

# ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ



МОСКВА **2015**

# ИСТОРИЧЕСКАЯ СВОДКА

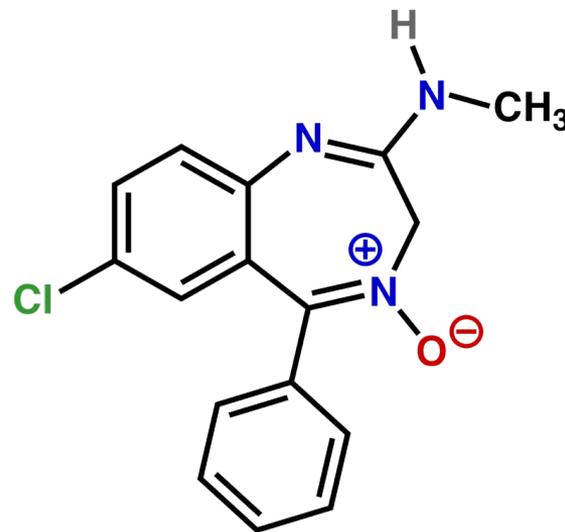
1951 – первый транквилизатор;

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 (нитрозепам,  
флунитрозепам)**

**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.).**

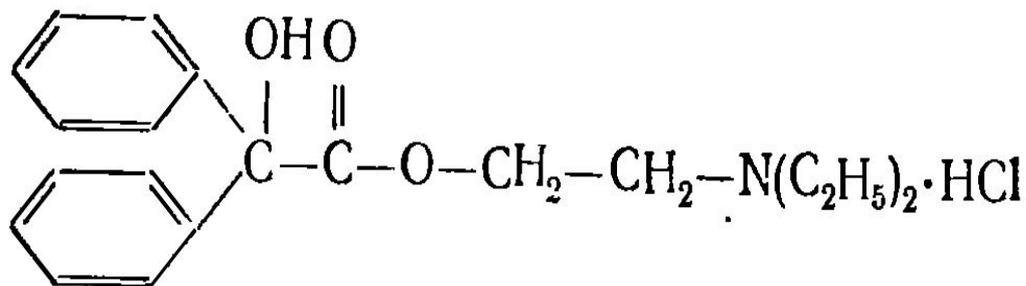


# КЛАССИФИКАЦИЯ Д.А. ХАРКЕВИЧА

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.

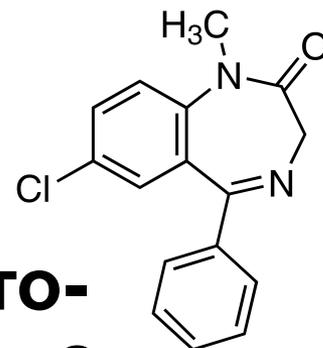
70810-0611-0

# 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).**

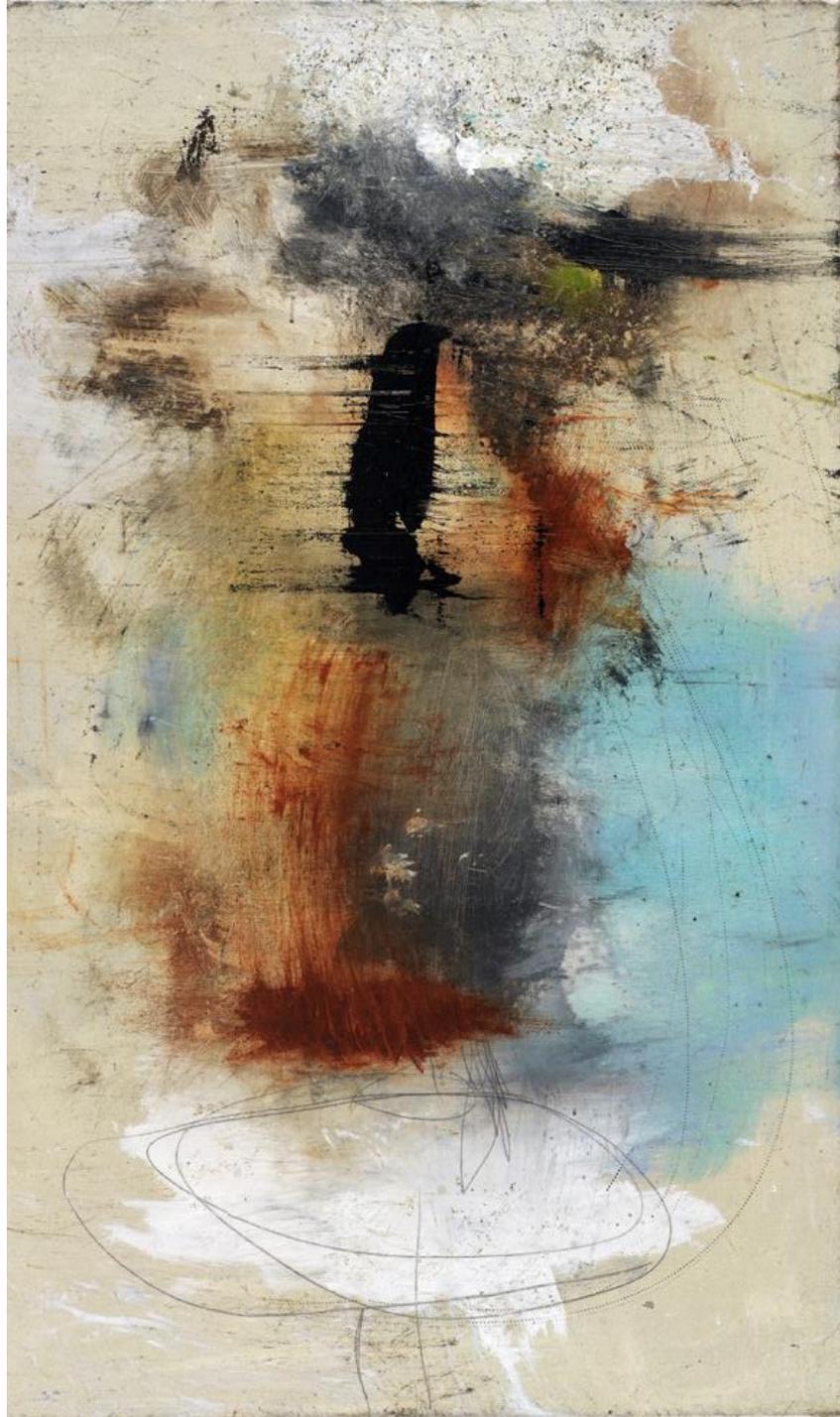


# МЕХАНИЗМ

**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).**

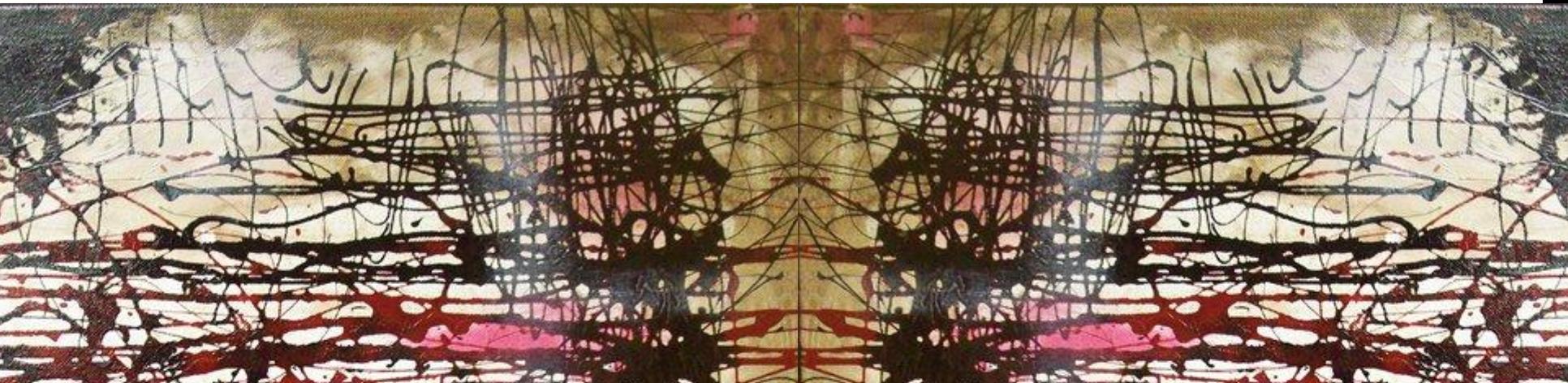
**Проникновение через ГЭБ, значительная скорость перераспределения из ЦНС в ткани (жировая ткань, мышцы)**

# **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;**

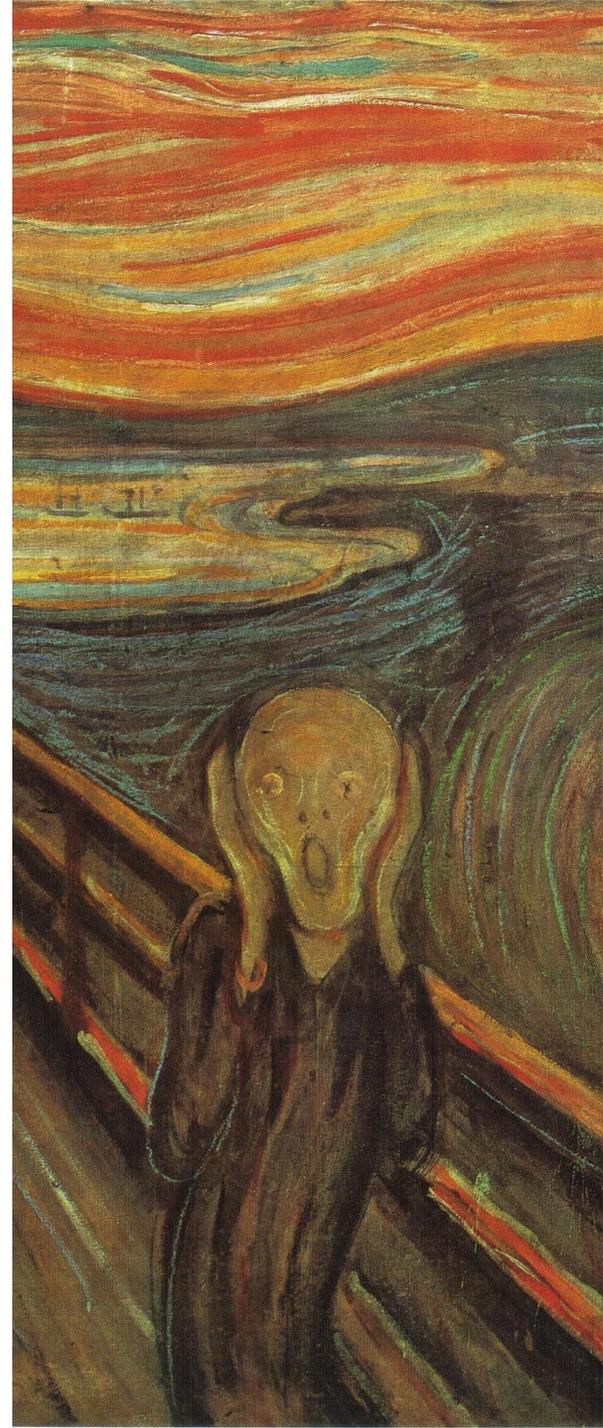
**Генерализованное тревожное расстройство;**

**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

