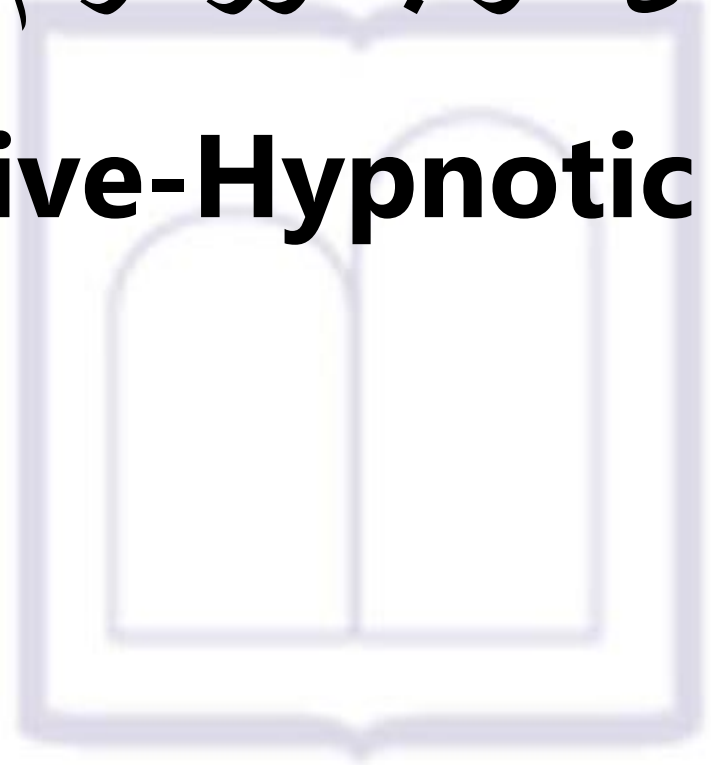


داروهای خواب آور- آرام بخش

Sedative-Hypnotic Drugs



مدرس: بهمن طالباری

طبقه بندی و فارماکوکینتیک

○ زیر گروه ها:

- بنزودیازپین ها
- باربیتورات ها
- داروهای متفرقه: کاربامات ها، الکل ها و اتر های حلقوی
- داروهای جدیدتر: بوسپیرون – زولپیدم - زالاپلون

جذب و توزیع

- اکثر داروها محلول در لیپید هستند، جذب خوب از دستگاه گوارش و توزیع خوب به مغز دارند
- توزیع سریع به مغز: تیوپنتال
- توزیع مجدد به خون: مکانیسم خاتمه اثر

متابولیسم و دفع

- اکثر داروهای آرام بخش- خواب آور قبل از حذف از بدن توسط آنزیم های کبدی متابولیزه می شوند.
 - غالباً دارای متابولیت فعال می باشند: دیازپام و فلورازپام
 - ترکیباتی مانند لورازپام و اکسازپام فاقد متابولیت فعال هستند.
 - طول اثر از تنها چند ساعت تا بیش از 30 ساعت متغیر است.
- فقط چند ساعت: زالاپلون، زولپیدم، تریازولام، کلرال هیدرات
بیش از 30 ساعت: کلردیازپوکساید، کلرازپات، دیازپام، فنوباربیتال

مکانیسم عمل

- چند مکانیسم عمل برای داروهای آرام بخش-خواب آور وجود دارد.
- بنزودیازپین: گیرنده **BZ** بخشی از ماکرومولکول کانال یونی-گیرنده گابا (**GABA**) می باشد.
 - باعث افزایش هدایت یون کلر از طریق افزایش فرکانس فعالیت کانال می شود.
 - آنتاگونیست: فلومازنیل
 - آگونیست معکوس: بتا کاربولین

مکانیسم عمل

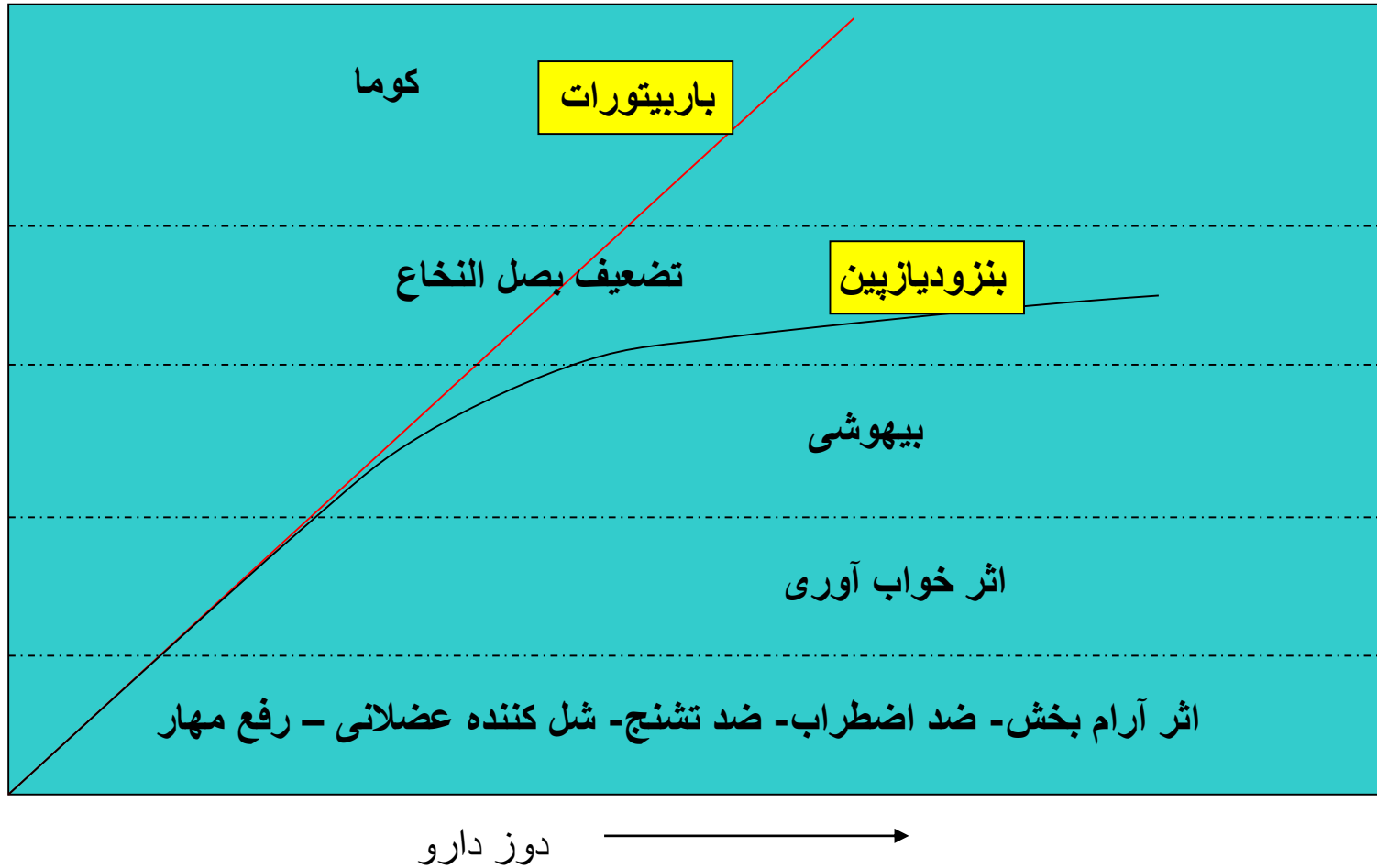
- باریتورات ها: از طریق تسهیل و طولانی کردن عمل کابا و گلايسين باعث کاهش فعالیت نورونی در مغز میانی و تشکیلات مشبک می شوند
- در جایگاهی متفاوت از بنزودیازپین و کابا باعث افزایش مدت باز بودن کانال یون کلر می شود.
- در غلظت ها بالا: گیرنده گلوتمات و کانال سدیم نیز ممکن است مهار شود

مکانیسم عمل

- بوسپیرون: $5HT_{1A}$
- زالاپلون و زولپیدم: BZ_1

فارماکودینامی

اثر سیستم عصبی مرکزی



1. اثر آرام بخشی (sedation)
2. اثر خواب آوری (Hypnosis)
3. بیهوشی (anesthesia) همراه با فراموشی و تضعیف رفلکسی
4. اثر ضد تشنج: اثر انتخابی با فنوباریتال و کلونازپام
5. اثر شل کننده عضلانی: دیازپام
6. تضعیف بصل النخاع: توقف تنفس، هیپوتانسیون، کلاپس قلبی و عروقی

7. تحمل (Tolerance): کاهش پاسخ دهی

8. وابستگی:

1. روانی

2. فیزیکی - سندرم قطع مصرف

کاربرد بالینی

○ حالات مختلف اضطراب:

- بنزودیازپین های با طول اثر متوسط و طولانی
- آلپرازولام و کلونازپام در درمان اختلالات پانیک و فوبیک
- بوسپیرون: فاقد اثرات سوء مغزی همچون نقصان هوشیاری و خواب آلودگی ولی با شروع اثر آهسته و تاخیری

○ اختلالات خواب:

- استازولام، فلورازپام و تریازولام
- زولپیدم و زالاپلون اثرات سوء کمتر بر هوشیاری روزانه و الگوی خواب

کاربرد بالینی

○ کاربرد های دیگر

- القا بیهوشی: تیوپنتال
- پروتوکول بیهوشی: دیازپام و میدازولام
- کنترل حالات تشنجی: کلونازپام و فنوباربیتال
- اسپاسم عضلانی: دیازپام
- برنامه ترک اعتیاد الکل و دیگر خواب آور-آرام بخش ها:
کلردیازپوکساید و دیازپام

- سوء عملکرد حرکتی روانی (سایکوموتور)
- تضعیف افزونی **CNS**: الکل ، آنتی هیستامین ها، روانگردان ها، ضد دردهای اپیوئید، ضد افسردگی های سه حلقه ای
- مصرف بیش از حد (**Overdosage**)
 - تضعیف تنفسی و قلبی عروقی
 - اثرات جانبی دیگر:
 - القا انزیم های کبدی: باربیتورات ها

لیست داروها

- **بنزودیازپین:** کلردیازپوکساید، دیازپام، تمازپام، آلپرازولام، فلورازپام، لورازپام، نیترازپام، اکسازپام، تریازولام و میدازولام
- **باربیتوارت ها:** فنوباربیتال، پنتوباربیتال، تیوپنتال، سکوباربیتال، متوهگزیتال
- **کاربامات ها:** میپروبامات
- **الکل ها:** اتانول و کلرال هیدرات
- **متفرقه:** بوسپیرون، زولپیدم و زالاپلون

خسته نباشید