

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.

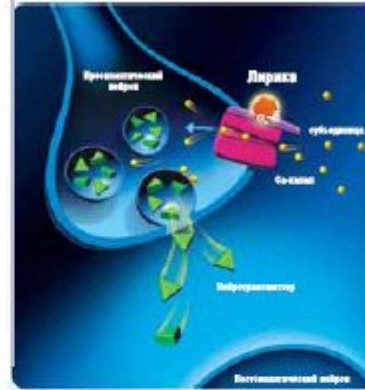
Предполагается, что такая связь в ЦНС приводит к противосудорожному, анксиолитическому и анальгетическому эффектам.

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.

‡ Амблиопия 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 тревоги ¹



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

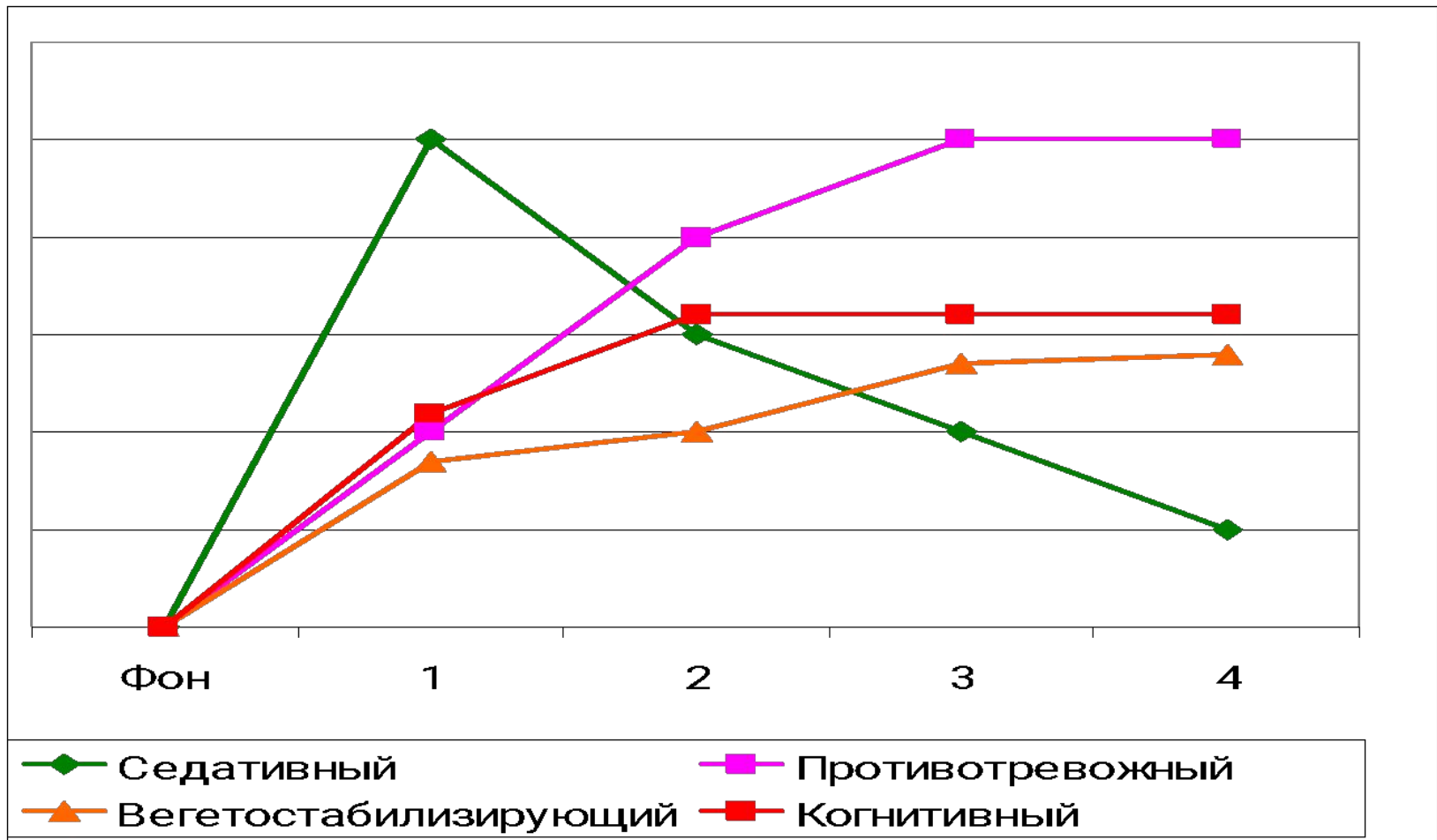
Показания: тревога, возбуждение,
алкогольная абстиненция

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

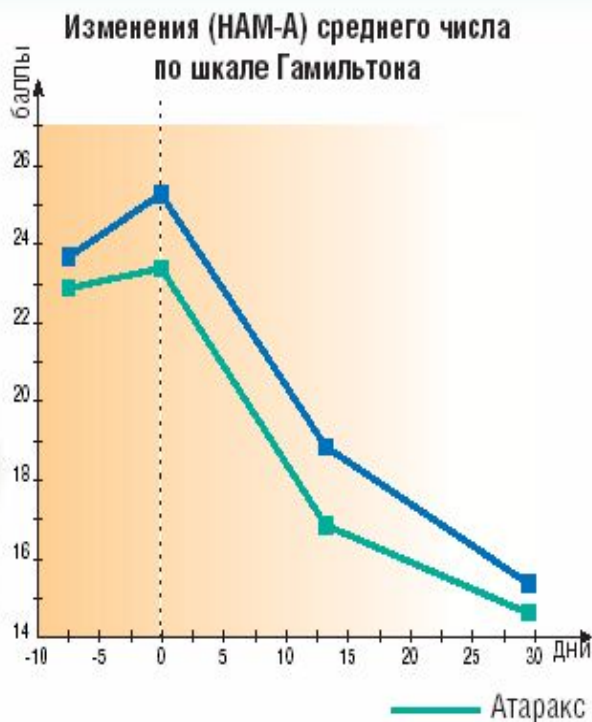
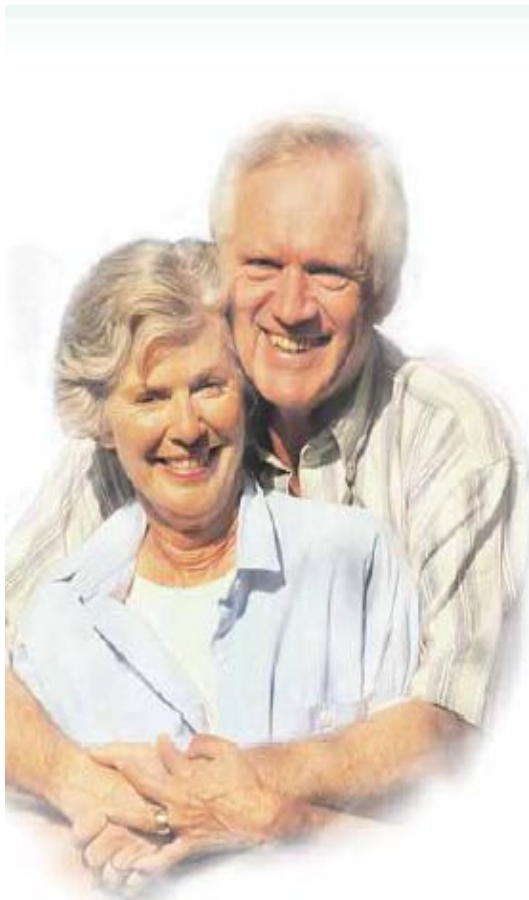
Атаракс - побочные эффекты

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

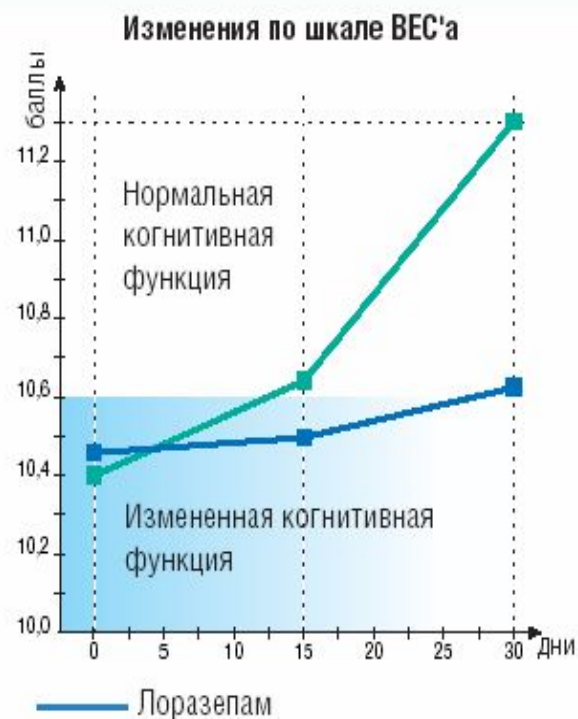
ОСОБЕННОСТИ ПСИХОТРОПНОГО ДЕЙСТВИЯ АТАРАКСА (ГИДРОКСИЗИНА)



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 !**

