

АНКСИОЛИТИКИ И ГИПНОТИКИ

1. Бензодиазепиновые транквилизаторы
2. Небензодиазепиновые анксиолитики
3. Небензодиазепиновые гипнотики
4. Несинтетические (растительные) гипнотики (валериана, новопассит и др.)
5. Корвалол, валокродин

БЕНЗОДИАЗЕПИНЫ

- анксиолитическое
- седативное
- противосудорожное
- миорелаксирующее
- гипнотическое
- вегетостабилизирующее

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ

ГАМК является основным ингибитором ЦНС. Эта аминокислота действует, связываясь с ГАМК-А рецепторами – лиганд-зависимыми каналами, в которых участок связывания нейромедиатора и ионный канал составляют один макромолекулярный комплекс.

Показания к применению анксиолитиков

1. Ситуационная или связанная со стрессом тревога
2. Социофобия
3. Генерализованное тревожное расстройство
4. Панические атаки
5. Простые фобии
6. ОКР
7. Тревожная депрессия
8. Депрессия с бессонницей
9. Бессонница

Показания к применению анксиолитиков

10. Алкогольная абстиненция
11. Алкогольный делирий
12. Мания и др. психозы с психомоторным возбуждением
13. Профилактика биполярного расстройства
14. Кататония
15. Длительное применение при хронических психозах
16. Делирий неалкогольный
17. Акатизия
18. Острая дискинезия
19. Поздние дискинезии
20. Органические тревожное и депрессивное расстройства и др.

Бензодиазепины

Препарат	Скорость развития эффекта после приема внутрь	Период полураспределения	Период полувыведения (часы)
Алпразолам (Ксанакс, Алзолам)	Средняя	Промежуточный	6-20
Диазепам	Высокая	Короткий	50-100
Клоназепам, Антелепсин	Средняя	Промежуточный	18-50
Феназепам	Высокая	Промежуточный	Около 20
Мидазолам 15 мг (Лормикум)	Средняя	Короткий	2-3

**По рекомендации ВОЗ
(Всемирной организации
здравоохранения)
курс терапии
бензодиазепинами не должен
превышать
ДВУХ НЕДЕЛЬ**

Презабалин – новые возможности в лечении ГТР¹

- **Значительное облегчение психических и соматических симптомов тревоги²**
- **Существенное улучшение нарушенного сна³**

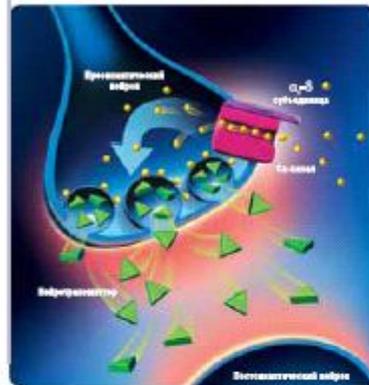
МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ ПРЕГАБАЛИНА

Прегабалин связывается с дополнительной субстанцией $\alpha 2$ -дельта-протеином вольтаж-зависимых кальциевых каналов в центральной нервной системе.

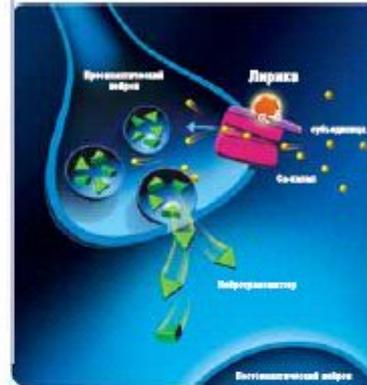
Предполагается, что такая связь в ЦНС приводит к противосудорожному, анксиолитическому и анальгетическому эффектам.

Механизм действия прегабалина^{1,2,3}

Основная причина развития нейропатической боли – повышенная возбудимость нейронов и массивный выброс болевых медиаторов



Лирика модулирует активность нейронов, снижая выброс болевых медиаторов



Лирика модулирует активность нейронов:

- Лирика связывается с субъединицей $\alpha_2\text{-}\delta$ потенциал-зависимых кальциевых каналов
- Лирика уменьшает приток ионов кальция в пресинаптические окончания гипервозбужденных нейронов
- Вследствие связывания с $\alpha_2\text{-}\delta$ прегабалин уменьшает выброс возбуждающих нейромедиаторов



Анальгетическая, анксиолитическая, противосудорожная активность

1. Данилов А.Б., Давыдов О.С., Нейропатическая боль. 2007, стр. 10,11,12; 2. Методические рекомендации по диагностике и лечению нейропатической боли под редакцией академика РАМН НН Яхно, издательство РАМН, Москва 2008 3. W esche D et al. The pharmacokinetic properties of pregabalin and gabapentin: Differences and Similarities, poster at IASP and WCP 2005.

ПРЕГАБАЛИН. ФАРМАКОКИНЕТИКА

- Биодоступность более 90%
- C_{\max} через 1 часа после приема на голодный желудок
- При приеме на полный желудок C_{\max} достигается через 2,5 часа
- Равновесная концентрация при 2х-кратном приеме достигается через 48 часов
- НЕ СВЯЗЫВАЕТСЯ С БЕЛКАМИ ПЛАЗМЫ

ПРЕГАБАЛИН. ФАРМАКОКИНЕТИКА

- ПРАКТИЧЕСКИ НЕ ПОДВЕРГАЕТСЯ МЕТАБОЛИЗМУ
- Выделяется с мочой 98% в неизменном виде
- $T_{1/2}$ – 6,5 часов
- Пол не влияет на фармакокинетику
- Возраст старше 65 лет требует более НИЗКИХ ДОЗ

ПРЕГАБАЛИН. ПОКАЗАНИЯ

- вспомогательное средство при терапии эпилепсии при парциальных формах припадков
- Генерализованное тревожное расстройство (ГТР)
- Нейропатические боли (сахарный диабет, постгерпетическая невралгия)

ПРЕГАБАЛИН. ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Гиперчувствительность
- Возраст до 18 лет (нет данных)
- Кормление грудью

ОТНОСИТЕЛЬНЫЕ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Почечная недостаточность
- Беременность

Переносимость Прегабалина

Частота нежелательных явлений vs плацебо* Количество пациентов (%)

	Плацебо (n=2290)	Прегабалина® 150 мг (n=1077)
Головокружение	8.7	15.1
Сонливость	7.8	13.4
Головная боль	13.4	10.9
Сухость во рту	3.4	5.4
Инфекции	7.8	8.0
Астенический синдром	5.2	6.0
Амблиопия [†]	2.1	4.4
Тошнота	7.0	5.2
Паросмия [‡]	1.4	3.8
Патологическое мышление	1.6	2.3
Увеличение массы тела	0.8	3.5

* Статистически значимы различия по сравнению с группой плацебо, согласно точному тесту Фишера, $p < 0.05$

† Включая другие дозы прегабалина (50, 75 мг в день). Дневная доза разбивается на 2 или 3 приёма.

‡ Паросмия описывалась как затуманенное зрение.

LYRICA®. Scientific Discussion, 27 Jan 2010 (EMA). Инструкция по медицинскому применению препарата Лирика, одобрена 07.07.2006 с дополнениями

ПЕРЕДОЗИРОВКА

- При передозировке (15 г) никаких иных явлений кроме описанных побочных эффектов не наблюдалось

ТЕРАПИЯ ПЕРЕДОЗИРОВКИ

- Промывание желудка
- Поддержание жизненно важных функций
- Гемодиализ

Лирика обеспечивает значительное облегчение психических и соматических симптомов тревоги¹



* M. Hamovit, 1959. Личностный опросник, направленный на выявление конституциональной тревожности и ситуационной тревоги. Содержит перечень 14 групп симптомов, относящихся к основным симптомам тревоги.

Результаты 8-недельного двойного слепого многоцентрового плацебо-контролируемого исследования с участием 374 пациентов, проводившегося в 47 исследовательских центрах: Бельгия, Канада, Франция, Ирландия, Италия, Голландия, Испания и Швеция.*

1. Herman B, Nivoli G, Petralia A and Mandel F. Efficacy of pregabalin and venlafaxine-XR in generalized anxiety disorder: results of a double-blind, placebo-controlled 8-week trial. Poster presented at the XXVI Congress of the Collegium Internationale Neuro-Psychopharmacologicum, July 13-17, 2008, Munich

ФОРМА ВЫПУСКА

- Капсулы 25 мг
- Капсулы 50 мг
- Капсулы 75 мг
- Капсулы 100 мг
- Капсулы 150 мг
- Капсулы 200 мг
- Капсулы 300 мг

Прегабалин – удобный режим дозирования при всех показаниях ¹

	Стартовая доза	2-я неделя	3-я неделя при необходимости	4-я неделя и далее при необходимости
Нейропатическая боль	 150 мг 2 раза в сутки x 75 мг	3-7 дней  300 мг 2 раза в сутки x 150 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг
Эпилепсия	 150 мг 2 раза в сутки x 75 мг	 300 мг 2 раза в сутки x 150 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг
Генерализованное тревожное расстройство	 150 мг 2 раза в сутки x 75 мг	3-7 дней  300 мг 2 раза в сутки x 150 мг	 450 мг 2 раза в сутки x 150 + 75 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг
Фибромиалгия	 150 мг 2 раза в сутки x 75 мг	 300 мг 2 раза в сутки x 150 мг	 450 мг 2 раза в сутки x 150 + 75 мг	 600 мг 2 раза в сутки x 300 мг

1. Инструкция по медицинскому применению препарата Лирика (прегабалин), одобрена 07.07.2006. с изменениями от 15.02.2010.

Атаракс – небензодиазепиновый анксиолитик

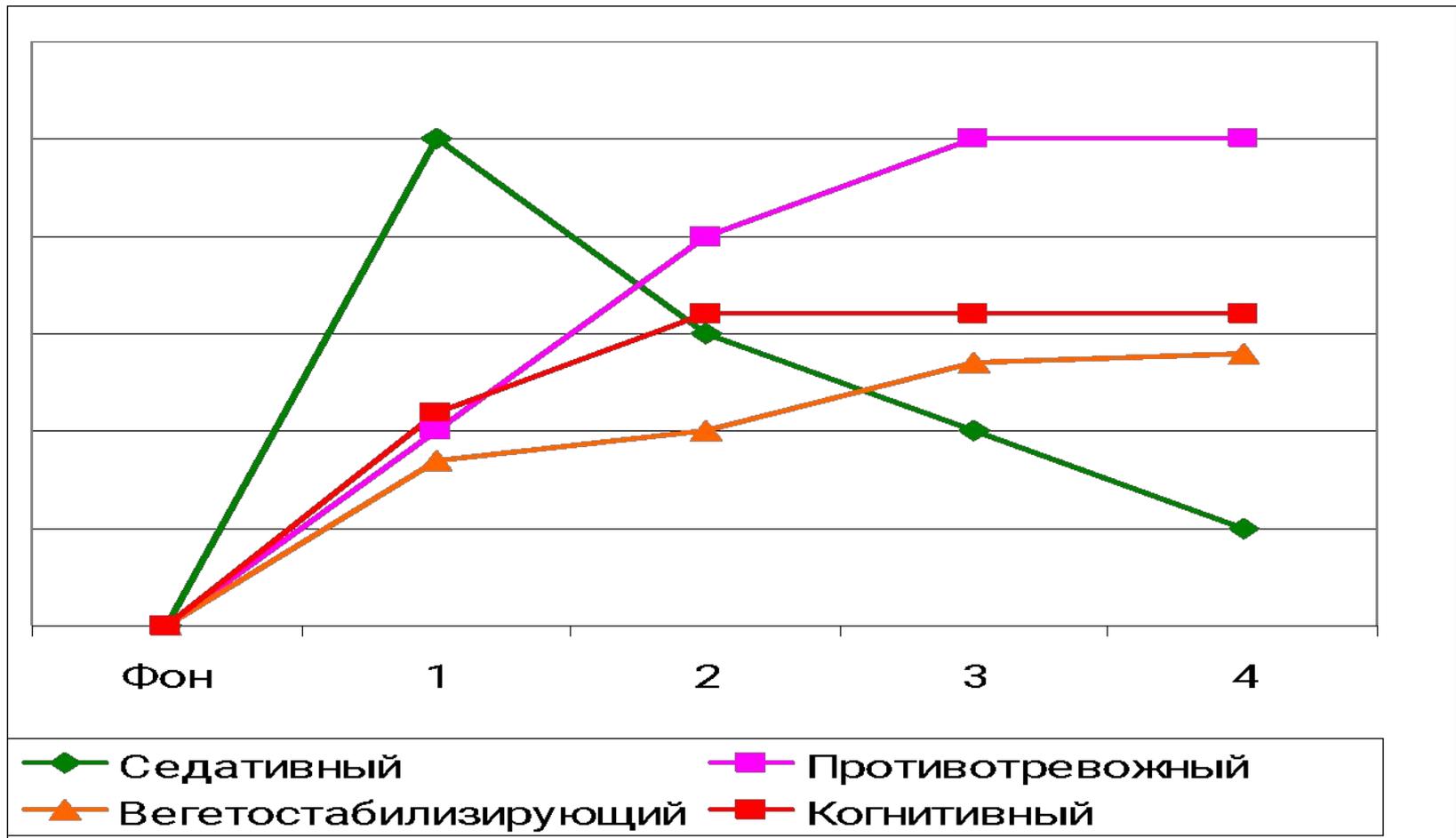
Показания: тревога, возбуждение,
алкогольная абстиненция

- Не вызывает зависимости и привыкания
- Максимальная концентрация через 2 часа после приема внутрь
- Метаболизируется в печени, активный метаболит цетиризин H₁-блокатор
- Выводится почками

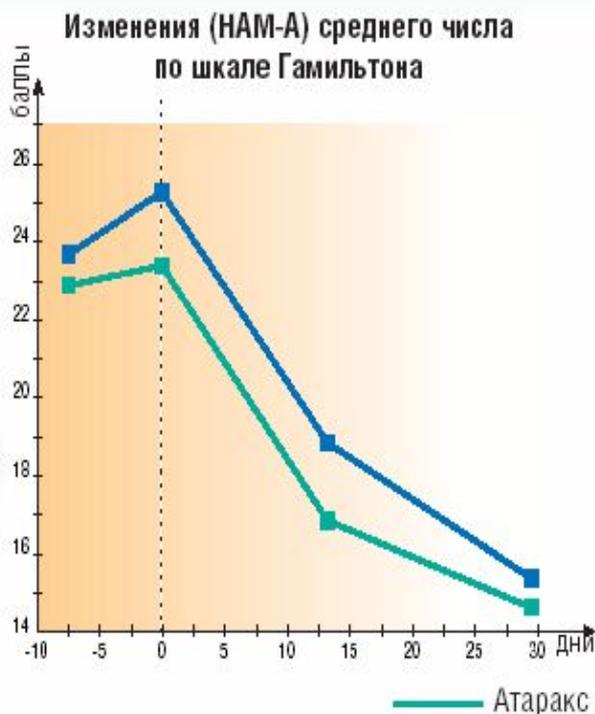
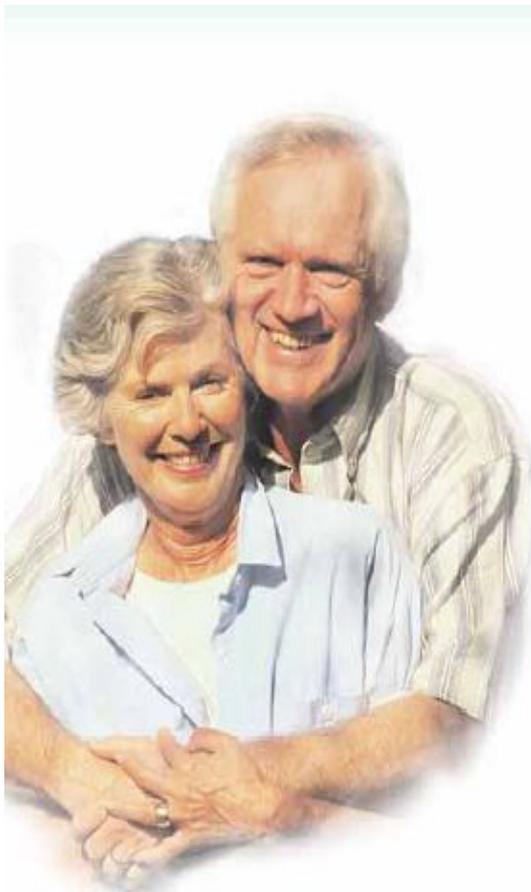
Атаракс - побочные эффекты

- антихолинергические (сухость слизистых, запоры, затруднение мочеиспускания)
- Угнетения ЦНС (сонливость, мышечная вялость)
- Кардиоваскулярные (гипотония, тахикардия)
- Потенцирует действие транквилизаторов, барбитуратов, алк.

ОСОБЕННОСТИ ПСИХОТРОПНОГО ДЕЙСТВИЯ АТАРАКСА (ГИДРОКСИЗИНА)



Атаракс – препарат выбора при тревоге у пожилых пациентов



- Атаракс эффективно купирует тревогу*



- Атаракс положительно влияет на когнитивную функцию*

ГИПНОТИКИ

Золпидем, Ивадал	T:5,10
Зопиклон, Имован	T:7,5
Доксиламин, Донормил	T:15, 30 мг T растворимые:15 мг

**СПАСИБО ЗА
ВНИМАНИЕ !**

