



МОЛЕКУЛЯРНАЯ ФАРМАКОЛОГИЯ СНОТВОРНЫХ И АНКСИОЛИТИЧЕСКИХ СРЕДСТВ

Медико-биологический факультет



ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ

НЕВРОЗ

- обратимое расстройство психической деятельности, обусловленное воздействием психотравмирующих факторов и протекающее с осознанием больным заболевания и без нарушения отражения реального мира.
- навязчивые страхи (фобии), боязнь высоты, закрытых помещений и т.д., истерия – наличие особого склада характера, когда для привлечения внимания окружающих используются припадки, во время которого человек может рвать на себе волосы, одежду, биться об пол и т.д.

ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ (АНКСИОЛИТИКИ)

Оказывают транквилизирующее действие

- снижают беспокойство, страх, оказывают
успокаивающее действие. Помогают
примириться в конфликтной ситуации

ТРАНКВИЛИЗАТОРЫ (АНКСИОЛИТИКИ)

- **Агонисты бензодиазепиновых рецепторов**
 - **Длительного действия ($T_{1/2}=24-48\text{ч.}$)**
 - диазепам (сибазон, седуксен, валиум)
 - феназепам
 - хлордиазепоксид (хлосепид, элениум)
 - **Средней продолжительности ($T_{1/2}=6-24\text{ч.}$)**
 - нозепам (оксазепам, тазепам)
 - лоразепам
 - алпразолам
 - **Короткого действия ($T_{1/2}<6\text{ч.}$)**
 - мидазолам (дормикум)
- **Агонисты серотониновых рецепторов**
 - буспирон
- **Разные**
 - амизил
 - фенибут
 - мебикар
 - мепробомат

Медиаторы и ферменты

Бензодиазепиновые рецепторы

ГАМК-рецепторы

Барбитуратовые рецепторы

Серотониновые рецепторы

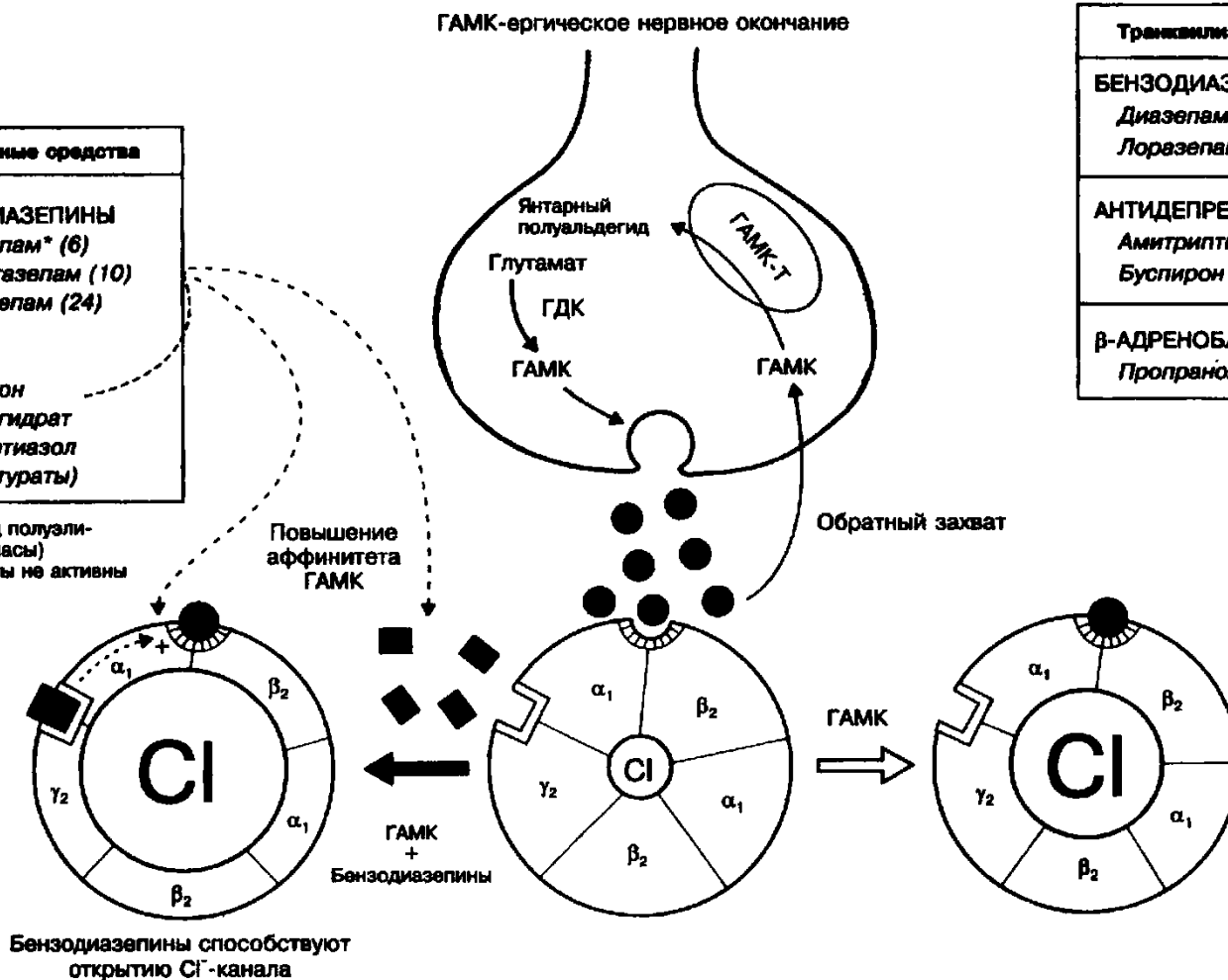
В-адренорецепторы

МАО

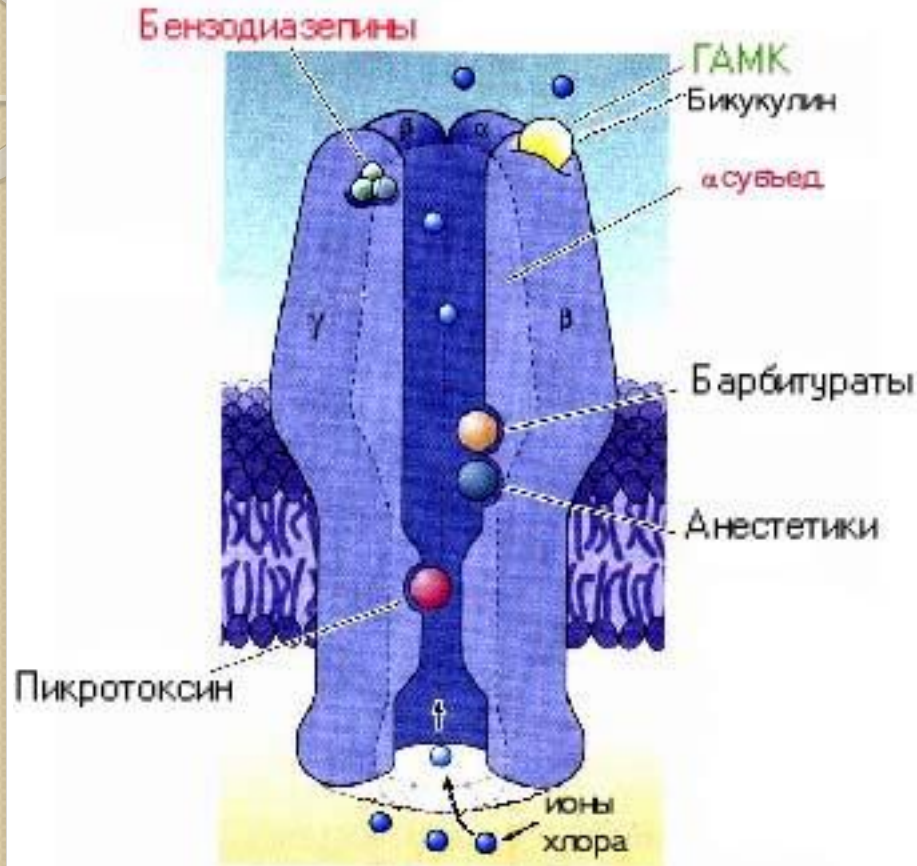
Снотворные средства
БЕНЗОДИАЗЕПИНЫ Темазепам* (6) Лорметазепам (10) Нитразепам (24)
ДРУГИЕ Зопиклон Хлоралгидрат Хлорметиазол (барбитураты)

()= Период полужизни (часы)
* Метаболиты не активны

Транквилизаторы
БЕНЗОДИАЗЕПИНЫ Диазепам (32) Лоразепам* (12)
АНТИДЕПРЕССАНТЫ Амитриптилин Бупирон
β-АДРЕНОБЛОКАТОРЫ Пропранолол



МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ БД



**Бензодиазепины
связываются с аллосте-
рическим участком
ГАМК_A рецептора**

**Торможение сопряжено
с гиперполяризацией
постсинаптической
мембраны из-за увели-
чения проводимости для
ионов хлора**

ЭФФЕКТЫ ТРАНКВИЛИЗАТОРОВ

- анксиолитический
- седативный
- снотворный
- амнестический
- антиагрессивный
- противосудорожный
- мышечно-расслабляющий
- индукция и поддержание общей анестезии (мидазолам)
 - антагонист - флумазенил (вводится для уничтожения эффекта мидазолама по завершении хирургической операции) – действует непродолжительно - до 30 мин, при отравлении вводят несколько раз.

ПРИМЕНЕНИЕ ТРАНКВИЛИЗАТОРОВ

- Неврастения, истерия
- Как снотворные
- При мышечной спастии
- Купирование эпилептического приступа
- Премедикация и анестезия – *атаралгезия* :
БД + НА + Антигист
- При негативных эмоциональных воздействиях

НЕЖЕЛАТЕЛЬНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- привыкание
- психическая и физическая зависимость
- Развиваются при длительном применении. При резкой отмене - возбуждение, вялость, до судорог
- потенцируют действие алкоголя
- ухудшают психическую работоспособность
- миорелаксация
- ухудшают операторскую деятельность (водители и т.д.)
- сонливость
- снижают либидо и потенцию



СНОТВОРНЫЕ СРЕДСТВА

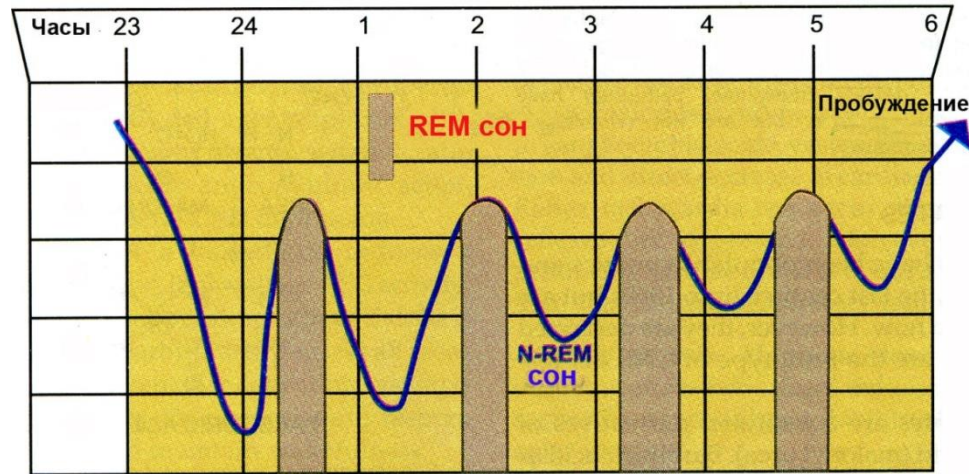
СНОТВОРНЫЕ СРЕДСТВА

фармакологические вещества,
способствующие засыпанию и
обеспечивающие необходимую
продолжительность сна

СОН

- активный процесс, при котором функция гипногенных структур головного мозга повышена, а активирующей восходящей ретикулярной формации понижена
- различают разные виды сна:
 - Физиологический
 - Патологический
 - Наркотический

НОРМАЛЬНЫЙ ЦИКЛ СНА



- Медленный сон (**N-REM**) - ↓ электрической активности мозга, пульса, дыхания, сновидения редко, преимущественно проявления психической деятельности: разговор во сне, снохождение и ночные страхи у детей. Длится 60—90 мин и сменяется второй стадией
- Быстрый сон (**REM**) - ↑ биоэлектрическая активность, пульс, дыхание, быстрые движения глаз, сновидения. Длится около 20 мин и вновь сменяется стадией «медленного сна».
- При изменениях последовательности и продолжительности этих периодов сон становится неполноценным, возникают поведенческие и психические расстройства

КЛАССИФИКАЦИЯ СНОТВОРНЫХ

Агонисты бензодиазепиновых рецепторов

- Производные бензодиазепина
 - *средней продолжительности ($t^{1/2}$ =12-24 часа):*
 - Нозепам (Оксазепам, Тазепам), Темазепам (Рестроил), Нитразепам (Радедорм, Эуноктин), Алпразолам
 - *длительного действия ($t^{1/2}$ =30-40 часов и более)*
 - Феназепам, Флуразепам (Далман), Диазепам (Сибазон, Седуксен)
- Препараты разного химического строения (небензодиазепиновые)
 - Золпидем
 - Зопиклон (Имован)

КЛАССИФИКАЦИЯ СНОТВОРНЫХ

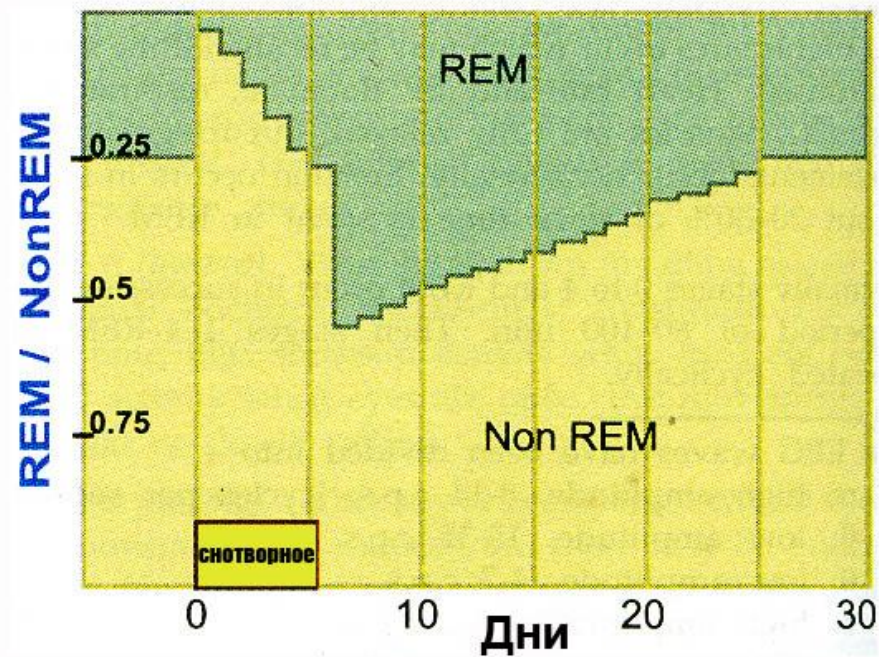
Снотворные средства с наркотическим типом действия

- Гетероциклические соединения - *Производные барбитуровой кислоты*
 - Этаминал-натрий
 - Фенобарбитал
- Алифатические соединения
 - Хлоралгидрат

Препараты разных фармакологических групп.

- Димедрол
- Натрия оксибутират
- Доксиламин (Донормил)

ВЛИЯНИЕ СНОТВОРНЫХ НА ФАЗЫ СНА



**прием снотворного в течение
6 ночей**

- ↓ фаза быстрого сна
- Наибольшее влияние оказывают барбитураты, в меньшей степени - бензодиазепины
- Не отмечено влияния у натрия оксибутирата и хлоралгидрата
- Отмена снотворных может сопровождаться феноменом «отдачи»
- выраженность зависит от дозы и срока применения.

ПРИМЕНЕНИЕ СНОТВОРНЫХ СРЕДСТВ

- **Бессонница, в т.ч.**
 - затрудненное засыпание
 - ночные пробуждения
 - раннее пробуждение
 - преходящая, ситуационная и хроническая бессонница
- **Вторичные нарушения сна при психических расстройствах**