

Практичне заняття № 15. НЕЙРОЛЕПТИКИ. ТРАНКВІЛІЗАТОРИ. ПСИХОСЕДАТИВНІ ЗАСОБИ

Актуальність теми. Нейролептики і транквілізатори — психотропні препарати з депримуєчим (пригнічуючим) впливом на ЦНС. Під депресантами ЦНС розуміють речовини різного походження, здатні знижувати збудливість вищих відділів ЦНС. Нейролептики — група психотропних препаратів з первинною блокуючою дією на певні медіаторні системи мозку — мають здатність купірувати психомоторне збудження різного генезу і послабляти розлади сприйняття, мислення і соціальної поведінки у рамках психозу.

Транквілізатори близькі до нейролептиків, але здатні вибірково пригнічувати явища емоційної нестійкості, напруженості, тривоги, страху (антифобічне), послабляють прояви дезадаптації до несприятливих чинників зовнішнього середовища, тобто мають протитривожну (анксіолітичну) дію. Препарати цієї групи різною мірою чинять протисудомну, міорелаксантну, седативно-снودійну, вегетостабілізуючу дії. Уведення транквілізаторів в клінічну практику значно розширило можливості лікування ряду нервових і психічних захворювань.

Кількість психотропних засобів, використовуваних в клінічній практиці, має тенденцію до збільшення і, на жаль, застосування їх виходить з під лікарського контролю. Психоседативні засоби мають широкий фармакологічний спектр від психоседативної до вегетотропної і спазмолітичної дії.

I. Самостійна робота

Контрольні питання

НЕЙРОЛЕПТИКИ (антипсихотики, нейроплегіки)

1. Загальна характеристика. Історія створення. Класифікація:

1) Похідні *фенотіазину* (типові нейролептики):

- аліфатичні похідні — аміназин, левомепромазин;
- піперазинові похідні — етаперазин, трифтазин, фторфеназин, фторфеназин-деканоат;
- піперидинові похідні — неупетил.

2) Похідні *бутирофенону* — галоперидол, трифлуперидол, дроперидол;

3) Похідні *дифенілбутилпіперидину* — флуспірилен, пімозид;

4) Похідні *бензаміду* — сульпірид (еглоніл), сультоприд, тіаприд, метоклопрамід* (церукал, реглан);

5) Похідні *різних хімічних класів* — резерпін, хлорпротиксен, азалептин (клозапін).

2. Фармакокінетика нейролептиків.

* Застосовується в гастроентерології.

3. Механізм нейролептичної (антипсихотичної) дії. Фармакодинамічні ефекти нейролептиків.

4. Порівняльна характеристика різних груп. Препарати пролонгованої дії (флуспірилен, пімозид, фторфеназин-деканоат).

5. Показання до застосування.

6. Небажані ефекти і протипоказання до призначення. Лікування нейролептичного паркінсонізму.

ТРАНКВІЛІЗАТОРИ (анксіолітики)

1. Загальна характеристика. Класифікація за **хімічною структурою**:

- похідні *бензодіазепіну* (типів): 1,4-бензодіазепіну — хлордіазепоксид, діазепам, феназепам, лоразепам, флуразепам, альпразолам, нітразепам, клоназепам, нозепам (оксазепам), мезапам, гідазепам та ін.; 1,5-бензодіазепіну — клобазам; 2,3-бензодіазепіну — тофізопам (грандаксин);
- похідні *різних хімічних груп* — мебікар, грандаксин, амізил, літоніт, фенібут та ін.

2. Фармакодинаміка. Класифікація за **механізмом дії**:

- *прямі агоністи бензодіазепінових рецепторів* комплексу ГАМК_A-рецептор-хлоріонний канал — похідні бензодіазепіну (діазепам, оксазепам, лоразепам та ін.);
- *прямі агоністи серотонінових рецепторів* — буспірон та ін.;
- *різного механізму дії* — амізил, мепробамат, тріоксазин та ін.

3. Фармакокінетика. Класифікація за **тривалістю дії** :

- *короткочасної* ($T_{1/2}$ до 6 год) — тріазолам, мідазолам.
- *середньої* (6-24 год) — лоразепам, нозепам, флунітразепам та ін.
- *тривалої* ($T_{1/2}$ понад 24 год) — нітразепам, феназепам, діазепам, феназепам, флуразепам (проліки, $T_{1/2} \approx 100$ год) та ін.

4. Показання до призначення. Класифікація за **спектром гіпнотичної дії** :

- *седативні* («великі», нічні) — нітразепам, флуразепам, діазепам, феназепам та ін.
- *денні* («малі»), такі, що мають стреспротективну активність з активуючим компонентом — мезапам, гідазепам, буспірон, мебікар.

5. Небажані ефекти і протипоказання до призначення. Гостре отруєння, лікування (*флумазеніл*). Формування лікарської залежності.

ПСИХОСЕДАТИВНІ ЗАСОБИ

1. Загальна характеристика. Класифікація:

- *рослинного походження* — валеріана лікарська, пустирник, пасифлора, шлемник байкальський, півонія, ін. і на їх основі препарати (новопасит, персен-форте, кардіофіт та ін.);
- *броміди* — натрію і калію бромід;
- *комбіновані* — валокордин (бромізовалеріанової кислоти етиловий ефір + фенобарбітал + м'ятна і хмелева олія + етанол), корвалол (як у валокордину, але без хмелевої олії), валокормід (настоянки валеріани, конвалії, беладони

(красавки) + бромід натрію + ментол), валоседан (екстракт валеріани + настоянка хмелю + глоду + ревеню + барбітал натрію й етанол), мікстура Кватера (настій валеріани + настій м'яти + натрію бромід + магнію сульфат + амідопірин + кофеїн), мікстура Іванова-Смоленського (настій валеріани + натрію бромід + амідопірин + барбітал-натрію) та ін.

2. Фармакодинаміка. Показання і протипоказання до застосування.

Перелік практичних робіт. Виписати рецепти на препарати з вказівкою їх застосування (окремо від рецепта!):

№ п/п	Назва препарату	Форма випуску
1.	Аміназин (<i>Aminasinum</i>) син.: хрорпромазин	Драже по 0,025; 0,05 і 0,1; табл. по 0,01; амп. 2,5 % р-ну по 1; 2; 5, і 10 мл
2.	Етаперазин (<i>Aethaperazinum</i>)	Табл. по 0,004; 0,006 і 0,01
3.	Галоперидол (<i>Haloperidolum</i>)	Табл. по 0,0005; 0,001; 0,002; 0,005 і 0,01; амп. 0,5 % р-ну по 1 мл; фл. 0,2% р-ну по 10 мл
4.	Дроперидол (<i>Droperidolum</i>)	Амп. 0,25% р-ну по 2; 5 і 10 мл
5.	Таламонал (<i>Thalamonal</i>)	Амп. по 2 мл
6.	Флушпірилен (<i>Fluspirilenum</i>)	Амп. по 2 мл суспензії (1 мл — 0,002)
7.	Сульпірид (<i>Sulpiridum</i>) син.: еглоніл	Капс. по 0,05
8.	Азалептин (<i>Azaleptini</i>) син.: клозапін, лепонекс	Табл. по 0,025 і 0,05; амп. 2,5% р-ну по 2 мл
9.	Хлозепід (<i>Chozepidum</i>) син.: хлордіазепоксид, еленіум	Табл., драже, капс. по 0,005; 0,01 і 0,025
10.	Діазепам (<i>Diazepam</i>) син.: седуксен, сибазон, реланіум, валіум	Табл. по 0,0001; 0,002 і 0,005; амп. 0,5% р-ну по 2 мл
11.	Феназепам (<i>Phenazepamum</i>)	Табл. по 0,0005; 0,01 і 0,0025; амп. 0,3% р-ра по 1 мл
12.	Гідазепам (<i>Gidazepamum</i>)	Табл. по 0,02 і 0,05
13.	Мікстура з настоєм кореня валеріани (<i>Valeriana</i>), РД-0,5, натрію броміду (<i>Natrii bromidum</i>), РД-0,3	
14.	Настойка пустирника (<i>T-ra Leonuri</i>)	Фл. по 50 мл
15.	Валокордин (<i>Valocordin</i>)	Фл. по 20 мл

Завдання для самоконтролю. Виберіть правильні відповіді.

1. Фармакологічними властивостями нейролептиків є:
 - А. Усувають психомоторне збудження

- В. Антипсихотичне (усувають марення і галюцинації)
 - С. Проявляють гіпертензивну дію
 - Д. Знижують температуру тіла тільки при гіпертермії
 - Е. Антиеметичне (протиблювотне)
2. До небажаних ефектів аміназину відносять:
- А. Порушення ендокринної функції
 - В. Місцевопоздразнювальна дія
 - С. Пригнічення лейкопоезу (агранулоцитоз)
 - Д. Ортостатичний колапс
 - Е. Екстрапірамідні розлади
3. Додаткова седативна дія аміназину зумовлена:
- А. А. Блокадою центральних D₂-дофамінорецепторів
 - В. В. Центральним α-адреноблокуючим ефектом
 - С. С. Блокадою центральних 5HT₂-рецепторів
 - Д. Блокадою центральних H₁-гістамінорецепторів
 - Е. Центральним ефектом M-холіноблокуючим ефектом
4. Ефектами транквілізаторів є:
- А. Активація вегетативної системи
 - В. Протитривожна дія
 - С. Протисудомна дія
 - Д. Стрес-протекторна дія
 - Е. Пригнічення дії засобів, що депримують ЦНС
5. Небажані ефекти транквілізаторів:
- А. Порушення координації рухів
 - В. Сонливість
 - С. Гіпертензія
 - Д. Лікарська залежність
 - Е. Тератогенність, ембріотоксичність

II. Аудиторна робота

1. Ознайомитися з колекцією препаратів.
2. Робота з тестами (Крок-1).
3. Виписати рецепт і обґрунтувати вибір препарату:
 - 1) для купірування маніакального збудження;
 - 2) нейролептик для нейролептанальгезії;
 - 3) при нейролептичному паркінсонізмі;
 - 4) при блювоті центрального походження;
 - 5) симпатолітик, що має нейролептичну активність;
 - 6) при невротичній інсомнії;
 - 7) для усунення емоційної напруженості;
 - 8) в комплексній терапії гіпертонічної хвороби;
 - 9) анксиолітик з виразною протисудомною дією;

- 10) анксиолітик з виразною міорелаксатною дією;
- 11) транквілізатор з менш вираженим снодійним ефектом;
- 12) при болях в ділянці серця невротичного походження;
- 13) седативний засіб у мікстурі.

Список літератури:

1. Фармакологія : підручник для студ. медичних та стоматологічних ф-тів вищих мед. навч. закладів України : вид. 4-е виправ. та переробл. / [І.С.Чекман, В.М. Бобирьов, В.Й. Кресюн та ін.]. – Вінниця : Нова книга, 2020. – 472 с.
2. Фармакологія : підручник для студ. медичних ф-тів вищих мед. навч. закладів України : вид. 4-е виправ. та переробл. / [Чекман І.С., Горчакова Н.О., Казак Л.І. [та ін.]; за ред. проф. І. С. Чекмана]. – Вінниця : Нова книга, 2017. – 784 с.
3. Лікарська рецептура зі загальною фармакологією : навч. посібник : 2-ге вид., переробл. і доповн. / [В.Й. Кресюн, В.В. Годован]. – Одеса : Одес. нац. мед. ун-т, 2017. – 280 с.
4. Фармакологія в рисунках і схемах : навч. посібник / В. В. Годован ; [за ред. В. Й. Кресюна] ; Одес. нац. мед. ун-т. - Вінниця : Нова Книга, 2019. - 462 с.