

МИНИСТЕРСТВО ЗДРАВООХРАНЕНИЯ УКРАИНЫ  
ЗАПОРОЖСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ  
КАФЕДРА ФАРМАКОГНОЗИИ, ФАРМАКОЛОГИИ И БОТАНИКИ

# **ФАРМАКОЛОГИЯ ЦЕНТРАЛЬНОЙ НЕРВНОЙ СИСТЕМЫ**

*(Смысловой модуль 3, VI семестр)*

## **УЧЕБНО-МЕТОДИЧЕСКОЕ ПОСОБИЕ**

для студентов фармацевтического факультета  
заочной формы обучения  
(специальность «Фармация»)

Запорожье, 2015

**Рецензенты:**

зав. кафедрой фармацевтической химии, доцент, д.фарм.н. *Кучеренко Л.И.*;  
зав. кафедрой органической и биоорганической химии, д.фарм.н., профессор  
*Коваленко С.И.*

**Учебно-методическое пособие составили:**

доцент *Тржецинский С.Д.*, ст. преподаватель *Гречаная Е.В.*, ассистенты:  
*Мазулин Г.В.*, *Кулинич Р.Л.*, *Клеванова В.С.*, *Носуленко И.С.*

Под общей редакцией зав. кафедрой фармакогнозии, фармакологии и ботаники доцента, доктора биологических наук *Тржецинского С.Д.*

**Фармакология центральной нервной системы.** (Смысловой модуль 3, VI семестр) : учеб.-метод. пособие для студентов фармац. факультета заочной форм обучения (специальность «Фармация») / сост. С. Д. Тржецинский, Е. В. Гречаная, Г. В. Мазулин [и др.]. – Запорожье : [ЗГМУ], 2015. – 86 с.

*Рекомендовано в качестве учебно-методического пособия для студентов  
заочной формы обучения*

## Введение

Учебно-методическое пособие предлагается в качестве дополнительного источника информации при изучении курса фармакологии для студентов фармацевтического факультета заочной формы обучения.

Издание содержит раздел фармакологии, изучающий лекарственные средства, влияющие на центральную нервную систему, которые, как правило, вызывают наибольшее затруднение у студентов при изучении курса фармакологии.

В учебном пособии приведены краткие сведения о лекарственных препаратах по изучаемому разделу курса, а также тестовые задания с обоснованием правильных ответов. Тестовые задания, выбранные из базы лицензионного экзамена КРОК-1, приурочены к отдельным темам поданного к изучению материала. Часть учебного материала представлена в виде схем и таблиц.

## ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, действующие на ЦНС.

Лекарственные средства, действующие на ЦНС – делят на две группы:

1. Вещества, **угнетающие** функции ЦНС. К данной группе лекарственных средств относятся:

- средства для наркоза;
- снотворные,
- противосудорожные средства,
- наркотические анальгетики,
- психотропные вещества (нейролептики, транквилизаторы, седативные средства);

2. Вещества, **возбуждающие** функции ЦНС

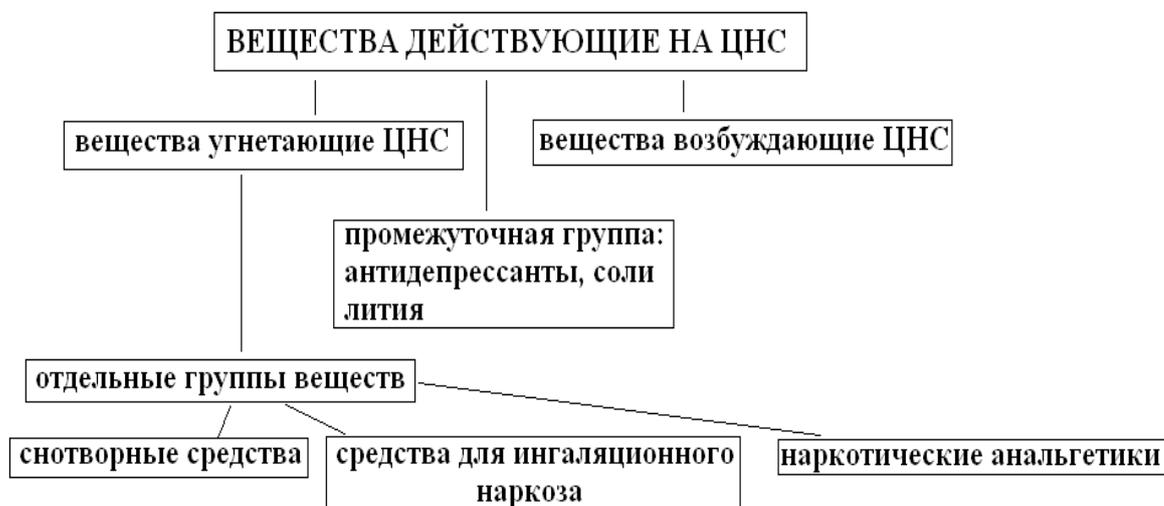
- аналептики
- психостимуляторы

Отдельная группа, средств действующих на ЦНС (занимающих промежуточное положение) – группа **антидепрессантов и соли лития**.

В свою очередь каждая из этих групп **делится на подгруппы**.

ЦНС регулирует деятельность всего организма, поэтому средства, влияющие на ЦНС также являются средствами – **общего** (резорбтивного) действия, оказывающие фармакологическое действие на весь организм в целом.

### Структура и особенности действия веществ действующих на ЦНС



### НАРКОТИЧЕСКИЕ АНАЛЬГЕТИКИ

**Понятие о ноцицептивной системе.** Механические, тепловые и химические виды воздействия на организм распознаются чувствительными (сенсорными) нервными волокнами, которые получили название **ноцицепторов**. Концентрация ноцицепторов на всех участках тела человека различна. Большинство их находится на кожной поверхности и в меньшей степени встречаются в глуболежащих тканях. Все ноцицепторы – **свободные нервные окончания**, которые состоят из конечных разветвлений осевого цилиндра чувствительного нейрона. Передача нервного (болевого) импульса осуществляется в ноцицептивной системе при помощи **специальных нейромедиаторов**: энкефалинов, эндорфинов (глутамат).

Ноцицептивная система является восходящей, обеспечивая проведение болевого импульса от периферических (ноцицептивных) рецепторов до коры головного мозга.

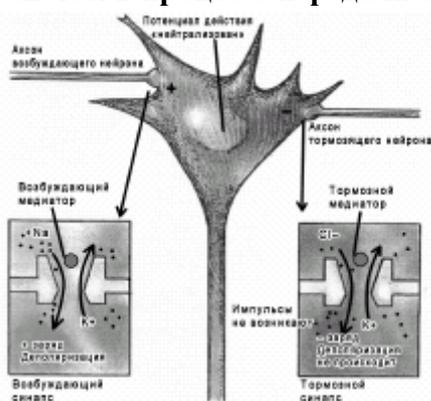
Ноцицепторы передают сигналы через сенсорные нейроны в спинной и головной мозг. В нейронах имеются так называемые опиоидные рецепторы, в которых высвобождается глутамат, главный нейромедиатор, который пересылает сигнал от одного нейрона к другому. Сигналы поступают в ретикулярную формацию и таламус. При этом ощущение боли возникает в сознании в тупой, плохо локализованной форме. Из таламуса сигнал поступает в соматосенсорную кору головного мозга, где болевое ощущение локализуется более отчетливо. Ноцицепция вызывает также менее определенные автоматические реакции, не зависящие от сознания, такие как: бледность, потоотделение, брадикардию, гипотонию, головокружение, тошноту и обморок.

### Схема действия ноцицептивной системы



Итоговое восприятие боли зависит от активности **антиноцицептивной системы**. Антиноцицептивная система (АНС) – противоположная по действию ноцицептивной, предназначена для контроля болевого синдрома и подавления болевых ощущений. Антиноцицептивная система является нисходящей, итоговое восприятие боли во многом зависит от ее активности, основную роль при этом играет АНС головного мозга. Антиноцицептивная система работает не изолированно, а взаимодействуя между собой и другими системами, регулируют не только болевую чувствительность, но и сопряженные с болью вегетативные, моторные, нейроэндокринные, эмоциональные и поведенческие проявления боли. В зависимости от активности АНС, боль может усиливаться или уменьшаться.

### Схематическое изображение механизма действия ноцицептивной и антиноцицептивной систем в процессе передачи болевого импульса.



Противоположные по действию возбуждающий (слева) и тормозной (справа) медиаторы, влияют на разные ионные каналы и приводят к нейтрализации потенциала действия

Механизм действия многих анальгетиков направлен на подавление передачи болевого импульса в ноцицептивной системе и (или) усиление действия антиноцицептивной системы (в случае ее недостаточности или чрезмерной боли) с помощью анальгетиков.

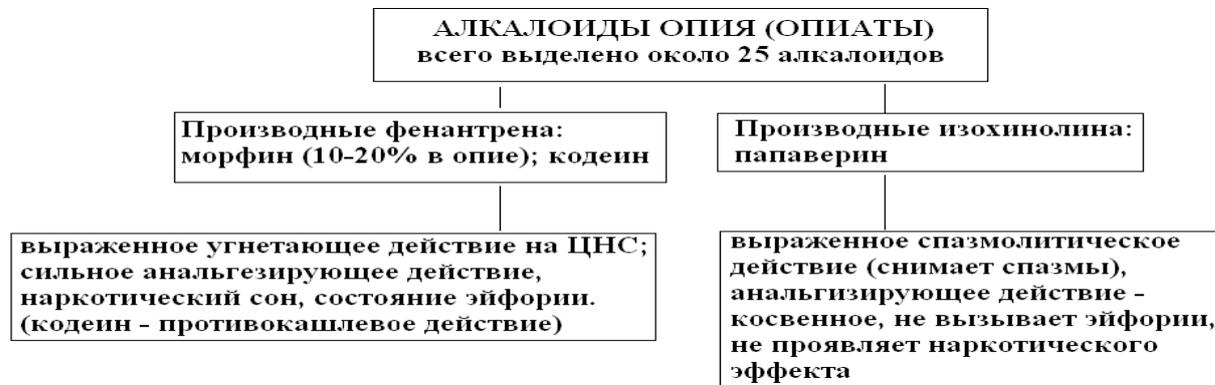
Так, механизм болеутоляющего действия алкалоидов опия (морфина) основан на блокаде опиоидных рецепторов (прерывание болевого импульса) и активации эндогенной антиноцицептивной системы, повышении порога болевой чувствительности в коре больших полушарий, угнетении болевой передачи на различных уровнях ЦНС, ретикулярной формации и спинного мозга.

**К наркотическим анальгетикам** относят алкалоиды опия, и ряд полусинтетических и синтетических веществ, обладающих сходным с морфином анальгезирующим действием.

Опий – продукт растительного происхождения, представляет собой высушенный млечный сок незрелых коробочек снотворного мака (*Papaver somniferum*). В опиуме установлено свыше 25 алкалоидов, большинство из которых не обладают наркотической или анальгетической активностью. Основным из алкалоидов опия является морфин (выделен из опия в 1806 г). Морфин был синтезирован в 1953 году, но его синтез оказался экономически невыгоден, поэтому для нужд медицины морфин по-прежнему получают из опия. В опиуме содержится от 10 до 20% морфина.

По химическому строению – алкалоиды опия представляют собой производные фенатрена (морфин, кодеин) и изохинолина (папаверин).

#### Структура и особенности действия наркотических анальгетиков



Производные фенантрена – оказывают сильное влияние на ЦНС, проявляют наркотическую активность. Производные изохинолина вызывают расслабление гладкой мускулатуры и наркотическими свойствами не обладают.

Анальгетическими свойствами обладают алкалоиды фенантренового ряда, наиболее фармакологически активным из которых является морфин. Уступающий ему по силе действия кодеин является слабым анальгетиком и применяется в качестве противокашлевого средства центрального действия (действует непосредственно на кашлевой центр в головном мозге).

Производное изохинолина – папаверин обладает спазмолитической активностью.

**Морфин** – основной алкалоид опия, действует на ЦНС, угнетает болевые импульсы на уровне спинного и головного мозга, подавляет чувство страха и ожидание боли.

Механизм обезболивающего действия морфина обусловлен его взаимодействием с опиоидными рецепторами, при которой происходит активация эндогенной

антиноцицептивной системы и угнетается передача болевых импульсов на различных уровнях ЦНС, прежде всего - нарушение проводимости болевого импульса в коре больших полушарий головного мозга, на уровне таламуса. Это объясняет большую эффективность морфина при болях, вызванных постоянным потоком допороговых болевых импульсов (спастическое сокращение мышц, сдавливание тканей опухолью и пр.).

Морфин угнетает проведение болевых импульсов также на уровне ретикулярной формации и спинного мозга.

Прием морфина сопровождается состоянием сонливой эйфории, при котором человек находится в состоянии наркотического сна, сопровождающегося яркими галлюцинациями, состоянии безмятежного благополучия. Приятное для человека состояние эйфории вызывает желание употребить это средство вновь, что в конечном итоге приводит к болезненному пристрастию и наркотической зависимости.

Морфин угнетает прочие центры головного мозга – в частности дыхательный и кашлевой центры, что наиболее ярко проявляется при отравлении морфином. При этом дыхание становится прерывистым (дыхание Чейна-Стокса), наблюдаются спутанность сознания с последующей его потерей, гипотония, понижение температуры тела. Смерть наступает от паралича дыхательного центра.

Помощь – промывание желудка (0,02% раствором перманганата калия), введение средств, возбуждающих дыхательный центр и антагониста – **«наллоксона»**.

Морфин раздражает рвотный центр (часто сопровождается тошнотой и рвотой). Характерным признаком употребления морфина является сужение зрачков после приема и расширенные зрачки при наркотическом голоде у больных со сформировавшейся зависимостью.

Действие морфина на центр блуждающих нервов – вызывает брадикардию и спастические явления со стороны внутренних органов, повышает тонус сфинктеров желудочно-кишечного тракта (запоры), мочевого пузыря, усиливает сокращения мускулатуры матки, бронхов, желче- и мочевыводящих путей.

- **Отравление морфином: резко суженные зрачки, спутанность сознания с последующей потерей, угнетение дыхания, гипотония, понижение температуры тела. Смерть наступает от остановки дыхания.**
- **Помощь: промывание желудка 0,02 % раствором перманганата калия (окисляет морфин), назначение средств – стимуляторов дыхания и возбудимости дыхательного центра. Антагонисты: наллоксон или налорфин.**

Действие морфина после подкожного введения наступает через 10 -15 минут и продолжается 4 – 5 часов.

Показания для применения морфина – сильные боли, не купируемые другими анальгетиками (ожоги, инфаркт, злокачественные новообразования, почечные и печеночные колики, вызываемые спазмами), шоковые состояния.

Основным недостатком морфина является его способность вызывать болезненное пристрастие (зависимость). Для устранения этого недостатка – были синтезированы

различные вещества, на основе структуры морфина - синтетические и полусинтетические заменители – промедол, фентанил, эстоцин и др.

**Промедол** – сходен с морфином по механизму действию на ЦНС. Препарат – слабее морфина, также угнетает дыхательный центр, но в меньшей степени возбуждает центры блуждающих нервов.

Оказывает умеренное спазмолитическое действие, рекомендуется как обезболивающее и усиливающее родовую деятельность.

**Фентанил** – в 100-150 раз превосходит морфин и промедол по анальгетической активности. При внутривенном введении действие проявляется через 2-3 мин и продолжается 15-30 минут. Применяется для нейролептанальгезии с дроперидолом; в качестве обезболивающего и противошокового (при болевом шоке) при тяжелых приступах стенокардии, инфаркте миокарда и некоторых хирургических операциях.

В настоящее время применяют – средства **агонисты опиоидных рецепторов (пентазоцин, буторфанол, бупренорфин, трамадол).**

Пентазоцин – получен путем модификации молекулы морфина.

Антагонистами синтетических заместителей морфина является **налорфин и налоксон**, которые применяются при отравлениях мофином.

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов.**

**Морфина гидрохлорид** - активный анальгетик (обезболивающее средство) - подавляет все виды болевой чувствительности без исключения сознания и изменения других видов чувствительности. Применяют при болях различной этиологии (травмы, злокачественные новообразования, ишемическая болезнь сердца и др.) внутрь по 0,01-0,02 г, подкожно по 1 мл 1% раствора; детям (старше 2 лет) дозы устанавливают соответственно возрасту.

Побочные действия: тошнота, рвота, запоры, угнетение дыхания. Для уменьшения побочных явлений одновременно назначают холинолитические средства (атропин и др.).

Противопоказания: дыхательная недостаточность, старческий возраст, общее истощение; при длительном применении возможно развитие наркомании.

Форма выпуска: таблетки по 0,01 г; ампулы по 1 мл 1% раствора.

**Кодеина фосфат** - по характеру действия аналогичен кодеину, однако, по сравнению с ним менее токсичен. Применяют как противокашлевое средство не только взрослым, но и детям, начиная с 6 месяцев: детям старше 6 месяцев по 0,002-0,01 г на прием в зависимости от возраста. Взрослым 0,01-0,02 г.

Побочные действия: запоры; длительное применение вызывает привыкание (ослабление или отсутствие эффекта при повторном применении) и пристрастие (лекарственную зависимость - “кодеинизм”).

Форма выпуска: порошок.

**Промедол** - эффективный анальгетик. По влиянию на центральную нервную систему близок к морфину. Применяют при травмах, заболеваниях, сопровождающихся болевыми ощущениями; в пред- и послеоперационном периоде; стенокардии, инфаркте миокарда, злокачественных новообразованиях и др.; для обезболивания родов. Применяют внутрь по 0,025 г, под кожу 1-2 мл 1% или 2% раствора, внутривенно 1 мл 1% раствора; детям (старше 2 лет) по 0,003-0,01 г на прием в зависимости от возраста.

Побочные действия: тошнота, рвота, запоры, угнетение дыхания. Для уменьшения побочных явлений одновременно назначают холинолитические средства (атропин и др.).

Форма выпуска: таблетки по 0,025 г; ампулы по 1 мл 1% раствора и 2% раствора.

**Налоксон** - опиатный антагонист, лишенный морфиноподобной активности. Действует по типу конкурентного антагонизма, блокируя связывание агонистов или вытесняя их из опиатных рецепторов. Применяют налоксон в/в, в/м в дозе 0,4-0,8 мг, главным образом при острой интоксикации наркотическими анальгетиками. Для диагностики наркомании вводят 0,5 мг налоксона. Он эффективен также при алкогольной коме (тяжелом отравлении алкоголем) и различных видах шока.

Побочные действия: введение налоксона страдающим наркоманией вызывает характерный приступ абстиненции.

Форма выпуска: ампулы по 1 мл с 0,4 мг налоксона гидрохлорида. Выпускается также специальная лекарственная форма для применения у новорожденных - Narcan neonatal - с 0,02 мг налоксона в 1 мл раствора.

**Бупренорфин** - анальгетик центрального действия. Механизм связан с высоким сродством препарата к опиоидным рецепторам. Не угнетает дыхательный центр. В проведенных испытаниях при длительном применении препарата не установлено развития привыкания и лекарственной зависимости. Применяют при болевых синдромах слабой и средней интенсивности различного происхождения. Вводят внутримышечно или внутривенно медленно по 0,3 мг (1 мл раствора для инъекций) каждые 6-8 ч, при необходимости однократную дозу можно увеличить. Внутрь принимают по 1-2 таблетки под язык каждые 6-8 ч или по мере необходимости.

Побочные действия: сонливость, тошнота, рвота, угнетение дыхания

Форма выпуска: таблетки подъязычные по 0,0002 г (0,2 мг); раствор для инъекций в ампулах по 1 и 2 мл (1 мл содержит 0,00003 г (0,3 мг) бупренорфина).

**Пентазоцин** – анальгетик с высокой обезболивающей активностью. Применяют при болях различной этиологии (травматические, при злокачественных новообразованиях, ишемической болезни сердца и др.). При острых болях препарат вводят парентерально (под кожу, внутримышечно, внутривенно), при хронических болях - внутрь. Доза для взрослых под кожу, внутримышечно или внутривенно составляет обычно 0,03 г (30 мг), а при сильных болях - 0,045 г (45 мг). Внутривенно вводят медленно.

Форма выпуска: таблетки по 0,05 г (50 мг); в ампулах по 1 мл, с 0,03 г (30 мг) пентазоцина в виде лактата.

**Оmnopон** - активный анальгетик, подавляющий все виды болевой чувствительности без выключения сознания и изменения других видов чувствительности. Применяют при болях различной этиологии (травматические, при злокачественных новообразованиях, ишемической болезни сердца и др.). Назначают внутрь по 0,01-0,02 г, подкожно - по 1 мл 1% или 2% раствора. Детям (старше 2 лет) в зависимости от возраста по 0,001-0,0075 г на прием.

Побочные действия: тошнота, рвота, запоры, угнетение дыхания. Для уменьшения побочных явлений одновременно назначают холинолитические средства (атропин и др.).

Форма выпуска: порошок; 1% и 2% раствор в ампулах по 1 мл.

**Этилморфина гидрохлорид** - аналогичен кодеину; при введении в конъюнктивальный мешок способствует купированию болей и рассасыванию экссудатов (богатой белком жидкости, вышедшей из мелких сосудов в ткани) и инфильтратов (уплотнений) при воспалительных заболеваниях тканей глаза. Применяют как противокашлевое средство при бронхитах, бронхопневмонии (сочетанном воспалении бронхов и легких), плеврите (воспалении оболочек легкого) и др.; в офтальмологии при различных заболеваниях глаз (паренхиматозный кератит, инфильтрат роговой оболочки, ирит, иридоциклит, травматическая катаракта, помутнение стекловидного тела) внутрь взрослым по 0,01-0,03 г на прием; в офтальмологии применяют 1-2% раствор и мази.

Форма выпуска: порошок; таблетки по 0,015 г.

**Фентанил** - синтетический анальгетик с быстрым и кратковременным действием. Применяют для нейролептанальгезии (метод обезболивания, основанный на сочетанном применении нейролептических средств и наркотических анальгетиков) при хирургических исследованиях, шоке, болевом синдроме различной этиологии внутримышечно для премедикации (подготовки к наркозу или местной анестезии) 0,05-0,1 мг вместе с дроперидолом; при вводимом наркозе внутривенно 1 мл 0,005% раствора на 5 кг массы тела; для поддержания анальгезии - при необходимости - 0,05-0,1 мг через 20-30 мин.

Форма выпуска: ампулы по 2 и 5 мл 0,005% раствора.

**Трамадол** - сильный анальгетик с быстрым и длительным эффектом. Уступает, однако, по активности морфину при одинаковых дозах (применяется, соответственно, в больших дозах). Применяют при сильных острых и хронических болях: в послеоперационном периоде, при травмах, у онкологических больных и др., а также перед операциями. Взрослым и детям старше 14 лет вводят внутривенно (медленно капельно) по 50-100 мг (1-2 ампулы), до 400 мг (0,4 г) в сутки. В такой же дозе вводят внутримышечно или подкожно. Внутрь назначают (с небольшим количеством жидкости) в капсулах по 50 мг - до 8 капсул (0,4 г) в сутки или в виде капель - по 20 капель (содержат 50 мг трамадола) на прием в небольшом количестве воды до 8 раз в сутки. При легких болях применять препарат не рекомендуется.

Форма выпуска: капсулы с 0,05 г (50 мг); капли (в 1 мл 100 мг); ампулы емкостью 1 мл с 50 мг (0,05 г) в 1 мл и емкостью 2 мл с 50 мг в 1 мл; ректальные свечи с 100 мг (0,1 г).

**Налорфин** - анальгетик, значительно слабее морфина. Налорфин уменьшает также анальгезирующее действие морфина и других наркотических анальгетиков и их влияние на тонус гладкой мускулатуры. Первоначально, до появления "чистого" антагониста морфина - налоксона, налорфин использовали в качестве антидота при резком угнетении дыхания и других нарушениях функций организма, вызванных острым отравлением при передозировке морфина, промедола, фентанила или других наркотических анальгетиков. Применяют как антидот лекарственных средств группы опия. В случае применения налорфина в качестве антидота опиатов, его вводят внутривенно, внутримышечно или подкожно. Более эффективно внутривенное введение. Взрослым назначают по 0,005-0,01 г (1-2 мл 0,5% раствора). При недостаточном эффекте инъекции повторяют с промежутками в 10-15 мин.

Форма выпуска: 0,5% раствор в ампулах по 1 мл (для взрослых) и 0,05% раствор в ампулах по 0,5 мл (для новорожденных).

**Налбуфин** – наркотический анальгетик, представитель группы агонистов-антагонистов опиоидных рецепторов применяют для терапии пациентов с выраженным болевым синдромом, в том числе при послеоперационной боли и во время родов. Налбуфин также может применяться как дополнительное средство во время проведения анестезии. Налбуфин предназначен для парентерального применения - вводят внутривенно и внутримышечно. Доза препарата рассчитывается индивидуально. Взрослым, как правило, назначают по 0,15-0,3 мг/кг массы тела пациента. Интервал между введением разовой дозы должен составлять не менее 4 часов.

Форма выпуска: налбуфин 10 мг и 20 мг в стеклянных ампулах по 1 мл.

**Таламонал** - комбинированный препарат, действие которого обусловлено свойствами входящих в него компонентов. Сочетает в себе нейролептический эффект (тормозящее действие на центральную нервную систему) дроперидола и анальгетический эффект фентанила. Применяют для премедикации и проведения нейролептанальгезии при хирургических вмешательствах, послеоперационном обезболивании; при диагностических исследованиях, купировании отека легких и болевого синдрома при стенокардии и инфаркте миокарда, лечении шока. Вводят для премедикации за 30-40 мин до операции внутримышечно 1-3 мл, для анестезии внутривенно (капельно) 10 мл в 100-150 мл 5% раствора глюкозы, в других случаях - фракционно внутримышечно или внутривенно по 1-5 мл.

Форма выпуска: флаконы по 10 мл (1 мл - 2,5 мг дроперидола и 0,05 мг фентанила).

## **ФАРМАКОЛОГИЧЕСКАЯ КОРРЕКЦИЯ ВОСПАЛЕНИЯ.**

### **НЕНАРКОТИЧЕСКИЕ АНАЛЬГЕТИКИ**

Одним из наиболее существенных факторов, способствующих развитию воспалительного процесса, является биосинтез простагландинов в тканях. Простагландины – биологически активные вещества липидной природы - вырабатываются во всех тканях организма, вызывая повышенную чувствительность ноцицептивной системы к различного рода воздействиям (химическим, механическим). Угнетение синтеза простагландинов и других медиаторов воспаления (брадикинина, серотонина, гистамина) лежит в основе механизма действия многих лекарственных препаратов из группы ненаркотических анальгетиков.

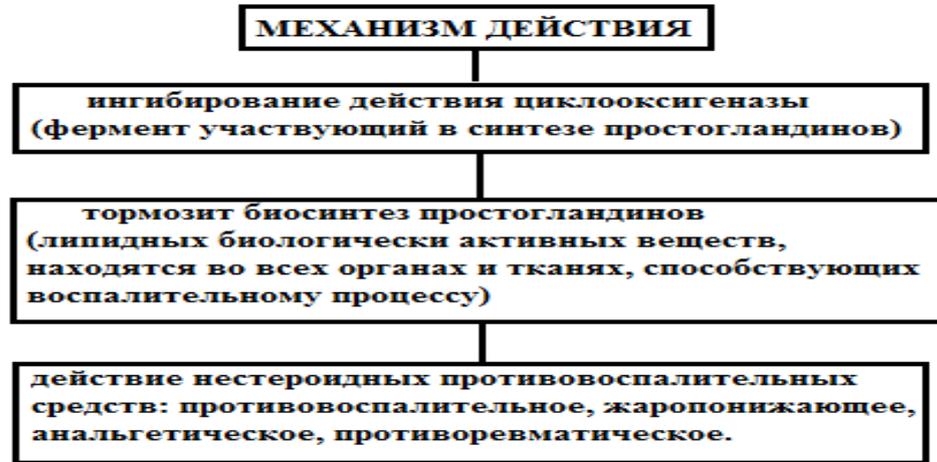
Противовоспалительной активностью обладают также некоторые другие группы лекарственных препаратов, для которых противовоспалительное действие является благоприятным сопутствующим фактором, например: вяжущие, обволакивающие, антацидные, адсорбирующие и пр. Однако данные вещества не оказывают прямого воздействия на синтез простагландинов.

По химической природе противовоспалительные средства делят на: **стероидные** (соединения гормонального происхождения с противовоспалительной активностью) и **нестероидной природы**.

По механизму противовоспалительного действия, большинство нестероидных противовоспалительных средств оказывает непосредственное влияние на биосинтез простагландинов в тканях организма - путем **ингибирования фермента** –

**циклооксигеназы (ЦОГ)**, которая в свою очередь является необходимым компонентом в синтезе простагландинов. Ингибирование ЦОГ приводит к торможению биосинтеза простагландинов в целом.

#### Схема механизма действия противовоспалительных средств



Наряду с противовоспалительным, большинство лекарственных препаратов этой группы оказывает также анальгетическое, жаропонижающее и противоревматическое действия.

Так, уменьшение синтеза простагландинов и медиаторов воспаления ведет к ослаблению воспалительного процесса, и способствует снижению болевых ощущений в месте воспаления. Поэтому у большинства лекарственных препаратов этой группы ярко выражен именно **анальгетический** эффект, а средства эффективны при болях воспалительного происхождения.

Многие из препаратов этой группы оказывают **противоревматическое** действие. Ревматизм – заболевание соединительных тканей организма, сопровождающееся воспалением, которое в значительной степени связано с аллергической реакцией организма на источник ревматического воспаления. Наиболее часто встречается ревматизм суставов и сердца, признаками ревматизма являются опухание и сильные боли в суставах, повышенная температура тела, нарушения сердечной деятельности и пр. Противоревматическое действие препаратов этой группы связано с уменьшением воспалительного процесса в тканях.

**Жаропонижающее** действие нестероидных противовоспалительных средств связано с их способностью воздействовать на пирогенные вещества и центр терморегуляции организма. У здорового человека поддерживается постоянный баланс между образованием тепла в организме (теплопродукцией) и его отдачей.

Выработка тепла в организме происходит за счет окислительных процессов (окисления углеводов, жиров и частично - белков) и происходит в основном в печени. Теплоотдача осуществляется через кожу путем излучения в окружающую среду. Непосредственно выработка и отдача тепла регулируется в организме центром терморегуляции, который тесно связан с вегетативной нервной системой и железами внутренней секреции, также участвующими в процессе терморегуляции.

У больного человека нарушается этот процесс при действии так называемых пирогенных веществ (высокомолекулярных веществ белковой природы, которые представляют собой продукты жизнедеятельности инородных микроорганизмов, а также поврежденные ткани организма и пр.). Повышение содержания пирогенных веществ в

крови ведет к возбуждению центра терморегуляции, вследствие чего теплоотдача уменьшается и температура тела повышается. Установлено, что под действием пирогенных веществ увеличивается концентрация простагландинов в спинномозговой жидкости и непосредственно в воспаленной ткани, что ведет к раздражению болевых рецепторов, повышению проницаемости капилляров и повреждениям пораженной ткани.

Под действием противовоспалительных средств, вследствие уменьшения синтеза простагландинов и медиаторов воспаления (брадикинина, серотонина, гистамина), возбудимость центра терморегуляции снижается, увеличивается теплоотдача, вследствие расширения пор и обильного потоотделения. Характерным признаком механизма действия этих препаратов является их способность стабилизировать клеточные мембраны, что также способствует снижению процесса воспаления. Но при этом, нестероидные противовоспалительные препараты не влияют на причину заболевания, после окончания их действия температура повышается вновь.

### Структура противовоспалительных средств нестероидной природы



К производным салициловой кислоты относятся такие препараты как, сама салициловая кислота, натрия салицилат, ацетилсалициловая кислота (аспирин). Салициловая кислота обладают выраженным раздражающим действием, особенно на слизистые оболочки, поэтому применяется исключительно местно в виде мазей и присыпок – для лечения кожных заболеваний, устранения мозолей, бородавок.

Производные салициловой кислоты, такие как натрия салицилат и ацетилсалициловая кислота обладают меньшим раздражающим действием, вследствие чего могут приниматься внутрь. Салицилаты применяются для лечения различных форм ревматизма, при воспалении суставов, мышц, головной боли. Как средства для лечения ревматизма, салицилаты обладают недостаточной противовоспалительной активностью, в связи с чем применяются в больших дозах, что может привести к нежелательным побочным эффектам. Поскольку салицилаты способны вызывать раздражение слизистой (ЖКТ) назначаются препараты этой группы после еды, рекомендуется запивать молоком и не применять при язвенной болезни ЖКТ.

Жаропонижающее действие салицилатов более выражено. Снижение температуры тела происходит за счет повышенной теплоотдачи и потоотделения.

**Производные пиразолона** (бутадион, анальгин) обладают выраженным противовоспалительным, анальгезирующим, жаропонижающим действием, назначаются при остром суставном ревматизме, артритах. Среди препаратов этой группы наибольшей противовоспалительной активностью обладает бутадион, однако вследствие большого количества побочных явлений (раздражающе действует на слизистую ЖКТ, а также на процессы кроветворения и свертывания крови) в настоящее время применяется только местно (в виде мазей).

К **производным индолуксусной кислоты** относится индометацин, который считается одним из наиболее эффективных противовоспалительных и противоревматических средств. Вместе с тем, при применении индометацина может проявиться ряд крайне негативных побочных эффектов. Так, при длительном лечении этим препаратом могут развиваться язвенные болезни желудка и кишечника. Индометацин может оказать негативное воздействие на центральную нервную систему, вплоть до развития психических расстройств.

**Производным фенилуксусной кислоты** является такой лекарственный препарат как диклофенак натрия (вольтарен). Как и прочие препараты, относящиеся к группе нестероидных противовоспалительных средств, диклофенак натрия обладает противовоспалительным, анальгетическим и жаропонижающим действием. Деклофенак Препарат является достаточно эффективным противовоспалительным и противоревматическим средством.

К **производным нафтилпропионовой кислоты** относится - напроксен. Уступая по силе противовоспалительного действия диклофенаку натрия, превосходит последний по анальгезирующей активности и большей продолжительностью действия.

**Производным фенилпропионовой кислоты** является ибупрофен, который по противовоспалительной активности близок к индометацину.

К **производным антраниловой кислоты** относится такой лекарственный препарат как мекенаминовая кислота, которая по противовоспалительной активности близка к салициловой кислоте.

#### Сравнительная характеристика ненаркотических анальгетиков

Препарат	Характер действия		
	противоревматическое	анальгезирующее	жаропонижающее
Натрия салицилат	+++	+	+++
Кислота ацетилсалициловая	++	+++	++++
Анальгин	++	++++	+++
Бутадион	++++	+++	+++
Фенацетин	+	++	+++
Индометацин	++++	+++	+++

Среди перечисленных лекарственных препаратов, относящихся к различным группам нестероидных противовоспалительных средств противоревматические, анальгезирующие и жаропонижающие свойства выражены неодинаково. Так, производное салициловой кислоты – кислота ацетилсалициловая обладает в большей

степени жаропонижающим действием, индометацин – противоревматическим, анальгин – анальгезирующим.

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов.**

**Кислота ацетилсалициловая** - оказывает противовоспалительное, жаропонижающее и болеутоляющее действие и имеет широкое применение в качестве противовоспалительного, жаропонижающего и анальгезирующего средства. Важной особенностью ацетилсалициловой кислоты является способность препарата оказывать антиагрегационное действие, ингибировать спонтанную и индуцированную агрегацию тромбоцитов. Применяют в виде таблеток внутрь после еды. Обычные дозы для взрослых как болеутоляющего и жаропонижающего средства (при лихорадочных заболеваниях, головной боли, мигрени, невралгиях и др.) 0,25-0,5-1 г 3-4 раза в день; для детей в зависимости от возраста - от 0,1 до 0,3 г на прием. Препарат применяют в конце приема пищи или сразу после еды. Непосредственно перед применением таблетку необходимо растворить в 1/2 стакана воды.

Побочные действия: при применении препарата может развиваться профузное (обильное) потоотделение, могут появиться шум в ушах и ослабление слуха, ангионевротический (аллергический) отек, кожные и другие аллергические реакции.

Противопоказания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки и желудочно-кишечные кровотечения являются противопоказаниями к применению ацетилсалициловой кислоты и натрия салицилата.

Форма выпуска: таблетки по 0,25 и 0,5 г (для взрослых) и по 0,1 г (с риской) - для детей; “шипучие” таблетки по 0,5 г.

**Анальгин** – препарат с выраженными анальгезирующим, противовоспалительным и жаропонижающим свойствами. Хорошая растворимость дает возможность широко использовать анальгин для парентерального введения. Применяют анальгин при болях различного происхождения (головная боль, невралгия - боль, распространяющаяся по ходу нерва, радикулиты, миозиты - воспаление мышц), лихорадочных состояниях, гриппе, ревматизме. Назначают анальгин внутрь, внутримышечно или внутривенно. Внутрь принимают после еды. Доза для взрослых - по 0,25-0,5 г 2-3 раза в день; при ревматизме - до 1 г 3 раза в день. Детям внутрь - по 5-10 мг/кг 3-4 раза в сутки. Внутримышечно или внутривенно (при сильных болях) вводят взрослым по 1-2 мл 50% или 25% раствора 2-3 раза в день; не более 2 г в сутки.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,5 г; 25% и 50% растворы в ампулах по 1 и 2 мл.

**Целекоксиб** - преимущественно подавляет активность ЦОГ-2 и минимально - ЦОГ-1. Применяют в качестве симптоматической терапии при: артритах (ревматоидном артрите, остеоартрите), спондилите, альгодисменорее, острой боли. Рекомендуются прием препарата в дозе 200 мг дважды в сутки. Учитывая, что осложнения со стороны сердечно-сосудистой системы зависят от дозы препарата, следует применять препарат в минимально эффективных дозировках, курсами небольшой длительности. При остеоартрите и ревматоидном артрите рекомендуется суточная доза 200 мг, возможен прием, как 200 мг один раз в сутки, так и по 100 мг дважды в сутки. При необходимости, дозу можно повысить до 800 мг в сутки (по 400 мг дважды в сутки), без увеличения риска развития побочных эффектов.

Форма выпуска: Капсулы 100 мг и 200 мг.

**Диклофенак натрия (ортофен)** - нестероидный противовоспалительный препарат - оказывает противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие, обусловленное угнетением продукции простагландинов. Применяют при ревматоидном артрите (инфекционно-аллергическая болезнь из группы коллагенозов, характеризующаяся хроническим прогрессирующим воспалением суставов), острым ревматизме, остеоартрозе, артрозах, спондилоартрозе и др. воспалительных и дегенеративных заболеваниях суставов. Дозы устанавливают индивидуально с учетом тяжести течения заболевания. Обычно взрослым назначают препарат в разовой дозе 25-50 мг внутрь 2-3 раза в сутки. Таблетки (драже) ретард (длительного действия) назначают обычно 1 раз в сутки в разовой дозе 100 мг. Ректальные свечи назначают обычно на ночь (по 1 свече в сутки). Лечение таблетками ретард или свечами можно при необходимости сочетать с назначением внутрь 50 мг ортофена в таблетках обычной продолжительности действия. Для лечения острых состояний или купирования обострения хронического процесса вводят 75 мг препарата в виде однократной внутримышечной инъекции.

Форма выпуска: таблетки, покрытые кишечнорастворимой пленкой по 0,025 г; 2,5% раствор в ампулах по 3 мл и 5 мл.; таблетки по 0,05 г.; таблетки-ретард по 0,025; 0,05 и 0,1 г.; драже по 0,025 г.; свечи ректальные по 0,05 и 0,1 г.; гель, крем, эмульгель (1 г - 0,01 г ортофена) в тубах.

**Напроксен** - производное пропионовой кислоты - оказывает выраженное противовоспалительное, анальгезирующее и жаропонижающее действие. Механизм действия препарата заключается в торможении миграции лейкоцитов, снижении активности лизосом и медиаторов воспаления. Напроксен тормозит активность циклооксигеназы арахидоновой кислоты, что приводит к угнетению синтеза промежуточных продуктов простагландинов, тормозит агрегацию тромбоцитов. Применяют при воспалительных и дегенеративных заболеваниях опорно-двигательного аппарата: ревматоидный, подагрический артрит, анкилозирующий спондилоартрит (болезнь Бехтерева), остеоартроз; инфекционно-воспалительные заболевания ЛОР органов с выраженным болевым синдромом (в составе комплексной терапии): фарингит, тонзиллит, отит. Лихорадочный синдром при "простудных" и инфекционных заболеваниях. Принимают внутрь целиком, запивая жидкостью или во время еды. В острой стадии заболевания - по 0,5-0,75 г 2 раза в сутки. Для поддерживающей терапии - в средней суточной дозе 500 мг за 2 приема. При необходимости применения напроксена в высоких дозах можно сочетать назначение в свечах и в таблетках.

Форма выпуска: таблетки, суспензия для перорального применения, свечи ректальные.

**Индометацин** - один из наиболее активных нестероидных противовоспалительных препаратов. Сильный ингибитор биосинтеза простагландинов. Индометацин эффективен при ревматоидном артрите, периартритах (воспалении тканей, окружающих сустав), анкилозирующем спондилите, остеоартрозах, подагре, воспалительных заболеваниях соединительной ткани, костномышечной системы, тромбозах и других заболеваниях, сопровождающихся воспалением. Принимают индометацин внутрь после еды, начиная обычно с 0,025 г (25 мг) 2-3 раза в день (взрослые), затем в зависимости от переносимости, увеличивают суточную дозу до 100-150 мг в сутки (в 3-4 приема). Как и

другие противовоспалительные препараты, индометацин назначают обычно длительно, преждевременное прекращение приема препарата может привести к возобновлению болезненных явлений. Для лечения острых состояний или купирования обострения хронического процесса вводят внутримышечно по 60 мг индометацина 1-2 раза в сутки. Продолжительность внутримышечного введения препарата - 7-14 дней.

Форма выпуска: драже и капсулы по 0,025 г (25 мг); свечи ректальные по 0,05 и 0,1 г.; раствор для инъекций в ампулах (1 мл - 0,03 г).

**Парацетамол** - жаропонижающее, анальгезирующее и умеренно противовоспалительное средство. Угнетает возбудимость центра терморегуляции, ингибирует синтез простагландинов. Жаропонижающий эффект наступает через 1,5-2 часа. Парацетамол показан для симптоматического лечения болевого синдрома различного происхождения легкой и средней интенсивности: головная боль, зубная боль, альгодисменорея, миалгия, невралгия, боль в спине. Применяют таблетки для взрослых по 0,35-0,5 г 3-4 раза в сутки. Препарат следует принимать после приема пищи, запивая большим количеством воды. Для детей в возрасте от 1 месяца до 3 лет применяют ректальные суппозитории, разовая доза парацетамола составляет 15 мг на 1 кг массы тела, суточная - 60 мг на 1 кг массы тела ребенка. Кратность использования 3-4 раза в сутки. Сироп: Для детей в возрасте от 3 до 12 месяцев 2,5-5 мл сиропа (60-120 мг парацетамола). Частота приема сиропа парацетамола составляет 3-4 раза в сутки.

Форма выпуска: таблетки 0,2 г., сироп 100 мл.

**Нимесулид** – нестероидный противовоспалительный препарат; относится к классу сульфонанилидов - селективно ингибирует ЦОГ-2, которая способствует синтезу простагландинов. Препарат влияет на агрегацию тромбоцитов, подавляя ее посредством ингибирования синтеза тромбоспандина А<sub>2</sub>, эндопероксидов и фактора агрегации. Нимесулид резко уменьшает высвобождение гистамина и цитокинов, на последние влияет путем ингибирования высвобождения фактора некроза опухоли. Не влияет на активность фагоцитоза и гемостаз, обнаруживает антиоксидантные свойства. За счет снижения активности миелопероксидазы, уменьшает образование токсических свободнорадикальных продуктов распада кислорода, что приводит к торможению перекисного окисления липидов. Применяют при артритах, в т.ч. ревматоидном артрите, артрозах и остеоартрозах, артралгии и миалгии, бурситах, лихорадке и болях различного генеза, в т.ч. альгодисменорее. Доказано, что анальгетический эффект нимесулида (особенно в гранулированной форме) развивается очень быстро, в течение 20 минут, поэтому его можно принимать при острой приступообразной боли. Применяют внутрь по 100 мг препарата (1 таб. или соответствующее количество суспензии) дважды в сутки, с целью нивелирования возможных осложнений, желательно после еды. Препарат необходимо запивать достаточным количеством воды. Длительность лечения подбирается индивидуально.

Форма выпуска: гранулы для изготовления суспензии 100 мг, суспензия для приема внутрь (60 мл), таблетки по 100 мг, гель 0,1% (30 г в тубе).

**Мефенаминовая кислота** - относится к группе НПВС и является производным антралиновой кислоты - обладает обезболивающим, противовоспалительным и жаропонижающим свойствами. Угнетает синтез простагландинов и серотонина, оказывая

противовоспалительное действие. Применяют при симптоматической терапии болевого синдрома; воспалительных процессах костно-суставного аппарата: ревматоидный артрит, ревматизм, болезнь Бехтерева; посттравматических и постоперационных проявлениях, такие как боль, отек и воспаление; кровопотерях при меноррагиях, обусловленных овуляторными дисфункциональными кровотечениями в случае отсутствия патологии тазовых органов; дисменореях; при лихорадочных состояниях как жаропонижающее средство; при комплексной терапии гриппа и ОРВИ. Препарат применяется перорально после приема пищи. Детский возраст старше 12 лет и взрослая возрастная категория: 250-500 мг три-четыре раза в день. Детская возрастная группа 5 - 12 лет: 250 мг три-четыре раза в день. Длительность терапии 20-60 дней и более. При симптоматической терапии болевого синдрома кратковременный курс лечения - до 7 дней.

Форма выпуска: таблетки покрытые оболочкой 500 мг.

**Мелоксикам** - нестероидное противовоспалительное средство, которое является селективным ингибитором циклооксигеназы-2. Действующее вещество оказывает на организм анальгетическое, противовоспалительное и жаропонижающее действие, а также блокирует работу специфического фермента, который принимает непосредственное участие при развитии воспалительных процессов. Применяют при симптомах ревматоидного артрита, остеоартроза, анкилозирующего спондилита (болезнь Бехтерева); болевых синдромах при остеоартритах, артрозах, дегенеративных заболеваниях суставов. Форма выпуска: таблетки по 15 и 7,5 мг в блистерной упаковке; ампулы 1,5 мл, содержащие 15 мг действующего вещества.

**Ибупрофен** - оказывает обезболивающее, противовоспалительное и умеренное жаропонижающее действие, обусловленное угнетением биосинтеза простагландинов путем ингибирования фермента циклооксигеназы. Применяют при: ревматоидном артрите, остеоартрозе, анкилозирующем спондилите, подагре, невралгии, миалгии, бурсите, радикулите, травматическом воспалении мягких тканей и опорно-двигательного аппарата, заболеваниях ЛОР-органов (в составе комплексной терапии), головной и зубной боли (в качестве вспомогательного средства). При ревматоидном артрите назначают по 800 мг 3 раза/сут. При остеоартрите и анкилозирующем спондилите ибупрофен применяют по 400-600 мг 3-4 раза/сут. При ревматоидном артрите препарат применяют в дозе 30-40 мг/кг массы тела/сут. При травмах мягких тканей, растяжении связок препарат назначают по 600 мг 2-3 раза/сут. При болевом синдроме умеренной интенсивности препарат назначают по 400 мг 3 раза/сут.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой по 200 и 400 мг, сироп по 100мл.

**Бутадион** - анальгезирующее, противовоспалительное и жаропонижающее средство. Применяют при ревматизме, инфекционном неспецифическом полиартрите (воспаление нескольких суставов), болезни Бехтерева, узловой эритеме (ограниченное покраснение кожи), малой хорее (болезнь, вызванная ревматическим поражением головного мозга) и др. Применяют внутрь по 0,1-0,15 г 2-3-4 раза в сутки. Длительность курса - 2-5 недель. Форма выпуска: таблетки покрытые оболочкой, по 0,05 г, и таблетки по 0,15 г.

## СРЕДСТВА ДЛЯ НАРКОЗА

Наркоз – обратимое угнетение функций ЦНС, при котором у человека – отключается сознание, наступает потеря чувствительности (болевой), способность двигаться, чаще всего мыслить и совершать какие либо осмысленные действия (человек находится в состоянии наркозного сна). В то же время сохраняется функция дыхания и деятельность сердечно-сосудистой системы.

Введение больного в состояние наркоза создает благоприятные условия для проведения хирургических операций. После выхода из наркоза – функции ЦНС и прочие функции **полностью восстанавливаются**.

### **Механизм действия наркозных средств**

По механизму действия – средства для наркоза уменьшают проницаемость клеточных мембран для ионов натрия, в результате – затрудняется процесс возникновения волны возбуждения в постсинаптической мембране нейрона.

Высокой чувствительностью к наркозным средствам обладают нейроны **ретикулярной формации и коры головного мозга**, менее чувствительны – нейроны спинного мозга. Менее всего чувствительны нейроны продолговатого мозга, в котором расположены центры дыхательного и сосудодвигательного центров.

Действие наркозных средств развивается **постепенно**, через определенные стадии, по мере увеличения концентрации вещества в ЦНС.

Низкая чувствительность нейронов продолговатого мозга к наркозным веществам, позволяет поддерживать концентрацию этих веществ на высоком уровне, безопасном для жизни.

В зависимости от путей введения средств для наркоза подразделяют на две группы:

- 1. Средства для ингаляционного наркоза;**
- 2. Средства для неингаляционного наркоза;**

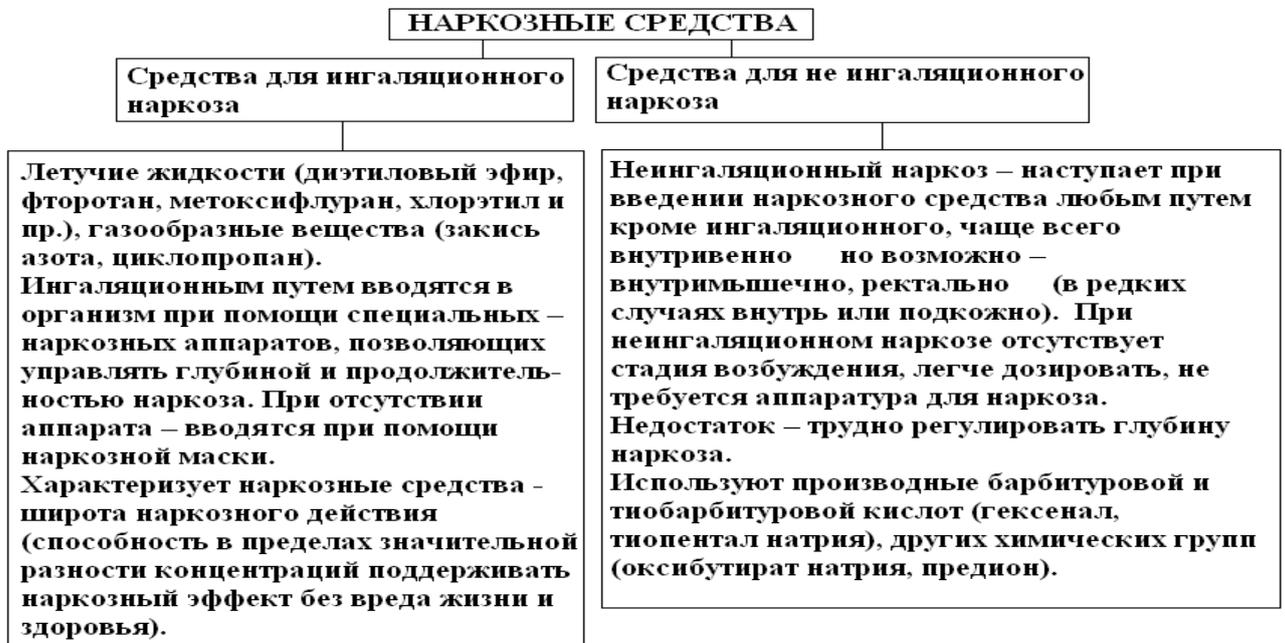
### **Средства для ингаляционного наркоза**

К группе средств для проведения ингаляционного наркоза относятся **летучие жидкости** (диэтиловый эфир, фторотан, метоксифлуран, хлорэтил и пр.) и **газообразные вещества** (закись азота, циклопропан).

Ингаляционный путь введения в организм осуществляется при помощи специальных наркозных аппаратов, позволяющих регулировать концентрацию наркозного вещества в крови, и таким образом – управлять глубиной и продолжительностью наркоза.

При отсутствии аппарата – можно вводить при помощи наркозной маски (контролируя жизненные показатели), что позволяет вводить в состояние наркоза в любых условиях.

### **Структура наркозных средств**



Характеризует наркозные средства - широта наркозного действия (способность в пределах значительной разности концентраций поддерживать наркозный эффект без вреда жизни и здоровья).

Широко распространенным средством для ингаляционного наркоза является диэтиловый эфир.

Течение эфирного наркоза делят на 4 стадии (дозами наркозного средства возможно поддерживать ту или иную стадию):

1. **Стадия оглушения (стадия неглубокого наркоза).** Уменьшение чувствительности и угнетение сознания. Начинается после попадания наркозного вещества в кровь. Мышечный тонус сохранен, поэтому на данной стадии проводят только несложные операции (вскрытие гнойников, обработка глубоких ран, замена повязок);
2. **Стадия возбуждения.** Характеризуется двигательным беспокойством, проявлением двигательной активности, речевым возбуждением, нарушением сердечного ритма и дыхания. Далее сознание утрачивается, рефлексы усиливаются (рвотный, кашлевой, мышечный тонус). Наблюдается обратная реакция подкорковых центров головного мозга на выключение тормозных влияний коры головного мозга.
3. **Стадия хирургического наркоза.** Усиление действия эфира на головной мозг по мере увеличения его концентрации в крови. Угнетающее действие распространяется на спинной мозг. Стадия возбуждения проходит, мышечный тонус снижается, угнетаются безусловные рефлексы, нормализуется дыхание, работа сердца и артериальное давление. Эта стадия наркоза также делится на несколько стадий, является наиболее подходящей для хирургических вмешательств. Данная стадия может искусственно поддерживаться достаточно длительное время.
4. **Стадия пробуждения.** Наступает после прекращения введения наркотического средства. Эфир достаточно быстро выводится из организма через легкие, функции организма постепенно восстанавливаются.

**При введении в наркоз необходим тщательный расчет дозы** – иначе, при передозировке, может наступить вместо пробуждения, стадия паралича дыхательного и сосудодвигательного центров, что может привести к смерти.

Возможными осложнениями при применении этих средств могут быть – **остановка дыхания и сердца** (вследствие действие на соответствующие центры головного мозга), а также рефлекторное раздражение (спазм) дыхательных путей (предупреждается введением атропина перед применением средств для ингаляционного наркоза).

При остановке сердца – применяется массаж, введение адреналина, при остановке дыхания - стимуляторы дыхания и искусственная вентиляция легких.

Крайне опасна – аллергическая реакция немедленного типа, которая развивается крайне быстро и может закончиться «анафилактическим шоком», сопряжена со спазмами дыхательных путей. Перед применением наркотических средств обязательно выявляют склонность к аллергиям, а также возможность аллергической реакции к данному наркотическому средству.

При развитии негативных процессов применяют симптоматическую реанимационную терапию.

В послеоперационный период – возможны тошнота, рвота, головная боль, раздражение слизистых дыхательных путей, гортани, бронхов, трахеи, легких. Иногда – нарушение функции почек и печени.

Другой наркотический препарат - **фторотан** – обладает широкой наркотической активностью (в 3 – 4 раза превосходит диэтиловый эфир) и легко управляем.

Но для него характерны брадикардия и снижение артериального давления. При осложнениях наркоза – не применяется адреналин (сочетание вызывает аритмию).

Другие препараты: энфлуран, изофлуран, десфлуран (сходны с фторотаном) но имеют различия по побочным действиям и механизму.

Хлористый этил – для общего наркоза не применяется (только местно, для кратковременного обезболивания).

Широкое применение имеет **закись азота** (газообразное вещество), достоинство которой – отсутствие побочных эффектов, недостаток – низкая наркотическая активность, поэтому применяется для комбинации с другими наркотическими средствами (**комбинированный наркоз**) и **общей анестезии**.

### **Средства для неингаляционного наркоза**

**Неингаляционный наркоз** – наступает при введении наркотического средства **любым путем кроме ингаляционного**, чаще всего внутривенно, но возможно – внутримышечно, ректально, в редких случаях внутрь или подкожно.

Применяется с середины XIX века. В настоящее время используют для этих целей производные барбитуровой и тиобарбитуровой кислот (**гексенал, тиопентал натрия**) или производные других химических групп (**оксибутират натрия, предион**).

При неингаляционном наркозе отсутствует стадия возбуждения, легче дозировать, не требуется аппаратура для наркоза. Недостаток – трудно регулировать глубину наркоза.

Представителем лекарственных средств этой группы является – **гексенал**. При внутривенном введении вызывает наркоз через 1-2 минуты, стадия возбуждения отсутствует. Продолжительность наркоза – после однократной дозы – 20-30 минут. После

выхода из наркоза – несколько часов сон. Наркоз – непродолжительный, быстро инактивируется печенью. При заболеваниях печени противопоказан. Для длительного наркоза – вводится капельно внутривенно. Осложнения – возможна остановка дыхания вследствие угнетения и паралича дыхательного центра.

**Тиопентал – натрия** при внутривенном введении – очень быстро вызывает состояние наркоза продолжительностью 15-20 минут, по силе эффекта превосходит гексенал.

**Преион для инъекций** напоминает стероидные гормоны но лишен гормональной активности. Наркоз наступает через 3-5 минут при внутривенном введении и продолжается от 1 до 3 часов. Побочное действие – раздражает стенки сосудов, но обладает большой шириной и малой токсичностью.

**Натрия оксибутират** по химическому строению близок к гамма-аминомасляной кислоте, которая выполняет роль медиатора торможения. При внутривенном введении сон наступает через 30-40 мин. и продолжается 1,5-2 часа. Мало токсичен, но наркоз развивается медленно.

**Сомбревин (пропанидид)** используется для внутривенного наркоза. Эффект наступает через 20-40 сек и продолжается 3-4 мин. Применяется для сверхкороткого наркоза. Обладает рядом побочных действий: тошнота, рвота, гиперсаливация, мышечные подергивания. Противопоказан при нарушениях деятельности сердца.

**Кетамин (кеталар, калипсол)** вызывает лишь общую анестезию с частичной утратой сознания, понижением болевой чувствительности и снотворным эффектом. При в/в введении действие наступает через 30-60 сек. и продолжается 5-10 мин., при внутримышечном - 15-30 мин. Применяется для кратковременных вмешательств и введении в наркоз.

В анестезиологии часто применяют комбинации наркотических средств, что позволяет уменьшать их дозы за счет эффекта синергизма.

Введению в наркоз предшествует введение ряда вспомогательных средств (премедикация) с основной целью – уменьшить чувство страха перед операцией и наркозом, спотенцировать действия наркотических средств, а также предупредить осложнения. Для этих целей применяют транквилизаторы, наркотические анальгетики, нейролептики и пр.

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов**

**Фторотан** - средство для ингаляционного наркоза - фармакокинетически отличается легкой всасываемостью из дыхательных путей и быстрым выделением легкими в неизменном виде; лишь небольшая часть фторотана метаболизируется в организме. Препарат оказывает быстрое наркотическое действие, прекращающееся вскоре после окончания ингаляции. Невоспламеняемость делает возможным его применение при использовании во время операции электро- и рентгеноаппаратуры.

Фторотан удобен для применения при операциях на органах брюшной и грудной полостей, так как не вызывает раздражения слизистых оболочек дыхательных путей, угнетает секрецию, расслабляет дыхательную мускулатуру, что облегчает проведение искусственной вентиляции легких. Фторотановый наркоз может применяться у больных бронхиальной астмой. Особенно показано применение фторотана в случаях, когда необходимо избегать возбуждения и напряжения больного (нейрохирургия, офтальмохирургия и др.).



анестезии одной только закисью азота без развития гипоксии невозможно, если только не осуществляется в гипербарической среде.

Период выведения также чрезвычайно короток, полное пробуждение наступает через 4-5 минут после прекращения вдыхания анестетика. Через 20 минут в крови не остается даже следов закиси азота.

Показания для применения закиси азота различаются в зависимости от требуемого вида обезболивания и состояния больного. Наркоз с применением азота закиси используется в хирургической практике, оперативной гинекологии, хирургической стоматологии. В настоящее время закись азота широко используется в анестезиологической практике как компонент комбинированной анестезии в сочетании с анальгетиками, мышечными релаксантами и другими анестетиками (эфир, фторотан, энфлуран) в смеси с кислородом (20-50%).

Закись азота применяют в смеси с кислородом при помощи специальных аппаратов для газового наркоза. Обычно начинают с применения смеси, содержащей 70-80% закиси азота и 30-20% кислорода, затем количество кислорода увеличивают до 40-50%. Если при концентрации закиси азота 70-75% необходимую глубину наркоза получить не удастся, применяют комбинированный наркоз, при котором закись азота сочетают с другими, более мощными средствами для наркоза и миорелаксантами. После прекращения подачи азота закиси во избежание гипоксии необходимо давать 100% кислород в течение 4-5 минут.

Противопоказания: закись азота противопоказана при тяжелых заболеваниях нервной системы, хроническом алкоголизме, состоянии алкогольного опьянения (возможны возбуждения, галлюцинации).

Форма выпуска: в металлических баллонах серого цвета емкостью 1 и 10 л под давлением 50 атм.

**Гексенал** - оказывает снотворное, а в больших дозах приводит к состоянию наркоза. В связи с угнетающим влиянием на дыхательный и сосудодвигательный центры к длительному внутривенному наркозу гексеналом обычно не прибегают, его используют преимущественно для вводного наркоза в сочетании с закисью азота, фторотаном, эфиром или другими средствами, применяемыми для основного наркоза.

Как самостоятельное средство для наркоза гексенал используют, главным образом при кратковременных внеполостных операциях (продолжительностью не более 15-20 мин) и при эндоскопии. Гексеналовый наркоз может сочетаться с местной анестезией.

Вводят гексенал внутривенно медленно, обычно со скоростью 1 мл в минуту. Токсическое действие (угнетение дыхания и кровообращения) усиливается при увеличении скорости введения и концентрации раствора гексенала (и других барбитуратов). Для наркоза обычно применяют 1-2 % раствор гексенала (в некоторых случаях 2,5-5 % раствор). Вначале вводят 1-2 мл и при отсутствии в течение 30-40 с побочных явлений вводят дополнительное количество раствора. Общая доза в зависимости от вида вмешательства, общего состояния больного и пр. составляет 0,5-0,7 г препарата (8-10 мг/кг). Перед наркозом гексеналом больному вводят атропин (или метацин) для предупреждения побочных явлений, связанных с возбуждением блуждающего нерва.

Форма выпуска: по 1 г в стеклянных флаконах.

**Тиопентал натрия** - как и гексенал, оказывает снотворное и наркотическое действие. По фармакологическим свойствам близок к гексеналу, однако действует несколько сильнее. Вызывает более сильное мышечное расслабление, чем гексенал. Применяют тиопентал-натрий как самостоятельное средство для наркоза главным образом при непродолжительных хирургических вмешательствах, а также для вводного и базисного наркоза с последующим использованием других средств для наркоза. Препарат можно использовать в сочетании с мышечными релаксантами при условии проведения искусственной вентиляции легких.

Тиопентал-натрий вводят внутривенно медленно (во избежание коллапса!), а также ректально (главным образом детям). Для наркоза применяют у взрослых 2-2,5 % раствор, а у детей, ослабленных больных и пожилых людей - 1 %. Растворы готовят непосредственно перед употреблением на стерильной воде для инъекций. Растворы должны быть абсолютно прозрачными. Для предупреждения осложнений, связанных с повышением тонуса блуждающего нерва (ларингоспазм, спазм мышц, бронхов, усиление саливации и др.), больному до наркоза вводят атропин или метацин.

Побочные действия: повышение тонуса блуждающего нерва (ларингоспазм /спазм гортани/, повышенная саливация), при быстром введении препарата – коллапс.

Противопоказания: тиопентал-натрий противопоказан при органических заболеваниях печени, почек, диабете, сильном истощении, шоке, коллапсе, бронхиальной астме, воспалительных заболеваниях носоглотки, лихорадочных состояниях, при резко выраженных нарушениях кровообращения.

Антагонистом тиопентал-натрия является бемеград.

Форма выпуска: порошок лиофилизированный по 0,5 и 1,0 во флаконах емкостью 20 мл.

**Оксибутират натрия** - препарат обладает элементами ноотропной активности. Характерным является его выраженное антигипоксическое действие; он повышает устойчивость организма, в том числе тканей мозга, сердца и сетчатки глаза к кислородной недостаточности. Препарат оказывает седативное и центральное миорелаксирующее действие, в больших дозах вызывает сон и состояние наркоза.

Применяют натрия оксибутират в анестезиологической практике как неингаляционное средство для наркоза при неполостных малотравматических операциях с сохранением спонтанного дыхания, а также для вводного и базисного наркоза в хирургии, акушерстве и гинекологии, особенно у больных, находящихся в состоянии гипоксии; в детской хирургии; при проведении наркоза у лиц пожилого возраста.

Действует натрия оксибутират в относительно больших дозах. Для общей анестезии применяют натрия оксибутират внутривенно, внутримышечно или внутрь. Внутривенно вводят физически крепким людям и возбудимым больным из расчета 70-120 мг на 1 кг массы тела; ослабленным больным - 50-70 мг/кг. Препарат растворяют в 50-100 мл 5 % (иногда 40 %) раствора глюкозы или применяют готовый 20 % водный раствор в ампулах. Вводят медленно (1-2 мл в минуту); через 5-7 мин после начала введения препарата больной засыпает. Хирургическая стадия наркоза наступает через 30-40 мин после введения препарата. Продолжительность наркоза 2-4 ч. Внутримышечно вводят натрия оксибутират в дозе 120-150 мг/кг (для наркоза) или 100 мг/кг в сочетании с барбитуратами. Внутрь назначают для наркоза из расчета 100-200 мг/кг. Порошок растворяют в кипяченой воде и дают выпить больному (в палате) за 40-60 мин до операции. Можно пользоваться готовым 5 % сиропом.

Основной наркоз на фоне базисного наркоза натрия оксибутиратом поддерживают фторотаном, закисью азота, эфиром или другими средствами для общей анестезии (фентанил, кетамин, стадол и др.).

Форма выпуска: 20 % раствор в ампулах по 10 мл; 5 % сироп во флаконах по 400 мл; 66,7 % раствор во флаконах по 37,5 мл.

**Предион** - снотворное и средство для наркоза - применяют для внутривенного вводного, базисного, а также для самостоятельного мононаркоза. К вводному предионовому наркозу прибегают в случаях, когда противопоказаны барбитураты. Применение предиона для базисного наркоза (в сочетании с эфиром, закисью азота, фторотаном) позволяет уменьшить количество основных средств для наркоза, необходимое для проведения анестезии. Наркотический эффект предиона после однократного внутривенного введения продолжается обычно 30-40 мин. Предион хорошо расслабляет мускулатуру, не оказывает существенного влияния на дыхание и сердечно-сосудистую систему. В связи с маловыраженным влиянием на углеводный обмен может применяться при сахарном диабете.

Растворы предиона для инъекций готовят непосредственно перед употреблением. В качестве растворителей применяют 5 % раствор глюкозы, изотонический раствор натрия хлорида, 0,25 % раствор новокаина или стерильную воду для инъекций. Применяют предион в растворах разной концентрации (0,5-5 %), чаще используют 2,5-5 % раствор. Начальная доза для вводного наркоза составляет 10-12 мг/кг, а для базисного и самостоятельного наркоза 15-20 мг/кг. Вводят раствор в вену большого калибра (обычно локтевую) через иглу с большим просветом. Скорость введения - 1 г в течение 3-5 мин.

Побочные действия: основным осложнением при использовании предиона является раздражение внутренней стенки вен, сопровождающееся болью по ходу сосуда во время введения препарата; в дальнейшем возможны уплотнение вен и развитие флебита. Для предупреждения этого осложнения при применении предиона рекомендуется в качестве растворителей использовать растворы глюкозы, натрия хлорида и новокаина; кроме того, до введения предиона следует ввести в вену 0,25-0,5 % раствор новокаина, а после окончания введения предиона (не вынимая иглы из вены) "промыть" вену указанными растворителями (10-20 мл).

Форма выпуска: флаконы или ампулы вместимостью 20 мл с содержанием 0,5 г препарата.

## ПСИХОТРОПНЫЕ ВЕЩЕСТВА

**Психотропные средства** (нейролептики, транквилизаторы и седативные) – влияют на психику человека и применяются для лечения нервных расстройств и психических заболеваний.

Психотропные вещества делятся на: средства **угнетающего действия** (нейролептики, транквилизаторы, седативные средства), **возбуждающего действия** (**психостимуляторы**) и **занимающие промежуточное положение** (**антидепрессанты, соли лития**).

**НЕВРОЗ** [гр. *neurōn* жила, нерв] - обширная группа функциональных нервно-психических заболеваний. Общим для них всех является **отсутствие органических повреждений головного мозга**. Обязательным условием для возникновения невроза является **стрессовая ситуация**. При исчезновении причины стресса невроз полностью излечим.

Главный *симптом невроза – тревога*. Многих пациентов часто преследуют страх *сойти с ума; заразиться инфекционным (в особенности венерическим) заболеванием; заболеть раком или сердечной болезнью; страх смерти или самоубийства; боязнь людей или животных*. Хотя у большинства из этих больных страх не имеет очевидной причины, он постоянно изнуряет их. Тревога - состояние хронического страха, предчувствий страшного несчастья, наполняет жизнь больных.

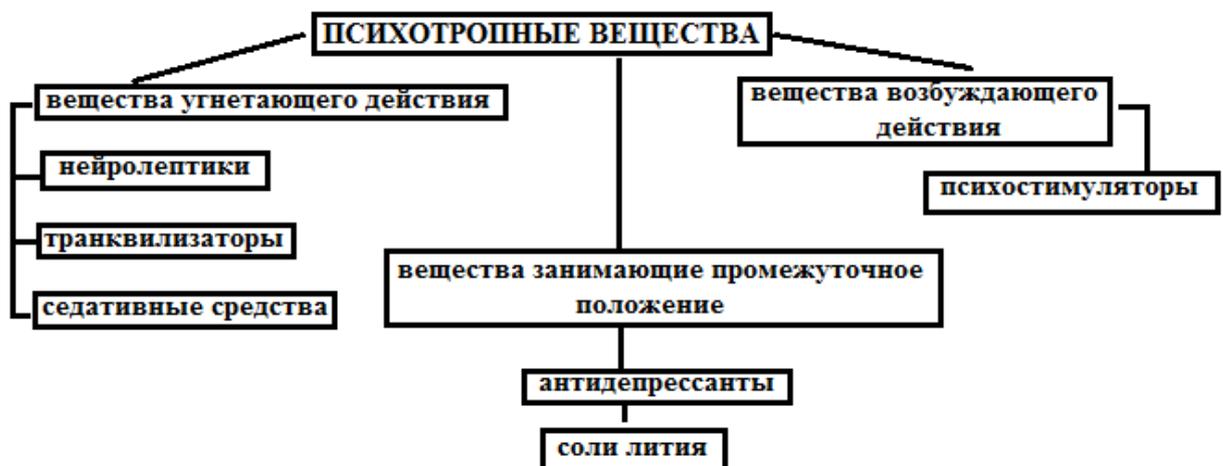
Неврозы проявляются так называемым *астеническим синдромом*, в который входят симптомы повышенной утомляемости, истощаемости нервно-психических процессов, часто возникают вегетативные расстройства (потливость, сердцебиение) и нарушения сна. К неврозам относят *неврастению, невроз страха (многочисленные фобии), истерический невроз и невроз навязчивых состояний*.

**ПСИХОЗ** [гр. psyche душа] – обширная группа психических заболеваний, при которых психическая деятельность больного не соответствует окружающей действительности, отражение реального мира в сознании резко искажено, что проявляется в нарушениях поведения, появлении несвойственных в норме патологических симптомов и синдромов. Психозы (или психотические расстройства) являются весьма распространенным видом патологии. В среднем, частота эндогенных психозов составляет 3-5% от численности населения.

### Общие сведения о нервных и психических заболеваниях

Психотические расстройства могут встречаться при целом ряде психических заболеваний: болезни Альцгеймера, старческом слабоумии, хроническом алкоголизме, наркомании, эпилепсии, олигофрении и т.д. Психоз может возникнуть вследствие воздействия сильной психической травмы (стрессовой ситуации). Это так называемый «реактивный» психоз. Нередко встречаются так называемые инфекционные (развивающиеся вследствие тяжелого инфекционного заболевания), соматогенные (вызванные тяжелой соматической патологией, например инфарктом миокарда) и интоксикационные психозы. Самым ярким примером последних служит алкогольный делирий - «белая горячка».

### Структура строения группы психотропных веществ



Основными проявлениями психозов являются: галлюцинации (слуховые, зрительные, обонятельные, вкусовые, тактильные); бредовые идеи (суждения, умозаключения, не соответствующие действительности); двигательные расстройства

(заторможенность (ступор) или возбуждение); расстройства настроения (депрессивные или маниакальные состояния). Наиболее часто встречаются слуховые галлюцинации, так называемые «голоса», которые человек может слышать доносящимися извне или звучащими внутри головы, а порой и тела. В большинстве случаев голоса воспринимаются настолько ярко, что у больного не возникает ни малейшего сомнения в их реальности. Голоса могут быть угрожающими, обвиняющими, нейтральными, императивными (приказывающими). Последние считаются самыми опасными, так как часто больные подчиняются приказам голосов и совершают поступки, опасные для себя или окружающих.

В неосложненных и незапущенных случаях стационарное лечение длится, как правило, полтора-два месяца. Часто у человека, перенесшего психоз, несмотря на полное исчезновение его симптомов, появляются так называемые негативные расстройства, которые в ряде случаев приводят к еще более серьезным социальным последствиям, чем само психотическое состояние. У больных происходит изменение характера, личностных свойств, выпадение из психики мощных пластов, ранее ей присущих. Больные становятся вялыми, малоинициативными, пассивными, не желают вступать в какие-либо социальные контакты. Нередко у них исчезают присущие им ранее отзывчивость, душевность, чувство такта; взамен этого появляются раздражительность, грубость, неуживчивость, агрессивность.

**БРЕД** – это совокупность идей и представлений, умозаключений, возникших не в результате обработки поступившей информации и не корректируемых поступающей информацией (при этом не важно, соответствует ли бредовое умозаключение действительности или нет). Бред является расстройством мышления, это неправильное умозаключение, возникающее на патологической основе (так называемая «кривая логика»), полностью изменяющее мировоззрение больного, не поддающееся коррекции извне и изнутри и с течением времени претерпевающее определенную динамику.

Если бред полностью овладевает сознанием, то такое состояние называют острым бредом. Иногда больной способен адекватно анализировать окружающую действительность, если это не касается тематики бреда. Такой бред называют инкапсулированным. Являясь продуктивной симптоматикой, бред является симптомом многих заболеваний мозга, но особенно он характерен для шизофрении.

Однако бред отличается от шизофрении тем, что при шизофрении изменение индивидуального внутреннего мира происходит полностью, целостно, тогда как в случае с бредом – лишь частично. При шизофрении больной становится как бы другим человеком, а в случае бреда за рамками бредовых образов деформированного фрагмента своего внутреннего мира он остается тем, кем был, сохраняя принятый им (и даже общепринятый) образ поведения.

Различают два вида бреда. При так называемом первичном бреде первичным является поражение мышления – поражается рациональное, логическое познание, искаженное суждение последовательно подкреплено рядом субъективных доказательств, имеющих свою систему. Ко вторичному бреду относятся «чувственный» бред, когда первично нарушено восприятие. Это бред образный, с преобладанием иллюзий и галлюцинаций. В случае вторичного бреда идеи фрагментарны, непоследовательны, т.к. первично нарушение чувственного познания (восприятия). Нарушение мышления наступает вторично, имеет место бредовая интерпретация галлюцинаций.

**ПАРАНОЙЯ** [гр. *paranoia* безумие] – хроническое психическое заболевание, характеризующееся навязчивыми систематизированными бредовыми идеями, овладевающими сознанием больного и обуславливающими его действия.

Паранойя сопровождается подозрительностью и достаточно хорошо обоснованной системой сверхценных идей, которые приобретают характер бреда только при чрезмерной их выраженности. Бредовый комплекс был бы совершенно логичен, если бы исходные патологические идеи были правильны.

Одержимый паранойей индивид, независимо от того, к какой социальной группе он принадлежит, навсегда посвящает себя борьбе с воображаемыми врагами и демонстрации подчеркнуто мужского поведения, граничащего с героизмом. Борьба никогда не кончается: как только побежден один враг, появляется другой, еще более опасный.

**ШИЗОФРЕНИЯ** [гр. *schizo* раскалываю + *phren* сердце, душа; ум, рассудок] – шизофрения – психическое заболевание, имеющее многообразные проявления (бред, галлюцинации, нервно-психическое возбуждение и пр.) и ведущее без своевременного лечения к нарушению психической деятельности. Под расщеплением подразумевается не раздвоение (например, личности), как часто это не совсем верно понимают, а нелогичность, несоответствие, отсутствие гармоничности.

Шизофрения прогрессирует текущий (прогредиентный – прогрессирующий) болезненный процесс, характеризующийся постепенно нарастающими изменениями личности (падение энергетического потенциала, замкнутость, аутизм, эмоциональное снижение, диссоциация психической деятельности, апатия) и различными по тяжести и выраженности продуктивными психопатологическими проявлениями (неврозо- и психопатоподобными, бредовыми, галлюцинаторными).

Шизофренией страдает примерно 1,5% всего населения Земли. Риск заболеть прямо пропорционален степени родства с больным шизофренией и количеству заболевших в роду. У братьев и сестёр, а также у детей страдающего шизофренией риск заболеть в несколько раз выше. Если же больны оба родителя, то риск равен примерно 45%.

Шизофрения отличается большим разнообразием клинических проявлений. Различны и исходы болезни: *от едва заметных изменений личности, не влияющих на социальную адаптацию, до глубоких нарушений, делающих невозможной жизнь больных вне стационара.*

Отличительные признаки шизофренических расстройств – нарушения мышления, восприятия, аффекта и моторной функции. При шизофрении мыслительные процессы *утрачивают нормальные ассоциативные связи*, и больной часто не способен сосредоточиться на какой-либо умственной задаче. На содержание мышления влияет также характерный для шизофрении феномен, а именно бред. Бред – это ошибочные и обычно очень стойкие убеждения, которые с учетом культурной среды больного признаются аномальными. Например, страдающий бредом преследования может быть убежден в том, что за ним шпионят полиция, ЦРУ и ФСБ. Многие бредовые сюжеты настолько противоестественны, что повседневного опыта достаточно, чтобы сделать выводы об их нереальности. Примером служит бредовое убеждение человека в том, что он был перенесен через космос на другую планету, и там высшие существа наделили его чудесной силой и озарением.

Помимо распространенного бреда преследования, существуют и другие виды шизофренического бреда. В их числе – бред утраты контроля за мыслями и движениями, когда больной убежден, что его мысли и движения контролируются внешними силами,

например, по проводам, с помощью электроники, телепатии или гипноза. При шизофрении возможны слуховые, зрительные или тактильные галлюцинации. Наиболее распространены слуховые галлюцинации.

## **НЕЙРОЛЕПТИКИ**

Антипсихотические средства (нейролептики) применяют для лечения **психических заболеваний** и относят к средствам угнетающего действия на ЦНС и способны подавлять симптомы психических расстройств, таких как галлюцинации и бредовые состояния. Нейролептики не эффективны при лечении неврозов. Вместе с тем, угнетающее действие нейролептиков на психику может привести к состоянию подавленности и депрессии.

Нейролептики также оказывают ряд сопутствующих фармакологически значимых эффектов, таких как: седативный и транквилизирующий, а также способность понижать температуру тела.

Механизм действия нейролептиков заключается в их способности влиять на синтез нейромедиаторов, главным образом – дофамина - в центральной нервной системе.

**Производное фенотиазина** - аминазин - один из наиболее эффективных лекарственных препаратов, применяемых при лечении психических расстройств. Эффективно устраняет симптомы психических заболеваний - галлюцинации и бред, оказывает транквилизирующее и седативное действие, уменьшает двигательную активность и мышечный тонус, снижает температуру тела (до 33-30°C), обладает сильным противорвотным действием. Аминазин также эффективен в качестве противосудорожного средства.

Аминазин (как и большинство препаратов из группы нейролептиков) усиливает действие психотропных, наркотических, седативных и пр. средств, угнетающих нервную систему. В некоторых случаях назначается в хирургической практике перед наркозом (премедикации), для более эффективного применения наркотических средств.

Вместе с тем, аминазин обладает рядом побочных эффектов. Так, длительный контакт с препаратом может вызывать дерматиты, раздражение дыхательных путей, слизистых оболочек (в том числе глаз), а также аллергические реакции. Препарат противопоказан при язвенной болезни ЖКТ, заболеваниях печени и почек.

Длительное применение аминазина при лечении психических заболеваний может привести к болезни Паркинсона. Кроме того, угнетающее действие на психику ведет к депрессии. При парентеральном введении аминазина возможен ортостатический коллапс при переходе из горизонтального в вертикальное положение.

### **Структура и особенности действия группы психотропных веществ**



Прочие препараты этой группы (фенотиазина) сходны с аминазином по своим фармакологическим свойствам, но различаются по выраженности отдельных видов действия.

**Сравнительная характеристика некоторых производных фенотиазина**

Препарат	Виды действия			
	антипсихотическое	седативное	противорвотное	экстремизирующие расстройства
Аминазин	+++	+++	+	++
Этаперазин	+++	+	++++	+++
Трифтазин	++++	++	+++	+++
Фторфеназин	+++	++	+++	+++

Среди нейролептиков из группы **бутирофенонов** наибольшее распространение получили такие лекарственные средства, как галоперидол и дроперидол.

Галоперидол является одним из наиболее эффективных лекарственных препаратов из группы нейролептиков, обладает сильным антипсихотическим, транквилизирующим и седативным действием. Препарат подобно аминазину, потенцирует действие средств, угнетающих ЦНС (наркотических препаратов, наркотических анальгетиков, снотворных средств и пр.). Обладает противорвотным действием (превосходит аминазин), в отличие от аминазина не обладает М-холиноблокирующими свойствами.

Применяется галоперидол (подобно аминазину), при лечении психических заболеваний, симптоматика которых проявляется в виде галлюцинации и бреда. Наиболее существенным негативным побочным эффектом применения этого препарата является нарушение двигательной активности и развитие паркинсонизма. Двигательное возбуждение и мышечные судороги возможны в первые дни лечения.

Представитель этой-же группы лекарственных средств – дроперидол - оказывает быстрое но непродолжительное действие. Дроперидол обладает протившоковой активностью, поэтому применяется в качестве обезболивающего средства, как правило, совместно с анальгетиком фентанилом, для проведения нейролептанальгезии.

Производным **тиоксанта** – является лекарственный препарат хлорпротиксен, который уступает препаратам группы фенотиазина по антипсихотической активности.

К производным **дибензодиазепина** относится клозапин, обладающий достаточно высокой антипсихотической активностью.

Производным **индола** является алкалоид резерпин (содержащийся в растении – раувольфии). Резерпин обладает слабым антипсихотическим действием, в большей степени проявляя действие – транквилизирующее. Действие резерпина на центральную нервную систему сходно с действием прочих лекарственных препаратов из группы нейролептиков, но в связи с недостаточной терапевтической активностью редко используется в психиатрии, но находит широкое применение в качестве гипотензивного средства при гипертонии.

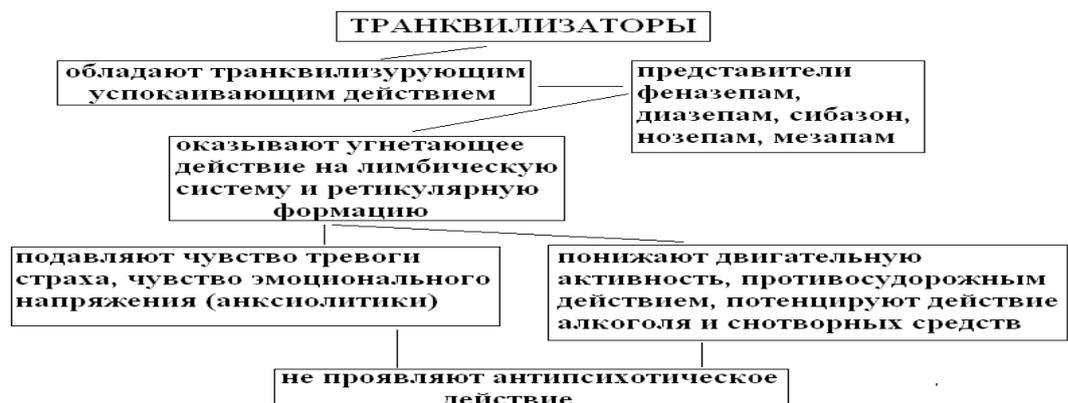
## ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ

Лекарственные средства группы транквилизаторов обладают успокаивающим действием на центральную нервную систему. Транквилизаторы подавляют чувство боязни, страха, тревоги, фобии различной этиологии, снижают двигательную активность, потенцируют действие наркотических средств, алкоголя, нейролептиков и прочих средств угнетающих ЦНС, обладают противосудорожным действием. Препараты этой группы применяются также при функциональных неврозах сердечно-сосудистой системы и ЖКТ.

Кроме того, транквилизаторы являются достаточно эффективными снотворными средствами. Подавляя чувство эмоционального напряжения, обладают снотворным эффектом, не изменяя структуру сна. В анестезиологии транквилизаторы принимают в качестве средства, подавляющего чувство страха перед хирургической операцией (премедикации).

Транквилизаторы применяются при лечении неврозов и не обладают антипсихотической активностью, не устраняют галлюцинации и бредовые состояния. Транквилизаторы оказывают угнетающее действие на участки мозга отвечающие за эмоциональную сферу (формирование эмоций). Механизм действия транквилизаторов связан с их способностью понижать возбудимость подкорковых областей головного мозга, оказывать угнетающее действие на лимбическую систему и ретикулярную формацию, таламус и гипоталамус.

### Структура и особенности действия лекарственных средств группы транквилизаторов



Среди лекарственных препаратов группы транквилизаторов наиболее часто применяются **производные бензодиазепина**: диазепам (сибазон, седуксен), хлорзепид (элениум), феназепам, нозепам, мезапам и пр. Бензодиазепины взаимодействуют в организме с бензодиазепиновыми рецепторами, в свою очередь связанными с ГАМК-рецепторами.

Производные **пропандиола** (мепробамат), обладают сходными свойствами с лекарственными препаратами бенздиазепинового ряда.

Производное **дифенилматана** – амизил, обладает сходными с прочими транквилизаторами фармакологическими свойствами, но отличается от них механизмом действия (угнетает м-холинорецепторы головного мозга).

Транквилизаторы не назначаются водителям транспорта или другим работникам, деятельность которых связана с необходимостью повышенной концентрации внимания. При лечении транквилизаторами не допустимо употребление алкоголя, поскольку алкоголь потенцирует действие транквилизаторов.

Влияющие на психику и эмоциональную сферу препараты этой группы вызывают лекарственную зависимость при их бесконтрольном приеме, поэтому транквилизаторы отпускаются исключительно по рецепту врача.

### СЕДАТИВНЫЕ СРЕДСТВА

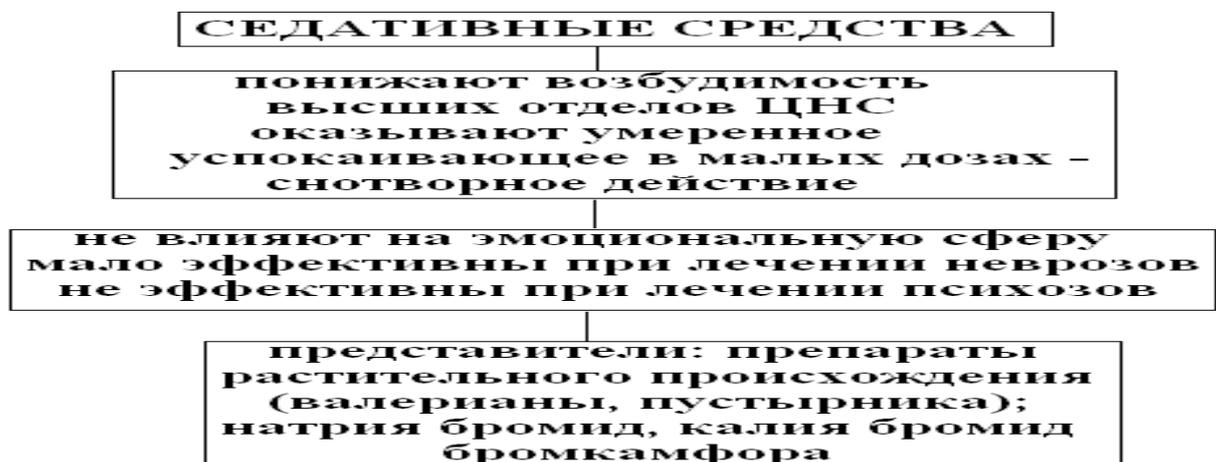
Седативные средства оказывают на организм умеренное успокаивающее действие, понижая возбудимость центральной нервной системы. По фармакологическим свойствам близки к транквилизаторам, но в отличие от последних седативные средства не действуют на эмоциональную сферу и менее эффективны при лечении неврозов. Вместе с тем, препараты этой группы не эффективны при лечении психических заболеваний, поскольку не устраняют симптомы психических расстройств (галлюцинации и бред). В малых дозах седативные средства обладают умеренным снотворным действием.

К седативным средствам относятся ряд препаратов растительного происхождения, такие как: препараты валерианы, пустырника, мелиссы, мяты, ромашки, пассифлоры, пиона и пр., а также лекарственные средства содержащие соли бромистоводородной кислоты (бромид натрия, бромид калия, бромкамфора).

Бромиды усиливают процессы торможения в коре головного мозга и нервной системе в целом. Бромиды способны восстанавливать баланс между процессами возбуждения и торможения в ЦНС за счет усиления процессов торможения.

Бромиды, как и прочие седативные средства, применяются для лечения неврастения, истерии и других нервных расстройств, для которых характерно ослабление процессов торможения в коре головного мозга. Особенностью применения препаратов брома является необходимость индивидуального подбора дозировки препарата.

#### Структура и особенности действия седативных лекарственных средств



Соли бромистоводородной кислоты в качестве действующих компонентов включены в сложные официальные прописи ряда экстемпоральных лекарственных средств (микстура Бехтерева, Павлова и пр.).

Бромиды обладают пролонгированным действием, поскольку достаточно медленно выводятся из организма (преимущественно почками), к тому же обладают свойством кумулироваться в организме. Следствием кумуляции является развитие хронического отравления бромидами (бромизм), для которого характерно: угнетенное состояние нервной системы, сонливость, апатия, возможны аллергические реакции в виде кожной сыпи и катаральных явлений (кашля и насморка). В случае развития бромизма, прием препаратов этой группы прекращают и назначают обильное питье, содержащее большие дозы хлорида натрия (до 20 г в сутки).

В качестве **седативных средств растительного происхождения** применяют препараты валерианы, пустырника, мяты, ромашки и пр.

Настойки, настои и экстракты этих растений оказывают выраженное седативное, успокаивающее действие на центральную нервную систему, а также умеренное спазмолитическое действие (понижают тонус гладкой мускулатуры внутренних органов).

Препараты назначаются в качестве успокаивающих средств при повышенном возбуждении, в качестве профилактического средства при нервных стрессах, лечении и профилактике неврозов сердечно-сосудистой системы, а также в качестве спазмолитического средства умеренного по силе действия.

Экстракты этих растений входят в состав большого количества комбинированных препаратов (валокордин, корвалол и пр.).

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов**

**Аминазин** - нейролептик - один из основных представителей нейролептиков (лекарственных средств, оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему и в обычных дозах не вызывающих снотворного эффекта). Одной из основных особенностей действия аминазина на центральную нервную систему является относительно сильный седативный эффект (успокаивающее действие на центральную нервную систему).

В психиатрической практике аминазин применяют при различных состояниях психомоторного возбуждения у больных шизофренией (галлюцинаторно-бредовый и др. синдромы), при хронических параноидных и галлюцинаторно-параноидных состояниях, маниакальном возбуждении у больных маниакально-депрессивным психозом (психозом с чередованием возбуждения и угнетения настроения).

Назначают аминазин внутрь (в виде драже), внутримышечно или внутривенно (в виде 2,5% раствора). При парентеральном введении эффект наступает быстрее и выражен сильнее. Внутри препарат рекомендуется применять после еды.

Форма выпуска: драже по 0,025, 0,05 и 0,1 г; 2,5% раствор в ампулах по 1, 2, 5 и 10 мл. Выпускаются также таблетки аминазина по 0,01 г.

**Сибазон (седуксен, реланиум, диазепам)** - транквилизатор - бензодиазепиновое производное, уменьшает возбудимость подкорковых участков мозга, которые отвечают за эмоциональные реакции и связь с корой мозга. Сибазон показан при невротических расстройствах, абстинентных состояниях, тревожных расстройствах, мышечном гипертонусе. Дозирование индивидуальное, определяется врачом. Внутривенно вводят в

виде раствора. Оптимальные растворители – декстроза или физиологический раствор (более 250 мл). Место введения меняют во избежание флебита и тромбоза.

Форма выпуска: таблетки для детей по 1 и 2 мг, для взрослых по 5 мг и ампулы с 0,5% раствором.

**Настойка валерианы** - снотворный и седативный препарат - прозрачная жидкость от желто-красного до красно-бурого цвета, с характерным запахом. Допускается образование осадка при хранении. Проявляет седативные, снотворные, анальгетические, спазмолитические свойства. Биологически-активные вещества, которые содержатся в корневище с корнями валерианы (эфирное масло, валериановая кислота, борнеол, алкалоиды, дубильные вещества, сахар), замедляют процессы возбуждения в центральной нервной системе, усиливают эффекты других седативных, снотворных, анальгетических и спазмолитических средств. Валерианы настойку применяют при функциональных расстройствах деятельности центральной нервной системы (повышенная эмоциональная возбудимость, раздражительность, расстройства сна), сердечно-сосудистой системы (нейроциркуляторная дистония), а также при спазмах органов желудочно-кишечного тракта внутрь по 20-30 капель 3-4 раза в день до достижения стабильного лечебного эффекта, детям с 12 лет - из расчета 1 капля на 1 год жизни на протяжении 2 месяцев.

Состав: 1 флакон содержит 30 мл настойки корневищ с корнями валерианы измельченных (1:5); *вспомогательное вещество*: спирт этиловый 70%.

**Корвалдин** - седативное средство – комбинированный препарат, обладающий успокаивающим и спазмолитическим действием. Ускоряет протекание фазы засыпания, и переход её в фазу естественного сна. Действующие вещества, определяющие фармакологический эффект препарата: этиловый эфир  $\alpha$  – бромизовалериановой кислоты – вещество с седативным и спазмолитическим эффектом, который достигается путём уменьшения активности ретикулярной формации и других мозговых структур. Фенобарбитал в составе корвалдина содержится в дозе, которая оказывает лёгкое седативное и сосудорасширяющее действие. Масла мяты перечной и хмеля обладают рефлекторным сосудорасширяющим и устраняющим спазмы действиями, благодаря которым способны устранять явления метеоризма.

Применение препарата показано при нарушениях сна, болях в области сердца, нарушении сердечного ритма по типу тахикардии, различных невротических состояниях, проявлениях вегетативной лабильности, сопутствующей раздражительности, а также на ранних стадиях артериальной гипертензии.

Наличие у препарата спазмолитического эффекта позволяет использовать его при спазмах гладкой мускулатуры органов желудочно-кишечного тракта, в частности при жёлчной и кишечной коликах.

Принимают препарат внутрь перед едой обычно с небольшим количеством воды или другой жидкости в соотношении: корвалдина 15-30 капель, жидкости 30-50 капель. Кратность приёма 2 – 3 раза в день.

Форма выпуска: спиртовой раствор по 15 или 25 мл во флаконах – капельницах.

**Дроперидол** - нейролептик из группы бутирофенонов - оказывает быстрое, сильное, но непродолжительное действие. Эффект при введении в вену проявляется через 2-5 мин, достигает максимума через 20-30 мин. Действие в зависимости от дозы продолжается 2-3

часа. В психиатрической практике дроперидол применяют при психомоторном возбуждении, галлюцинациях. В основном применяется в анестезиологической практике для нейролептанальгезии, обычно в сочетании с фентанилом или другими анальгетиками. Вводят дроперидол под кожу, внутримышечно и внутривенно. Для премедикации и нейролептанальгезии дроперидол вводят обычно внутримышечно за 30-45 мин до операции в дозе 2,5-5 мг (1-2 мл 0,25% раствора) вместе с 0,05-0,1 мг (1-2 мл 0,005% раствора) фентанила или 20 мг (1 мл 2% раствора) промедола.

Форма выпуска: 0,25 % раствор в ампулах по 5 и 10 мл (12,5 или 25 мг; по 2,5 мг в 1 мл).

**Галоперидол** – нейролептик - оказывает тормозящее действие на центральную нервную систему и в обычных дозах не вызывает снотворного эффекта; средство с выраженным антипсихотическим эффектом. Применяют при шизофрении, маниакальных (неадекватно повышенное настроение, ускоренный темп мышления, психомоторное возбуждение), галлюцинаторных (бред, видения, приобретающие характер реальности), бредовых состояниях, острых и хронических психозах, вызванных различными причинами. В комплексной терапии при болевом синдроме, стенокардии, при неукротимой тошноте и рвоте. Используют внутрь по 0,0015-0,03 г в день, внутримышечно и внутривенно по 0,4-1 мл 0,5% раствора. Как противорвотное назначают внутрь взрослым по 0,0015-0,002.

Форма выпуска: таблетки по 0,0015 и 0,005 г; ампулы по 1 мл 0,5% раствора; во флаконах по 10 мл 0,2% раствора.

**Трифтазин** - активное нейролептическое средство - оказывает тормозящее действие на центральную нервную систему и в обычных дозах не вызывает снотворного эффекта. Применяют при шизофрении (различные формы), других психических заболеваниях, протекающих с бредом и галлюцинациями (инволюционные /старческие/ и алкогольные психозы) внутрь по 0,005 г с последующим повышением дозы в среднем на 0,005 г в день; внутримышечно - 1-2 мл 0,2% раствора.

Форма выпуска: таблетки по 0,001 г, 0,005 г и 0,01 г, покрытые оболочкой; ампулы по 1 мл 0,2% раствора.

**Феназепам** - высокоактивный транквилизатор - средство, оказывающее успокаивающее влияние на центральную нервную систему. По силе транквилизирующего и анксиолитического (противотревожного) действия превосходит другие транквилизаторы; оказывает также выраженное противосудорожное, миорелаксантное и снотворное действие. Феназепам назначают при различных невротических, неврозоподобных, психопатических и психопатоподобных состояниях, сопровождающихся тревогой, страхом, повышенной раздражительностью, эмоциональной лабильностью (неустойчивостью). Препарат эффективен при навязчивости, фобии, ипохондрических синдромах (угнетенном состоянии, обусловленном страхом за свое здоровье), в том числе резистентных к действию других транквилизаторов, показан также при психогенных психозах, панических реакциях и др. Назначают феназепам внутрь в виде таблеток. В амбулаторных условиях (вне больницы) назначают взрослым 0,00025-0,0005 г 2-3 раза в день.

Форма выпуска: таблетки по 0,0005 и 0,001 г (0,5 и 1 мг).

**Натрия бромид** - седативное средство - способствует восстановлению равновесия между процессами возбуждения и торможения при нарушениях их соотношения. Применяют при

повышенной раздражительности, бессоннице, гипертонической болезни внутрь по 0,1-1 г 3-4 раза в день, детям (в зависимости от возраста) по 0,05-0,3 г 3 раза в день.

Форма выпуска: порошок.

**Хлозепид** – транквилизатор - оказывает успокаивающее действие на центральную нервную систему, вызывает миорелаксацию, даёт слабый противосудорожный эффект, потенцирует действие снотворных средств и анальгетиков. Применяют при невротических состояниях, сопровождающихся тревогой, возбуждением, повышенной раздражительностью, бессонницей; невротоподобных и психопатоподобных расстройств у больных с атеросклерозом сосудов мозга, органическим поражением головного мозга; при абстиненции у больных алкоголизмом и наркоманией, вегетососудистых дисфункциях у больных неврозами, психопатиями и при патологическом развитии личности. В психиатрии - при шизофрении с невротоподобной симптоматикой. Дозы препарата подбирают индивидуально. Обычно назначают взрослым внутрь, постепенно повышая дозу до получения терапевтического эффекта. Препарат отменяют постепенно, снижая дозу. Курс лечения не должен превышать 75 дней.

Форма выпуска - таблетки по 0,005 г, покрытые оболочкой.

**Гидазепам** – транквилизатор, оказывающий анксиолитическое (противотревожное) и противосудорожное действие. Отличается от других транквилизаторов наличием активирующего эффекта и слабовыраженным миорелаксирующим действием. Гидазепам назначают взрослым в качестве “дневного” транквилизатора при невротических, невротоподобных, психопатических и психопатоподобных состояниях, мигрени, при состояниях, сопровождающихся тревогой, страхом, повышенной раздражительностью, напряженностью, навязчивостями, нарушениями сна, а также при эмоциональной лабильности (неустойчивости), для купирования синдрома абстиненции при алкоголизме и в период ремиссии больным хроническим алкоголизмом. Назначают внутрь по 0,02-0,05 г 3 раза в день, постепенно повышая дозу.

Форма выпуска: таблетки по 0,02 и 0,05 г (20 и 50 мг).

**Настойка пустырника - седативное средство** - препарат растительного происхождения; оказывает седативное, противосудорожное, кардиотоническое и диуретическое действие. В качестве седативного лекарственного средства применяют при повышенной нервной возбудимости, функциональных нарушениях ССС (ВСД, лабильная артериальная гипертензия) внутрь, за 1 ч до еды. По 70-100 мл (1/3-1/2 стакана) настоя 2 раза в сутки; по 30-50 кап настойки 3-4 раза в сутки;

Форма выпуска: настойка 25мл и 30 мл (1:5)

**Сульпирид** - нейролептическое (психотропное) средство - оказывает тормозящее действие на центральную нервную систему и в обычных дозах не вызывает снотворного эффекта. Оказывает противорвотное действие. Способствует улучшению перистальтики кишечника и ускоряет заживление ран и язвы желудка. Используют при депрессивных состояниях, сопровождающихся вялостью, заторможенностью, апатией (снижением двигательной и речевой активности), при острых и старческих маниакально-депрессивных психозах (психозах с чередованием возбуждения и угнетения настроения), шизофрении и др. Принимают внутрь по 0,2-0,4 г в сутки, в тяжелых случаях вводят внутримышечно по 0,1-0,8 г в сутки. При язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, мигрени,

головокружении - внутрь по 0,1-0,3 г в сутки в течение 1-2 недель. Поддерживающая терапия - по 0,05-0,15 г ежедневно в течение 3 недель.

Форма выпуска: капсулы по 0,05 г; раствор 5% в ампулах по 2 мл для инъекций; раствор 0,5% во флаконах по 200 мл.

**Мезапам** - транквилизатор бензодиазепинового ряда. Оказывает успокаивающее действие, снимает эмоциональное напряжение, уменьшает тревогу, страх, обладает вегетостабилизирующим действием. В отличие от других производных бензодиазепина, препарат в меньшей степени проявляет миорелаксантные и гипноседативные свойства, в связи с чем он относится к числу "дневных" транквилизаторов. Препарат потенцирует эффект нейротропных и снотворных препаратов. Применяют при неврозах, психопатии с тревогой, возбуждении, нервном напряжении, раздражительности, мигрени (профилактика приступов), климактерическом синдроме, алкоголизме (абстинентный синдром). У детей - "школьные" неврозы, психическая лабильность, чрезмерная возбудимость. Назначают внутрь, перед приемом пищи, начиная с 5 мг 2-3 раза в день, постепенно повышая дозу до 30 мг/сутки.

Форма выпуска: порошок, таблетки по 0,01 г, гранулы для детей 1,0 г.

**Хлорпротиксен** - транквилизирующее (успокаивающее) и нейролептическое (оказывающее тормозящее действие на центральную нервную систему и в обычных дозах не вызывающее снотворного эффекта) средство; усиливает действие снотворных и анальгетических средств. Применяют при психозах с тревогой и страхом, невротических состояниях с чувством страха, беспокойством, агрессивностью, нарушениями сна; соматических заболеваниях (заболевания внутренних органов) с неврозоподобными расстройствами, кожным зудом; как противорвотное средство. Применяют внутрь по 0,025-0,05 г 3-4 раза в день с последующим постепенным уменьшением дозы, внутримышечно по 25-50 мг 2-3 раза в день. Как противорвотное средство - внутримышечно по 12,5-25 мг.

Форма выпуска: таблетки по 0,015 и 0,05 г; ампулы по 1 мл 2,5% раствора.

### СНОТВОРНЫЕ СРЕДСТВА

Снотворные средства - лекарственные препараты способствующие наступлению, нормальному течению и достаточной продолжительности сна.

Кроме того, снотворные средства могут использоваться в качестве седативных средств (в небольших дозах), а также противосудорожных (противоэпилептических) средств (фенобарбитал).

Процесс сна развивается вследствие развития процессов торможения в коре головного мозга, с последующим его распространением на другие области ЦНС.

Выснено, что сам процесс сна имеет две стадии: медленного и быстрого сна. Сон начинается со стадии **медленного сна**, для которого характерно развитие процессов торможения в коре головного мозга, угасания очагов возбуждения и как следствие - ослабление дыхания, деятельности сердечно-сосудистой системы, урежение пульса.

Стадия медленного сна продолжается приблизительно 1-1,5 часа и сменяется второй стадией - **быстрого сна**. Для этой стадии характерны процессы противоположного характера: усиление активности мозга и деятельности сердечно-сосудистой системы, учащение пульса, дыхания, отмечают быстрое и хаотичное движение глазных яблок, в стадии быстрого сна человек видит сновидения. Стадия быстрого сна длится

приблизительно 20 минут и вновь сменяется стадией медленного сна. В процессе сна стадии медленного и быстрого сна несколько раз меняют друг друга. В случае нарушения стадий – сон становится неполноценным. Нежелательным считается действие снотворных средств, которые нарушают структуру сна.

При некоторых заболеваниях, вследствие чрезмерного возбуждения, стрессовых ситуаций, при развитии склероза в старческом возрасте и пр. у больного может развиваться бессонница. При этом у некоторых больных возникают трудности с засыпанием, либо со слишком раннем пробуждением, после которого больные не могут вновь заснуть. Иногда нарушается как процесс засыпания, так и течение сна в целом. В этом случае сон бывает чрезмерно чутким, поверхностным, беспокойным, сопровождается частыми пробуждениями.

Бессонница крайне отрицательно сказывается на общем самочувствии больного, состоянии его нервной системы, особенно если приобретает хронический, изнуряющий характер.

Снотворные средства обладают способностью угнетать возбуждение в коре головного мозга, а также передачу нервных импульсов в ЦНС. Особенно важное значение в процессе наступления сна и его течения имеет угнетение снотворными средствами ретикулярной формации, активирующей работу головного мозга.

Ряд лекарственных препаратов, таких как производные барбитуровой кислоты (барбитураты), нарушают структуру сна, подавляют стадию «быстрого сна». Другие лекарственные средства, например транквилизаторы, на стадии сна влияния не оказывают.

Существует множество классификаций снотворных средств, основанных на особенностях их фармакологического действия или химического строения.

На протяжении долгого времени основными снотворными лекарственными препаратами, применяемыми в медицине, оставались производные барбитуровой кислоты (барбитураты) - достаточно многочисленный класс соединений, обладающих сильным снотворным эффектом. В свою очередь барбитураты классифицируются в зависимости от особенностей и продолжительности их действия.

Однако в настоящее время в качестве снотворных средств барбитураты практически не применяются, что связано с многочисленными побочными эффектами, характерными для данной группы лекарственных средств. Так, большинство барбитуратов обладают способностью к кумуляции, поскольку достаточно медленно разлагаются в печени, что приводит к длительному последствию лекарственных средств этой группы: сонливости, заторможенности, рассеянности, ослаблению памяти.

Кроме того, как было установлено, лекарственные средства из группы барбитуратов вызывают стойкую лекарственную зависимость, что позволило некоторые из них отнести к категории наркотических средств.

В последнее время некоторые лекарственные средства этой группы (фенобарбитал) находят применение в качестве противосудорожных (противоэпилептических) средств.

### **Структура и особенности действия снотворных лекарственных средств**



В настоящее время, в качестве снотворных средств нашли применение лекарственные средства других фармакологических групп, например, транквилизаторы (нитразепам, нозепам, диазепам и пр.). Лекарственные средства из группы транквилизаторов обладают выраженной снотворной активностью, что особенно характерно для такого лекарственного средства, как «нитразепам», для которого снотворное действие является основным.

Действуя угнетающе на эмоциональную сферу, транквилизаторы снимают эмоциональную напряженность, чем способствуют процессу засыпания и нормальному течению сна. Транквилизаторы, в отличие от барбитуратов, не изменяют структуру сна и не проявляют эффекта последействия (сонливости, заторможенности и пр.). Снотворный эффект транквилизаторов наступает в течении 1 часа после приема препарата и продолжается до 8-10 часов.

Кроме транквилизаторов, в качестве снотворных средств получили распространение лекарственные препараты – активаторы ГАМК – рецепторов, усиливающих процессы торможения в коре головного мозга. К препаратам этой группы относятся: золпидем и зопиклон. Активаторы ГАМК рецепторов проявляют выраженное снотворное действие в сочетании с седативным (успокаивающим) эффектом.

Снотворные средства – **производные алифатического ряда** также обладают достаточно выраженным снотворным эффектом. Представителем этой группы лекарственных средств является хлоралгидрат, который действует достаточно длительно (до 8 часов) и, при этом не нарушает структуру сна. Вместе с тем хлоралгидрат обладает рядом отрицательных побочных эффектов: раздражает слизистые оболочки, нарушает сердечную деятельность, работу печени и выделительной системы.

### Снотворные средства

Классификация	Снотворные средства с наркотическим типом действия		Производные бензодиазелина
	Производные барбитуровой кислоты	Алифатические соединения	
<i>Механизм действия</i>	Повышают чувствительность ГАМК-рецепторов к эндогенной г-аминомасляной кислоте, что способствует усилению процессов торможения в ЦНС	Угнетают межнейронную передачу в ЦНС	Взаимодействие с бензодиазепиновыми рецепторами, непосредственно связанными с ГАМК-рецепторами, и повышение их чувствительности к эндогенной ГАМК
<i>Фармакологические эффекты</i>	Облегчают засыпание, с повышением дозы сон переходит в наркоз, однако наркотическая широта у большинства препаратов незначительна. Противосудорожное действие (фенобарбитал)	Успокаивающее действие (бромизовал), облегчает засыпание, противосудорожное действие (хлоралгидрат)	Снотворное, транквилизирующее, седативное, противосудорожное действия
<i>Побочные эффекты</i>	Изменяют структуру сна, укорачивают быстрый сон и вызывают его дефицит, что является причиной синдрома отдачи после отмены препарата. Материальная кумуляция является причиной последствия. Угнетают дыхательный и сосудодвигательный центры. Снижают температуру тела. Вызывают психическую и физическую зависимость	На структуру сна не влияют, не кумулируют. Могут вызвать психическую и физическую зависимость. Угнетают функцию печени, почек, сердца	На структуру сна практически не влияют, не вызывают кумуляции и последствия, меньше риск лекарственной зависимости. Относительно малотоксичны
<i>Противопоказания</i>	Болезни почек, печени, беременность, гипотензия, хронический алкоголизм, выраженный атеросклероз		

При отравлении снотворными средствами наблюдается потеря сознания, угнетение дыхания, отсутствие реакции на болевые раздражители, падение артериального давления, понижение температуры тела, расслабление скелетной мускулатуры. Смерть может наступить от острой сердечной недостаточности или паралича дыхательного центра.

#### Меры помощи при остром отравлении снотворными средствами

<b>Клиника отравления</b>	Глубокий сон, переходящий в наркоз и далее в барбитуровую кому. Сознание отсутствует, угнетение рефлексов, мышечного тонуса, дыхательного и сосудодвигательного центров, гипотермия
<b>Меры помощи</b>	
<i>Цель мероприятий</i>	<i>Содержание мероприятий</i>
Прекращение дальнейшего поступления препарата в кровь (при энтеральном введении)	Зондовое промывание желудка, очистительная клизма, активированный уголь и солевое слабительное внутрь
Ускорение выведения всосавшегося внутрь вещества	Гемодиализ (5 % р-р глюкозы, 0,9 % р-р NaCl, гемодез всего не менее 1,5 л) и форсированный диурез (фуросемид в/в в конце инфузии)
Нормализация дыхания, нарушенного за счет угнетения дыхательного центра	В легких случаях – analeптики центрального действия (бемегрид, кофеин, коразол), в тяжелых – аппаратное дыхание, оксигенотерапия
Нормализация сердечной деятельности, нарушенной за счет угнетения сосудодвигательного центра	Прессорные вещества (адреналин, норадреналин, мезатон, эфедрин), сердечные гликозиды (строфантин, коргликон)

В качестве неотложной медицинской помощи применяют – промывание желудка и мочегонные средства (с целью максимально быстрого выведения лекарственного средства из организма), а также средства возбуждающие центральную нервную систему. При необходимости больного подключают к аппарату искусственного дыхания.

### ПРОТИВОСУДОРОЖНЫЕ СРЕДСТВА

Судороги - это независимое от сознания, произвольное сокращение скелетных мышц. Различают тонические судороги, при которых одновременно сокращаются сгибательные и разгибательные мышцы; клонические, при которых попеременно

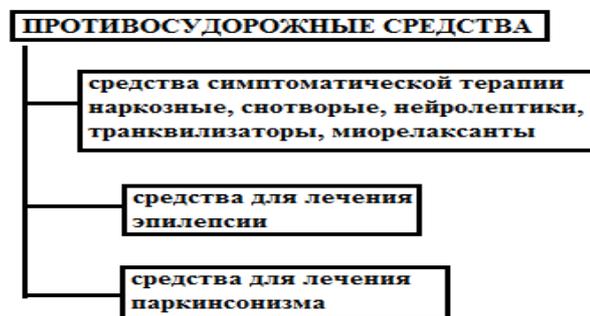
сокращаются и расслабляются большие группы мышц; тонико-клонические или смешанные. Кроме того, судороги подразделяют на генерализованные и локальные.

Причина судорог может быть различной, например, инфекционные заболевания (столбняк), отравление так называемыми судорожными ядами (стрихнин), а также заболевания нервной системы такие как паркинсонизм и эпилепсия.

Противосудорожные средства квалифицируются, в зависимости от направленности их терапевтического действия, на следующие группы:

- Средства симптоматической терапии, имеющие достаточно широкий спектр терапевтического действия и не являющиеся непосредственно противосудорожными средствами. К ним относятся: средства для наркоза (в том числе ингаляционного), снотворные, нейролептики, транквилизаторы;
- Средства для лечения эпилепсии;
- Средства для лечения паркинсонизма;

### Структура противосудорожных средств



### ПРОТИВОЭПИЛЕПТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

Эпилепсия – заболевание центральной нервной системы. Причины заболевания в настоящее время до конца не выяснены, предполагают, что таковыми могут быть нарушения обмена веществ в нервных клетках головного мозга.

Причиной эпилептических припадков могут быть также заболевания головного мозга или ЦНС, например, опухоль мозга, черепно-мозговая травма, нейросифилис, сопровождающийся поражением головного мозга, развитием атеросклероза сосудов головного мозга и пр. Кроме того, эпилепсия является болезнью, передающейся по наследству.

Отличительной особенностью эпилепсии являются периодически повторяющиеся судорожные припадки (возможно с потерей сознания), а также изменения психики и поведения человека.

Различают четыре вида эпилептических припадков:

1. Большие судорожные эпилептические припадки, сопровождающиеся тонико-клоническими судорогами и потерей сознания;
2. Малые судорожные эпилептические припадки, при которых больной на короткое время (несколько секунд) теряет сознание, тонико-клонические судороги при этом отсутствуют;
3. Психомоторные эквиваленты, при которых больной может совершать не осмысленные, не мотивированные (иногда общественно опасные) поступки, о которых впоследствии ничего не помнит;

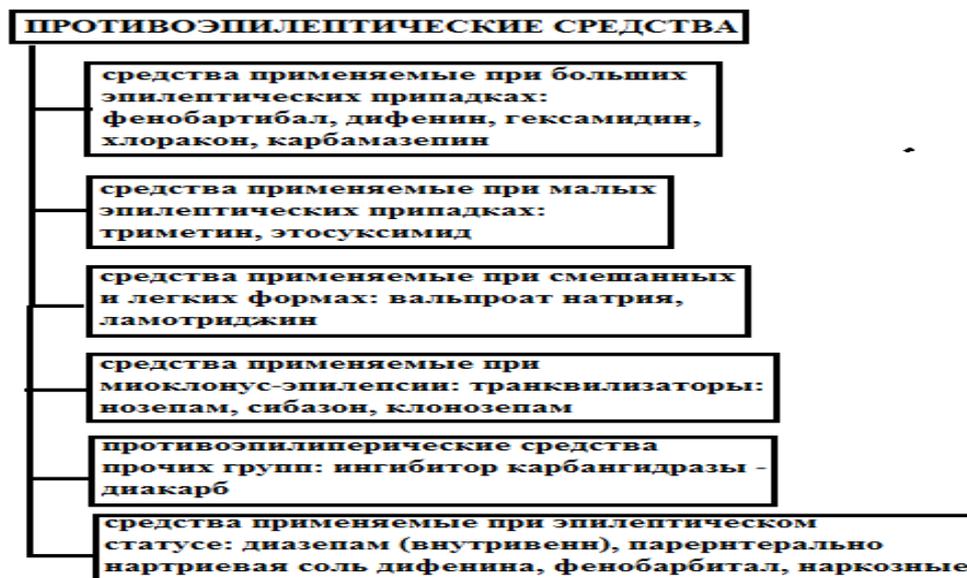
4. Миоклонус – кратковременные судорожные подергивания мышц (тонические судороги), которые не сопровождаются потерей сознания;

Кроме того выделяют также особое состояние, так называемый – эпилептический статус, при котором эпилептические припадки следуют один за другим.

Длительное время для лечения эпилепсии применялся лекарственный препарат из группы барбитуратов – фенобарбитал. Однако фенобарбитал обладает рядом нежелательных побочных эффектов. Так, фенобарбитал вызывает сонливость, заторможенность, а также лекарственную зависимость при длительном применении, кроме того при лечении у детей наблюдалось отставание в физическом и умственном развитии. В современной медицине существует достаточно большое количество противоэпилептических лекарственных средств избирательного действия, которые лишены вышеуказанных недостатков.

Применяемая в настоящее время основана на их фармакологической активности, проявляемой при различных видах эпилептических приступов. Современные средства, применяемые для лечения эпилепсии не излечивают болезнь, но способны уменьшать частоту и тяжесть эпилептических приступов.

### Структура противоэпилептических средств



При больших приступах эпилепсии применяются такие средства, как фенобарбитал, дифенин, гексамидин, хлоракон, карбамазепин.

При малых приступах эффективны триметин и этосуксимид, при смешанных и легких формах – вальпроат натрия.

Сравнительная эффективность основных противоэпилептических средств при различных проявлениях эпилепсии

Препарат	Форма эпилепсии		
	большие припадки	малые припадки	психомоторные эквиваленты
Фенобарбитал	+++		
Дифенин	+++		++
Гексамидин	++	+	++
Хлоракон	++		++
Триметин		+++	

При миоклонус – эпилепсии эффективны транквилизаторы: диазепам, нитразепам, клоназепам и пр. Как было установлено, противоэпилептической активностью обладают также лекарственные средства других фармакологических групп, например, ингибитор карбоангидразы – диакарб.

При эпилептическом статусе применяются диазепам, дифенин и фенобарбитал. В особо тяжелых случаях могут быть применены средства для ингаляционного наркоза.

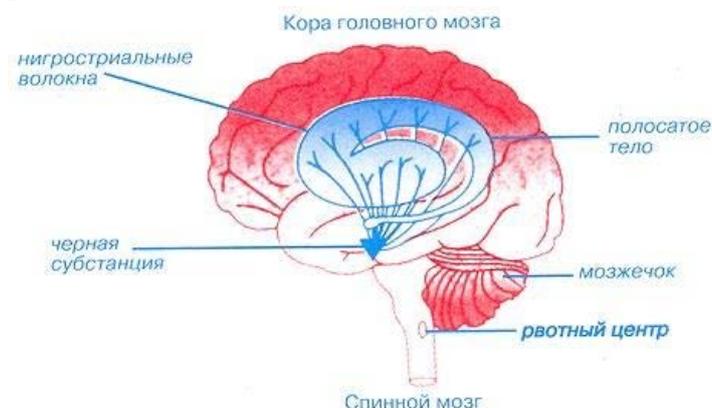
Механизм действия противоэпилептических средств в настоящее время установлен недостаточно, поскольку часто неизвестны причины заболевания. Считают, что противоэпилептические средства угнетают межнейронную передачу возбуждения, которая генерируется эпилептическим очагом в головном мозге, за счет стабилизации нейронных мембран и усиления тормозных процессов в головном мозге. Значительную роль в этом процессе играют тормозные медиаторы (ГАМК).

На современном уровне развития медицины эпилепсия является неизлечимой болезнью. Поэтому лекарственные препараты, уменьшающие частоту и силу эпилептических припадков, принимаются больными длительное время, иногда в течение десятков лет. Противоэпилептические лекарственные средства иногда принимаются комбинированно, либо последовательно. При этом большинство лекарственных препаратов этой группы проявляют ряд нежелательных побочных эффектов, которые следует учитывать при их длительном применении. Так, возможны изменения компонентного состава крови (уменьшение лейкоцитов и эритроцитов), нарушение функций печени и почек и пр.

### СРЕДСТВА ДЛЯ ЛЕЧЕНИЯ ПАРКИНСОНИЗМА

Паркинсонизм (болезнь Паркинсона) характеризуется повышенным мышечным тонусом, сопровождающимся постоянным тремором (непроизвольным дрожанием) конечностей, головы или всего тела, а также малоподвижностью, медлительностью, скованностью. Такое состояние получило название «дрожащий паралич».

Причины паркинсонизма изучены недостаточно. Считается, что таковыми может быть развитие склеротических изменений в коре головного мозга (склероз сосудов головного мозга), а также некоторые инфекционные заболевания, поражающие головной мозг (энцефалит, малярия).

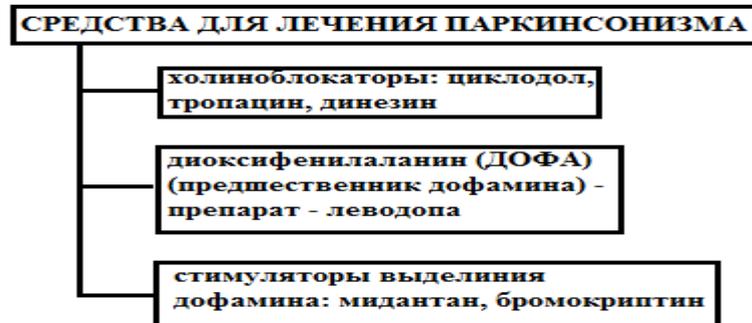


Паркинсонизм связывают с чрезмерной активностью определенных структур головного мозга (в частности - полосатого тела), регулирующих деятельность двигательных нейронов. Действие лекарственных средств, применяемых при лечении паркинсонизма, направлено на уменьшение активности полосатого тела (расположенного

в затылочной части головного мозга) - уменьшением возбуждающего (стимулирующего) влияния на него холинергической системы, либо усиление тормозных процессов, увеличением дофаминергического влияния.

Установлено, что наилучший терапевтический эффект при лечении паркинсонизма дают лекарственные средства, обеспечивающие поступление или стимулирующие выделение дофамина.

### Структура противозипептических средств



К лекарственным средствам, применяемым для лечения паркинсонизма относят следующие группы лекарственных препаратов:

- Холиноблокаторы (циклодол, тропацин);
- Предшественник дофамина (диоксифенилаланин или ДОФА) – леводопа;
- Средства стимулирующие выделение дофамина (мидантан, бромокриптин);

К наиболее эффективным средствам, применяемым при лечении паркинсонизма, относится лекарственный препарат леводопа. Сам дофамин плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, вследствие чего в незначительном количестве достигает головного мозга. Предшественник дофамина - леводопа, способен преодолевать этот барьер и оказывает терапевтическое действие непосредственно на головной мозг.

Вместе с тем, леводопа оказывает ряд негативных побочных эффектов, таких как: ортостатическая гипотензия, психические расстройства и пр. К тому же ряд побочных эффектов этого препарата связан с образованием дофамина из леводопы в периферических тканях, которые уменьшают сочетание леводопы с декарбоксилазой (ферментом ингибирующем периферическую ДОФА). Комплексными препаратами, сочетающими леводопу с периферическими ингибиторами ДОФА, являются – наком, синемет.

В некоторых случаях положительный эффект дают лекарственные препараты – стимуляторы дофаминовых рецепторов. К препаратам этой группы относят: бромкриптин, мидантан и пр.

При лечении паркинсонизма могут применяться также ингибиторы моноаминооксидазы (МАО) – фермента разрушающего нейромедиаторы и, таким образом, уменьшающие проведение нервного импульса. К препаратам этой группы относится – селегинин.

### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

**Клоназепам** – транквилизатор - оказывает успокаивающее, мышечно-расслабляющее, анксиолитическое (противотревожное) и противосудорожное действие. Противосудорожное действие выражено у клоназепама сильнее, чем у других препаратов этой группы, поэтому его применяют в основном для лечения судорожных состояний.

Применяют клоназепам у детей и взрослых при малых и больших формах эпилепсии с миоклоническими приступами (подергиваниями отдельных пучков мышц), при психомоторных кризах, повышенном мышечном тонусе. Используют также в качестве снотворного средства, особенно у больных с органическими повреждениями головного мозга. Лечение клоназепамом начинают с малых доз, постепенно увеличивая их до получения оптимального эффекта. Дозировка индивидуальна в зависимости от состояния больного и его реакции на препарат. Препарат назначают в дозе 1,5 мг в сутки, разделенной на 3 приема. Постепенно дозу повышают на 0,5-1 мг каждый 3-й день до получения оптимального эффекта. Детям клоназепам назначают в следующих дозах: новорожденным и детям до 1 года - 0,1-1 мг в сутки, от 1 года до 5 лет - 1,5-3 мг в сутки, от 6 до 16 лет - 3-6 мг в сутки. Суточную дозу делят на 3 приема.

Форма выпуска: Таблетки по 0,001 г.

**Зопиклон** - снотворное средство из группы циклопирролонов, структурно отличающихся от бензодиазепинов и барбитуратов. Оказывает седативное, снотворное действие. Быстро вызывает сон, не уменьшая фазы быстрого сна в его структуре, и затем поддерживает сон с сохранением нормального фазового состава. Не вызывает постсомнических нарушений: отсутствуют ощущения разбитости и сонливости на утро следующего дня. Сон наступает в течение 30 мин и продолжается 6-8 ч. Препарат уменьшает головные боли. Применяют его при нарушениях сна (затруднении засыпания, ночных или ранних пробуждениях, преходящей, ситуационной и хронической бессоннице); нарушениях сна при психических расстройствах, бронхиальной астме с ночными приступами в сочетании с разовым приемом суточной дозы теофиллина. Зопиклон принимают внутрь, по 7,5 мг, за 30-40 мин до предполагаемого сна, при необходимости - до 15 мг (максимальная доза). Длительность непрерывного применения - не более 1 мес. Вызывает лекарственную зависимость.

Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой 7,5 мг.

**Вальпроат натрия** - противосудорожное, противоэпилептическое средство. Механизм действия связан с повышением содержания тормозного нейромедиатора ГАМК в центральной нервной системе за счет ингибирования фермента ГАМК-трансферазы. Применяют при эпилепсии генерализованного и локального типа, фебрильных судорогах у детей, расстройстве поведения, связанных с эпилепсией, детском тике. Режим дозирования подбирается индивидуально. Препарат принимают 2-3 раза в день во время еды. Взрослым назначают в начальной дозе по 0,3 г 2 раза в день, дозу постепенно увеличивают на 0.2 г/сут, с 3-дневным интервалом до достижения клинического эффекта.

Форма выпуска: таблетки 0,2, 0,3, 0,5 г.; раствор для приема внутрь; сироп; микстура.

**Селегилин** - противопаркинсоническое средство - селективный ингибитор MAO. Применяют в качестве монотерапии и в комбинации с леводопой или с содержащими ее препаратами при болезни Паркинсона, симптоматическом паркинсонизме.

Форма выпуска: таблетки по 5 мг.

**Карбамазепин** - противосудорожное, противоэпилептическое средство - оказывает выраженное противосудорожное (противоэпилептическое) и в умеренной степени антидепрессивное и нормотимическое (улучшающее настроение) действие. Применяют карбамазепин при психомоторной эпилепсии, больших припадках, смешанных формах

(главным образом при комбинации больших припадков с психомоторными проявлениями), локальных формах (посттравматического и постэнцефалитного происхождения). При малых припадках недостаточно эффективен. Назначают внутрь (во время еды) взрослым, начиная с 0,1 г (1/2 таблетки) 2-3 раза в день, постепенно увеличивая дозу до 0,8-1,2 г (4-6 таблеток) в день.

Форма выпуска: таблетки по 0,2 г.

**Хлоралгидрат** - снотворное средство - оказывает сложное действие на ЦНС: снотворное, анальгезирующее, противосудорожное и успокаивающее. В больших дозах обладает наркотическими свойствами. В небольших дозах препарат ослабляет тормозные процессы, в больших - снижает процессы возбуждения.

Сон при действии хлоралгидрата наступает через 15–20 минут после приёма препарата и продолжается 5–6 часов.

применяют для купирования психического возбуждения в психиатрической практике, как снотворное и противосудорожное средство при спазмофилии, столбняке, эклампсии и др.

Взрослым хлоралгидрат назначают внутрь или в виде клизм в дозе 0,2-1,0 г на прием. Препарат принимается только совместно с обволакивающими средствами и в большом разведении.

Форма выпуска: выпускается в виде таблеток, содержащих по 0,5, 0,75 и 1,5 г активного вещества.

**Донормил** - снотворное средство - антагонист H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов группы этаноламинов с M-холиноблокирующим действием. Обладает седативным и снотворным эффектами. Уменьшает время, необходимое для засыпания; повышает длительность сна, улучшая его качество. На фазы сна влияния не оказывает. Продолжительность действия от 6 до 8 часов.

Применяют при нарушениях сна различной этиологии, включая нарушение засыпания (бессонница). Принимают по половине или целой таблетке в сутки за 15 минут до сна. Шипучую таблетку растворяют в воде; таблетки в оболочке запивают небольшим количеством воды. В случае неэффективности препарата после консультации врача можно увеличить дозировку до 2 таблеток. Если бессонница не излечивается в течение 2-5 суток, необходимо изменить метод терапии.

Форма выпуска: шипучие таблетки по 15 мг и таблетки, покрытые оболочкой.

**Бромизовал** - седативное средство - оказывает успокаивающее и умеренное снотворное действие.

Применяют при бессоннице, нервном возбуждении. Назначают внутрь как успокаивающее средство по 0,3 - 0,6 г 1-2 раза в день, как снотворное - по 0,6 - 0,75 г на прием за полчаса до сна.

Форма выпуска: порошок; таблетки по 0,3 г.

**Леводопа** - противопаркинсоническое средство. Дофамин наряду с ацетилхолином является межнейронным медиатором (передатчик) в базальных ганглиях центральной нервной системы. При паркинсонизме отмечается преобладание холинергической активности, поэтому сбалансирования адрено- и холинергических взаимодействий в центральной нервной системе можно достигнуть либо уменьшением активности

холинергических структур (применение холинолитиков), либо повышением активности адренергических структур (введение дофамина). Дофамин плохо проникает через гематоэнцефалический барьер, поэтому с лечебной целью вводят предшественник дофамина леводопу. Препарат снимает главным образом тремор и акинезию; улучшает речь, уменьшает слюнотечение и явления себорей; леводопа в меньшей степени влияет на ригидность.

Применяют при болезни Паркинсона, паркинсонизме (эффективность препарата выше при идиопатическом и васкулопатическом паркинсонизме) внутрь по 0,1 г после еды 5 раз в сутки, постепенно увеличивая дозу до 3-6 г и более (10 г) в сутки. Необходимо исключить из пищи продукты, содержащие пиридоксин (витамин В<sub>6</sub> содержится во многих продуктах: в зерновых ростках, в грецких орехах и фундуке, в шпинате, картофеле, моркови, цветной и белокочанной капусте, помидорах, клубнике, черешне, апельсинах и лимонах).

Форма выпуска: порошок в капсулах по 0,5 г.

**Амантадин** - противопаркинсоническое средство - стимулирует допаминергическую передачу в базальных ганглиях и других отделах ЦНС за счет усиления выделения медиатора и угнетения его обратного нейронального захвата.

Применяют при болезни Паркинсона; потере сознания при черепно-мозговой травме; невралгии при опоясывающем лишае внутрь в первые 3 дня лечения назначают по 100 мг, затем дозу повышают до 200 мг/сут (второй прием - во второй половине дня, до ужина), при необходимости возможно дальнейшее повышение дозы на 100 мг в неделю. В случае проведения комбинированного лечения с другими противопаркинсоническими средствами дозу устанавливают индивидуально.

Форма выпуска: таблетки 100 мг.

**Ламотриджин** - противосудорожное, противоэпилептическое средство - снижает патологическую активность нейронов без угнетения их функции. Стабилизирует нейрональные мембраны посредством влияния на Na<sup>+</sup>-каналы, блокирует избыточный выброс возбуждающих аминокислот (в основном глутамата), не снижая его нормальное высвобождение. Применяют при эпилепсии у взрослых (монотерапия и в составе комбинированной терапии) и детей старше 2 лет (только в составе комбинированной терапии противоэпилептическими ЛС): парциальные и генерализованные припадки (в т.ч. тонико-клонические); биполярные расстройства (маниакально-депрессивный психоз).

Назначают при монотерапии: взрослым и детям старше 12 лет в начальной дозе 25 мг 1 раз в сутки в течение 2 нед, далее повышают до 50 мг 1 раз в день в течение 2 нед.

Форма выпуска: таблетки 25 мг, 50 мг, 100 мг.

**Фенобарбитал** - снотворное средство - однако в настоящее время наибольшее значение имеет как противоэпилептическое средство. В малых дозах оказывает успокаивающее действие. Применяют при лечении эпилепсии, при генерализованных тоникоклонических припадках (grand mal). В связи с противосудорожным действием назначают при хорее (заболевании нервной системы, сопровождающемся двигательным возбуждением и некоординированными движениями), спастических параличах, различных судорожных реакциях и как снотворное средство. Для лечения эпилепсии взрослым назначают, начиная с дозы 0,05 г 2 раза в день и постепенно повышая дозу до тех пор, пока не

прекратятся припадки, но не более 0,5 г в сутки. Детям препарат назначают в меньших дозах в соответствии с возрастом. Лечение проводят длительно. Прекращать прием фенобарбитала при эпилепсии надо постепенно, так как внезапная отмена препарата может вызвать развитие припадка и даже эпилептического статуса. В качестве успокаивающего и спазмолитического средства фенобарбитал назначают в дозе 0,01-0,03-0,05 г 2-3 раза в день.

Форма выпуска: порошок; таблетки по 0,005 г для детей и по 0,05 и 0,1 г для взрослых.

**Этосуксимид** - противоэпилептическое средство - производное сукцинимидов. Эффективен при малых приступах эпилепсии, а также при миоклонических приступах. Применяют при малых эпилептических приступах, сопровождающихся кратковременной потерей сознания; кратковременных потерях сознания у маленьких детей; атипичных общих приступах при вторичной эпилепсии, сопровождающихся кратковременной потерей сознания; тяжелых комплексных и атипичных приступах (в комбинации с соответствующим противосудорожным препаратом, таким как примидон или фенобарбитал). Дозирование этосуксимида устанавливают индивидуально в зависимости от клинической картины заболевания, чувствительности к препарату и его переносимости. Дозу препарата повышают постепенно; полный эффект достигается через 4-8 нед.

Детям и взрослым: назначают в начальной суточной дозе от 5 до 10 мг/кг; в дальнейшем ее повышают на 5 мг/кг каждые 4-7 сут.

Форма выпуска: капсулы (250 мг).

**Бипериден** - группа холинолитических, противопаркинсонических средств - блокирует центральные н-холинорецепторы и периферическую м-холинергическую передачу возбуждения; последнее обеспечивает миотропные и спазмолитические эффекты. Уменьшает ригидность мышц, тремор и вегетативные нарушения, в меньшей степени - симптомы акинезии. Применяют при болезни Паркинсона, экстрапирамидных расстройствах, дискинезии, акинезии при лечении нейролептиками и др. препаратами внутрь, в/в или в/м. Дозировка и частота приема подбираются индивидуально. Взрослым при приеме внутрь в начале лечения - по 1 мг 2 раза/сут, затем частоту приема можно постепенно увеличить и применять по 2 мг 2-4 раза/сут. Доза может быть повышена до 6-16 мг/сут. При в/м или в/в введении разовая доза составляет 2,5-5 мг. Повторное введение в той же дозе возможно каждые 30 мин, но не более 4 раз/сут.

Форма выпуска: таблетки по 0,002 г и таблетки ретард по 0,004 г; 0,5% раствор в ампулах по 1 мл.

**Наком** - противопаркинсоническое средство - комбинированный препарат, содержащий левопу вместе с ингибитором периферического (экстрацеребрального) декарбоксилирования (разложения) левопы, разработанный для уменьшения побочных эффектов и усиления лечебного действия препарата левопы. При этом левопы используется в меньших дозах. Уменьшается выраженность побочных явлений. Назначают дозы внутрь как во время, так и после еды, подбирая индивидуально с учетом особенностей действия основного компонента - левопы. Обычно прием начинают с 1/2 таблетки 1-2 раза в сутки; при необходимости увеличивают дневную дозу, добавляя 1/2 таблетки через каждые 2-3 дня до достижения оптимального эффекта (обычно до 3-6 таблеток в сутки, но не более 8). Форма выпуска: таблетки, содержащие 0,25 г левопы и 0,025 г карбидона.

**Золпидем** - снотворное средство из группы имидазопиридинов. Действующее вещество - золпидема гемитартрат. Оказывает седативное, незначительно выраженное анксиолитическое, противосудорожное и центральное миорелаксирующее действие. Возбуждает бензодиазепиновые рецепторы (омега) в альфа-субъединице ГАМК-рецепторных комплексов. Применяют при нарушениях сна: затрудненном засыпании, ранних и ночных пробуждениях внутрь (непосредственно перед сном) в разовой дозе 10 мг. У пожилых или ослабленных пациентов, при нарушении функции печени лечение начинают с дозы 5 мг. Курс лечения не должен превышать 4 нед. При преходящей бессоннице рекомендуемый курс лечения - 2-5 дней, при ситуационной - 2-3 нед. Форма выпуска: таблетки, покрытые оболочкой по 10 мг.

## **ПСИХОТОНИЧЕСКИЕ, АНТИДЕПРЕССАНТЫ, ОБЩЕТОНИЗИРУЮЩИЕ СРЕДСТВА**

Психотонические (психотропные, психостимулирующие средства), оказывают возбуждающее и стимулирующее действие на центральную нервную систему, в результате чего повышается физическая и умственная работоспособность, бодрость, устраняется сонливость, прилив сил и энергии.

Среди психостимуляторов наиболее распространенным средством являясь кофеин (кофеина бензоат натрия) – один из алкалоидов (производное ксантина), содержащихся в листьях чая, плодах кофе, орехах кола. Широко распространены тонизирующие напитки, содержащие кофеин (кофе, чай), которые употребляются с учетом их общетонизирующих свойств. Кроме того, кофеин получают синтетически.

Кофеин является психостимулятором и аналептиком, обладающим общетонизирующими свойствами. Психостимулирующее действие кофеина проявляется в уменьшении чувства усталости, повышении работоспособности, взбадривающем эффекте. Механизм действия кофеина заключается в усилении процессов возбуждения в коре головного мозга. Кроме того, кофеин является ингибитором фосфодиэстеразы, что способствует накоплению циклического аденозинмонофосфата (цАМФ), увеличению гликогенолиза (расщепление гликогена до глюкозы и глюкозы - 6 - фосфата в печени) и липолиза (расщепление жиров на составляющие компоненты).

Кофеин применяется в качестве стимулятора дыхания при его угнетении, а также при шоковых состояниях, коллапсе и пр. Кофеин усиливает обмен веществ в организме, а также секреторную функцию желез внутренней секреции, в том числе выработку адреналина надпочечниками. Следствием этого является усиление сердечной деятельности, повышение артериального давления, увеличение уровня глюкозы в крови. Кроме того, кофеин непосредственно усиливает сердечные сокращения, возбуждает дыхательный и сосудодвигательный центры.

Действие кофеина на сосуды является несколько парадоксальным. Расширяя коронарные сосуды сердца, головного мозга, почек и поперечнополосатой мускулатуры, кофеин суживает периферические сосуды, в частности - сосуды брюшной полости, вследствие возбуждения сосудодвигательного центра. Такое двойное действие приводит к тому, что пониженное артериальное давление под воздействием кофеина повышается, а

нормальное существенно не изменяется. Расширение сосудов головного мозга способствует уменьшению головной боли при мигрени.

Под влиянием кофеина усиливается секреторная активность желудка, умеренно повышается диурез (за счет угнетения процесса реабсорбции ионов натрия в почечных канальцах).

При передозировке (в том числе, неумеренном употреблении тонизирующих напитков) может наступить истощение нервных клеток, следствием чего является повышенная возбудимость, раздражительность, бессонница.

Кофеин противопоказан при гипертонии, атеросклерозе, бессоннице, повышенной нервной возбудимости.

Психостимулирующее средство – **фенамин**, является представителем обширной группы психотропных лекарственных средств – амфетаминов. Фенамин является сильным психостимулирующим средством, повышающим умственную и физическую работоспособность, придающим ощущение бодрости, прилива сил, состояние восторженной, деятельной эйфории. Фенамин уменьшает чувство голода, значительно снижает потребность во сне, возбуждает дыхательный центр, стимулирует сердечную деятельность, суживает сосуды и повышает артериальное давление, повышает концентрацию глюкозы в крови.

Первоначально фенамин и его производные достаточно широко применялись в медицине в качестве аноректиков (средств, снижающих аппетит), а также в качестве психостимуляторов при переутомлении, или при выполнении работы, требующей повышенной концентрации внимания (например, водителями автотранспорта).

Однако, вскоре был выявлен ряд негативных побочных эффектов этих веществ. Так, было установлено, что после состояния деятельного возбуждения следовала длительная стадия апатии и упадка сил. Такой эффект последствия производных фенамина связан с механизмом фармакологического действия веществ этой группы, при котором источником энергии стадии возбуждения являются энергетические ресурсы организма, которые под действием производных фенамина расходуются вследствие ускорения внутриклеточных обменных процессов. Поэтому прекращение действия препарата ведет к упадку сил и потребности восполнить затраченные энергетические запасы. Кроме того, выяснилось, что препараты группы фенамина достаточно быстро вызывают лекарственную (психическую) зависимость, при которой появляется непреодолимое желание вновь употребить очередную дозу вещества для восстановления бодрого и деятельного состояния.

В отдельных случаях производные фенамина действуют парадоксально, и вместо возбуждающего действия на ЦНС вызывают ее угнетение и депрессивные состояния.

### Общая структура психостимулирующих средств

**ПСИХОСТИМУЛЯТОРЫ**  
уменьшение чувства усталости,  
сонливости, повышение умственной  
и физической трудоспособности

Представители: кофеин, фенамин (уменьш. голод)  
Усиливают процессы возбуждения в головном мозге, повышает обмен веществ, секрецию адреналина вследствие чего усиливается работа сердца, возбуждаются дыхательный и сосудодвигательный центры, расширяет сосуды сердца, мозга, почек но сужает сосуды брюшной полости, повышает АД (при пониженном), умеренно усиливает диурез. При передозировке: нервно-психич. расстройства: бессонница, раздражительность.

В настоящее время фенамин и его производные не применяются в медицинской практике. Большинство из них входит в Список психотропных средств Комитета по контролю наркотиков в Украине и запрещены в легальном обороте.

### АНТИДЕПРЕССАНТЫ

К группе антидепрессантов относятся вещества, устраняющие депрессивные состояния (чувство тоски, тревоги, подавленности, безнадежности).

Некоторые лекарственные препараты этой группы способны оказывать как психостимулирующее так и седативное действие. Такие вещества используются в психиатрии для лечения маниакально депрессивных психозов, для которых характерна резкая смена состояний от депрессивного до возвышенного, беззаботного и веселого.

По механизму действия антидепрессанты делятся на группы:

- Ингибиторы MAO (моноаминоксидазы);
- Трициклические антидепрессанты

MAO или моноаминоксидаза - фермент, принимающий участие в разрушении медиаторов, нейромедиаторов, гормонов. Существует два типа MAO: MAO А, субстратами для которой являются: адреналин, норадреналин, серотонин, дофамин, гистамин и пр. и MAO Б, субстратами для которого являются: фенилэтиламин и дофамин.

В группу антидепрессантов - ингибиторов MAO входит достаточно большое количество веществ, которые являются эффективными антидепрессантами. Ингибиторы MAO делятся на две группы: неселективные ингибиторы необратимого действия и селективные ингибиторы или ингибиторы MAO обратимого действия.

#### Структура антидепрессантов



Необратимые ИMAO взаимодействуют с моноаминоксидазой, образуя с ней химические связи. Фермент после этого оказывается неспособным выполнять свои функции и метаболизируется, а вместо него организмом синтезируется новый, на что обычно уходит около двух недель. Необратимые ИMAO обладают высокой токсичностью.

Обратимые ИMAO, связываясь с активным центром фермента, образуют с ним относительно стабильный комплекс. Этот комплекс постепенно диссоциирует, высвобождая ИMAO, который далее поступает в кровь и выводится из организма, оставляя фермент неповрежденным.

Кроме того, ингибиторы MAO делят на селективные ИMAO (ингибируют главным образом какой-либо один из типов MAO), неселективные (оба типа).

Необратимые ИMAO являются неселективными. В связи с высокой токсичностью, из веществ этой группы используется относительно небольшое количество лекарственных

средств (например, ниаламид). Ниаламид оказывает стимулирующее действие на ЦНС, является эффективным антидепрессантом.

К веществам из группы обратимых селективных ингибиторов МАО А - относится пиразидол. В отличие от неселективных ИМАО необратимого действия - ингибиторы МАО А вызывают меньше негативных побочных эффектов.

Вещества группы трициклических антидепрессантов не влияют на активность МАО. Механизм их действия заключается в стимулировании адренергических процессов в мозге человека, за счет торможения обратного захвата норадреналина пресинаптическими мембранами, а также воздействие на процессы обмена серотонина в ЦНС.

К веществам этой группы относятся: имизин, амитриптилин, азафен, флуоксетин, дезипрамин и др. Имизин и амитриптилин являются основными представителями веществ этой группы. Эти препараты являются достаточно эффективными средствами при лечении депрессивных состояний.

Трициклические антидепрессанты могут вызывать ряд негативных побочных эффектов: головные боли, головокружения, сердцебиение. Эти препараты не назначают одновременно с ингибиторами МАО и препаратами щитовидной железы.

### **ПРЕПАРАТЫ ЛИТИЯ**

При лечении маниакально депрессивных психозов достаточно эффективными являются препараты лития (лития карбонат). Препараты лития обладают способностью купировать маниакальные возбуждения у психически больных, устраняя маниакальные состояния и ажитацию (сильное эмоциональное возбуждение, сопровождаемое чувством тревоги и страха и переходящее в двигательное беспокойство, потребность в движении, либо речевое беспокойство, часто не осознаваемые).

Механизм действия соединений лития связан со способностью активно влиять на нейрохимические процессы (в том числе в головном мозге). Препараты лития обладают способностью уменьшать количество свободного норадреналина и серотонина, тормозят транспорт ионов натрия в нервных и мышечных клетках, повышают чувствительность нейронов к действию дофамина.

### **ОБЩЕТОНИЗИРУЮЩИЕ СРЕДСТВА**

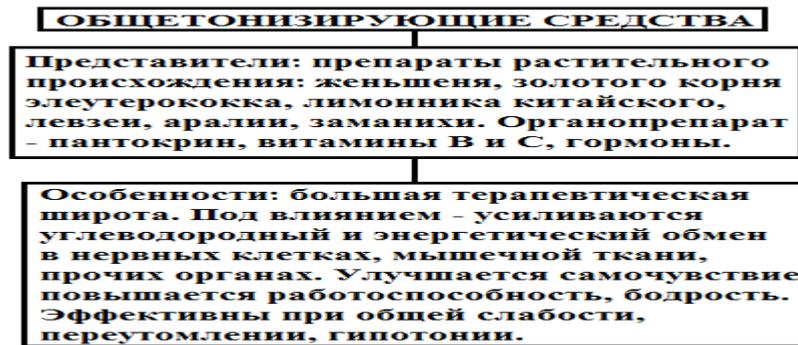
Общетонизирующие средства улучшают самочувствие, повышают умственную и физическую работоспособность, бодрость, восстанавливают аппетит, повышают потенцию у мужчин.

Механизм действия общетонизирующих средств заключается в нормализации и усилении обменных процессов, активизации и улучшении углеводного и энергетического обмена в нервных волокнах, мышечной ткани и внутренних органах. В отличие от средств группы фенамина, общетонизирующие средства не вызывают нервного истощения, стадия апатии и упадка сил после их употребления отсутствует.

В качестве общетонизирующих средств используют препараты растительного происхождения: женьшень, аралию, элеутерококк, китайский лимонник, золотой корень, заманиху и др. Общетонизирующими свойствами обладают некоторые гормоны и витамины (В, С).

Общетонизирующие средства растительного происхождения не оказывают токсического действия, эффект последствия также отсутствует. Средства этой группы не вызывают пристрастия и привыкания. Тонизирующий эффект не вызывает нервного и психического возбуждения.

## Структура общетонизирующих средств



Особенностью действия общетонизирующих средств является их большая широта терапевтического действия. Токсического действия вещества этой группы не проявляют, несмотря на длительные сроки применения.

### Краткая характеристика лекарственных препаратов:

**Амитриптилин** - трициклический антидепрессант из группы неизбирательных ингибиторов нейронального захвата моноаминов. Обладает выраженным тимоаналептическим и седативным действием. Механизм антидепрессивного действия амитриптилина связан с угнетением обратного нейронального захвата катехоламинов (норадреналина, дофамина) и серотонина в ЦНС. Применяют при депрессиях любой этиологии. Особенно эффективен при тревожно - депрессивных состояниях, в силу выраженности седативного эффекта. Не вызывает обострения продуктивной симптоматики (бреда, галлюцинаций) в отличие от антидепрессантов со стимулирующим действием. Смешанные эмоциональные расстройства и нарушения в поведении, фобические расстройства.

Назначают внутрь (во время или после еды). Начальная суточная доза при приёме внутрь составляет 50-75мг (25мг в 2-3 приёма), затем дозу постепенно увеличивают на 25-50мг, до получения желаемого антидепрессивного эффекта (максимальная часть дозы принимается на ночь).

Форма выпуска: таблетки 25 мг; раствор для инъекций 10 мг/мл в ампулах.

**Настойка женьшеня** - общетонизирующее средство растительного происхождения - оказывает адаптогенное, метаболическое, биостимулирующее, противорвотное, общетонизирующее действие, стимулирует аппетит. Фармакологическая активность обусловлена содержанием сапониновых гликозидов-гинсеноидов (панаксозиды А и В, панаквилон, панаксин), эфирных и жирных масел, стеролов, пептидов, витаминов и минералов. Стимулирует ЦНС, уменьшая общую слабость, повышенную утомляемость, сонливость, повышает АД, умственную и физическую работоспособность; стимулирует половую функцию. Снижает содержание холестерина и глюкозы в крови, активизирует деятельность надпочечников. Применяют при астении, неврастении (в т.ч. после перенесенных инфекционных истощающих заболеваний, при ослаблении половой функции), психическом и физическом перенапряжении, пожилом возрасте, чрезмерной утомляемости, артериальной гипотензии, для повышения работоспособности и сопротивляемости организма внутрь, за 30-40 мин до еды, по 30-50 кап настойки 2-3 раза в день. Максимальная суточная доза для взрослых - 200 кап. Капсулы назначают внутрь,

во время еды, по 0,5-1 г (в пересчете на сухой стандартизированный экстракт женьшеня) 2-3 раза в день, в течение 25-30 дней. При необходимости проводят повторные курсы лечения с перерывом в 2 нед.

**Глицин** – антидепрессант - заменимая аминокислота. По современным данным, является центральным нейромедиатором (передатчиком нервного возбуждения) тормозного типа действия. Оказывает седативное действие (успокаивающее на центральную нервную систему). Улучшает метаболические процессы (обменные процессы) в тканях мозга. Оказывает положительное влияние при мышечных дистрофиях (уменьшении объема и силы мышц). Рекомендован для применения как средство, ослабляющее влечение к алкоголю, уменьшающее явления абстиненции, депрессивные нарушения (состояния подавленности), повышенную раздражительность, нормализующее сон, а также при других явлениях у больных хроническим алкоголизмом.

Назначают глицин в виде таблеток под язык. Больным хроническим алкоголизмом при купировании (снятии) запоя назначают 1 таблетку препарата, затем через 20 мин - вторую, через 60 мин - третью и в последующем в течение суток по 1 таблетке 3-4 раза. При синдроме похмелья препарат применяют 5-7 дней по 1 таблетке 2 раза в день и в последующем (как курсовое лечение) в течение 6-15 дней по 1 таблетке утром.

Форма выпуска: таблетки по 0,1 г.

**Флуоксетин** – антидепрессант - способен селективно подавлять обратный захват серотонина, минимально влияя на обмен норадреналина, ацетилхолина и дофамина. Препарат снижает тревожность, уменьшает чувство страха и напряженности. Не оказывает токсического влияния на сердце. Полный терапевтический эффект от приема флуоксетина наступает в течение 1-2 недель. Применяют при депрессиях различной степени тяжести, комплексной терапии алкоголизма, расстройстве аппетита (булимии и анорексии), навязчивых состояниях.

При депрессии рекомендован прием 20 мг (1табл.) флуоксетина ежедневно утром, при недостаточной эффективности возможно увеличение дозы до 40 мг в сутки (2 таблетки). При булимии рекомендованная доза 60 мг (3 таблетки), при навязчивых состояниях 20-60 мг (1-3 таблетки). Курс терапии определяется в зависимости от нозологии и степени тяжести состояния, минимальный курс составляет 3-4 недели.

Форма выпуска: капсулы 20 мг.

**Имизин** - антидепрессант (тимолептик) - увеличивает концентрацию норадреналина в синапсах и/или серотонина в ЦНС (снижение их обратного всасывания). Накопление этих нейромедиаторов происходит в результате ингибирования обратного захвата их мембранами пресинаптических нейронов. Имизин применяется в психиатрии для лечения. Прием внутрь обычно начинают с дозы 0,025 г 3-4 раза в день, постепенно увеличивая суточную дозу препарата до 0,15-0,25-0,30 г, после чего дозу постепенно снижают. В некоторых случаях лечение начинают с ударных доз препарата - 0,075–0,10 г в день. Поддерживающая доза - 0,05–0,10 г в сутки. Курс лечения строго индивидуален до 2-3 месяцев.

Форма выпуска: драже и таблетки по 0,025 г; 1,25% раствор в ампулах по 1 мл и 2 мл.

**Ниаламид** - антидепрессант - неизбирательный и необратимый ингибитор МАО I поколения. Улучшает общее состояние и познавательные (когнитивные) функции больных с депрессией, уменьшает частоту и интенсивность приступов стенокардии. Терапевтический эффект проявляется через 7-14 дней. Применяют при депрессии (инволюционной, невротической, циклотимической, в т.ч. сопровождающейся вялостью, заторможенностью, безынициативностью), хроническом алкоголизме, в составе комбинированной терапии – при невралгии тройничного нерва, стенокардии.

Назначают внутрь, после еды - по 50-75 мг/сут в 2 приема (утром и днем), с постепенным увеличением дозы на 25-50 мг/сут до 200-350 мг/сут. После наступления терапевтического эффекта дозу постепенно снижают. Длительность лечения - 1-6 мес.

Форма выпуска: таблетки по 0,025 г

**Лития карбонат** - антидепрессант (препарат лития) - понижает возбудимость центральной нервной системы, оказывает седативное (успокаивающее) и антиманиакальное действие. Применяют при маниакальных состояниях (неадекватно повышенном настроении, ускоренном темпе мышления, психомоторном возбуждении) различного генеза (происхождения).

Назначают при маниакальных состояниях внутрь, начиная с 0,6 г в день с постепенным повышением дозы в течение 4-5 дней до 1,5-2,1 г в 2-3 приема; в профилактических целях - 0,6-1,2 г в сутки, под контролем концентрации препарата в крови.

Форма выпуска: таблетки по 0,3 г.

### АНАЛЕПТИКИ, АДАПТОГЕНЫ, НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА

К аналептикам относятся вещества, возбуждающие центры головного (продолговатого) мозга, прежде всего сосудодвигательный и дыхательный. Как правило, лекарственные препараты этой группы обладают достаточно широким спектром фармакологического действия. Многие аналептики относятся к высокотоксичным веществам (к так называемым судорожным ядам).

Представителями группы аналептиков являются такие вещества как: кордиамин, камфора, бемеград, углекислый газ, кофеин, коразол. Стимулирующее действие на дыхательный центр оказывают лобелин, цититон, этимизол, а также стрихнин (в незначительных дозах).

Аналептики являются антагонистами наркотических, снотворных средств, наркотических анальгетиков, барбитуратов, прочих веществ, угнетающих центральную нервную систему, вследствие чего некоторые из них могут применяться в качестве антидотов при отравлениях этими средствами.

Лекарственные средства группы аналептиков различаются между собой по механизму действия. Некоторые из них, такие как: коразол, кофеин, бемеград, камфора, стрихнин, кордиамин, оказывают прямое действие на центры головного мозга (дыхательный и сосудодвигательный центры). Другие, такие как цититон и лобелин, оказывают такое действие опосредовано, рефлекторно (через рецепторы синокартикоидной зоны). Такие вещества, как углекислый газ (карбоген), оказывают смешанное действие (как прямое, так и рефлекторное).

К аналептикам, действующим непосредственно на дыхательный центр относится лекарственное средство - **этимизол**. Этимизол оказывают продолжительное стимулирующее действие на дыхательный и сосудодвигательный центры. Кроме того,

этимизол обладает транквилизирующими свойствами и может применяться, в том числе, в психиатрической практике, а также как средство, усиливающее действие наркотических средств (для премедикации, а так же после проведения хирургических операций).

К аналептикам прямого действия относится **камфора**. Это лекарственное средство, наряду с центральным аналептическим действием оказывает прямое стимулирующее действие на сердце, а также повышает чувствительность миокарда к действию адреналина. В медицинской практике широко используются медицинские препараты камфоры – сульфокамфокаин (водорастворимый), а также масляный раствор камфоры для подкожных инъекций, которые применяются в качестве стимуляторов дыхания и сердечной деятельности (кардиотонических средств).

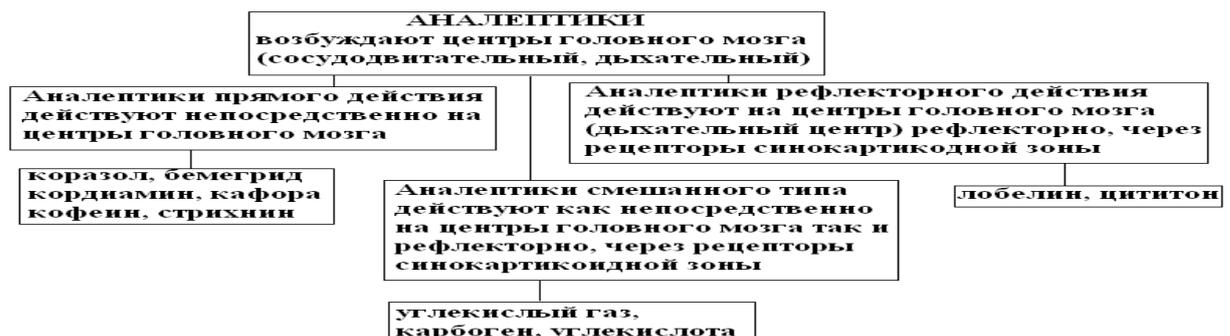
Более фармакологически активным, но, вместе с тем, и более токсичным является лекарственное аналептическое средство центрального действия – коразол, применение которого может вызвать клонические судороги.

Углекислый газ является естественным стимулятором дыхания организма, возбуждая дыхательный центр непосредственно и опосредованно, через рецепторы синокартикоидной зоны. Повышение процента углекислого газа в крови оказывает возбуждающее действие на дыхательный центр, воздействуя на хемо и механорецепторы, обеспечивающих нормальную работу дыхательного центра в соответствии с потребностями организма в обмене газов. Основным регулятором активности центрального дыхательного механизма является афферентная сигнализация о газовом составе крови, которая поступает от центральных (бульбарных) и периферических (артериальных) хеморецепторов.

Главный стимул, управляющий дыханием - **высокое содержание  $\text{CO}_2$**  (гиперкапния) в крови и в внеклеточной жидкости мозга. Чем сильнее возбуждение бульбарных хемочувствительных структур и артериальных хеморецепторов, тем выше происходит вентиляция. Механорецепторы дыхательной системы, во-первых, участвуют в регуляции параметров дыхательного цикла - регуляции глубины вдоха и его продолжительности; во-вторых, эти рецепторы являются рецепторами рефлексов защитного характера - кашля. Смесь углекислого газа и кислорода – карбоген (5%  $\text{CO}_2$ ; 95%  $\text{O}_2$ ).

К аналептикам, возбуждающим дыхательный центр рефлекторно (воздействуя на рецепторы синокаротидной зоны), относятся лекарственные препараты лобелин, цититон и пр. Эти лекарственные средства эффективны только при сохранении возможности передачи нервного возбуждения от синокаротидной зоны на дыхательный центр (сохранении возможности рефлекторной возбудимости дыхательного центра). В случае, если такая передача прерывается (например, при отравлении наркотическими или наркотическими средствами), лекарственные препараты этой группы не эффективны.

### Структура средств аналептического действия



К аналептикам, действующим преимущественно на нервные клетки спинного мозга, относятся стрихнин, секуренин и некоторые другие средства растительного происхождения.

Стрихнин – алкалоид растений рода (*Strychnos*). В медицине находят применение стрихнинсодержащие препараты: экстракт и настойка чилибухи, а также нитрат стрихнина.

Стихнин оказывает стимулирующее действие на центры продолговатого мозга (дыхательный и сосудодвигательный) но преимущественно действует на спинной мозг, улучшая проведение нервных импульсов, а также оказывает тонизирующее действие на скелетную мускулатуру, улучшает функции органов чувства – зрение, слух, обоняние. Стрихнин применяется в медицине в качестве средства при лечении параличей, гипотонии, нарушениях органов чувств. Однако медицинское применение стрихнина ограничено в связи с его высокой токсичностью. Меньшей токсичностью обладает секуренин (алкалоид секуринеги полукустарниковой).

Стрихнин и секуренин относятся к так называемым «судорожным ядам». При отравлении этими веществами клиническая картина напоминает острое инфекционное заболевание – столбняк (отравление столбнячным токсином). Во время отравления тело прогибается дугой (опистотонус), возникают тяжелые приступы тонических судорог. В качестве средств медикаментозной помощи в этом случае применяются миорелаксанты (с подключением к аппарату искусственного дыхания). Кроме того необходимо удалить ядовитое вещество из организма путем промывания желудка раствором перманганата калия (1:1000), ввести активированный уголь. Для ускорения выведения ядовитого вещества применяют слабительные и диуретические средства.

## НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА

Ноотропные вещества (метаболические стимуляторы) это лекарственные средства, способные улучшать обменные процессы и кровоснабжение в головном мозге, а также память и умственную работоспособность.

Одним из наиболее широко распространенных ноотропных средств является лекарственный препарат пирацетам (ноотропил), сходный по химическому строению с гамма-аминомасляной кислотой (ГАМК). Гамма-аминомасляная кислота является биогенным веществом, содержится в ЦНС и принимает участие в нейромедиаторных и метаболических процессах в мозге. ГАМК относится к важнейшему тормозному нейромедиатору центральной нервной системы человека, под влиянием ГАМК активируются энергетические процессы мозга, повышается дыхательная активность тканей, улучшается усвояемость мозгом глюкозы, улучшается кровоснабжение.

### Структура ноотропных средств

#### НООТРОПНЫЕ СРЕДСТВА

Улучшают кровоснабжение и обменные процессы в головном мозге, а также память и умственную работоспособность. Эффективны только при длительном применении у больных с нарушением мозгового кровообращения. Не эффективны при применении здоровыми людьми. Применяются длительно (не менее 2 месяцев)

Представитель: пирацетам (ноотропил), сходный по химическому строению с гамма – аминномасляной кислотой (ГАМК). ГАМК важный тормозной нейромедиатор центральной нервной системы, под влиянием которой активируются энергетические процессы мозга, повышается дыхательная активность тканей, улучшается усвояемость мозгом глюкозы, улучшается кровоснабжение. Препараты сходные с пирацетамом по химическому строению: амinalон, фенибут, пантогам, пикамилон др.

К препаратам этой группы относятся также: аминалон, фенибут, пантогам, пикамилон пр. По своему химическому строению большинство этих веществ имеет сходство с пирацетамом, хотя и имеют некоторые различия в фармакологическом действии.

Особенностью действия ноотропных препаратов является то, что эти средства практически не оказывают влияния на здорового человека. Данные вещества действуют только при острых и хронических нарушениях мозгового кровообращения, снижении умственной работоспособности, последствиях интоксикации (например, этиловым спиртом), астеническом синдроме и прочих подобных состояниях, а лечебный эффект при применении этих средств достигается только после длительного их применения (не менее двух месяцев). Длительное применение ноотропных средств, как правило, не вызывает побочных эффектов.

### **СРЕДСТВА, УЛУЧШАЮЩИЕ МОЗГОВОЕ КРОВООБРАЩЕНИЕ**

Головной мозг человека чрезвычайно чувствителен к недостатку кислорода. При прекращении поступления кислорода в головной мозг, в течение нескольких секунд человек теряет сознание, через 5 – 6 минут нервные клетки мозга начинают интенсивно и необратимо отмирать. Повышенная чувствительность мозговых нервных клеток связана с отсутствием в головном мозге каких либо запасов питательных веществ (гликогена). Вместе с тем, чрезмерное поступление крови в мозг ведет к повышению внутричерепного давления, что сопровождается головными болями, а также может привести и к другим негативным последствиям (например, геморрагическому инсульту).

Поэтому, для нормальной жизнедеятельности головного мозга человека чрезвычайно важным является поддержание баланса или стабильности кровотока (ауторегуляции), который не должен зависеть от колебаний артериального давления. Механизм ауторегуляции достаточно сложен и включает ряд факторов, среди которых основными являются: миогенный (связанный с работой сердца), метаболический (связанный с обменными процессами в клетках), нейрогенный (связанный с иннервацией и нейрорегуляцией) и пр.

Сосуды мозга способны путем ауторегуляторных механизмов поддерживать кровотоки на относительно стабильном уровне при изменениях системного АД в пределах 60 - 180 мм рт.ст. При подъеме АД выше 180 мм рт.ст. возможно резкое расширение артерий мозга, сопровождающееся нарушением функций гематоэнцефалического барьера, возникновением отека и возрастанием интенсивности мозгового кровотока. При относительном постоянстве общего мозгового кровотока локальный кровоток в различных отделах мозга не постоянен и зависит от интенсивности их функционирования. Так, при напряженной умственной работе локальный кровоток в коре головного мозга человека может возрастать в 2- 3 раза по сравнению с состоянием покоя.

При некоторых патологических состояниях (травмах, применении наркотических, гипотензивных, наркотических средств или нейролептиков) ауторегуляция может нарушиться в сторону снижения артериального давления. Ауторегуляция нарушается и при хронической артериальной гипертензии, со сдвигом в сторону более высокого артериального давления. Причиной нарушения мозгового кровообращения может быть атеросклероз сосудов головного мозга, а также тромбоз (закупорка кровеносных сосудов).

Лекарственными средствами, которые избирательно действуют на сосуды головного мозга, уменьшают их сопротивляемость и улучшают кровоснабжение мозга, являются: кавинтон, девинкан, циннаризин, ницерголин, пикамилон, сермион и пр.

К представителям этой группы препаратов относится девинкан (средство, растительного происхождения – алкалоид содержащийся в барвинке). По химическому строению к девинкану близок кавинтон. Эти лекарственные средства действуют на сосуды головного мозга, уменьшая их сопротивляемость, улучшают кровоснабжение, восстанавливают ауторегуляцию мозгового кровотока, а также нормализуют нарушенный метаболический обмен в головном мозге. Кроме того, кавинтон и девинкан оказывают умеренное гипотензивное и седативное действие, уменьшают агрегацию тромбоцитов. Кавинтон и девинкан применяют для лечения нервных и психических заболеваний, этиология которых связана с нарушениями мозгового кровообращения.

Циннаризин – лекарственный препарат, улучшающий мозговое кровообращение, применяется при различных формах нарушения мозгового кровообращения, связанного с гипертонией и атеросклерозом сосудов головного мозга.

В качестве средств, улучшающих мозговое кровообращение, могут применяться также спазмолитики миотропного действия (папаверин, дибазол, но-шпа и пр.).

Эффективным средством, расширяющим сосуды головного мозга является нитроглицерин, однако действие его кратковременно.

К средствам, улучшающим мозговое кровообращение относятся также ноотропные лекарственные препараты, производные гамма-аминомасляной кислоты (пирацетам, ноотропил, пикамилон и др.). Однако, терапевтический эффект этих препаратов наступает при их длительном применении (в течение нескольких месяцев).

Достаточно эффективным лекарственным средством, улучшающим мозговое кровообращение является - церебролизин, который представляет собой сумму аминокислот и является гидролизатом мозгового вещества.

### **Краткая характеристика лекарственных препаратов:**

**Пирацетам** - ноотропное средство - усиливает в мозге синтез дофамина, повышает содержание норадреналина. Препарат также увеличивает количество ацетилхолина на синаптическом уровне и плотность холинорецепторов. Оптимизация энергетических процессов способствует повышению устойчивости ЦНС к гипоксии и различным токсическим факторам. Пирацетам улучшает интегративную деятельность мозга, способствует консолидации памяти, улучшает процессы обучения. Препарат назначают при атеросклерозе головного мозга, сосудистом паркинсонизме, других патологических процессах с явлениями хронической церебрально-сосудистой недостаточности с нарушением памяти, внимания, речи, головокружением, при изменениях мозгового кровообращения, коматозных и субкоматозных состояниях в результате травм мозга и интоксикаций. Применяют при заболеваниях нервной системы со снижением интеллектуально-мнестических функций и нарушениями эмоционально-волевой сферы. Применяют внутрь, внутривенно. Парентерально - в/в, в начальной дозе 10 г; при тяжелых состояниях - в/в капельно, в течение 20-30 мин - до 12 г/сутки; после улучшения дозу постепенно снижают и переходят на пероральное применение. Внутрь, в начале лечения - по 800 мг в 3 приема, перед приемом пищи, при улучшении состояния разовую дозу постепенно снижают до 400 мг; кратность приема - 2 раза в сутки, при необходимости - 3-4 раза в сутки. Длительность лечения составляет от 2-3 нед до 2-6 мес.

Форма выпуска: капсулы по 0,4 г; таблетки по 0,2 г, покрытые оболочкой; 20% раствор в ампулах по 5 мл.

**Нимодипин** – средство, улучшающее мозговое кровообращение. Специфической особенностью нимодипина является его преимущественное влияние на кровоснабжение мозга, способность снижать сопротивление резистентных сосудов (артериол) мозга, улучшать мозговое кровообращение, уменьшать гипоксические (связанные с нехваткой кислорода) явления.

Нимодипин применяют как профилактическое и лечебное средство при ишемических нарушениях мозгового кровообращения (несоответствии между потребностью тканей мозга в кислороде и его доставкой с кровью).

Нимодипин назначают сразу после наступления острой ишемии (кровоизлияния под оболочки мозга) и продолжают лечение в течение 5-14 дней. В первые 2 ч взрослым вводят внутривенно (в виде медленной инфузии) по 0,001 г нимодипина 2 раза в час. Через 2 ч увеличивают дозу до 2 мг в 1 ч, следя за гемодинамикой, чтобы избежать слишком резкого снижения артериального давления. Для введения раствор разводят в изотоническом растворе натрия хлорида или 5% растворе глюкозы.

Форма выпуска: таблетки по 0,03 г; 0,02% раствор во флаконах по 50 мл для инфузий.

**Церебролизин** – средство, улучшающее мозговое кровообращение - способствует улучшению обмена веществ в мозговой ткани. Церебролизин содержит биологически активные аминокислоты и пептиды, являющиеся основными звеньями мозгового метаболизма (обмена веществ). Проникая через гематоэнцефалический барьер (барьер между кровью и тканью мозга), препарат регулирует внутриклеточный обмен и улучшает синаптическую передачу (передачу нервного возбуждения). Применяют при заболеваниях, сопровождающихся нарушениями функций центральной нервной системы (энцефалите /воспалении мозга/), нарушениях мозгового кровообращения, операциях на головном мозге, отсталости умственного развития у детей, психиатрических заболеваниях, сопровождающихся рассеянностью, ослаблением памяти и др. В острой стадии инсульта (острого нарушения мозгового кровообращения) - геморрагического (обусловленного разрывом сосудов мозга) и ишемического (обусловленного неадекватным притоком крови); при тяжелых формах менингита (гнойного воспаления оболочек мозга), энцефалита, непосредственно после тяжелых черепно-мозговых травм и нейрохирургических операций (в зависимости от степени угнетения сознания) церебролизин должен вводиться ежедневно капельно внутривенно по 10-30 мл в 100-200 мл изотонического раствора натрия хлорида в течение 60-90 минут. Данной категории больных церебролизин назначается на 10-25 дней.

Форма выпуска: в ампулах по 1 и 5 мл 5% раствора.

**Сульфокамфокаин** – аналептик. Фармакологическое действие обусловлено содержанием в препарате камфоры и новокаина. Быстро всасывается при подкожном введении (практически не дает осложнений), возможно внутривенное введение. Применяют при острой и хронической сердечной слабости, гипотонии, коллапсе (резкое падение артериального давления); для профилактики и лечения нарушений кровообращения при инфекционных заболеваниях, пневмонии, гноynom плеврите (воспалении оболочек легких), отравлениях наркотиками, снотворными. Особенно при острых состояниях

(кардиогенный и анафилактический шок, острая легочная недостаточность). Используют подкожно и внутримышечно, в острых случаях внутривенно (струйно или капельно) по 2 мл 10% раствора 2-3 раза в день.

Форма выпуска: ампулы по 2 мл 10% раствора.

**Кордиамин** - препарат группы аналептиков, стимуляторов центральной нервной системы неселективного действия. Оказывает действие преимущественно на головной мозг, в частности на дыхательный и сосудодвигательный центры в продолговатом мозге. Путем стимуляции хеморецепторов находящихся в каротидном синусе препарат способствует учащению дыхательных движений. По фармакологическим свойствам препарат является антагонистом веществ проявляющих наркотическое действие, в том числе наркотических и снотворных лекарственных средств, и может быть использован при отравлении этими препаратами. Прием препарата кордиамин приводит к учащению дыхательных движений, устраняет поверхностное дыхание, делая его более глубоким, приводит к нормализации артериального давления, способствует возвращению ясного сознания.

**Показания к применению:** Коллапс. Асфиксия, в том числе асфиксия новорожденных. Шок различной этиологии. Отравления снотворными, наркотическими препаратами, барбитуратами и другими веществами угнетающими центральную нервную систему. Нарушение кровообращения при инфекционных заболеваниях. Нарушения кровообращения неинфекционного происхождения, в том числе хронические с понижением сосудистого тонуса. Дыхательная недостаточность. Обморок.

**Способ применения:** Взрослым назначают по 15-40 капель 2-3 раза в день или 1-2мл подкожно/внутривенно/внутримышечно 2-3 раза в день. Внутривенно вводят очень медленно. Капли принимают независимо от приема пищи.

**Форма выпуска:** Раствор для инъекций в ампулах по 1 или 2мл. Раствор для перорального приема по 30мл во флаконе.

**Ницерголин** - Средство улучшающее мозговое кровообращение

**Фармакологическое действие:** Ницерголин в химическом отношении напоминает алкалоиды спорыньи. Спазмолитические свойства Ницерголина особенно выражены в отношении сосудистой периферии и мозговых артерий. Ницерголин снижает тонус легочных и мозговых артерий, увеличивая кровоток. Вследствие этого улучшается состояние больных с функциональными артериопатиями центральных и периферических сосудов, сокращается восстановительный период после ишемических атак.

**Показания к применению:** При острых и хронических нарушениях мозгового кровообращения и их последствиях, мигрени, вертиго, диабетической ретинопатии, ишемиях зрительного нерва, дистрофии роговицы, церебральном атеросклерозе. При нарушениях периферического кровообращения: диабетическая ангиопатия, болезнь Рейно, облитерирующие васкулиты, атеросклероз сосудов нижних конечностей.

**Способ применения:** Таблетки Ницерголина принимают внутрь, перед едой, запивая необходимым количеством воды. Обычная суточная доза составляет 30 мг (три таблетки). Суточную дозу принимают равными частями за 3 раза. Курс лечения определяет врач. Как правило, Ницерголин принимают не менее 2-3 мес, ориентируясь на эффективность терапии.

**Форма выпуска:** Таблетки 0,01 г, покрытые оболочкой.

**Камфора** – аналептик - возбуждает центральную нервную систему, стимулирует кровообращение и дыхание, а также оказывает положительное влияние на обменные процессы в миокарде (сердечной мышце).

**Показания к применению:** Острая и хроническая сердечная слабость, гипотония (пониженное артериальное давление), коллапс (резкое падение артериального давления); для профилактики и лечения нарушений кровообращения при инфекционных заболеваниях, пневмонии (воспалении легких), гнойном плеврите (воспалении оболочек легких), отравлениях наркотиками, снотворными.

**Способ применения:** Подкожно по 1-5 мл 20% масляного раствора.

**Форма выпуска:** 20% масляный раствор в ампулах по 1 мл и 2 мл.

**Фенибут** - ноотропное средство - фенильное производное ГАМК и фенилэтиламина. Доминирующим является его антигипоксическое и ноотропное действие. Снимает напряжение, тревожность, страх, улучшает сон; удлиняет и усиливает действие снотворных, наркотических, нейролептических и противосудорожных средств. Фенибут — ноотропное средство, которое облегчает ГАМК-опосредованную передачу нервных импульсов в ЦНС (прямое действие на ГАМК-ергические рецепторы), оказывает также транквилизирующее, психостимулирующее, антиагрегантное и антиоксидантное действие.

**Показания к применению:**•снижение интеллектуальной и эмоциональной активности, нарушение памяти, снижение концентрации внимания;•астеническое и тревожно-невротическое состояние, беспокойство, тревога, страх;•людям пожилого возраста — при нарушении сна, ночном беспокойстве;•для профилактики стрессовых состояний, которые возникают перед хирургическим вмешательством и болезненными диагностическими процедурами.

**Аминалон** - Ноотропное средство

**Фармакологическое действие:** Гамма-аминомасляная кислота (ГАМК) - биогенный амин, содержащийся в центральной нервной системе и принимающий участие в нейромедиаторных и метаболических процессах мозга. ГАМК является основным медиатором, участвующим в процессах центрального торможения в результате взаимодействия со специфическими ГАМК-ергическими рецепторами. Под влиянием препарата восстанавливаются процессы метаболизма головного мозга: активируются энергетические процессы, улучшается утилизация глюкозы, повышается дыхательная активность тканей, улучшается кровоснабжение. ГАМК способствует удалению токсических продуктов обмена, обеспечивает нормализацию динамики нервных процессов. Повышает продуктивность мышления, улучшает память, оказывает мягкое психостимулирующее действие, благоприятно влияет на восстановление движений и речи после нарушения мозгового кровообращения.

**Показания к применению:** У взрослых: состояния после нарушений мозгового кровообращения, черепно-мозговых травм; атеросклероз церебральных артерий (с явлениями размягчения мозга); >> сосудистые заболевания головного мозга (гипертоническая болезнь), особенно с головной болью, головокружениями; >> хроническая церебрально-сосудистая недостаточность с нарушением памяти, внимания, речи, головокружениями и головной болью; >> алкогольные энцефалопатия и полиневриты; >> симптомокомплекс укачивания

**Способ применения:** Препарат принимают до еды. Начальная доза для взрослых составляет 0.5 г 2 раза в день, на 3-5 день после начала курса лечения дозу можно увеличить до 1 г 2 раза в день. Детям в возрасте от 1 года до 3 лет назначают по 1 г в сутки; от 4 до 6 лет - 1.5 г в сутки; старше 7 лет - 2 г в сутки. При необходимости через 6-8 мес. проводят повторные курсы лечения. Для устранения симптомокомплекса укачивания (морская, воздушная болезнь) препарат назначают взрослым по 0.5 г и детям по 0.25 г 2 раза в день в течение 3-4 дней. С профилактической целью взрослым назначают по 0.5 г 2 раза в день в течение 3 дней, предшествующих возможному укачиванию, и в той же дозе непосредственно перед использованием транспортом.

**Форма выпуска:** По 6 или 12 таблеток в контурной ячейковой упаковке.

**Циннаризин** - средство улучшающее мозговое кровообращение

**Фармакологическое действие:** Циннаризин положительно влияет на мозговое, периферическое и коронарное (сердечное) кровообращение; улучшает микроциркуляцию. Повышает способность эритроцитов к деформации (повышению пластичности) и уменьшает повышенную вязкость крови. Повышает устойчивость тканей к гипоксии (недостаточному снабжению тканей кислородом или нарушению его усвоения). Препарат оказывает непосредственное спазмолитическое (снимающее спазмы) действие на кровеносные сосуды, уменьшает их реакцию на биогенные сосудосуживающие вещества. Потенцирует (усиливает) действие на сосуды мозга CO<sub>2</sub> (оксида углерода).

**Показания к применению:** Как цереброваскулярное (влияющее на сосуды мозга) средство назначают при нарушениях мозгового кровообращения, связанных со спазмом (резким сужением просвета) сосудов, атеросклерозом, перенесенными черепно-мозговыми травмами, инсультом. Препарат уменьшает цереброастенические явления (ослабление функции мозга), головную боль, шум в ушах, улучшает общее состояние. Назначают циннаризин при мигрени, болезни Меньера (болезни внутреннего уха).

**Способ применения:** Принимают циннаризин внутрь после еды: при нарушениях мозгового кровообращения - обычно по 25 мг (1 таблетка) 3 раза в день или по 75 мг (1 капсула) 1 раз в день; при нарушениях периферического кровообращения - по 50-75 мг (2-3 таблетки) 3 раза в день или по 2-3 капсулы (по 75 мг в каждой) в день. Применяют препарат относительно длительно (курсами от нескольких недель до нескольких месяцев).

**Форма выпуска:** Таблетки по 0,025 г (25 мг); капсулы по 75 мг циннаризина (стугерон форте), а также в виде капель во флаконах с содержанием 75 мг циннаризина.

**Кофеин-бензоат натрия** -Аналептик

**Фармакологическое действие:** По фармакологическим свойствам аналогичен кофеину и применяется в тех же случаях.

**Показания к применению:** Угнетение центральной нервной системы, отравление наркотическими средствами, недостаточность сердечно-сосудистой системы.

**Способ применения:** Назначают внутрь по 0,1-0,2 г 2-3 раза в день, подкожно - по 1-2 мл 10% и 20% раствора.

**Противопоказания:** Повышенная возбудимость, бессонница, выраженная гипертония (стойкий подъем артериального давления), атеросклероз, органические заболевания сердечно-сосудистой системы, старческий возраст, глаукома (повышение внутриглазного давления).

**Форма выпуска:** Порошок; таблетки по 0,075 г (для детей); таблетки по 0,1 и 0,2 г; ампулы 10% раствора по 1 мл и 2 мл; ампулы 20% раствора по 1 и 2 мл.

**Тиоцетам** - средство улучшающее мозговое кровообращение - комбинированный лекарственный препарат группы цереброактивных лекарственных средств. Тиоцетам имеет широкий спектр фармакологической активности, обладает выраженным ноотропным, противоишемическим, мембраностабилизирующим и антиоксидантным действием. Кроме того, препарат стимулирует синтез некоторых нейромедиаторов центральной нервной системы. В состав препарата входят два активных компонента – пирацетам и тиотриазолин, которые взаимно усиливают фармакологические эффекты друг друга.

**Показания к применению:** Препарат в форме таблеток применяют для терапии пациентов с различными заболеваниями, которые сопровождаются нарушениями церебрального и коронарного кровообращения, в том числе: - атеросклероз мозговых сосудов, которым сопровождаются различные формы нарушений церебрального кровообращения, в том числе транзиторные и хронические нарушения мозгового кровообращения; - нарушение микроциркуляции и обменных процессов мозга, которые возникли вследствие черепно-мозговой травмы, а также нарушения обменных процессов мозга у пациентов с интоксикацией и диабетической энцефалопатией; - препарат может применяться для терапии пациентов, перенесших ишемический и геморрагический инсульт

**Способ применения:** Препарат в форме таблеток, покрытых оболочкой, Тиоцетам: Препарат предназначен для перорального применения. Таблетку рекомендуется глотать целиком, не разжевывая и не измельчая. Для достижения максимального терапевтического эффекта препарат рекомендуется принимать за 30 минут до еды.

**Форма выпуска:** Таблетки, покрытые оболочкой, Тиоцетам Форте по 10 штук в блистере, по 3 или 6 блистеров в картонной упаковке.

**ТЕСТОВЫЕ ЗАДАНИЯ**  
**(с обоснованием правильных ответов)**  
**по вышеобозначенным темам учебной дисциплины «фармакология».**

**Опиоидные и неопиоидные анальгетики**

1. У наркоманов после окончания действия наркотика возникают тяжелые психические, неврологические и соматические нарушения. Как называется этот симптомокомплекс?
- A. \* Абстинентный синдром
  - B. Тахифилаксия
  - C. Сенсбилизация
  - D. Кумуляция
  - E. Толерантность

**Обоснование правильного ответа:** Медицинское (чаще немедицинское) применение наркотических средств ведет к тяжелым психоневротическим и соматическим нарушениям, которые возникают по окончании действия наркотика. Для этого состояния характерно сильное психомоторное возбуждение, сопряженное с сильными мышечными болями, непреодолимым желанием к приему очередной дозы наркотического средства и пр., которые купируются принятием очередной дозы наркотика. Данное состояние наркоманов называется абстинентным синдромом.

2. Вы сотрудник аптечного склада. При внесении поступивших препаратов в компьютерную базу данных укажите, к какой фармакологической группе относится парацетамол.
- A. \* Ненаркотический анальгетик
  - B. Снотворное средство
  - C. Диуретическое средство
  - D. Гипотензивное средство
  - E. Антиангинальное средство

**Обоснование правильного ответа:** Парацетамол относится к группе ненаркотических анальгетиков, обладает противовоспалительным, жаропонижающим и анальгезирующим действием.

3. У наркоманов после окончания действия наркотика возникли тяжелые психические, неврологические и соматические нарушения. Как называется этот симптомокомплекс?
- A. \* Абстинентный синдром
  - B. Идиосинкразия
  - C. Сенсбилизация
  - D. Кумуляция
  - E. Толерантность

**Обоснование правильного ответа:** Медицинское (чаще немедицинское) применение наркотических средств ведет к тяжелым психоневротическим и соматическим нарушениям, которые возникают по окончании действия наркотика. Для этого состояния характерно сильное психомоторное возбуждение, сопряженное с сильными мышечными

болями, непреодолимым желанием к приему очередной дозы наркотического средства и пр., которые купируются принятием очередной дозы наркотика. Данное состояние наркоманов называется абстинентным синдромом.

4. Женщине 65 лет с переломом нижней челюсти назначили препарат из группы наркотических анальгетиков. Назовите препарат.
- A. \* Промедол
  - B. Пирацетам
  - C. Гепарин
  - D. Циннаризин
  - E. Фуросемид

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе наркотических анальгетиков относится лекарственный препарат – промедол. Промедол оказывает сильное анальгезирующее действие, по обезболивающему эффекту и влиянию на ЦНС близок к морфину.

5. У больного острое отравление морфином. Какой препарат следует ввести в качестве антидота?
- A. \* Налоксон
  - B. Лобелина гидрохлорид.
  - C. Бемегрид.
  - D. Атропину сульфат
  - E. Унитиол

**Обоснование правильного ответа:** В качестве антидота при отравлении морфином применяется лекарственный препарат налоксон. Налоксон является антагонистом наркотических средств опиоидного ряда, действуя по типу конкурентного антагонизма - блокирует опиатные рецепторы или вытесняя из них вещества группы морфина.

6. Помогите врачу выбрать наркотический анальгетик, который возможно использовать для обезболивания родов?
- A. \* Промедол
  - B. Парацетамол
  - C. Кодеину фосфат
  - D. Фентанил
  - E. Анальгин

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов для обезболивания родов наиболее рационально применить - промедол. Промедол относится к группе наркотических анальгетиков, оказывает сильное анальгезирующее действие, по силе действия и влиянию на ЦНС близок к морфину, но действие его менее продолжительно.

7. Женщине 25 лет, течение с явлениями острой интоксикации морфином был введен налоксон, вызвавший быстрое улучшение ее состояния. Каков механизм действия этого препарата?
- A. \* Блокада опиоидных рецепторов
  - B. Блокада ГАМК-рецепторов

- C. Блокада серотониновых рецепторов
- D. Блокада дофаминовых рецепторов
- E. Блокада бензодиазепиновых рецепторов

**Обоснование правильного ответа:** В качестве антидота при отравлении морфином применяется лекарственный препарат налоксон. Налоксон является опиоидным антагонистом, действует по типу конкурентного антагонизма, блокируя опиатные рецепторы или вытесняя из них вещества группы морфина.

8. Объясните своему коллеге провизору, какие показания к применению налоксона?
- A. \* Острое отравление наркотическими анальгетиками
  - B. Отравление тяжелыми металлами
  - C. Отравление сердечными гликозидами
  - D. Отравление алкалоидами спорыньи
  - E. Отравление атропина сульфатом

**Обоснование правильного ответа:** Налоксон применяется в качестве антидота при отравлении морфином и другими наркотическими анальгетиками. Налоксон является опиатным антагонистом, действует по типу конкурентного антагонизма, блокируя связывание ангонистов или вытесняя из опиатных рецепторов.

9. Во время инфаркта миокарда больному была проведена нейролептанальгезия. Выберите лекарственное средство из группы наркотических анальгетиков, которое применяют для этой цели совместно с дроперидолом:
- A. \* Фентанил
  - B. Омнопон
  - C. Промедол
  - D. Пентазоцин
  - E. Морфин

**Обоснование правильного ответа:** Фенталил – оказывает сильное, но кратковременное анальгетическое действие. Применяется для нейролептанальгезии при инфаркте миокарда в сочетании с нейролептиками, прежде всего – дроперидолом.

10. У больного острое отравление морфином. Какой препарат следует ввести в качестве антидота в данном случае?
- A. \* Налоксон
  - B. Унитиол
  - C. Сальбутамол
  - D. Атропина сульфат
  - E. Прозерин

**Обоснование правильного ответа:** В качестве антидота при отравлении морфином применяется лекарственный препарат налоксон. Налоксон является опиатным антагонистом, действует по типу конкурентного антагонизма, блокируя связывание ангонистов или вытесняя из опиатных рецепторов.

11. У наркоманов после окончания действия наркотика возникают тяжёлые психические, неврологические и соматические нарушения. Как называется этот симптомокомплекс?

- A. \* Абстинентный синдром
- B. Сенсibilизация
- C. Кумуляция
- D. Толерантность
- E. Идиосинкразия

**Обоснование правильного ответа:** Медицинское (чаще немедицинское) применение наркотических средств ведет к тяжелым психоневротическим и соматическим нарушениям, которые возникают по окончании действия наркотика. Для этого состояния характерно сильное психомоторное возбуждения сопряженное с сильными мышечными болями, которые купируются принятием очередной дозы наркотического средства. Данное состояние называется абстинентным синдромом.

12. Роженице с затяжными родами необходимо устранить болевой симптом. Какой из перечисленных ниже препаратов необходимо использовать?
- A. \* Фентанил
  - B. Диклофенак-натрия
  - C. Морфина гидрохлорид
  - D. Анальгин
  - E. Промедол

**Обоснование правильного ответа:** В данном случае препаратом выбора может быть – лекарственное средство фентанил. Фентанил – синтетический анальгетик, производное фенилпиперидина, по химической структуре сходен с промедолом, оказывает сильное, но кратковременное анальгезирующее действие.

#### **Фармакологические корректоры воспаления (НПВС).**

13. У больного 55 лет во время лечения на 4 день индометацином возникло желудочное кровотечение в результате язвы слизистой оболочки желудка. С чем связано ulcerогенное действие препарата?
- A. \* Уменьшения активности циклооксигеназы-1 (ЦОГ-1 )
  - B. Уменьшения активности циклооксигеназы-2 (ЦОГ- 2 )
  - C. Уменьшения активности липооксигеназы (ЛОГ)
  - D. Уменьшения активности тромбоксансинтетазы
  - E. Уменьшения активности простаглицлинсинтетазы

**Обоснование правильного ответа:** Язвенные заболевания желудочно-кишечного тракта, обострение язвенных заболеваний ЖКТ, желудочные кровотечения являются возможным побочным действием противовоспалительного препарата индометацина, могут проявляться при его применении, в том числе в умеренных дозах, что связано с уменьшением активности циклооксигеназы-1 (фермента, участвующего в синтезе простаноидов, влияющих на функционирование защитных механизмов слизистой ЖКТ). Следует учитывать это побочное действие индометацина при его назначении.

14. В аптеку поступил препарат нового поколения нестероидных противовоспалительных средств "мелоксикам". Укажите, какими преимуществами

владеет данный препарат, как подавляющий блокатор циклооксигеназы-2, сравнительно с другими нестероидными противовоспалительными средствами:

- A. \* Минимальное косвенное действие на пищеварительный канал
- B. Выразительный миоспазмолитический эффект
- C. Наличие интерферогенных свойств
- D. Минимальное косвенное действие на кроветворение
- E. Значительное притеснение активности протеаз

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат противовоспалительного действия меллоксим, в сравнении с прочими нестероидными противовоспалительными препаратами оказывает менее выраженное раздражающее побочное действие на желудочно-кишечный тракт. Мелоксикам относится к группе оксикамов, избирательное подавление циклооксигеназы 2 обеспечивает обезболивающий и противовоспалительный эффекты. Препарат легко и практически полностью всасывается в ЖКТ.

15. Какой механизм действия диклофенака натрия?

- A. \* Блокирует циклооксигеназу
- B. Активирует синтез фосфодиэстеразы
- C. Подавляет холинэстеразу
- D. Активирует аденилатциклазу
- E. Подавляет фосфодиэстеразу

**Обоснование правильного ответа:** Диклофенак натрия (ортофен) – лекарственный препарат, оказывающий противовоспалительное, жаропонижающее, анальгезирующее действие. По механизму действия существенную роль играет его ингибирующее влияние на синтез простагландинов, в частности блокада фермента циклооксигеназы.

16. Ответьте на вопрос своего коллеги провизора. Какой нестероидный противовоспалительный препарат относится к средствам, селективно блокирующим ЦОГ?

- A. \* Целекоксиб
- B. Анальгин
- C. Парацетамол
- D. Диклофенак-натрия
- E. Кислота ацетилсалициловая

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к нестероидным противовоспалительным средствам, селективно ингибирующим ЦОГ2 и блокирующим провоспалительные ПГ относится целекоксиб. Данный препарат оказывает противовоспалительное, жаропонижающее и анальгезирующее действие.

17. Помогите врачу подобрать препарат из группы нестероидных противовоспалительных средств. Данный препарат является ингибитором ЦОГ-2 и не оказывает раздражающего действия на ЖКТ.

- A. \* Целекоксиб
- B. Кислота ацетилсалициловая
- C. Индометацин
- D. Парацетамол
- E. Диклофенак-натрий

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к нестероидным противовоспалительным средствам, селективно ингибирующим ЦОГ-2 и блокирующим провоспалительные ПГ относится целекоксиб. Данный препарат оказывает противовоспалительное, жаропонижающее и анальгезирующее действие.

18. Пациентке с ревматоидным артритом и сопутствующей язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки необходимо назначить нестероидный противовоспалительный препарат. Какой препарат является препаратом выбора в данном случае?
- A. \* Целекоксиб
  - B. Ацетилсалициловая кислота
  - C. Парацетамол
  - D. Анальгин
  - E. Диклофенак-натрий

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов группы нестероидных противовоспалительных препаратов, препаратом выбора является – лекарственный препарат целекоксиб. Целекоксиб является ингибитором ЦОГ-2 и применяется при лечении ревматоидного артрита, кроме того данный препарат достаточно быстро всасывается и не проявляет значительного раздражающего действия на желудочно-кишечный тракт (не ингибирует ЦОГ-1, что влечет язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки).

19. Ответьте на вопрос своего коллеги провизора, какой механизм действия НПВС целекоксиба?
- A. \* Селективное ингибирование ЦОГ- 2
  - B. Блокада АПФ
  - C. Стимуляция М-холинорецепторов
  - D. Блокада H1-гистаминовых рецепторов
  - E. Стимуляция бета-2-адренорецепторов

**Обоснование правильного ответа:** Целекоксиб, относится к группе нестероидных противовоспалительных препаратов. Данный препарат применяется при лечении ревматоидного артрита. Целекоксиб является ингибитором ЦОГ-2 и применяется при лечении ревматоидного артрита, кроме того данный препарат не оказывает заметного негативного воздействия на желудочно-кишечный тракт (не ингибирует ЦОГ-1, что влечет язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки).

20. Больному для профилактики тромбообразования при лечении ИБС был назначен препарат из группы нестероидных противовоспалительных средств.
- A. \* Кислота ацетилсалициловая
  - B. Ибупрофен
  - C. Пироксикам
  - D. Кислота мефенамова
  - E. Индометацин

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственное средство – ацетилсалициловая кислота относится к группе нестероидных противовоспалительных препаратов, одновременно проявляет антиагрегантное действие, вследствие чего применяется для

лечения тромбозов. Антиагрегантное действие – способность лекарственного препарата (ацетилсалициловой кислоты) препятствовать спонтанной и индуцированной агрегации тромбоцитов. Применяется для лечения и профилактики тромбоза.

21. Вы провизор-информатор работаете в аптеке. Посоветуйте больному с обострением ревматоидного артрита обезболивающий противовоспалительный препарат, который менее всего вредит желудку.
- A. \* Целекоксиб;
  - B. Диклофенак-натрий;
  - C. Кислота ацетилсалициловая;
  - D. Ибупрофен;
  - E. Индометацин.

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов группы нестероидных противовоспалительных препаратов препаратом выбора является – лекарственный препарат целекоксиб. Целекоксиб является ингибитором ЦОГ-2 и применяется при лечении ревматоидного артрита, кроме того не оказывает заметного негативного воздействия на желудочно-кишечный тракт (не ингибирует ЦОГ-1, что влечет язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки).

22. В аптеку обратился больной с язвенной болезнью желудка, которому врач назначил ранитидин. Укажите механизм действия данного препарата?
- A. \* Блокада H<sub>2</sub>-гистаминовых рецепторов
  - B. Блокада H<sub>1</sub>-гистаминовых рецепторов
  - C. Блокада H-холинорецепторов симпатических ганглиев
  - D. Угнетение активности H<sup>+</sup>-K<sup>+</sup>-АТФ-азы
  - E. Блокада M-холинорецепторов

**Обоснование правильного ответа:** Ранитидин – противоязвенное средство, относится к группе блокаторов H<sub>2</sub> гистаминовых рецепторов, находящихся в париетальных клетках слизистой оболочки желудка, чем угнетает выделение соляной кислоты желудочного сока и способствует лечению язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки.

23. Больному, страдающему ревматизмом, врач назначил диклофенак-натрий. Вследствие обострения сопутствующего заболевания препарат был отменен. Какое заболевание является противопоказанием для назначения диклофенака-натрия?
- A. \* Язвенная болезнь желудка
  - B. Гипертоническая болезнь
  - C. Стенокардия
  - D. Сахарный диабет
  - E. Бронхит

**Обоснование правильного ответа:** Диклофенак натрия – нестероидный противовоспалительный препарат, производное фенилуксусной кислоты. В качестве побочных явлений возможны эрозийно-язвенные поражения и кровотечения желудочно-кишечного тракта. В случае побочных проявлений препарат отменяют.

24. Какой нестероидный противовоспалительный препарат относится к средствам, селективно блокирующим циклооксигеназу-2?

- A. \* Целекоксиб
- B. Диклофенак-натрий
- C. Анальгин
- D. Кислота ацетилсалициловая
- E. Парацетамол

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к средствам селективно-блокирующим циклооксигеназу 2 относится – целекоксиб. Целекоксиб обладает противовоспалительным, анальгизирующим, жаропонижающим действием, селективно ингибируя ЦОГ 2, препарат блокирует провоспалительные ПГ.

25. У больного 55 лет на 4-й день лечения индометацином возникло желудочное кровотечение. Ульцерогенное действие препарата связано с уменьшением активности такого фермента:
- A. \* Циклооксигеназа-1
  - B. Липооксигеназа
  - C. Простаглицинсинтаза
  - D. Тромбоксансинтетаза
  - E. Циклооксигеназа-2

**Обоснование правильного ответа:** Язвенные заболевания желудочно-кишечного тракта, обострение язвенных заболеваний ЖКТ, желудочные кровотечения являются возможным побочным действием противовоспалительного препарата индометацина, могут проявляться при его применении, в том числе в умеренных дозах, что связано с уменьшением активности циклооксигеназы-1 (фермента, участвующего в синтезе простаноидов, влияющих на функционирование защитных механизмов слизистой ЖКТ). Следует учитывать это побочное действие индометацина при его назначении.

26. Пациентке с ревматоидным артритом и сопутствующей язвенной болезнью двенадцатиперстной кишки необходимо назначить нестероидное противовоспалительный препарат. Какой препарат является препаратом выбора в данном случае
- A. \* Целекоксиб
  - B. Ацетилсалициловая кислота
  - C. Диклофенак натрия
  - D. Анальгин
  - E. Парацетамол

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов группы нестероидных противовоспалительных препаратов, препаратом выбора является – лекарственный препарат целекоксиб. Целекоксиб является ингибитором ЦОГ-2 и применяется при лечении ревматоидного артрита, кроме того данный препарат достаточно быстро всасывается и не проявляет значительного раздражающего действия на желудочно-кишечный тракт (не ингибирует ЦОГ-1, что влечет язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки).

27. Вы провизор-информатор работаете в аптеке. Посоветуйте больному с обострением ревматоидного артрита обезболивающий противовоспалительный препарат, который менее всего вредит желудку.

- A. \* Целекоксиб;
- B. Диклофенак-натрий;
- C. Кислота ацетилсалициловая;
- D. Ибупрофен;
- E. Индометацин.

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов группы нестероидных противовоспалительных препаратов препаратом выбора является – лекарственный препарат целекоксиб. Целекоксиб является ингибитором ЦОГ-2 и применяется при лечении ревматоидного артрита, кроме того не оказывает заметного негативного воздействия на желудочно-кишечный тракт (не ингибирует ЦОГ-1, что влечет язвенные поражения желудка и двенадцатиперстной кишки).

28. У больного 44-х лет с ревматоидным полиартритом возникло обострение пептической язвы желудка. Какое из перечисленных средств необходимо исключить из комплексной терапии?
- A. \* Индометацин
  - B. Анаприлин
  - C. Димедрол
  - D. Уродан
  - E. Атропин

**Обоснование правильного ответа:** Из перечисленных лекарственных средств обострение пептической язвы желудка мог вызвать нестероидный противовоспалительный лекарственный препарат индометацин. Язвенные заболевания желудочно-кишечного тракта, обострение язвенных заболеваний ЖКТ, желудочные кровотечения являются возможным побочным действием индометацина, могут проявляться при его применении, в том числе в умеренных дозах, что связано с уменьшением активности циклооксигеназы-1 (фермента, участвующего в синтезе простаноидов, влияющих на функционирование защитных механизмов слизистой ЖКТ).

### **Нейролептики, транквилизаторы, седативные средства.**

29. Женщина страдает неврозом, плохо спит. Какому из перечисленных средств следует отдать предпочтение при лечении бессонницы?
- A. \* Нитразепам
  - B. Фенобарбитал
  - C. Этаминал-натрий
  - D. Бромизовал
  - E. Настойка валерианы

**Обоснование правильного ответа:** Препаратом выбора будет – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бенздиазепина. Среди препаратов группы бензодиазепина, а также среди перечисленных лекарственных препаратов, нитразепам обладает наиболее выраженным снотворным действием.

30. В аптеку обратился больной, который в течение месяца принимал феназепам. Больной настаивал на приобретении еще двух упаковок этого препарата, объясняя

тем, что он без диазепама плохо себя чувствует. Что лежит в основе косвенного действия препарата, что развилась у больного?

- A. \* Лекарственная зависимость
- B. Идиосинкразия
- C. Синдром последействия
- D. Кумуляция
- E. Толерантность

**Обоснование правильного ответа:** Феназепам относится к группе транквилизаторов. Лекарственные препараты данной группы обладают успокаивающим, седативно-гипнотическим действием. При длительном их применении возникает лекарственная (психическая) зависимость от данных средств, при которой больной стремится к систематическому приему лекарственных препаратов данной группы без медицинских показателей.

31. Больному, страдающему неврозом с явлениями тревоги и страха, врач назначил диазепам. Какой фармакологический эффект препарата позволяет применять его для лечения данного заболевания?
- A. \* Анксиолитический
  - B. Противоаритмический
  - C. Противовоспалительный
  - D. Гипотензивный
  - E. Антиангинальный

**Обоснование правильного ответа:** Эффект, избирательно подавляющий чувство эмоционального напряжения, беспокойства, тревоги, страха при невротических состояниях называется - анксиолитическим эффектом.

32. Мужчина 55 лет, жалуется на бессонницу, раздражительность, общую слабость. Какой из указанных ниже препаратов целесообразно назначить в данном случае?
- A. \* Нитразепам
  - B. Аминазин
  - C. Трифтазин
  - D. Дроперидол
  - E. Амитриптилин

**Обоснование правильного ответа:** Целесообразный препарат выбора – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепа, оказывает выраженное седативное и снотворное действие.

33. Больному неврозом было назначено анксиолитическое средство, производное бензодиазепа. Назовите препарат:
- A. \* Диазепам
  - B. Атропина сульфат
  - C. Пироксикам
  - D. Ретаболил
  - E. Циклодол

**Обоснование правильного ответа:** Анксиолитические средства – транквилизаторы, психотропные средства снимают эмоциональную напряженность, подавляют тревогу,

страх, беспокойство. Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе транквилизаторов производных бензодиазепаина относится – лекарственное средство диазепам.

34. Больному с шизофренией назначен нейролептик. Какой из перечисленных препаратов принадлежит к этой группе?
- A. \* Аминазин
  - B. Целекоксиб
  - C. Анаприлин
  - D. Морфин
  - E. Пирацетам

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе нейролептиков относится лекарственный препарат – аминазин - основной представитель группы нейролептиков - лекарственных средств оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему. Для аминазина характерно антипсихотическое, седативное, миорелаксирующее действие. Антипсихотическое действие аминазина обусловлено блокадой дофаминовых D<sub>2</sub> рецепторов пусковой зоны (мезолимбической и мезокортикальной систем). Антипсихотический эффект проявляется в устранении продуктивной симптоматики психозов.

35. Благодаря какому фармакологическому эффекту диазепам применяется для лечения неврозов?
- A. \* Анксиолитическому
  - B. Анальгетическому
  - C. Диуретическому
  - D. Жаропонижающему
  - E. Антидепрессивному

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат диазепам применяется для лечения неврозов, проявляет при этом анксиолитический эффект. Анксиолитический эффект это способность подавлять страх, тревожное состояние, устранять беспокойство, внутреннее напряжение.

36. Страх, эмоциональное напряжение у больного неврозом позволили врачу подобрать препарат, снижающий эти симптомы.
- A. \* Диазепам
  - B. Карбонат лития
  - C. Сиднокарб
  - D. Ноотропил
  - E. Кофеин

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе транквилизаторов (анксиолитических средств), способных подавлять эмоциональное напряжение у больного неврозом относится лекарственное средство – диазепам.

37. Больному, 30 лет, с расстройством сна и неуравновешенностью психоэмоциональной сферы врач назначил диазепам. Чем обусловлен психоседативный эффект препарата?
- A. \* Активацией ГАМК-эргической системы
  - B. Торможением лимбической системы
  - C. Торможением ретикулярной формации
  - D. Уменьшением количества норадреналина в ЦНС
  - E. Торможением опиоидных рецепторов

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат диазепам относится к группе транквилизаторов, обладает успокаивающим, снотворным, миорелаксирующим действием. Механизм действия связан со стимулированием бензодиазепиновых рецепторов супрамолекулярного ГАМК – бензодиазепин-хлорионофор-рецепторного комплекса, приводящий к усилению ингибирующего действия ГАМК на передачу нервных импульсов.

38. Объясните больному, какой препарат, относящийся к средствам, стимулирующим ЦНС, обладает одновременно психостимулирующим и аналептическим действием?
- A. \* Кофеин
  - B. Ниаламид
  - C. Настойка женьшеня
  - D. Пирацетам
  - E. Кордиамин

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к средствам - одновременно стимулирующим ЦНС и обладающих аналептическим (возбуждающим) действиями относится – кофеин. Под действием кофеина ускоряется сердечная деятельность, поднимается кровяное давление, слегка улучшается настроение, повышается трудоспособность.

39. Больному, страдающему шизофренией, врач назначил препарат из группы нейролептиков, производных бутирофенона. Назовите препарат.
- A. \* Дроперидол
  - B. Ноотропил
  - C. Этаперазин
  - D. Аминазин
  - E. Азалептин

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов, к группе нейролептиков производных бутирофенона относится лекарственный препарат – дроперидол, применяется при психомоторном возбуждении, которое сопровождается галлюцинациями.

40. Больному с явлениями тревоги, страха, неуверенности, психического напряжения, врач назначил диазепам. Какой возможный механизм его транквилизирующего действия?
- A. \* Взаимодействие с бензодиазепиновыми рецепторами
  - B. Взаимодействие с адренорецепторами
  - C. Взаимодействие с серотониновыми рецепторами

D. Взаимодействие с дофаминовыми рецепторами

E. Взаимодействие с холинорецепторами

**Обоснование правильного ответа:** Диазепам относится к анксиолитическим средствам – транквилизаторам. Транквилизаторы - психотропные средства, снимающие эмоциональную напряженность, подавляющие тревогу, страх, беспокойство. Механизм действия диазепама обусловлен стимуляцией бензодиазепиновых рецепторов, что приводит к усилению ингибирующего действия ГАМК (ингибитора пред- и постсинаптического торможения во всех отделах ЦНС) на передачу нервных импульсов.

41. Больному с неврозом назначено анксиолитическое средство, производное бензодиазепаина. Назовите этот препарат:

A. \* Диазепам

B. Целекоксиб

C. Ретаболил

D. Атропина сульфат

E. Леводопа

**Обоснование правильного ответа:** В данном случае препаратом выбора является лекарственное средство – диазепам. Диазепам относится к анксиолитическим средствам – транквилизаторам. Транквилизаторы - психотропные средства, снимающие эмоциональную напряженность, подавляющие тревогу, страх, беспокойство.

42. Больному для купирования судорожного синдрома был назначен препарат из группы бензодиазепаина. Назовите этот препарат:

A. \* Диазепам

B. Леводопа

C. Кофеин бензоат натрия

D. Суксаметоний хлорид

E. Налоксон

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных препаратов лекарственное средство из группы бензодиазепаина, применяемое для купирования судорожного синдрома – диазепам. Данный препарат относится к группе анксиолитических средств (транквилизаторов), психотропных средств которые снимают эмоциональную напряженность, подавляют тревогу, страх, беспокойство. Препарат обладает также противосудорожным и миорелаксирующим действием.

43. Студенту врач назначил тонизирующее средство. Настойка какого лекарственного растения может быть предложена в данном случае?

A. \* Родиола розовая

B. Акация белая

C. Наперстянка пурпурная

D. Тысячелистник обыкновенный

E. Ортосифон тычиночный

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных средств растительного происхождения тонизирующим действием обладает настойка из родиолы розовой (золотого корня). Применяется в качестве стимулятора центральной нервной

системы при астенических и невротических состояниях, повышенной утомляемости, пониженной работоспособности и пр.

### **Снотворные, противосудорожные, антипаркинсонические средства**

44. Женщина страдает неврозом, плохо спит. Какому из перечисленных средств следует отдать предпочтение при лечении бессонницы?
- A. \* Нитразепам
  - B. Фенобарбитал
  - C. Этаминал-натрий
  - D. Бромизовал
  - E. Настойка валерианы

**Обоснование правильного ответа:** Препаратом выбора будет – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепина. Среди препаратов группы бензодиазепина, а также среди перечисленных лекарственных препаратов, нитразепам обладает наиболее выраженным снотворным действием.

45. Больному с болезнью Паркинсона назначили препарат с преобладающим влиянием на дофаминергическую систему. Назовите это лекарственное средство
- A. \* Леводопа
  - B. Зопиклон
  - C. Дроперидол
  - D. Аминазин
  - E. Лоразепам

**Обоснование правильного ответа:** Противопаркинсоническим лекарственным препаратом, оказывающим непосредственное влияние на дофаминергическую систему, является лекарственное средство леводопа (дофа, допа - дигидроксифенилаланин). Допа – биогенное вещество, образующееся в организме из тирозина, является предшественником дофамина, который в свою очередь является предшественником норадреналина. Лекарственный препарат проявляет ярко выраженное противопаркинсоническое действие.

46. Мужчина 55 лет жалуется на бессонницу, раздражительность, общую слабость. Какой из указанных ниже препаратов целесообразно назначить в данном случае?
- A. \* Нитразепам
  - B. Аминазин
  - C. Трифтазин
  - D. Дроперидол
  - E. Амитриптилин

**Обоснование правильного ответа:** Целесообразный препарат выбора – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепина, оказывает выраженное седативное и снотворное действие.

47. Больному паркинсонизмом для устранения мышечной ригидности был назначен препарат, который является предшественником дофамина. Назовите этот препарат:
- A. \* Леводопа
  - B. Аминазин

- C. Парацетамол
- D. Скопаламина гидробромид
- E. Атропина сульфат

**Обоснование правильного ответа:** Противопаркинсоническим лекарственным препаратом, устраняющим мышечную ригидность и, вместе с тем, влияющим на дофаминергическую систему, является лекарственное средство леводопа (дофа, допа - дигидроксифенилаланин). Допа – биогенное вещество, образующееся в организме из тирозина, является предшественником дофамина, который в свою очередь является предшественником нораденалина

48. Женщина после перенесенного стресса плохо спит. Какому из перечисленных снотворных средств следует отдать предпочтение для лечения бессонницы?
- A. \* Нитразепам
  - B. Фенобарбитал
  - C. Хлоралгидрат
  - D. Аминазин
  - E. Барбитал

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов – препаратом выбора является нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепина, оказывает наиболее выраженное снотворное действие.

49. С целью облегчения процесса засыпания больной принял 5 таблеток фенобарбитала. Вскоре он потерял сознание, артериальное давление понизилось, дыхание резко ослаблено. Укажите, какой препарат следует применять в комплексной терапии при данном состоянии?
- A. \* Бемеград
  - B. Метамизол
  - C. Аминазин
  - D. Налорит
  - E. Промедол

**Обоснование правильного ответа:** В данном случае необходимо применить – бемеград. Бемеград – является антагонистом снотворных средств, уменьшает токсичность барбитуратов, снимает угнетение дыхания и кровообращения вызываемых действием этих веществ.

50. Больному, страдающему болезнью Паркинсона, назначили препарат с преобладающим влиянием на дофаминергическую систему. Назовите это лекарственное средство:
- A. \* Леводопа
  - B. Аминазин
  - C. Диазепам
  - D. Дроперидол
  - E. Нитразепам

**Обоснование правильного ответа:** Противопаркинсоническим лекарственным препаратом, оказывающим непосредственное влияние на дофаминергическую систему, является лекарственное средство леводопа (дигидроксифенилаланин). Допа – биогенное

вещество, образующееся в организме из тирозина, является предшественником дофамина, который в свою очередь является предшественником нораденалина.

51. Больному с бессонницей, вызванной чувством страха, врач назначил средство, которое устраняет отрицательные эмоции и способствует сну. Какой препарат был назначен пациенту?
- A. \* Нитразепам
  - B. Этаминал-натрий
  - C. Фенобарбитал
  - D. Бромизовал
  - E. Хлоралгидрат

**Обоснование правильного ответа:** Целесообразный препарат выбора в данном случае – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепина, оказывает выраженное седативное и снотворное действие.

52. В аннотации на магния сульфат указано, что этот препарат назначают как противосудорожное средство. Какой рациональный путь введения необходимо выбрать для получения данного фармакологического эффекта?
- A. \* Внутримышечный
  - B. Ректальный
  - C. Сублингвальный
  - D. Пероральный
  - E. Ингаляционный

**Обоснование правильного ответа:** В качестве противосудорожного средства магния сульфат применяется внутримышечно. Магния сульфат в этом качестве уменьшает высвобождение ацетилхолина из нервно-мышечных синапсов, подавляя при этом нервно-мышечную передачу, оказывает прямое угнетающее действие на центральную нервную систему.

53. Больному с бессонницей, вызванной эмоциональными расстройствами, врач назначил средство, которое вызывает сон за счёт транквилизирующего действия. Какой снотворный препарат был назначен пациенту?
- A. \* Нитразепам
  - B. Фенобарбитал
  - C. Этаминал-натрий
  - D. Бромизовал
  - E. Хлоралгидрат

**Обоснование правильного ответа:** Целесообразный препарат выбора в данном случае – нитразепам. Нитразепам относится к транквилизаторам группы бензодиазепина, оказывает выраженное седативное и снотворное действие.

54. Больной паркинсонизмом для устранения мышечной ригидности был назначен препарат, который является предшественником дофамина. Назовите препарат:
- A. \* Леводопа
  - B. Аминазин
  - C. Атропина сульфат

- D. Скополамина гидробромид
- E. Парацетамол

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственным препаратом – предшественником дофамина является лекарственный препарат леводопа (дигидроксифенилаланин) – биогенное вещество, образующееся в организме из тирозина, которое является предшественником дофамина. Леводопа (допа, дофа) применяется при лечении паркинсонизма.

55. При длительном использовании фонобарбитала у больного с эпилепсией развилась толерантность к препарату. Что лежит в основе развития данного явления?
- A. \* Ускорение биотрансформации
  - B. Повышение чувствительности рецепторов
  - C. Ослабление процесса всасывания
  - D. Угнетение биотрансформации
  - E. Накопление вещества в организме

**Обоснование правильного ответа:** При длительном применении лекарственного препарата возможно развитие толерантности, при которой прежние дозы не оказывают терапевтического действия и для получения необходимого эффекта следует значительно повысить дозу лекарственного препарата, либо заменить его другим. В основе данного явления лежит ускорение биотрансформации лекарственного препарата.

56. У мужчины диагностирована болезнь Паркинсона. Какое средство целесообразно назначить больному?
- A. \* Леводопа
  - B. Парацетамол
  - C. Аминазин
  - D. Анаприлин
  - E. Нитразепам

**Обоснование правильного ответа:** Противопаркинсоническим лекарственным препаратом, оказывающим непосредственное влияние на дофаминергическую систему является лекарственное средство леводопа (дофа, допа, дигидроксифенилаланин). Допа – биогенное вещество, образующееся в организме из тирозина, является предшественником дофамина, который в свою очередь является предшественником нораденалина.

### **Психоторические средства, антидепрессанты.**

57. Для снятия бреда и галлюцинаций у больной шизофренией врач использовал аминазин. Какой механизм антипсихотического действия препарата?
- A. \* Ингибирование дофаминергических процессов в ЦНС
  - B. Стимуляция адренергических и дофаминергических процессов в ЦНС
  - C. Стимуляция холинергических процессов в ЦНС
  - D. Ингибирование холинергических процессов в ЦНС
  - E. Ингибирование адренергических процессов в ЦНС

**Обоснование правильного ответа:** Для аминазина характерно антипсихотическое, седативное, миорелаксирующее действие. Антипсихотическое действие аминазина

обусловлено блокадой дофаминовых D<sub>2</sub> рецепторов пусковой зоны (мезолимбической и мезокортикальной систем). Антипсихотический эффект проявляется в устранении продуктивной симптоматики психозов.

58. Больному депрессией врач назначил препарат из группы трициклических антидепрессантов. Назовите препарат.

- A. \* Амитриптилин
- B. Феназепам
- C. Дроперидол
- D. Аминалон
- E. Кофеин

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе трициклических антидепрессантов относится лекарственный препарат – амитриптилин. Амитриптилин обладает выраженным тимоаналептическим и седативным действием, применяется при лечении депрессий любой этиологии, особенно эффективен при тревожно-депрессивных состояниях.

59. Вы - провизор, проходящий интернатуру. При сдаче тестового экзамена выберите из предложенных фармакологических эффектов тот, который позволяет применять аминазин для лечения психозов.

- A. \* Антипсихотический
- B. Гипотермический
- C. Противоспалительный
- D. Противорвотный
- E. Спазмолитический

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат аминазин, применяемый для лечения психозов, проявляет антипсихотический эффект - основной представитель группы нейролептиков - лекарственных средств оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему. Антипсихотический эффект проявляется в устранении продуктивной симптоматики психозов.

60. Больному с шизофренией назначен нейролептик. Какой из перечисленных препаратов принадлежит к этой группе?

- A. \* Аминазин
- B. Целекоксиб
- C. Анаприлин
- D. Морфин
- E. Пирацетам

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе нейролептиков относится лекарственный препарат – аминазин – основной представитель группы нейролептиков - лекарственных средств оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему. Для аминазина характерно антипсихотическое, седативное, миорелаксирующее действие. Антипсихотическое действие аминазина обусловлено блокадой дофаминовых D<sub>2</sub> рецепторов пусковой зоны (мезолимбической и мезокортикальной систем). Антипсихотический эффект проявляется в устранении продуктивной симптоматики психозов.

61. Больному в состоянии психоза назначен антипсихотик.
- A. \* Аминазин
  - B. Диазепам
  - C. Циклодол
  - D. Кофеин
  - E. Фенобарбитал

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе нейролептиков относится лекарственный препарат – аминазин – основной представитель группы нейролептиков, лекарственных средств оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему. Для аминазина характерно антипсихотическое, седативное, миорелаксирующее действие. Антипсихотический эффект проявляется в устранении продуктивной симптоматики психозов.

62. Больному, страдающему депрессией, врач назначил препарат из группы трициклических антидепрессантов. Назовите препарат.
- A. \* Амитриптилин
  - B. Дроперидол
  - C. Аминалон
  - D. Феназепам
  - E. Кофеин

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат из группы трициклических антидепрессантов – амитриптилин. Амитриптилин – антидепрессант, действие которого сочетается с выраженным седативным, снотворным и анксиолитическим (противотревожным) эффектом, а также холинолитической и антигистаминной активностью.

63. Проконсультируйте врача-психиатра, какой побочный эффект не характерен для аминазина?
- A. \* Понижение АД
  - B. Повышение АД
  - C. Экстрапирамидные расстройства
  - D. Нарушение функции печени, холестаза
  - E. Контактный дерматит

**Обоснование правильного ответа:** Одно из побочных явлений, проявляющихся при применении лекарственного препарата аминазина – понижение артериального давления (в том числе при приеме препарата per os). Гипотензия (снижение артериального давления) развивается, чаще всего, у больных с гипертензией (повышенным артериальным давлением). Таким больным препарат назначают в уменьшенных дозах.

64. Больному, страдающему депрессией, врач назначил препарат из группы трициклических антидепрессантов. Какой препарат назначил врач?
- A. \* Амитриптилин
  - B. Дроперидол
  - C. Кофеин
  - D. Аминалон

Е. Феназепам

**Обоснование правильного ответа:** Лекарственный препарат из группы трициклических антидепрессантов – амитриптилин. Амитриптилин – антидепрессант, действие которого сочетается с выраженным седативным, снотворным и анксиолитическим (противотревожным) эффектом, а также сильной холинолитической и антигистаминной активностью.

65. Больному с психозом было назначено нейролептическое средство с психоседативным эффектом. Какой это препарат?

- А. \* Аминазин
- В. Диазепам
- С. Кофеин-бензоат натрия
- Д. Этимизол
- Е. Нитразепам

**Обоснование правильного ответа:** Среди перечисленных лекарственных препаратов к группе нейролептиков относится лекарственный препарат – аминазин. Аминазин – является основным представителем группы нейролептиков, лекарственных средств оказывающих тормозящее действие на центральную нервную систему.

#### **Аналептики, адаптогенные, ноотропные средства.**

66. При инфаркте миокарда была проведенная нейролептанальгезия. Какой препарат из группы нейролептиков чаще всего применяется совместно с фентанилом?

- А. \* Дроперидол
- В. Этаперазин
- С. Левомепромазин
- Д. Клозапин
- Е. Сульпирид

**Обоснование правильного ответа:** Фентанил – оказывает сильное, но кратковременное анальгетическое действие. Применяется для нейролептанальгезии в сочетании с нейролептиками, прежде всего – дроперидолом. Данное сочетание лекарственных препаратов наиболее часто применяется при лечении инфаркта миокарда.

67. Больному после перенесенной черепно-мозговой травмы, врач назначил пирацетам. К какой фармакологической группе относится этот препарат?

- А. \* Ноотропные препараты
- В. Ненаркотические анальгетики
- С. Транквилизаторы
- Д. Средства для наркоза
- Е. Нейролептики

**Обоснование правильного ответа:** Пирацетам относится к группе ноотропных препаратов. Ноотропные средства оказывают прямое активизирующее действие на головной мозг, улучшают умственную деятельность, память, повышают устойчивость к агрессивным воздействиям. Действие ноотропных препаратов основано на усилении синтеза дофамина и норадреналина клетками головного мозга.

68. Врачу-анестезиологу необходимо провести операцию, используя нейролептанальгезию. Какую из перечисленных ниже комбинаций лекарственных средств целесообразно использовать в данном случае?

- A. \* Фентанил с дроперидолом
- B. Фентанил с диазепамом
- C. Дроперидол с преднизолоном
- D. Промедол с амитриптиллином
- E. Диазепам с аминазином

**Обоснование правильного ответа:** Для проведения нейролептанальгезии целесообразно использовать комбинации фентанил-дроперидол. Фентанил – опиоидный анальгетик по силе действия и химическому строению сходен с промедолом, широко применяется в сочетании с дроперидолом (нейролептическое средство из группы бутирофенонов) – препарат потенцирует действие анальгетиков, обладает противошоковым и противорвотным действием.

69. Больному после перенесенной черепно-мозговой травмы, врач назначил пирацетам. К какой фармакологической группе относится этот препарат

- A. \* Ноотропные препараты
- B. Нейролептики
- C. Средства для наркоза
- D. Ненаркотические анальгетики
- E. Транквилизаторы

**Обоснование правильного ответа:** Пирацетам относится к группе ноотропных препаратов. Ноотропные средства оказывают прямое активизирующее действие на головной мозг, улучшают умственную деятельность, память, повышают устойчивость к агрессивным воздействиям. Действие ноотропных препаратов основано на усилении синтеза дофамина и норадреналина клетками головного мозга.

70. В аптеку обратилась мама 2х-месячного ребенка с просьбой выдать жаропонижающий препарат. Какой препарат следует рекомендовать для ребенка?

- A. \* Парацетамол
- B. Нимесулид
- C. Индометацин
- D. Ацетилсалициловая кислота
- E. Диклофенак натрия

**Обоснование правильного ответа:** В данном случае препаратом выбора будет лекарственный препарат парацетамол. Парацетамол – обладает жаропонижающим, анальгезирующим и умеренным противовоспалительным действием, угнетает возбудимость центра терморегуляции, применим в детской практике.