

PSYCHOTROPNÍ LÁTKY

Poznámky ke cvičením z Farmakologie II

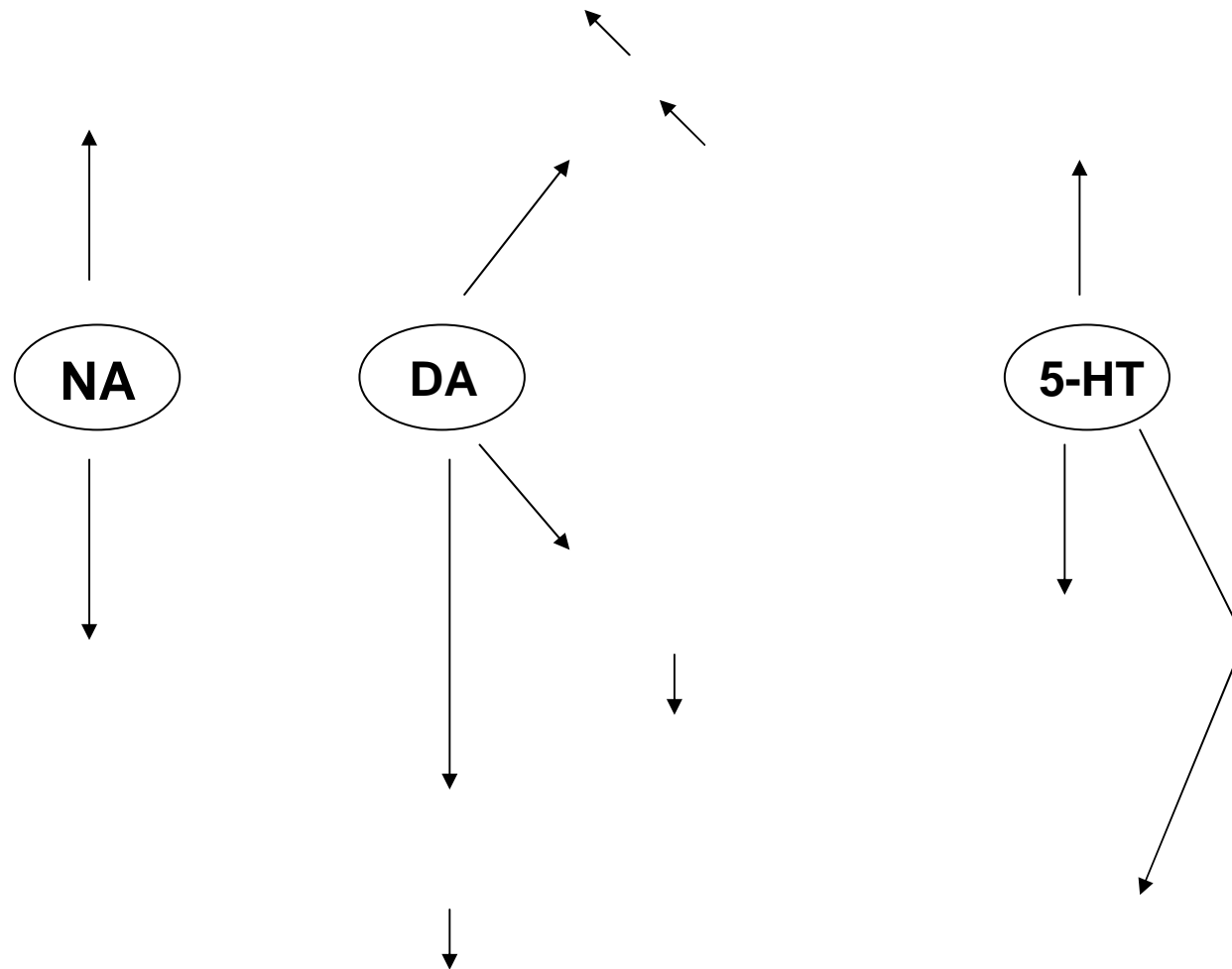
MUDr. Jana Nováková, Ph.D.

Tento studijní materiál slouží výhradně pro výuku praktických cvičení předmětu Farmakologie II studentů VL a ZL lékařské fakulty MU. Představuje stručné podklady pro přípravu k probírané látce a osnovu pro záznam vlastních poznámek ve výuce. Vysvětlující doplnění, aktuální údaje a prohloubení obsahu jsou předmětem jednotlivých cvičení.

změny psychiky
při ↑ aktivitě

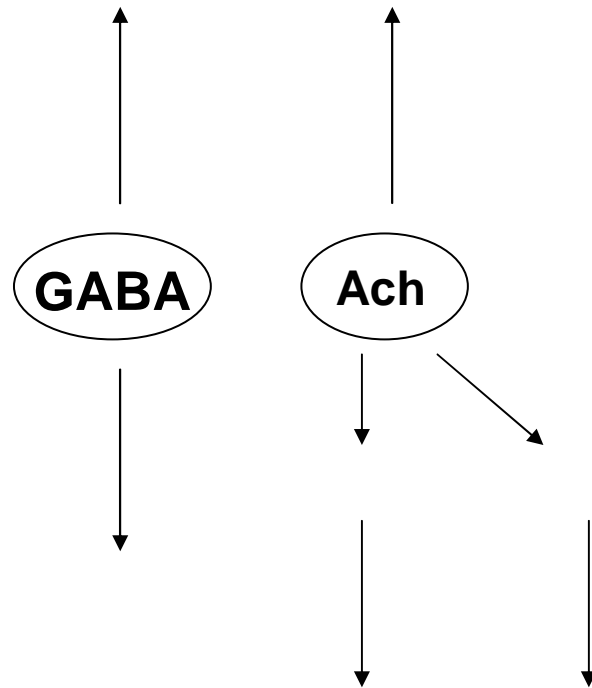
neurotransmitter

změny psychiky
při ↓ aktivitě



změny psychiky
při ↑ aktivitě

neurotransmitter



změny psychiky
při ↓ aktivitě

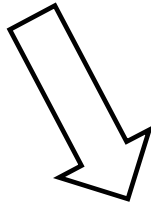
ANXIOLYTIKA

- /malé trankvilizéry, ataraktika, antifobika, antineurotika/
- látky působící tlumivě (ne všechna jsou sedativní) na CNS

INDIKACE

ZÁSTUPCI ANXIOLYTIK

- benzodiazepiny



ÚČINKY

- 1) hypnosedativní
- 2) anxiolytické
- 3) antikonvulzivní
- 4) myorelaxační
- (5) amnestické

relativně vysoký závislostní potenciál !!!

(fyzická i psychická závislost)

MECHANISMUS ÚČINKU

- - *specifický (receptorový)*

NEŽÁDOUCÍ ÚČINKY BZD

KONTRAINDIKACE PODÁNÍ BZD

FARMAKOKINETIKA

- - p.o. podání dobré, téměř kompletně resorbované z GITu
- - i.m. podání – rychlost absorpce často nepředvídatelná
- - intenzivní vazba na plazmatické bílkoviny
- - v játrech probíhá dealkylace, hydroxylace a následně konjugace s kys.glukuronovou
- - vylučování převážně močí ve formě metabolitů

BZD

příklady:

- -chlordiazepoxid (prodrug)
- -diazepam
- -oxazepam
- -bromazepam
- -lorazepam
- -alprazolam
- klobazam, klorazepát, tofisopam,...

- *další.....*

- hl.hypnotický účinek:

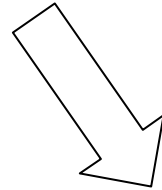
myorelax., antiepileptický, antikonvulz. úč.:

DĚLENÍ BDZ DLE FARMAKOKINETIKY

- ultrakrátce působící triazolam ($t_{1/2}$ 3-6 hod), midazolam ($t_{1/2}$ 2-3 hod)
- krátce působící oxazepam ($t_{1/2}$ 6-10 hod), tofisopam ($t_{1/2}$ 5-7 hod)
- středně dlouho působící alprazolam ($t_{1/2}$ 8-14 hod),
flunitrazepam ($t_{1/2}$ 15-30 hod),
nitrazepam ($t_{1/2}$ 16-36 hod),
bromazepam ($t_{1/2}$ 8-20 hod)
- dlouhodobě působící diazepam ($t_{1/2}$ 30-80 hod),
klonazepam ($t_{1/2}$ 20-60 hod),
chlordiazepoxid ($t_{1/2}$ 20-40 hod)


specifický antagonist BZD receptorů

- **!!!!!!!!!!flumazenil!!!!!!!!!!**



barbituráty

**podobný mechanismus účinku jako BZD, dnes
v anxiolytické indikaci již obsolentní**

- 
- působí nezávisle na GABA, půs. na jiném vazebném místě než BZD
 - nasedají na Cl⁻ kanál a prodlužují dobu jeho otevírání
 - hyperpolarizace na vnitřní straně membrány, inhibice přenosu vzruchu

OSTATNÍ ANXIOLYTIKA

- **I. parciální agonisti 5-HT_{1A} rec.**
- **II. malé d.antidepresiv**
- **III. malé d. antipsychotik (neuroleptik)**
- **IV. H₁-antiHis.**
- **V. beta-blok.**
- **VI. deriváty propanu**

HYPNOTIKA, SEDATIVA, HYPNOSEDATIVA

Definice:

HYPNOTIKA:

SEDATIVA:

Místo zásahu v CNS: FR, hypothalamus,
thalamus, mozková kůra

HYPNOTIKA, SEDATIVA, HYPNOSEDATIVA

INDIKACE

- **HYPNOTIKA:**
- **SEDATIVA:**
- **HRANICE MEZI HYPNOTIKY A SEDATIVY**

neostrá



HYPNOSEDATIVA

INDIKACE HYPNOTIK U NESPAVOSTI V PŘÍPADĚ, ŽE:

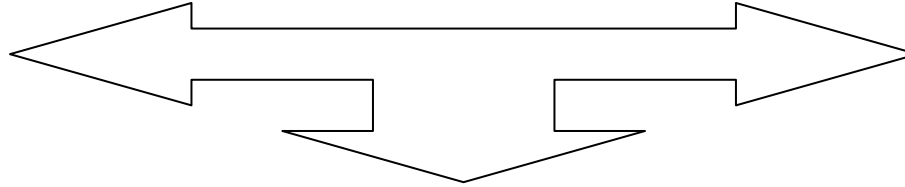
- * není možná kauzální léčba
- * ještě nezabrala kauzální léčba
- * jedná se o léčbu krátkodobé poruchy spánku
- * jedná se o závažnou poruchu spánku

POŽADAVKY NA „IDEÁLNÍ“ HYPNOTIKUM

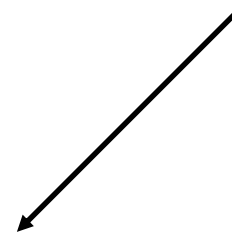
HYPNOTIKA

I. generace

III. generace

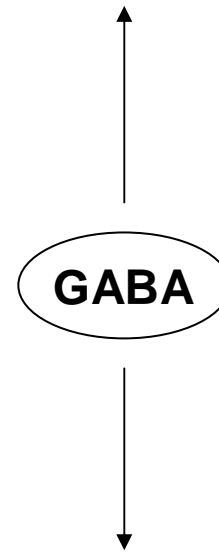
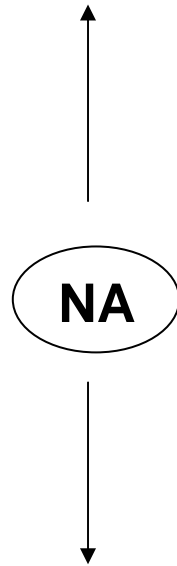


II. generace



změny psychiky
při ↑ aktivitě

neurotransmitter



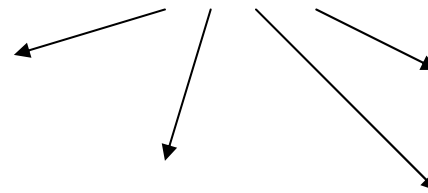
změny psychiky
při ↓ aktivitě

HYPNOTIKA

I. generace

barbituráty – dnes obsolétní

nebarbiturátová hypnotika (obsolétní nebo málo používaná)



HYPNOTIKA

II. generace

benzodiazepiny

HYPNOTIKA

III. generace selektivní agonisté Ω_1
benzodiazepinových receptorů (Ω_1 rec. =
dnes: BZD₁ rec.)

OSTATNÍ PSYCHOFARMAKA UŽÍVANÁ JAKO HYPNOSEDATIVA

I. malé d.antidepresiv – tlumivá

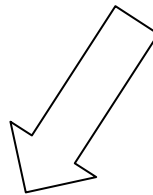
II. malé d. antipsychotik (neuroleptik)

III. H1-antiHis.

IV. rostlinná hypnosedativa

NOVÉ TRENDY V LÉČBĚ INSOMNIE

- chronohypnotika
 - chronobiotika
- } II. ovlivňující cirkadiánní rytmus



- melatonin (**CIRCADIN**)
- syntetické látky působící na melatoninové receptory

HYPNOTIKA ROSTLINNÉHO PŮVODU

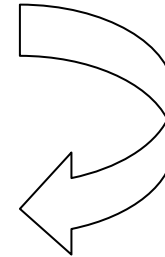
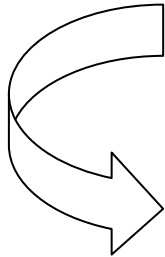
- -Melissa off.
- -Valeriana off.
- -Humulus lupulus
- -Crataegus monogyna
- -Passiflora incarnata
- -Hypericum perforatum

SEDACE PŘI VĚDOMÍ ANALGOSEDACE

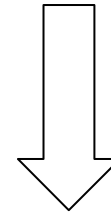
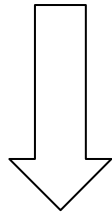
Ze stomatologických výkonů: extrakce retinované osmičky, resekce zubního kořene, resekce zubní cysty, zavádění implantátu,...)

Požadavky na analgosedaci:

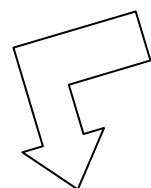
VŠEOBECNĚ POUŽÍVANÁ KOMBINACE



benzodiazepin + opioidní analgetikum

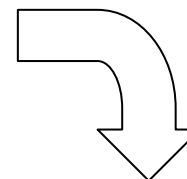


DALŠÍ POUŽÍVANÉ KOMBINACE



BZD

midazolam + etomidat



**krátkodobé nebarbiturové
hypnotikum**

Postup:

- 1) midazolam**
- 2) LA**
- 3) etomidat**
- 4) remifentanil**

Premedikace (cca 1 hod před výkonem)