



**ЗАСОБИ, ЯКІ ВПЛИВАЮТЬ НА
ЦЕНТРАЛЬНУ НЕРВОВУ СИСТЕМУ**

**«Фармакологія наркотичних та
ненаркотичних анальгетиків»**

Психотропні засоби



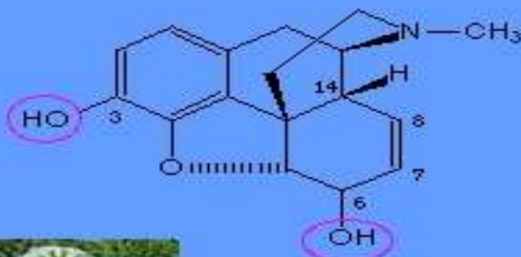
**препарати,
що пригнічують ЦНС**

- засоби для наркозу
- Снодійні,
протисудомні
- Нейролептики
(антипсихотичні)
- Транквілізатори
(анксіолітики)
- Седативні засоби
- Анальгетики
(наркотичні, ненаркотичні)

**препарати, які
стимулюють ЦНС**

- Психомоторні
стимулятори
- Антидепресанти
- Ноотропні засоби
- Аналептики
- Адаптогени

Narcotic Analgesics



Morphine



Heroin



C. Ophardt, © 2003

Наркотичні анальгетики

Наркотичні анальгетики - група центральних знеболюючих засобів, які усувають всі види чутливості, але зберігають свідомість. Їх дія розповсюджується на емоційний стан, свідомість та здатність викликати залежність

КЛАСИФІКАЦІЯ ОПІАТНИХ РЕЦЕПТОРІВ ТА ЇХ ФУНКЦІОНАЛЬНЕ ЗНАЧЕННЯ

μ (мю)

Аналгезія, пригнічення дихання, ейфорія,
розвиток залежності, седативний ефект,
закрепи, міоз

κ (каппа)

Аналгезія, седативний ефект,

δ (дельта)

Аналгезія, ейфорія, порушення поведінки

σ (сігма)

Манія, галюцинації, мідріаз

Мак снодійний





КЛАСИФІКАЦІЯ НАРКОТИЧНИХ АНАЛЬГЕТИКІВ

I. Агоністи опіатних рецепторів:

1. Препарати опія: **Морфін, Омнопон, Кодеїн.**

2. Синтетичні засоби:

а) похідні пиперидину: **Промедол, Фентаніл**

б) похідні фенантрени: **Трамадол**

II. Агоністи-антагоністи та часткові агоністи опіатних рецепторів:

Пентазоцин, Бупренорфін

III. Антагоністи опіатних рецепторів:

Налоксон, Налтрексон

Механізм знаболюючої дії

-  **Порушення сумарної здатності підпорогових больових імпульсів в thalamus opticus**
-  **Порушення межнейронної передачі больових імпульсів від таламуса в кору головного мозку**
-  **Порушення сприйняття больового відчуття (дія на кору)**
-  **Стимуляція викиду ендогенних антиноцицептивних речовин (енкефалінів та ендорфінів)**

Механізм дії (продовження)

“мозаїчна дія” на ЦНС

Пригнічуюча дія

- Частота та глибина дихання (дихальний центр)
- Кашель (кашльовий центр)
- Психоемоційна сфера (поверхневий сон)

Стимулююча дія

- Звуження зіниці (центр окорухового нерву)
- Брадикардія, бронхоспазм (центр блукаючого нерву)
- Ейфорія (стан повного психологічного комфорту, який супроводжується приємними емоційними та фізичними відчуттями)

Двояка дія

- Блювотний центр (великі дози – збуджують, малі – пригнічують)

Основні властивості наркотичних анальгетиків :

- ▣ **Сильна анальгезуюча активність**, яка забезпечує можливість їх використання в якості вискоєфективних болетамуючих засобів при травмах та захворюваннях з вираженим больовим синдромом;
- ▣ Особливий вплив на ЦНС людини, який полягає в розвитку **ейфорії** та формуванні при повторному застосуванні синдромів **фізичної та психічної залежності**;
- ▣ Розвиток больового синдрому – **абстиненції** у людей з синдромом фізичної та психічної залежності при утриманні їх від прийому анальгетичного препарата;
- ▣ Усунення токсичних проявів на ЦНС, порушень серцевої діяльності, а також анальгезії **специфічними антагоністами**.



Фармакодинаміка наркотичних анальгетиків

- Болетамуюча дія
- Протикашльова дія
- Блювотна (протиблювотна) дія
- Пригнічення дихання
- Потенціювання дії наркотичних, снодійних та місцевоанастезуючих засобів
- Вплив на свідомість, настрій, емоції
- Гіпно-седативна дія
- ↓ функцій ССС: брадикардія та ↓АТ
- ↓ тонусу СЕЧОВОГО МІХУРА та затримка сечі
- Обстипація (закрепи)

ПОКАЗАННЯ ДО ПРИЗНАЧЕННЯ:

-  перед оперативним втручанням та в післяопераційний період
-  тяжкі травми, опіки (профілактика больового шоку)
-  неоперабельні злоякісні новоутворення (для полегшення душевних та фізичних страждань)
-  при болях ішемічного (інфаркт міокарду, стенокардія) або спастичного (ниркова, печінкова колька) генеза
-  гострий набряк легень
-  кашель центрального походження

Побічні ефекти наркотичних анальгетиків

- ☠ Пригнічення дихання
- ☠ Блювота (збудження пускової зони блювотного рефлексу)
- ☠ брадикардія (підвищений тонус центра n. vagus)
- ☠ Атонія ШКТ та спазм сфінктерів , закрепи)
- ☠ Підвищення тонуся гладенької мускулатури сечовидільної системи та жовчного міхура (затримка сечі, холестаза)
- ☠ Бронхоспазм
- ☠ Лікарська залежність (наркоманія)



Найбільш небезпечним побічним ефектом наркотичних анальгетиків є морфінізм

Психічна залежність (ейфорія) (активізація в корі головного мозку центрів задоволення та радості, пригнічення хвилювань. Формується стан блаженства, відсутності проблем. Сон при введенні морфіна яскравий, із сновидіннями).

Фізична залежність, яка може проявитися вже після 6-10 ін`екцій та супроводжується явищами абстиненції

Гостре отруєння морфіном та опіатами



💧 Симптоми:

Головокружіння
Нудота, блювота,
липкий холодний піт
Загальна слабкість,
сонливість, яка
переходить в
коматозний стан
Бліда та цианотична
шкіра, зниження
температури тіла
Слабкий пульс,
зниження АТ,
Часте поверхневе
дихання

Смерть
настає в результаті
зупинки дихання
(різке пригнічення
дихального центру)

Диференціально-діагностичні ознаки:

- 👁️ Звуження зіниці (міоз)
- 👁️ Дихання при введенні морфіна неглибоке, типа Чейн-Стокса
- 👁️ Посилення спинальних рефлексів (колінних)

Допомога при гострому отруєнні морфіном та опіатами

- ☼ **Naloxon 0,4-1,2 мг в/в (антагоніст опіоїдних рецепторів)**
- ☼ **Промивання шлунка 0,05-0,1% р-ном KMnO_4 (морфін може секретуватися залозами шлунка та повторно всмоктуватись), сорбенти (активоване вугілля)**
- ☼ **Atropini sulfas, щоб усунути вагусні ефекти, спазмолітики для профілактики бронхоспазма**
- ☼ **Катетеризація сечового міхура**
- ☼ **Сольові послаблюючі засоби, форсований діурез**
- ☼ **Інгаляції карбогеном (5-7% CO_2 и 93-95% O_2)**

Абстинентний синдром

проявляється через декілька годин після зупинки введення наступної дози

- ✓ слюзотеча
- ✓ біли в епігастральній ділянці, тремор.
- ✓ активація адренергічних процесів: підвищення АТ, часте дихання, біль в м'язах (бета-адреноблокатори, нейролептики, центральні м-холінолітики).
- ✓ при абстиненції виникає страх, тривожність, неспокій. Застосовують препарати, які сприяють детоксикації організму.

**«Если морфин (как и другие
наркотические анальгетики)
применяется ТОЛЬКО для облегчения
боли, пристрастия к нему, как к
наркотику НЕ ВОЗНИКАЕТ»**

Р. Мелзак
(лауреат Нобелевской премии
за фундаментальные и
клинические исследования
боли и обезболивания)

Протипокази до застосування наркотичних анальгетиків

- Біль при хронічних захворюваннях
- Діти до 2 років
- У дітей від 2 до 6 років та у літніх людей –дуже обережно (можливо пригнічення дихального центру)
- Вагітність, лактація
- Знеболювання пологів (пригнічення дихального центру плода), крім **промедолу**
- Черепно-мозкові травми, крововиливи в мозок (підвищення внутрішньочерепного тиску)
- Захворювання, що супроводжуються пригніченням дихального центру, бронхіальна астма

Ненаркотичні анальгетики

**(нестероїдні
протизапальні засоби,
НПЗЗ)**

НЕНАРКОТИЧНІ АНАЛЬГЕТИКИ

(неопіоїдні, нестероїдні протизапальні засоби, НПЗЗ) – це лікарські препарати різної хімічної структури, які володіють протизапальною, анальгезуючою та жарознижуючою діями та не мають наркогенного потенціалу.

НПЗЗ в клінічній практиці

- На сьогодні фармацевтичний ринок надає практичному лікарю 104 НПЗЗ, які представлені 3009 торговими марками. Причому цей ринок постійно поповнюється. Так, в останні роки з'явилися 16 нових препаратів, такі як лізину ацетилсаліцилат, ітеноксиам, мелоксиам, німесулід, лорноксиам, целекоксиб, рофекоксиб, вальдекоксиб, парекоксиб, еторикоксиб та ін.
- щорічно в світі НПЗЗ придбають на суму більше 6 млрд. долларів;
- мінімум 30 млн. людей на планеті щоденно використовують НПЗЗ, причому в зв'язку із старінням популяції це число постійно збільшується.

Основні ефекти НПЗЗ

Протизапальний

Анальгезуючий

Жарознижуючий

Антиагрегантний

**Імуно-
депресивний**

Класифікація НПЗЗ за хімічною будовою

1. Похідні саліцилової к-ти:

Ацетилсаліцилова
кислота (аспірин)

2. Похідні піразолону:

Анальгін (метамізол)
Бутадіон

3. Похідні аніліна:

Парацетамол

4. Похідні арилалканових кислот:

арилоцтової к-ти:

Диклофенак-натрій
(Ортофен, Вольтарен)

Арилпропіонової к-ти:

Ібупрофен, Кетопрофен,
Напроксен

гетероарилоцтової к-ти:

Кеторолак трометамин;

індолоцтової к-ти:

Індометацин, Суліндак

5. Препарати ін. хім. груп

антоанилової к-ти:

Мефенамова кислота

оксиками:

Мелоксикам (Моваліс)

ізонікотинової к-ти:

Амізон

інші: Німесулід (Месулід)

6. Коксиби

Целекоксиб, Рофекоксиб,
Еторикоксиб, Парекоксиб

Дві форми циклооксигенази (ЦОГ)

ЦОГ-1

Конститутивна

Синтезує

простагландини,
які регулюють функції
гомеостазу

Локалізація

- Слизова шлунка
- Нирки
- Тромбоцити
- Ендотелій

ЦОГ-2

Індуцибельна

Синтезує

простагландини, які
приймають участь в
розвитку запалення, болі,
лихоманки

КЛАСИФІКАЦІЯ НПЗЗ, ЯК ІНГІБІТОРІВ ЦИКЛООКСИГЕНАЗИ (ЦОГ)

1. Інгібітори переважно ЦОГ-1:

Ацетилсаліцилова кислота (аспірин) в дозах <375 мг;

2. Невибіркові інгібітори ЦОГ-1 и ЦОГ-2;

Диклофенак-натрій (вольтарен, ортофен)

ібупрофен (бруфен, солпафлекс, нурофен)

індометацин (метиндол)

ацетилсаліцилова кислота (в дозах >375 мг)

3. Інгібітори переважно ЦОГ-2:

Мелоксикам (моваліс)

Німесулід (Месулід, Німід, Найс)

4. Високоселективні інгібітори ЦОГ-2;

Целекоксиб (целебрекс)

Рофекоксиб (рофіка)

МЕХАНІЗМ ПРОТИЗАПАЛЬНОЇ ДІЇ

Препарати в більшості обмежують розвиток ексудативної та проліферативної фаз запалення, на альтерацію впливають мало.

Противапальний ефект пов'язаний з тим, що ці препарати:

Пригнічують утворення із арахідонової кислоти медіаторів болі, запалення та лихоманки – простагландинів, внаслідок чого знижується активність фермента ЦОГ-2 (індуцибельної)

Пригнічують синтез та вивільнення медіаторів запалення (серотоніну, гістаміну) із опасистих клітин;

Пригнічують активність гіалуронідази – фермента, який розщеплює гіалуронову кислоту, тим самим обмежують процес ексудації;

Інгібують синтез колагену фібробластами грануляційної тканини, пригнічують проліферативну фазу запалення.

МЕХАНІЗМ АНАЛЬГЕЗУЮЧОЇ ДІЇ

Анальгетичний ефект виникає через 0,5 – 2 години та є, насамперед, наслідком протизапальної дії.

Основний компонент – периферичний
(зменшення продукції альгогенів,
антиексудативна дія)

Центральний компонент - пов'язаний гальмуванням проведення больових імпульсів до кори головного мозку

МЕХАНІЗМ ЖАРОЗНИЖУЮЧОЇ ДІЇ

- Знижують температуру тіла (через *0.5-2 години*), тільки якщо вона підвищена, тобто при лихоманці, що пов'язано з інгібуванням синтезу простагландинів в центрі терморегуляції в гіпоталамусі.
- Значно посилюють тепловіддачу внаслідок розширення судин шкіри, слизових оболонок, підвищення функції потових залоз.
- На теплопродукцію практично не впливають.

Показання до застосування НПЗЗ

- Болі запального походження (артрити, міозіти, радикуліти, неврити)
- Головний, зубний біль
- Болі травматичного походження (через 3-4 дні)
- Ревматоїдний артрит, остеоартроз
- Гіпертермія
- Профілактика тромбозів
- Болі в ділянці органів малого тазу (дисменорея)

Acetylsalicylic acid



Жарознижуючий та
анальгезуючий ефект –
0,25-0,5 г

Протизапальний ефект
3,0 – 4,0 г на день
(артрити, міокардити
плеврити)

Як антитромботичний
препарат (інфаркти
міокарда, ІХС,
тромбози) –добова
доза 0,1- 0,325 мг

Analginum (metamizolum)



Baralgin (maxigan, spazgan, spazmalgon, trigan)



**Аналгетик +
спазмолітик**

Ампули

Таблетки

Суппозиторії

Paracetamol (Panadol, Efferalgan, Tylenol)

Таблетки

Суппозиторії

Сироп

Розчинні
таблетки

Капсули



Paracetamol



Panadol (Paracetamol)



Ketorolak (ketanov)

По анальгетичній активності перевершує аспірин, індометацин, диклофенак, наближується до опіоїдних анальгетиків

Практично не має протизапальної, жарознижуючої та антиагрегантної дії

Високо ефективний при післяопераційних болях, в стоматологічній практиці, знеболюванні пологів, травмах, коліках

Ketorprofen (Ketonal)

**Сильна анальгезуюча, протизапальна
та жарознижуюча дія**

**Застосовується для лікування артритів,
артрозів, болей різного генезу
(хірургічного, травматичного,
менструального, і т.і.)**

**Призначається всередину,
внутрішньом'язево, в формі
суппозиторіїв, мазі)**

Протизапальна активність

диклофенак натрія > індометацин > бутадіон >
ібупрофен > напроксен = мелоксикам =
целекоксиб = німесулід > ацетилсаліцилова
кислота.



Анальгетична активність

кеторолак > диклофенак натрія > анальгін >
індометацин > парацетамол > ібупрофен >
бутадіон = мелоксикам = целекоксиб

Побічні ефекти НПЗЗ

Ульцерогенна

дія (Диспепсія,
ерозії та виразки
шлунка
Ураження кишечника)

Гепатотоксичність
(підвищення печінкових
ферментів)

Нефротоксичність
(Порушення
 клубочкової
фільтрації, підвищення
АТ, набряки)

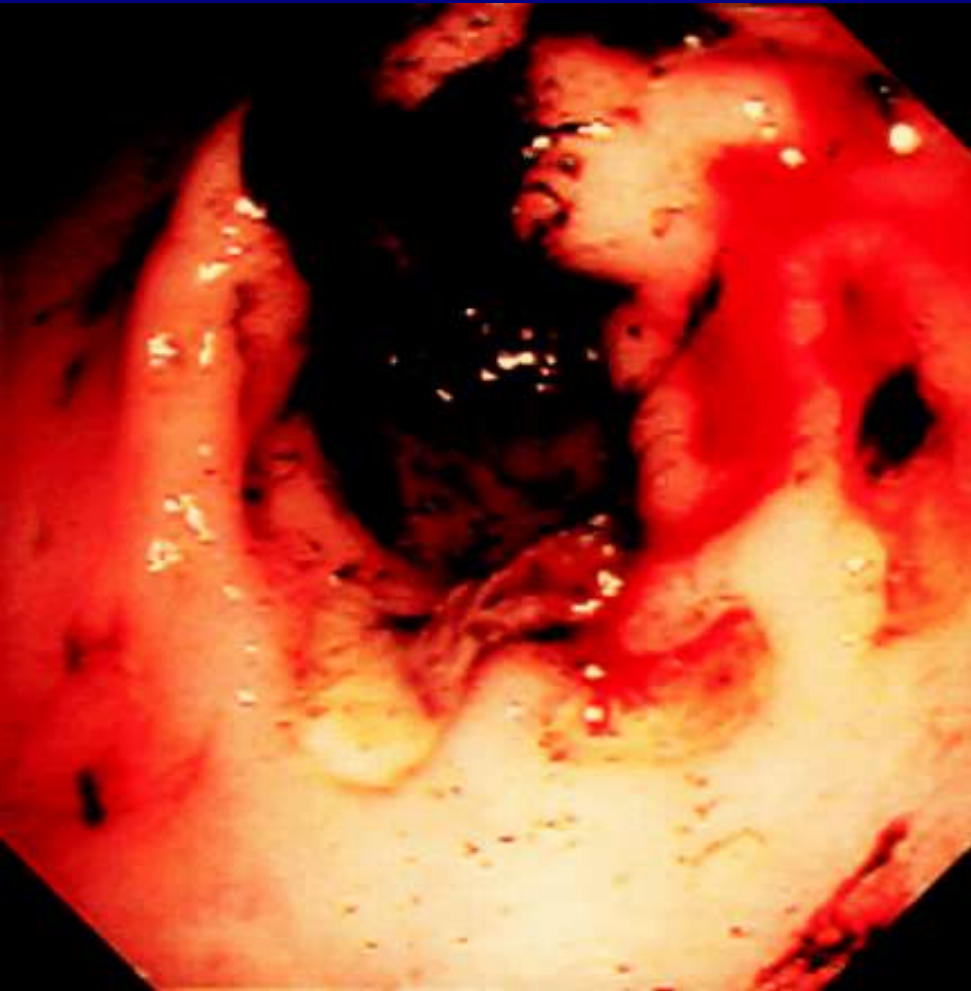
Неврологічні Головний
біль , головокружіння

Алергічні прояви
Зуд, кожная сыпь
Аспіринова астма

Гемотоксичність
Лейкопенія,
тромбоцитопенія

Інші
Стоматит, васкуліт,
панкреатит

ВИРАЗКОВІ УРАЖЕННЯ ВНАСЛІДОК ДІЇ НПЗЗ



**ТРИ ВИРАЗКИ (ОДНА З
КРОВОТЕЧЕЮ) В АНТРАЛЬНОМУ
ВІДДІЛІ ШЛУНКА**

**ТАКІ ВИРАЗКОВІ УСКЛАДНЕННЯ
Є ПРИЧИНОЮ 16 500 ЛЕТАЛЬНИХ
ВИПАДКІВ В США та 2000
ВИПАДКІВ В АНГЛІЇ ЩОРІЧНО**

засоби, що збуджують ЦНС

- ☺ Аналептики
- ☺ Психомоторні стимулятори
- ☺ Антидепресанти
- ☺ Ноотропні засоби
- ☺ Адаптогени

***“Объясните
людям значение
слов, и половина
недоразумений и
споров исчезнут
сами собой”***

Декарт



Аналептики - речовини, що стимулюють діяльність життєво-важливих центрів довгастого мозку (дихального та судинорухового)

Класифікація аналептиків:

- ⊗ Центральної дії: **Кофеїн**
(*Coffeinum-natrii benzoas*),
Бемегрид (*Bemegridum*),
Етимізол (*Aethymisolium*)
- ⊗ Рефлекторної дії – **Цитизин**
- ⊗ Змішаної дії – **Сульфокамфокаїн**
(*Sulfocamphocainum*), **Кордіамін**
(*Cordiaminum*)

Показання до застосування аналептиків:

- ⌘ Гострі отруєння нейротропними засобами депримуючого типу дії
- ⌘ В комплексі реанімаційних заходів при утопленні, ураженні електричним струмом, отруєнні угарним газом
- ⌘ гострі та хронічні розлади кровообігу;
- ⌘ шок, колапс, асфіксія
- ⌘ Гостра та хронічна серцева недостатність

Побічні ефекти:

💣 судоми мілких м'язів (мімічної мускулатури, кінцівок)

Підвищена збудливість ЦНС, неспокій, гіпертензія
безсоння,
епілепсія, підвищена судомна активність мозку



Психостимулятори

Психостимулятори –

препарати, здатні активувати психічну та фізичну діяльність організму. Під їх дією підвищується настрій, розумова активність, зникає втома, тимчасово знижується потреба у сні.

Кофеїн (Coffeinum)

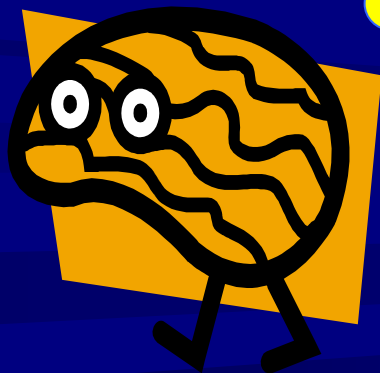
Покази до призначення ПСИХОСТИМУЛЯТОРІВ



- ☯ для підвищення психічної та фізичної працездатності
- ☯ при депресії,
- ☯ при астеничних станах,
- ☯ при енурезі у дітей,
- ☯ при патологічній сонливості, втомі

Странная вещь! Люди могут
жаловаться на все: на больной
желудок, на утомляемость, на
головную боль, на одышку, и
прочее, только не на
**СЛАБОСТЬ своих
УМСТВЕННЫХ
СПОСОБНОСТЕЙ**

И. Граве



Ноотропні засоби

- препарати, які покращують навчання, пам'ять та розумову діяльність, підвищують стійкість мозку до дії агресивних факторів.

Пірацетам (ноотропіл) – Pyracetatum

Аміналон (Aminalonum)

Покази до застосування:

- ✓ наслідки черепно-мозкових травм, інсультів,
- ✓ в геронтології.
- ✓ Розумова відсталість у дітей





АДАПТОГЕНИ

Це препарати, що провляють загальнотонізуючу дію на організм, викликають мя'ку стимулюючу дію, підвищуючи розумову та фізичну працездатність, підвищують можливості організму до пристосування

- Корень Жень-шеня - *Radix Ginseng*
- Екстракт Елеутерококку рідкий - *Extr. Eleyterococci fluidum*
- Настоянка лимонника – *Tinctura Schizandrae*
- Пантокрин – *Pantocrinum*

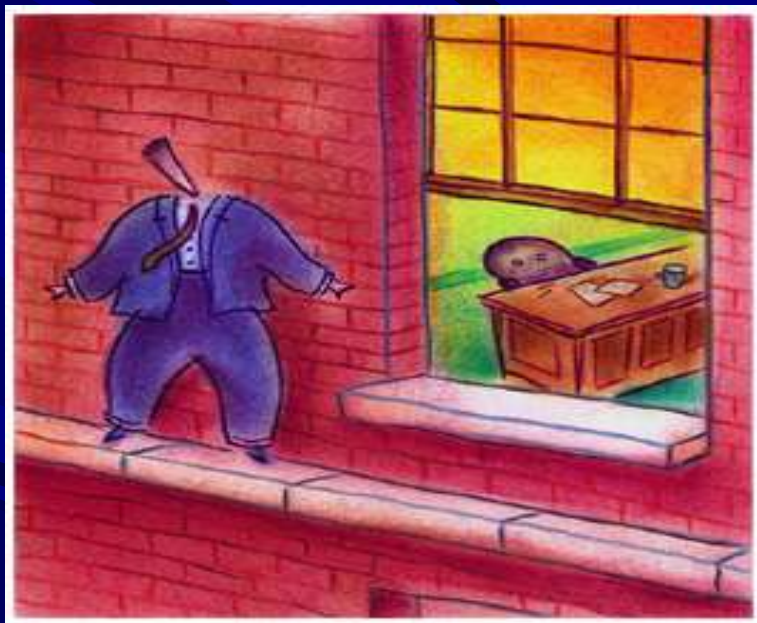
Застосування адаптогенів:

- Для підвищення працездатності **здорових** людей, які працюють в екстремальних умовах навколишнього середовища,
- при статичних і динамічних навантаженнях у **спортсменів**,
- у людей **похилого віку** при швидкому статичному стомленні
- Профілактика захворювань інфекційної та неінфекційної етіології, в період реконвалісценції.
- Лікування астеничних станів, неврастенії; гіпотонії, підвищеній сонливості ; вегетосудинній дистонії



Необхідно мати на увазі, що адаптогени є, перш за все, профілактичними засобами, оскільки їх ефект проявляється при тривалому систематичному використанні

Протипокази: гіпертонічна хвороба, підвищена збудливість, безсоння.



АНТИДЕПРЕСАНТИ

препарати, здатні
усувати синдроми
емоційного
пригнічення та депресії

■ Імізин – *Imizinum*, син.: Іміпрамін

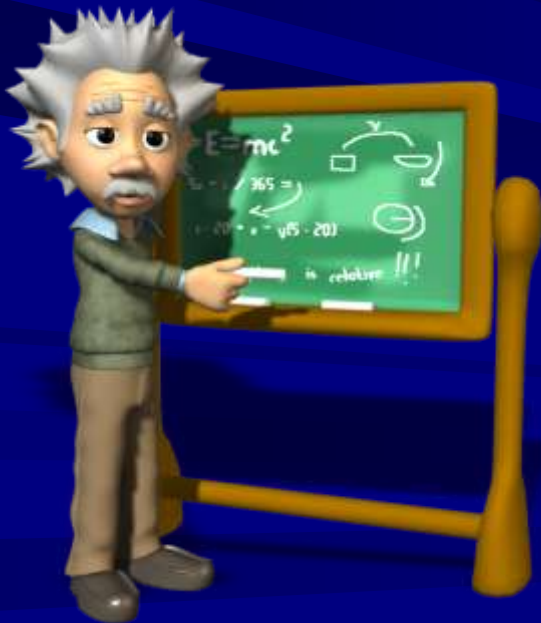
■ Амітриптилін – *Amitriptylinum*

■ Флуоксетин – *Fluoxetinum*

■ Ніаламід - *Nialamidum*

Покази до застосування антидепресантів

- 👍 Депресивні стани різного генезу;
- 👍 Психопатії,
- 👍 Неврози,
- 👍 Абстинентний синдром;
- 👍 Нервова булімія;
- 👍 Хронічний больовий синдром





Жизнь прекрасна!