

Ноотропные препараты

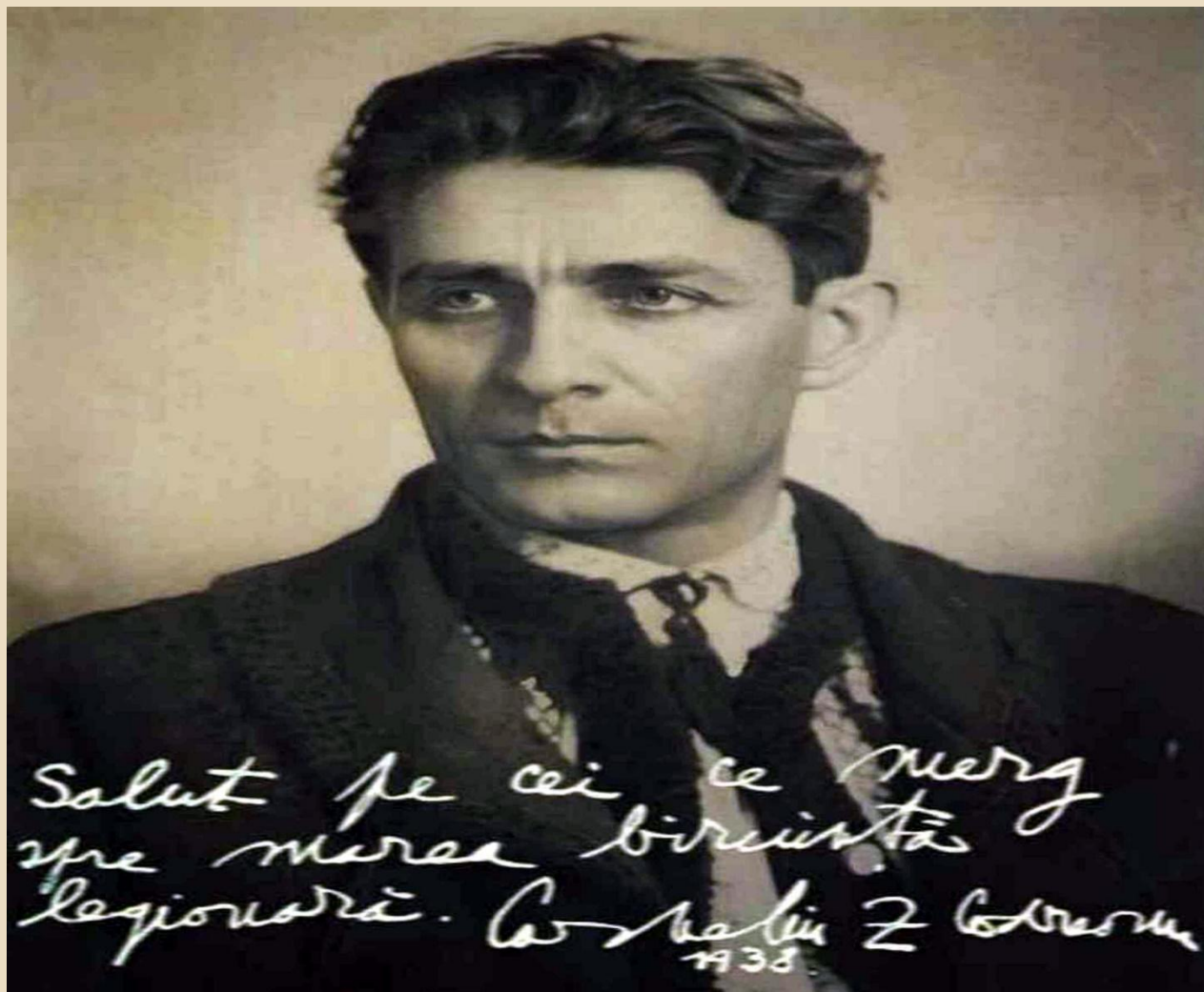
Подготовил Ефремов А.
А.



Ноотропы (греч. *noos* — мышление, разум; *tropos* — направление) — средства, оказывающие специфическое позитивное влияние на высшие интегративные функции мозга. Они улучшают умственную деятельность, стимулируют познавательные функции, обучение и память, повышают устойчивость мозга к различным повреждающим факторам, в т.ч. к экстремальным нагрузкам и гипоксии. Кроме этого, нейрометаболические стимуляторы обладают способностью снижать неврологический дефицит и улучшать кортикосубкортикальные связи.

Историческая справка

- В начале 60-х годов бельгийские фармакологи получили соединение, которое представляло собой гамма-аминомасляную кислоту, свернутую в кольцо и снабженную некоторыми дополнительными радикалами. Профессор К. Джурджеа и его сотрудники установили, что это соединение значительно улучшает память и облегчает процесс обучения, то есть влияет на высшие интеллектуальные функции мозга. Поскольку по-латыни "мышление и разум" - "noos", а "средство" - "tropos", новое лекарство получило название ноотропил. Все последующие лекарства с подобным действием стали называться ноотропными. Вещества этой группы улучшают интегративные процессы в мозге, память, а также повышают устойчивость мозга к стрессовым воздействиям.



В 1963 году бельгийскими фармакологами К. Джурджеа и его коллегами был синтезирован первый препарат этой группы — пирацетам, ныне известный в основном под коммерческим названием «ноотропил».

После успешного внедрения в лечебную практику пирацетама было синтезировано более 10 оригинальных ноотропных препаратов пирролидинового ряда.

Вслед за ними стали формироваться и другие группы ноотропных препаратов:

- Холинергические
- ГАМКергические
- Глутаматергические
- Пептидергические
- Кроме того, была идентифицирована ноотропная активность у некоторых ранее известных веществ.

Классификация

1. Пирролидоновые ноотропы (рацетамы) – пирацетам (ноотропил), фенотропил, оксирацетам, анирацетам.
2. Вещества, влияющие на синтез ГАМК – гаммалон (аминалон), пантогам, пикамилон, дигамм, фенибут, оксибутират натрия.
3. Холиномиметики центрального действия – холина хлорид, холина альфосцерат (глиатилин), ингибиторы ацетилхолинэстеразы (физостигмин, ривастигмин, ипидакрин).
4. Препараты нейроаминокислот – глицин, глутаминовая кислота, мемантин.
5. Церебральные вазодилататоры – винпоцетин, винкамин, винконат; ницерголин, пентоксифиллин; циннаризин, флунаризин, нимодипин.
6. Нейропротекторы-антиоксиданты – мексидол, дибунол, эмоксипин.
7. Пептидергические вещества – церебролизин, актовегин.
8. Производные пиридоксина – пиритинол (энцефабол).
9. Препараты Ginkgo biloba- билобил, танакан, мемоплант.
10. Энергодающие субстраты – рибоксин, АТФ.
11. Комбинированные препараты – инстенон.

Механизм действия ноотропных средств.

В основе механизма действия лежит изменение биоэнергетических процессов в нервной клетке:

- увеличивается потребление глюкозы и кислорода нейронами
- усиливается утилизация глюкозы
- активация аденилатциклазы
- усиление кругооборота АТФ
- стимулирование синтеза РНК и белков
- усиление в мозговой ткани обмена фосфатидилэтаноламина и фосфатидилхолина

Фармакодинамика ноотропов.

- Ноотропный эффект – влияют на задержку развития или нарушение высших корковых функций, повышают уровень суждений и критических возможностей мозга;
- психостимулирующее действие – устраняется апатия и психическая заторможенность;
- седативный эффект – уменьшается раздражительность и эмоциональная возбудимость;
- антиастеническое действие;
- мнемотропное действие (способствуют улучшению запоминания).
- антидепрессивное действие;
- адаптогенное действие (повышают устойчивость мозга к воздействию неблагоприятных факторов окружающей среды);

- антиэпилептическое действие – предупреждают деградацию личности при применении противоэпилептических средств;
- антипаркинсоническое действие;
- иммунокорректирующее действие;
- повышение уровня бодрствования сознания.
- проявляют антигипоксический эффект.

Показания к применению.

1. Олигофрения: лечение олигофрении ноотропами проводится с целью повышения интеллектуальных возможностей мозга, а также стимуляции обучаемости.
2. В геронтологической практике для лечения старческой деменции, в том числе при болезни Альцгеймера. Применение ноотропов позволяет сохранить интеллектуальные способности пожилых людей на более длительный срок.
3. Лечение алкогольного слабоумия.
4. Различные цереброваскулярные расстройства (последствия черепно-мозговых травм, инсультов) для ускорения и расширения процессов функциональной реабилитации.
5. Комплексная терапия депрессий.
6. Эпилепсия – в комплексной терапии с противоэпилептическими препаратами.
7. ИБС и другие заболевания, сопровождающиеся ишемией.

- ГАМК используется для применения в качестве лекарственного средства под названием "Аминалон". "Аминалон" нашел применение главным образом в гериатрической практике и при лечении детей с умственной отсталостью. Эффект его развивается медленно, требуется относительно длительный курс его применения. Несмотря на появление новых ноотропных препаратов, дающих в ряде случаев более выраженный эффект (пирацетам и др.), "Аминалон" лечебного значения не потерял.

Пирацетам

- Имеет по химической структуре сходство с ГАМК, однако в организме пирацетам в ГАМК не превращается и содержание ГАМК в мозге после применения пирацетама не повышается. Пирацетам усиливает синтез дофамина, повышает уровень норадреналина в мозге, влияет на другие нейромедиаторные системы мозга, включая аминокислотные (глутаматергическую и др.) и моноаминергические. Под влиянием пирацетама увеличиваются содержание ацетилхолина на уровне синапсов и плотность холинергических рецепторов.



Фенотропил

- *Фенотропил*, по сравнению с пирацетамом, содержит в структуре неполярную фенильную группу, поэтому лучше преодолевает гематоэнцефалический барьер. Фенотропил проявляет выраженное психостимулирующее действие. Побочный эффект фенотропила – повышенная раздражительность.

Пикамилон

- *Никотиноил гамма-аминомасляная кислота* в химическом отношении может рассматриваться как сочетание молекулы ГАМК и никотиновой кислоты. Применяют пикамилон (у взрослых) как ноотропное и сосудистое средство при нарушениях мозгового кровообращения легкой и средней тяжести, вегетососудистой дистонии, состояниях тревоги, страха, повышенной раздражительности, абстиненции у больных алкоголизмом, а также для повышения устойчивости к физическим и умственным нагрузкам. Используют препарат самостоятельно или в комплексной терапии.

Фенибут

- По химической структуре можно рассматривать как производное ГАМК, усиленной путем введения неполярной фенильной группы (бензольного кольца) для более легкого преодоления гематоэнцефалического барьера. Является ноотропом с анксиолитической активностью. Может вызывать привыкание, толерантность вырабатывается быстро. Применяют фенибут при беспокойстве, тревоге, страхе, бессоннице, для профилактики укачивания. Детям назначают при заикании, тиках, задержке речевого развития.

Мексидол

- Мексидол является ингибитором свободнорадикальных процессов, мембранопротектором, обладающим антигипоксическим, стресспротективным, ноотропным, противосудорожным и анксиолитическим действием.
- Препарат повышает резистентность организма к воздействию различных повреждающих факторов (шок, гипоксия и ишемия, нарушения мозгового кровообращения, интоксикация алкоголем и антипсихотическими средствами (нейролептиками)).
- Механизм действия препарата мексидол обусловлен его антиоксидантным, антигипоксантным и мембранопротекторным действием. Он ингибирует перекисное окисление липидов, повышает активность супероксиддисмутазы, повышает соотношение липид–белок, уменьшает вязкость мембраны, увеличивает ее текучесть.

Адаптогены

- *Адаптогены* – это группа ЛС, повышающих неспецифическую сопротивляемость организма и увеличивающих его устойчивость к воздействию неблагоприятных факторов внешней среды.
- **Классификация адаптогенов.**
 - *Препараты растительного происхождения.*
 - настойка жень-шеня;
 - экстракт элеутерококка;
 - настойка лимонника китайского;
 - препараты эхинацеи (настойка эхинацеи, имунал).
 - *Препараты животного происхождения.*
 - рантарин;
 - пантокрин.

Механизм действия адаптогенов.

- Активируют адаптивный синтез РНК и белков за счет мембранопротекторного действия и регуляции селективной проницаемости мембран. Антиоксидантное действие, которое реализуется путем повышения эндогенных антиоксидантов в организме. Ослабляют биохимические и функциональные сдвиги при стресс-реакциях.

Фармакодинамика.

- Адаптогенное действие – повышают устойчивость организма к воздействию экстремальных факторов;
- тонизирующее действие – улучшают функции ЦНС, не вызывая эйфории и не нарушая суточных ритмов;
- актопротекторное действие;
- повышают устойчивость организма к инфекционным агентам;
- антиоксидантное действие, которое реализуется путем повышения эндогенных антиоксидантов в организме;
- защитное действие при интоксикации ксенобиотиками.

Показания к применению:

- Неврозы и пограничные состояния.
- Астенические состояния.
- Общее ослабление функций организма после перенесенных заболеваний.
- Синдром хронической усталости (СХУ).
- Для профилактики стрессовых реакций.

Актопротекторы

Актопротекторы –это группа ЛС, повышающих физическую и умственную работоспособность в экстремальных условиях. К ним относятся следующие препараты:

1. Ацефен
2. Бемитил

Лекарственные средства повышают работоспособность при физических нагрузках, способствуют уменьшению проявлений астении, способствуют адаптации к действию экстремальных факторов (спортивная медицина, авиакосмическая медицина, медицина чрезвычайных ситуаций).

Спасибо