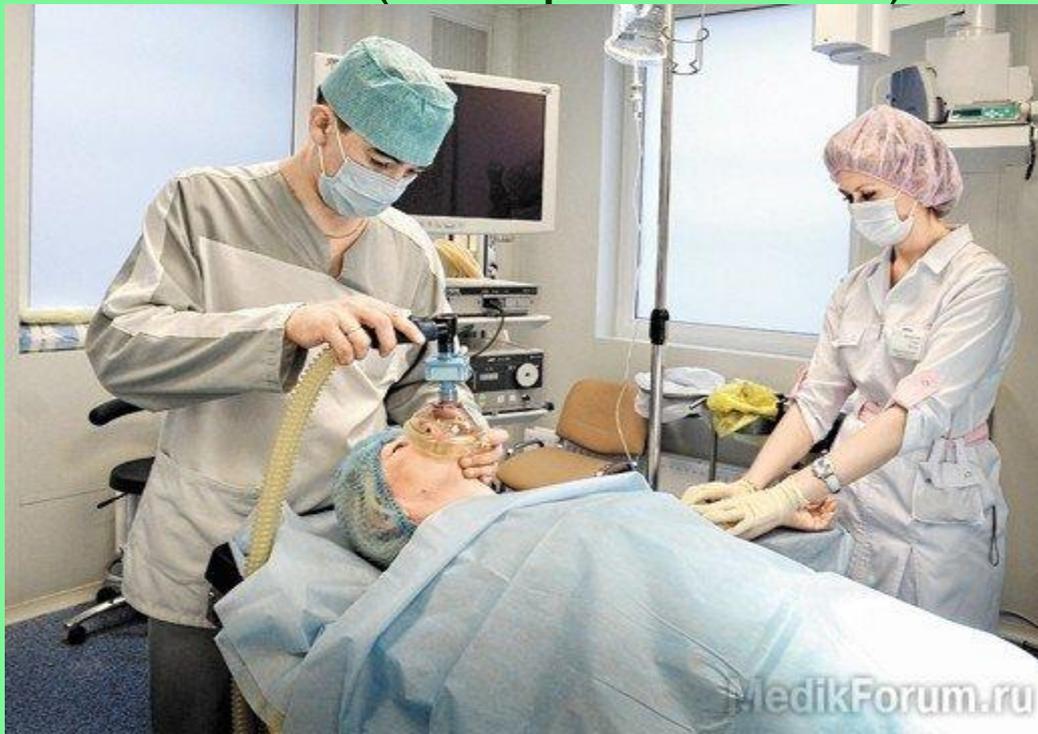




16 октября, Бостон, 1846 год, первый эфирный наркоз.

Средства для наркоза

Состояние наркоза, или общей анестезии, обычно включает потерю чувствительности, прежде всего - болевой (анальгезию, обезболивание), потерю сознания, угнетения рефлексов, расслабление скелетной мускулатуры и амнезию (потерю памяти).



Средства для ингаляционного наркоза



Средства для ингаляционного наркоза

- **Фторотан** – наркоз наступает быстро (через 3-5 мин), стадия возбуждения короткая, наркоз легко управляем.

Побочные явления

гипотензия, брадикардия (повышен тонус блуждающего нерва) и аритмия вплоть до фибрилляции желудочков и остановки сердца, иногда — тошнота, рвота, головная боль; после длительного наркоза — небольшая гипотермия.

Противопоказания к применению

Фторотановый наркоз противопоказан при шоке, коллапсе, тяжёлых поражениях сердца, выраженных аритмиях,.

Состав и форма выпуска: флаконы тёмного стекла по 50 мл, 200 мл и 250 мл

- **Закись азота (веселящий газ)** – применяется смесь 80% закиси азота + 20% кислорода.

Наркотический эффект недостаточен поэтому сочетают с фторотаном. Применяют также при инфаркте миокарда или при других состояниях, сопровождающихся сильными болями (хороший анальгезирующий эффект).

- **Ксенон** – хороший, но дорогой препарат. Не вступает в химическую реакцию с нейронами, но временно изменяет их функции в передаче болевых сигналов. Из всех многочисленных анестетиков ксенон ближе всех стоит к разгадке теорий наркоза. Не случайно, в научном мире его считают инструментом познания механизмов анестезии.

Средства для неингаляционного наркоза



Пропофол - быстродействующий внутривенный анестетик для введения в общую анестезию и ее поддержания, также для седации больных во время интенсивной терапии. Общая анестезия наступает через 30-60 секунд. Продолжительность анестезии составляет от 10 минут до 1 часа. От анестезии пациент пробуждается быстро и с ясным сознанием. Возможность открыть глаза появляется через 10 минут.

Применение Вводная анестезия, поддержание общей анестезии; седация пациентов при проведении ИВЛ, хирургических и диагностических процедур.

Противопоказания Гиперчувствительность, детский возраст: до 1 мес — для вводного наркоза и поддержания анестезии, до 16 лет — для обеспечения седативного эффекта во время интенсивной терапии.

Побочные действия Снижение АД, брадикардия, кратковременная остановка дыхания, одышка; редко — судороги, в период пробуждения — головная боль, тошнота, рвота, послеоперационная лихорадка (редко); местные — боль в месте инъекции, редко — флебит и тромбоз вен.

Натрия оксибутират - Применяют в анестезиологической практике как неингаляционное наркотическое средство для наркоза при неполостных малотравматических операциях с сохранением спонтанного дыхания, также для вводного и базисного наркоза в хирургии, акушерстве и гинекологии, особо у заболевших, находящихся в состоянии гипоксии; в детской хирургии; при проведении наркоза у лиц пожилого возраста. В психиатрической и неврологической практике применяют натрия оксибутират у заболевших с невротическими и неврозоподобными состояниями, при интоксикациях и травматических повреждениях ЦНС, при нарушениях сна, при нарколепсии (для улучшения ночного сна). Имеются данные об эффективности натрия оксибутирата при невралгии тройничного нерва.

+ **Достоинства ингаляционного наркоза** - его хорошая управляемость и относительная легкость проведения наркотизации,

- **Недостатки** - длительное вхождение в наркоз и наличие стадии возбуждения.

+ **Достоинства неингаляционного наркоза** - быстрое наступление его и отсутствие стадии возбуждения,

- **Недостаток** - плохая управляемость.

Стадии эфирного наркоза

- 1. Стадия анальгезии** - исчезает болевая чувствительность, но больной находится в сознании.
- 2. Стадия возбуждения**
- 3. Стадия хирургического наркоза.** Обусловлена она угнетением большинства подкорковых образований, за исключением дыхательного и сосудодвигательного центра.
- 4. Агональная стадия** происходит полное угнетение всех отделов ЦНС и без жизнеобеспечивающих мероприятий быстро наступает смерть.

• При отмене эфира все стадии наркоза идут в обратном порядке (стадия пробуждения), но, как правило, быстрее и с менее выраженными признаками.

Этиловый спирт - При резорбтивном действии этиловый спирт проявляется себя как низкоэффективное средство для наркоза. При этом он имеет ряд особенностей: отсутствует стадия анальгезии, стадия возбуждения длительная и с сохранением сознания, характерна выраженная расторможенность (речевая, двигательная, сексуальная), стадия наркоза очень быстро переходит в агональную стадию.

В медицине этиловый спирт применяется местно как антимикробное средство (70%) и как раздражающее в компрессах (40-50%). Резорбтивное действие этилового спирта применяется редко, как согревающее и как поставщик легкоусвояемой энергии истощенным больным. в малых дозах этиловый спирт обладает мягким седативным действием, повышает аппетит, улучшает пищеварение. Постоянный прием малых доз спирта (до 20 мл/сутки) достоверно снижает риск возникновения инфаркта миокарда и появления приступов стенокардии. Этот эффект спирта связывают со снижением уровня холестерина в крови и снижением свертывания крови. Однако при постоянном приеме высоких доз алкоголя серьезно нарушается функция ЦНС, человек теряет способность к самокритике, совершает антисоциальные поступки.

При стойком пристрастии к алкоголю при его непоступлении в организм развивается синдром отмены - **абстиненция** - в виде белой горячки.



Снотворные средства

Есть разные классификации снотворных средств, но в историческом и практическом смысле их можно разделить на три группы:

- 1. производные барбитуровой кислоты (барбитураты),*
- 2. производные бензодиазепина,*
- 3. снотворные разного химического строения.*



Барбитураты

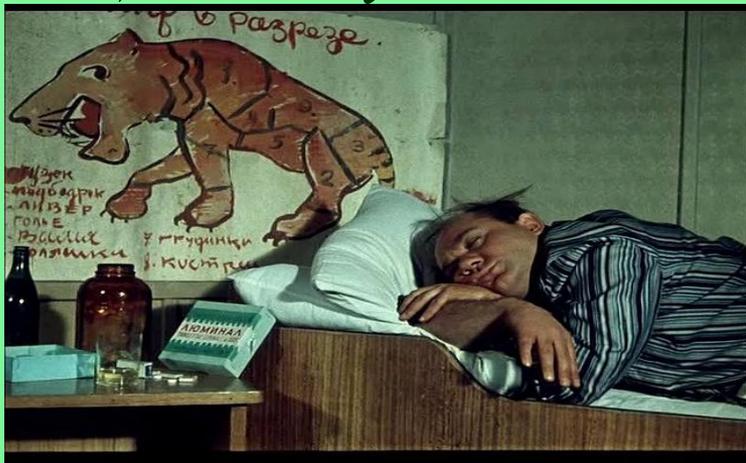
(производные барбитуровой кислоты)

Фенобарбитал, барбитал-натрий, этаминал-натрий, барбамил и др.

• *Для всех барбитуратов характерно нарушение структуры сна - увеличение длительности медленного сна, что не дает удовлетворения от сна.*

• *Все барбитураты способны повышать активность антитоксической функции печени, за счет чего к ним довольно быстро развивается привыкание. (Фенобарбитал, иногда используется по этому действию для профилактики возможных отравлений препаратами, метаболизирующимся в печени.)*

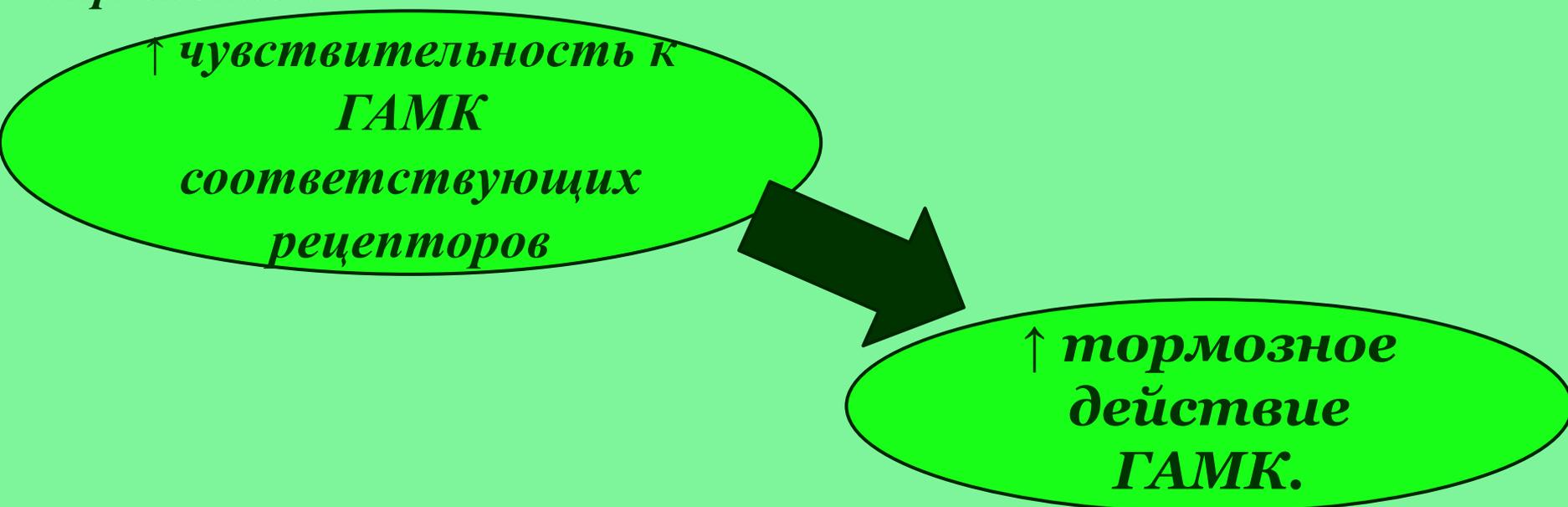
• *Чаще используется для лечения эпилептических припадков.*



Бензодиазепиновые производные (БДА)

Производные БДА взаимодействуют с бензодиазепиновыми рецепторами

Считаются оптимальными снотворными средствами. Эффективны при нарушениях сна связанных с тревогой и эмоциональным напряжением.



• Бензодиазепины обладают широким спектром фармакологического действия, включающим анксиолитическое, седативное, снотворное, миорелаксирующее, противосудорожное, амнестическое и др.

Препараты средней продолжительности действия:

• **Нитразепам.** (Он обладает хорошим седативным действием и в то же время выраженным снотворным. Сон наступает после приема нитразепама через 20-45 минут и длится до 8 часов. Важной особенностью препарата является то, что он практически не нарушает нормальную фазовую структуру сна.

• Препараты длительного действия: **Диазепам, феназепам.**

Зопиклон и Золпидем – не являются производными БДА, но имеют сродство к БДА



Идеальное снотворное средство должно вызывать сон, близкий по структуре и длительности к физиологическому, иметь малый латентный период (то есть время от приема препарата до засыпания), не иметь побочных и токсических явлений, не вызывать пристрастия и привыкания, не оказывать последствий (то есть головная боль, головокружение, чувство разбитости, депрессия на следующий день). Со всей очевидностью следует признать, что в настоящее время ни одно из имеющихся в арсенале медиков снотворных не удовлетворяет полностью этим критериям. Более того, практически все снотворные средства обладают одним общим отрицательным свойством - **синдромом отдачи**.

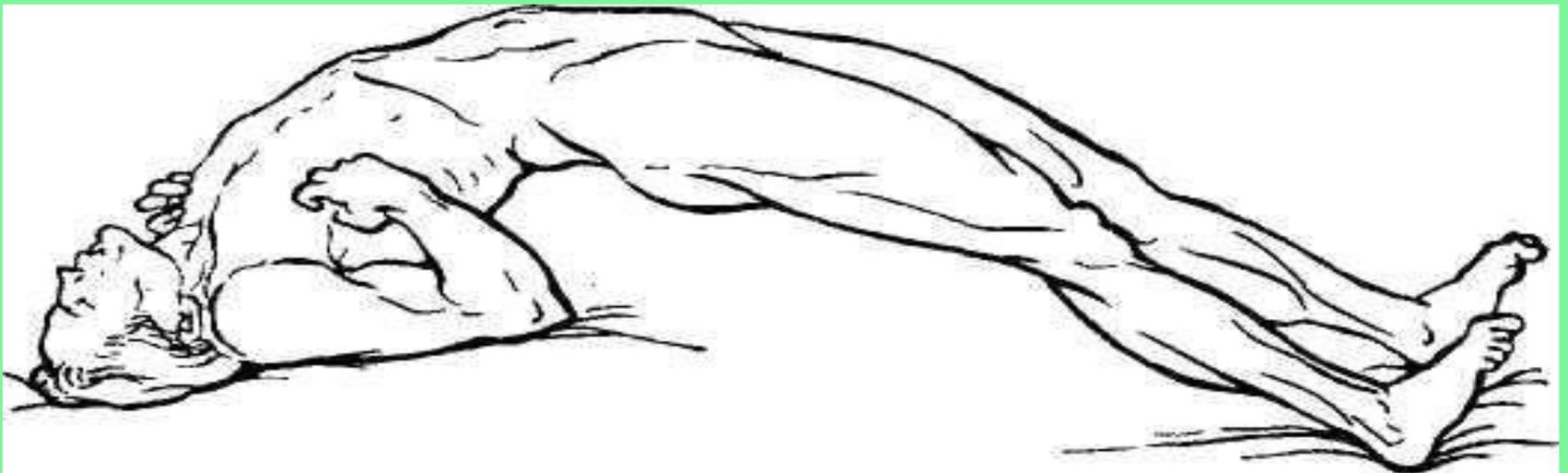
Он означает, что при отмене препарата бессонница не только появляется вновь, но и становится более выраженной. Кроме того, ко всем снотворным средствам в той или иной мере развивается привыкание и пристрастие.

Поэтому длительное лечение бессонницы снотворными средствами (более недели) является врачебной ошибкой.



Противосудорожные средства

1. Средства симптоматической терапии: наркозные, снотворные, нейролептики, транквилизаторы, миорелаксанты.
2. Средства для лечения эпилепсии.
3. Средства для лечения болезни Паркинсона.



Болезнь Паркинсона - вызвана прогрессирующим разрушением и гибелью нейронов, продуцирующих нейромедиатор *дофамин*.

ПОЭТОМУ НУЖНО

**восполнить дефицит
дофамина в
головном мозге**

**угнетать центральные
холинергические
влияния.**

Предшественники дофамина – **Леводопа** – проникает через ГЭБ в базальные ганглии и превращается там в дофамин. **Наком, мадопар, мидантан.**

- Средства стимулирующие дофаминовые рецепторы.
Бромокриптин (парлодел) – возбуждает дофаминовые рецепторы.
- Центральные холиноблокаторы - **Циклодол. Тропацин.**

Средства для лечения болезни Паркинсона.



Противоэпилептические средства

Эпилепсия — хроническое заболевание, характеризующееся повторяющимися время от времени эпизодами неконтролируемого возбуждения нейронов мозга. В зависимости от причины, вызвавшей патологическое возбуждение нейронов и локализации очага возбуждения в мозге, эпилептические припадки могут иметь множество форм.

Типы судорог	Препараты
1) Генерализованные судороги	
Большие судорожные припадки	Карбамазепин, фенobarбитал, дифенин, натрия вальпроат, ламотриджин.
Эпилептический статус	Диазепам, клоназепам.
Малые приступы эпилепсии	Этосукцимид, клоназепам, натрия вальпроат, ламотриджин.
Миоклонус - эпилепсия	Клоназепам, натрия вальпроат, ламотриджин.
1) Парциальные судороги	Карбамазепин, клоназепам, дифенин, натрия вальпроат, ламотриджин

Дифенин оказывает выраженное противосудорожное действие. Дифенин снижает возбудимость двигательных центров головного мозга при отсутствии снотворного эффекта. Благоприятно влияет на общее состояние больных эпилепсией.

Карбамазепин - Снижает частоту приступов, тревогу, депрессию, раздражительность и агрессивность у больных эпилепсией. Влияние на когнитивные функции у больных эпилепсией variabelно. Предупреждает появление пароксизмальных болей при невралгии. Используют при синдроме алкогольной абстиненции :снижает повышенную нервную возбудимость, тремор, нарушения походки. Используется для лечения аффективных расстройств в качестве антипсихотического и нормотимического средства.

Клоназепам - Клиническое действие проявляется сильным и продолжительным противосудорожным эффектом. Оказывает также антифобическое, седативное (особенно выражено в начале лечения), миорелаксирующее и умеренное снотворное действие.

Ламотриджин (ламиктал) – эффективен при различных формах эпилепсии. Тормозит выделение возбуждающих аминокислот в ЦНС.

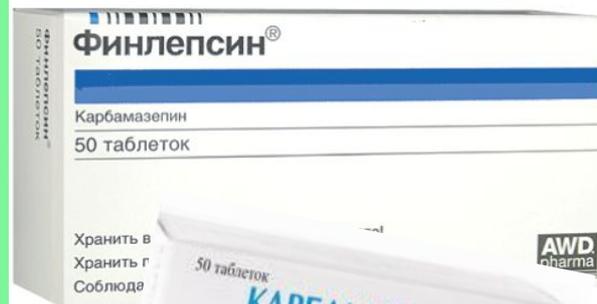
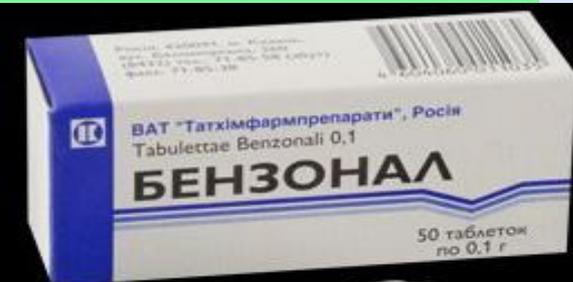
Диазепам – используют для лечения эпилептического статуса.

Лечение эпилепсии проводится на протяжении нескольких лет. Это нередко приводит к побочным эффектам: головной боли, тошноте, появлению кожного зуда.

Возможны лейкопения и эритропения, нарушения функции печени и почек.

Практически все противоэпилептические средства вызывают седативный эффект, нарушают способность к концентрации внимания и замедляют скорость психомоторных реакций.

Противоэпилептические средства



Психотропные препараты

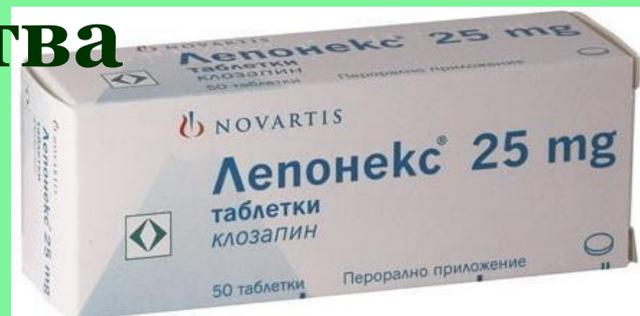
Современные психотропные вещества вмешиваются в биохимические процессы ткани мозга.

1. **психоседативные** средства - оказывают успокаивающее влияние на ЦНС;
2. **психостимулирующие** средства и антидепрессанты - оказывают возбуждающее влияние на ЦНС;
3. **ноотропные вещества** - влияющие на процессы мышления (ноос - разум);
4. **психодислептики, галлюциногены** - нарушают психическую деятельность человека. Они не являются лекарствами, а используются как одурманивающие вещества

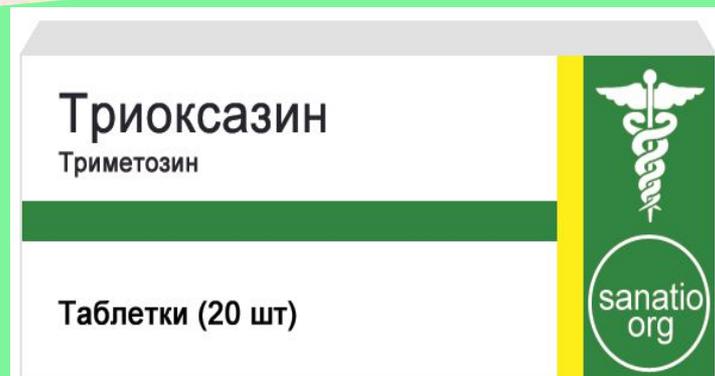
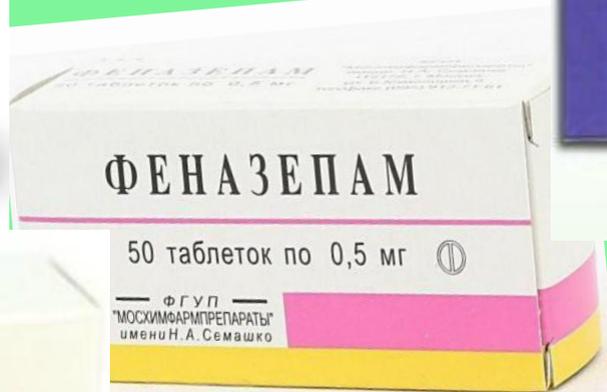
.

Психоседативные средства

Нейролептики оказывают выраженное угнетающее влияние на нервную и психическую деятельность человека без нарушения сознания. Они обладают транквилизирующим (успокаивающим) и антипсихотическим действиями.



Транквилизаторы - это препараты, ослабляющие чувство страха, тревоги, беспокойства, внутреннего напряжения. Их часто называют анксиолитики (анксиоз - беспокойство).



Седативные средства

До появления транквилизаторов это были средства терапии неврозов. В настоящее время, вследствие низкой эффективности, седативные препараты практически утратили свое значение и имеют в основном исторический интерес.



СТИМУЛЯТОРЫ

Психостимуляторы - повышают настроение, способность к восприятию внешних раздражений, психомоторную активность. Они уменьшают чувство усталости, повышают физическую и умственную работоспособность (особенно при утомлении), временно снижают потребность во сне.



Amphetamine



Ноотропные средства - активируют высшие интегративные функции головного мозга.

Многие ноотропные средства обладают выраженной противогипоксической активностью.

На высшую нервную деятельность здоровых животных и психику здорового человека эти препараты не влияют.



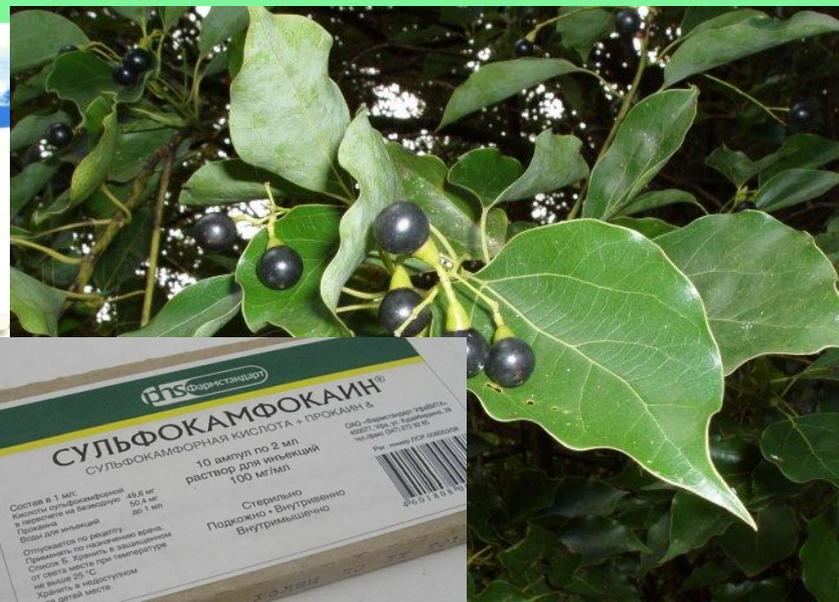
Препараты, улучшающие мозговое кровообращение.

Улучшающее мозговое кровообращение действие лекарственных препаратов проявляется в усилении кровотока и кровоснабжения ГОЛОВНОГО МОЗГА.



Аналептики.

Это лекарственные средства, оказывающие сильное возбуждающее действие на дыхательный и сосудодвигательный центры продолговатого мозга непосредственно (**кофеин, камфора, бемегрид**), либо путём повышения их чувствительности (**стрихнин**), что стимулирует жизненно важные функции дыхания и кровообращения. Некоторые аналептики могут, помимо этого, стимулировать и другие отделы ЦНС, что при передозировке вызывает судороги.





Антидепрессанты.

— психотропные лекарственные средства, применяемые прежде всего для лечения депрессии. У депрессивного больного они улучшают настроение, уменьшают или снимают тоску, вялость, апатию, тревогу и эмоциональное напряжение, повышают психическую активность, нормализуют фазовую структуру и продолжительность сна, аппетит. Многие антидепрессанты не вызывают улучшения настроения у человека, не страдающего депрессией

Магния сульфат оказывает многогранное влияние на организм.

Препарат понижает возбудимость дыхательного центра, большие дозы продукта при парентеральном (минуя пищеварительный тракт) введении легко могут вызвать паралич дыхания. Артериальное давление несколько понижается в связи с общим успокаивающим действием продукта; этот эффект более выражен при гипертонической болезни (стойком повышении артериального давления)

При парентеральном введении магния сульфат оказывает успокаивающее действие на центральную нервную систему. В зависимости от дозы может наблюдаться седативный (успокаивающий), снотворный или наркотический эффект.

При приеме внутрь он плохо всасывается, действует как слабительное средство.



Анальгетики

С точки зрения медицины, **боль** — это:

- вид чувства, своеобразное неприятное ощущение;
- реакция на это ощущение, которая характеризуется определённой эмоциональной окраской, рефлекторными изменениями функций внутренних органов, двигательными безусловными рефлексам, а также волевыми усилиями, направленными на избавление от болевого фактора.
- неприятное сенсорное и эмоциональное переживание, связанное с реальным или предполагаемым повреждением тканей, и одновременно реакция организма, мобилизующая различные функциональные системы для его защиты от воздействия патогенного фактора.

Болевые ощущения воспринимаются специальными рецепторами – **ноцицепторами** которые находятся в окончаниях разветвленных афферентных волокон, расположенных в коже, мышцах, суставных капсулах, надкостнице, внутренних органах и т.п.

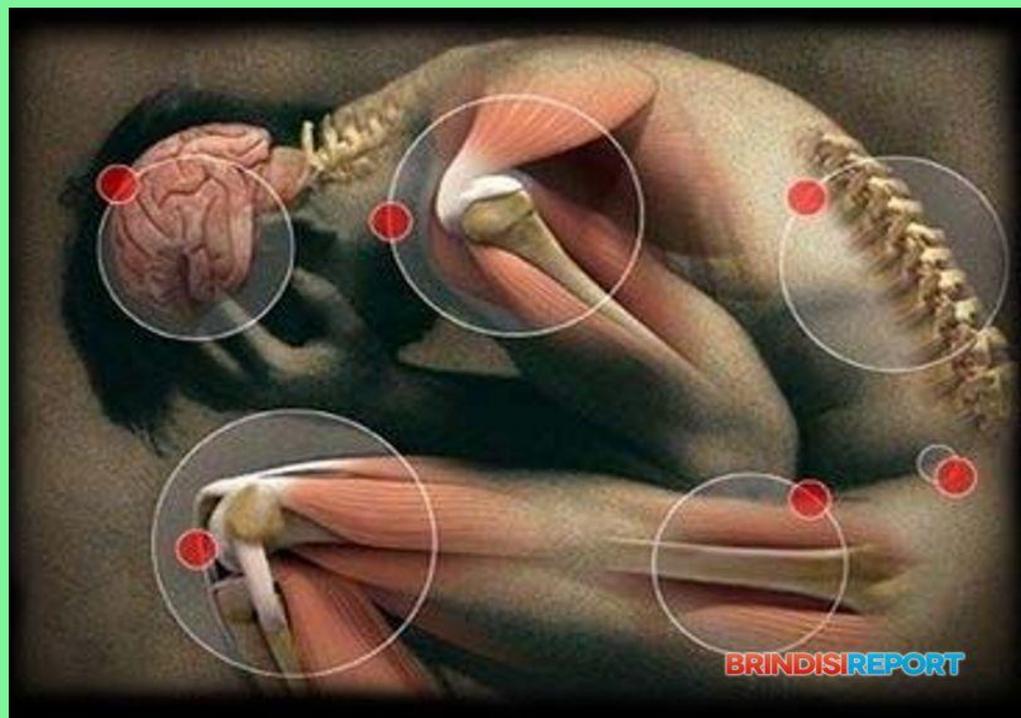
Причины боли : ●воспаление

●эндогенные в-ва (брадикинин, серотонин, гистамин)

●простагландины

(Простагландины являются медиаторами с выраженным физиологическим эффектом.)

Они повышают чувствительность ноцицепторов к химическим и термическим раздражителям.



Анальгетики – препараты, которые при резорбтивном действии избирательно подавляют болевую чувствительность. Они не угнетают сознание и не выключают другие виды чувствительности. Выделяют

- 1. наркотические (опиоидные) анальгетики,**
- 2. ненаркотические анальгетики**
- 3. анальгетики смешанного действия.**



К наркотическим анальгетикам относят :

• алкалоиды опия фенантренового ряда:

- Морфин
- Омнопон
- Кодеин



• синтетические наркотические анальгетики:

- Промедол
- Фентанил



Наркотические анальгетики.

- Действуют на опиатные рецепторы, при этом происходит потеря болевой чувствительности. Другие виды чувствительности не нарушаются, более того, слух, зрение и обоняние могут обостряться.
- Угнетают дыхательный центр (снижают его чувствительность к углекислому газу), особенно при передозировках, и это является основной причиной гибели при острых отравлениях морфином.
- Вызывают эйфорию, Исчезают чувства тревоги, страха, голода, усиливается воображение и устраняется самоконтроль, появляется полное безразличие к окружающему. Человек отрешается от действительности на время действия препарата, в дальнейшем он испытывает потребность в повторных подобных ощущениях и втягивается в зависимость от препарата.
- стимулирует центры глазодвигательных нервов, что проявляется выраженным миозом, и блуждающего нерва - вызывает брадикардию. Кроме того, на периферии морфин повышает тонус сфинктеров ЖКТ, мочевого пузыря и бронхов.

При продолжительном приеме развивается толерантность ко многим эффектам наркотических анальгетиков, за исключением миоза и запора.

Передозировка Морфина:

Симптомы острой и хронической передозировки: холодный липкий пот, спутанность сознания, головокружение, сонливость, снижение АД, нервозность, усталость, миоз, брадикардия, резкая слабость, медленное затрудненное дыхание, гипотермия, тревожность, сухость слизистой оболочки полости рта, делириозный психоз, внутричерепная гипертензия (вплоть до нарушения мозгового кровообращения), галлюцинации, мышечная ригидность, судороги, в тяжелых случаях — потеря сознания, остановка дыхания, кома.



Специфическими антагонистами наркотических анальгетиков являются антагонисты опиоидных рецепторов **налуксон** и **налтрексон**, которые успешно применяются при остром отравлении морфином и его аналогами.

СИНТЕТИЧЕСКИЕ НАРКОТИЧЕСКИЕ АНАЛЬГЕТИКИ

Промедол - уступает морфину по анальгетическому действию, но не обладает спазмогенным действием. Особенностью препарата является его действие на беременную матку - он способствует установлению правильных ритмических сокращений матки и ускоряет родоразрешение. Промедол является препаратом выбора для обезболивания родов, хотя нужно помнить, что он способен в определенной степени угнетать дыхательный центр плода, хотя и меньше, чем морфин.

Фентанил, является одним из наиболее сильных анальгетиков, но обладает малой продолжительностью эффекта (до 30 мин). Его часто используют вместе с нейролептиком дроперидолом для достижения особого вида общего обезболивания, называемого нейролептанальгезией. При этом у больного анальгезия сопровождается сохранением сознания, но отсутствием чувства страха и беспокойства, развитием безразличия к хирургическому вмешательству. Используют для кратковременных хирургических вмешательств.

В последнее время появился ряд новых синтетических препаратов: **Пентазоцин, буторфанол, трамадол, и др.**

Ненаркотические анальгетики.

Характеризуются:

- отсутствием наркотического действия;
- не эффективны при интенсивных болях
- показаны при болях, вызванных воспалением (артриты, невриты, миозиты)

Выделяют **3 группы** ненаркотических анальгетиков:

1. производные салициловой кислоты (салицилаты) - **аспирин (ацетилсалициловая кислота)**
2. производные пиразолона - **анальгин, бутадион,**
3. производные анилина - **парацетамол.**

Производные пиразолона



Производные анилина



В настоящее время в фармакологии принято выделять еще одну группу препаратов, которая очень близка к ненаркотическим анальгетикам. Эту группу препаратов обозначают как **нестероидные противовоспалительные средства (НПВС)**, таким образом, противопоставляя эту группу препаратов стероидным (гормональным) противовоспалительным средствам. НПВС включают препараты разных химических групп - **индометацин, вольтарен, ибупрофен** и др. Эти препараты преимущественно используются в качестве противоревматических, противоартритических средств. Они в несколько раз превосходят противовоспалительную активность салицилатов и производных пиразолона

НПВС



ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ НПВС

1. Ревматические заболевания

Следует учитывать, что при ревматоидном артрите НПВС оказывают только симптоматический эффект, не влияя на течение заболевания. Но облегчение, которое НПВС приносят больным ревматоидным артритом, настолько существенно, что ни один из них не может обойтись без этих препаратов. При больших коллагенозах (системная красная волчанка, склеродермия и другие) НПВС часто малоэффективны.

2. Неревматические заболевания опорно-двигательного аппарата

3. Неврологические заболевания. Невралгия, радикулит, ишиас, люмбаго.

4. Почечная, печеночная колика.

5. Болевой синдром различной этиологии, в том числе, головная и зубная боль, послеоперационные боли.

6. Лихорадка (как правило, при температуре тела выше 38,5°C).

7. Профилактика артериальных тромбозов.

8. Дисменорея.

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

НПВС противопоказаны при эрозивно-язвенных поражениях желудочно-кишечного тракта, особенно в стадии обострения, выраженных нарушениях функции печени и почек, цитопениях, индивидуальной непереносимости, беременности.



При необходимости, наиболее безопасными (но не перед родами!) являются небольшие дозы аспирина .

Индометацин не следует назначать амбулаторно лицам, профессии которых требуют повышенного внимания.

Продолжение следует

