

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ РОССИЙСКОЙ ФЕДЕРАЦИИ  
Федеральное государственное бюджетное образовательное учреждение высшего образования  
«СЕВЕРНЫЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ»

Кафедра фармакологии и фармакотерапии  
Зав. кафедрой: д.м.н., профессор Воробьева Н.А  
Преподаватель: к.м.н., доцент Белякова И.В

# Антидепрессанты



Кислухина А.В  
Студентка 6 курса 2 группы  
Педиатрического факультета

Г.Архангельск  
2017г

# Определение

- Антидепрессанты - Лекарственные средства психоаналептического действия с преимущественным влиянием на патологически сниженное настроение или депрессивный аффект. Эйфоризирующим эффектом они не обладают, у здоровых лиц повышения настроения не вызывают.

- Депрессией (от латинского *depressio* - подавление, угнетение) называется психическое расстройство, оказывающее существенное отрицательное влияние на социальную адаптацию, качество жизни и характеризуется патологически пониженным настроением (гипотимией) с пессимистической оценкой себя и своего положения в окружающей действительности (может сопровождаться суицидальными попытками), торможением интеллектуальной и моторной деятельности, снижением побуждений и соматовегетативными нарушениями.
- Депрессией (от латинского *depressio* - подавление, угнетение) называется психическое расстройство, оказывающее существенное отрицательное влияние на социальную адаптацию, качество жизни и характеризуется патологически пониженным настроением (гипотимией) с пессимистической оценкой себя и своего положения в окружающей действительности (может сопровождаться суицидальными попытками), торможением интеллектуальной и моторной деятельности, снижением побуждений и соматовегетативными нарушениями.

# Классификация антидепрессантов

## 1. Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов

### А. Неизбирательного действия

- *Трициклические антидепрессанты*
- Вторичные амины
- Третичные амины
- Атипичные трициклические соединения ( антидепрессивный эффект – неосновной)
- Гетероциклические антидепрессанты

### Б. Избирательного действия

- Ингибиторы захвата серотонина
- Ингибиторы захвата норадреналина
- Ингибиторы захвата серотонина и норадреналина
- Ингибиторы захвата норадреналина и дофамина

## 2. Ингибиторы моноаминоксидазы

### А. Неселективные

### Б. Селективные

## 3. Агонисты рецепторов моноаминов

### А. Норадренэргические и специфические серотонинэргические антидепрессанты

### Б. Специфические серотонинэргические антидепрессанты

## 4. Мелатонинэргические антидепрессанты

## 5. Предшественники серотонина

# Показания

- Антидепрессанты — это группа препаратов, применяемая для лечения и профилактики депрессии, в том числе в рамках биполярного расстройства. Однако антидепрессанты в клинической практике используют и с целью коррекции других нарушений. Среди них панические состояния, неврозы, обсессивно-компульсивные нарушения (применяются СИОЗС), энурез (применяются ТЦА в качестве дополнительной терапии), хронические болевые синдромы (применяются СИОЗС и ТЦА) Известны случаи эффективного использования антидепрессантов в качестве компонента вспомогательной терапии при лечении булимии, табакокурения, ранней эякуляции. Также антидепрессанты с успехом применяют при коррекции структуры сна.

# Общие противопоказания

- Индивидуальная непереносимость,
- психомоторное возбуждение,
- судорожные припадки,
- острые случаи спутанности сознания,
- заболевания печени и почек в стадии декомпенсации,
- стойкая артериальная гипотензия,
- нарушения кровообращения,
- беременность,
- тиреотоксикоз.

# Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов неизбирательного действия

- = трициклические антидепрессанты
- Механизм действия: Блокируют обратный захват нейромедиаторов (преимущественно норадреналина и серотонина) пресинаптической мембраной.
- Данная группа препаратов отличается высокой эффективностью, однако, имеет довольно большое количество побочных эффектов.

# Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов неизбирательного действия

- Недостатками ТЦА являются:
- большое количество побочных эффектов, вследствие этого — худшая переносимость препаратов данной группы и частое нежелание пациентов применять их;
- высокая токсичность при передозировке;
- наличие большого количества противопоказаний, что ограничивает их применение у пожилых и соматически ослабленных больных;
- тератогенный эффект;
- очень узкий терапевтический диапазон, мешающий существенно завышать дозу по сравнению с максимально допустимой по инструкции;
- перекрёстная резистентность (если у пациента оказался неэффективен один препарат этой группы, практически нет смысла назначать другой).



# Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов неизбирательного действия

- Представители: Имипирамин, Амитриптилин
- +: большая доказательная база, высокая эффективность, маленькая стоимость
- -: очень много побочных эффектов (ухудшение зрения, дисфагия, тошнота, рвота, нарушение когнитивных функций, провоцируют делирий, судороги, гиперпролактинемия, СД, недержание мочи, гепато и кардиотоксическое действие и др)

# Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов избирательного действия

- Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина
- Механизм действия СИОЗС — ингибирование обратного захвата серотонина + прямое стимулирующее действие на серотониновые 5-HT<sub>2C</sub>-рецепторы,
- Представители: Флуоксетин, праоксетин, дапоксетин
- +: лучше переносятся, меньше побочных эффектов (тошнота, рвота, диарея, головная боль, тремор), по эффективности одинаковы с ТЦА
- -: СИОИЗ – индуцированный апатический синдром

## Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов избирательного действия

- Селективные ингибиторы обратного захвата норадреналина (СИОЗН)
- Механизм действия - ингибирование обратного захвата НА
- Известные представители группы — ребоксетин, атомоксетин .
- +: хорошо переносятся, нет седативного действия, эффективность близка к ТЦА
- -: побочные эффекты как у ТЦА

# Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов избирательного действия

- Селективные ингибиторы обратного захвата серотонина и норадреналина (СИОЗСиН)
- Известные представители данной группы — венлафаксин, дулоксетин, милнаципран
- +:малые или минимальными побочными эффектами и хорошей переносимостью. Препараты данной группы приближаются по силе к ТЦА
- -:СИОЗСиН имеют больше побочных эффектов, чем СИОЗС, и потому не могут быть рекомендованы в качестве препаратов первой линии при депрессиях лёгкой и умеренной степени.

## Средства блокирующие нейрональный захват моноаминов избирательного действия

- Селективные ингибиторы обратного захвата норадреналина и дофамина (СИОЗНиД)
- Представитель: бупропион
- +: психостимулирующее действие без развития зависимости, хорошо переносится
- -: может возникнуть обратный эффект (беспокойство, бессонница, ажитация), повышает судорожную готовность

# Ингибиторы моноаминоксидазы

- МАО - митохондриальный фермент, который принимает участие в дезаминировании биогенных аминов (норадреналина, адреналина, дофамина, серотонина).
- Неизбирательные / избирательные

# Неизбирательные ингибиторы моноаминоксидазы

- Эти препараты необратимо блокируют оба типа моноаминоксидазы: МАО-А и МАО-Б.
- Представители:  
ипрониазид, изокарбоксазид, ниаламид  
производные амфетамина —  
транилципромин, паргилин
- +: высокоэффективны
- -: много побочных эффектов, не сочетаются с многими препаратами (например, НПВС), требуют соблюдения диеты
- Сейчас используют редко

# Избирательные ингибиторы моноаминоксидазы

- Ингибиторы MAO-A  
моклобемид, пиразидол, инказан, бефол
- Ингибиторы MAO-B селегилин
- +: дают значительно меньшие побочные эффекты, лучше переносятся и не требуют соблюдения специальной диеты. Риск лекарственных взаимодействий при приёме ниже, чем у неизбирательных ИМАО
- -: эффективности ниже, чем у ТЦА, неизбирательных ИМАО



# Агонисты рецепторов моноаминов

- Норадренергические и специфические серотонинергические антидепрессанты (НасСА)
- Представители: миансерин и мirtазапин
- Механизм: увеличивают содержание норадреналина и серотонина в синапсах + блокируют постсинаптические серотониновые 5-HT<sub>2</sub> и 5-HT<sub>3</sub> рецепторы,
- +: нет побочных эффектов характерных для СИОЗС
- -: много побочных эффектов

# Агонисты рецепторов моноаминов

- Специфические серотонинергические антидепрессанты (ССА)
- Представители: тразадон, нефазадон
- Механизм: блокирование обратного захвата серотонина и повышение серотонинергической нейротрансмиссии, блокируют серотониновые рецепторы подтипа 5-HT<sub>2</sub>
- +: нет побочных эффектов характерных для СИОЗС, нормализуют структуру сна,
- -: нефазадон может привести к смерти, снят с производства

# Агонисты рецепторов моноаминов

- Мелатонинэргический антидепрессант
- Представитель: агомелатин
- Механизм:  
стимулирует мелатониновые (MT1 и MT2) и  
блокирует серотониновые 5-HT2C рецепторы.
- +: единственный нормализует циркадные  
ритмы, мало побочных эффектов
- -: гепатотоксичность

# Агонисты рецепторов моноаминов

- Предшественники серотонина
- Представители: L-триптофан и 5-окситриптофан
- В РФ – это БАД!
- Механизм: прекурсоры серотонина
- рекомендуется для дополнительного потенцирования серотонинергических эффектов комбинаций «литий + ИМАО» и «литий + кломипрамин»
- -: возможны повреждения сердца
- При сочетании триптофана и 5-окситриптофана с традиционными антидепрессантами (СИОЗС, ИМАО) возможен серотониновый синдром.

# Применение у детей

- Для лечения депрессий у детей и подростков в Российской Федерации разрешены 2 препарата:
  1. Флувоксамин - СИОЗС (с 8 лет)
  2. Сертралин - СИОЗС (с 6 лет)
- Организацией FDA для применения у детей также разрешены 2 препарата: флуоксетин и эсциталопрам (оба из группы СИОЗС), однако, для лечения депрессий у детей в России они противопоказаны ( у обоих препаратов в инструкции по применению в графе противопоказания указан детский возраст до 18 лет), но эти препараты могут быть назначены и назначаются психиатрами, по индивидуальным показаниям по решению врачебного консилиума.