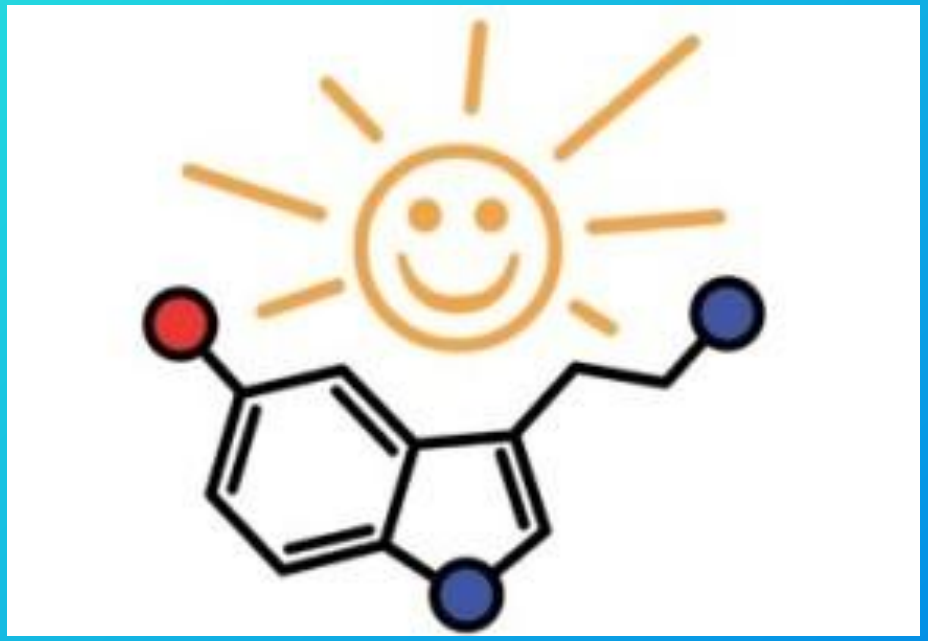
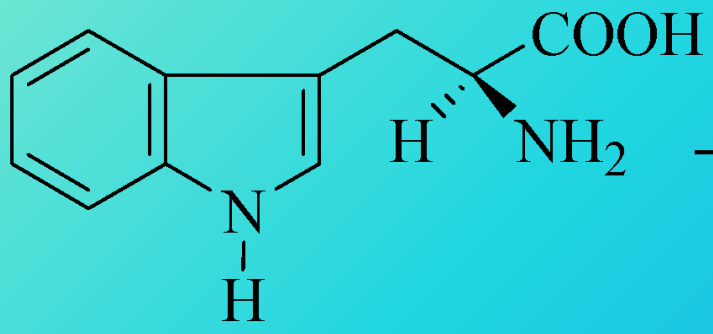
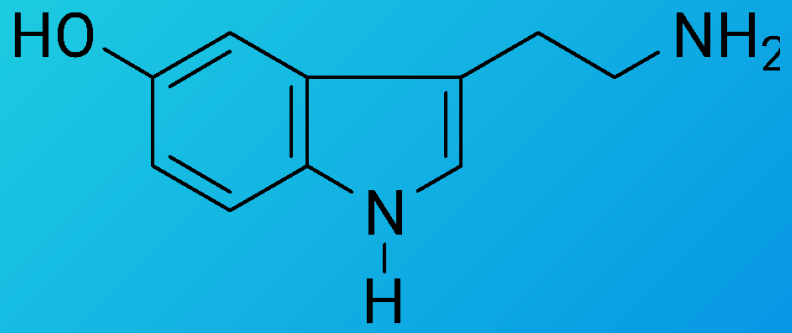
Фармацевтическая химия лекарственных средств, влияющих на серотониновые рецепторы

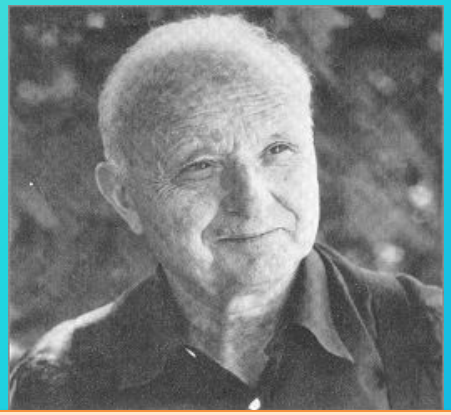




триптофан



серотонин

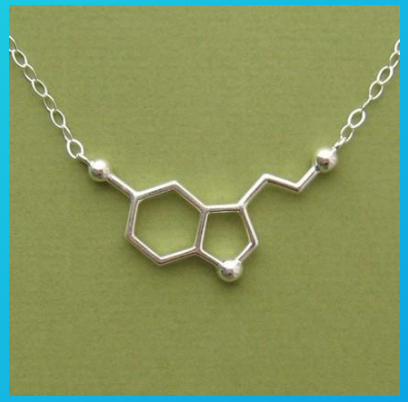


Vittorio Erspamer

В 1930

80% - энтерохромафинные клетки кишечника

20% - серотонинергические нейроны ЦНС



Классификация 5HT рецепторов

- **5HT**
- 5HT7
- **5HT1**
- **5HT2**
- **5HT3**
- **5HT4**
- 5ht5
- 5ht6

5-ht$_{5A}$
5-ht$_{5B}$

5-HT$_{1A}$, 5-HT$_{1B}$, 5-HT$_{1D}$,
5-ht$_{1E}$, 5-ht$_{1F}$

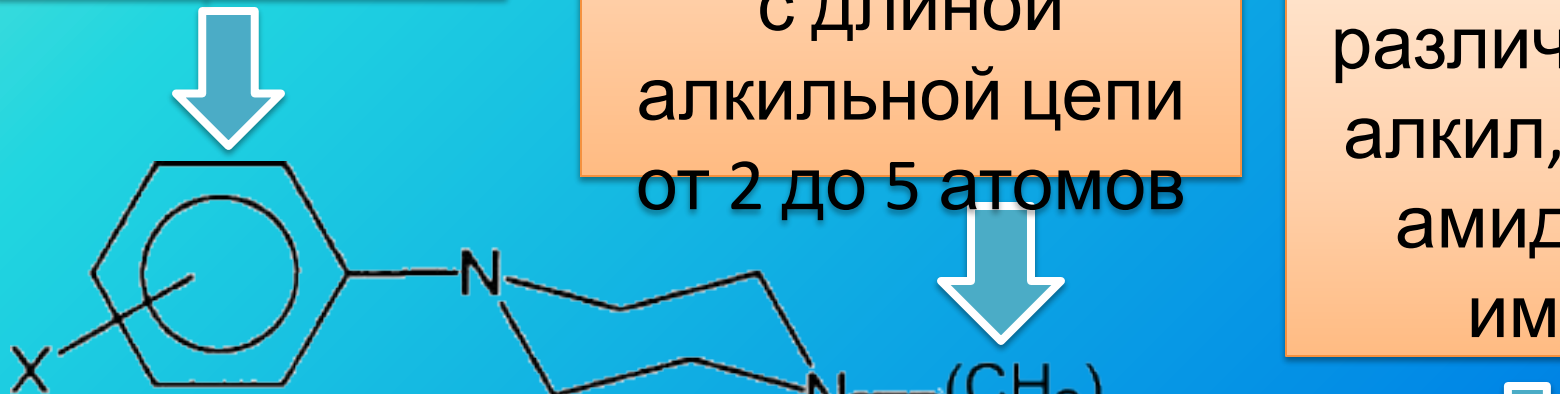
5-HT$_{2A}$, 5-HT$_{2B}$, **5-HT$_{2C}$**

Частичные агонисты $5HT_{1A}$

Фенил, замещенный фенил или гетероцикл

Может быть разветвленной или неразветвленной, с длиной алкильной цепи от 2 до 5 атомов

Может сильно различаться: алкил, арил, амид или имид



Buspirone Hydrochloride

Bristol-Myers Squibb

FDA 1986 г.

Частичный агонист $5HT_{1A}$

ГТ

Buspar,
Буспирон
Гексал,
Буспирон
Сандоз,
Спитомин,
Anxut,
Busp.

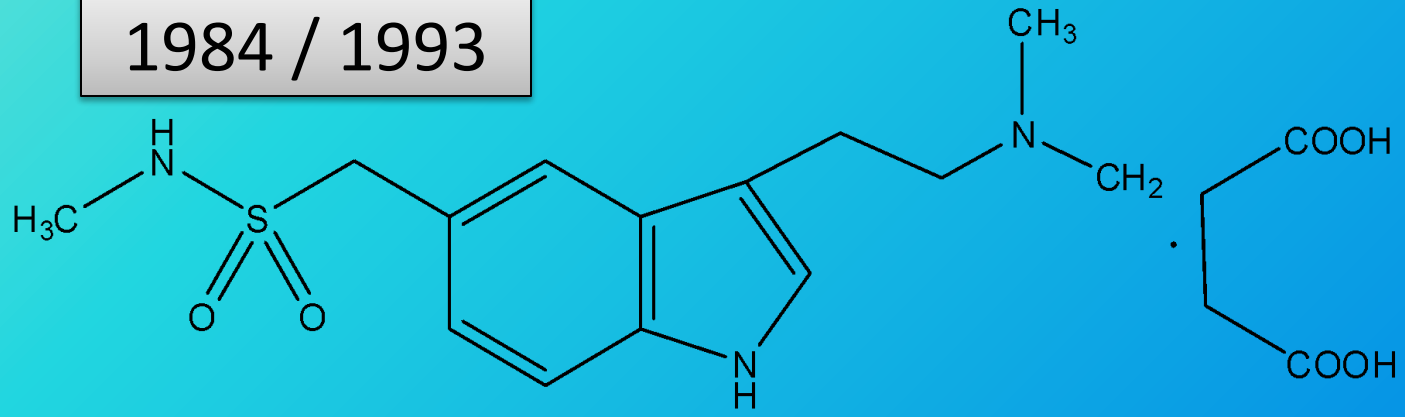
Таблетки по 5, 10, 15, 20 и 30 мг

Агонисты 5HT$_{1B/1D}$ рецепторов

GlaxoSmithKline

1984 / 1993

Sumatriptan Succinate



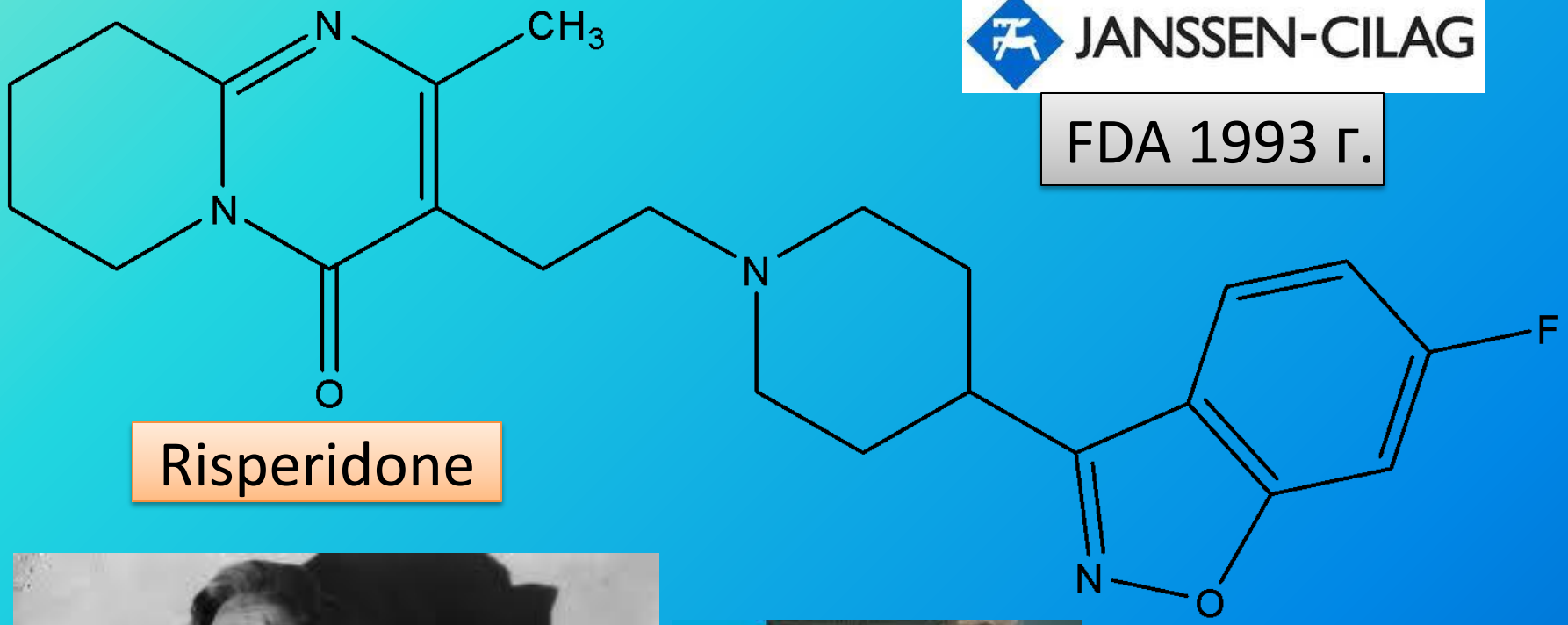
Imitrex, Imigran, Сумамигрен, Амигренин, Мигрепам, Сумитран, Тримигрен.

Таблетки по 25, 50 и 100 мг; **шприцы**, содержащие 6 мг суматриптана в 0,5 мл изотонического раствора; **назальный спрей**. Есть комбинированный препарат Treximet, содержащий суматриптан и напроксен.

Антагонисты $5HT_{2A}$ рецептора

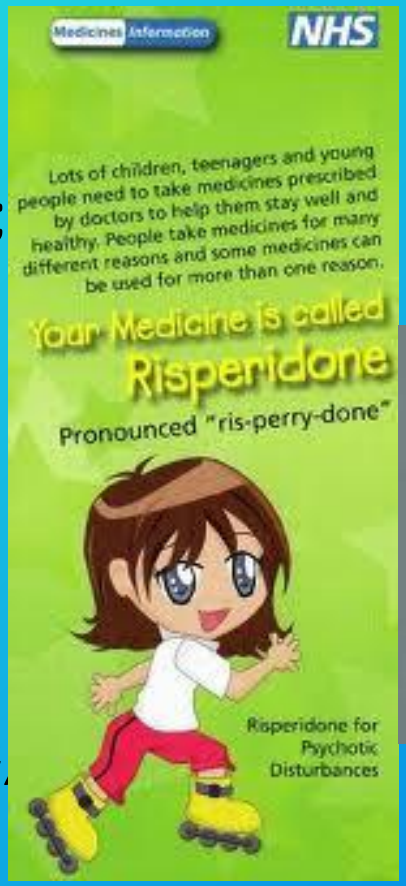
JANSSEN-CILAG

FDA 1993 г.



Risperidone

Risperdal;
Рисполепт;
Лептинорм;
Нейпилепт;
Ридонекс;
Рилептид;
Рисдонал;
Риспаксол;
Риспен;
Рисполепт
Конста;
Рисполепт
Квиклет;
Рисполюкс,
Торендо



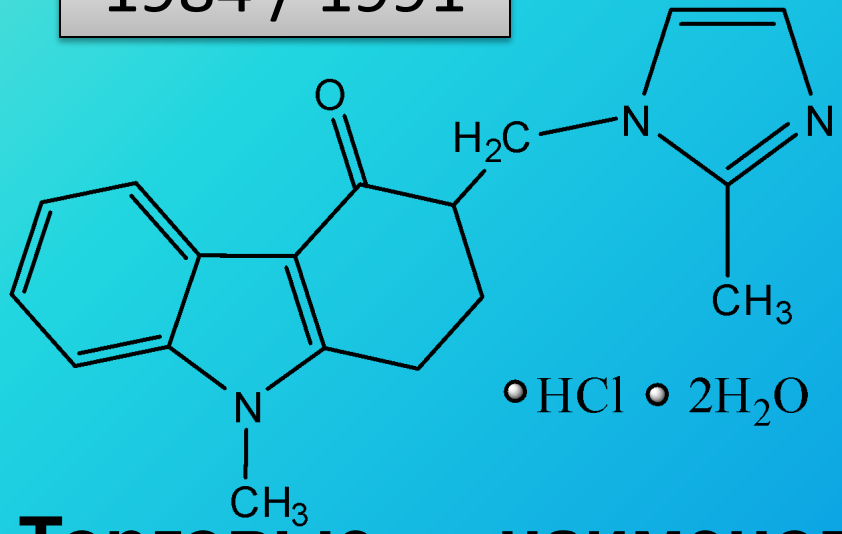
Таблетки по 0,25, 0,5, 1, 2, 3 и 4 мг; **раствор для перорального применения**

Антагонисты $5HT_3$ рецептора

GlaxoSmithKline

1984 / 1991

Ondansetron Hydrochloride



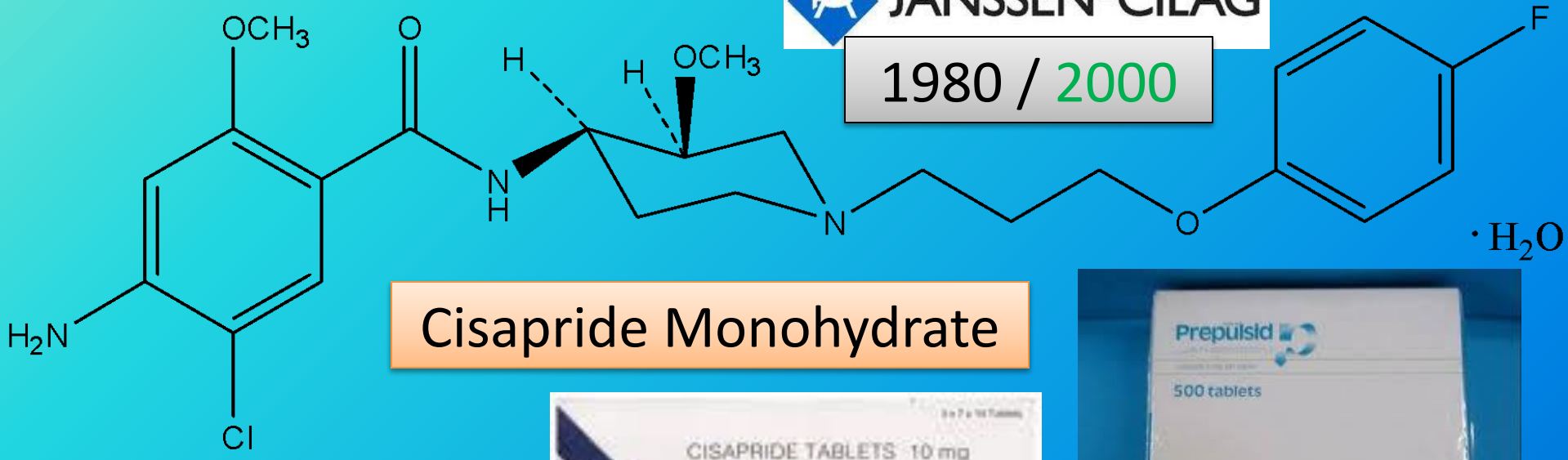
Торговые наименования: **Зофран**, Веро-Ондансетрон, Домеган, Латран, Лазаран ВМ, Ондансетрон-Ферейн, Ондасол, Осетрон, Сетронон, Эмесет, Эметрон.

Таблетки по 4 и 8 мг, **раствор для инъекций** 2 мг/мл

Агонисты $5HT_4$ рецептора

JANSSEN-CILAG

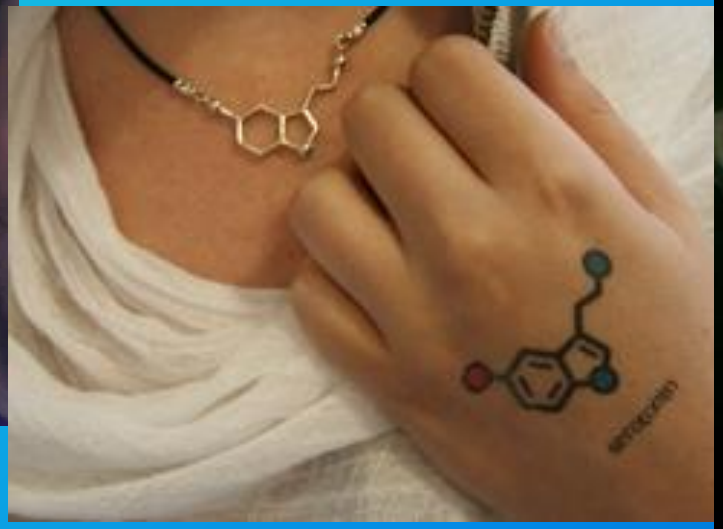
1980 / 2000



Cisapride Monohydrate

Торговые наименования: **Prepulsid**, Координакс, Перистил, Сизапро, Цисап, Цисапид.

Таблетки по 0,005 и 0,01 г.;

Суспензия для приема внутрь (в 1 мл - 1 мг) - 60 мл во флаконе в комплекте с мерным колпачком.

Спасибо за внимание!