

Лікарські засоби, що впливають на еферентну іннервацію.

КЛАСИФІКАЦІЯ ЛІКАРСЬКИХ ЗАСОБІВ, ЯКІ ВПЛИВАЮТЬ НА ЕФЕРЕНТНУ ІННЕРВАЦІЮ.

I. Холінергічні засоби:

- холіноміметики (прямі) – збуджують холінорецептори (ХР) подібно ацетилхоліну (АХ);
- антихолінестеразні засоби (непрямі холіноміметики) – інактивують холінестеразу і сприяють накопиченню АХ;

II. Антихолінергічні засоби (дія, протилежна АХ – блокують ХР і роблять їх нечутливими до АХ);

III. Адренергічні засоби (їх дія подібна норадреналіну та адреналіну);

IV. Антиадренергічні засоби, діють протилежно адренергічним.

ХОЛІНОТРОПНІ ЗАСОБИ, ЇХ КЛАСИФІКАЦІЯ.

Класифікація:

I. Холіноміметичні засоби:

- М-, Н-холіноміметики;
- М-холіноміметики;
- Н-холіноміметики;

II. Антихолінестеразні засоби:

- зворотної дії;
- незворотної дії;

III. Антихолінергічні засоби:

- М-холіноблокатори;
- Н-холіноблокатори:
 - а) гангліоблокатори;
 - б) міорелаксанти.

Холіноблокатори – це ЛЗ, які блокують холінорецептори і тим самим перешкоджають взаємодії ацетилхоліну з холінорецептором.

М-холіноблокатори – це група речовин, які зворотно вибірково блокують М-холінорецептори.

Класифікація

1. Природні речовини	2. Синтетичні речовини
Атропіну сульфат (Атромед) Платифіліну гідротартрат Скополаміну гідро хлорид Гоматропіну гідро бромід	Метацину йодид Пірензепін (Гастроцепін, Гастрил, Пірен) Іpratропій бромід (Атровент, Ітроп) Тропікамід (Мідріацил, Мідрум) Бутил скополаміну бромід (Бускопан) Адифенін (Спазмолітин, Дифацил) Прифіній бромід (Ріабал) Циклодол

Атропіну сульфат

При місцевому застосуванні на око, розширює зіниці на 5-7 днів внаслідок усунення холінергічних впливів на круговий м'яз райдужки очей. Зір встановлюється на дальнє бачення (параліч акомодатії) 7-12 діб.

Показання до застосування: при виразковій хворобі шлунка і 12-палої кишки, пілороспазмі, холециститі, жовчокам'яній хворобі, нирковій кольці, бронхіальній астмі,

для обмеження секреції слинних, травних та бронхіальних залоз, при брадикардії, інколи при атріовентрикулярній блокаді (в випадках з рідким ритмом серця).

При болях, викликаних спазмом непосмугованих м'язів, атропін часто вводять в поєднанні з анальгезуючими речовинами (промедол, морфін, тощо).

Призначають також атропін для рентгенологічного дослідження шлунково-кишкового тракту, при необхідності зменшити тонус та моторику шлунка, кишок.

Платифіліну гідротартрат

Має заспокійливу дію на ЦНС, пригнічує судинно-руховий центр.

Виявляє спазмолітичну, папавериноподібну (послаблює гладенькі м'язи судин, не лише периферичних але і вінцевих), болезаспокійливу дію, менше впливає на секрецію залоз

Гастроцепін (пірензепін) - специфічний блокатор M1-холінорецепторів, вибірково пригнічує секрецію залоз шлунка, соляної кислоти та пепсиногену..

Тропікамід - сильний периферичний холінолітик, викликає мідріаз на 2-4 год, використовують в офтальмології для діагностичного дослідження очного дна та визначення рефракції.

Іпратропій бромід - блокує в основному M-холінорецептори бронхів та слизової оболонки носа. Застосовують у вигляді аерозолі при хронічних обструктивних бронхітах і бронхоастматичних станах, хронічних пневмоніях. Назальний спрей «Атровент» застосовують при ринітах різної етіології.

Прифінію бромід (Ріабал) - вибірково блокує периферичні m-холінорецептори слизової оболонки травного тракту, жовчовивідних і сечовивідних шляхів та матки, не проникає крізь ГЕБ..

Мебеверину гідрохлорид - міотропний спазмолітик з вибірковою дією на гладкі м'язи ШКТ, не діє безпосередньо на M-ХР і не спричиняє характерних для спазмолітичних засобів з M-холіноблокуючою дією побічних ефектів (відчуття сухості у роті, порушення зору, затримка сечовипускання), що дозволяє застосовувати його для пацієнтів із гіпертрофією передміхурової залози або глаукомою.

Адренергічні засоби – це лікарські речовини, які діють у ділянці адренергічних синапсів.

Адренергічні засоби – блокують або полегшують процес передавання імпульсів у адренергічних синапсах.

Передача збудження в адренергічних синапсах здійснюється з участю медіатору норадреналіну та адреналіну. Під дією нервового імпульсу медіатор вивільняється з нервового закінчення, виливається в синаптичну щілину і збуджує адренорецептори постсинаптичної мембрани.

Класифікація адренергічних лікарських засобів

А) адреноміметики прямої дії – безпосередньо збуджують адренорецептори.

α -адреноміметики

β- адреноміметики

Б) адреноміметики непрямої дії (симпатоміметики) збільшують концентрацію норадреналіну у синаптичній щілині.

α+β-адреноміметики

2. Антиадренергічні засоби.

А) адреноблокатори – засоби, які блокують адренорецептори.

α-адреноблокатори

β- адреноблокатори

α+β- адреноблокатори

Б) симпатолітики – засоби, які зменшують концентрацію медіатора та його викид в синаптичну щілину.

Адреноміметичні засоби (адреноміметики, адренопозитивні засоби) збуджують адренорецептори, завдяки чому відтворюють ефекти медіатора симпатичної вищої нервової системи; вони ніби імітують дію норадреналіну і адреналіну на внутрішні органи.

α – адреноміметичні засоби

При збудженні α – адренорецепторів звужуються кровоносні судини, скорочуються непосмуговані м'язи матки, сфінктерів, капсули селезінки, радіального м'яза райдужки, знижується моторика і тонус кишок.

До α – адреноміметиків прямої дії належать норадреналін, мезатон, нафтизин.

Норадреналіну гідротартрат (Норепінефрин)

Норадреналіну гідротартрат (норепінефрин) є адреноміметиком прямої дії, який стимулює α_1 -, α_2 - і β_1 -адренорецептори.. Вводиться виключно в/в краплинно.

Застосовують норадреналіну гідротартрат у випадках гострого зниження артеріального тиску – при шоківих, колаптоїдних станах, при хірургічних втручаннях, травмах.

Застосування: при колапсі, шоці, для пролонгування дії місцевих анестетиків, при пароксизмальній тахікардії.

Побічні ефекти: некроз тканин при підшкірному або внутрішньом'язовому введенні.

Мезатон (Фенілефрин)

Мезатон (фенілефрин) є синтетичним α_1 -адреноміметичним засобом прямої дії.

Застосування: при колапсі, артеріальній гіпотензії, алергічних станах. Призначають разом з місцево анестезуючими засобами для сповільнення їх всмоктування, розширення зіниць з діагностичною метою.

Нафтизин (Нафазолін)

Застосування: як місцевий судинозвужуючий препарат при гострому і хронічному риніті, алергічному кон'юнктивіті, носових кровотечах.

Ксилометазолін (Галазолін , Длянос, Отривін, Фармазолін, Назальний спрей доктора Тайса) - за будовою та дією близький до нафтизину. При місцевому використанні практично не всмоктується.

Оксиметазолін (Називін, Назол) - А-адреностимулятор тривалої дії 10-12 годин. Використовується в ЛОР-практиці.

Препарат застосовують не більше 3 днів!!

Тетризолін

Тизин назальний спрей 0,1% і 0,05%

Має судинозвужувальну, протинабрякову та антиексудативну дію, що призводить до звуження дрібних артеріол, зменшення набряку слизової оболонки носових ходів та зниження ексудації. Протипоказаний при атрофічному риніті, дітям до 2 років.

Візин краплі очні 0,05%

Справляє судинозвужувальну, проти набрякову та антиексудативну дію при закапуванні в кон'юнктивальний мішок ока без розвитку мідріазу або феномену рикошета у вигляді реактивної гіперемії..

β – адреноміметики – відтворюють ефекти збудження β – адренорецепторів. При збудженні β_2 – адренорецепторів настає розширення судин, зниження тону непосмугованих м'язів бронхів і матки, внаслідок чого просвіт бронхів збільшується, а скоротливість біометрії зменшується.

Ізадрин (Новодрин, Ізопрепалін)

Препарат збуджує β_1 – β_2 – адренорецептори, але не діє на α – адренорецептори, є активним бронхорозширюючим препаратом, який розріджує харкотиння, полегшує його виділення, збільшує серцевий викид, підвищує потребу міокарда в кисні, полегшує атріовентрикулярну провідність, підвищує автоматизм серця, знижує АТ, стимулює центральну нервову систему, послаблює тонус матки.

Сальбутамол (Астмал, Вентолін, Саламол)

Синтетичний препарат, що вибірково збуджує β_2 – адренорецептори, у лікувальних дозах не викликає тахікардії та змін АТ. У вигляді сиропу застосовують у педіатричній практиці. На роботу серця не впливає.

Протипоказання: тахікардія, гіпертиреоз, артеріальна гіпертензія.

Орципреналіну сульфат (Алупент, Астмопент)

Близький до ізадрину, але збуджує β_2 – адренорецептори, тому більше впливає на гладкі м'язи і менше на серце, краще переноситься, дія триває 4-5 годин.

Фенотерол (Беротек, Партусистен)

Замінник орципреналіну, більш тривалої дії б'єгод, краще переноситься. Під назвою Партусистен застосовується в акушерській практиці для послаблення скорочувальної активності та тонусу матки при загрозі передчасних пологів.

Добутамін (Добутрекс)

Селективний β_1 -адреноміметик, у зв'язку з чим проявляє сильну ізотропну дію (збільшує ССС) і мало впливає на автоматизм і частоту, тому рідко викликає аритмію, збільшує коронарний кровообіг. Застосовують при гострій серцевій недостатності і кардіогенному шоці.

Кленбутерол (Спіропент)

Стимулює β_2 рецептори бронхів і справляє бронхорозширюючий дію, виявляє також токолітичну дію. Застосовують в основному як бронхорозширюючий засіб при бронхіальній астмі, емфіземі легень, різних бронхоспастичних станах.

Сальметерол (Серевент, Сальметер)

Відносно новий вибіркового β_2 -адреностимулятор тривалої дії, використовується 1 раз на добу. Застосовується для профілактики приступів бронхіальної астми і лікування хронічного бронхіту. Для купування приступу не використовують.

Гексопреналін (Гініпрал, Іпрадол)

Являється вибірково β_2 -адреностимулятором, проявляє бронхорозширюючу дію. Під назвою Гініпрал використовують в акушерстві як токолітичний засіб.

Антиадренергічні засоби це засоби, які знімають адренергічну інервацію в органі або тканині. За механізмом дії поділяються на дві групи: адреноблокуючі (α і β -адреноблокуючі) та симпатолітики.

α -адреноблокатори – блокують α -адренорецептори і роблять їх нечутливими до медіатору норадреналіну. Вони справляють протилежний ефект до дії адреноміметиків, особливо по відношенню до судин.

β -адреноблокатори – препарати, що блокують β -адренорецептори і виявляють специфічний блокуючий вплив на ефекти, пов'язанні з стимуляцією β -адренореактивних систем.

За вибірковістю дії β -адреноблокатори розрізняють:

1) **Кардіоселективні** – ті, які блокують β_1 -адренорецептори серця.

Атенолол (атенобене)

Бетаксол (локрен)
Метопролол (Беталок, Валокардин, Корвітол, Егілок)
Ацебуталол (Сектраль, Ацекор)
Талінолол (Корданум)

2) **Неселективні (невибіркові)** – діють одночасно на β_1 -рецептори серця і β_2 -рецептори (бронхів).

Пропранолол (Анаприлін, Індерал, Обзидан)

Всі β -адреноблокатори характеризуються трьома видами дії:

Антиангіальна дія β -адреноблокаторів пояснюється зменшенням потреби міокарда в кисні (за рахунок зниження енергетичних затрат серця), а також перерозподілу регіонального (коронарного) кровотоку міокарда в користь ішемічних вогнищ.

Антиаритмічна дія пов'язана зі зниженням збудження та автоматизму провідної системи серця, оскільки препарати блокують β -адренорецептори синусового вузла.

Гіпотензивний ефект зв'язаний зі зменшенням серцевого викиду та активності ренін-ангіотензивної системи, зниженням чутливості барорецепторів, заспокійливим впливом на центральну нервову систему. Крім того, β -адреноблокатори блокують рецептори нефрона, внаслідок чого зменшується надходження у кров реніну й утворення ангіотензину II.

Вінцеві судини під дією неселективних блокаторів звужуються, для них характерне підвищення тону гладеньких м'язів, тому вони можуть провокувати коліки і викликати явища бронхоспазму. Зменшують секрецію інсуліну.

β -адреноблокатори виявляють стимулюючий вплив на скоротливість м'язів матки.

Застосування:

- профілактика або усунення надшлуночкових аритмій.
- артеріальна гіпертензія
- стенокардія
- прискорення пологової діяльності у жінок з різними видами екстрагенітальної патології.
- тиреотоксикоз у хворих з алергічними реакціями на мерказоліл
- емоційні порушення у вигляді страху, тривоги, напруги.

Анаприлін (Пропранолол, індерал, обзидан)

Є неселективним β_1 -, β_2 -адреноблокатором. У наш час анаприлін широко використовується для лікування хворих на ІХС, ГХ, серцеві аритмії (покрощує перебіг захворювання, зменшуючи кількість нападів стенокардії і підвищуючи толерантність хворих до фізичного навантаження).

Також застосовують в очних краплях для лікування відкритокутової глаукоми.

Атенолол (Катенол, Теноблок) - є кардіоселективним β_1 -адреноблокатором. Має тривалу дію. Може призначатися хворим зі схильністю до бронхоспазму та спазму периферичних судин з меншим ризиком, ніж неселективні β -адреноблокатори. Викликає брадикардію.

Бетаксол (Локрен) - володіє гіпотензивною дією, попереджає підвищення АТ, не пригнічує серцеву діяльність, не впливає на метаболізм вуглеводів та ліпідів.

ПСИХОТРОПНІ ЗАСОБИ

Психотропні (грец. psuche-душа, свідомість, tropos- спорідненість) лікарські засоби вибірково регулюють психічні функції, передусім емоції, мислення, пам'ять, мотивацію поведінки, психомоторну активність і призначені для застосування при порушеннях психічних функцій, у тому числі при граничних станах.

Вони поділяються на

1. Психолептики (заспокійливі) – ЛП, що пригнічують ЦНС

Нейролептики (антипсихотики) – антипсихотичні засоби, що застосовуються при шизофренії, психоох, галюцинаціях та інших розладах психіки.

Транквілізатори (анксіолітики) – засоби, що знімають патологічний страх, емоційне напруження, надмірне збудження.

Седативні – препарати, що здійснюють не диференційну заспокійливу дію за рахунок зниження збудливості і реактивності ЦНС до різних стимулів і концентрації гальмуючих процесів.

2. Психотоніки – лікарські препарати, що збуджують ЦНС.

Антидепресанти – засоби, які покращують патологічно змінений настрій, повертають оптимізм при депресіях, підвищують продуктивність асоціативних процесів.

Ноотропні засоби – засоби, які мають неспецифічну загально тонізуючу дію на функції мозку, ендокринну регуляцію, обмінні процеси і підвищують адаптацію організму до несприятливих умов, що сприяє покращенню роботи ЦНС.

Психостимулятори – засоби, що підвищують розумову і фізичну працездатність, мобілізують енергетичні і функціональні ресурси організму.

Адаптогени - препарати природного походження, які мають неспецифічну загально тонізуючу дію на функції мозку, ендокринну регуляцію, обмінні процеси і підвищують адаптацію організму до несприятливих умов, що сприяє покращенню роботи ЦНС.

Аналептики

АНКСІОЛІТИКИ (ТРАНКВІЛІЗАТОРИ)

Анксиолітики (транквілізатори) (лат. *tranquillare* – робити спокійним, безтурботним) вибірково усувають страх, тривогу, неспокій, емоційну напругу. Класифікуються **за хімічною структурою**:

Класифікація та препарати

Похідні бензодіазепіну		Похідні пропандіолу, азаспіродеканедіону*, дифенілметану**	Похідні інших хімічних груп
Діазепам	Медазепам	Мепробамат	Бензоклідину г/х
Хлордіазепоксид	Гідазепам	Буспірон*	Триметозин Афобазол Мебікар
Алпразолам		Гідроксизин**	
Бромазепам		Бенактизин**	
Оксазепам	Лоразепам		
Дикалію клоразепат	Феназепам		

За домінуванням психотропного компонента:

- З вираженою седативною і снодійною дією - «нічні» транквілізатори (хлордіазепоксид, діазепам, лоразепам, феназепам, бенактизин, мепробамат).
- Із слабкою седативною і снодійною дією - «денні» транквілізатори (медазепам, дикалію клоразепат, мебікар, гідазепам, триметозин, бензоклідину г/х, буспірон, афобазол).
- Зі стимулюючою дією (гідазепам, гідроксизин, афобазол).

За механізмом дії:

- Агоністи бензодіазепінових рецепторів.
- Агоністи серотонінових рецепторів.
- Препарати інших типів дії.

Головні ефекти:

- анксиолітичний - вибіркоче придушення почуття тривоги, страху (антифобічна дія), невпевненості, зменшення емоційного збудження і психічного напруження за рахунок впливу на мигдалеподібний комплекс лімбічної системи (всі препарати);

- стреспротекторний - усунення реакції на фактори, що викликають стан стресу;
- седативний;
- снодійний, обумовлений анксиолітичною і седативною дією препаратів, у великих дозах вони викликають антерограду амнезію;
- міорелаксуючий, пов'язаний з впливом препаратів на полісинаптичні спинальні рефлекси ЦНС, тому їх називають «центральною міорелаксантами»;
- протисудомний - пригнічення епілептогенної активності гіпокампа у зв'язку з посиленням гальмівних ГАМК-ергічних процесів в ЦНС при збереженій руховій і розумовій активності;
- психостимулюючий;
- вегетостабілізуючий;
- потенціовальний - посилення дії ліків, що пригнічують ЦНС: алкоголь, наркозні, снодійні, анальгетики, місцевоанестезуючі засоби.

Застосування.

- неврози
 - нейрогенні захворювання (стенокардія, гіпертонічна хвороба, виразкова хвороба шлунку),
 - при малих епілептичних випадках,
 - спазм посмугованих м'язів,
 - премедикація (перед операцією для заспокоєння хворих)
 - порушення сну, пов'язане з негативними емоціями
 - депресивні стани
 - синдром абстиненції при алкоголізмі та наркоманії
- При тривалому застосуванні до транквілізаторів розвивається
- Звикання і залежність.
 - Синдром «відміни»
 - Сонливість, втомленість, запаморочення, послаблення пам'яті, порушення концентрації уваги, головний біль, нервозність, дискоординація рухів, ейфорія.
 - Сухість у роті, артеріальна гіпертензія, нудота, алергічні реакції, тахікардія, мідріаз, запор.
 - При значному передозуванні рухове та психічне збудження, гнів, розлад сну, марення, судоми.

Похідні бензодіазепіну

Діазепам (Сібазон)

Препарат відноситься до транквілізаторів групи бензодіазепіна, які проявляють анксиолітичну, седативну, міорелаксуючу і протисудомну дію. Основні фармакологічні властивості діазепама зумовлені його здатністю активувати дію γ -аміномасляної кислоти, найбільш важливого гальмівного медіатора центральної нервової системи.

Застосування: пероральна форма застосовується для симптоматичного лікування стану тривоги, ажитації, напруження у пацієнтів з неврозами, нетривалими реактивними станами.

Як додатковий засіб в комплексній терапії різних психічних і соматичних захворювань, що супроводжуються вираженим станом тривоги, відчуттям страху або їх функціональних, вегетативних або рухових еквівалентів (серцебиття, пітливість, безсоння, тремор, тривога і т.д.). В психіатрії діазепам використовують для лікування станів збудження і тривоги, при руховому збудженні і білій гарячці. Також для купірування епілептичного статусу та інших судомних станів (правець, еклампсія.).

Раптова відміна препарату може призвести до абстиненції (хвилювання, тремор, судоми).

Феназепам

Застосування: при різних невротичних, неврозоподібних, психопатичних і психопатоподібних станах, що супроводжуються тривогою.

Гідазепам

Наділений активуючим ефектом, не має снодійних властивостей.

Застосування: невротична, психопатична астенія; стани, які супроводжуються тривогою, страхом, підвищеною дратівливістю, порушенням сну; емоційна лабільність; купірування абстинентного синдрому при алкоголізмі та підтримувальна терапія під час ремісії при хронічному алкоголізмі; логоневроз; мігрень.

Похідні дифенілметану та пропандіолу

Буспірон. Показання. Симптоматичне лікування тривожних станів з такими домінуючими симптомами як тривожність, внутрішній неспокій, стан напруження.

Бенактизин - анксиолітична та седативна дія, гальмує кашльовий рефлекс. Показання: тривожні астеноневротичні і депресивні порушення, фобія, премедикація, післяопераційний стан, захворювання, що супроводжуються спазмом гладеньких м'язів внутрішніх органів, паркінсонізм.

Препарати різної будови

Мебікар

Має помірну транквілізуючу дію, не має снодійного ефекту, не порушує рухової активності.

Афобазол - ефект залежить від фенотипу емоційно-стресової реакції (стимулюючий при астенічній, седативний - при стенічній).

АНТИПСИХОТИЧНІ ЗАСОБИ (НЕЙРОЛЕПТИКИ)

Антипсихотичні засоби – це психотропні препарати, що пригнічують ЦНС (не порушуючи свідомості), усувають галюцинації, марення і психомоторне збудження (рухове і мовне), тобто продуктивну психотичну симптоматику.

Класифікація і препарати

Похідні фенотіазину (аліфатичні, піперазинові*, піперидинові**)	Похідні бутирофенону	Похідні тіоксантену	Похідні інших хімічних груп (дифенілбутилпіперидину*, дибензодіазепіну**, бензизоксазолу***, індолу, бензаміди·, тієнобензодіазепіну)	
Хлорпромазин Левомепромазин Тіопроперазин Периціазин <i>Перфеназину г/х *</i> Флуфеназин * Трифлуоперазин ** Тіоридазин **	Дроперидол Галоперидол Трифлуперидол	Хлорпротиксен Зуклопентиксол Флупентиксол	Пенфлюридол* Клозапін ** Рисперидон*** Дикалію клоразепат· Сульпірид ··	Сультоприд ·· Оланзапін Кветіапін

Механізм антипсихотичної дії пов'язаний з пригніченням функції ретикулярної формації і усунення її активуючої дії на кору великих півкуль. Нейролептики блокують медіаторну функцію дофаміну, особливо в дофамінергічних D₂-рецепторах мезолімбічної і мезокортикальної системи, що призводить не тільки до розвитку антипсихотичного ефекту, але й до виникнення екстрапірамідних розладів, схожих з паркінсонізмом.

Седативний ефект пов'язаний з блокуванням центральних α-рецепторів у ретикулярній формації та пригніченням H₁-гістамінових рецепторів. Заспокійлива дія

нейролептиків – пригнічення реакцій на зовнішні стимули, ослаблення психомоторного збудження і приглушення відчуття страху, зниження агресивності.

Потенціююча дія нейролептиків пов'язана з їх впливом на стовбурний відділ мозку. Вони потенціюють ефекти наркозних, анальгетиків, снодійних, місцевих анестетиків. При одночасному їх введенні продовжується дія останніх.

Протиблювотна дія нейролептиків має велике практичне значення. Ці речовини попереджують блювання, яке з'являється внаслідок подразнення рецепторів тригер-зони, розташованих на дні четвертого шлуночка.

Механізм **гіпотермічної дії** нейролептиків пояснюється збільшенням тепловіддачі у зв'язку з розширенням теплопродукції за рахунок зменшення м'язового тону і центральної регуляції обміну речовин. Пригнічення функції гіпоталамуса, внаслідок чого гальмується продукція гормонів гіпофіза, та різке зниження процесів обміну.

У людини гіпотермічний ефект не виявляється, якщо додатково не використовується фізичне охолодження чи загальні анестетики.

Зниження м'язового тону і ослаблення рухової активності зумовлені пригніченням функції низхідної системи стовбура мозку. Однак, вони не є істинними протисудомними засобами. Більш того, вони підвищують смертність тварин, отруєних стрихніном.

Важливою властивістю нейролептиків є їх **блокуючий** вплив на центральні α -адрено- і дофамінорецептори, що призводить до судинорозширювальної дії, **зниження артеріального тиску**.

Для нейролептиків характерні ефекти:

- антипсихотичний;
- седативний;
- потенціювальний;
- гіпотермічний;
- протиблювотний;
- α -адренолітичний;
- холінолітичний.

Антипсихотичні засоби протипоказані, або застосовуються з обережністю при органічних захворюваннях головного мозку, органів кровотворення, печінки, нирок, серцево-судинній патології з явищами декомпенсації.

У разі виникнення гіпертермії необхідно негайно припинити вживання **нейролептиків**, з обережністю використовувати їх в жарку погоду.

Похідні фенотіазину

Хлорпромазин (Аміназин). Є одним із основних представників нейролептиків.

Застосування:

1. В психіатричній практиці аміназин застосовують при різних станах психомоторного збудження у хворих, шизофренії, епілепсії, МДП, пресинильному психозі, та тих неврозах, що супроводжуються страхом, безсонням, напруженням, при гострих алкогольних психозах.
2. В неврології при захворюваннях, що супроводжуються підвищеним м'язовим тонусом (після інсульту).
3. Іноді для купірування епілептичного статусу
4. Ефективне застосування при болях разом з анальгетиками, барбітуратами – при безсонні.
5. Як протиблювотний засіб – при блюванні у вагітних, хворобі Мен'єра, в онкологічній практиці.
6. Зудячі дерматити.

Похідні бутирофенону

Дроперидол. Застосування: в психіатрії при психомоторному збудженні, маренні і галюцинації. Переважно застосовують для нейролептанальгезії, в комбінації з наркотичним анальгетиком фентанілом.

Похідні тіоксантену

Флупентиксол володіє антипсихотичним і стимулюючим ефектами. Підвищує комунікабельність і полегшує соціальну адаптацію хворих, проявляє антидепресивну і анксиолітичну дію.

Рисперидон володіє антипсихотичним, седативним, протиблювотним і гіпотермічним ефектами. Менше пригнічує моторну активність й індукує каталепсію.

Сульпірид проявляє помірний нейролептичний, анальгетичний, антидепресивний, психостимулюючий, тимолептичний, протиблювотний, антисеротонічний і цитопротекторний ефекти.

Клозапін володіє сильною антипсихотичною, седативною, потенціюючою, М-холінолітичною і міорелаксуючою дією. Ефективний у хворих, резистентних до інших нейролептиків. Рідше викликає екстрапірамідні розлади і пізню дискінезію.

Оланзапін поєднує виражений антипсихотичний з седативним ефектом, володіє α -адренолітичною, М-холінолітичною, антигістамінною, протиблювотною дією.

Опіюїдні (наркотичні) анальгетики — це лікарські препарати, які при резорбтивній дії вибірково пригнічують больову чутливість і спричиняють ейфорію, звикання та психічну і фізичну залежність (наркоманію).

Класифікація:

Природні та напівсинтетичні:

а) Агоністи опіюїдних рецепторів:

- Морфіну гідрохлорид
- Кодеїн
- Етилморфінуг/х
- Омнопон

Синтетичні:

а) Агоністи-антагоністи:

- Пентазоцин
- Буторфанол
- Бупренорфін
- Налорфін

б) Антагоністи опіюїдних рецепторів:

- Тримепередин (Промедол)
- Фентаніл
- Бупренорфін

Зі змішаним механізмом дії:

- Трамадол (Трамал)

Механізм дії: Взаємодіють з опіатними рецепторами ЦНС, внаслідок чого пригнічується виділення медіаторів болю (альгогенів) на шляху проходження імпульсів.

Вплив на організм:

І. Гальмівні ефекти:

А) Центральні:

- Пригнічення болю
- Седативний і снодійний ефекти
- Депресія центру дихання
- Пригнічення кашльового центру

- Пригнічення центру терморегуляції
- Ослаблення секреції гонадотропних гормонів

Б) Периферичні:

- Пригнічення моторики шлунка і пропульсивної перистальтики кишечника
- Пригнічення секреції залоз шлунка, підшлункової залози, кишечника
- Пригнічення полісинаптичних рефлексів

II. Стимулюючі ефекти:

А) Центральні:

- Ейфорія
- Стимуляція центрів окорухових нервів (міоз)
- Стимуляція центрів блукаючих нервів
- Підвищення продукції пролактину та АДГ
- Можлива стимуляція рецепторів пускової зони блювотного центру

Б) Периферичні:

- Підвищення тонусу сфінктерів ШКТ
- Підвищення тонусу м'язів кишечника
- Підвищення тонусу сфінктера Одді
- Підвищення тонусу бронхіальних м'язів
- Підвищення тонусу сфінктерів сечового міхура
- Посилення моносинаптичних рефлексів

Показання до застосування:

- ✓ Сильний біль, викликаний і патологічними процесами: інфарктом міокарда, масивними опіками, шоком, інооперабельними формами злоякісних новоутворень, гострими запальними процесами у внутрішніх органах (перитоніт, холецистит), нирковими і печінковими кольками
- ✓ безсоння, викликане надмірним болем;
- ✓ профілактика травматичного шоку (усі, крім кодеїну та етилморфіну г/х).
- ✓ Морфін застосовують також як протишоківий засіб.
- ✓ В акушерській практиці для знеболювання (тримеперидин, дименоксадолу г/х.)
- ✓ Рентгенологічне дослідження жовчного міхура та шлунка (морфін гідрохлорид)
- ✓ Кашель при пневмотораксі, легеневій кровотечі, при операціях на органах грудної клітини (кодеїн, етилморфіну г/х, дименоксадолу г/х).
- ✓ В анестезіології морфін використовують при підготовці до операції і в післяопераційному періоді
- ✓ Нейролептанальгезія (фентаніл).
- ✓ Захворювання очей (етилморфіну г/х).
- ✓ Сильне невгамовне блювання у тих випадках, коли не допомагають інші засоби.

Нейролептанальгезія- комбінований метод внутрішньовенної загальної анестезії, при якому пацієнт перебуває в свідомості, але не відчуває емоцій (нейролепсія) і болю (анальгезія). Завдяки цьому відключаються захисні рефлексі симпатичної системи і зменшується потреба тканин в кисні..

Лікування: фентаніл + антипсихотичний засіб.

Неопіюїдні (ненаркотичні) анальгетики- це лікарські препарати різної хімічної структури, які володіють протизапальною, анальгезуючою та жарознижуючою діями та не мають наркогенного потенціалу.

Класифікація:

I. З центральним компонентом дії:

а) Анальгетики-антипіретики:

- Парацетамол
- Кеторолак
- Метомізол натрію

II. Анальгетики-антипіретики периферичної дії:

а) Монопрепарати:

- Метамізол натрію(Аналгін)

б) Комбіновані:

- Аскопар
- Аскофен
- Дипрен
- Цитрамон
- Продеїн
- Паравіт
- Пенталгін
- Седалгін

в) Спазмоанальгетики:

- Андипал
- Баралгетас
- Новіган
- Реналган
- Спазмoverалгін НЕО

Механізм дії: Блокують Циклооксигеназу, що приводить до пригнічення синтезу Простагландинів в осередку запалення і ЦНС та зменшення сенсibiliзації ноцицепторів до дії альгогенів.

Ненаркотичні анальгетики виявляють такі ефекти:

- Анальгезуючий (усі ННА);
- Жарознижуючий (усі, крім нефопаму та спазмoverалгіну НЕО);
- Протизапальний (усі, крім нефопаму, парацетамолу, спазмoverалгіну НЕО);
- Седативний (седалгін, пенталгін, темпалгін, спазмoverалгін НЕО);
- Спазмолітичний (циклопар, реналган, баралгін, новіган, андипал, спазмoverалгін НЕО, кеторолак);

Показання до застосування:

- Біль, що не загрожує життю (головний, зубний, суглобний, ін.) – усі ННА, крім андипалу, спазмoverалгіну НЕО.
- Лихоманка – усі ННА, крім нефопаму, циклопару, баралгіну, новігану, андипалу, спазмoverалгіну НЕО.
- Невралгія – усі ННА, крім нефопаму, циклопару, баралгіну, новігану, андипалу, спазмoverалгіну НЕО, грипоциду.
- Коліки – циклопар, реналган, баралгін, новіган, андипал, спазмoverалгін НЕО.
- Спазми коронарних судин та судин мозку – реналган, баралгін, андипал;
- Мігрень – аскофен, аскопар, томапирин, седалгін, пентапгін, спазмoverалгін НЕО.

- Післяпологовий та післяопераційний період – реналган, продеїн, нефопам, кеторолак.
- ОВРЗ, набряк слизової носа, алергічний риніт, ринофарингіт – грипоцид, антикатарап Едиген, неоанапірин.

Нестероїдні протизапальні препарати (НПЗП) —це клас лікарських засобів, які забезпечують анальгетичний та антипіретичний (жарознижуючий) ефекти і при застосуванні у вищих дозах, протизапальний ефект.

Класифікація:

I. Похідні саліцилової кислоти:

- Ацетилсаліцилова к-та (Аспірін)
- Ацетил саліцилат лізину (Аспізол)

II. Похідні арилкарбонової кислоти:

- Диклофенак натрію (Вольтарен)
- Кетопрофен(Фастум гель)
- Тіaproфенова к-та (Сургам)
- Ібупрофен

III. Оксиками та фенамати*

- Мелоксикам
- Піроксикам
- Ніфлумова к-та*
- Мефенамінова к-та*

IV. Похідні піразолону та індолоцтової кислоти*

- Індометацин*
- Фенілбутазон(Бутадіон)
- Клофезон

V. Коксиби

- Целекоксиб(Целебрекс)
- Рофекоксиб(Рофіка)

V. Комбіновані та інші препарати*

- Копацил
- Реопірин
- Німесулід*
- Етодолак*
- Набуметон*

Механізм дії: Основним механізмом протизапальної дії НПЗП є пригнічення синтезу простагландинів (ПГ), зумовлене блокадою ферменту циклооксигенази (ЦОГ).

НПЗП володіють такими ефектами:

- протизапальним
- жарознижуючим
- анальгезуючим (усі НПЗП, крім бен-гею)
- антиагрегантним ефектами (ацетилсаліцилова к- та, ацетилсаліцилат лізину, неоанапірин, кетопрофен, диклофенак натрію, ніфлумова к-та, індометацин).
- десенсибілізуюча дія характерна для індометацину, диклофенаку натрію, ацетилсаліцилової кислоти.

Застосування:

- Запальні захворювання сполучної тканини – усі НПЗЗ, крім копацилу.
- Міалгії, радикуліт, бурсит – усі НІ 133, крім етодолаку, набуметону, диклокаїну, целекоксибу.
- Головний біль – ацетилсаліцилова к-та, ацетилсаліцилат лізину, мефенамова к-та, копацил.
- Післяопераційний больовий синдром – диклофенак натрію (диклофенак ретард), тіапрофенова к-та, ніфлумова к-та, клофезон, німесулід (месулід), етодолак.
- Болі при травматичних ушкодженнях – диклофенак натрію (диклофенак ретард), ацетилсаліцилова к-та, ацетилсаліцилат лізину, кетопрофен, піроксикам, ніфлумова к-та, індомегацин (індометацинова мазь), етодолак.
- Артрити – целекоксиб (целібрекс), всі, крім ацетилсаліцилової кислоти, ацетилсаліцилату лізину.
- Остеоартроз – диклофенак натрію (диклофенак ретард), мелоксикам, клофезон, німесулід (месулід), етодолак, індомегацин (індометацинова мазь).
- Гіпертермія – ацетилсаліцилова к-та, ацетилсаліцилат лізину, мефенамова та ніфлумова к-та, німесулід (месулід), копацил.
- Тромбофлебіт – ацетилсаліцилова к-та, ацетилсаліцилат лізину, кетопрофен, фенілбутазон, індомегацин (індометацинова мазь).
- Гіперкоагуляційний синдром, профілактика тромбозів – ацетилсаліцилова к-та, ацетилсаліцилат лізину.
- Подагра – кетопрофен, диклофенак натрію (диклофенак ретард), індомегацин (індометацинова мазь), ібупрофен, піроксикам, ніфлумова к-та, фенілбутазон, клофезон, реопірин.
- Гломерулонефрит-індомегацин.
- Невралгія, біль при ревматоїдних ураженнях м'яких тканин – диклофенак натрію (диклофенак ретард), індомегацин (індометацинова мазь).

АНТИДЕПРЕСАНТИ

Антидепресанти (тимоаналептики) – психотропні засоби, що усувають симптоми депресії: патологічно пригнічений, тужливий настрій, відсутність інтересу до життя, психічну і рухову загальмованість. Антидепресанти не викликають ейфорії і підвищення настрою в осіб, які не страждають депресією.

Класифікація препаратів

I покоління (неселективні)			
<i>Інгібітори МАО-А і МАО-Б незворотної дії</i>	<i>Інгібітори зворотного нейронального захоплення моноамінів (трициклічні і тетрациклічні)</i>	<i>Рецепторної дії, рослинні * і комбіновані **</i>	
Ніаламід	Іміпрамін Кломіпрамін Амітриптилін	Доксепін Мапротилін	Міансерин Гіперіцин * Аміксид ** (амітриптилін + хлордіазепоксид)
II покоління (селективні)			
<i>Інгібітори МАО-А оборотної дії</i>	<i>Селективні зворотного серотоніну,</i>	<i>інгібітори захоплення дофаміну *</i>	<i>Рецепторної дії і збільшують зворотно</i>

	<i>но-радреналіну **; серотоніну з одночасною блокадою серотонінових рецепторів 2-го типу ***</i>	<i>захоплення серотоніну *</i>
Моклобемід Піразидол Бефол	Флуоксетин Сертралін Пароксетин♦ Ребоксетин **	Циталопрам Бупропіон * Нефазодон ***
III покоління (з «подвійною» дією)		
Мілнаципран	Венлафаксин	

Фармакодинаміка

- *антидепресивний* - усунення основних проявів депресії: стійких негативних емоцій, почуття туги, пригніченості, безнадії, рухової і психічної загальмованості;
- *тимолептичний* - підвищення настрою у хворих, що страждають депресіями;
- *психостимулювальний* (інгібітори MAO, іміпрамін, флуоксетин, ребоксетин, бупропіон);
- *седативний* (амітриптилін, аміксид, мапротилін, міансерин, пароксетин, циталопрам, флувоксамін, міртазапін, докsepін, нефазодон);
- *анксіолітичний* (амітриптилін, аміксид, докsepін, мапротилін, міансерин, пароксетин, флуоксетин, нефазодон, тіанептин);
- *нормалізуючий ЦНС* - стимулювальна дія при адинамічних і седативна при тривожних, ажитованих депресіях (піразидол, кломіпрамін, сертралін, тіанептин);
- *холінолітичний* (амітриптилін, докsepін, іміпрамін, кломіпрамін, флуоксетин, мапротилін, циталопрам, пароксетин - помірний);
- *α₁-адренолітичний* (амітриптилін, іміпрамін, кломіпрамін, докsepін, мапротилін, міансерин, циталопрам, ніаламід; міртазапін - слабкий);
- *антигістамінний* (амітриптилін, кломіпрамін, докsepін, мапротилін, циталопрам; міртазапін - помірний).

Інші ефекти:

- *снодійний* (міансерин);
- *анальгезивний* (докsepін, амітриптилін, іміпрамін, кломіпрамін, іміпрамін, інгібітори зворотного захоплення серотоніну);
- *антифобічний* (інгібітори зворотного захоплення серотоніну);
- *анорексигенний* (інгібітори зворотного захоплення серотоніну);
- *потенціювальний* посилює дію наркотичних анальгетиків за рахунок збільшення їх подібності до опіоїдних рецепторів (іміпрамін);
- *антистресовий* (тіанептин);
- *мнемотропний* - підвищення концентрації уваги і поліпшення процесів мислення (мілнаципран, піразидол);
- *спазмолітичний, противиразковий, міорелаксуючий, протисудомний, судинорозширювальний* (докsepін).

Показання до застосування та взаємозамінність антидепресантів

- *депресивні стани різної етіології*, у тому числі депресії при шизофренії, органічних захворюваннях нервової системи (паркінсонізм, деменції, інсульті, пухлинах, посттравматичних розладах); алкоголізмі, старечих психозах, маніакально-депресивних і клімактеричних психозах, атеросклерозі (всі препарати);

- атипові депресії* (інгібітори MAO-A, селективні інгібітори зворотного захоплення серотоніну);
- *алкоголізм* (піразидол, моклобемід, іміпрамін, флуоксетин, тіанептин);
 - *енурез* (іміпрамін, кломіпрамін, амітриптилін);
 - *панічні розлади* (флуоксетин, сертралін, пароксетин, інгібітори MAO-A);
 - *нав'язливі стани* (інгібітори зворотного захоплення серотоніну, кломіпрамін);
 - *фобії* (інгібітори зворотного захоплення серотоніну, інгібітори MAO, кломіпрамін).

Трициклічні

Амітриптилін

Синоніми: Триптизол, Триптил, Елівел

Застосування: депресивна фаза маніакально-депресивного психозу, всі інші типи ендогенних депресій, інволюційні депресії, депресивний синдром, при шизофренічних психозах (на фоні продовження терапії нейролептиками), депресії при органічних порушеннях головного мозку, депресії після лікування резерпіном, реактивні депресії, невротичні депресії, енурез, подразнення товстого кишечника.

Депресії дитячого віку, що супроводжуються тривожним станом і страхом, підвищеною чутливістю, уникнення спілкування, змішані емоційні порушення і порушення поведінки з переважанням почуття тривоги, неповноцінності і нав'язаних станів, дитячий енурез.

Меліпрамін (Депринол, Іміпрамін)

Застосування: при депресивних станах різної етіології, особливо при астенодепресивних станах, інволюційній клімактеричній депресії, реактивній депресії, при алкогольних депресіях.

Селективні інгібітори зворотнього захоплення серотоніну

Селективні інгібітори зворотнього захоплення серотоніну вибірково інгібують зворотнє нейрональне захоплення серотоніну у синаптичній щілині, що призводить до його накопичення там і до посилення його дії.

Флуоксетин (Портал, Депрекс, Флувал, Флуксоніл) Показання. Великі депресивні епізоди/розлади, нав'язливо-маніакальні розлади, нервова булімія.

Сертралін (Золофт)-препарат нового покоління, застосовують для лікування тяжких депресивних та тривожних станів. Застосовують для симптоматичного лікування депресивних станів різної етіології, в тому числі тих, що супроводжуються відчуттям тривоги, за наявності та відсутності манії в анамнезі, для лікування посттравматичних стресових і панічних розладів.

Рослинні комбіновані та інші антидепресанти

Підвищують зворотнє захоплення серотоніну нейронами кори головного мозку і гіпокампу, пригнічують активність MAO (гіперіцин).

Гіперіцин (Деприм, Туриневрин)

Показання для застосування. Депресивні розлади легкого та середнього ступеня тяжкості, що супроводжуються такими симптомами, як пригнічений настрій, відчуття хронічної втоми, емоційна виснаженість, зниження працездатності.