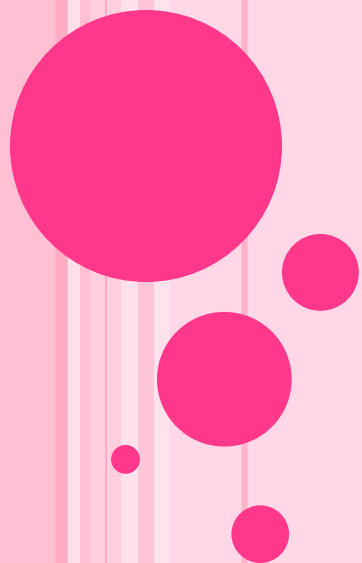


Психостимуляторы.



ОПРЕДЕЛЕНИЕ

Психостимуляторы -
лекарственные вещества,
стимулирующие психическую
функцию у здоровых и больных
людей.

КЛАССИФИКАЦИЯ ПСИХОСТОМУЛЯТОРОВ

ПСИХОМОРНЫЕ ПСИХОСТИМУЛЯТОРЫ:

по химическим свойствам

- производные ксантина — кофеин
 - теофиллин
 - теобромин
- производные имидазола - этимизол
- фенилалкиламины - фенамин (амфетамин)
- производные фенилалкилпиперидина - меридил
- производные фенилалкилсиднонимина - сиднофен
 - мезокарб



ПСИХОМЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ПСИХОСТИМУЛЯТОРЫ

(НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА):

К ним относятся препараты гамма-аминомасляной кислоты и ее аналогов, а также некоторые другие средства.

- Производные пирролидина (рацетамы):
этирацетам
- Производные и аналоги ГАМК:
гамма-аминомасляная кислота (аминалон)
никотиноил-ГАМК (пикамилон)
гопантеновая кислота
пирацетам



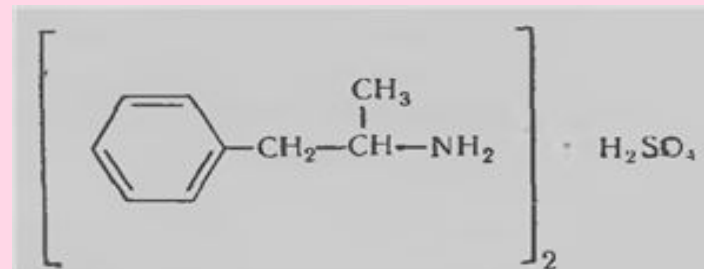
ЭФФЕКТЫ ПСИХОСТИМУЛЯТОРОВ

Психостимуляторы временно повышают работоспособность, концентрацию внимания и поддерживают состояние бодрствования, снижают аппетит и массу тела. Некоторые из них могут оказывать эйфоризирующий эффект и приводить к развитию зависимости.



ФЕНАМИН (АМФЕТАМИНА СУЛЬФАТ)

Является типичным представителем психостимуляторов.



Механизм действия:

- 1) Усиливают выброс всех моноаминовых нейромедиаторов, преимущественно норадреналина и дофамина в синаптическую щель.
 - 2) Блокируют обратный захват этих медиаторов рецепторами пресинаптической мембраны (конкурируют за эти рецепторы).
 - 3) Блокируют активность МАО в центральной и периферической нервной системе.
- Соответственно действие фенамина связано с накоплением в синаптической щели НА и дофамина.



- 4) Возбуждающий эффект фенамина связан с его стимулирующим эффектом на восходящую активирующую ретикулярную формацию.
- 5) В ЦНС амфетамины стимулируют корковые и стволовые структуры, а также таламус и ядра среднего мозга, что приводит к возникновению чувства бодрости, улучшению настроения.
- 6) Амфетамин обладает периферической адренергической активностью (стимулирует α - и β -адренорецепторы)



ЦЕНТРАЛЬНЫЕ ЭФФЕКТЫ АМФЕТАМИНА:

- Стереотипное поведение
- Анарексия (фенамин влияет на пищевой центр, расположенный в гипоталамусе, что приводит к подавлению чувства голода, активизирует рвотный центр)
- Оказывает прямое стимулирующее действие на центр дыхания (в основном на фоне угнетения дыхания => аналептика)
- Эйфория, чувство уверенности, улучшение настроения
- Двигательное, речевое, сексуальное возбуждение
- Исчезает усталость, увеличивается работоспособность, увеличиваются показатели физ. мастерства, выносливость (поэтому амфетамин) используется как допинг



ПЕРЕФЕРИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ АМФЕТАМИНА:

- Сужение периферических сосудов
- Увеличение АД (стимуляция альфа-АР)
- Тахикардия (за счёт стимуляции норадреналином β -адренорецепторов сердца)
- Тормозит перистальтику ЖКТ
- Увеличение агрессии (у животных)



АМФЕТАМИН (ПРОДОЛЖЕНИЕ)

- При передозировке препарата могут возникнуть головокружение, озноб, тошнота, потеря аппетита, бессонница, тахикардия, аритмии.
- При хроническом применении возникает толерантность и зависимость.
- В дозах, вызывающих эйфорию, возможно возникновение амфетаминового психоза:
 - зрительные и слуховые галлюцинации
 - паранойя

Убирается этот эффект введением нейролептиков, т.к. необходимо снизить концентрацию дофамина. После снятия психоза развивается сонливость и депрессия.



ПРИМЕНЕНИЕ:

Раньше использовали для лечения депрессий, сейчас он запрещен.



УЖЕ НЕАКТУАЛЬНО.

Отпускается (в странах, где его применение разрешено) строго по рецепту врача.

Противопоказаниями к применению амфетамина служат:

- старческий возраст
- бессонница
- состояние возбуждения
- заболевания печени
- гипертензия
- атеросклероз
- заболевания сердечно-сосудистой системы

Назначают амфетамин внутрь взрослым по 0,005—0,01 г (5—10 мг) 1—2 раза в день.

Период полувыведения 12 часов.

Биотрансформации подвергается частично.

Выводится почками в значительной части в неизмененном виде.



МЕЗОКАРБ.

Сильный психомоторный психостимулятор, производное фенилалкилсиднонимина.

Отличия от амфетамина:

- В большей степени активизирует адренергические, а не дофаминэргические синапсы.
- Эффект развивается постепенно и более длительно
- Нет эйфории
- Нет резкого увеличения АД



ПРИМЕНЕНИЕ.

- При астенических состояниях, протекающих с заторможенностью, вялостью, апатией, снижением работоспособности, ипохондричностью, повышенной сонливостью.
- При некоторых шизофрениях с преобладанием астенических расстройств.
- Уменьшает или снимает побочные явления (миорелаксацию, сонливость), вызываемые транквилизаторами бензодиазепинового ряда (феназепамом) при этом он не уменьшает транквилизирующий эффект. Оптимальное соотношение доз феназепама и сиднокарба составляет 1:1,25 или 1:2,5.



ФАРМАКОКИНЕТИКА.

Сиднокарб хорошо всасывается при приёме внутрь.

Назначают в виде таблеток 1—2 раза в день в первой половине дня (до еды).

Поддерживающие дозы — 0,005—0,01 г в день.

Больным кататонией доза препарата может быть увеличена до 0,125—0,15 г в сутки.

Детям и лицам пожилого возраста препарат назначают в уменьшенных дозах (суточная доза 0,0025—0,005 г в 2 приёма).

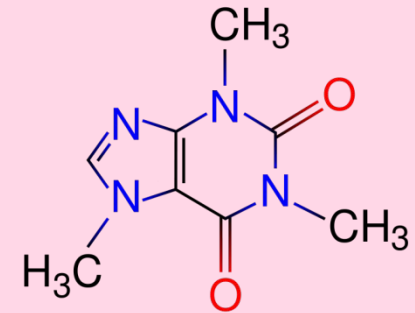


ПЕРЕДОЗИРОВКА.

- Повышенная раздражительность
- Беспокойство
- Иногда отмечается понижение аппетита



КОФЕИН.



Кофе́ин — алкалоид, содержащийся в таких растениях, как кофейное дерево, чай и некоторых других. Также производится синтетически. Содержится в различных напитках, в малых дозах оказывает стимулирующее воздействие на нервную систему.

Чашка растворимого кофе содержит 50-70 мг кофеина



ФАРМОКОЛОГИЧЕСКИЕ СВОЙСТВА.

Совмещает психостимулирующие и фармакологические свойства.

- Возбуждает, психостимулирует, при небольших дозах снижает усталость, сонливость, появляется бодрость.
- Уменьшает время психической и физической реакции.
- Действие кофеина проявляется на фоне усталости.
- В больших дозах оказывает угнетающее действие.

Не вызывает:

- эйфорию
- стереотипию
- психоз
- толерантность менее выражена



ПЕРЕФЕРИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ: ?

Сердце:

- брадикардия (через n.vagus),
- тахикардия (прямое действие на сердце)

Сосуды:

- увеличение тонуса при стимуляции сосудодвигательного центра
- уменьшение тонуса при прямом влиянии

Увеличивается диурез в результате уменьшения реабсорбции натрия

Увеличивается желудочная секреция.

Увеличивается основной обмен:

- ув-ся липолиз
- ув-ся гликогенолиз

Уменьшается тонус ГМК при прямом действии ???

Уменьшается тонус бронхов и желчевыводящих путей ???



МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ.

- Кофеин усиливает и регулирует процессы возбуждения в коре головного мозга, в следствии увеличивается двиг.акт-ть, уменьшается утомляемость, сонливость
- Мишенью кофеина явл-ся пуриновые рецепторы. Существует 2 класса пуриновых рецепторов:
 - P1 (A1, A2, A3)
 - P2 (P2x, P2y)

Мишенью для кофеина является P1 рецептор, его подтипы A1 и A2. Он явл-ся антогонистом этих рецепторов.

Пурины, связываясь с этими рецепторами, расположенными на пресинаптической мембране, оказывают модулирующий эффект на НА, уменьшая его выделение, а кофеин ингибирует P1, следовательно ув-ся выд-е НА и акт-ся адренергическая система.



ФАРМАКОКИНЕТИКА.

- Быстро всасывается в ЖКТ.
- Пик концентрации в крови через час после приема.
- Очень липофилен, хорошо проникает через ГЭБ.
- Метаболизируется в печени путем окисления и деметилирования, выводится с мочой.
- Период полувыведения 3-7 часов.
- Хорошо проникает через плацентарный барьер, не рекомендуется беременным, т.к. увеличивается риск возникновения спонтанного аборта.



ПРИМЕНЕНИЕ.

- Как мягкий стимулятор ЦНС с целью поддержания умственной работоспособности и состояния бодрости.
- В качестве вспомогательного средства при апноэ у новорожденных (как аналептик)
- При аналгезирующей терапии в сочетании с парацетамолом или аспирином.



НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА.

К ним относятся пирацетам, аминало, этирацетам и др.

Оказывают специфическое активирующее влияние на интегративные функции мозга:

- положительно влияющие на обучение,
- улучшающие память и умственную деятельность
- повышающие устойчивость организма к агрессивным воздействиям



ЭФФЕКТЫ НООТРОПНЫХ СРЕДСТВ ОБУСЛОВЛЕННЫ:

- 1) благоприятным влиянием на обменные мозга, улучшением мозгового кровотока и микроциркуляции крови в мозгу, стабилизация синтеза макроэргических фосфатов, белков.
- 2) Действием на нейромедиаторные системы головного мозга
 - пирацетам вызывает увеличение содержания в мозге дофамина и норадреналина, некоторые другие ноотропы — серотонина
 - пирацетам и меклофеноксат увеличивают содержание ацетилхолина в синаптических
 - производные пиридоксина и пирролидина улучшают церебральную холинергическую проводимость
 - глутаматергическая (мемантин и глицин воздействуют через NMDA-рецепторы).



ПИРАЦЕТАМ.

Фармокологическое действие:

- ускоряет передачу нервного импульса в мозге
- улучшает метаболический фон и микроциркуляцию, не оказывая при этом сосудорасширяющего действия
- воздействует непосредственно на мозг, улучшая его функции, как у здоровых, так и у больных людей
- не оказывает седативного и психостимулирующего действия.
- оказывает защитное действие и восстанавливает дефицит распознавания при нарушениях функций головного мозга вследствие гипоксии и интоксикации
- ингибирует агрегацию активированных тромбоцитов и восстанавливает свойства наружной мембраны эритроцитов



ФАРМАКОКИНЕТИКА.

- Принимается внутрь.
- Быстро и практически полностью абсорбируется.
- Биодоступность составляет около 100%.
- Максимальная концентрация в плазме достигается через 30 мин после приема внутрь.
- Максимальная концентрация достигается через 2 – 8 часов.



ПОКАЗАНИЯ:

- нарушения памяти
- головокружение
- изменение настроения
- нарушения поведения и стирание черт личности в пожилом возрасте, у больных болезнью Альцгеймера
- для симптоматической терапии в рамках комплексного лечения симптомов деменции, в том числе вследствие повторных нарушений мозгового кровообращения;
- дефицит функции распознавания при черепно-мозговых травмах
- лечение синдрома абстиненции и психоорганического синдрома при хроническом алкоголизме
- для коррекции обучаемости у детей

