

# **Синтетические производные пипиразина**



- ▣ Производные пиперазина — класс дизайнерских наркотиков, проявляющих психоактивные свойства, которые влияют на функции центральной нервной системы.
- ▣ Соединения этого ряда стимулируют высвобождение и подавляют обратный захват дофамина, серотонина и норадреналина.

- Впервые злоупотребление производными пиперазина отмечено в США в 1996 г. В начале XXI века пиперазины были широко распространены в Европе в качестве заменителя MDMA. (метилендиоксиметамфетамина)
- В Западной Европе и США меры контроля за психоактивными производными пиперазина установлены в 2008 г.
- Производные пиперазина в РФ были популярными и легальными (до июля 2006 г.) заменителями MDMA. Отдельные пиперазины были включены в списки наркотических веществ в 2006 г., а в 2011 г., когда ввели понятие «производные», под контроль попали и другие соединения этой группы.

# Пиперазины

- ВЗР, 1-бензилпиперазин;
- тСРР, 1-(3-хлорфенил)пиперазин;
- МеОРР, 1-(4-метоксифенил)пиперазин;
- рФРР, 1-(4-фторфенил)пиперазин;
- ТФМРР, 3-трифторометилфенилпиперазин, единственный препарат, внесённый в США в Список наркотиков I, а затем получивший легальный статус, из-за того, что ДЕА не смог доказать необходимость постоянного нахождения препарата в списке.

# ДИЭТИЛКАРБАМАЗЕПИНА ЦИТРАТ – синтетическое производное пиперазина

- Механизм действия:
- 1. Обездвиживает микрофиллярии Р что приводит к их выведению из организма.
- 2. Изменяет поверхностную структуру молодых форм паразита Р они становятся чувствительными к протеолитическим механизмам организма хозяина.
- 3. На взрослых гельминтов не действует.
- Показания: филляриатоз, лоалоз, тропическая эозинофилия, онхоцеркоз.
- Побоч.эф.: диспепсия, гол.боль, сонливость – от препарата; эозинофилия, лейкоцитоз, лимфангит, волдыри, мышечная и суставная боль – от разложения погибшего паразита.
- Противопоказания: гипертензия, заболевания почек.

# ЭМЕТИНА ГИДРОХЛОРИД – производное из субстрата ипекакуаны.

- Механизм действия:
- 1. блокада адрено- и холинорецепторов паразита
- 2. блокада синтеза белков Р ингибируется движение рибосом вдоль и-РНК Р прекращается синтез ДНК у паразита.
- Показания: фасциолез (печеночная форма), парагонимоз.
- Поб.эф.: тахиаритмии, одышка, гипотензия, миастения, парезы, диарея.
- Противопоказания: заболевания почек и миокарда, полиневрит, детский возраст, беременность.

# АВЕРМЕКТИН –

- Механизм действия: усиливает ГАМК-ергическую передачу сигнала в периферических нервах у паразита  $\text{P}$  обездвживание паразита.
- Показания: онхоцеркоз, филляриатоз, стронгилоидоз.
- Поб.эф.: реакция Мазотти (лих-ка, гол.боль, сонливость, сыпь, зуд, диарея, артромиалгия, гипотензия, тахикардия, лимфаденит, отек); помутнение роговицы.
- Противопоказания: менингит, беременность, африканская сонная болезнь (трипаносомоз), с барбитуратами, бензодиазепинами, группой вальпроевой кислоты.

# АЛБЕНДАЗОЛ - энтеральный антигельминт.пр-т. производное бензимидазола карбамата.

- Показания: аскаридоз, трихоцефалез, стронголоидоз, анкилостомоз.
- Механизм: блокирует захват глюкозы восприимчивыми паразитами на личиночной и взрослой стадиях развития, истощая запасы гликогена и ограничивая образование АТФ. В результате - иммобилизация и гибель гельминтов. Личинкоцидный эффект препарат дает также при некаторозе.
- препарат дает также при некаторозе.
- Применение: от кишечных паразитов - прием на пустой желудок, от тканевых паразитов - с жирной пищей.
- Аскаридоз, трихоцефалез, инвазии анкилостомами и острицами: Доза - 200мг однократно, при заражении острицами - прием повторить через 2 недели. При тканевой инвазии - 400мг/сут. в течение 2-3 дней.
- Стронгилоидоз: 400мг по 2 раза в сутки в течении 7-14 дней во время еды.
- Эхинококкоз: 800мг/сут во время еды в течении 28 дней. Курс повторяют 3 раза с интервалом в 2 недели.
- Нейроцистицеркозы: вместе с ГКС. 15мг/кг/сутки в течении 30 дней.
- Побочные реакции: головная боль, рвота, гиперемия, изменение психики, конвульсии, утомляемость, бессоница, транзиторное повышение активности трансаминаз, лейкопения, эозинофилия.
- Противопоказания: детям до 2-х лет, беременность, цирроз печени.

## **БИТИОНОЛ - препарат выбора при лечении фасциолёза (овечья двуустка), альтернативный препарат при лечении парагонимоза.**

- Фармакокинетика: макс.конц-ция - через 4-8часов. При приеме в дозе 50мг/кг, тремя дробными дозами в течении 5 дней концентрация в сыворотке держится на уровне 50-200мкг/мл. выводится почками.
- Применение парагонимоз, фасциолез - 30-50мг/кг/сут до получений 10-15 доз.
- Побоч.эф-ты: диарея, абдоминальные спазмы, анорексия, гол.боль, зудящие уртикарные и папулезные высыпания, лейкопения, протеинурия, бессоница.
- Противопоказания: детям до 8 лет, заб.печени и кроветворной системы (лейкоз).
- Противопоказания: 1 триместр беременности, детям до 1 года, заб-я печени.

# НИКЛОСАМИД – препарат выбора при инвазии ленточными

## червями.

- ▣ Механизм действия: снижает окислительное фосфорилирование Р стимулируется активность АТФазы Р уничтожаются сколексы и сегменты цестод Р в ЖКТ хозяина перевариваются отцепившиеся сегменты паразита.
- ▣ Показания: тениоз (бычий, свиной цепень), дифилоботриоз (широкий лентец), гименолепидоз (карликовый цепень), трематодоз.
- ▣ Поб.эф.: диспепсия, аллергия, невролог.симп-ка.
- ▣ Противопоказания: алкоголь, детям до 2-х лет, беременность.

- Клиническая картина отравления похожа на отравление амфетаминами, возможен судорожный синдром. При интоксикации пиперазином ведущими являются изменения функций различных отделов ЦНС и желудочно-кишечного тракта.
- У больного возникают тошнота, рвота, понос, головокружение, головная боль, беспокойство.

- При более выраженном отравлении характерно угнетение ЦНС, мышечная гипотония, атаксия, тремор, нарушение координации движений, равновесия, зрения, потеря сознания (Wechselberg, 1956).
  - В ряде случаев отмечают психическое возбуждение, галлюцинации, клонические судороги, уртикарную сыпь (О. И. Келлина, 1958, и др.). Исход отравления при своевременном лечении благоприятен.
- 