

Транквилизаторы

Транквилизаторы (анксиолитики)

- * - успокаивающие средства, способные устранять страх, тревогу, эмоциональное напряжение.
- * - большинство анксиолитиков оказывает седативное действие
- * - применяются, главным образом, при невротических и неврозоподобных состояниях

Классификация

- * **Агонисты бензодиазепиновых рецепторов** (диазепам, феназепам и др.)
- * **Агонисты серотониновых рецепторов** (буспирон)
- * **Вещества разного типа действия** (амизил и др.)

Классификация бензодиазепиновых анксиолитиков

- * 1. Длительного действия ($T_{1/2}=24-48\text{ч}$)
 - * - феназепам
 - * - диазепам
 - * - хлордиазепоксид
- * 2. Средней продолжительности действия ($T_{1/2}=6-24\text{ч}$)
 - * - оксазепам
 - * - лоразепам
 - * - алпразолам
- * 3. Короткого действия ($T_{1/2}<6\text{ч}$)
 - * - мидазолам

Классификация бензодиазепиновых анксиолитиков

- * **«Дневные анксиолитики»** – бензодиазепины с выраженным анксиолитическим действием и отсутствием или минимальным седативно-гипнотическим эффектом.
- * К ним относятся: медазепам, тофизопам.

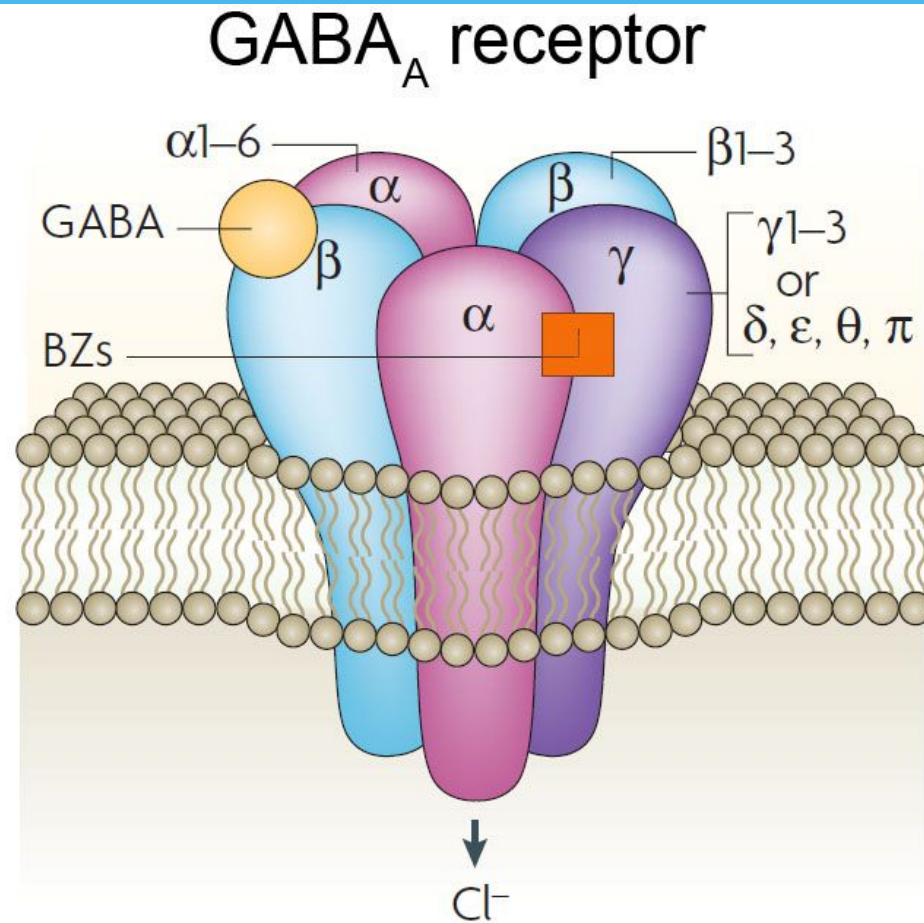
Характерные эффекты бензодиазепиновых препаратов

- * Анксиолитический
- * Седативный
- * Снотворный
- * Мышечно-расслабляющий
- * Противосудорожный
- * Амнестический

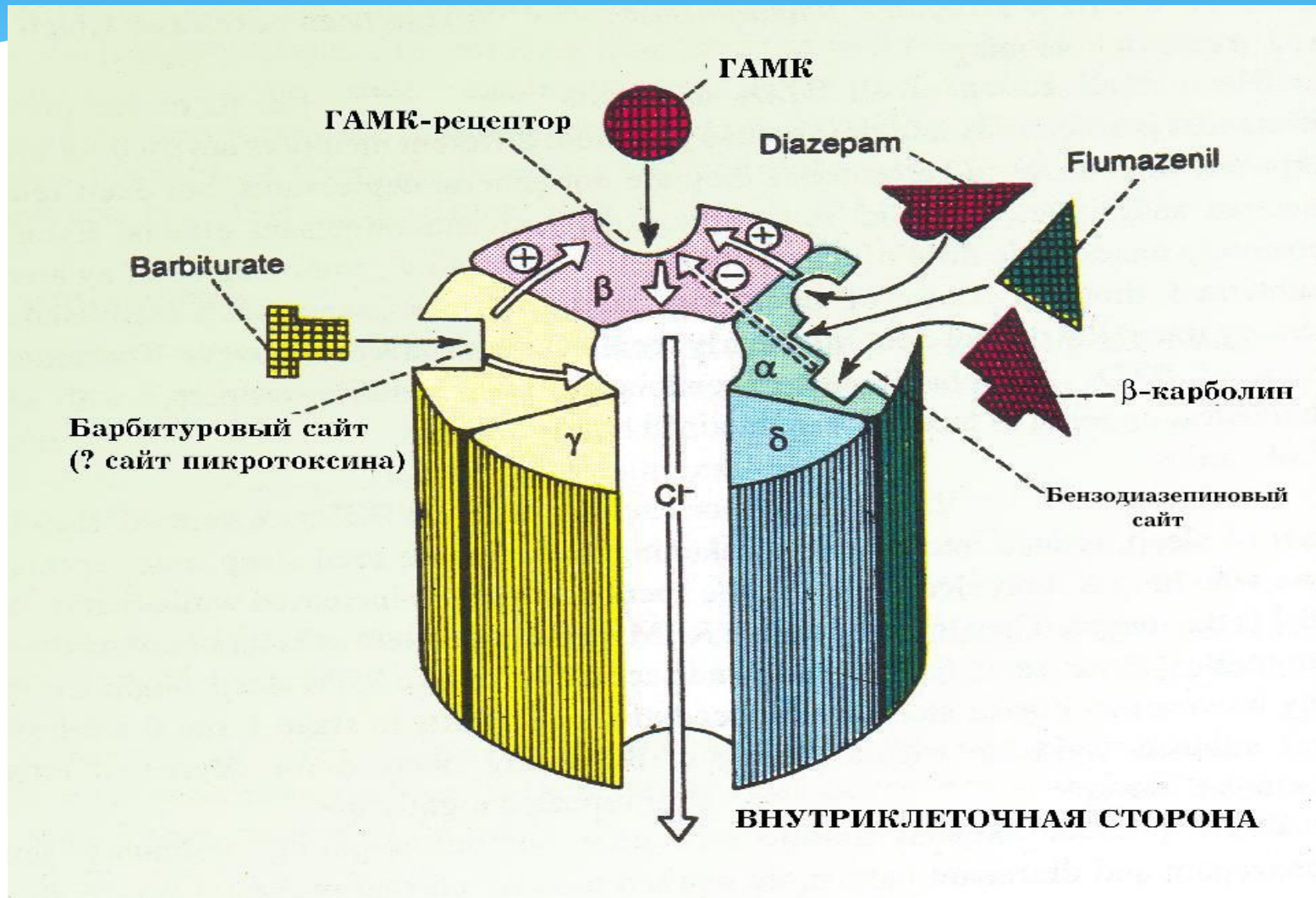
Механизм действия

- * Психотропное действие связано с влиянием на лимбическую систему (снижают спонтанную активность нейронов гиппокампа, гипоталамуса, ретикулярной формации ствола ГМ).

ГАМК_A-рецепторный комплекс



ГАМК_A-рецепторный комплекс



Фармакокинетика некоторых бензодиазепиновых анксиолитиков

Препарат	F,%	Tmax, ч	Связывание с белками плазмы, %	Некоторые активные метаболиты, T _{1/2} , ч	Общая продолжительность действия, ч
Диазепам	90-100	1-1,5	97-99	Дезметил-Диазепам (40-120)	24-48
Флуразепам	-	0,5-1	~97	Дезалкил-флуразепам	24-48
Альпразолам	75-100	0,5-3	~70	-	~24
Клоназепам	70-100	1,5-3	~86	-	~24
Лоразепам	90-100	1,2-2,6	~90	-	12-18
Нитразепам	54-98	2-3	~87	-	18-24
Оксазепам	≤100	1-4	~97	-	12-18
Темазепам	≤100	1-2	~96	-	12-18

Специфический антагонист бензодиазепинов

* ФЛУМАЗЕНИЛ

- * - устраняет полностью или уменьшает выраженность большинства центральных эффектов бензодиазепинов
- * - используют для устранения остаточных эффектов бензодиазепинов (Нр, в хирургии)
- * - используют при передозировке или остром отравлении бензодиазепинами
- * - вводят обычно в/в, действует кратковременно (30-60 мин)

Агонисты (частичные) серотониновых рецепторов

- * **БУСПИРОН**
- * Высокий аффинитет к серотониновым рецепторам ГМ подтипа 5-HT_{1A} (ауторецепторы)
- * Аутоингибирующее действие, что приводит к снижению активности нейронов ядра шва, уменьшению синтеза и высвобождения серотонина.
- * Буспирон связывается с дофаминовыми рецепторами
- * Эффект развивается медленно (в течение 1-2 недель)
- * У препарата отсутствует седативное, снотворное, противосудорожное и мышечно-расслабляющее действие
- * Мало выражена способность вызывать привыкание и лекарственную зависимость

Анксиолитики разного типа действия

- * **АМИЗИЛ**
- * - центральный холиноблокатор
- * - угнетает М-холинорецепторы ретикулярной формации ГМ
- * - обладает противосудорожной активностью
- * - подавляет кашлевой рефлекс
- * - характерно периферическое М-холиноблокирующее действие
- * Имеет анестезирующее и антигистаминное свойство

Показания

- * Неврозы и неврозоподобные состояния
- * С целью премедикации перед хирургическим вмешательством
- * Лечение бессоницы
- * Лечение эпилепсии
- * Неврологические нарушения, сопровождающиеся гипертонусом скелетных мышц