

Средства, влияющие на функции органов пищеварения

О.С.Медведев

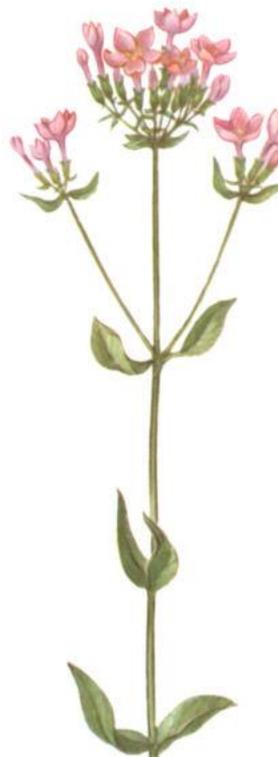
Москва, 2013

Средства, повышающие аппетит

- Горечи – препараты лекарственных растений



Полынь



Золототысячник



Аир
болотный



Трилистник

Настойка горькая - Tinctura amara

- трава золототысячника,
- корневища аира,
- листья трилистника,
- трава полыни,
- плоды кориандра

Средства, применяемые при

ожирении

Индекс массы тела

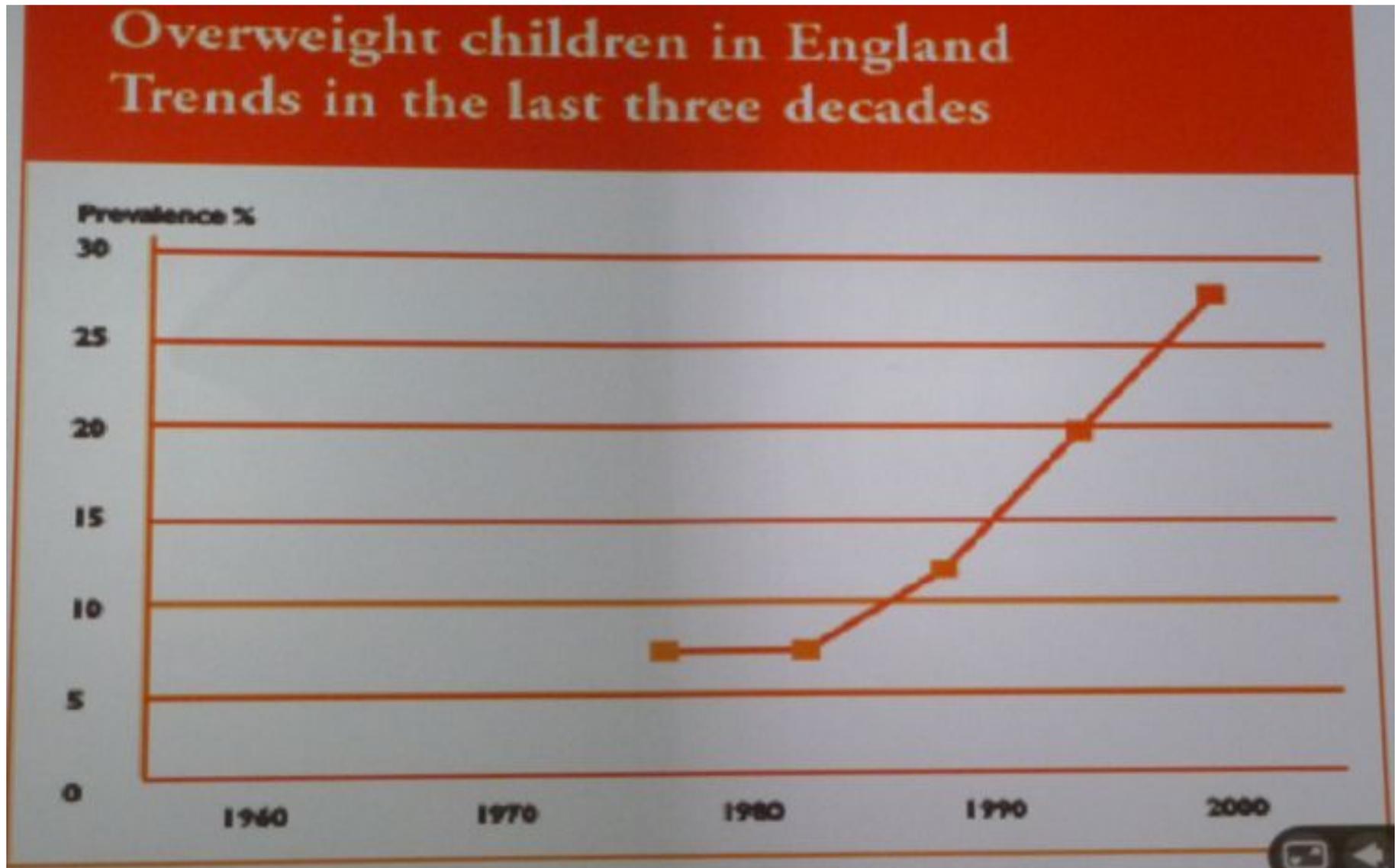
$$\text{ИМТ} = \text{вес (кг)} / \text{рост (м)}^2$$

Индекс массы тела	
18,5—24.9	Норма
25—29.9	Избыточная масса тела
>30	Ожирение

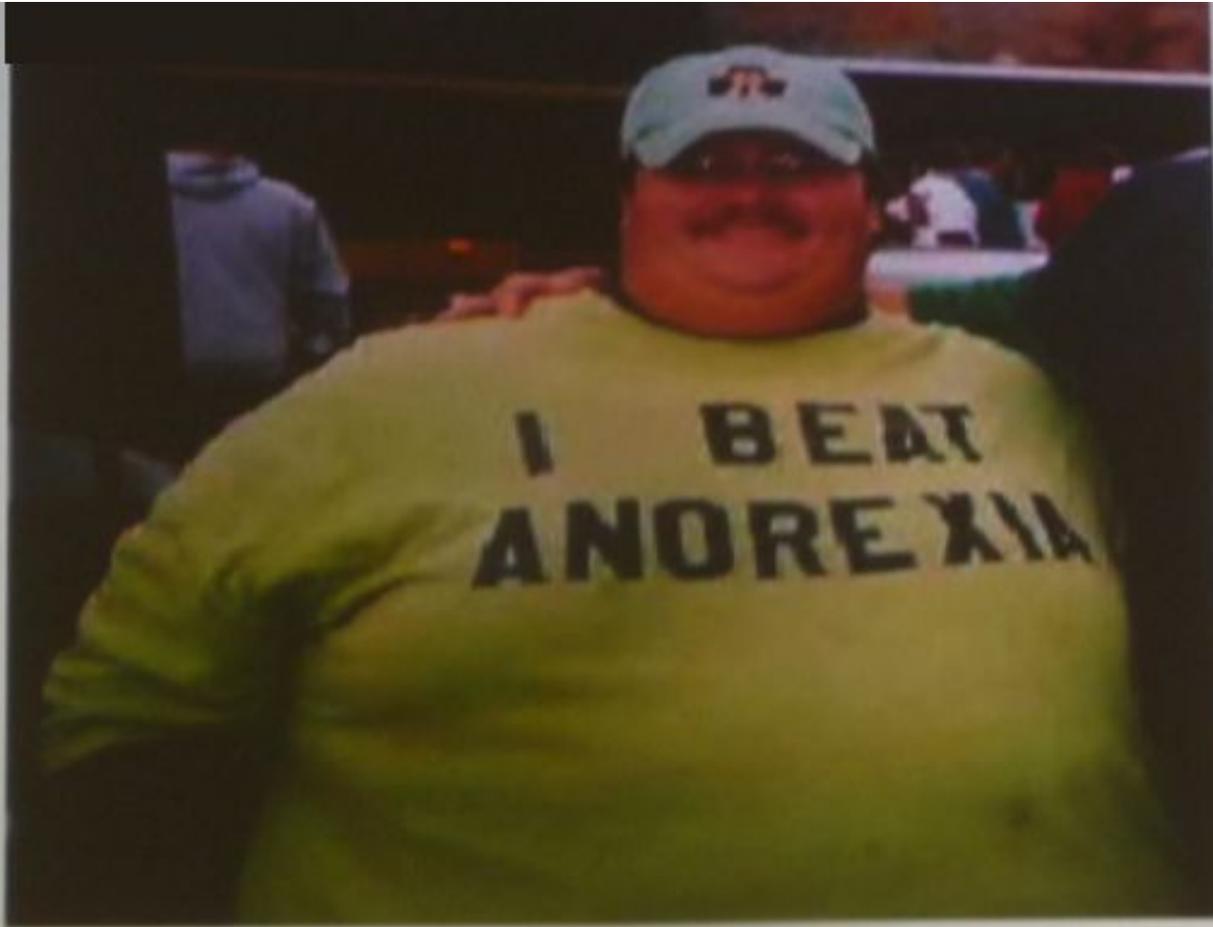
В США 64% населения имеют повышенный вес, из которых 4.7% имеет экстремальное ожирение (ИМТ>40).

По прогнозам ВОЗ к 2015 г. в мире будет 2.3 млрд людей с повышенным весом и 700 млн. человек-с ожирением

Проблемы с ожирением у детей



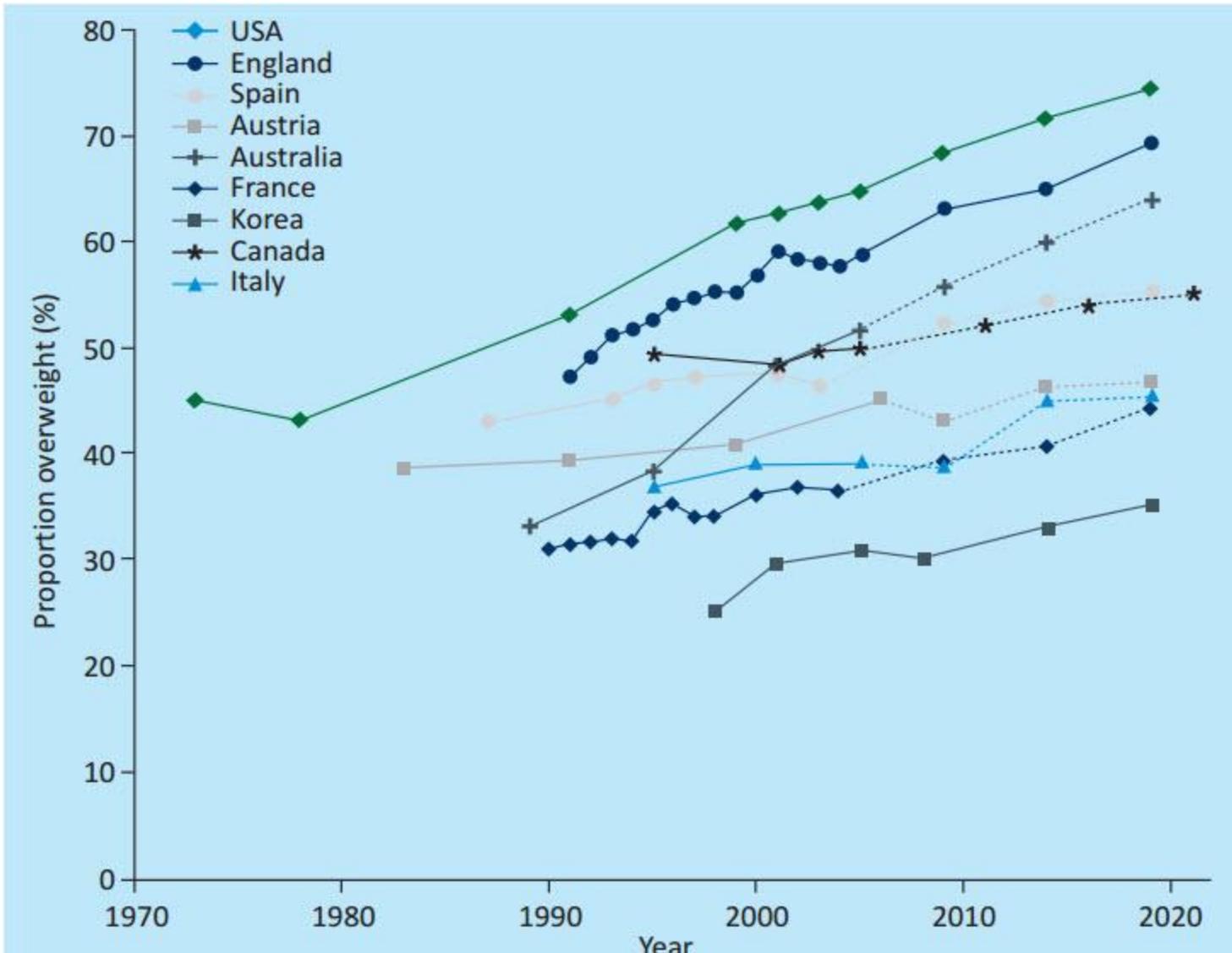
Проблемы с ожирением у взрослых



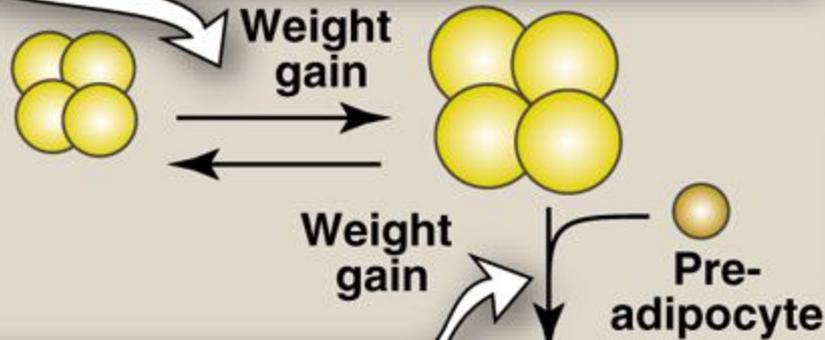
2007 Foresight Report:
£15.8bn annual cost to UK



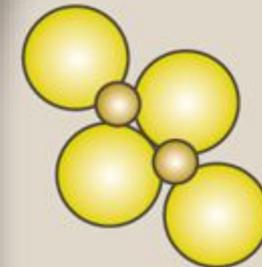
Figure 26.5 Identical twins with combined weight of 1,300 pounds. Note similarity in body shape.



Modest weight gain or loss in a non-obese person mainly affects the size, but not the number of adipocytes.



When adipocytes reach their maximum size, further weight gain is achieved by recruitment and proliferation of new pre-adipocytes.



Weight gain



Weight loss occurs mainly by a decrease in fat cell size.

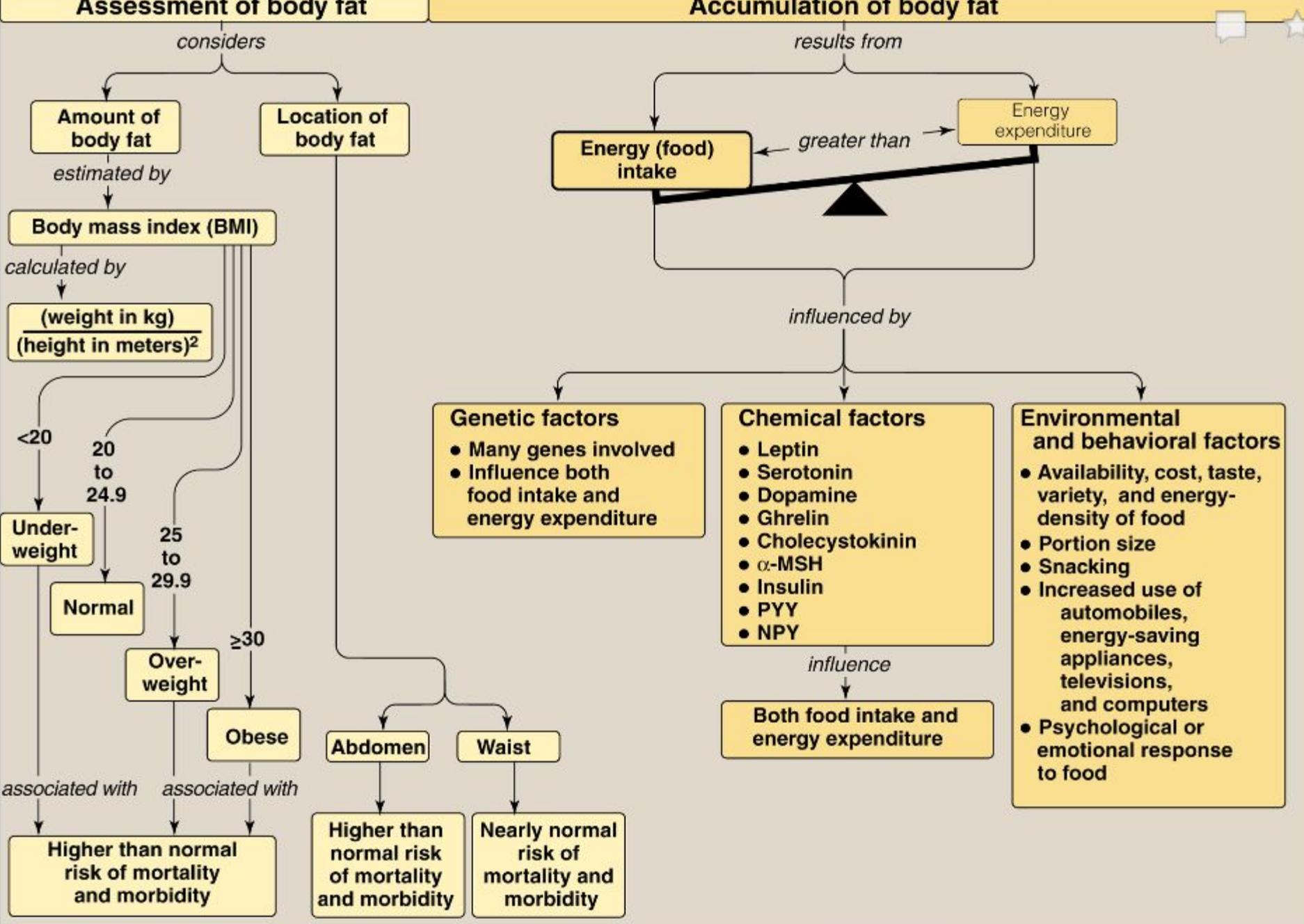


Figure 26.10 Key concept map for obesity.



Рис. 1. Риск развития сахарного диабета 2 типа в зависимости от индекса массы тела [8]

С.А.Бутрова, А.А.Плохая РМЖ, 2001, т.9, № 24

Затраты на лечение ожирения в США – 426 млн USD в 2000г.-
-- 1,3 млрд в 2010 г.

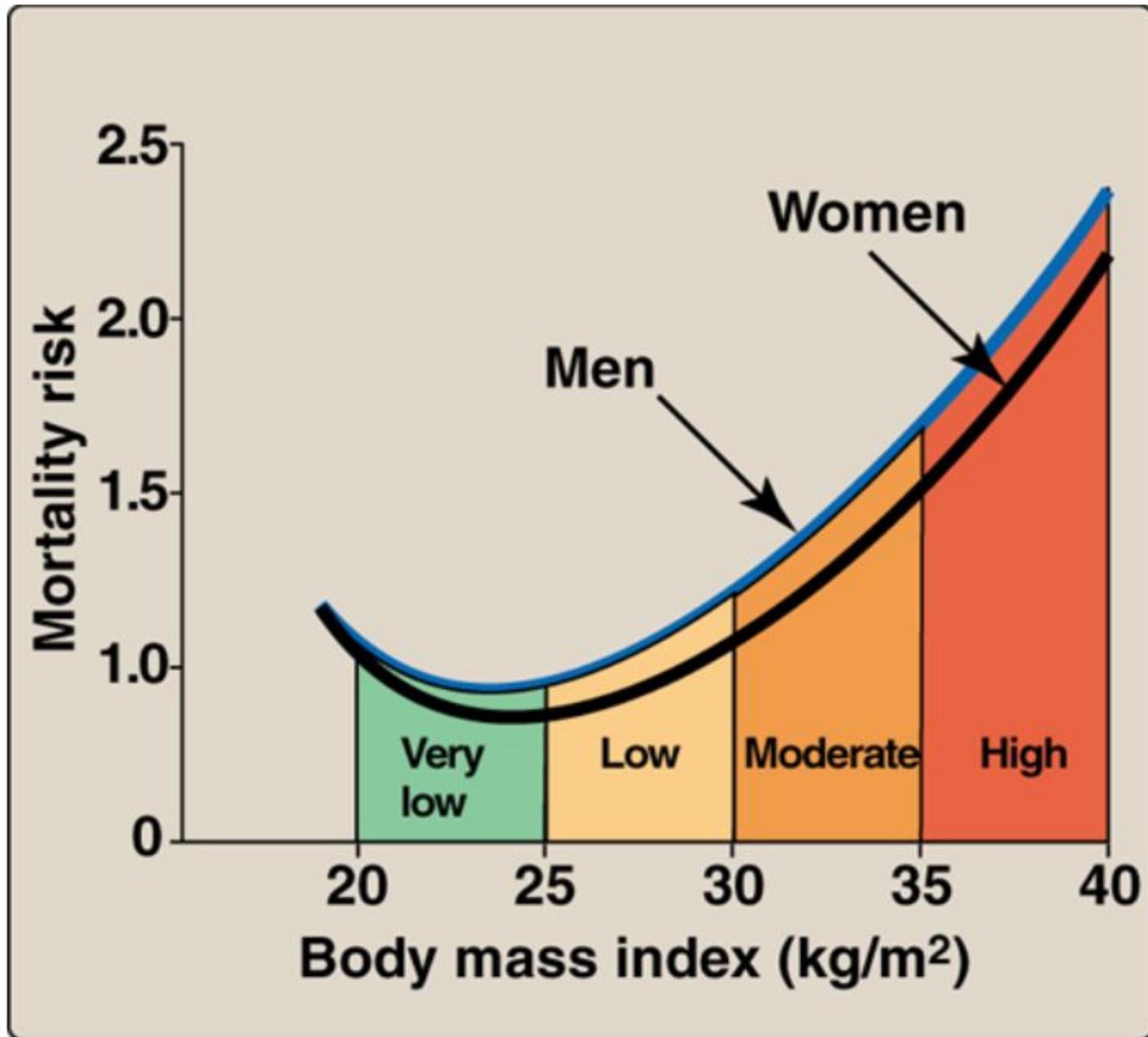


Figure 26.9 Body mass index and the relative risk of death.



John Powel et al., Warwick Medical School, 2010

Препараты, вызывающие повышение веса

Antipsychotics

Risperidone

Sertindole

Olanzapine

Clozapine

Antidepressants

Tricyclic drugs

Monoamine oxidase inhibitors

Mirtazapine

Antiepileptics

Valproate

Gabapentin

Carbamazepine

Mood Stabilizers

Lithium

Antidiabetic agents

Insulin

Sulfonylureas

Thiazolidinediones

Antihypertensive agents

Beta-blockers

Alpha-1-blockers

Antihistamines

Cyproheptadine

Осложнения, связанные с ожирением

Cardiovascular system

Coronary artery disease

Hypertension

Pulmonary embolism

Varicose veins

Gastrointestinal system

Cholelithiasis

Gastroesophageal reflux disease

Colon cancer

Hepatic steatosis

Hernias

Nonalcoholic fatty liver disease

Type 2 diabetes mellitus

Musculoskeletal system

Immobility

Low back pain

Osteoarthritis

Genitourinary system

Hypogonadism

Prostate cancer

Urinary stress incontinence

Polycystic ovarian syndrome

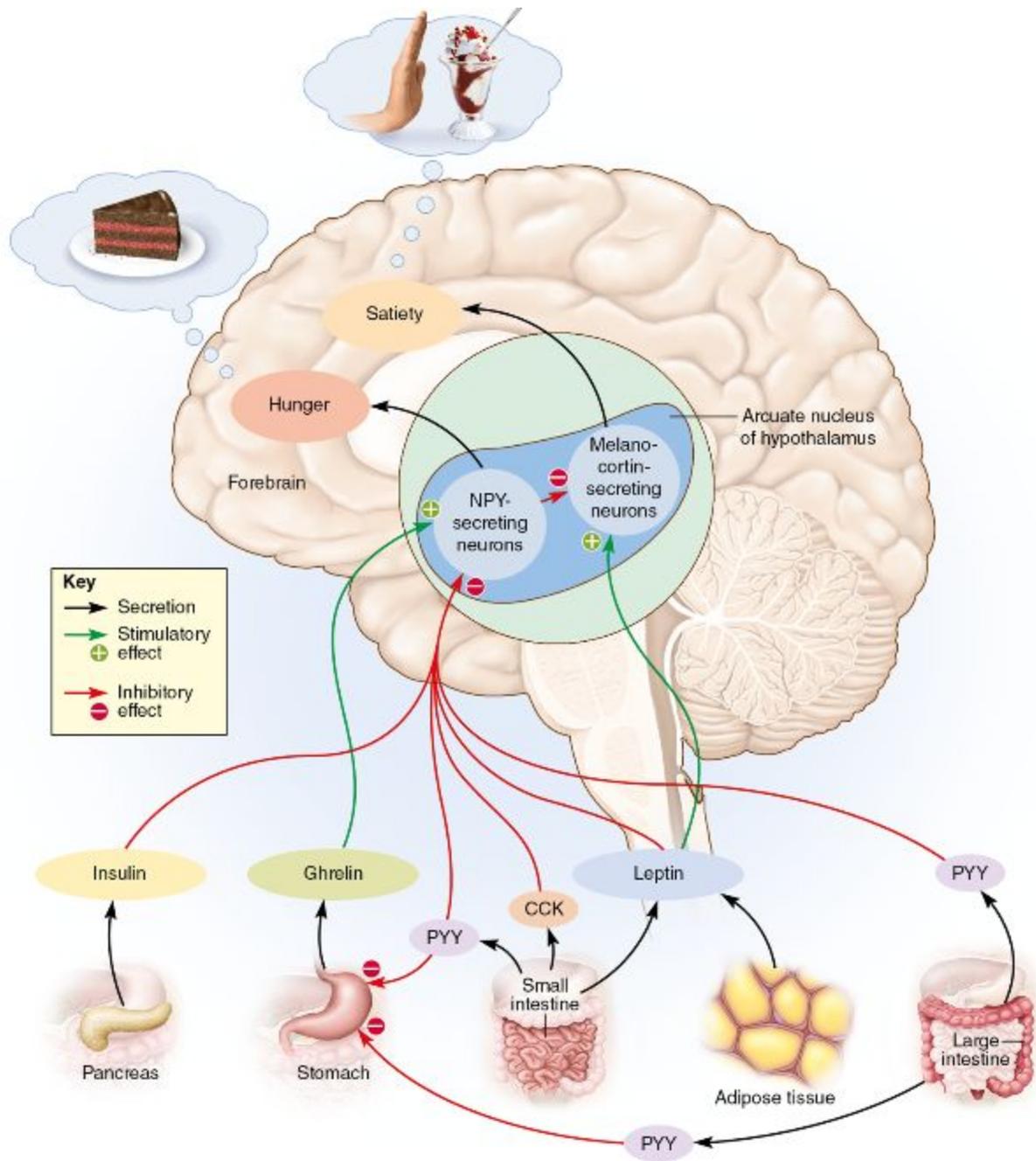
Respiratory system

Dyspnea and fatigue

Obesity hypoventilation syndrome

(Pickwickian syndrome)

Obstructive sleep apnea



Key

- Secretion
- Stimulatory effect (+)
- Inhibitory effect (-)

Insulin



Ghrelin



CCK



Leptin



PYY



PYY

Satiety

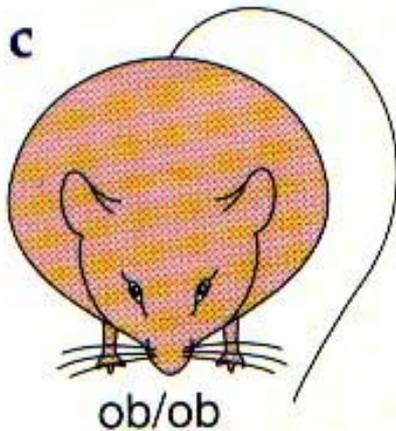
Hunger

Forebrain

Arcuate nucleus of hypothalamus

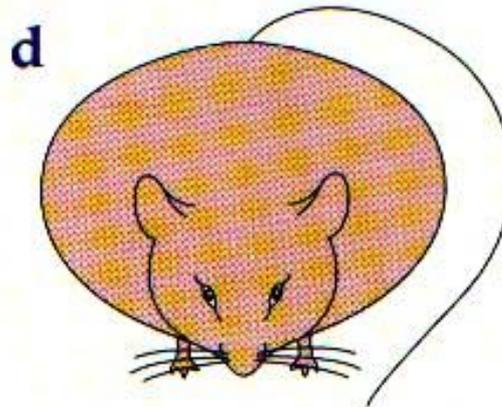
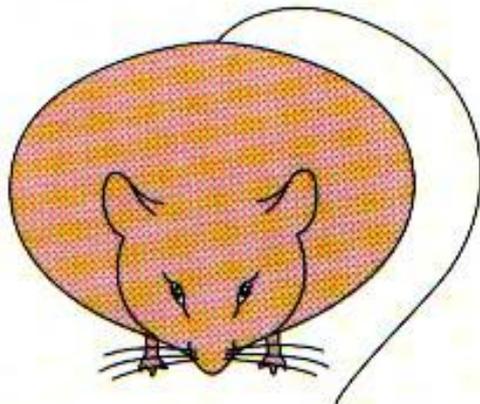
NPY-secreting neurons

Melanocortin-secreting neurons



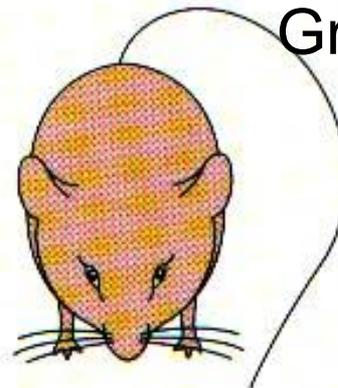
no leptin (идент. в 1994 г.)

↑ appetite
↓ energy expenditure



recombinant leptin
recombinant leptin
recombinant leptin

↓ appetite
↑ energy expenditure



Greek – leptos =
тонкий

Центральная регуляция аппетита

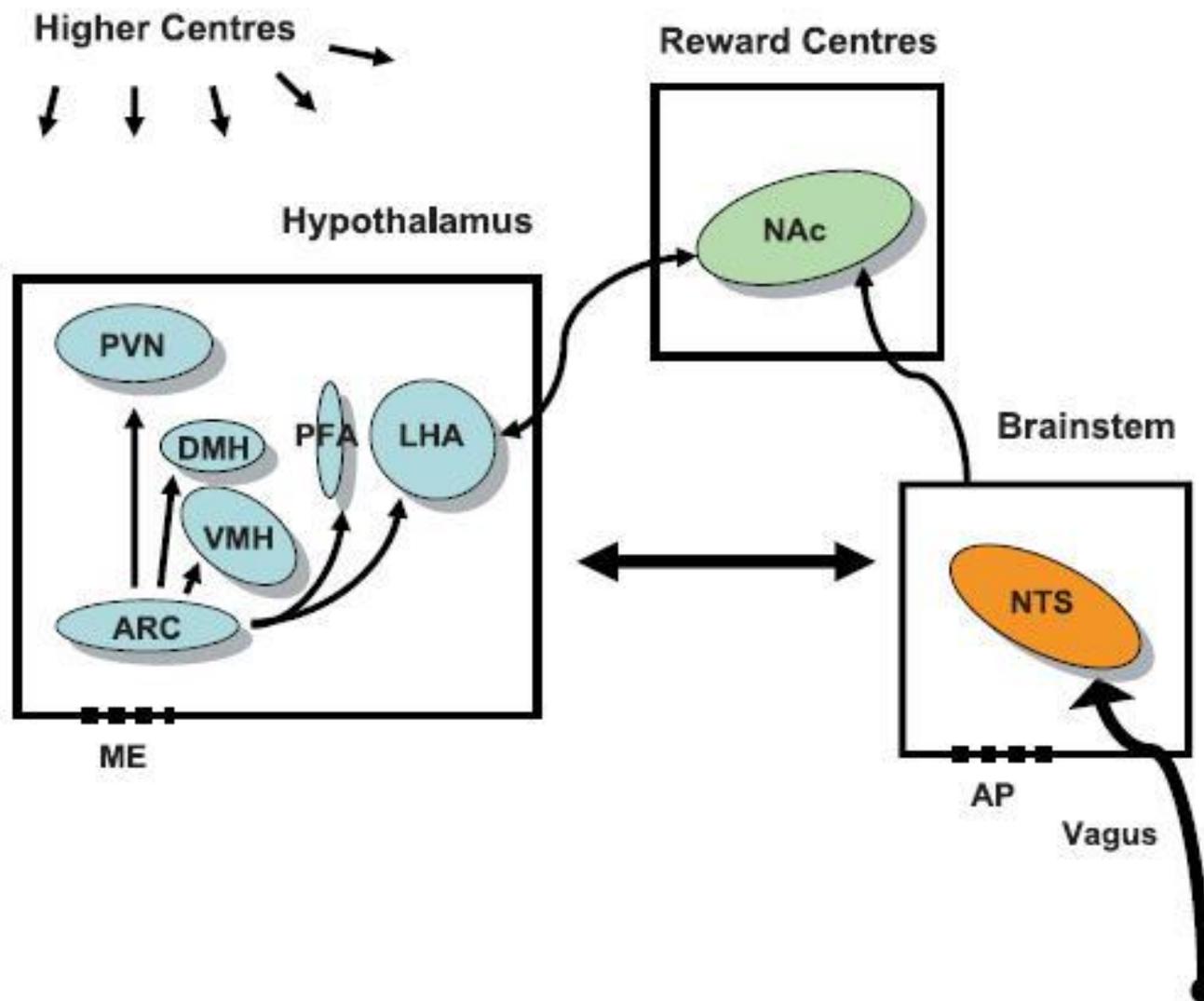
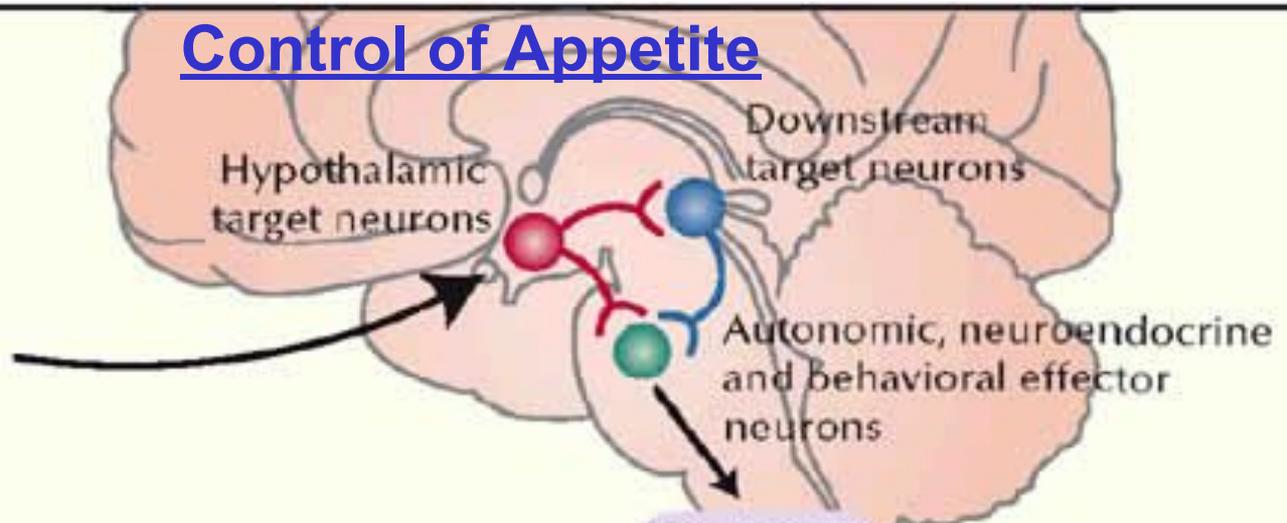


Figure 3 The central control of appetite. AP, area postrema; ME, median eminence; NAc, nucleus accumbens; PFA, perifornical area.

Control of Appetite

Hormonal and metabolic signals:
↑ LC-FAs
Δ glucose
Insulin
Leptin
Ghrelin
etc.



Coordinated outputs

Insulin + glucose
Target tissues:

Adipocytes
Δ glucose uptake

Pancreas
Δ insulin secretion

Liver
Δ glucose production

Muscle
Δ glucose uptake

Feeding behavior

Energy expenditure

Changes in body weight
Altered glucose homeostasis

Центры регуляции аппетита

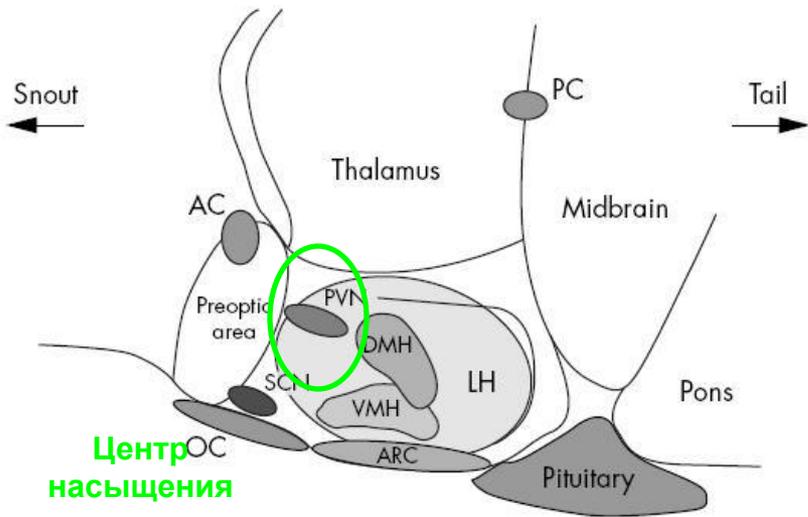
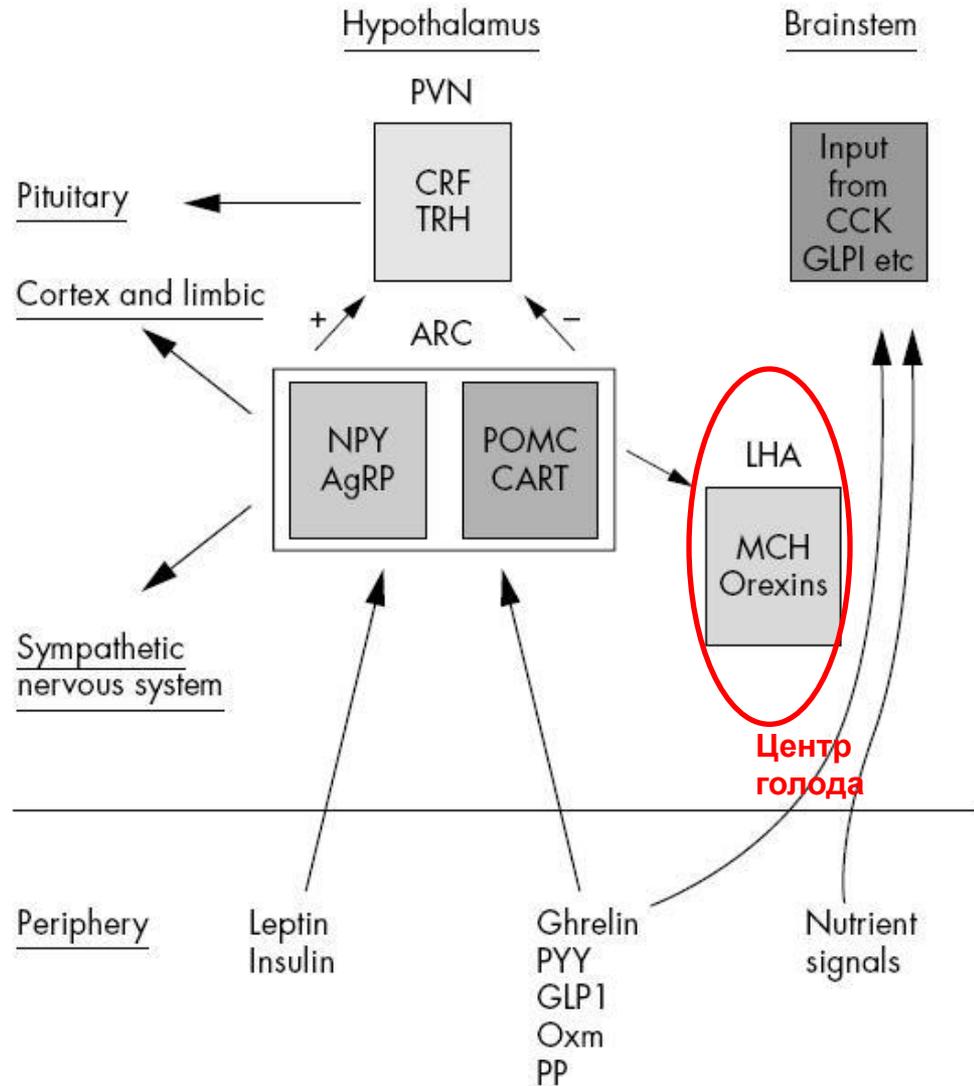


Figure 1 Diagram representing sagittal section through a rodent brain to show the nuclei of the hypothalamus involved in appetite regulation. ARC, arcuate nucleus; VMH, ventromedial nucleus of the hypothalamus; DMH, dorsomedial nucleus of the hypothalamus; LH, lateral hypothalamus; SCN, suprachiasmatic nucleus; OC, optic chiasm; PVN, paraventricular nucleus.



Анорексигенные средства

а) Норадренергические средства (короткого применения)

(пр. фенилалкиламинов)

Амфетамин (фенамин)

Дезоксиэфедрин (1947)

Фентермин (1959 -снят в 2000 г. из-за повышения АД и ИБС)

Фенилпропаноламин + прямая активация адренорецепторов

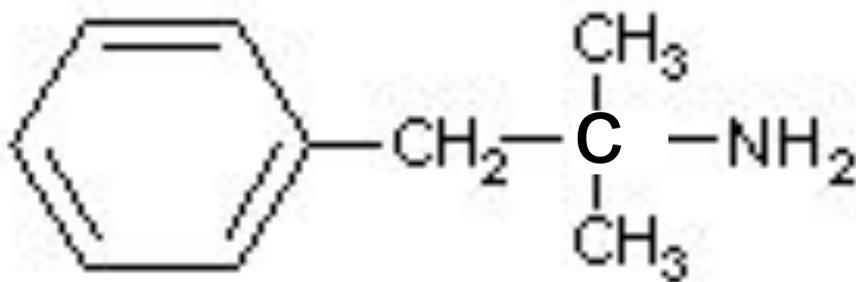
(разрешен с 1983 г. (без рецепта с дозой <25mg), снят в 2000 г. из-за риска геморрагического инсульта)

Усиливают выброс НА
в центрах гипоталамуса.
Снижают чувство голода

Qnexa –комбинация фентермина и медленно-поступающим **topiramate** -

Топираматом (произв. Фруктозы) ожидается одобрение FDA.

Фентермин



$C_{10}H_{16}N$

Анорексигенные средства

а) Норадренергические средства

Мазиндол (теронак) 1973 г.- производное индола

Блокирует обратный захват НА –угнетает аппетит (снят в 1993 г. в Австралии)

Бупропион – блокирует обратный захват дофамина и НА

Анорексигенные средства

б) Серотонинергические средства

Фенфлурамин 1973 (Снят в 1997 г.)

Вызывают повреждение клапанов сердца

Стимулируют выброс 5-НТ и угнетают

обратный захват

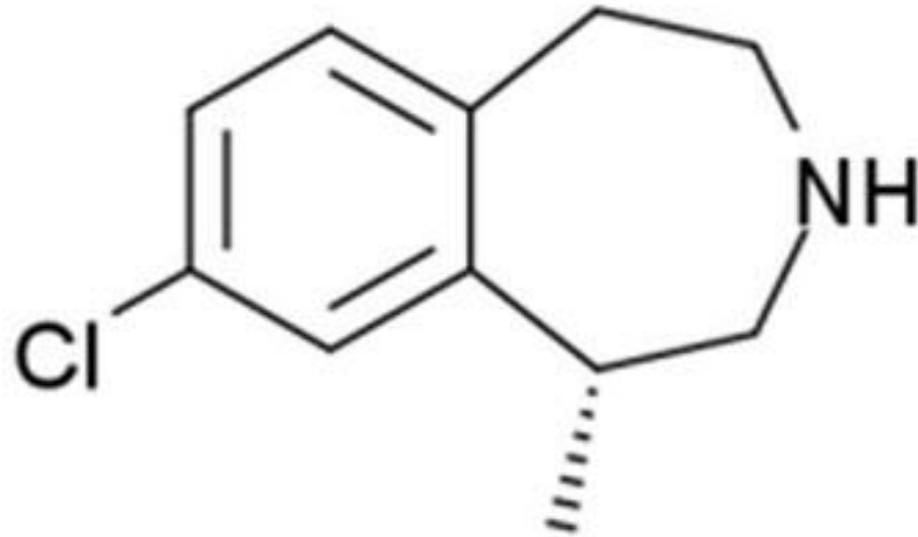
Фенфлурамин+Фентермин (Фен-Фен) (Снят в 1997 г.)

Дексфенфлурамин 1996 (Снят в 1997 г.)

Флуоксетин (Прозак)

Лоркасерин , агонист 5-НТ_{2C}- одобрен FDA в 2012 году.

Lorcaserin



Systematic (IUPAC) name

(1*R*)-8-chloro-1-methyl-2,3,4,5-tetrahydro-1*H*-3-benzazepine

<http://en.wikipedia.org/wiki/Lorcaserin>

в) Средства, нарушающие обратный захват норадреналина и серотонина (слабо –дофамина)

Сибутрамин (с 1997 в США и с 1999 г. в Европе)

Усиливает чувство сытости.

Начинают с дозы 10 мг (потеря веса д.б. 2 кг за 4 недели)

Не назначают на срок более 1 года.

Побочные эффекты - головная боль, сухость во рту, запоры, бессонница, повышение АД

Средства, применяемые при ожирении

2. Средства, уменьшающие усвоение пищи

Орлистат

Ингибирует липазы, частично угнетает гидролиз триглицеридов, что уменьшает образование всасываемых свободных жирных кислот и поэтому уменьшает потребление пищевых жиров (в среднем на 30%)

Желательно дополнительное назначение жирорастворимых витаминов – А, D, E, K.

Акарбоза

– ингибитор альфа-глюкозидазы

Уменьшает всасывание углеводов

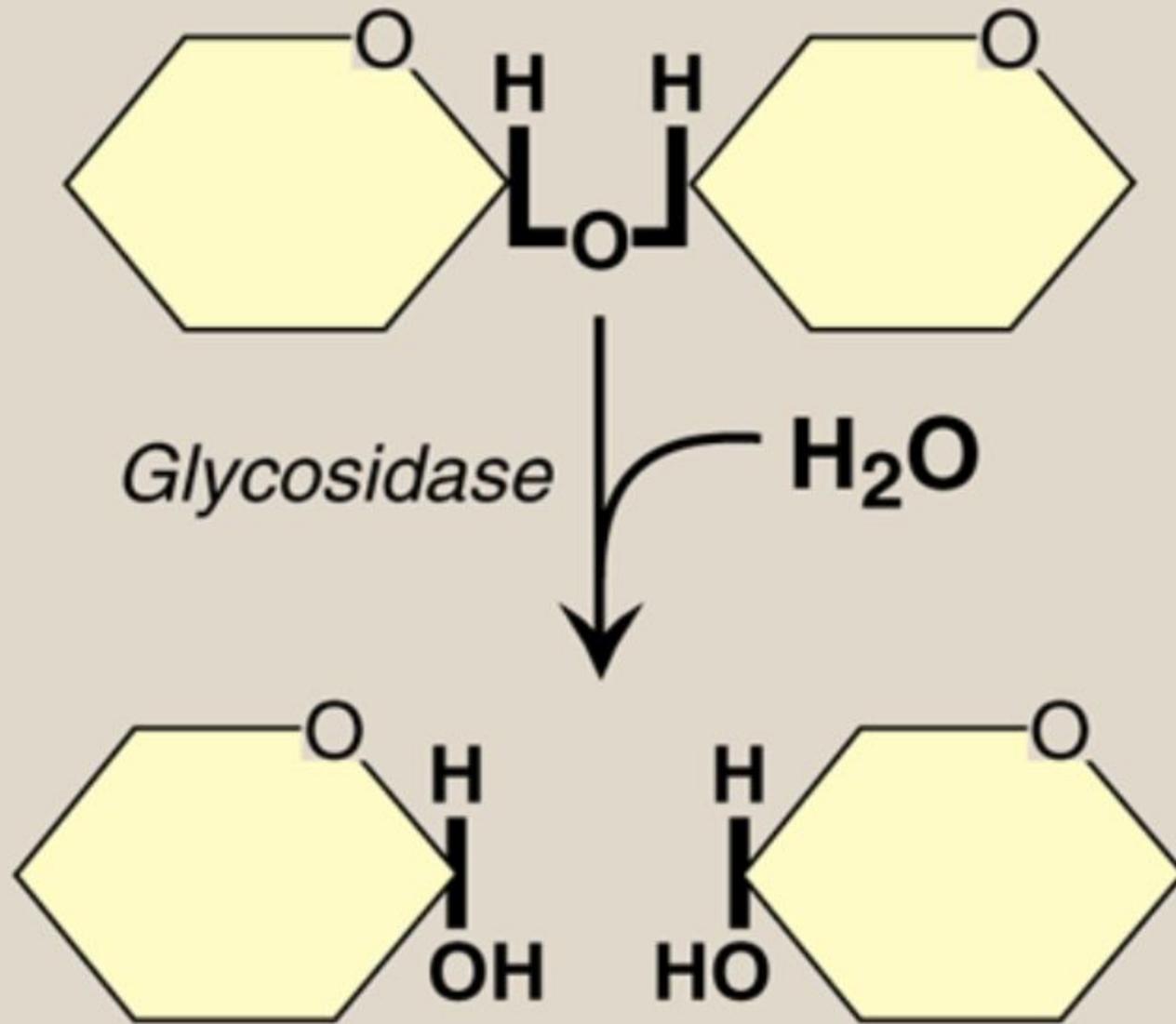
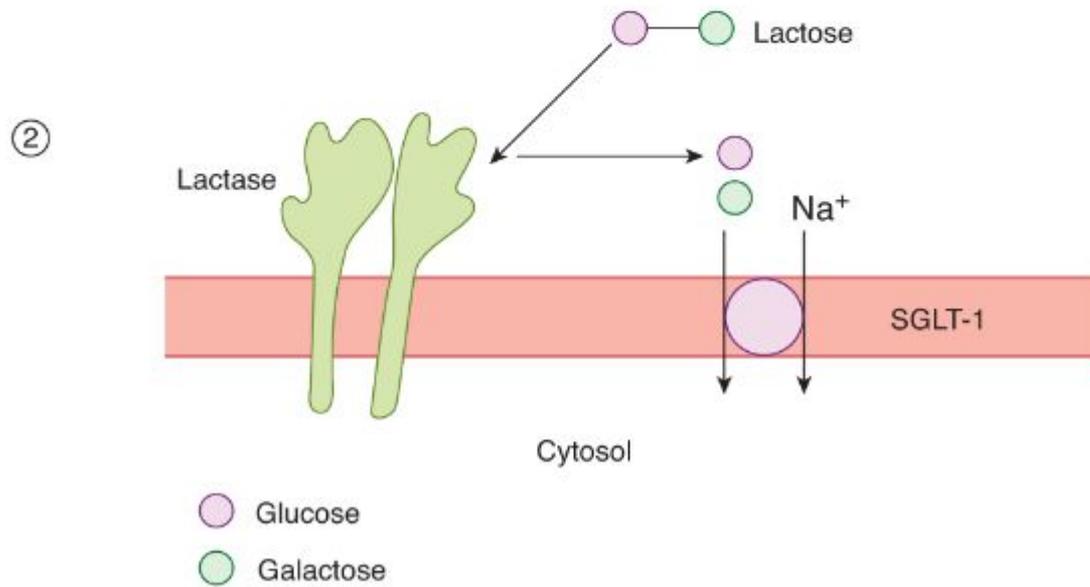
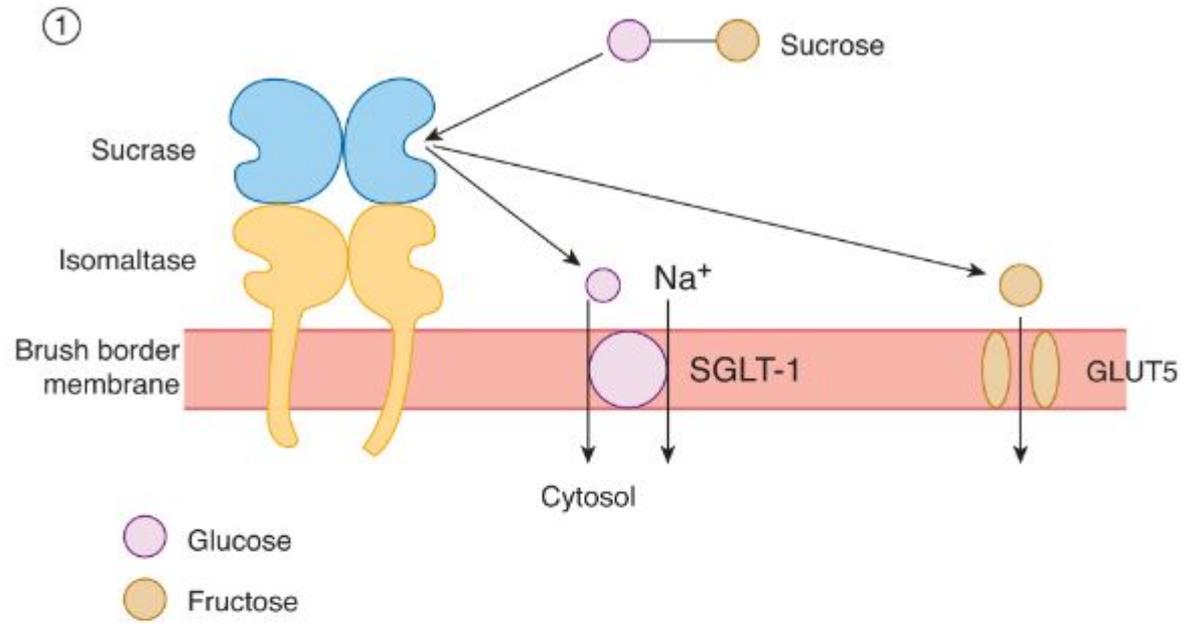


Figure 7.8 Hydrolysis of a glycosidic bond.

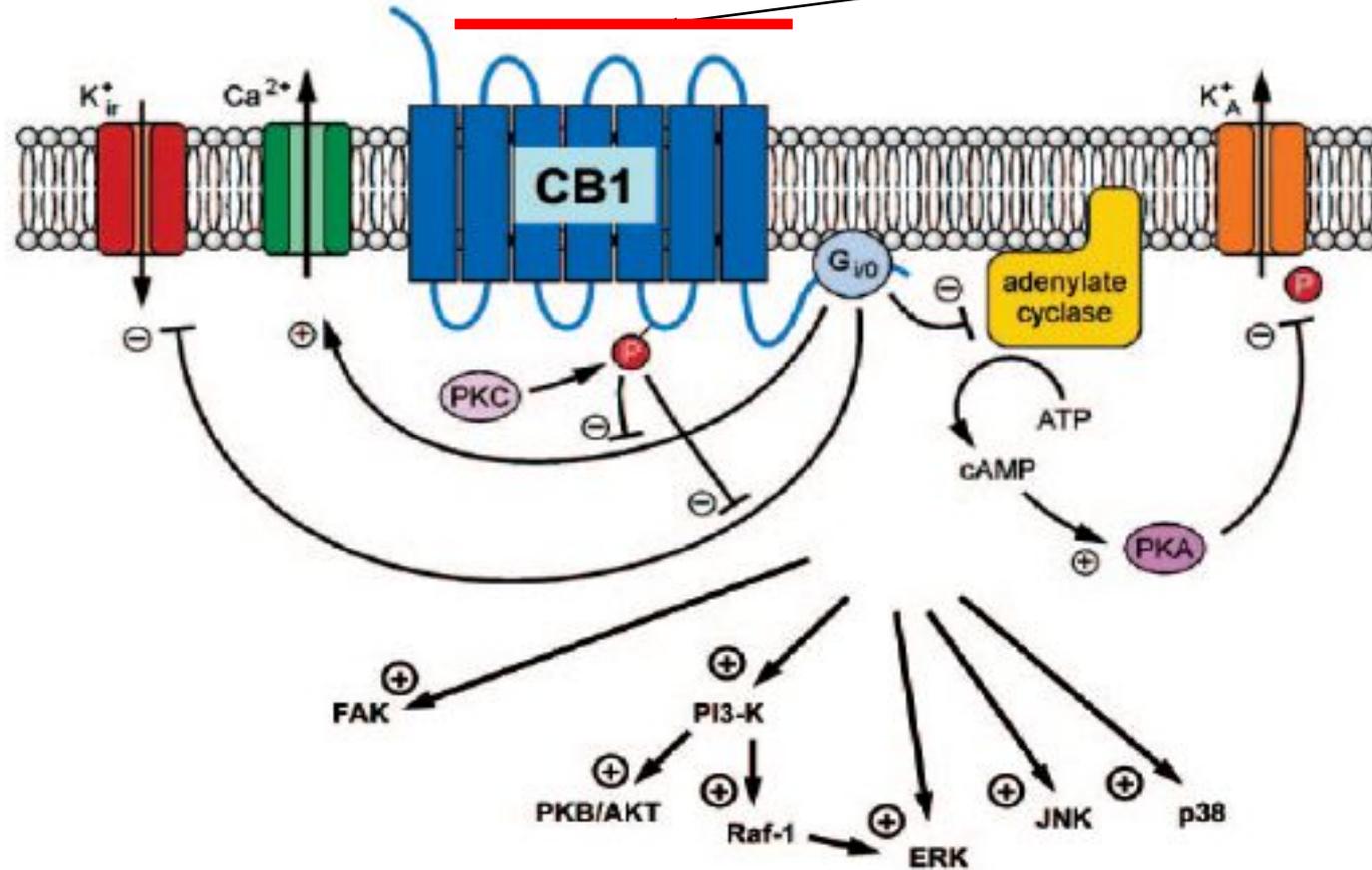


Римонабант

(2006 г. в Европе)–

блокатор каннабиоидных рецепторов 1-го типа. (марихуана – агонист этих рецепторов, вызывает усиленное потребление жирной и сладкой пищи)

Римонабант



Discovery of the cannabinoid receptors has led to the development of rimonabant, a cannabinoid-1 (CB₁) antagonist. Selective blockade of this receptor has been shown to lead to decreased **appetite** and food intake in animal models.

Clinical studies have shown that rimonabant 20 mg once daily produces significant decreases in weight and waist circumference in obese human subjects and improves the lipid profile and glucose **control**.

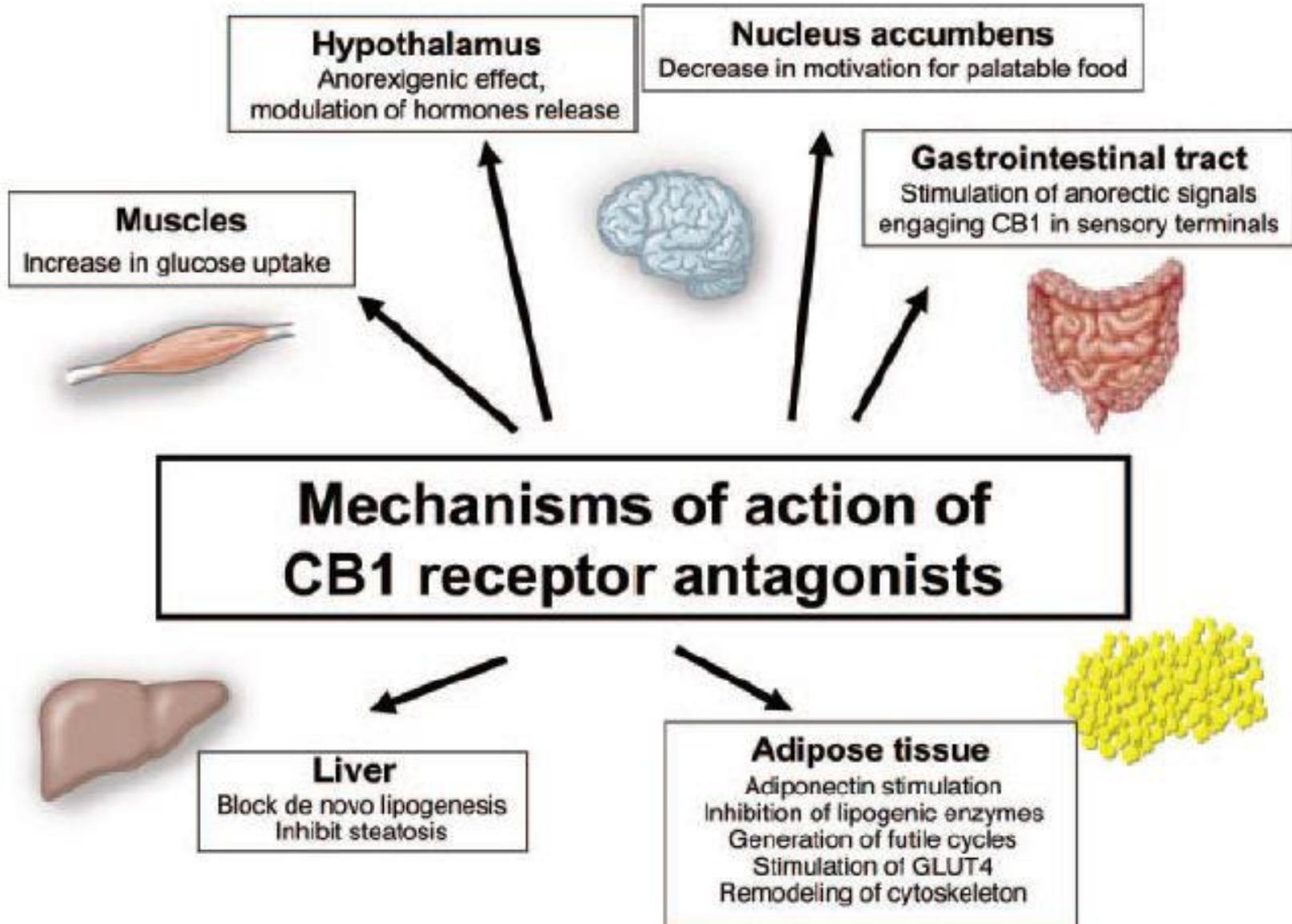


Table 2. Anti-obesity

drugs

	Mechanism of action	Typical dose	Adverse events
Sibutramine	Appetite suppressant: norepinephrine and serotonin reuptake inhibitor	10–15mg once daily	Headache, dry mouth, constipation, insomnia, increased blood pressure
Orlistat	Gastric and pancreatic lipase inhibitor	120mg three times a day with meals	Oily stool, flatulence, fecal urgency, increased defecation
Rimonabant	Appetite suppressant: endocannabinoid (CB1) receptor blocker	20mg once daily	Nausea, dizziness, diarrhea, insomnia, depression, suicidal ideation

Table 1. Anti-obesity drugs, their year of introduction, withdrawal and serious adverse events.

Year of introduction and withdrawal	Anti-obesity drug	Serious adverse effect
1893/1949	Thyroxine	Thyrotoxicosis
1933/1935	Dinitrophenol	Cataracts and hyperthermia
1937/1971	Amphetamine and derivatives	Tolerance and psychosis
1960/2000	Phenylpropanolamine (norephedrine and norpseudoephedrine)	Hemorrhagic stroke
1965/1972	Aminorex	Pulmonary hypertension
1973/1997	Fenfluramine + phentermine (fen-phen)	Pulmonary hypertension and heart valve problems
1997/2010	Sibutramine	Myocardial infarction and stroke
2006/2009	Rimonabant	Suicidality and depression

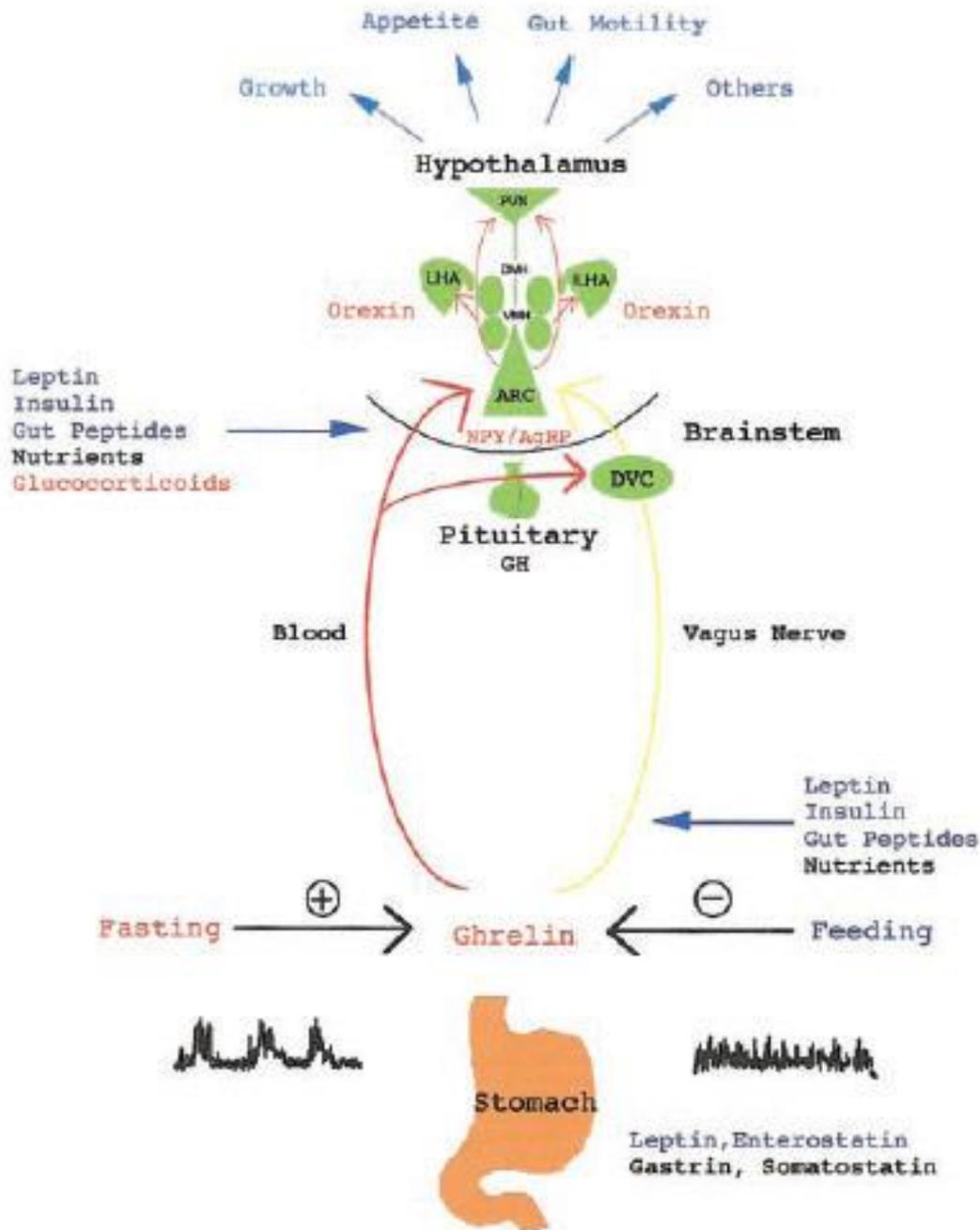
Эффективность и побочные эффекты основных средств для лечения ожирения

• Эффективность:

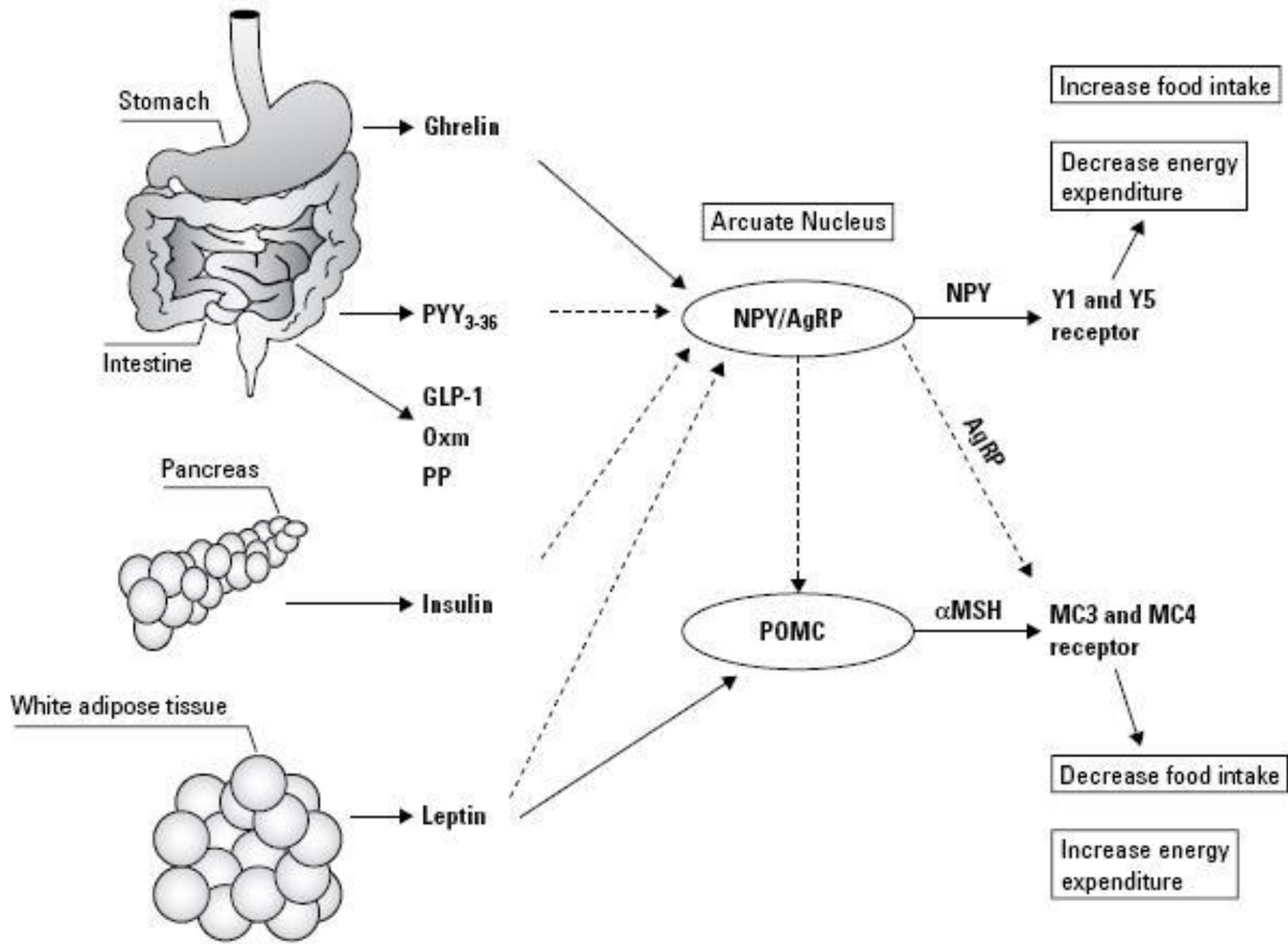
- Sibutramine: 4.45 kg at 12 months**
- Orlistat: 2.89 kg at 12 months**
- Phentermine: 3.6 kg at 12 months**
- Diethylpropion: 3.0 kg at 6 months**
- Fluoxetine: 3.15 kg at 12 months**
- Bupropion: 2.8 kg at 6 to 12 months**

• Побочные эффекты:

- modest increases in blood pressure and pulse and nervousness**
- diarrhea, flatulence, and bloating**
- cardiovascular abnormalities**
- tachycardia and insomnia**
- agitation and nervousness**
- Bupropion: paresthesia and insomnia**



Vol. 18 March 2004 The FASEB J., p.439



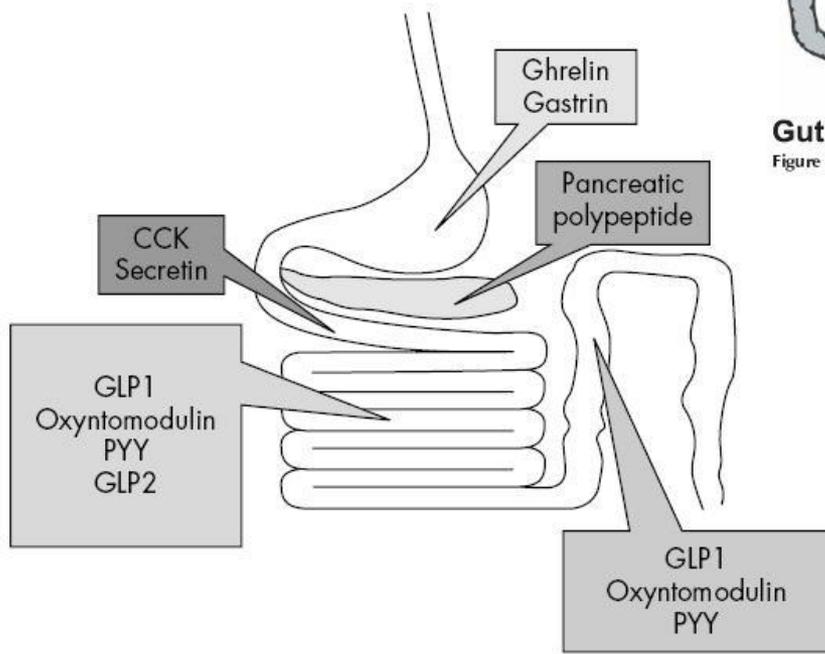


Figure 3 Summary of main gut hormones involved in appetite regulation and their sites of production. CCK, cholecystokinin; PYY, peptide YY; GLP1, glucagon-like peptide 1; GLP2, glucagon-like peptide 2.

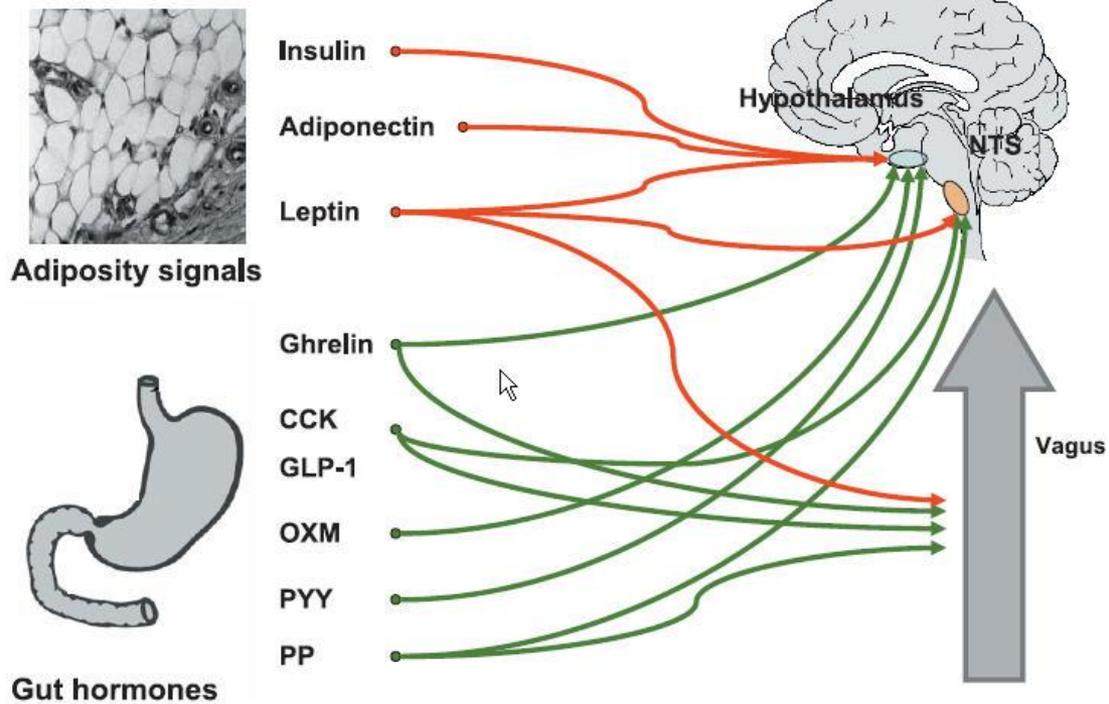


Figure 4 Peripheral control of appetite.

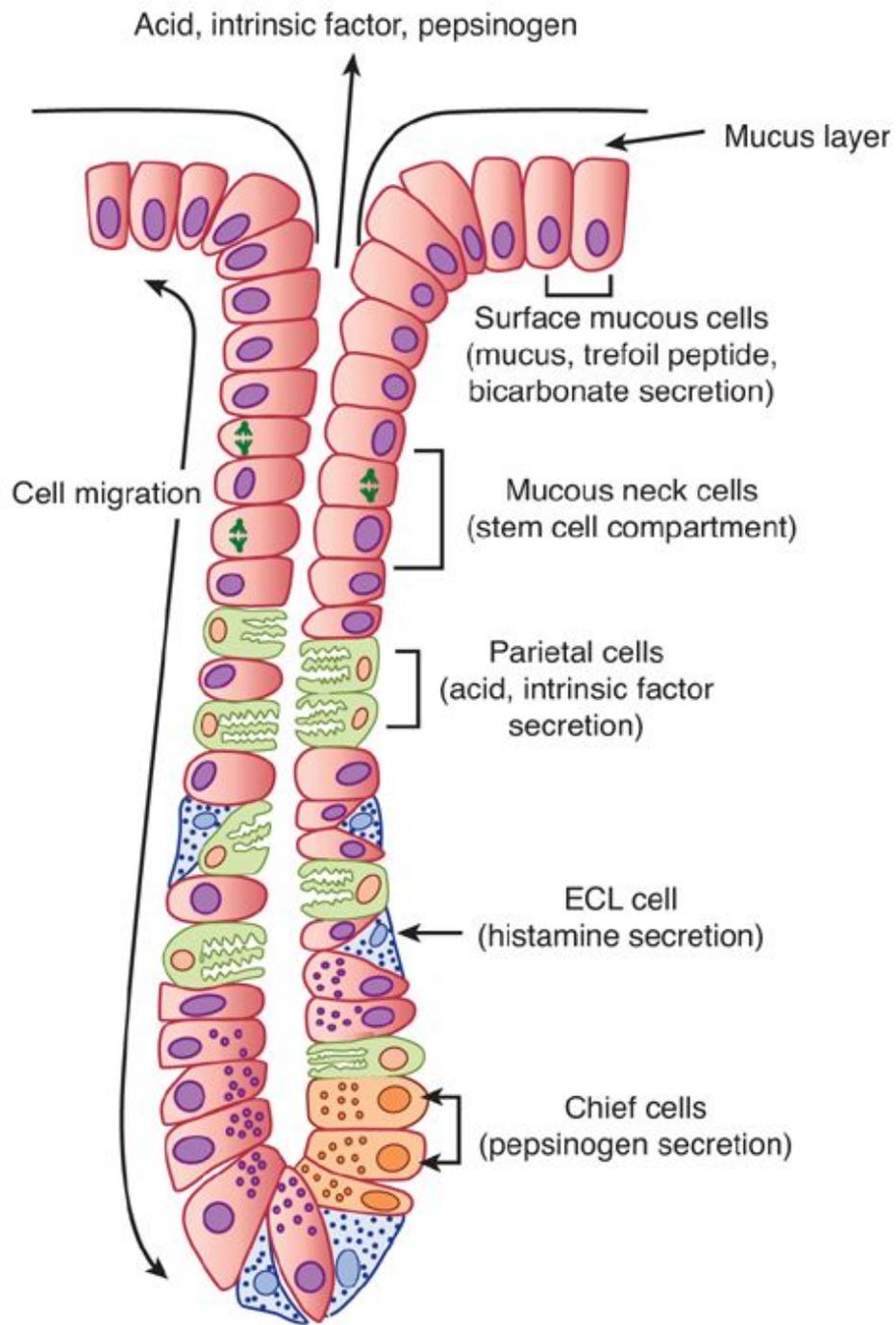
J.Endocrinol., 2005, 184; 291-318

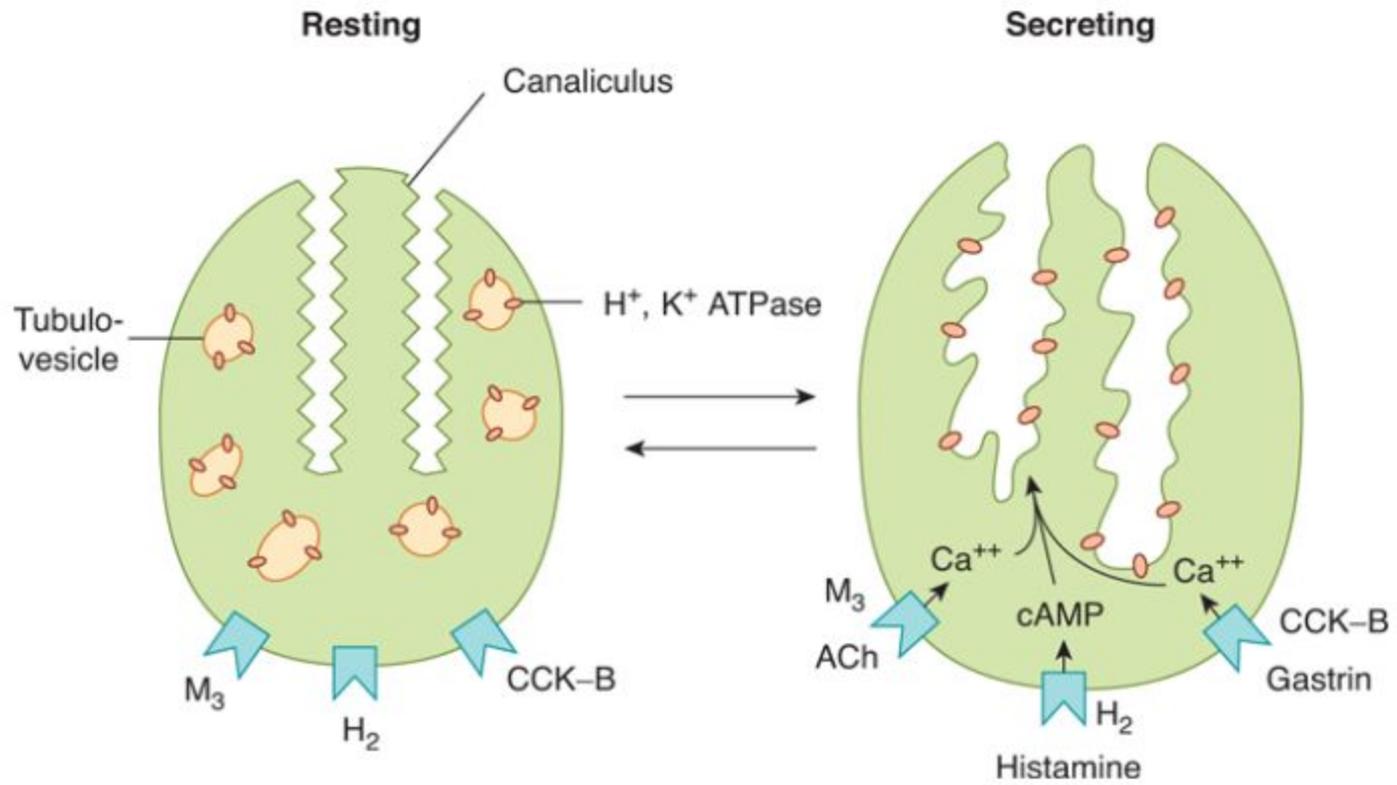
Arch. Dis. Child. 2006, 91; 183-187

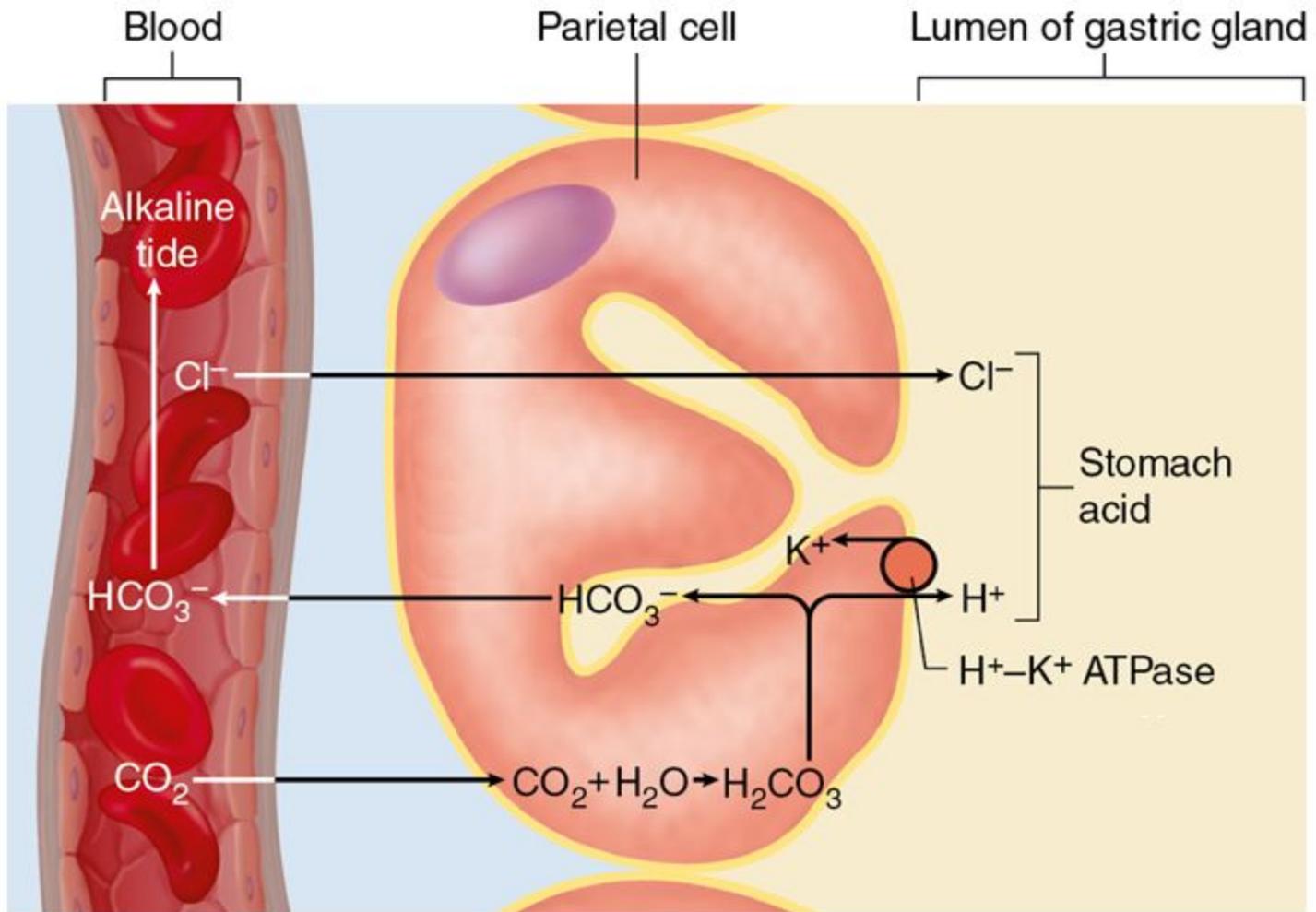
ТЕНДЕНЦИИ В ИЗЫСКАНИИ АНОРЕКСИГЕННЫХ СРЕДСТВ

<i>Нейропептиды и гормоны</i>	<i>Доклинические испытания</i>
<p>Нейропептид Υ</p> <p>Меланин-концентрирующий гормон</p> <p>Орексин А</p> <p>Меланоцит-стимулирующий гормон</p> <p>Кортикотропина рилизинг-фактор</p>	<p>- антагонисты Υ_1 и Υ_2-рецепторов</p> <p>- антагонисты MCH-рецепторов</p> <p>- антагонисты OX₁-рецепторов</p> <p>- агонисты MC₄-рецепторов</p> <p>- агонисты CRF₁-рецепторов</p>
<p>Холецистокинин</p> <p>Глюкагон-подобный пептид-1</p>	<p>- агонисты CCK-рецепторов</p> <p>- аналоги;</p> <p>агонисты рецепторов</p>

Средства для лечения язвенной болезни







ФАКТОРЫ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ЦЕЛОСТНОСТЬ СЛИЗИСТОЙ ОБОЛОЧКИ ЖЕЛУДКА

ФАКТОРЫ АГРЕССИИ:

- ПЕПСИН
- HCl
- HELICOBACTER PYLORI
- ЖЕЛЧНЫЕ КИСЛОТЫ

ФАКТОРЫ, ВЛИЯЮЩИЕ НА ЦЕЛОСТНОСТЬ СЛИЗИСТОЙ ОБОЛОЧКИ ЖЕЛУДКА

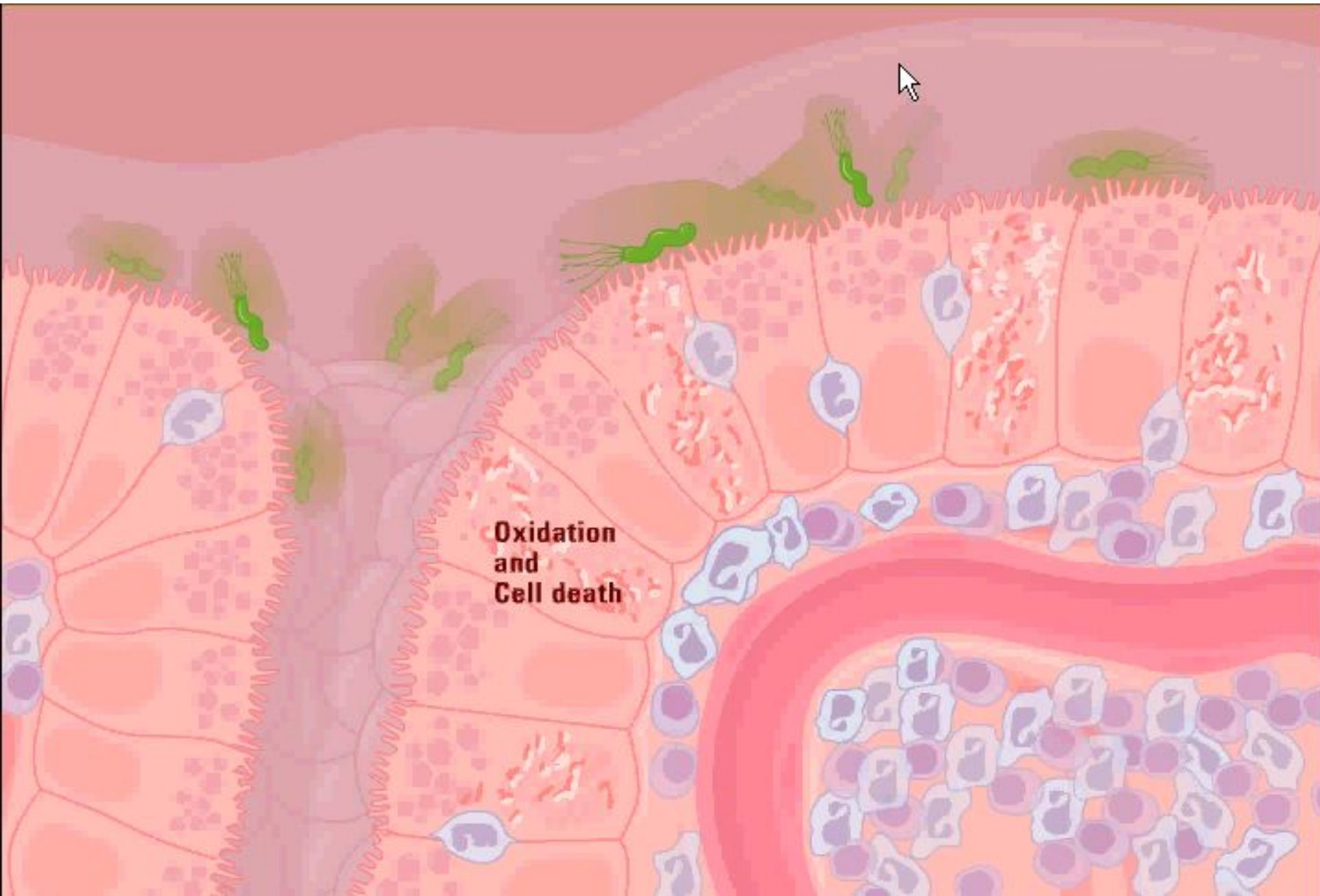
ФАКТОРЫ АГРЕССИИ:

- ПЕПСИН
- HCl
- HELICOBACTER PYLORI
- ЖЕЛЧНЫЕ КИСЛОТЫ

ЗАЩИТНЫЕ ФАКТОРЫ :

- СЛИЗЬ
- HCO_3^-
- ВЫСОКАЯ РЕГЕНЕРАТИВНАЯ СПОСОБНОСТЬ ЭПИТЕЛИЯ
- КРОВΟΣНАБЖЕНИЕ СЛИЗИСТОЙ ОБОЛОЧКИ

Роль *Helicobacter pylori* в патогенезе язвы



СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. M-холиноблокаторы

2. Блокаторы H_2 -рецепторов

3. Ингибиторы H^+ , K^+ -АТФазы

4. Аналоги простагландинов E

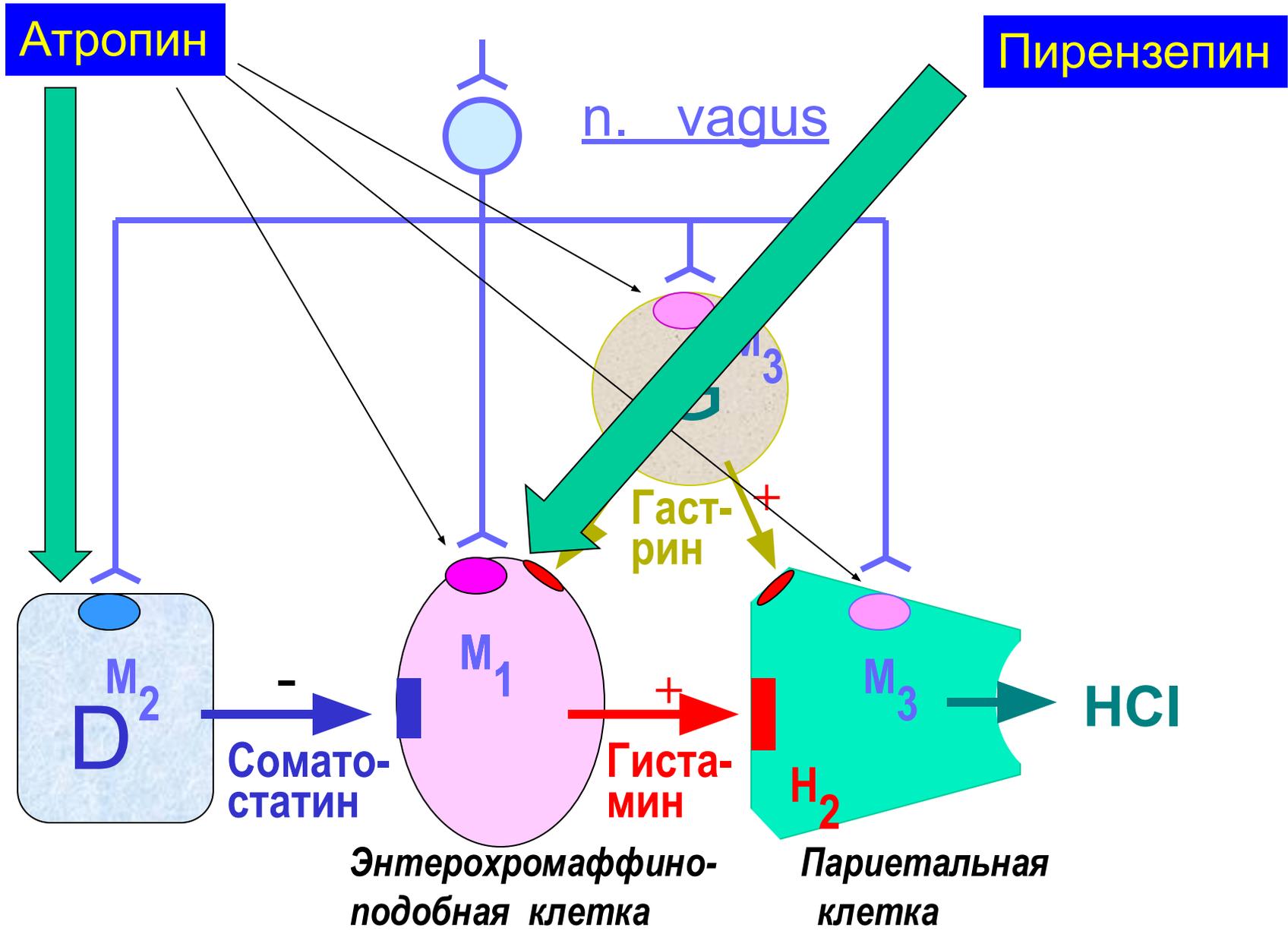
СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. М-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

М₁-холино-блокатор



СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. M-холиноблокаторы

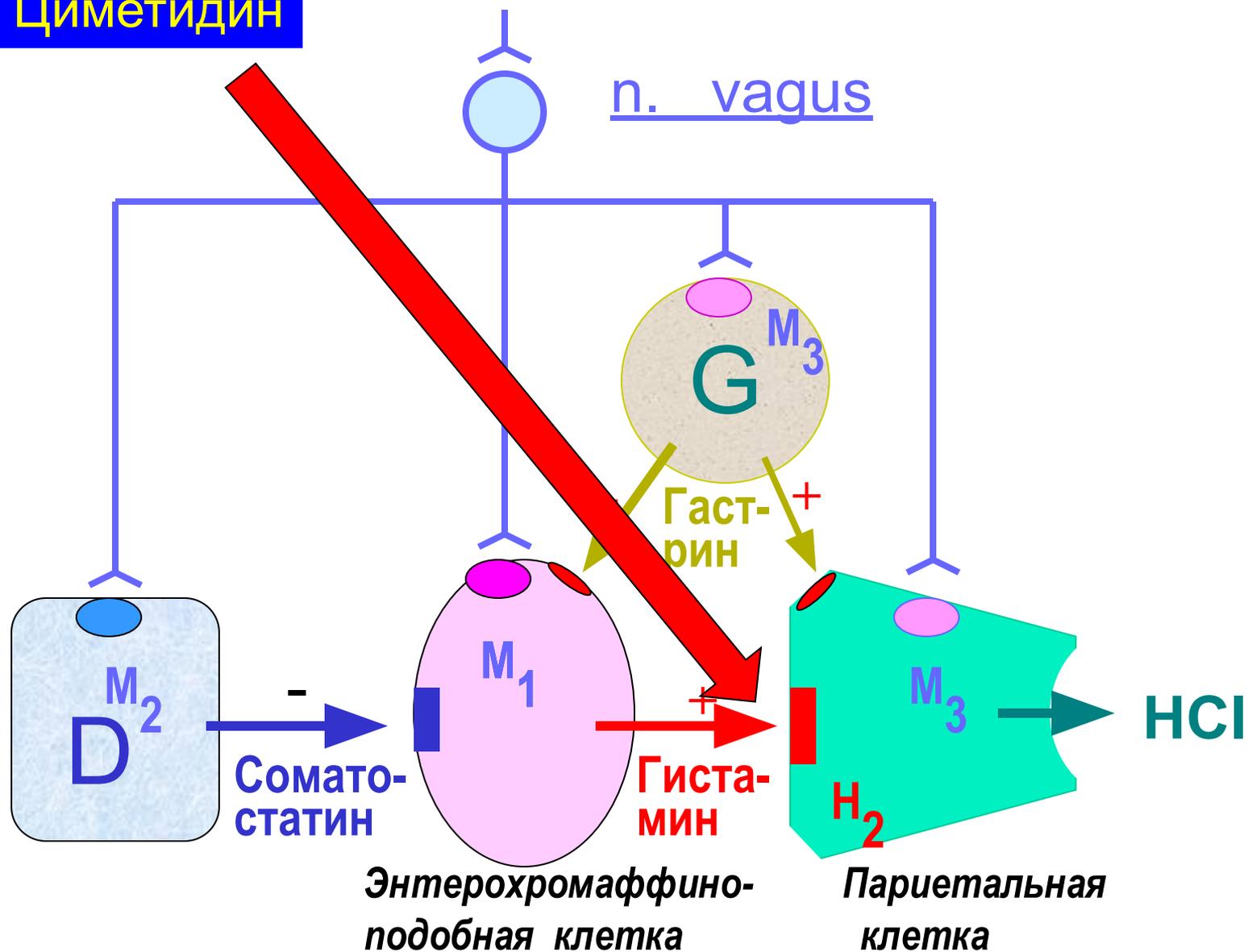
Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H₂-рецепторов

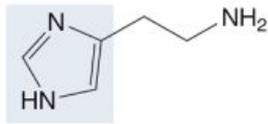
I поколение - Циметидин (тагамет)

Циметидин

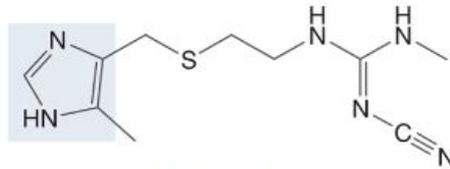


Побочные эффекты циметидина

- антиандрогенное действие
- повышение секреции пролактина
- брадикардия
- сонливость, дезориентация
- миалгии
- лейкопения, тромбоцитопения
- ингибирование микросомальных ферментов

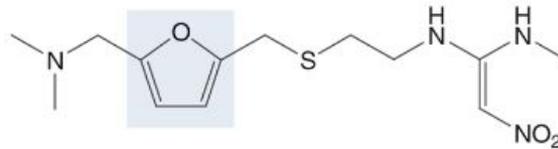


Histamine
(imidazole ring)



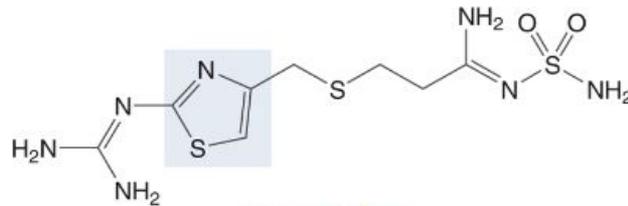
Cimetidine
(imidazole ring)

1-поколение



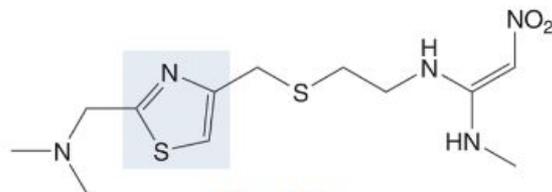
Ranitidine
(furan ring)

2-поколение



Famotidine
(thiazole ring)

3-поколение



Nizatidine
(thiazole ring)

СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. M-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H₂-рецепторов

I поколение - Циметидин (тагамет)

II поколение - Ранитидин (зантак)

III поколение - Фамотидин
Роксатидин

СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. M-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H₂-рецепторов

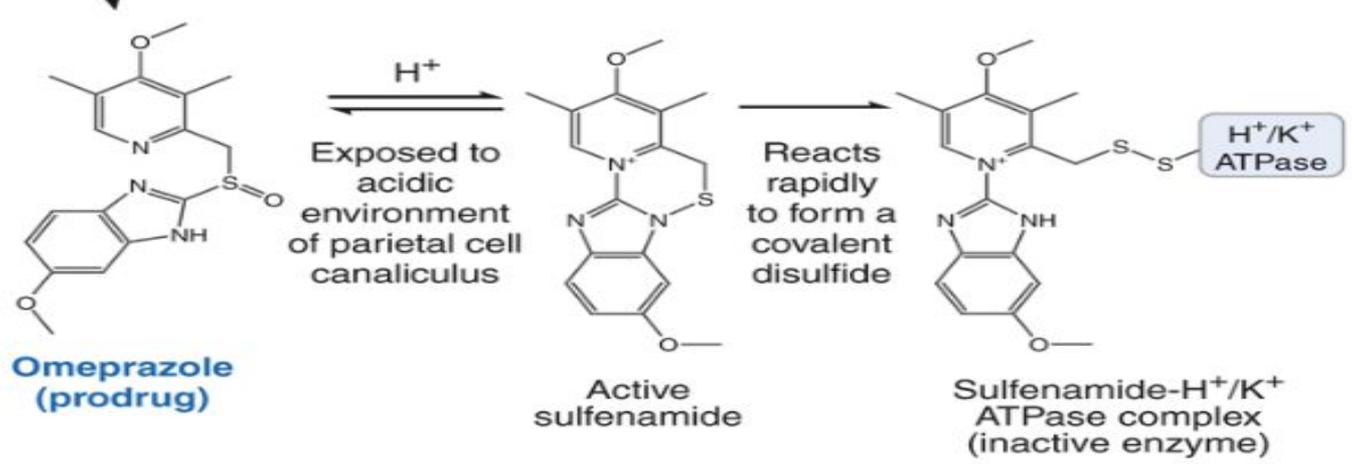
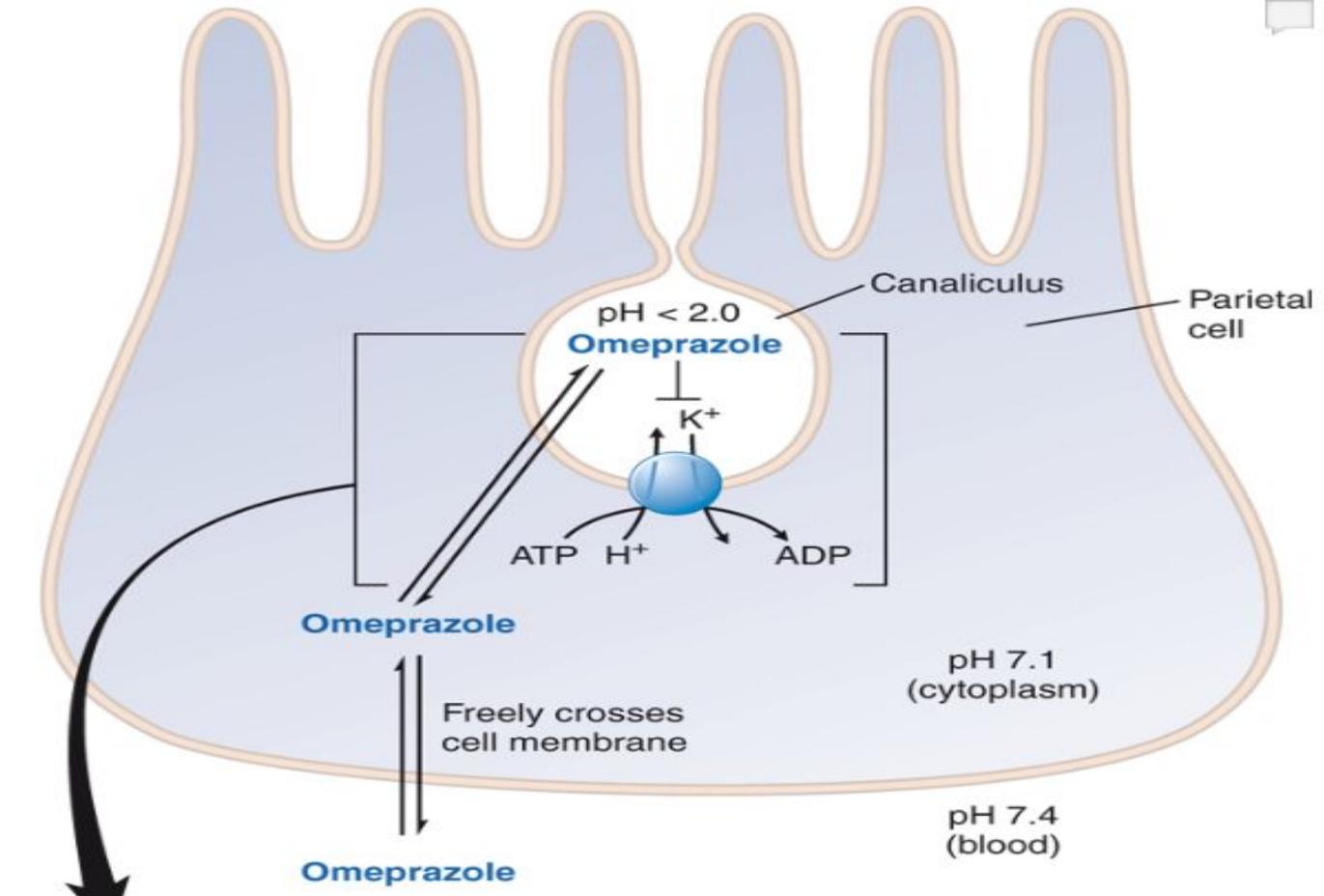
- I поколение - Циметидин (тагамет)
- II поколение - Ранитидин (зантак)
- III поколение - Фамотидин
Роксатидин

3. Блокаторы H⁺K⁺АТФазы

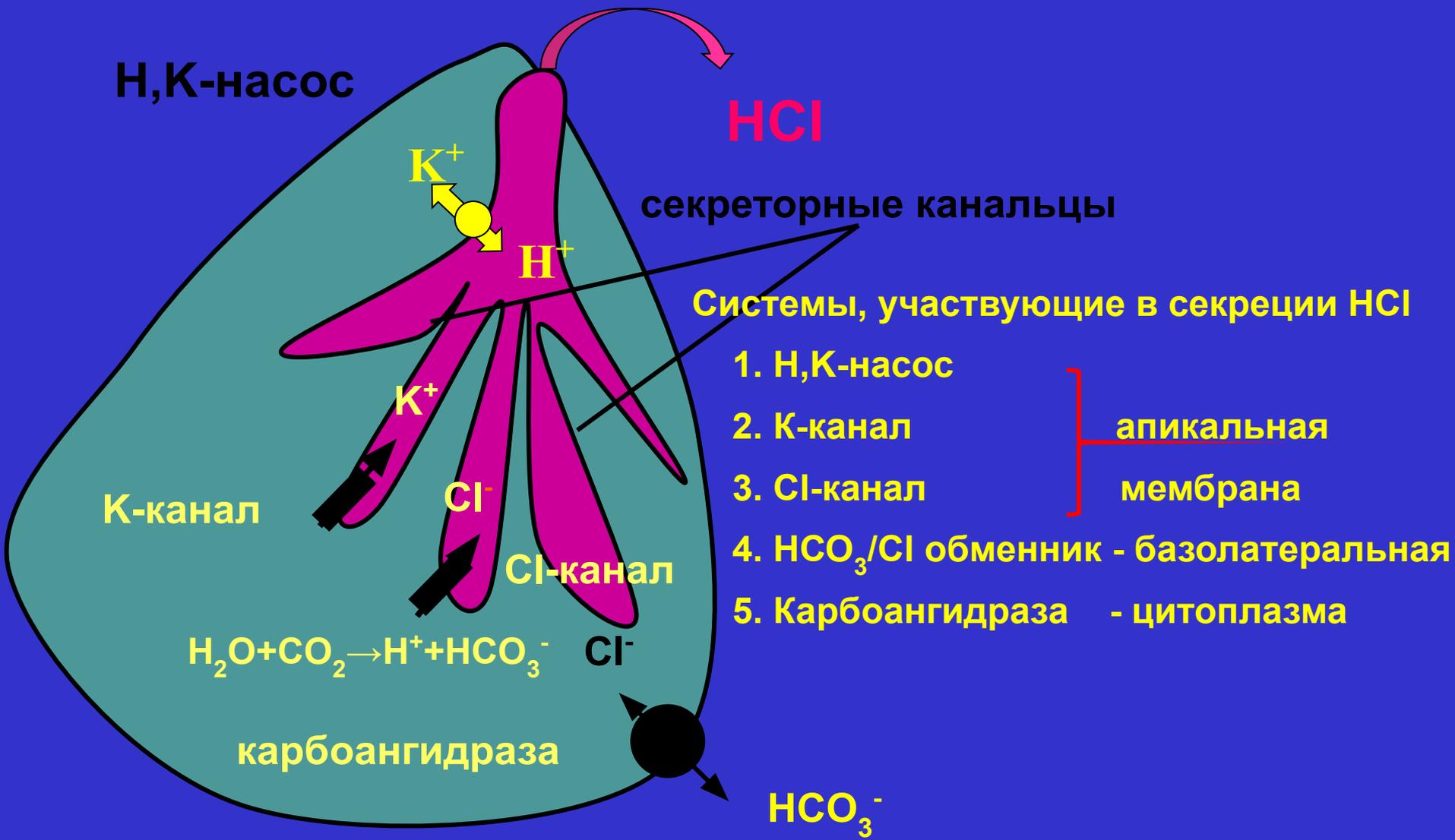
Омепразол (омез)

Лансопразол

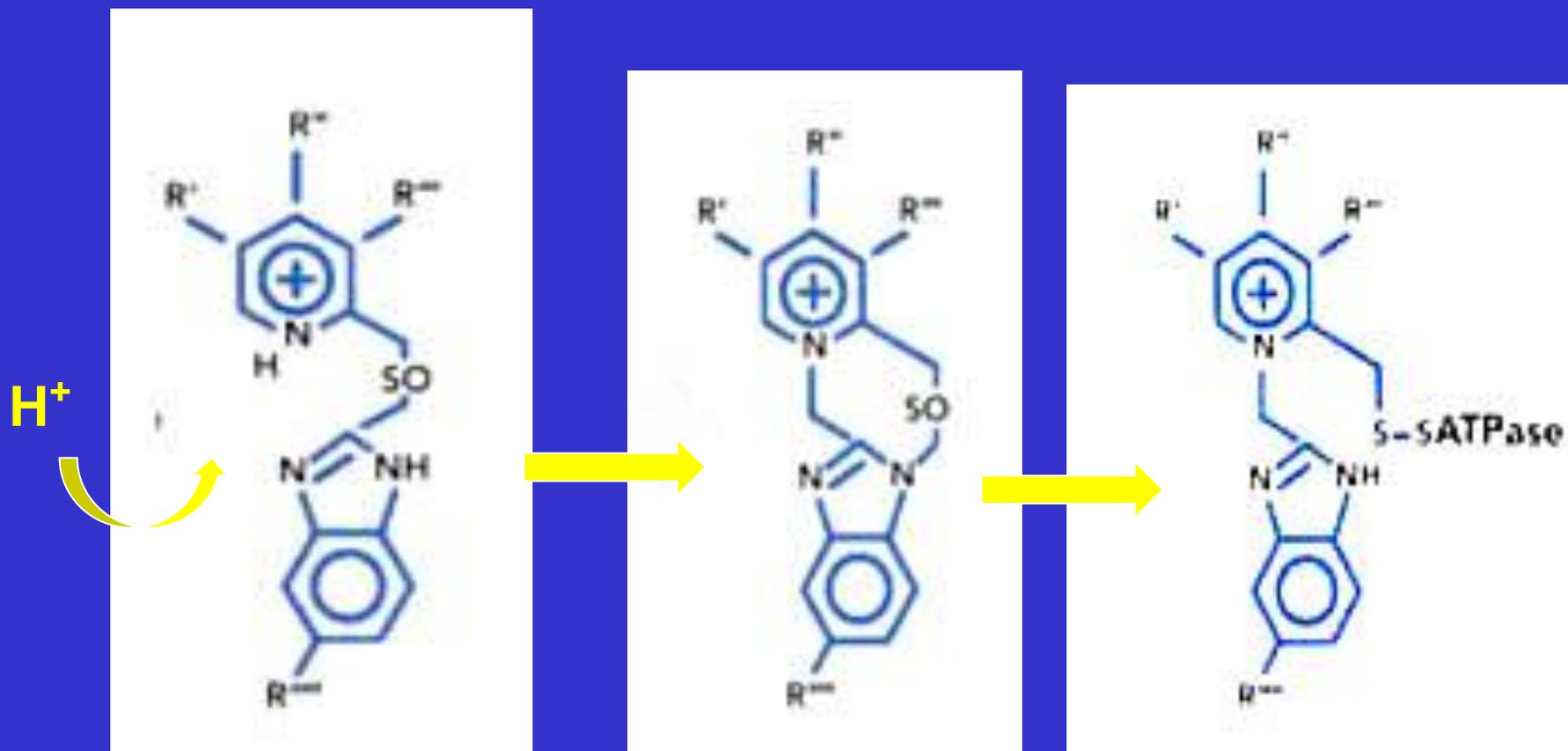
Пантопразол



Механизм секреция соляной кислоты париетальными клетками



Активация ингибиторов протонного насоса в кислой среде

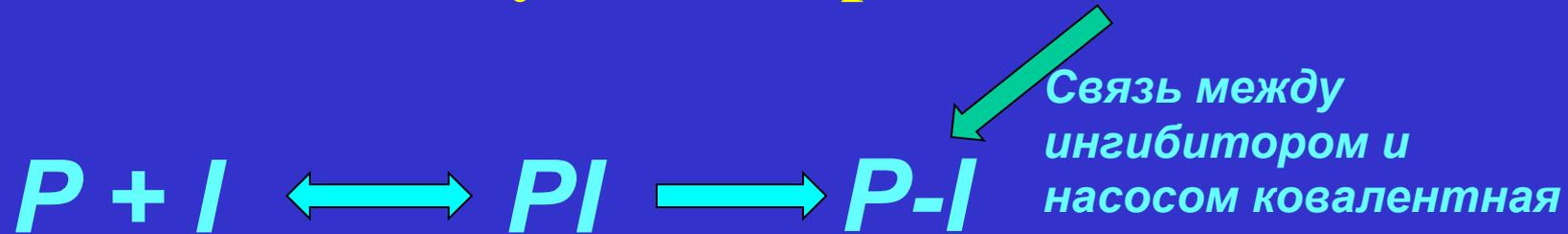


1. Протонирование

2. Циклизация

3. Образование ковалентной связи с SH-группой Н,К-насоса

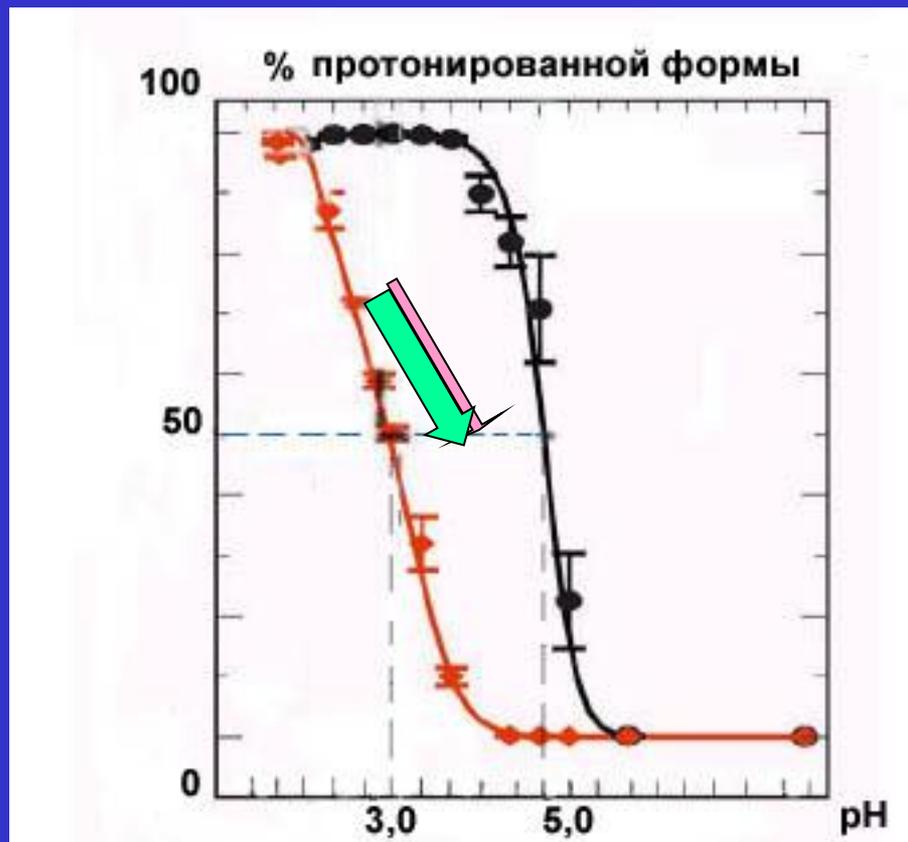
Ингибиторы протонного насоса действуют необратимо



После стадии 2 концентрация комплекса PI (то есть эффект) не зависит от концентрации ингибитора, блокада продолжается невзирая на снижение концентрации ИПП в крови

Действие необратимых ингибиторов протонного насоса длится до тех пор, пока молекула насоса не подвергнется внутриклеточному протеолизу. Время полужизни H,K -насоса человека около 40 ч

Зависимость активации ингибиторов протонного насоса от рН



Пантопразол - 3,0

Омепразол - 4,0

Эзомепразол - 4,0

Лансопразол - 4,0

Рабепразол - 4,9

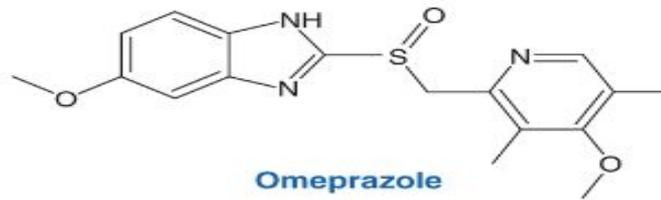


Диапазон рН, в котором
ИПП существуют в
протонированной форме

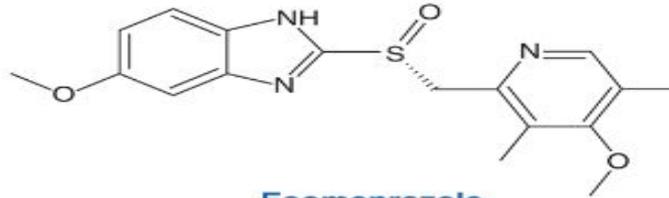
Механизм действия ингибиторов протонного насоса

1. Всасывание в тонком кишечнике, попадание в кровь
2. Прохождение в незаряженном виде через мембраны париетальной клетки в секреторные каналцы
3. Протонирование и концентрирование в каналцах
4. Внутримолекулярная перестройка (образование циклического сульфенамида)
5. Образование ковалентной S-S-связи с SH-группой H,K-насоса

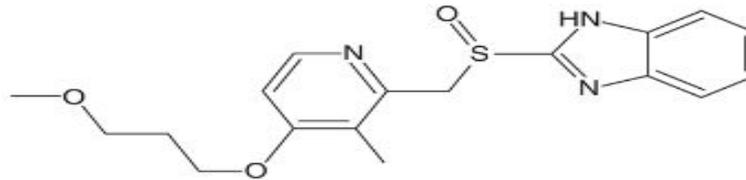




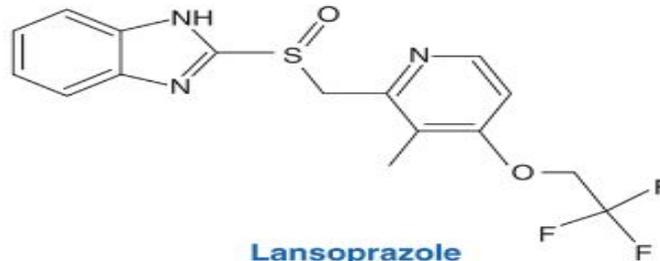
Omeprazole



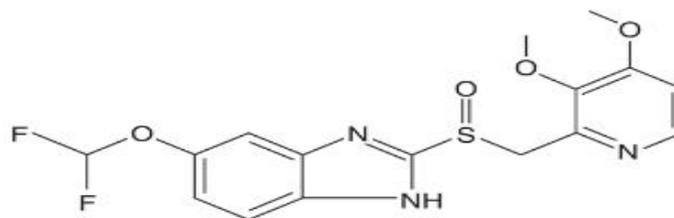
Esomeprazole



Rabeprazole



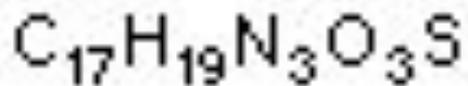
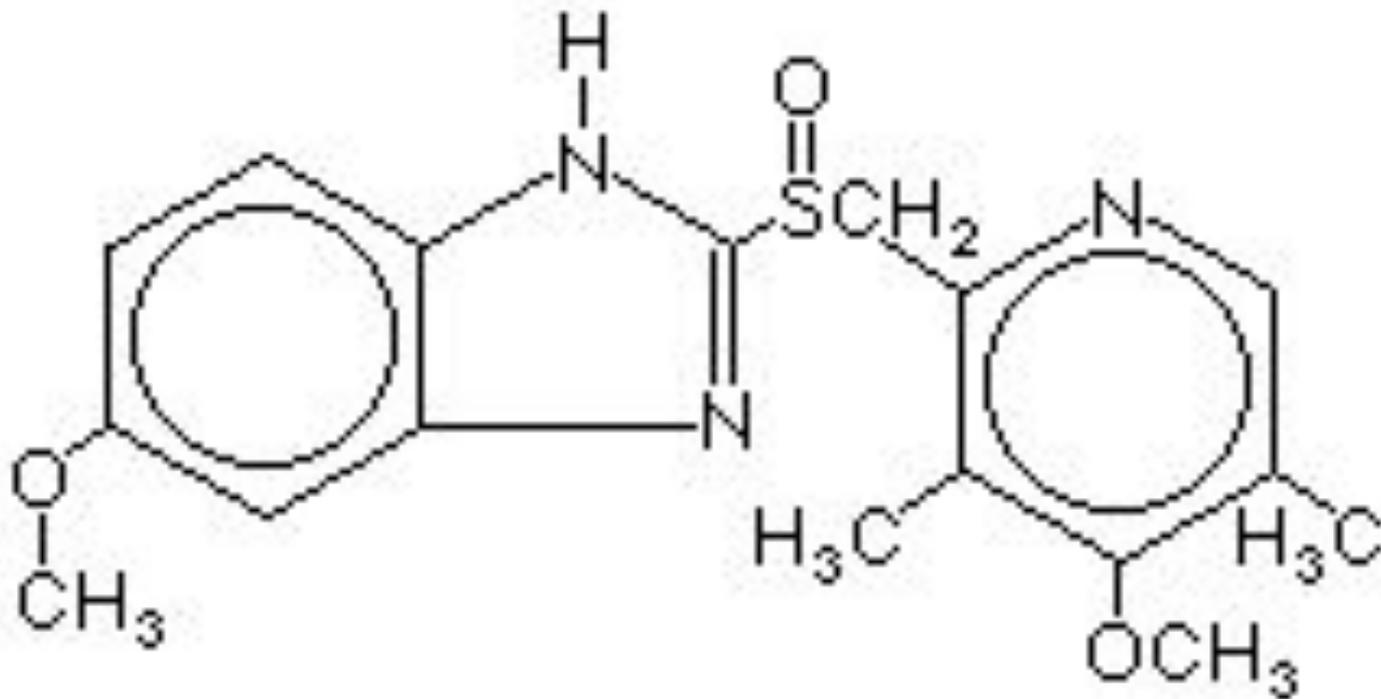
Lansoprazole



Pantoprazole

Омепразол

(омез)



СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. М-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H_2 -рецепторов

I поколение - Циметидин (тагамет)

II поколение - Ранитидин (зантак)

III поколение - Фамотидин
Роксатидин

3. Блокаторы H^+K^+ АТФазы

Омепразол (омез)

Лансопразол

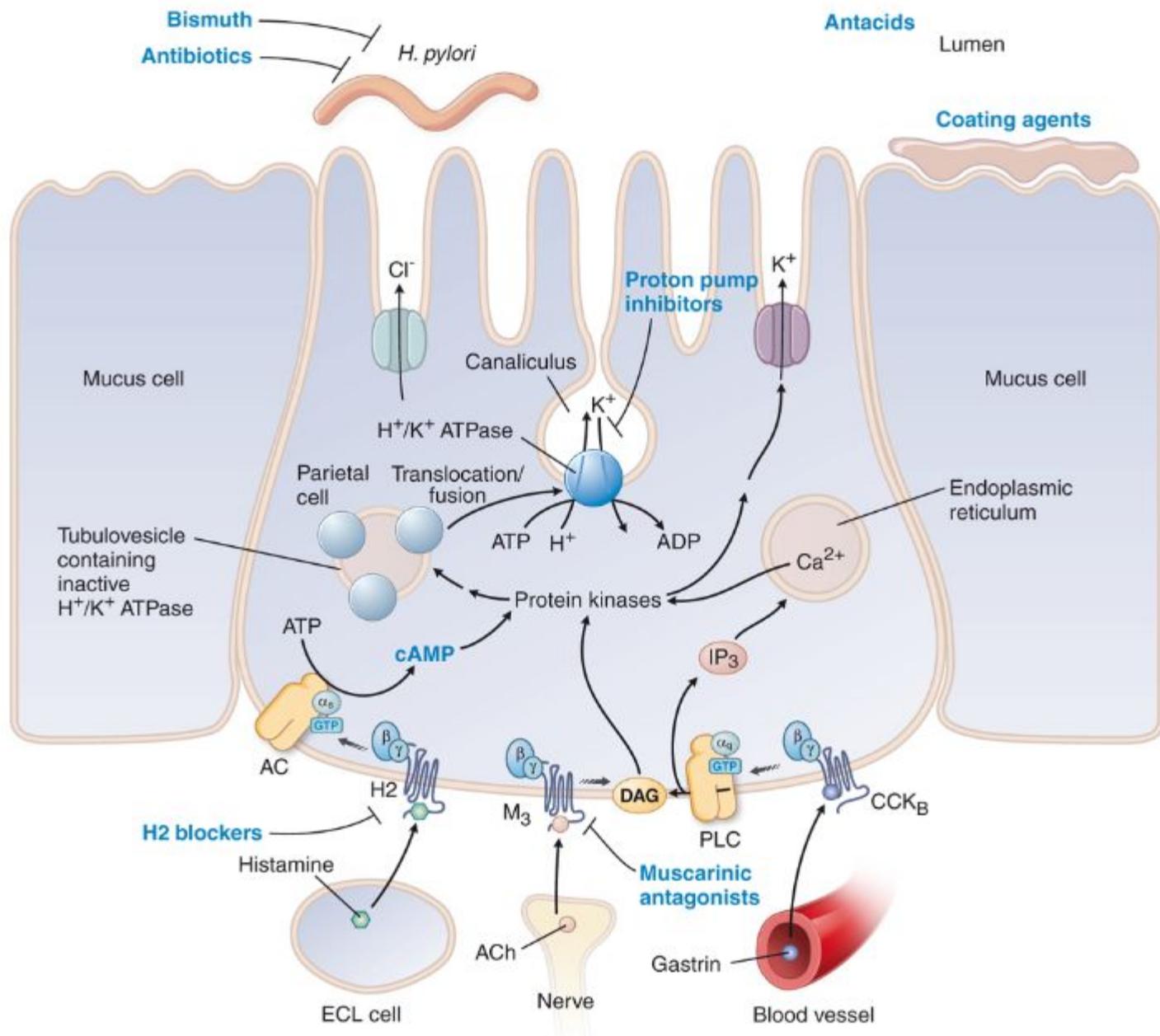
Пантопразол

4. Аналоги простагландинов E

Мизопростол

Простагландины E_1 , E_2 , I_2 :

- 1) снижают секрецию HCl,
- 2) увеличивают секрецию слизи,
- 3) увеличивают секрецию HCO_3^- ,
- 4) повышают устойчивость эпителия к повреждающим факторам,
- 5) расширяют кровеносные сосуды и улучшают кровоснабжение слизистой оболочки.



Гастропротекторы

Черника



Черемуха



Зверобой



Гастропротекторы

Висмута трикалия дицитрат (Де-нол)

Гастропротекторы

Висмута трикалия дицитрат (де-нол)

Сукралфат



СРЕДСТВА, ДЕЙСТВУЮЩИЕ НА Helicobacter pylori

Аминопенициллины

Ампициллин

Амоксициллин

Макролиды

Кларитромицин

Нитроимидазолы

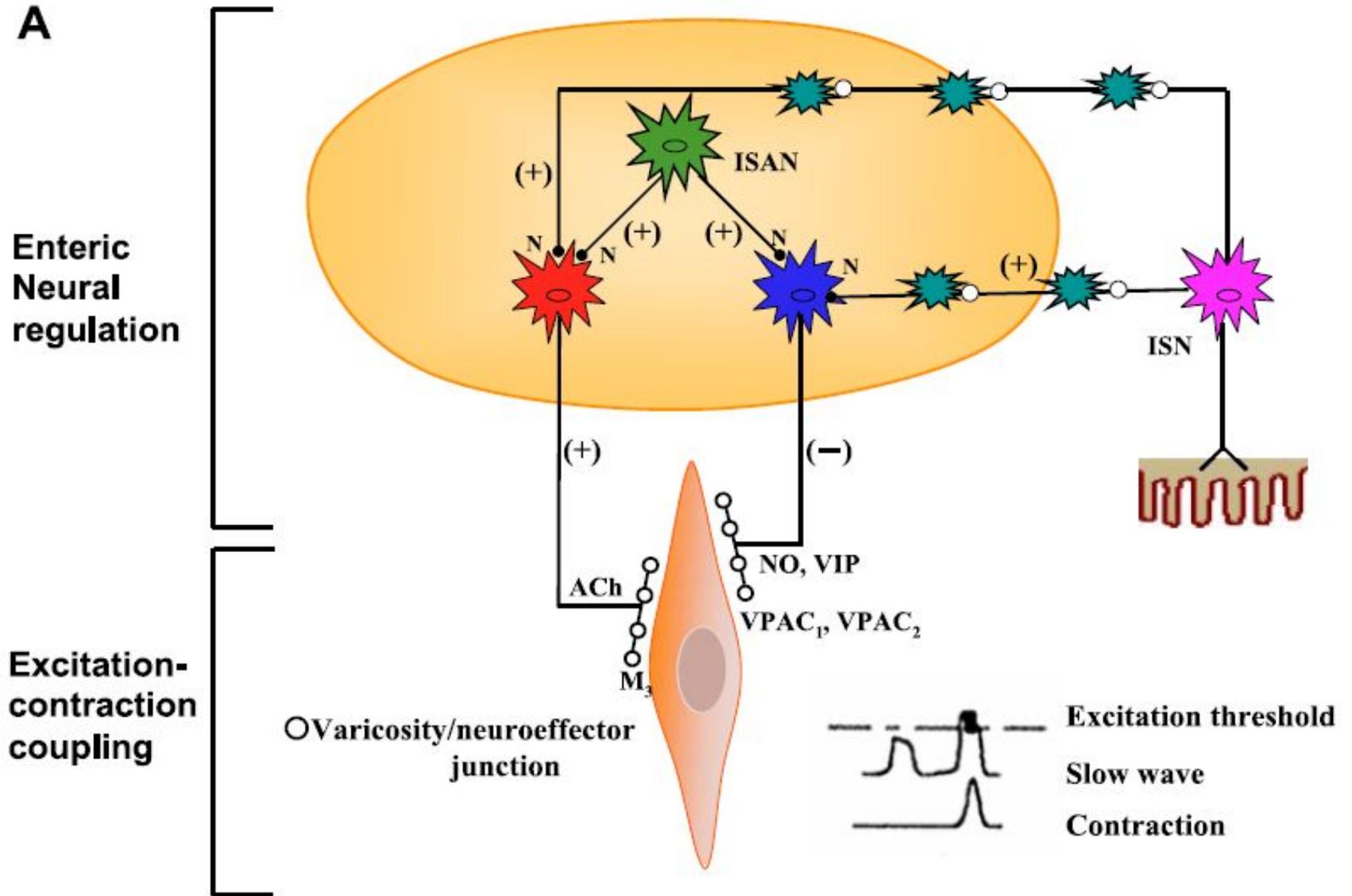
Метронидазол

Тинидазол

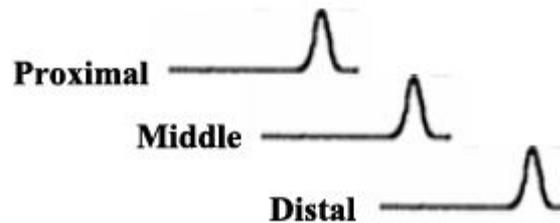
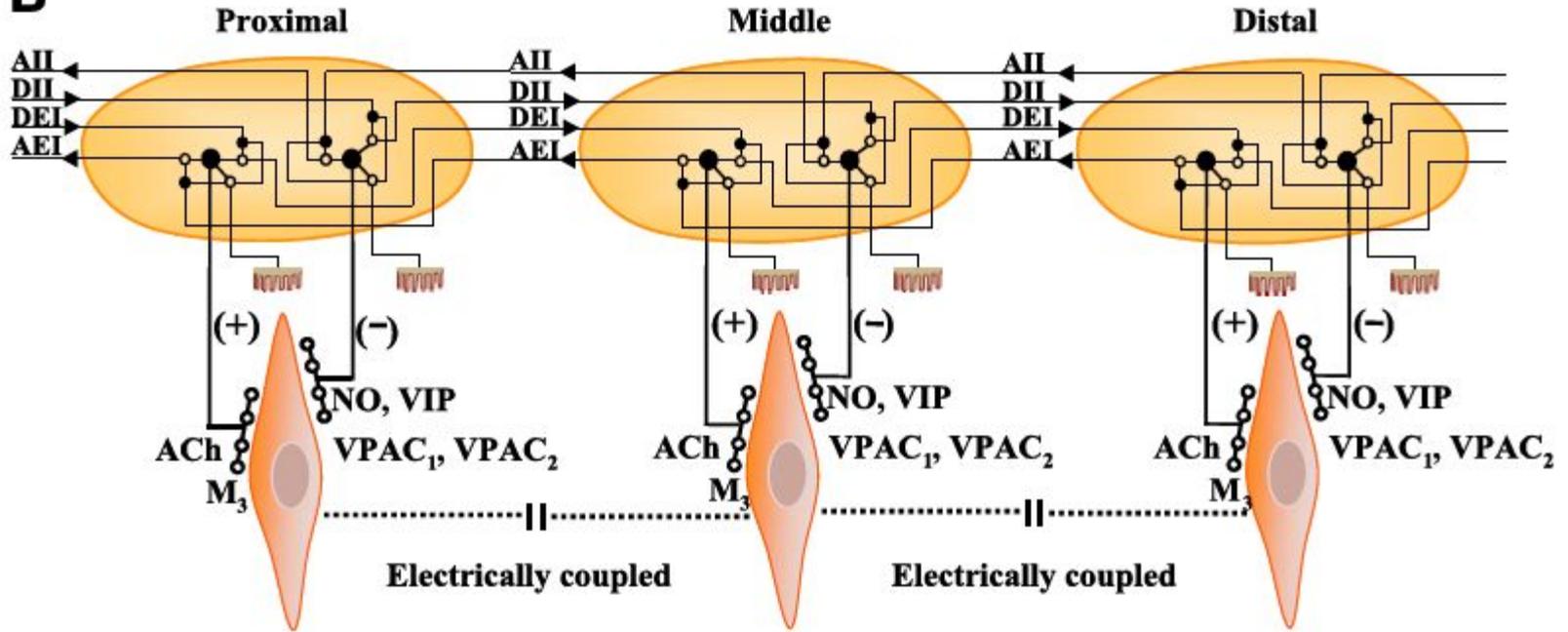
Препараты висмута

Висмута трикалия дицитрат

РАСПРОКРИЖИТИВИ (ПРОКРИЖИТИВИ)



Sushil K. Sarna, *Am J Physiol Gastrointest Liver Physiol* 291:545-555, 2006.

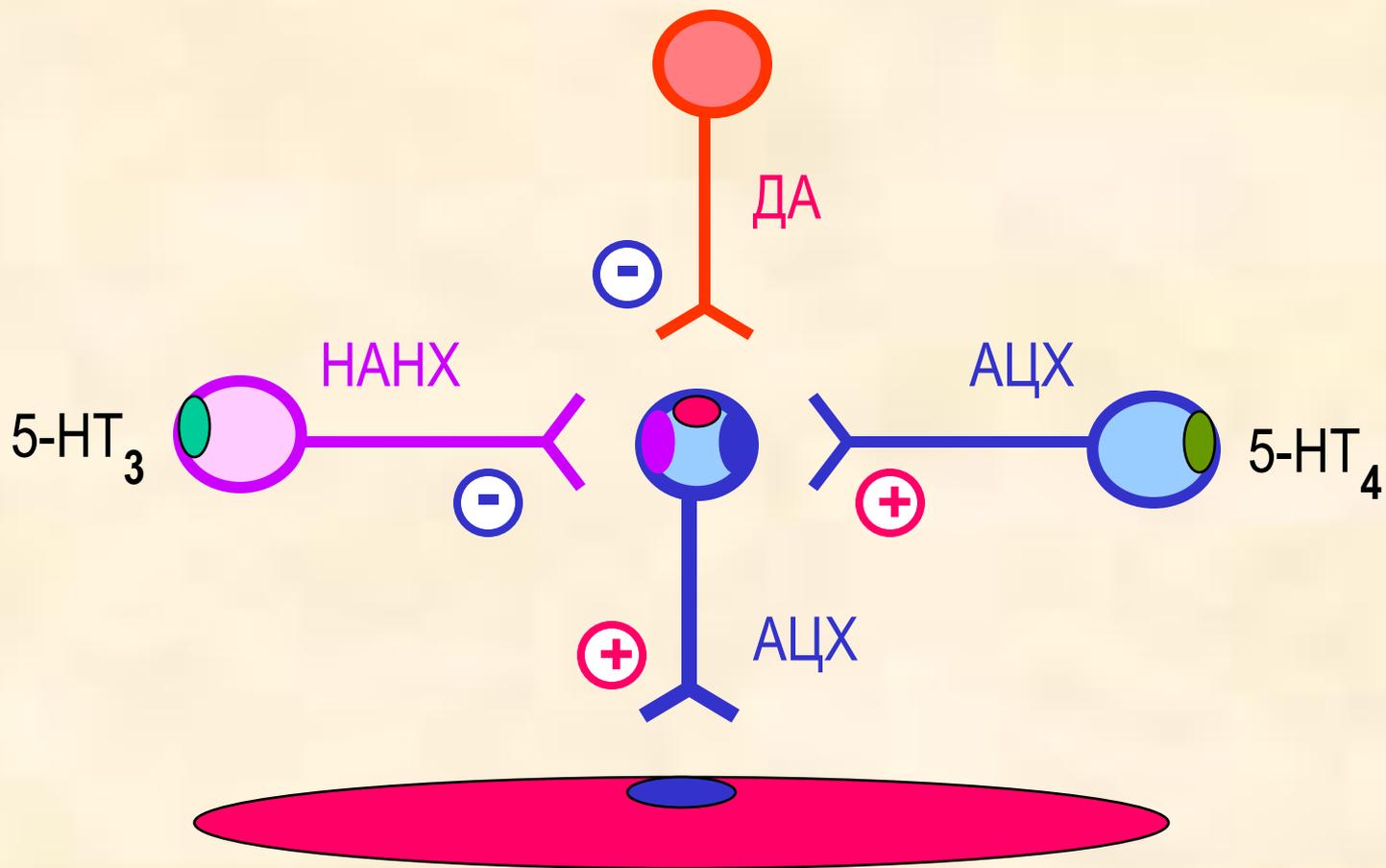
B

- Neuronal Cell Body
- Varicosity/neuroeffector junction

- AII = Ascending inhibitory interneuron
- DII = Descending inhibitory interneuron
- DEI = Descending excitatory interneuron
- AEI = Ascending excitatory interneuron

Sushil K. Sarna, *Am J Physiol Gastrointest Liver Physiol* 291:545-555, 2006.

Нейроны миентерального сплетения



Гастрокинетика (прокинетика)

Домперидон (мотилиум)

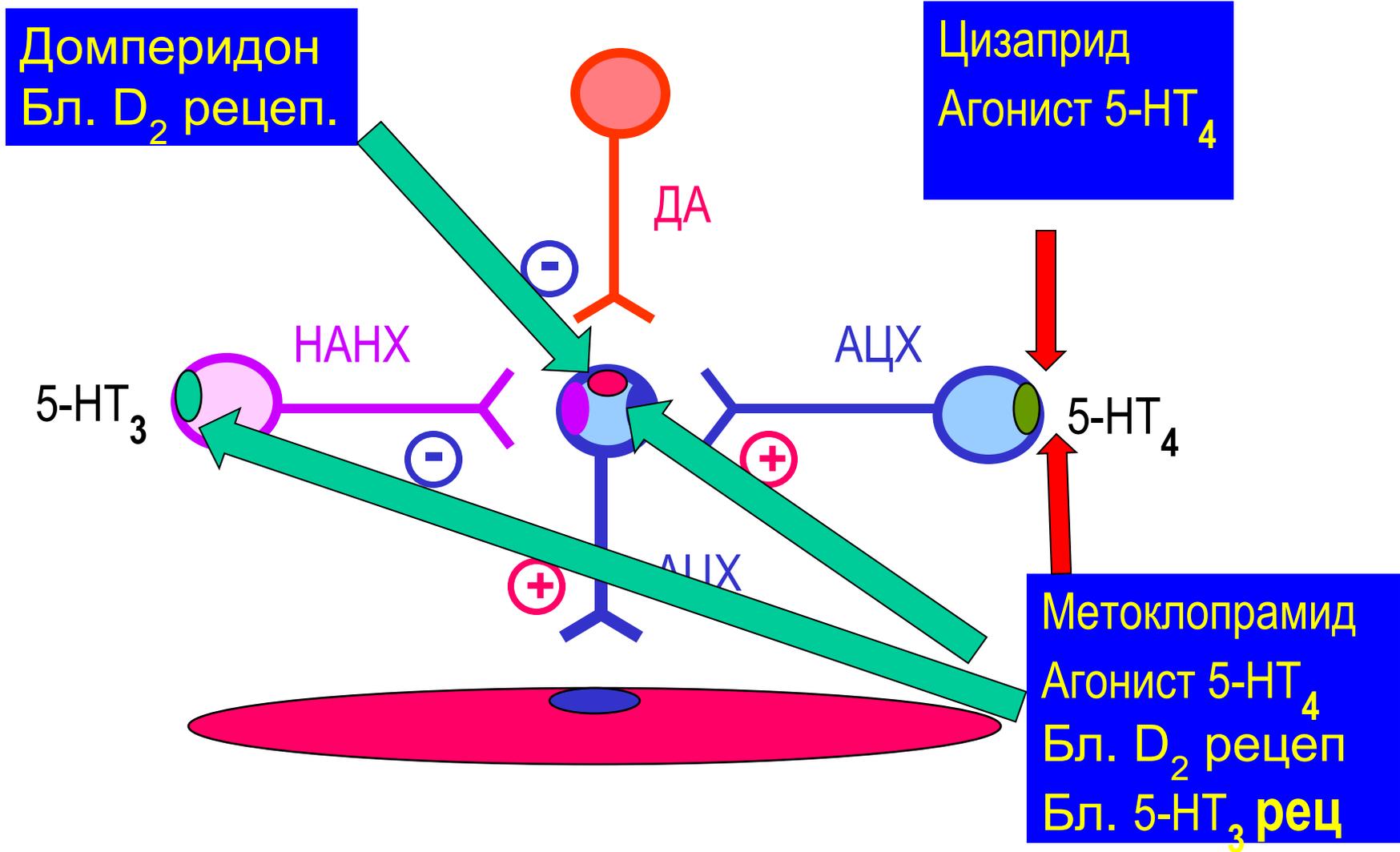
Метоклопрамид (церукал, реглан)

Цизаприд (координакс)

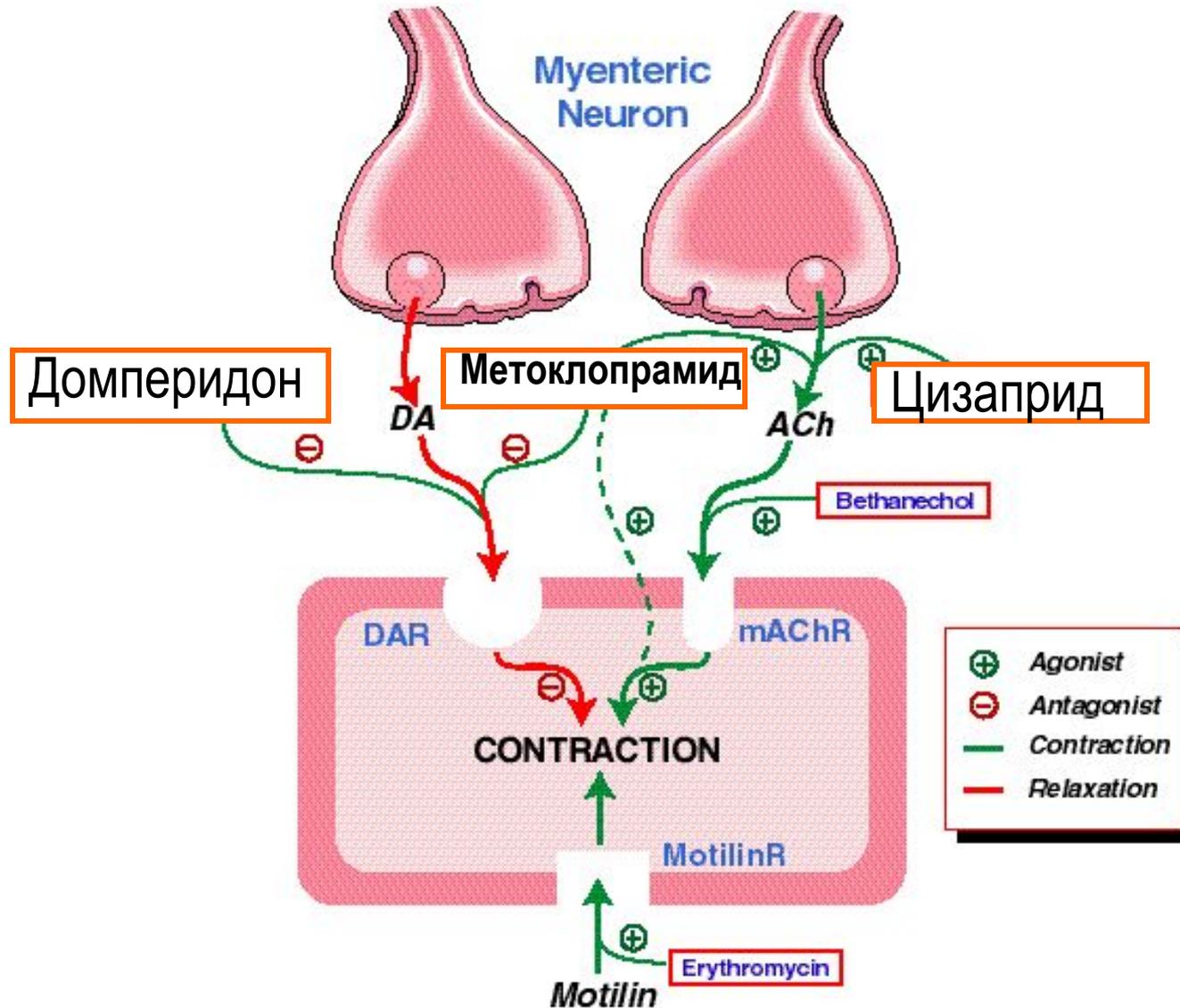
Сравнение прокинетиков

	Метоклопрамид	Домперидон	Цизаприд
D ₂ -рецепторы	Антагонист	Антагонист	
5-HT ₃ -рецепторы	Антагонист		
5-HT ₄ -рецепторы	Агонист		Агонист
Проницаемость ГЭБ	+		
Противорвотное д-е	+	+	
Прокинетическое д-е <i>проксимальный ЖКТ</i>	+	+	+
<i>дистальный ЖКТ</i>			+

Нейроны миентерального сплетения

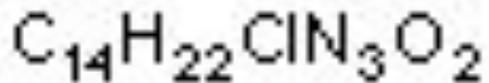
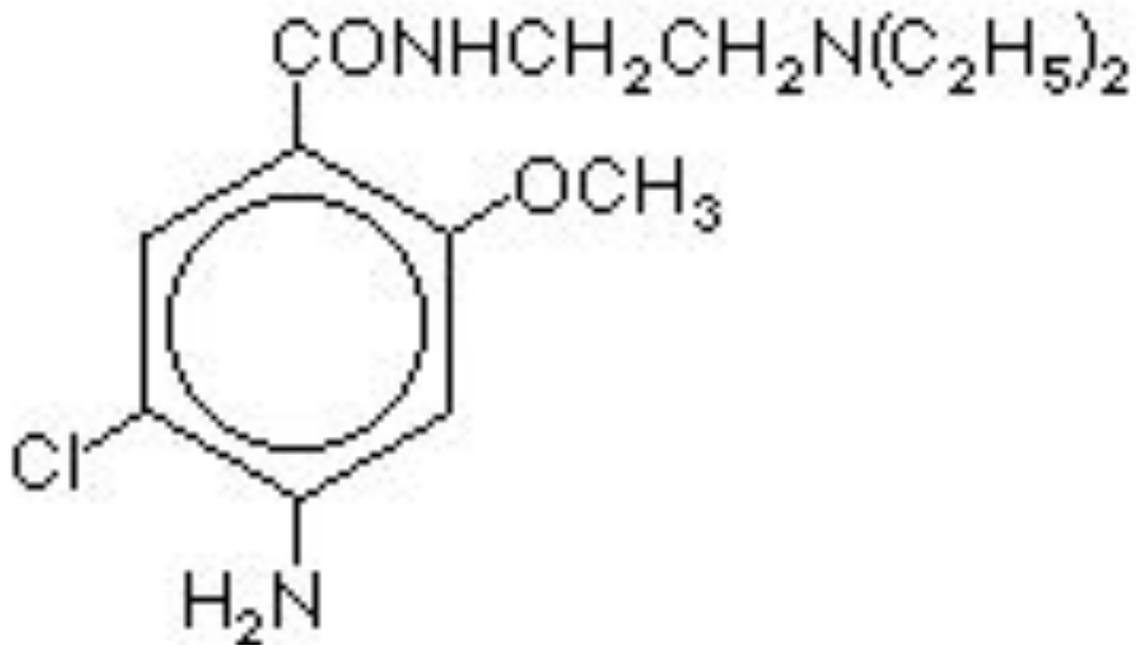


Regulation of GI Smooth Muscle Contractility



Метоклопрамид

(церукал, реглан)



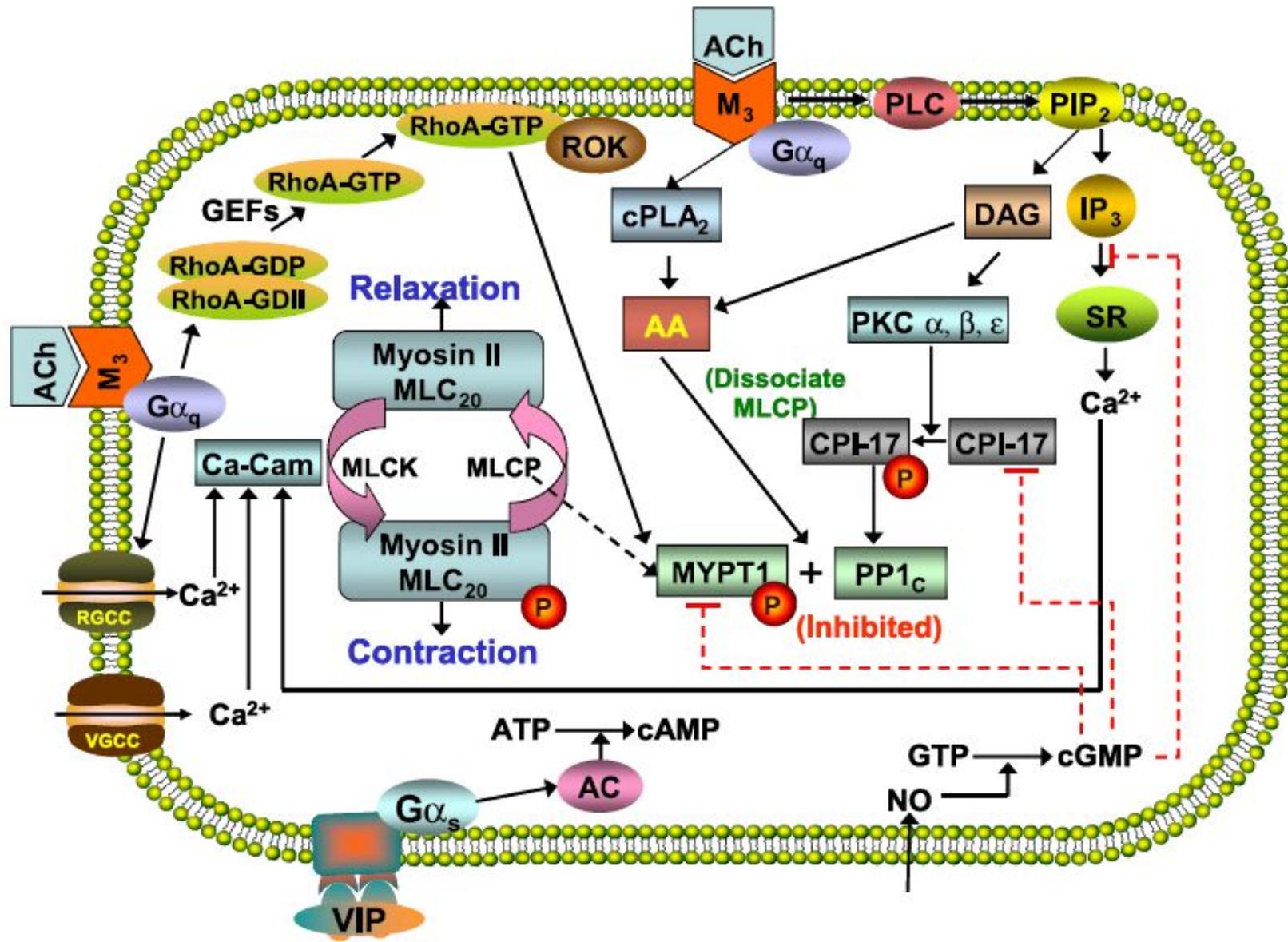
Показания к применению метоклопрамида

1) в качестве гастрокинетического средства:

- задержка эвакуации содержимого желудка,
- диабетический гастропарез,
- гастропарез после операции,
- рентгеновское исследование желудка и кишечника,
- гастро-эзофагальный рефлюкс,
- пилороспазм,

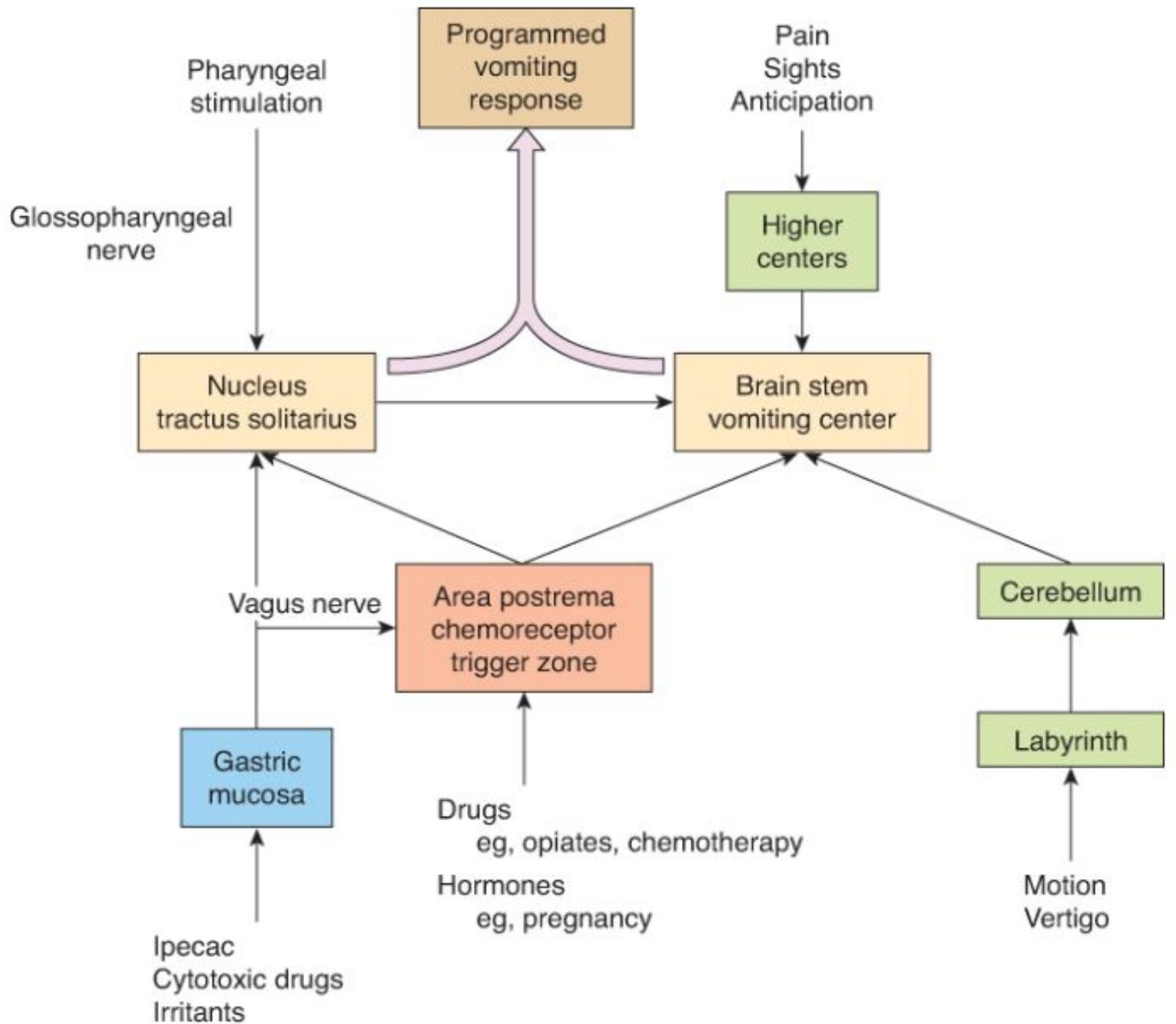
2) в качестве противорвотного средства:

- рвота при заболеваниях ЖКТ, мигрени, химиотерапии опухолей

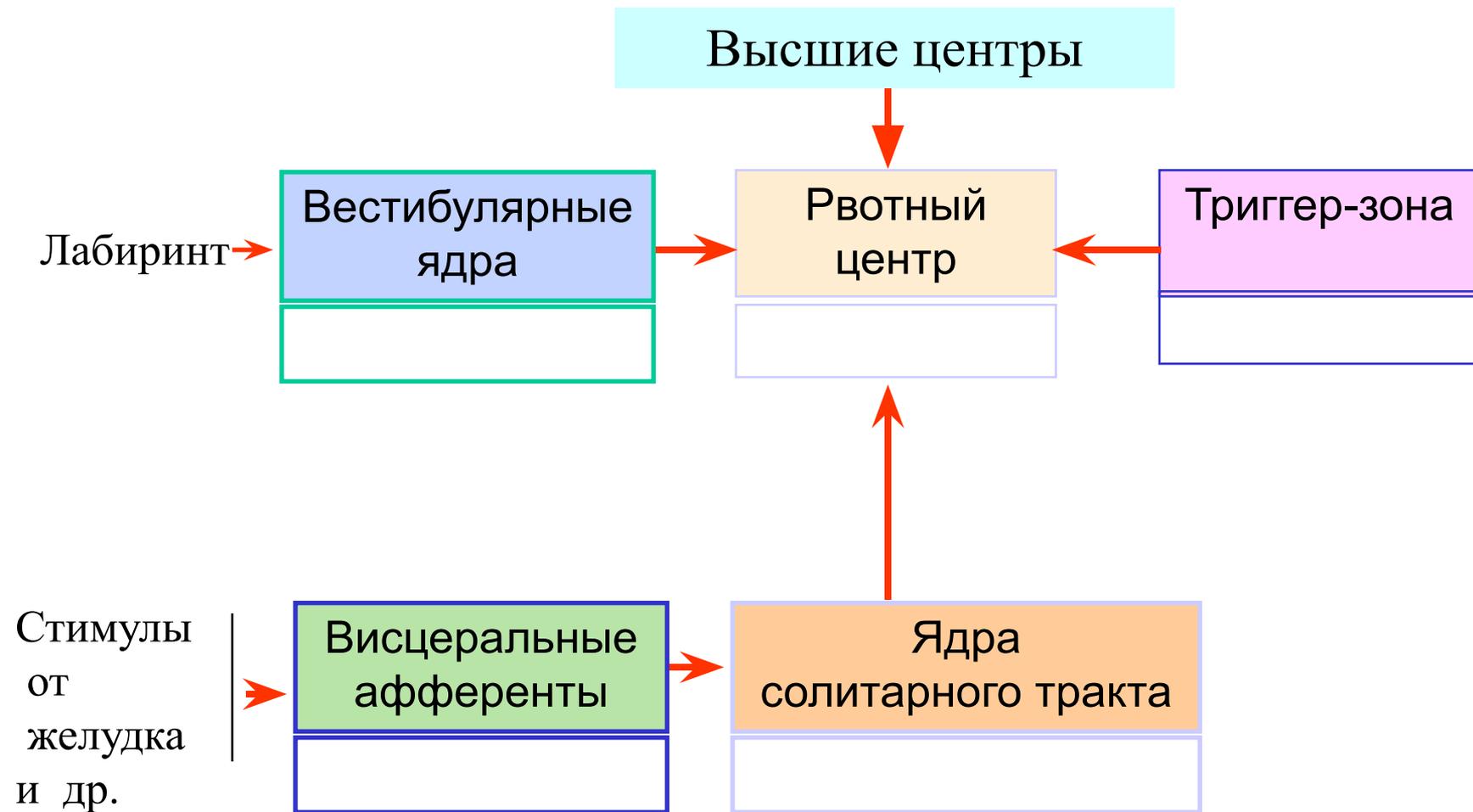


Sushil K. Sarna, *Am J Physiol Gastrointest Liver Physiol* 291:545-555, 2006.

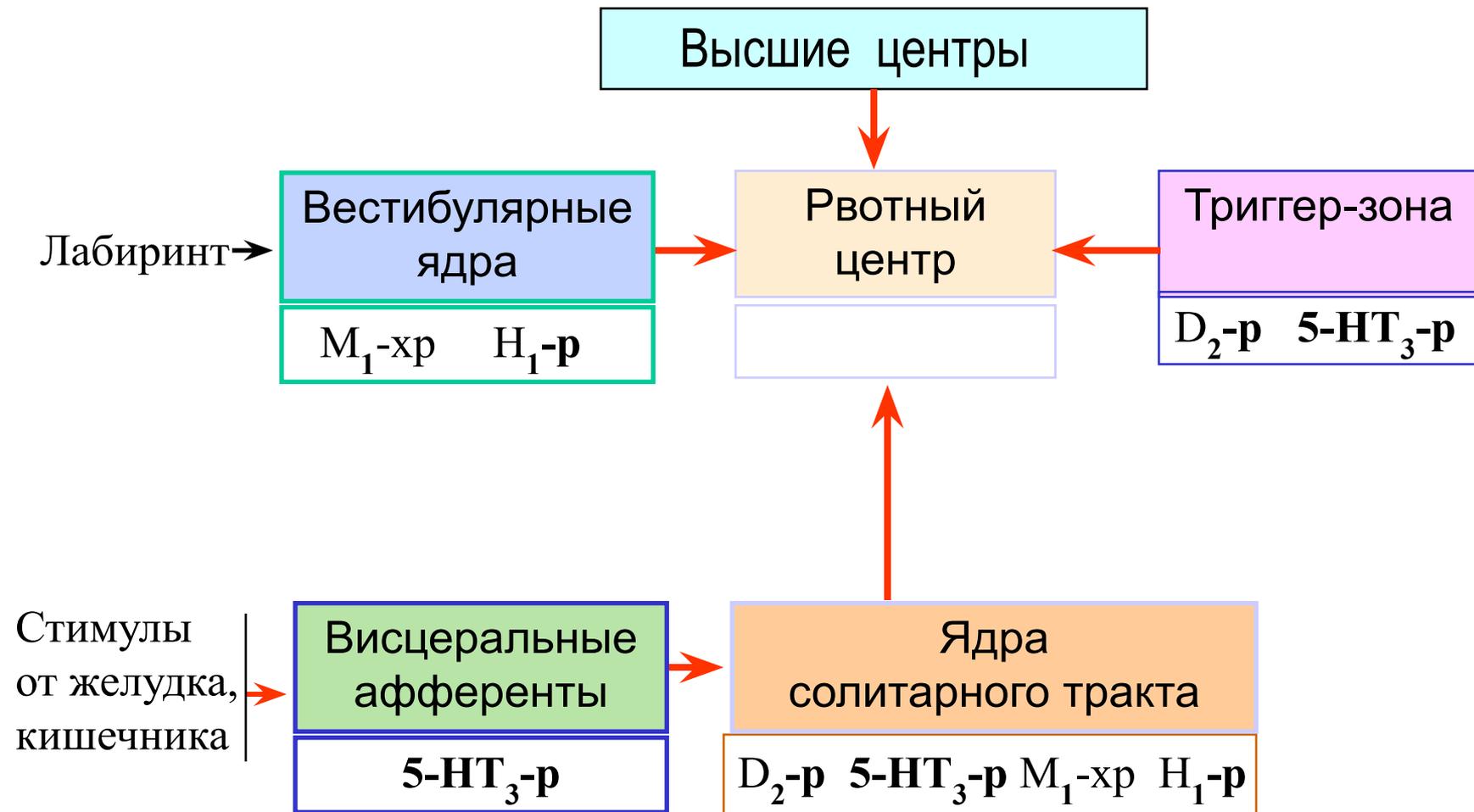
Противорвотные средства



Возбуждение рвотного центра



ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ

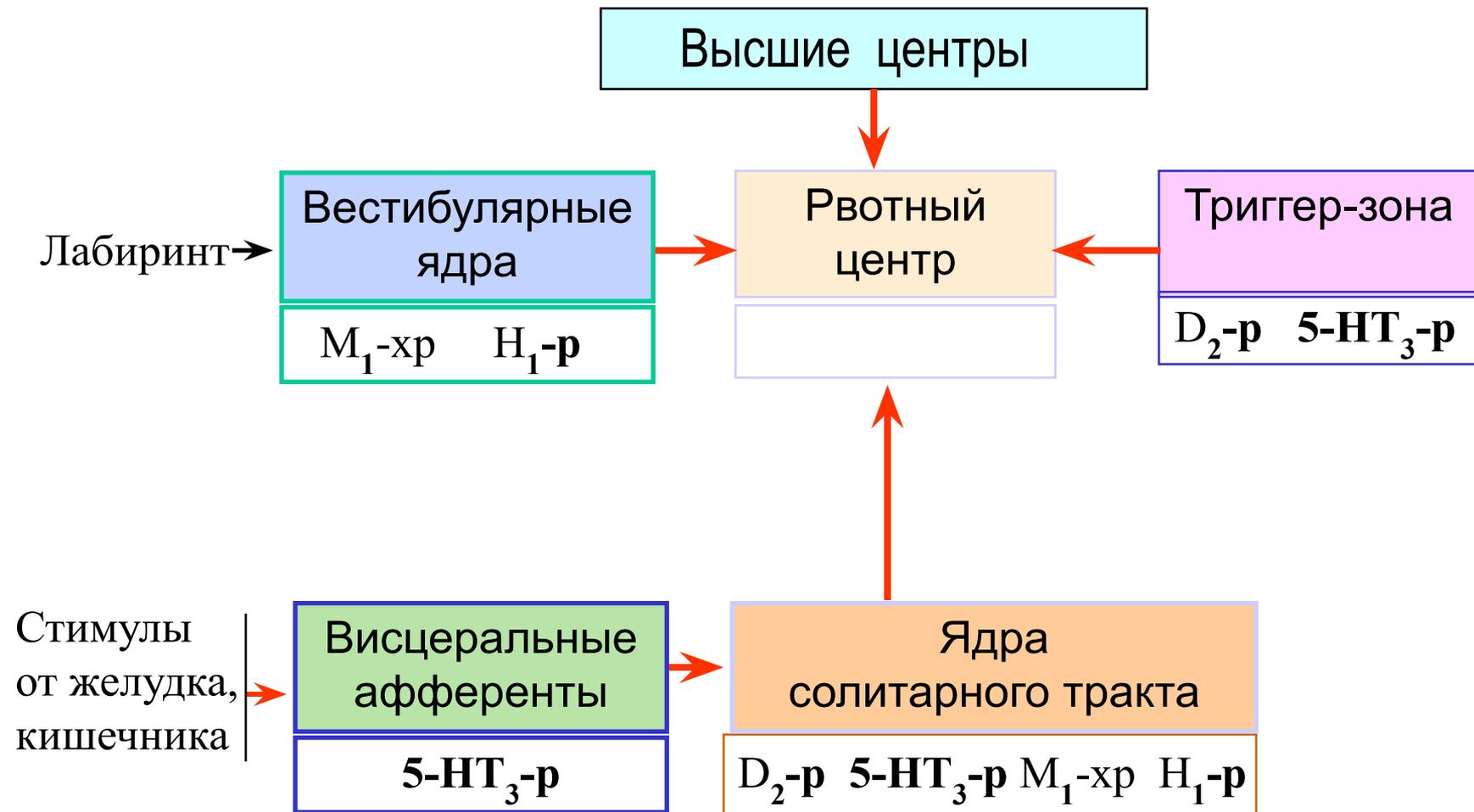


ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. *M-холиноблокаторы*

Скополамин

ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ



ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. M-холиноблокаторы

Скополамин

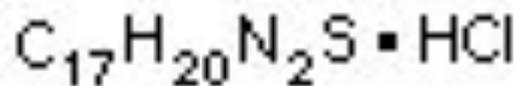
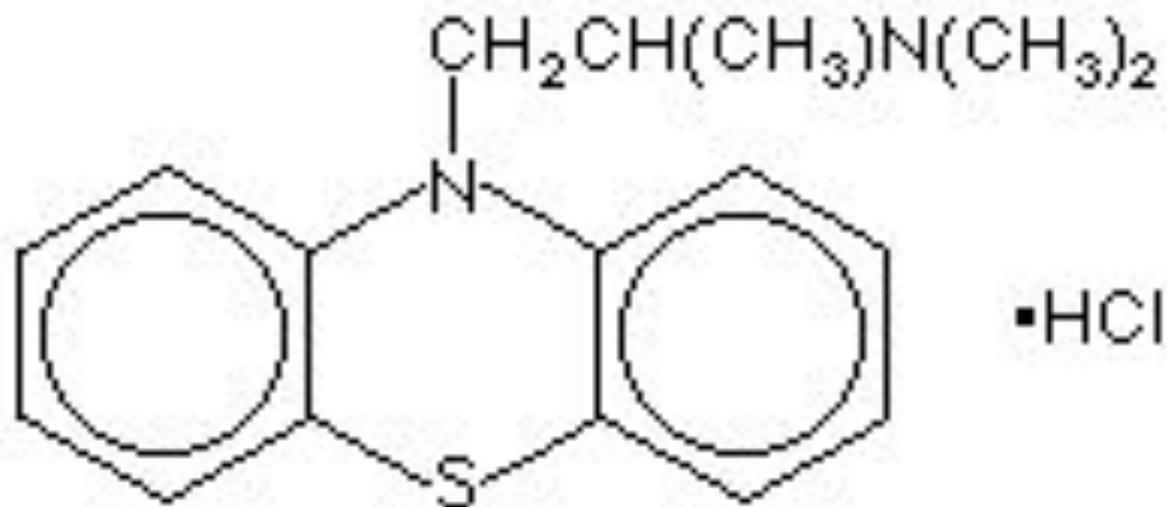
2. Блокаторы H₁-рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

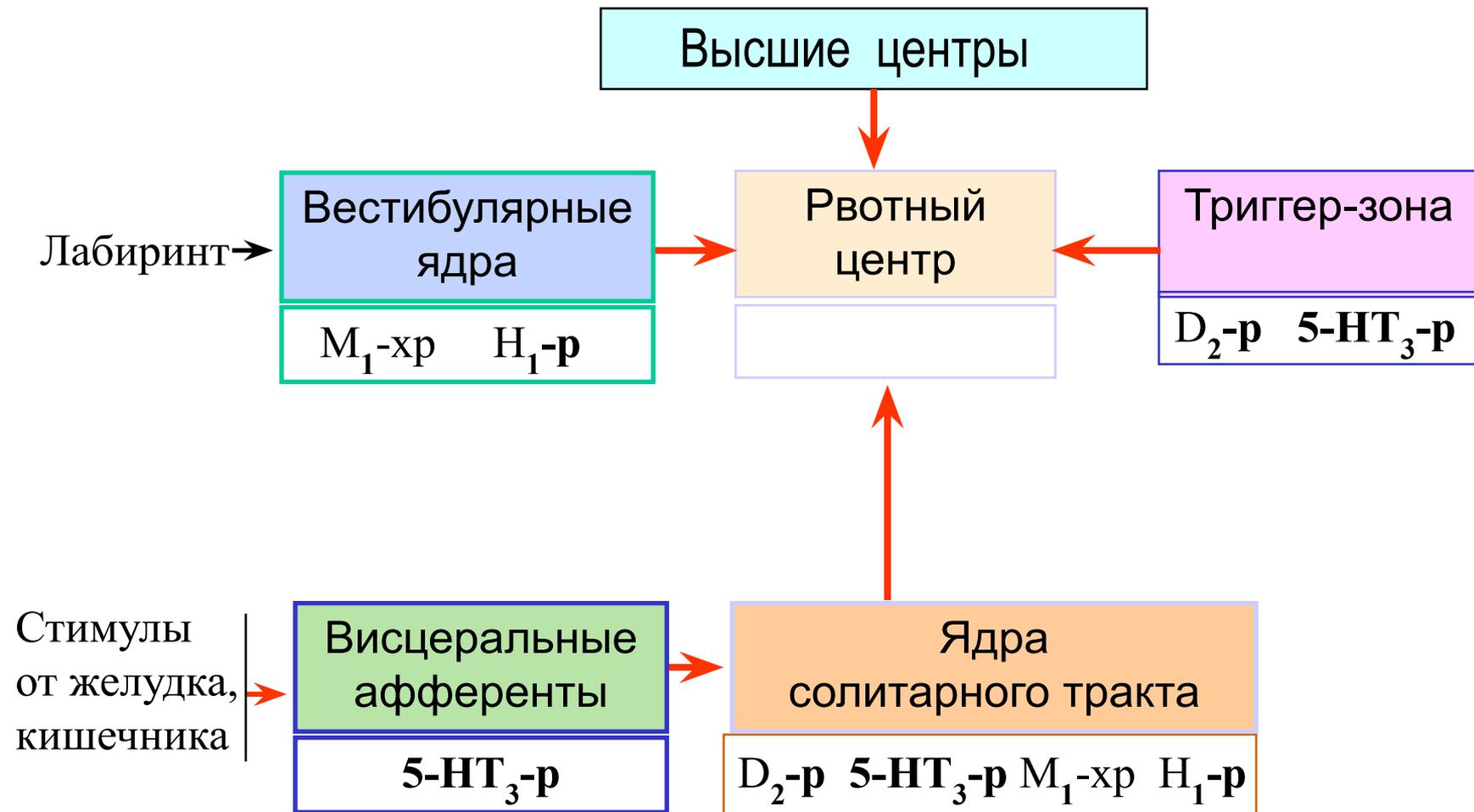
Прометазин (дипразин, пипольфен)

Прометазин

(дипразин, пипольфен)



ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ



ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H_1 -рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D_2 -рецепторов

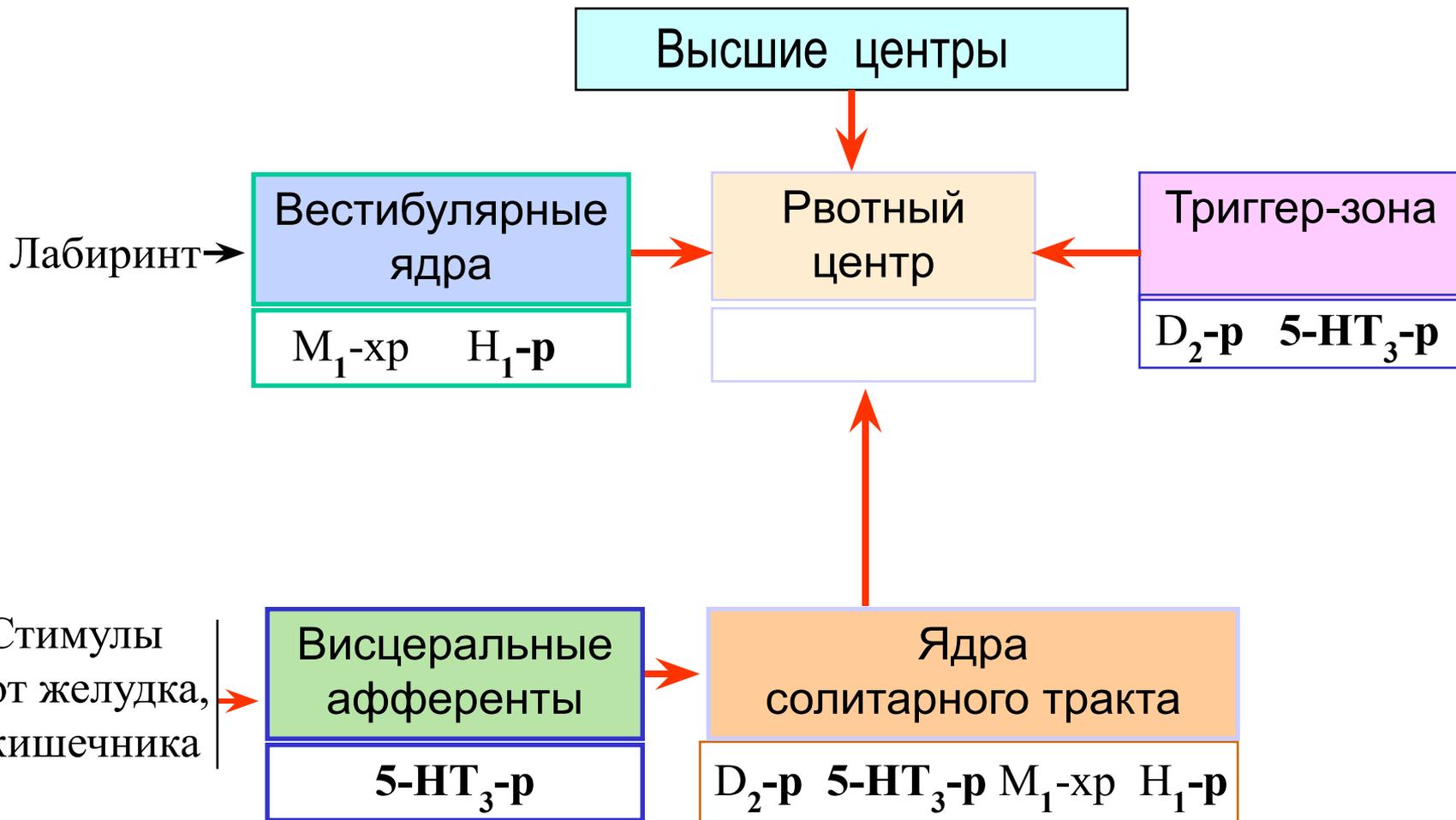
Тиэтилперазин (торекан)

Перфеназин (этаперазин)

Галоперидол

Домперидон (мотилиум)

ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ



ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H_1 -рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D_2 -рецепторов

Тиэтилперазин (торекан)

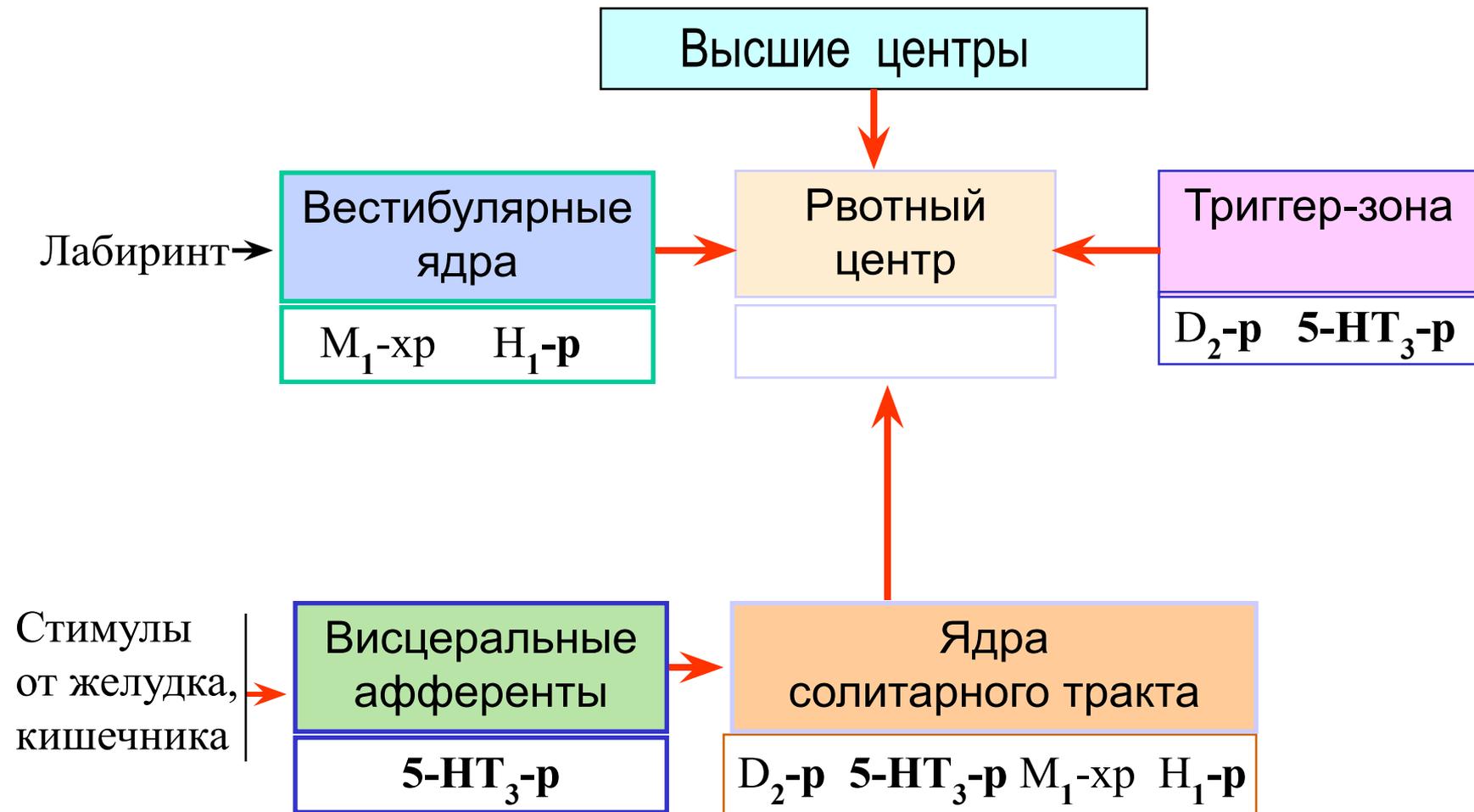
Перфеназин (этаперазин)

Галоперидол

4. Блокаторы D_2 - и $5-HT_3$ -рецепторов

Метоклопрамид (церукал)

ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ



ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H_1 -рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D_2 -рецепторов

Тиэтилперазин Перфеназин (этаперазин) Галоперидол

Домперидон (мотилиум)

4. Блокаторы D_2 - и $5-HT_3$ -рецепторов

Метоклопрамид (церукал)

5. Блокаторы $5-HT_3$ -рецепторов

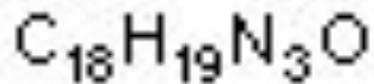
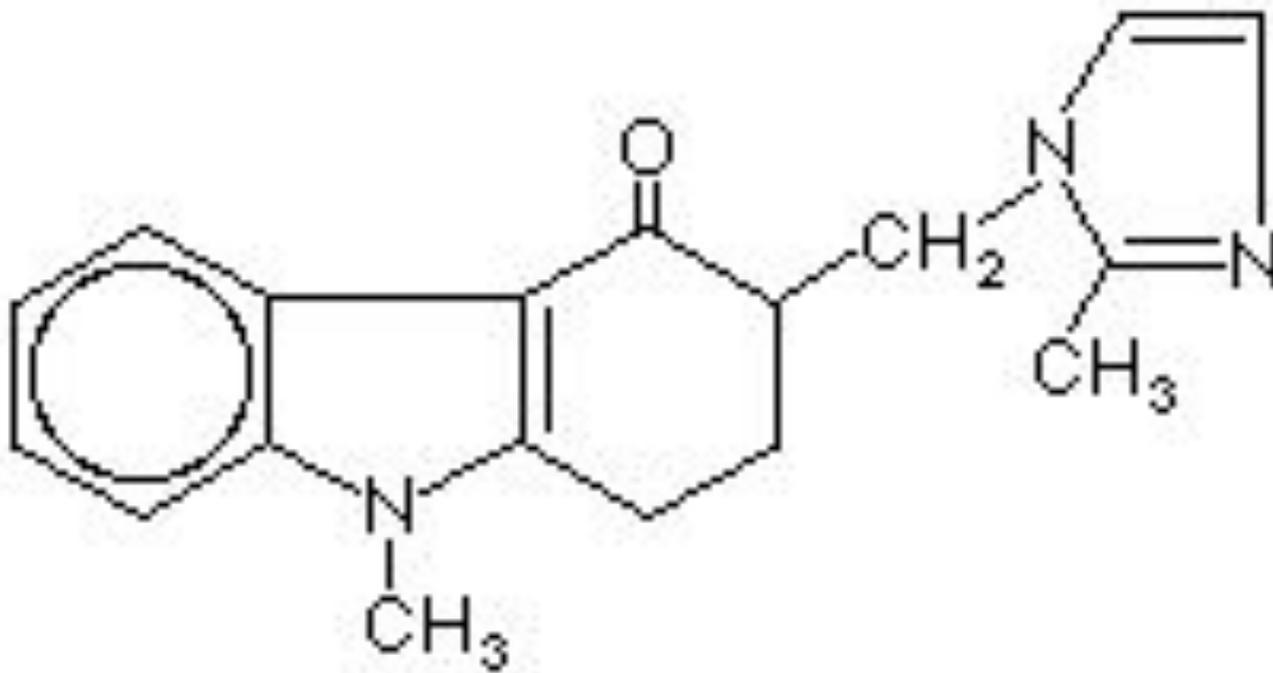
Ондансетрон (зофран)

Трописетрон

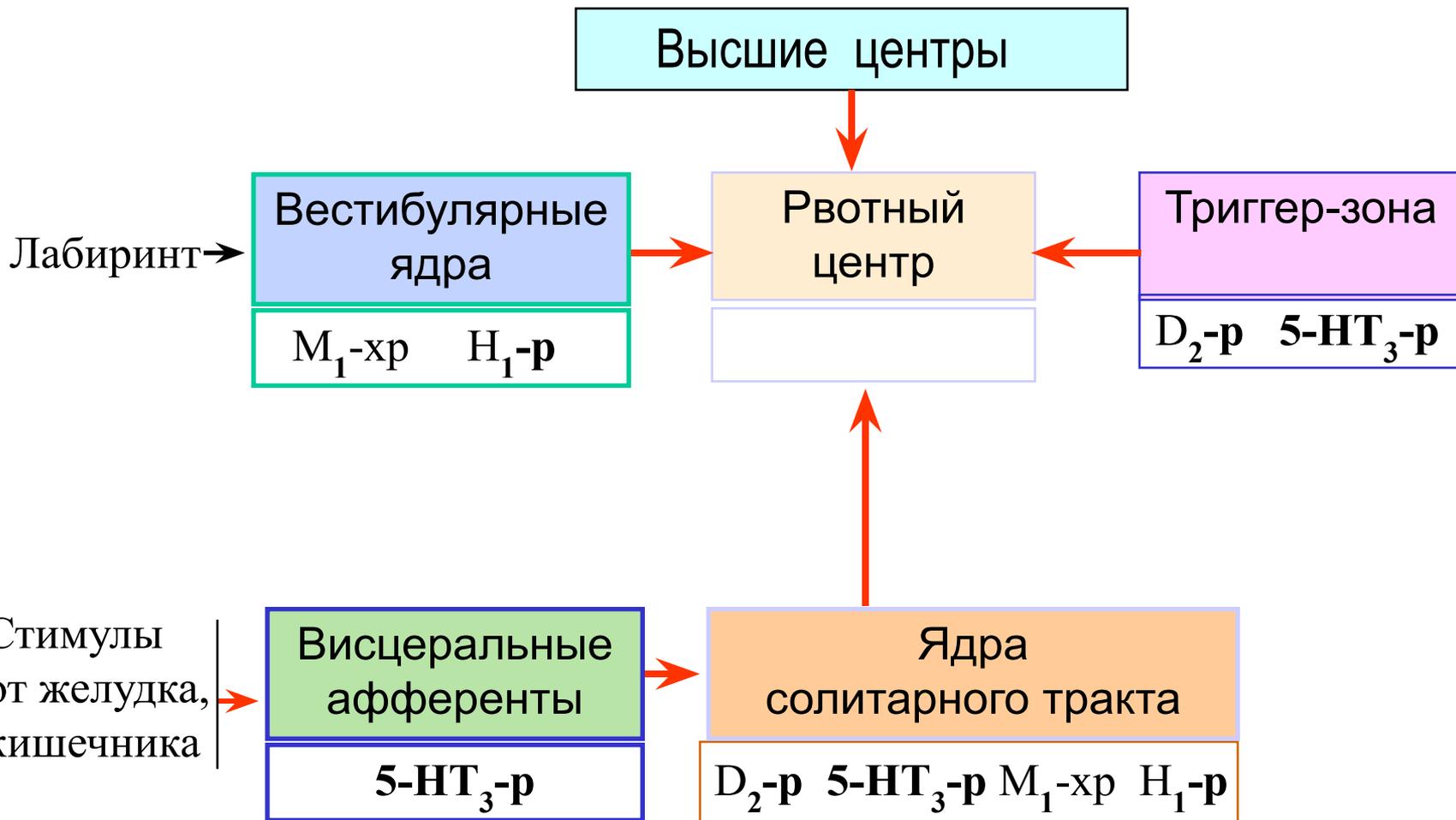
Гранисетрон

Ондансетрон

(зофран)



ЛОКАЛИЗАЦИЯ РЕЦЕПТОРОВ В СТРУКТУРАХ, СВЯЗАННЫХ С РВОТНЫМ ЦЕНТРОМ



ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H₁-рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D₂-рецепторов

Тиэтилперазин Перфеназин (этаперазин) Галоперидол

Метоклопрамид (церукал) Домперидон (мотилиум)

4. Блокаторы 5-HT₃-рецепторов

Ондансетрон (зофран)

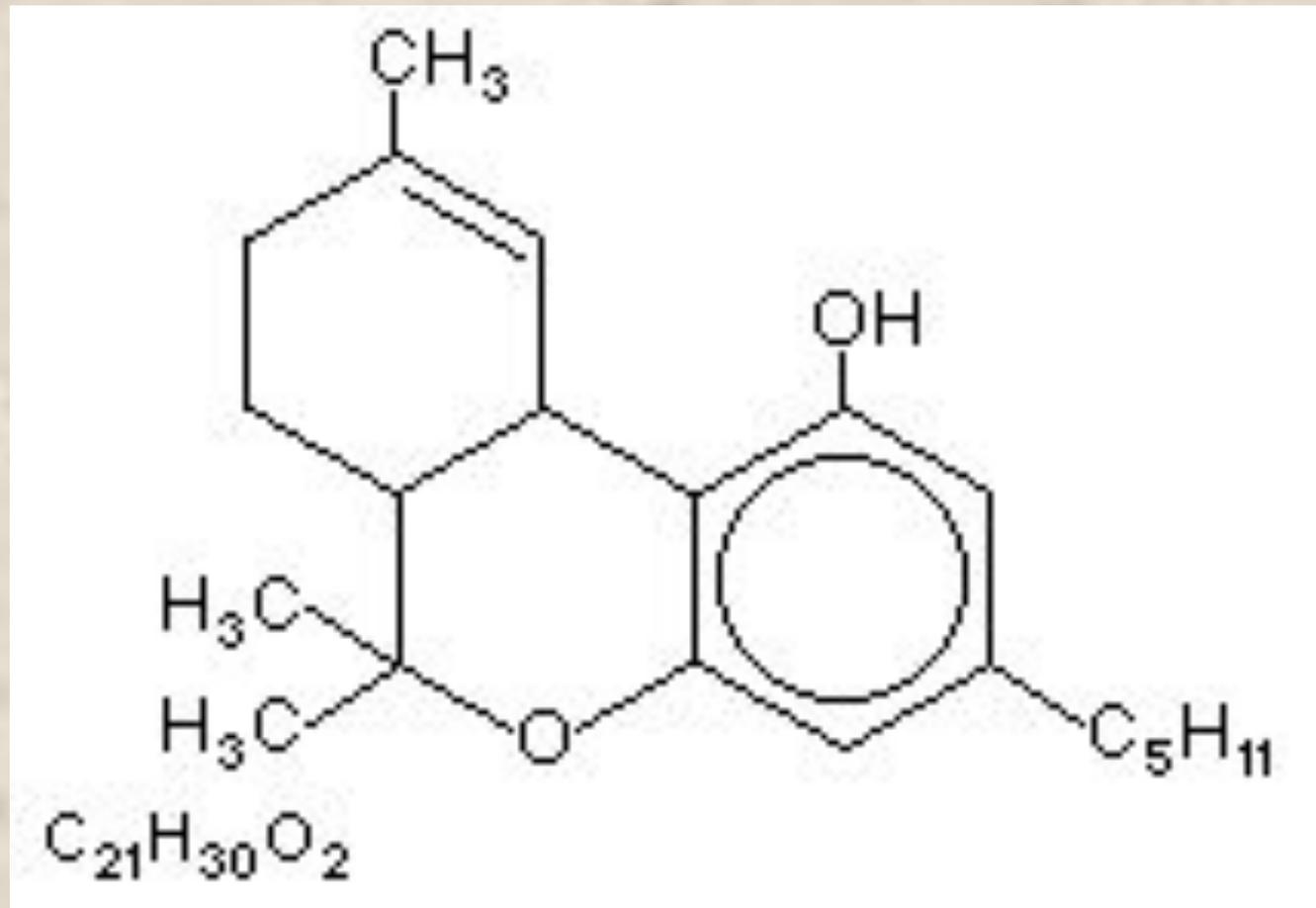
Трописетрон Гранисетрон

5. Каннабиноиды

Дронабинол

Набилон

Дронабинол



Фармакологические эффекты тетрагидроканнабинола

- релаксация
- обострение сенсорного восприятия
- бронходилатация
- противорвотное действие
- анальгезия
- снижение внутриглазного давления
- вазодилатация
- тахикардия
- повышение аппетита
- нарушение кратковременной памяти
- нарушение координации
- католептогенное д-е
- импотенция
- снижение иммунитета

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ ДРОНАБИНОЛА

- ЭЙФОРΙΑ
- ДИСФОРΙΑ
- ЛЕКАРСТВЕННАЯ ЗАВИСИМОСТЬ
- СНИЖЕНИЕ АРТЕРИАЛЬНОГО ДАВЛЕНИЯ
- ТАХИКАРДИЯ
- ОРТОСТАТИЧЕСКАЯ ГИПОТЕНЗИЯ
- СНИЖЕНИЕ УРОВНЯ ТЕСТОСТЕРОНА
- СНИЖЕНИЕ КОЛИЧЕСТВА СПЕРМАТОЗОИДОВ

Гастропротекторы

Висмута трикалия дицитрат (де-нол, вентрисол)

Висмута субгаллат

Висмута субсалицилат

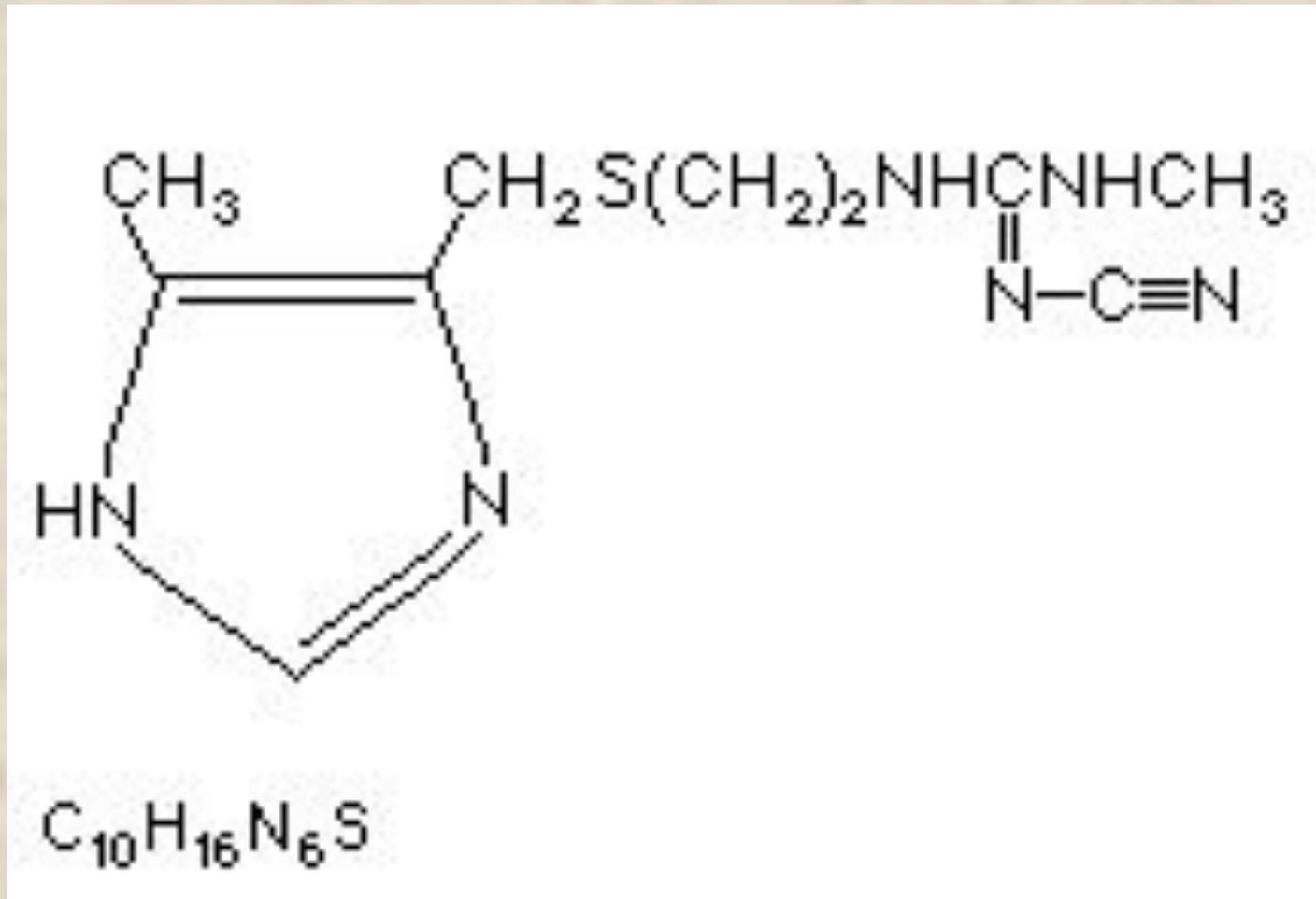
Ранитидин висмута цитрат

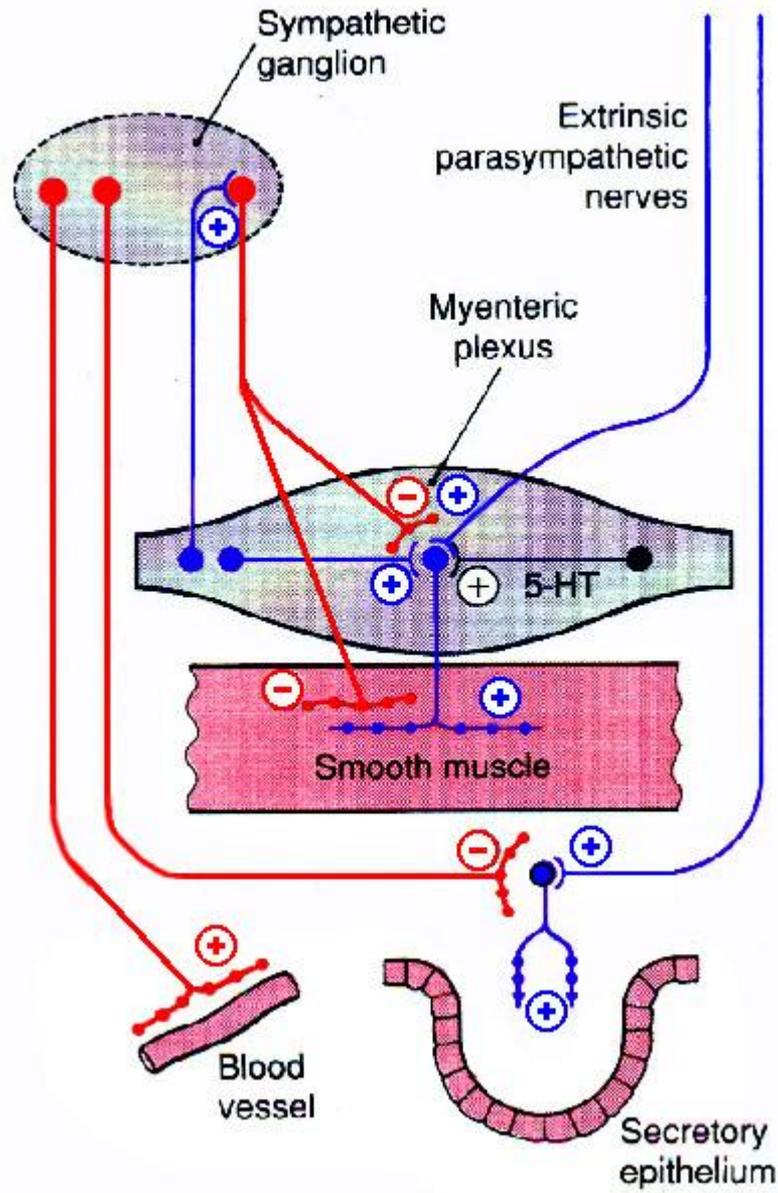
Сукралфат

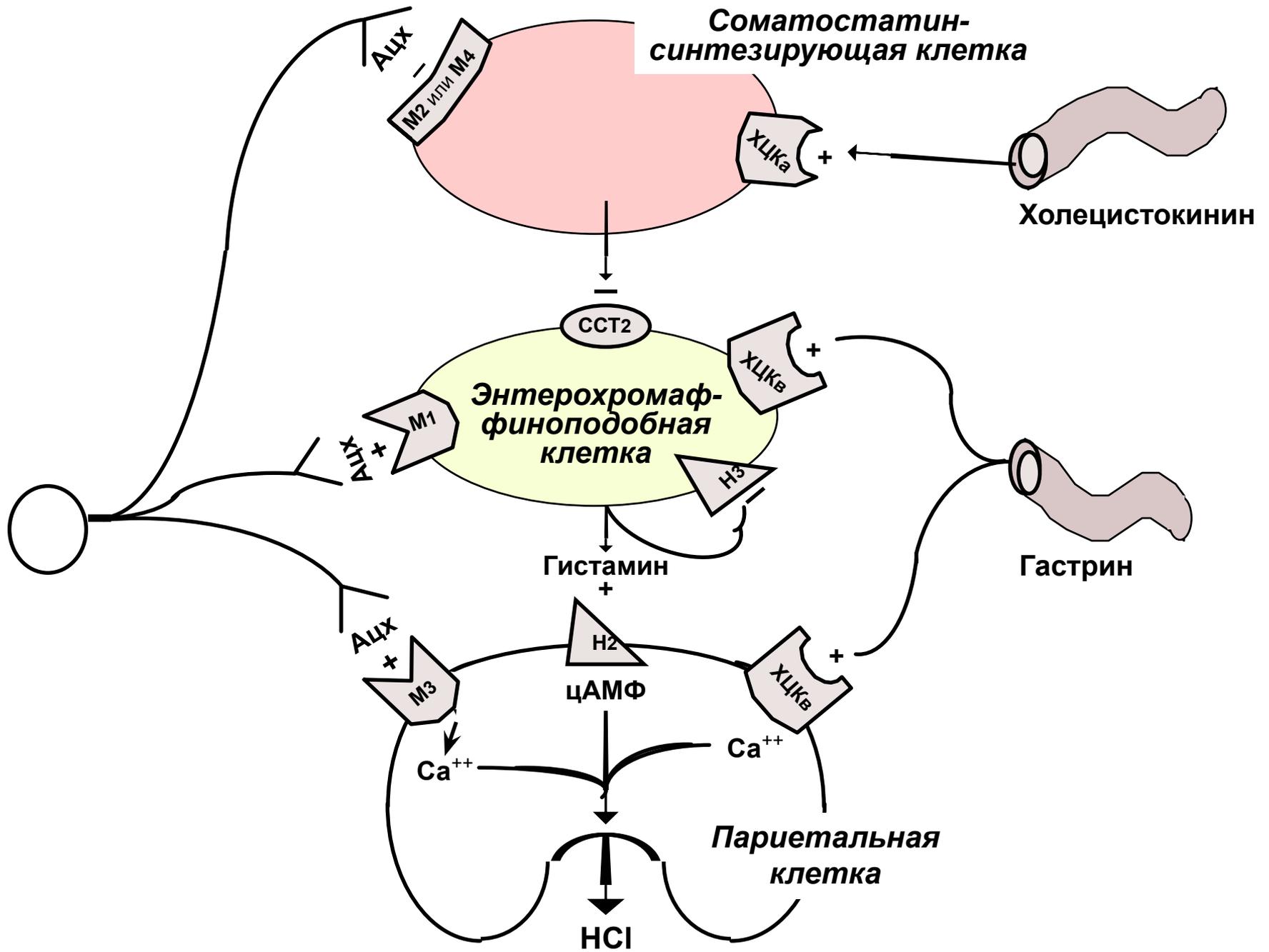


Циметидин

(тагамет)







Средства, применяемые при ожирении

1. Средства, снижающие потребление пищи
(анорексигенные средства)

а) Норадренергические средства б) Серотонинергические средства

Амфетамин (фенамин)

Фенфлурамин

Амфепранон (фепранон)

Дексфенфлурамин

Мазиндол (теронак)

Флуоксетин

Фенилпропаноламин

в) Средства, влияющие на обратный захват
норадреналина и серотонина

Сибутрамин

Средства, применяемые при ожирении

2. Средства, увеличивающие затраты энергии (термогенные вещества)

1) **Агонисты бета3-адренорецепторов**
(BRL 26830A)

2) **Эфедрин + Кофеин**

3. Средства, уменьшающие усвоение пищи

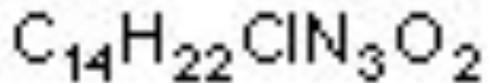
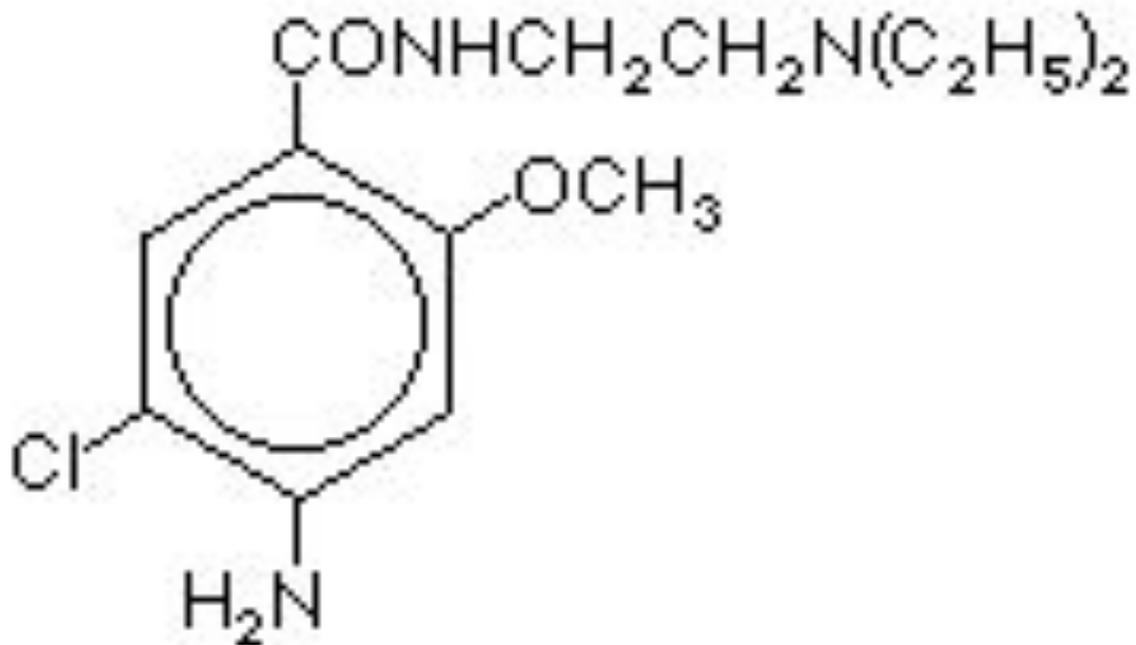
Орлистат **Акарбоза** **Метформин**

4. Заменители жира

Олестра

Метоклопрамид

(церукал, реглан)



Средства, применяемые при ожирении

1. Средства, снижающие потребление пищи (анорексигенные средства)

а) Норадренергические средства

Амфетамин (фенамин)

Хлорфентермин, Мазиндол

Фентермин
Фенилпропаноламин

б) Серотонинергические средства

Фенфлурамин Дексфенфлурамин

Флуоксетин

в) Средства, влияющие на обратный захват норадреналина и серотонина

Сибутрамин

2. Средства, увеличивающие затраты энергии (термогенные вещества)

1) Эфедрин + Кофеин

2) Агонисты бета3-адренорецепторов (BRL 26830A)

3. Средства, уменьшающие усвоение пищи

Орлистат Акарбоза Метформин

4. Заменители жира

Олестра

ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H_1 -рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D_2 -рецепторов

Тиэтилперазин (торекан)

Перфеназин (этаперазин)

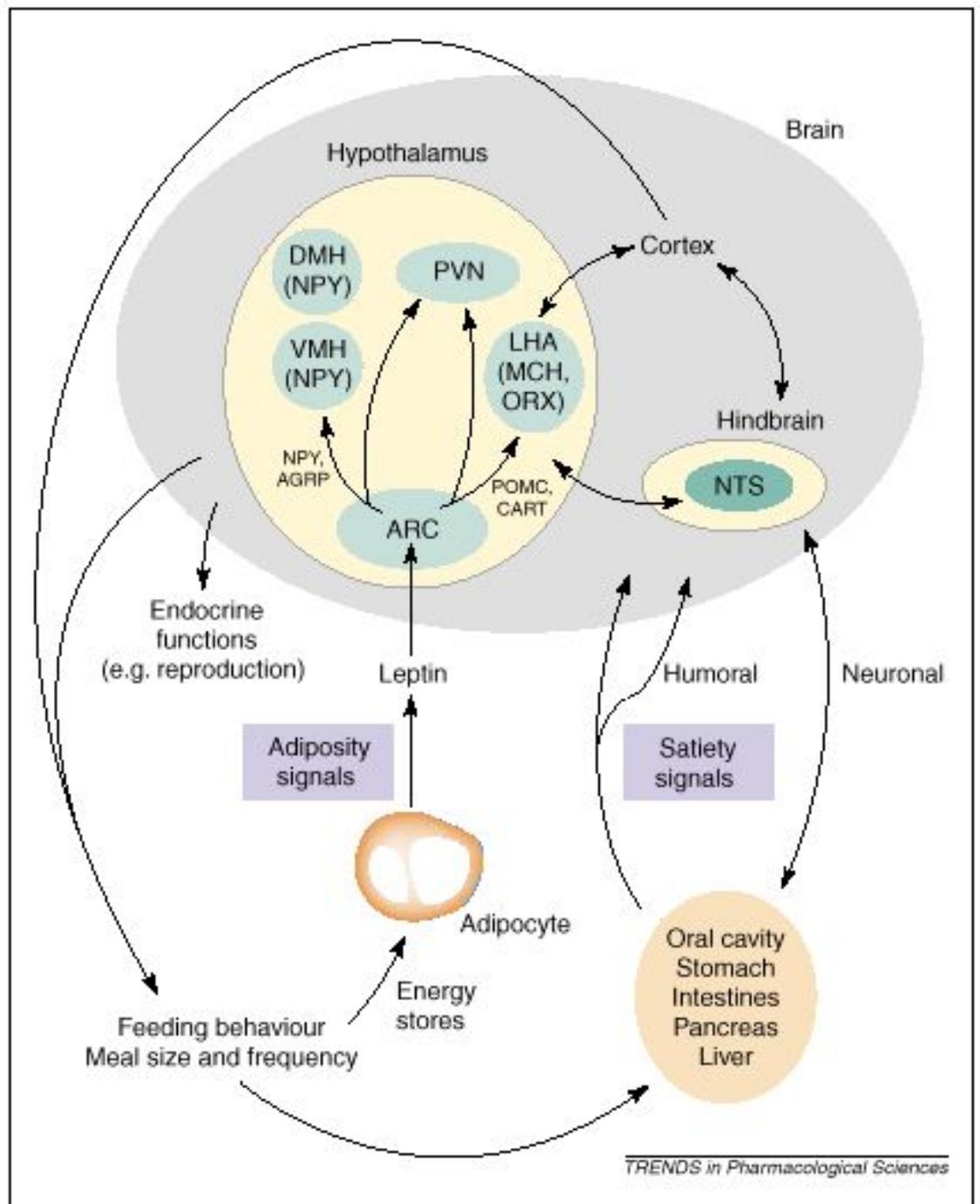
Галоперидол

Метоклопрамид (церукал)

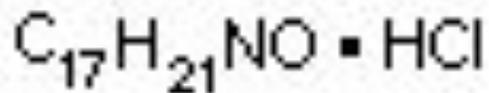
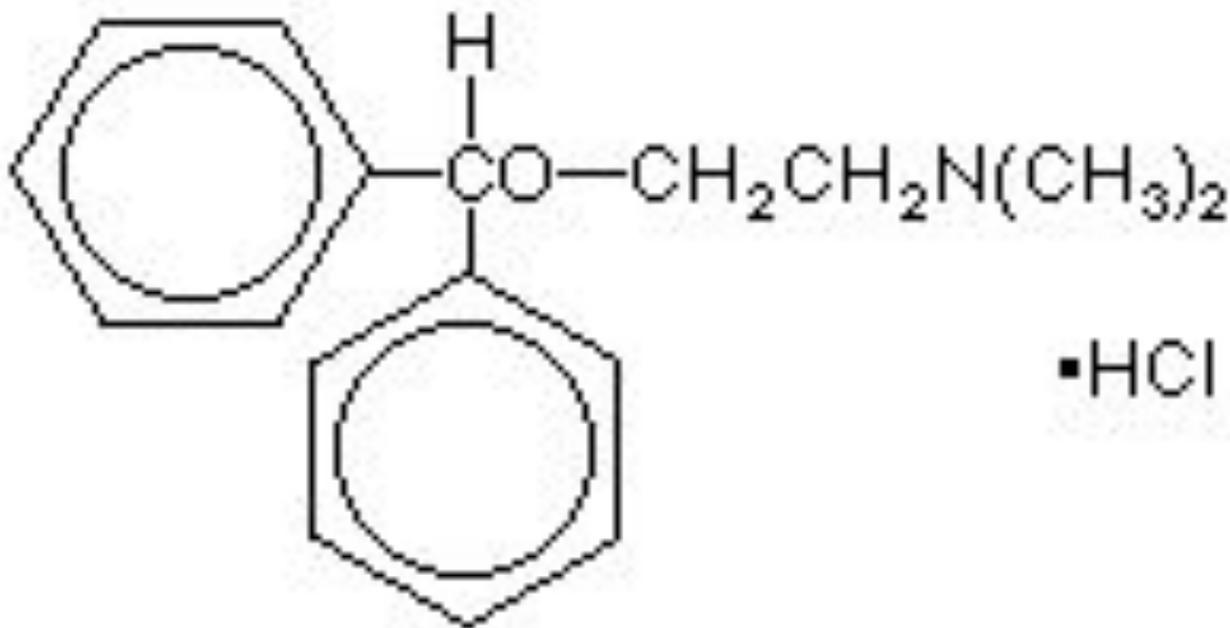
Домперидон (мотилиум)

} прокинетики

The regulation of food intake and energy stores



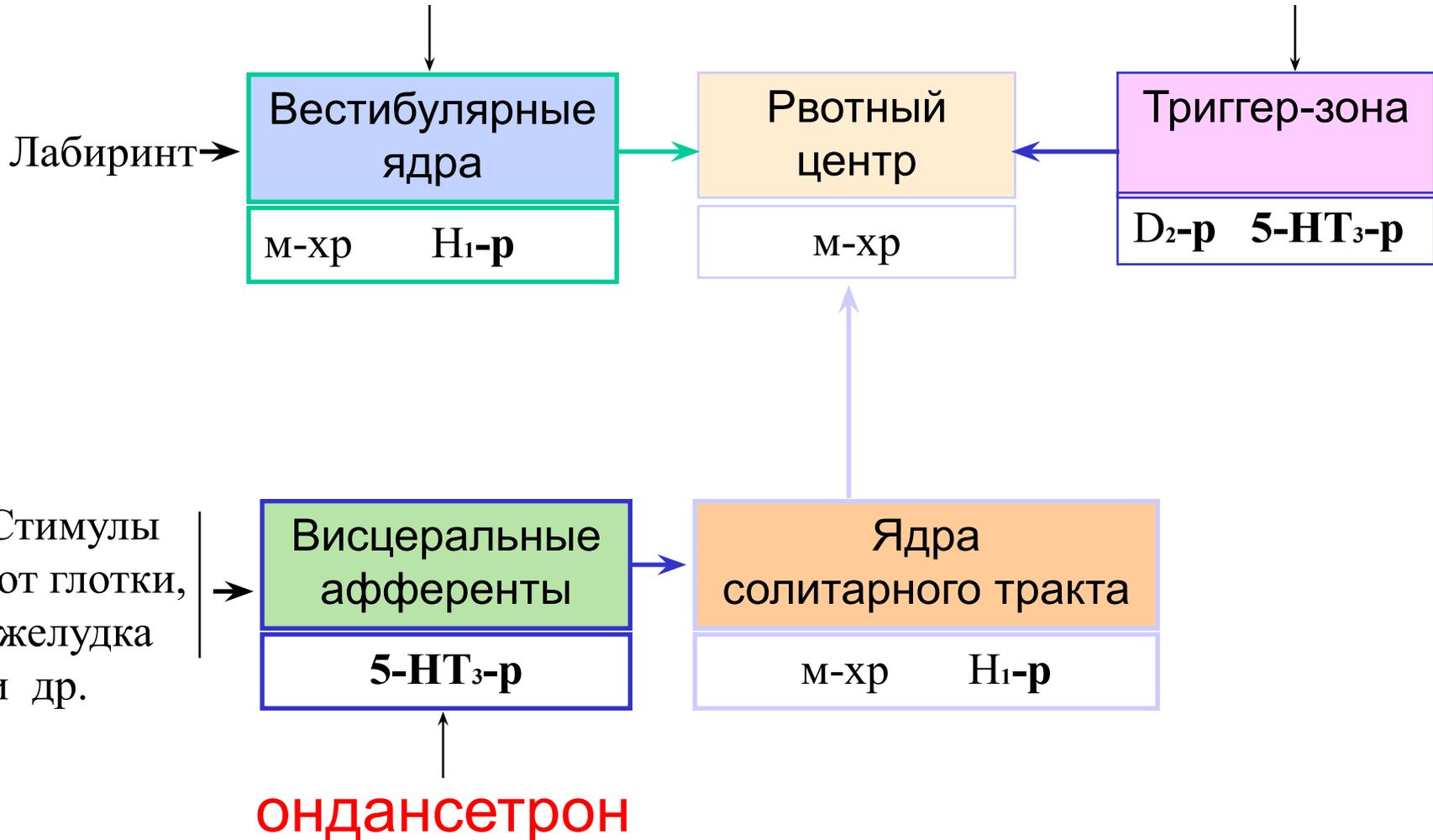
Дифенгидрамин (димедрол)



ЛОКАЛИЗАЦИЯ ДЕЙСТВИЯ ПРОТИВОРВОТНЫХ СРЕДСТВ

скополамин,
дифенгидрамин

тиэтилперазин
ондансетрон



СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСИ

1. M-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H₂-рецепторов

- I поколение - Циметидин (тагамет)
- II поколение - Ранитидин (зантак)
- III поколение - Фамотидин
Роксатидин

3. Аналоги простагландинов E

Мизопростол

4. Блокаторы H⁺K⁺АТФазы

Омепразол (омез)

Лансопразол

Пантопразол

ПРОТИВОРВОТНЫЕ СРЕДСТВА

1. М-холиноблокаторы

Скополамин

2. Блокаторы H₁-рецепторов

Дифенгидрамин (димедрол)

Прометазин (дипразин, пипольфен)

3. Блокаторы D₂-рецепторов

Тиэтилперазин Перфеназин (этаперазин) Галоперидол

Метоклопрамид (церукал)

Домперидон (мотилиум)

4. Блокаторы 5-HT₃-рецепторов

Ондансетрон (зофран)

Трописетрон Гранисетрон

5. Каннабиноиды

Дронабинол

Набилон

Средства, применяемые при ожирении

1. Средства, снижающие потребление пищи
(анорексигенные средства)

а) Норадренергические средства б) Серотонинергические средства

Амфепранон (фепранон)

Фенфлурамин

Хлорфентермин (дезопимон)

Дексфенфлурамин

Фентермин

Флуоксетин

Фенилпропаноламин

Мазиндол (теронак)

в) Средства, влияющие на обратный захват норадреналина
и серотонина

Сибутрамин

Средства, применяемые при ожирении

1. Средства, снижающие потребление пищи
(анорексигенные средства)

а) Норадренергические средства б) Серотонинергические средства

Амфепранон (фепранон)

Фенфлурамин

Хлорфентермин (дезопимон)

Дексфенфлурамин

Фентермин

Флуоксетин

Фенилпропаноламин

Мазиндол (теронак)

в) Средства, влияющие на обратный захват норадреналина
и серотонина

Сибутрамин

СРЕДСТВА, УМЕНЬШАЮЩИЕ СЕКРЕЦИЮ НСІ

1. M-холиноблокаторы

Атропин

Пирензепин (гастроцепин)

2. Блокаторы H₂-рецепторов

- I поколение - Циметидин (тагамет)
- II поколение - Ранитидин (зантак)
- III поколение - Фамотидин
Роксатидин

3. Блокаторы H⁺K⁺АТФазы

Омепразол (омез)

Лансопразол

Пантопразол