**Транквилизаторы (анксиолитики)**

**Транквилизаторы** (лат. «транхалло» - успокаивать) - относятся к психотропным средствам. Малые транквилизаторы обычно представляют собой анксиолитики (противотревожные), большие транквилизаторы - антипсихотики (нейролептики). Препараты из этой группы вызывают тревогу,[невроз](https://az.wikipedia.org/wiki/Nevroz),[депрессия](https://az.wikipedia.org/wiki/Depressiya)и используется для лечения нарушений сна.

Транквилизаторы - это препараты, которые уменьшали или устраняли чувства и состояния человека, такие как дистресс, напряжение, волнение (страх) и дисфорию (дискомфорт), возникающие в результате депрессии.

К психологическим симптомам относятся такие симптомы, как психическое напряжение, раздражительность, бессонница, беспомощность. Большинство соматических симптомов связано с симпатической гиперактивностью (сердцебиение, потливость и тремор). Также могут отмечаться анорексия, одышка, гипервентиляция, утомляемость и спазм скелетных мышц. Тревожные реакции и нарушения поведения (фиксированные идеи) также могут регистрироваться при различных видах тревоги.

Транквилизаторы:

-Снятие беспокойства и напряжения;

-Седативный эффект;

-Сбор настроения;

- Вещества, не влияющие на трудоспособность и умственную деятельность.

Некоторые транквилизаторы также обладают противогрибковым и нейролептическим действием.

Может возникнуть зависимость от транквилизаторов.→следует использовать с осторожностью.

Идеальные транквилизаторы обладают анксиолитическим действием: в широком диапазоне доз, без гипноза, без атараксии (душевного комфорта) и речевых нарушений.

Однако идеальных препаратов с такими эффектами не существует. Многие транквилизаторы также обладают седативным эффектом.

Инструкции по использованию:

-Бессонница;

-Возбуждение и напряжение;

- страх депрессии, в сочетании с антидепрессантами;

-Мышечные спазмы, мышечное напряжение, травмы спинного мозга и спастические параличи (мягкий инсульт);

-При лечении эпилепсии.

Предупреждения:

Наиболее важным побочным эффектом является психическая зависимость (в зависимости от дозы ниже), поэтому необходимо постепенно прекращать применение транквилизаторов, а в некоторых случаях из-за высоких доз может возникнуть физическая зависимость.

Седативные средства, седативные средства, нейролептики и алкоголь усиливают благотворное влияние на ЦНС.

Они усиливают действие миорелаксантов.

У людей, принимающих барбитураты и алкоголь, могут наблюдаться нарушения внимания и памяти, а также снижение рефлексов.

Классификация:

1. Производные бензодиазепинов

2. Производные пропандиолдикарбамата

3. Производные дифенилметана

4. Производные циклопиролона

5. Производные различного строения.

**Производные и аналоги бензодиазепинов**

Они составляют основную группу транквилизаторов.

Имеют широкий терапевтический индекс

Риск самоубийства высок при использовании в сочетании с другими антидепрессантами и алкоголем.

Анксиолитические эффекты

Они делают это без успокоительного

Они считаются более рекомендуемыми транквилизаторами, поскольку не вызывают психической зависимости.

Механизмы действия:

Были проведены многочисленные исследования для определения механизма действия бензодиазепинов. Эти исследования показали, что бензодиазепины работают с гамма-аминокислотами.

Бензодиазепины связываются с бензодиазепиновыми рецепторами, расположенными в головном мозге;

Улучшает функцию НАЗАД в головном мозге;

Открываются хлоридные каналы и ускоряется поступление хлора в организм;

Происходит гиперполяризация→волнение падает.

В отсутствие RETURN бензодиазепины не могут воздействовать на хлоридные каналы и, следовательно, ингибировать нейроны.



**Отношения «структура-деятельность»**



Ядро 1,4-бензодиазепина необходимо для эффекта

В случаях 1, 2, 3 и 7 введение заменителей увеличивает активность

В первом случае наличие метильной группы придает высокую активность (во втором случае наличие карбонильной группы приводит к образованию тауромера). Введение алкильных радикалов усложняет метаболизм и приводит к снижению активности.

Необходим для активности карбонильного радикала в состоянии 2. Активность снижается при переходе на Тион.

При замещении 3-го условия активность снижается, но не снижается активность в гидроксильных производных и их эфирах.

Введение атома хлора или фтора в фенильное ядро ​​в положении 5 увеличивает активность. Помещение этих заменителей в метасостояние снижает активность.

Размещение 7-й электроотрицательной позиции увеличивает активность.



Насыщение двойных связей в 4-5 состояниях или переход ее в 3-4 состояния снижает активность.

**Бензодиазепины и производные бензодиазепин-N-оксида**



7-хлор-1-метил-5-фенил-2,3-дигидро-1H-[1,4]-бензодиазепин

**Хлордиазепоксид**



**Хлордиазепоксид** При синтезе 5-хлор-2-аминобензофенона получают сначала хиназолин, а затем и препарат:



5-хлор-2-аминобензофенон 5-хлор-2-амин-2-хлорметил-6-хлор-3-оксид-4-

бензофеноноксим фенилхинозолин

Эффект длительный. Гидролизуется в водном растворе кислот с образованием бензофенона. Метиламиновая группа делает это соединение более стабильным, чем его аналоги.



**Производные бензодиазепин-2-она**







Синтез диазепама:



**3-замещенные производные бензодиазепин-2-она.**





**Хлоразепат**

В случае 3 имеется группа -COO –K +

Алкоголь используется для лечения абстинентного синдрома и тревоги.

Метаболизм:



Производные бензодиазепина полностью и быстро всасываются после приема внутрь. Оксазепам является активным метаболитом диазепама.

**Производные триазолбензодиазепина.**



В отличие от алпразолама, он сохраняет о-хлорфенильную группу в 6 состояниях.

В отличие от алпразолама, он не сохраняет метильную группу в третьем состоянии.

1-Метил-8-хлор-6-фенил-4Н-1,2,4-триазоло[4,3-а]1,4-бензодиазепин

Алпразолам получают синтезом. Для этого после присоединения гидразина к молекуле производного хинолиндихлора образуется тиазольный цикл и конденсацией с триэтоксиэтаном получают диарилкетон. Затем к триазольному циклу добавляют бромметильную группу, а диразилкетон конденсируют с аммиаком с получением алпразолама:





 Представляет собой белый или слегка желтоватый мелкокристаллический порошок. Нерастворим в воде и эфире, мало в спирте, легко растворим в хлороформе.

**Производные оксазолобензодиазепина**



10-Хлор-11b-фенил-2-метил-2,3,7,11b-тетрагидрооксазоло[3,2-d]1,4-бензодиазепин-6(5Н)-он



7-(2-гидроксиэтил)-10-хлор-11b-(2-фторфенил)-2,3,7,11b тетрагидрооксазоло[3,2-d]1,4-бензодиазепин-6(5H)- на

**Другие производные трициклических бензодиазепинов.**



**Производные пропандиолдикарбамата**



Полностью и быстро всасывается после приема внутрь. Не рекомендуется к употреблению, так как может вызвать привыкание и отравление в больших дозах.

**Производные дифенилметана.**



Большинство этих соединений обладают антигистаминным, анальгетическим и холиноблокирующим (спазмолитическим) эффектами с репеллентным действием на ЦНС, некоторые из которых более выражены.

Эти вещества считаются медленно действующими и более слабыми транквилизаторами. Длительного лечения этими препаратами не существует.

Благодаря антигистаминному действию их применяют для лечения атипичных дерматитов и бронхиальной астмы у детей-аллергиков.



6-(5-хлорпиридин-2-теил)-7-оксо-6,7-дигидро-5Н-пироло[3,4-b]пиразин-5-ил 4-метилпиперазин-1-карбоксилат

Оказывает снотворное, седативное, анксиолитическое, мио­ре­лак­си­ру­ющее и противогрибковое действие.

Используется для кратковременного лечения нарушений сна.

Метаболизм:



**Производные с различной структурой.**



Это эффективный анксиолитик, такой как диазепам. Острое и хроническое возбуждение в основном используются при депрессивных расстройствах. Оказывает агонистическое действие на 5-HT1A-рецепторы.

Используется для лечения аутизма. Также оказывает нейролептическое действие.



1-(3,4-Диметоксифенил)-4-метил-5-этил-7,8-диметокси-5Н-2,3-бензодиазепин

Это производное 2,3-бензодиазепинов. В отличие от других бензодиазепинов, он не оказывает противогрибкового, миорелаксирующего или седативного действия.