

ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ



МОСКВА **2015**

ИСТОРИЧЕСКАЯ СВОДКА

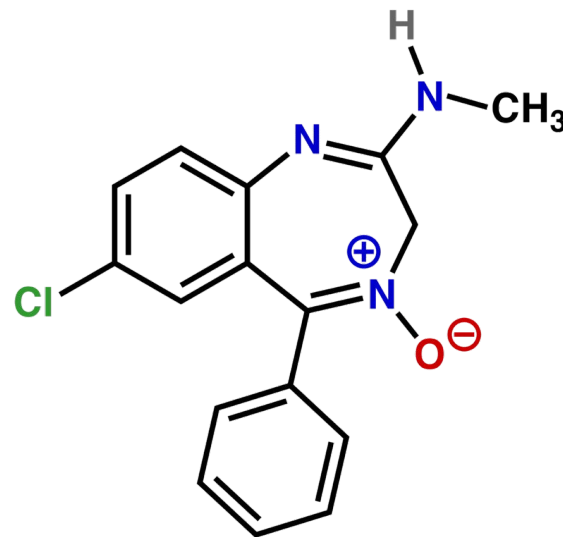
1951 – первый транквилизатор;

1952 – выходец из центральных миорелаксантов;

1955 – испытан в клинической практике;

1957 – «транквилизатор» - термин медицинской литературы;

1959 и 1963 – бензодиазепины



ОПРЕДЕЛЕНИЕ

психотропные средства, уменьшающие выраженность или подавляющие тревогу, страх, беспокойство, эмоциональное напряжение.



ДЕЙСТВИЕ

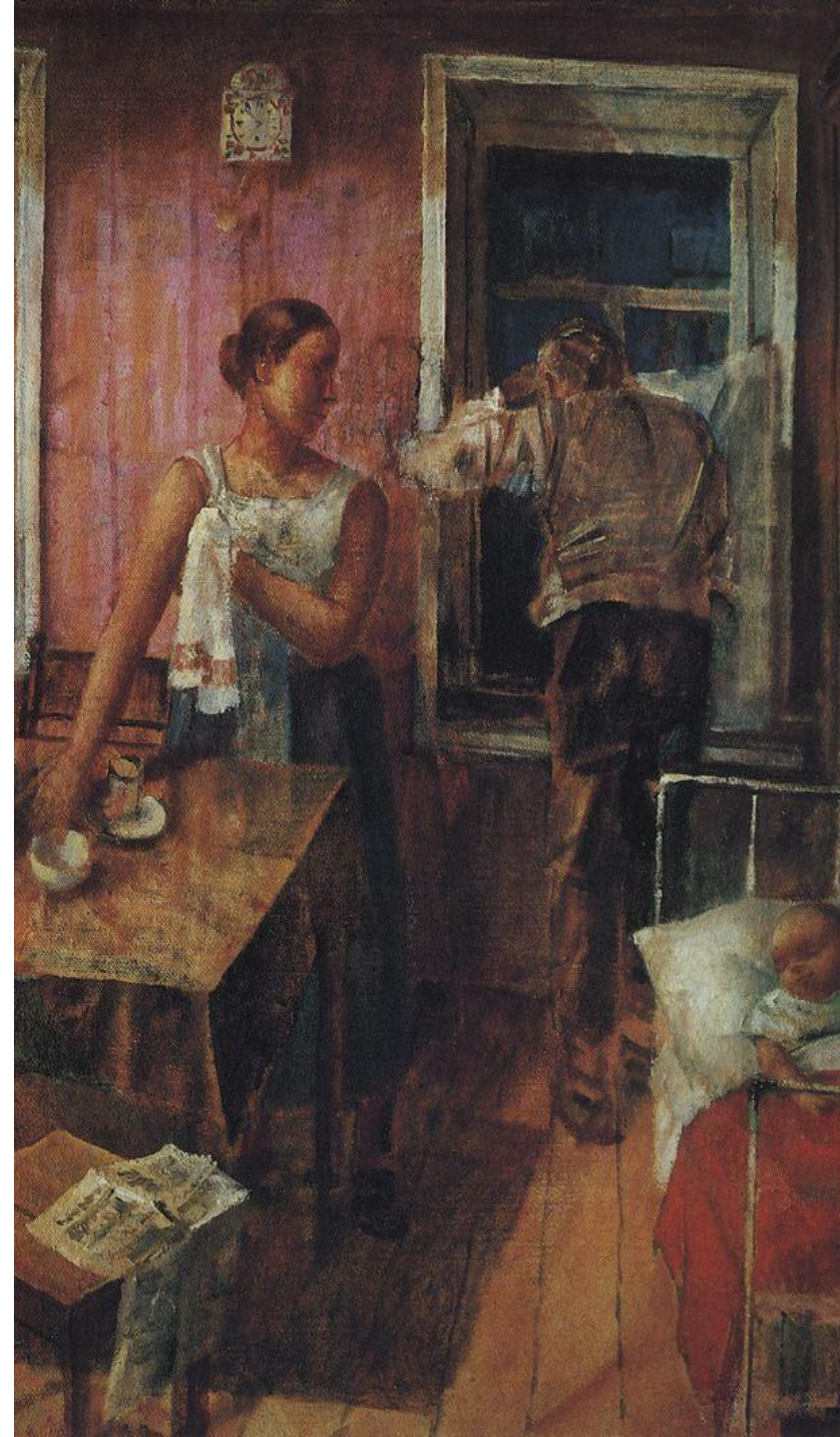
**Анксиолитическое
(хлордиазепоксид, диазепам,
оксазепам, лоразепам)**

Седативное

**Снотворное (нитрозепама,
флунитрозепама)**

**Миорелаксирующая
активность (тетразепам)**

**Противосудорожное
(клоназепам)**



КЛАССИФИКАЦИЯ М.Д. МАШКОВСКОГО

**производные бензодиазепина
(бензодиазепины);**

**карбаминовые эфиры
замещенного пропандиола
(мепробамат);**

**производные дифенилметана
(бенактизин, гидроксизин);**

**транквилизаторы разных
химических групп
(бензоклидин, буспирон,
мебикар и др.).**

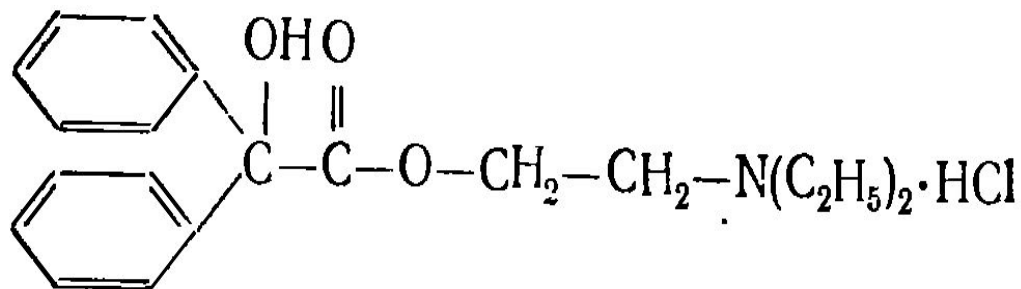


КЛАССИФИКАЦИЯ Д.А. ХАРКЕВИЧА

агонисты бензодиазепиновых рецепторов
(диазепам, феназепам и др.);

агонисты серотониновых рецепторов (буспирон);

вещества разностороннего типа действия
(бенактизин и др.).



Бенактизин

КЛАССИФИКАЦИЯ ВОРОНИНОЙ Т.А.

Прямые агонисты ГАМКА-РК и БЗ-РК

**Препараты разного механизма действия
(мепробамат)**

Частичные агонисты БР-РК

Эндогенные регуляторы ГАМКА-БД-РК

Агонисты ГАМКА-РК

Мембранные модуляторы ГАМКА-БД-РК

Глутаматергические

Серотонинергические



ПОКОЛЕНИЯ

- I. мепробамат, гидроксизин, бенактизин и др.;
- II. препараты бензодиазепинового ряда;
- III. буспирон и др.;



NDC 51672-4148-1

100 Tablets

**Meprobamate
Tablets USP,**
400 mg 

Rx only

Each tablet contains: Meprobamate USP, 400 mg

Usual Dosage: See package insert for dosage and full prescribing information.

Dispense in a well-closed container with child-resistant closure.

Store at 20° - 25°C (68° - 77°F) [see USP Controlled Room Temperature].

Mfd. by: Taro Pharmaceutical Industries Ltd.
Haifa Bay, Israel 26110
Dist. by: **Taro Pharmaceuticals U.S.A., Inc.**
Hawthorne, NY 10532
TARO is a registered trademark of Taro Pharmaceuticals U.S.A., Inc.

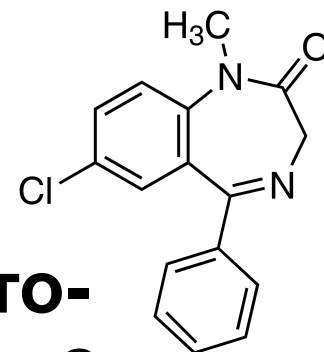
70810-0611-0

БЕНЗОДИАЗЕПИНЫ

2-кето-бензодиазепины содержат кето-группу при атоме углерода в позиции 2 (дiazepam, дикалия хлоразепат и др.);

3-гидрокси-бензодиазепины содержат гидроксигруппу при атоме углерода в позиции 3 (lorazepam);

триазолобензодиазепины содержат триазоловое кольцо, соединенное с диазепиновым кольцом через атом азота в положении 1 и атом углерода в положении 2 (alprazolam).

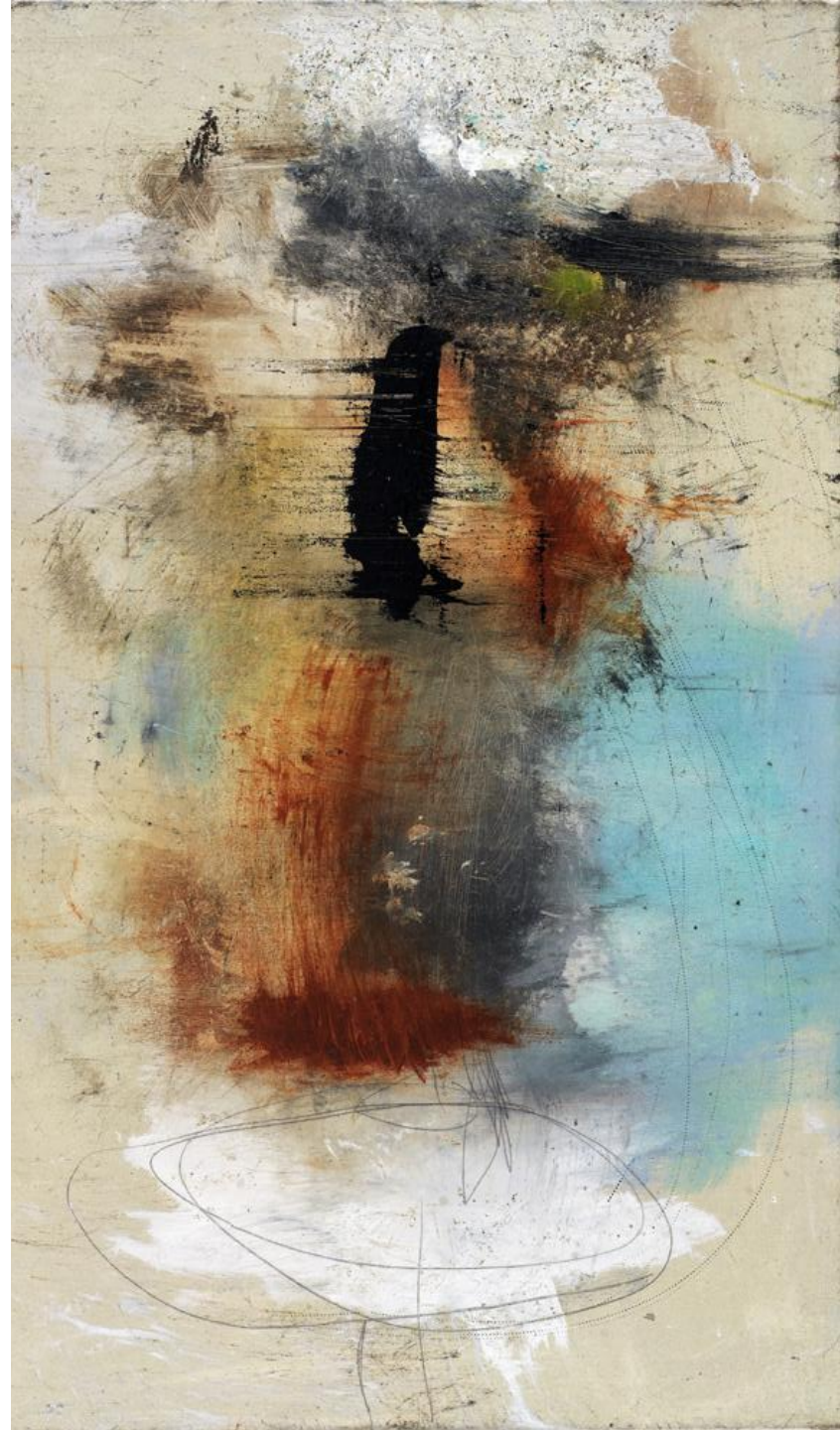


МЕХАНИЗМ

**БД – 1
(анксиолитический,
противосудорожный,
седативный)**

**БД – 2 (миорелаксанция,
депрессия, седация)**

**БД – 3 (защита нейронов
от окислительного
повреждения)**



ДЕЙСТВИЕ

**неселективные
полные агонисты (I
поколение)**

**селективные
агонисты (золпидем)**

**обратные агонисты
(флумазенил)**

FRANCIS BACON



ЛИПОФИЛЬНОСТЬ

хорошо всасываются из ЖКТ, преимущественно из двенадцатиперстной кишки (быстрее всех диазепам, медленнее – оксазепам, лоразепам)

Антациды могут понижать скорость всасывания

Внутримышечное введение – медленнее (исключение - лоразепам).

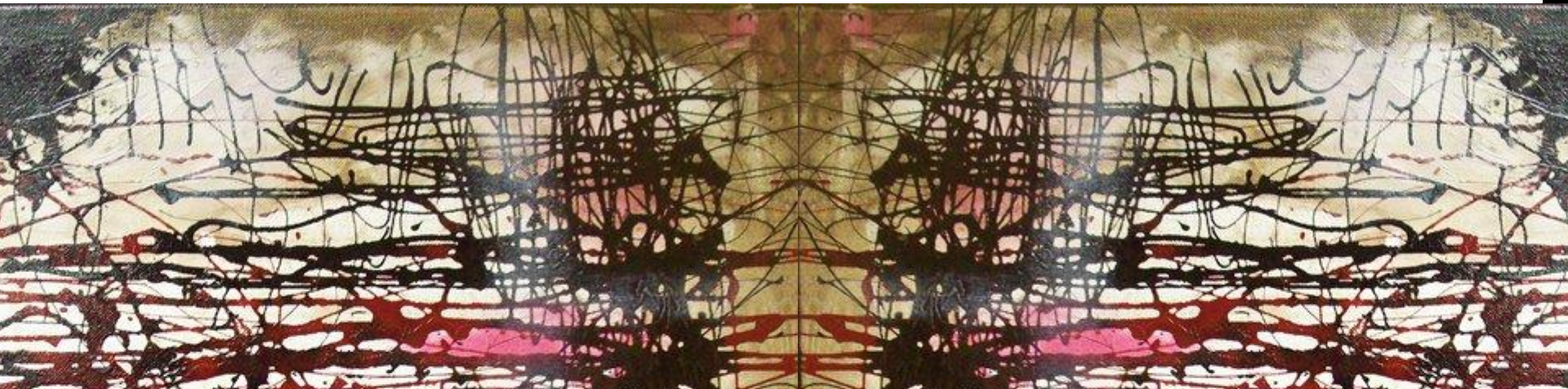
Проникновение через ГЭБ, значительная скорость перераспределения из ЦНС в ткани (жировая ткань, мышцы)

T ДЕЙСТВИЯ

**длительного действия ($T_{1/2}$ — 24–48 ч):
дiazepam, хлордiazепоксид и др.;**

**средней продолжительности действия
($T_{1/2}$ — 6–24 ч): алпразолам, оксазепам,
лоразепам и др.;**

короткого действия ($T_{1/2}$ — менее 6 ч).



ПОКАЗАНИЯ

Аффективные расстройства;

Шизофрения и общие психотические состояния;

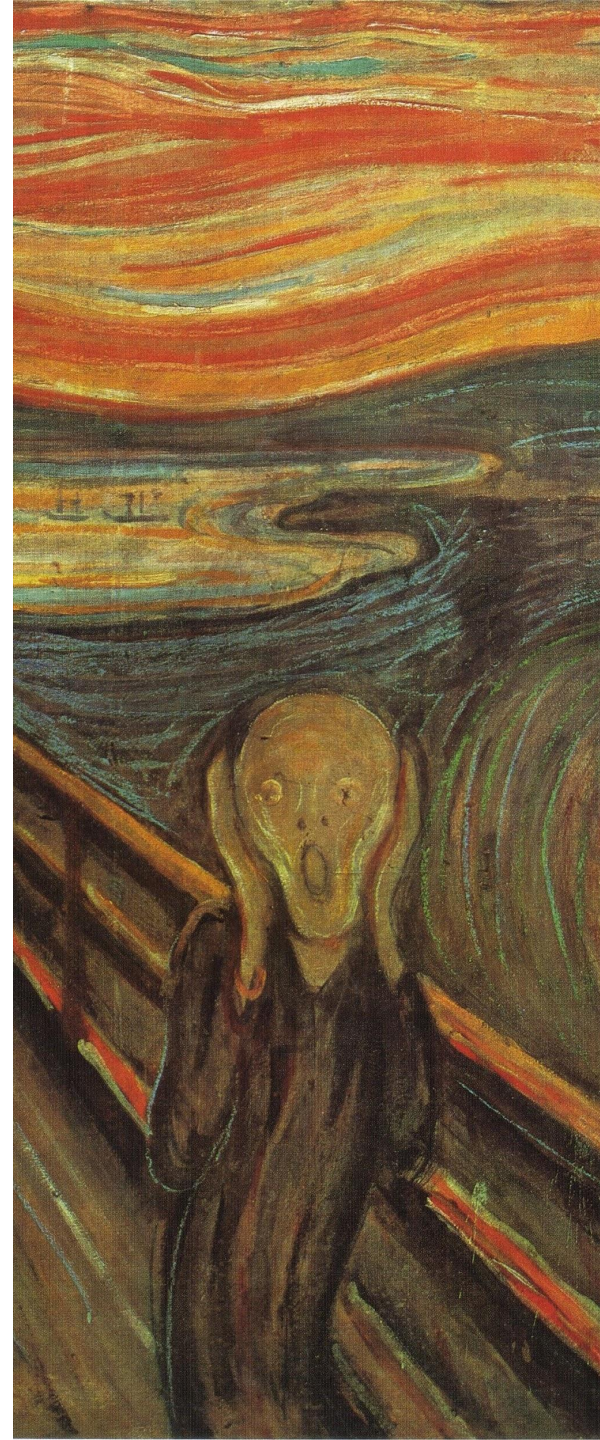
Генерализованное тревожное расстройство;

Простые фобии;

Панические атаки;

ОКР;

Соматоформные и соматизированные расстройства



ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- индивидуальная гиперчувствительность,
- выраженная печеночная недостаточность,
- тяжелая миастения,
- глаукома,
- выраженная дыхательная недостаточность,
- атаксия,
- выраженная депрессия, суицидальные наклонности,
- наркотическая или алкогольная зависимость (за исключением лечения острого абстинентного синдрома).



СИНДРОМ ОТМЕНЫ

**Рецидив состояния тревоги
«Рикошетные» расстройства**

Новые симптомы:

- тревога
- раздражительность
- бессонница
- тошнота
- гиперакузия
- трудность концентрации
- тремор
- деперсонализация

СПАСИБО ЗА
ВНИМАНИЕ

