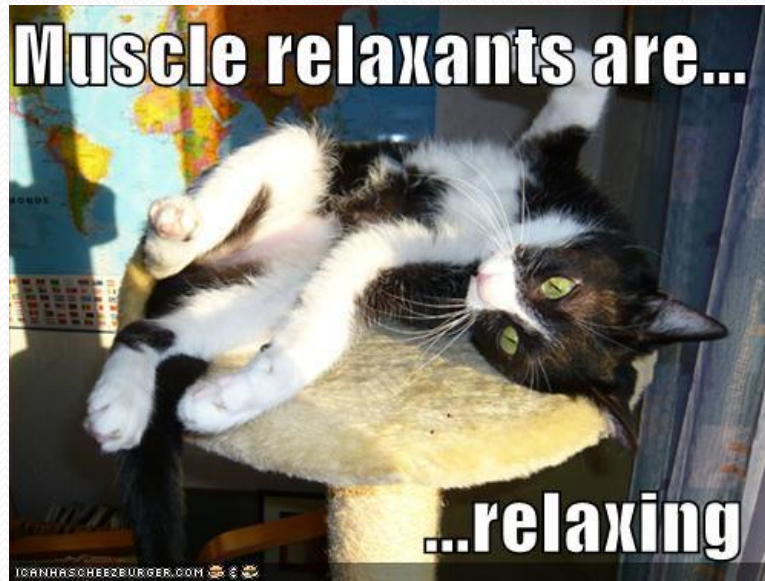




**SANTRAL ETKİLİ KAS  
GEVŞETİCİLER  
(MİYORELAKSAN İLAÇLAR)**

**Meral Tunçbilek**

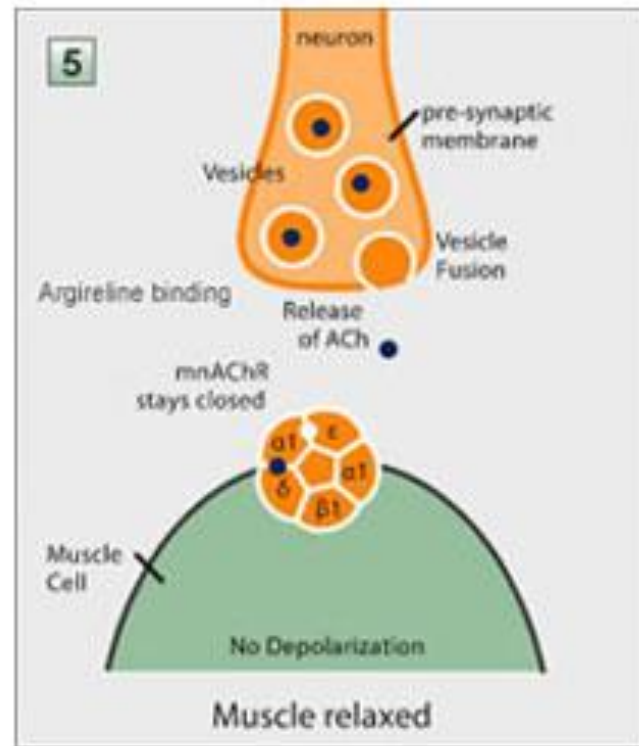
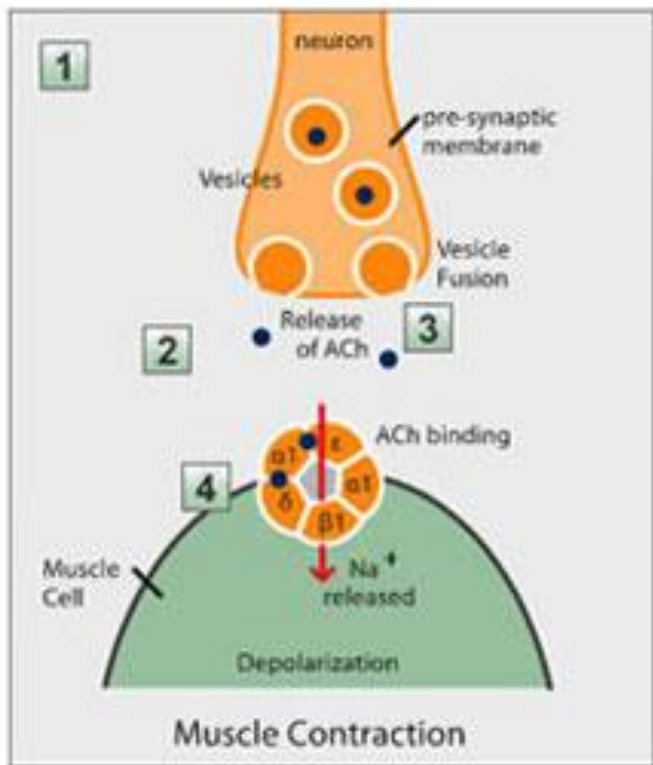


© Original Artist  
Reproduction rights obtainable from  
[www.CartoonStock.com](http://www.CartoonStock.com)



**"WELL, FIRST, I THINK WE'LL CUT BACK ON THOSE MUSCLE RELAXANTS!"**





- \* **Santral etkili kas gevşeticiler**, kas tonüsünü kontrol altında tutarak merkezi sinir sistemini deprese ederler.
- \* Çizgili kaslarda spazm oluşmasına, kas ve iskelet hastalıklarında periferden gelen uyarı kalıbının bozulması veya omurilikteki motor nöronlar üzerinde etkili supraspinal kaynaklı tonüsler arasındaki dengenin bozulması neden olur.
- \* Bu ilaçlar, nöromuskuler kavşakta etki göstermezler ve çizgili kasların bir kısmının tonusunun artmasıyla karakterize olan hastalıkların tedavisinde kullanılırlar.
- \* 1910-Fenoksipropandiol keşfi
- \* 1946-Berger ve Bradly, tesadüfen **mefenezin**'in spinal medullada sinir iletiminin blokajı
- \*1949-Goodman tarafından **benzimidazol** yapısında miyorelaksan aktivite

## Sınıflandırma

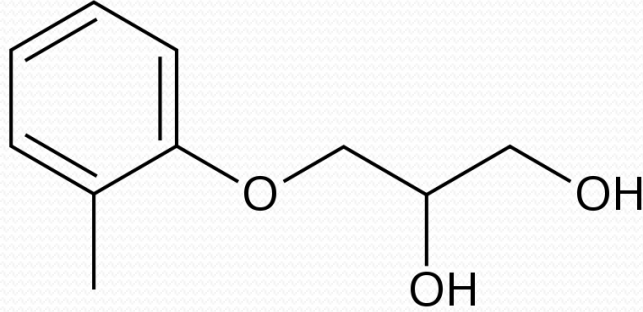
- 1) Propandiol Türevleri
- 2) Benzoksazol Türevleri
- 3) Benzodiazepinler
- 4) Selektif Etkili İlaçlar (Baklofen, Dantrolen)
- 5) Diğer İlaçlar (Tizanidin, Mefenoksalon, Metaksalon, Fenprobamat, Tiyokolşikozid)

## Propandiol Türevleri

- Gliserin'in fenol ile oluşturduğu monoariloksigliserol ve karbamatlarıdır.
- MSS üzerindeki depresan etkileri nedeniyle **sedasyon** yaparlar ve kısmi **tranklizan** etkileri de vardır.

## Mefenezin

Inflazone, Relaxar, Decontractyl

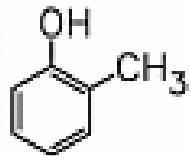


3-(2-Metilfenoksi)-1,2-propandiol

- Bu grup ilaçlar için prototip ve tedavide ilk kullanılan ilaç
- Etki süresi çok kısa ve yan etkileri fazla
- Kullanımı az
- Ağız yoluyla alındığında gastrointestinal kanaldan absorbe olur
- Karaciğerde metabolizasyona uğrar

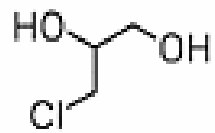
## Mefenezin Sentezi

a

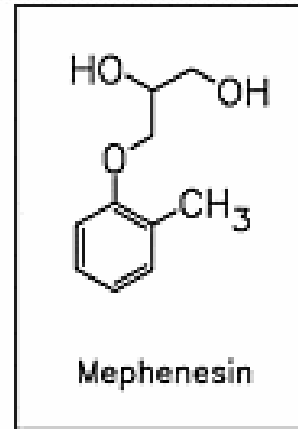


o-cresol (1)

+



3-chloro-1,2-propanediol



Mefenesin

b

1 +



glycidol





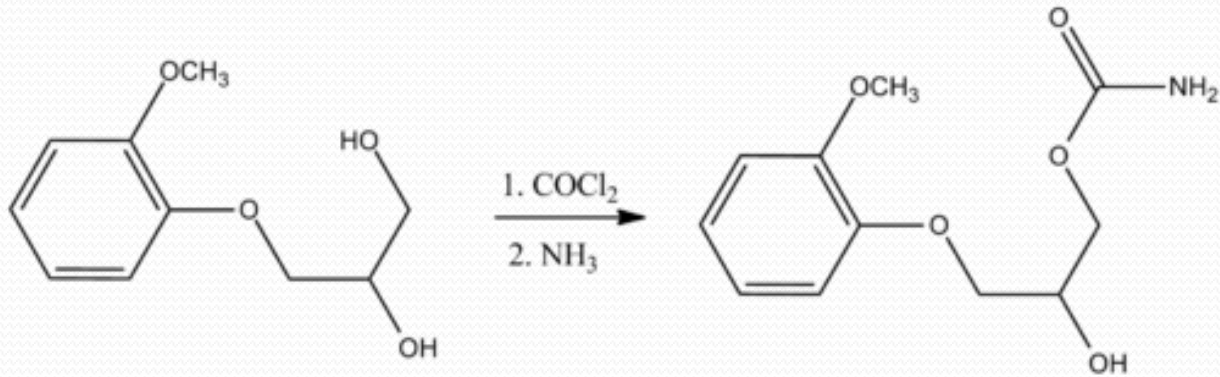
## Mefenezin karbamat



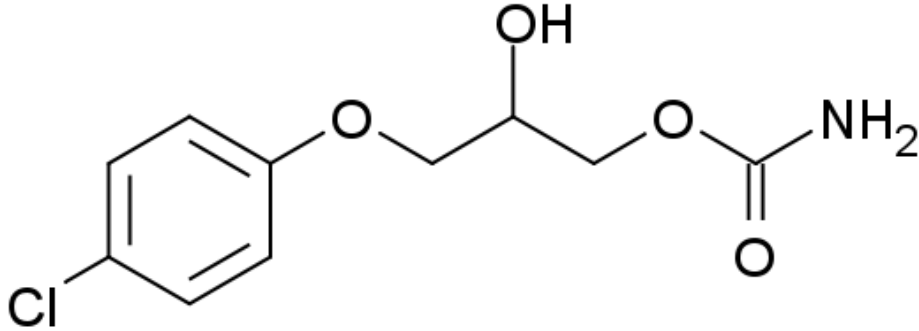
[2-Hidroksi-3-(2-metilfenoksi)propil] karbamat

- Mefenezin'e göre daha yavaş absorbe olur
- Biyotransformasyonu daha yavaş

## Mefenezin karbamat Sentezi



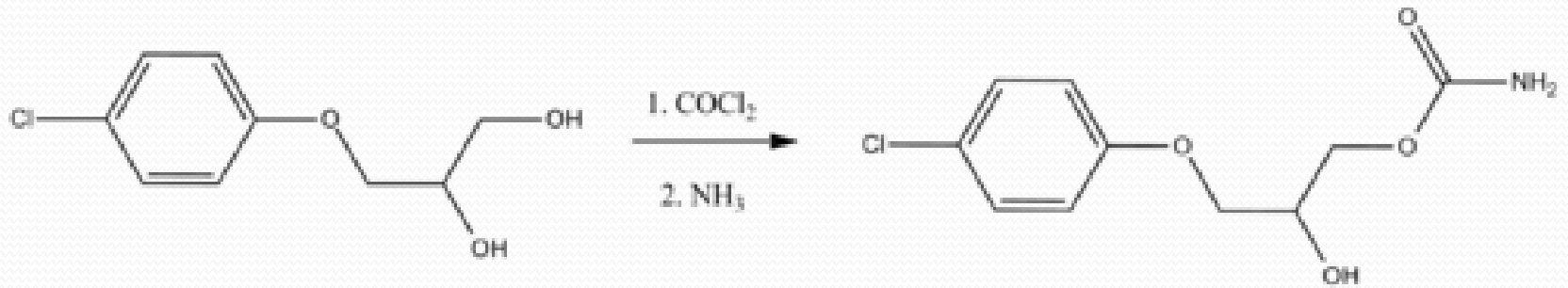
## Klorfenezin karbamat Rinlaxer



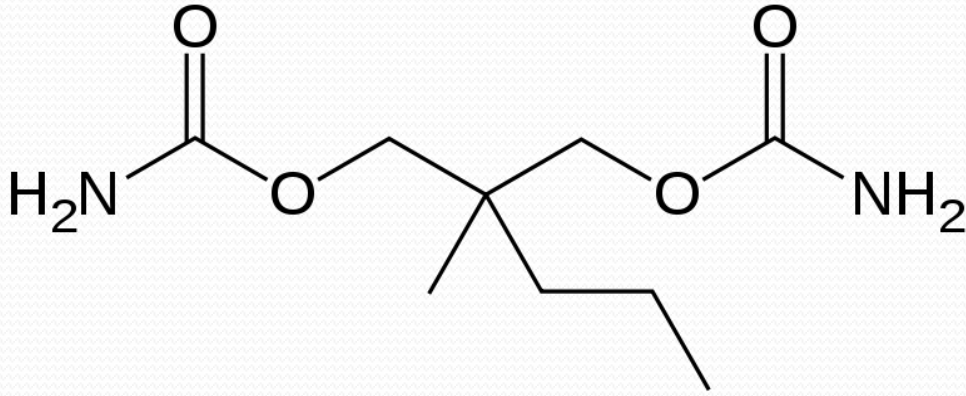
[3-(4-Klorofenoksi)-2-hidroksipropil] karbamat

- Mefenezin'e göre etki süresi daha uzun
- Yan etkileri; ağız kuruluğu, uyuşukluk, baş dönmesi, uykusuzluk ve bulantı

## Klorfenezin karbamat Sentezi



## **Meproamat** Danitrin Forte



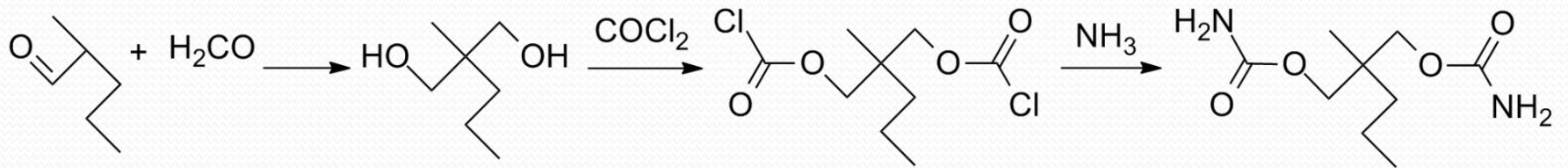
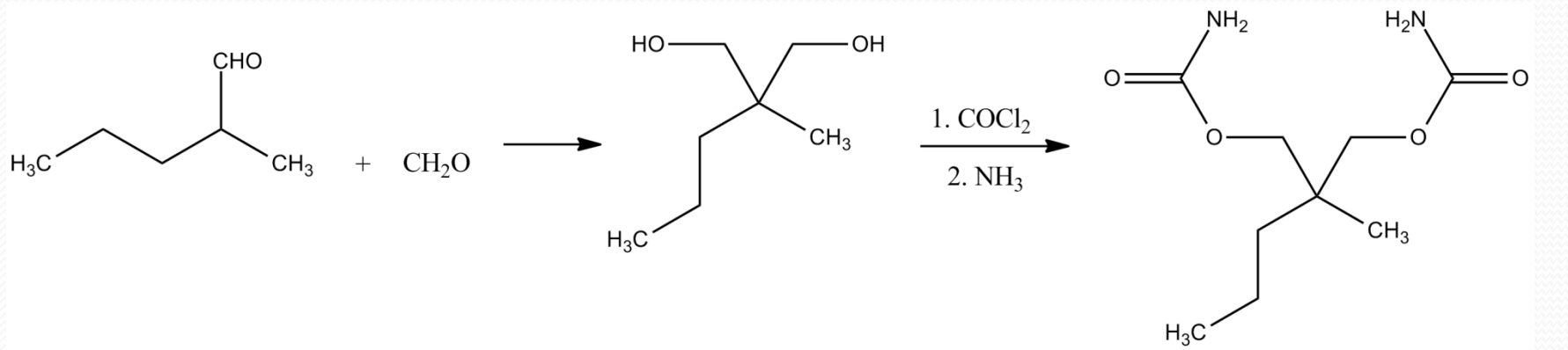
2-Metil-2-propilpropan-1,3-diol dikarbamat  
[2-(Karbamoiloksimetil)-2-metilpentil] karbamat

**Tranklizan** etkisinin yanı sıra **kas gevşetici** etkisi var

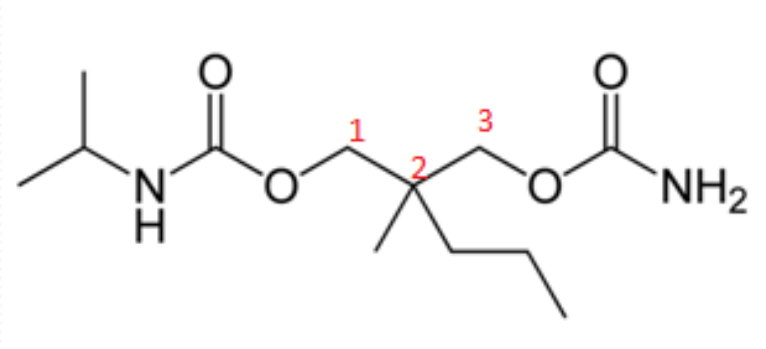
Karaciğerde mikrozomal enzimler tarafından metabolizasyona uğrar

Propil yan zincirinin oksidasyonu ile hidroksi meproamat ve glukuronik asit konjugatları halinde atılır

## Meprobamat Sentezi

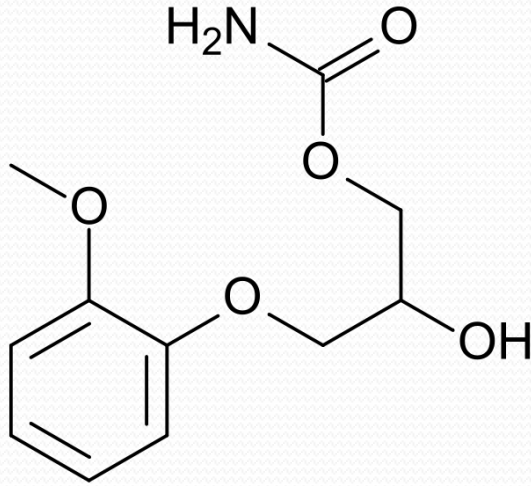


## Karizoprodol Soma, Carisoma



- N-İzopropil-2-metil-2-propilpropan-1,3-diol dikarbamat
- İskelet kası spazmlarında kullanılır
- Hafif **analjezik** etkisi nedeniyle spazm ağrılarını da giderir
- Karaciğer mikrozomal enzimler ile metabolize olur
- Yan etkileri; sedasyon, uyuşukluk, cilt döküntüleri

**Metokarbamol** Miyoreks, Myorel

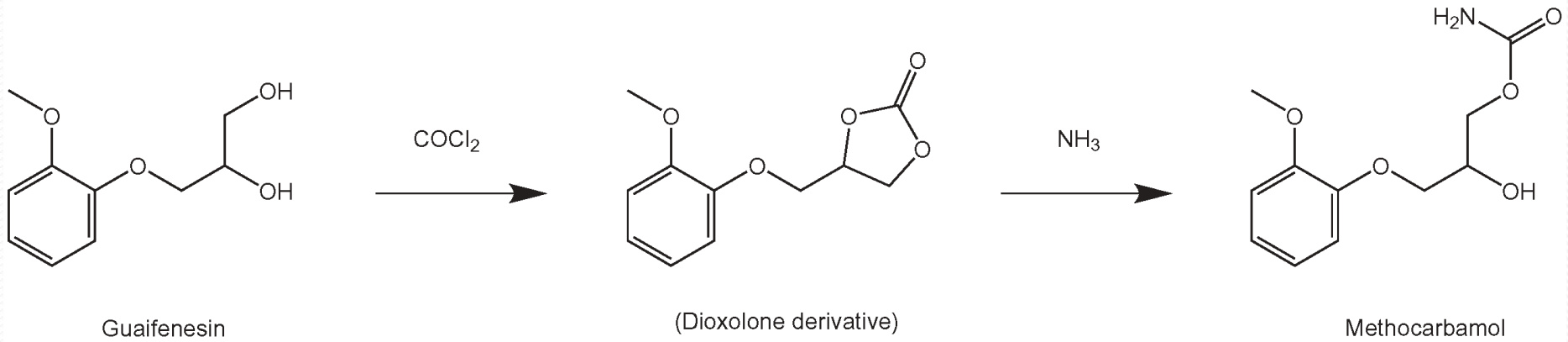


[2-Hidroksi-3-(2-metoksifenoksi)propil] karbamat

- Kas ve iskelet kası spazmlarında etkili
- Yan etkileri; uyuşukluk, baş dönmesi, bulantı, allerjik belirtiler

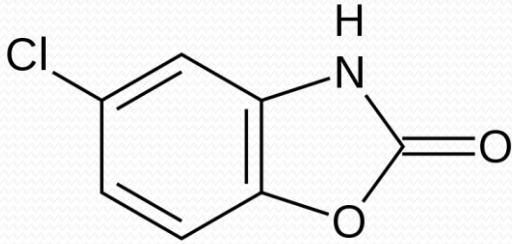


## Metokarbamol Sentezi



## Benzoksazol Türevleri

**Klorzoksazon** Paraflex, Parafon, Mepadol, Muskazon



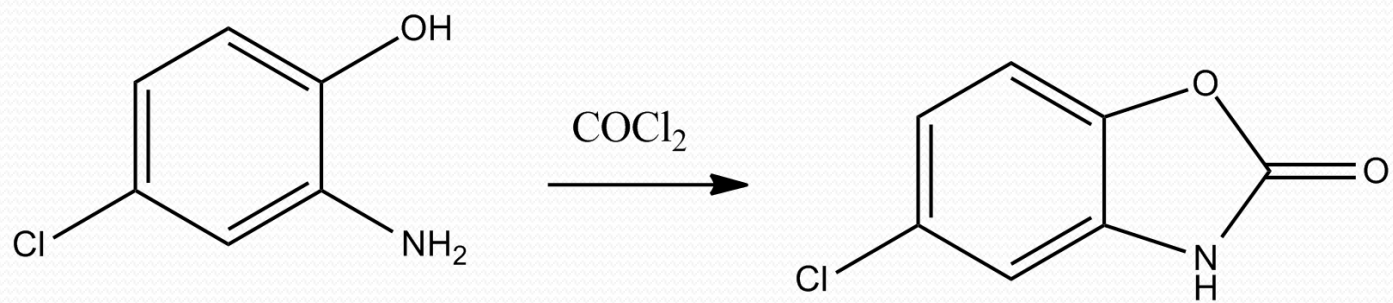
5-Kloro-2-benzoksazolinon

İskelet kaslarında görülen **çizgili kas spazmlarına** karşı aspirin veya diğer analjezik ilaçlarla birlikte kullanılır.

Vücuttan eliminasyonu hızlıdır bu nedenle etki süresi kısa

Hepatotoksik

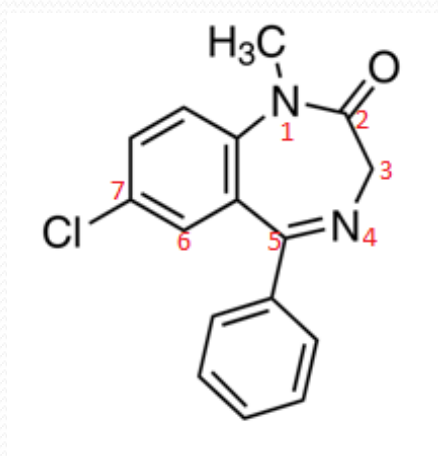
## Klorzoksazon Sentezi



## Benzodiazepinler

- Sedatif ve hipnotik ilaçlar
- Tranklizan
- Bazı benzodiazepin türevleri merkezi etkili adele gevşetici

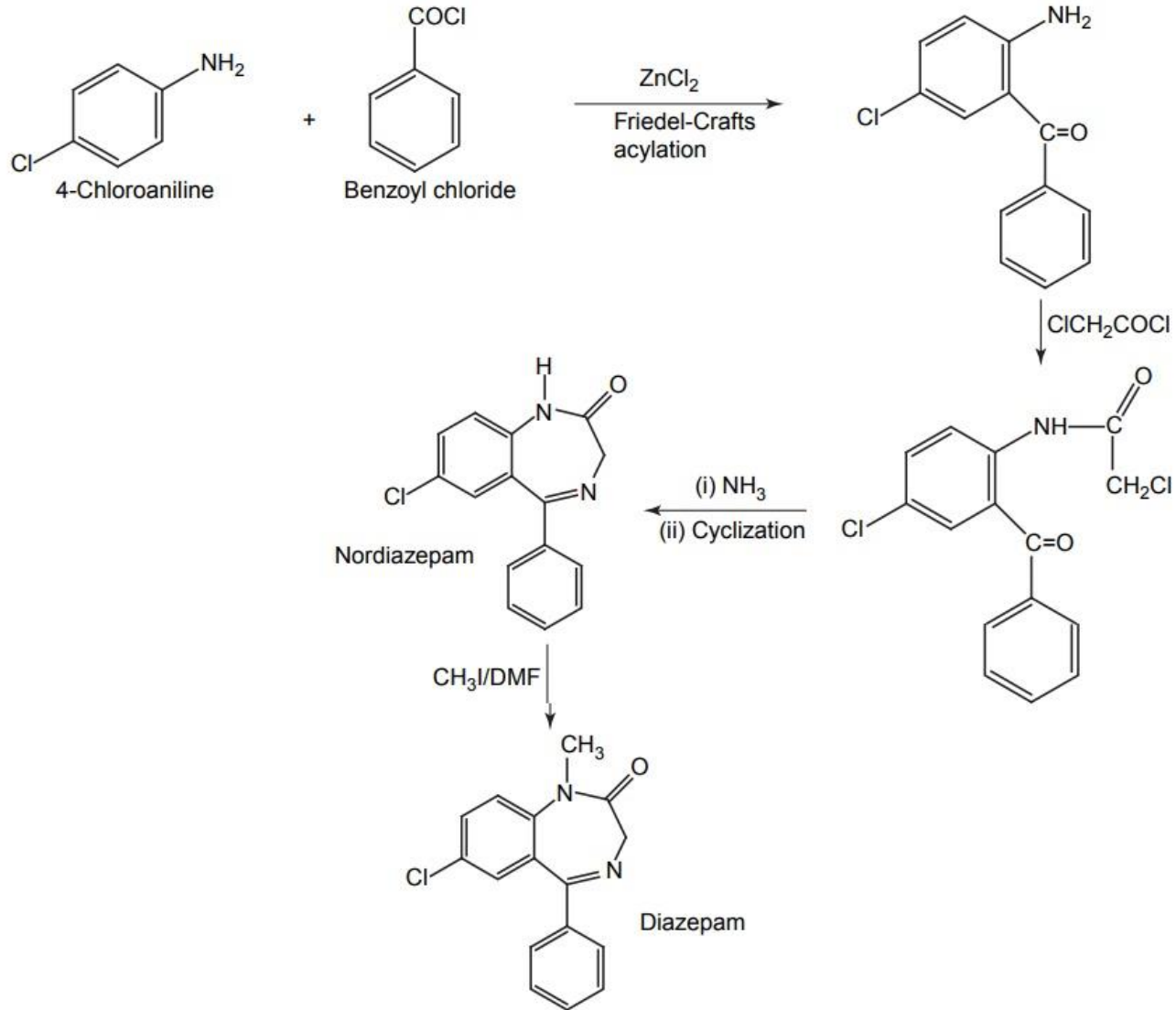
**Diazepam** Diapam, Diazem, Lizan, Nervium



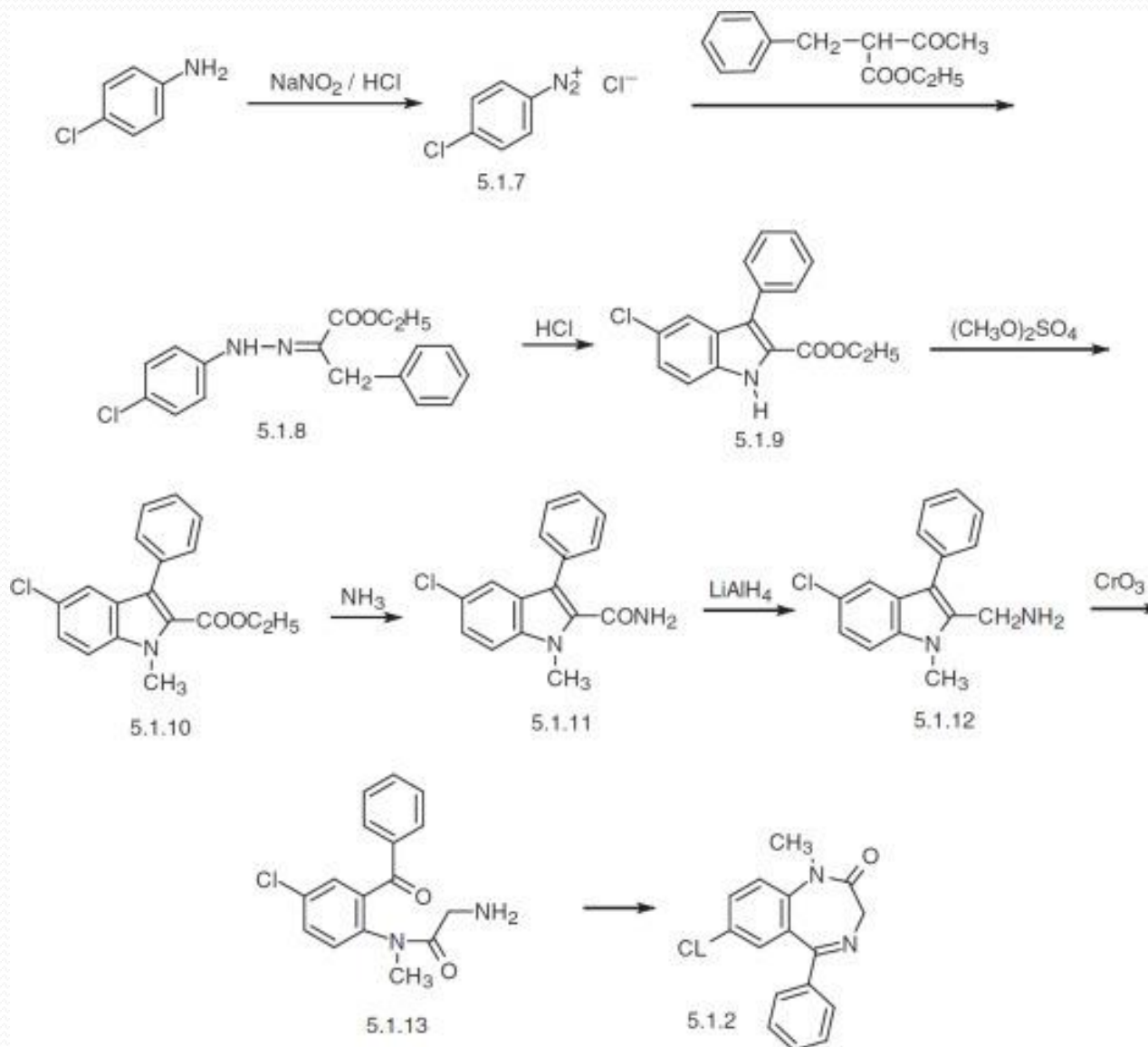
7-Kloro-1,3-dihidro-1-metil-5-fenil-2H-1,4-benzodiazepin-2-on

- Diazepam, vücutta yavaş metabolize edilmesi nedeniyle etki süresi uzun olan bir benzodiazepin türevi anksiyolitik ilaçtır ve **kas gevşetici** olarak da kullanılır.
- Ayrıca belirgin **antikonvülsan** etkinlik gösterir.
- Diazepam, beyin ve omurilik hastalıklarında ortaya çıkan çizgili kas spastisitelerinin tedavisi amacıyla en sık kullanılan kas gevşetici ilaçtır.
- Kas-iskelet kaynaklı kas spazmlarına karşı da etkilidir.
- Çizgili kas gevşemesi yapan dozlarda sedasyon ve uyuşukluk gibi yan etkileri vardır.

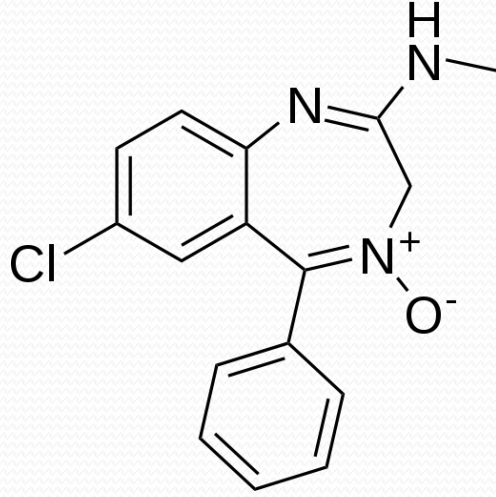
## Diazepam sentezi



## Diazepam sentezi



**Klordiazepoksit** Librax, Libkol, Libroksil



7-kloro-2-metilamino-5-fenil-3H-1,4-benzodiazepin-4-oksit

- Çizgili kas spazmlarında kullanılan uzun etkili türev
- Diazepam'a göre daha fazla sedasyon ve uyuşukluk gözlenmiştir.



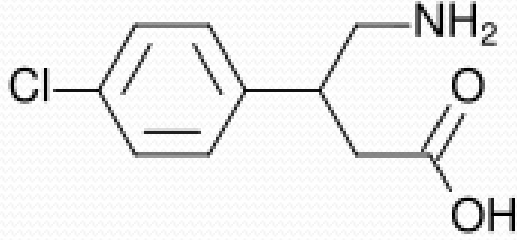
## Selektif Etkili İlaçlar

- SSS'nde yaygın depresyon yapmayan  
(Sedatif etkileri zayıf/hiç olmayan)

**Baklofen** GABAB reseptör agonisti

**Dantrolen** Çizgili kas hücrelerini özel bir mekanizmayla etkiler

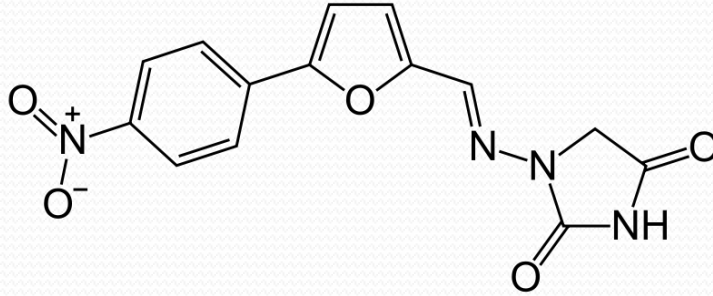
## **Baklofen** Lioresal



### 4-Amino-3-(4-klorofenil)butanoik asit

- MSS'de inhibitör mediyatör GABA'nın türevidir. GABA sistemik uygulandığında MSS'ne geçemez. Baklofen geçer.
- Kas gevşetici etkisi omurilik üzerindedir.
- Merkezi kas gevşetici etkisinden kısıtlı olarak yararlanır.
- Multipl skleroz ve omurilik lezyonlarına bağlı spazmlarda kullanılır
- Mide-barsak kanalında absorbe olur
- %70 böbreklerden değişmeden atılır
- Yan etki; uyuşukluk, baş dönmesi, hipotansiyon, bulantı

## Dantrolen

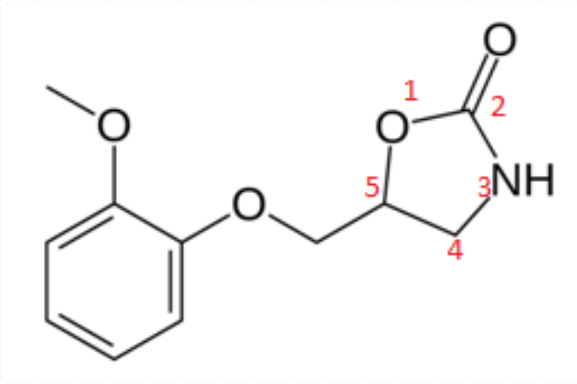


1-[[5-(4-nitrofenil)-2-furil]metilidenamino]imidazolidin-2,4-dione

- \*Kullanılış yerleri bakımından SEKG'e benzer.
- \*Etki mekanizması ve yeri bakımından SEKG ve NMBE'den ayrılır.
- \*Çizgili kasları, kas düzeyindeki primer etkisiyle gevşetir. Çizgili kaslarda **kalsiyum salınımını inhibe eder**, eksitasyon-kontraksiyon keneti bozular; çizgili kaslarda gevşeme meydana gelir.
- \*Beyin (inme gibi) ve omurilik lezyonları nedeniyle oluşan nörolojik hastalıklardaki kronik spastisiteye karşı kullanılır.

## Diğer İlaçlar

**Mefenoksalon** Dorsifleks, Dorsilon, Seskafleks



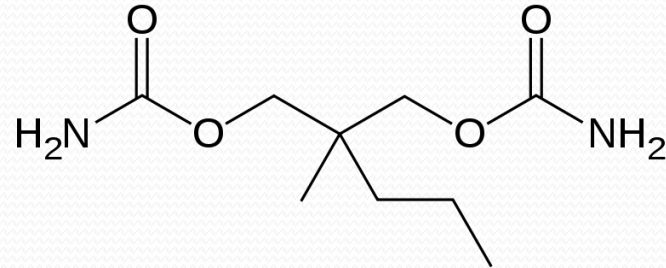
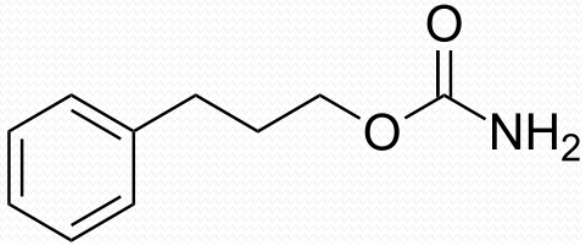
5-(2-Metoksifenoksi)metil-2-oksazolidinon

- İskelet kaslarındaki spazm ve ağrılı krampları gevşetir.
- Sedatif etkisi de vardır.

**Fenprobamat** Gamakuil, Kuilil, Gamaflex, Kuiflex

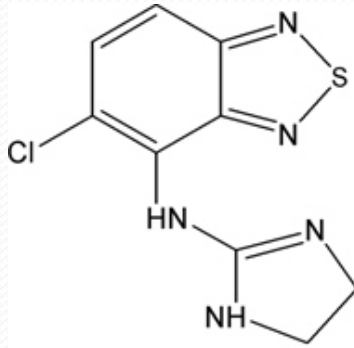
3-Fenilpropanol karbamat

Oral veya rektal yoldan kullanılan ve genel özellikleri meprobamat'a benzeyen santral etkili bir bileşiktir.



**Meprobamat**

## **Tizanidin** Sirdalud, Devalud



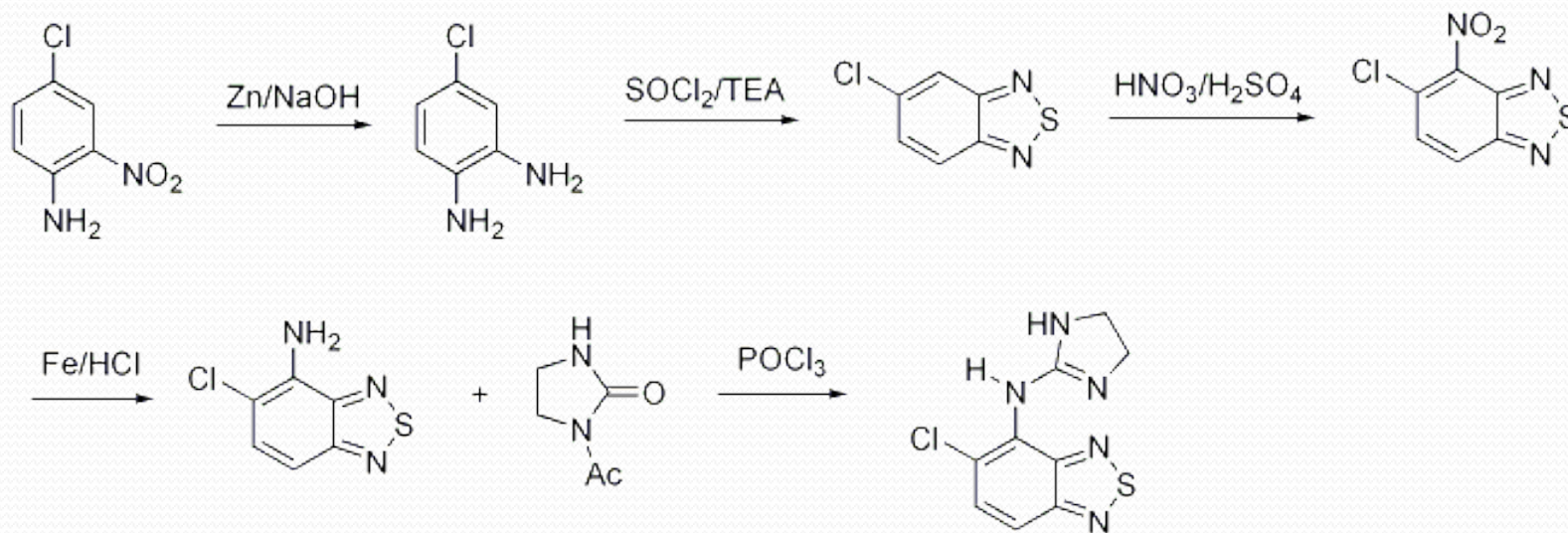
5-Kloro-4-(2-imidazolin-2-il-amino)-2,1,3-benzotiyadiazol  
5-Kloro-N-(4,5-dihidro-1*H*-imidazol-2-il)-2,1,3-benzotiyadiazol-  
4-amin

Benzotiyadiazol türevi santral etkili kas gevşetici ilaçtır.

Esas olarak **omurilik düzeyindeki polisinaptik yolları inhibe ederek** çizgili kas tonusunu azaltır.

Spinal ve supraspinal lezyonlara bağlı kas spastisitelerine karşı etkilidir.

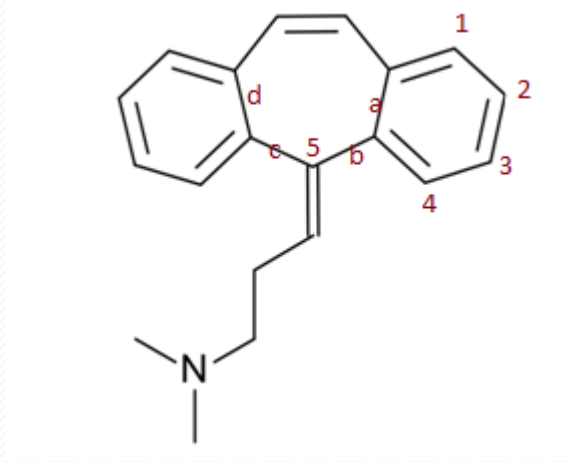
## Tizanidin Sentezi



*Huaxua Shiji*, 2003, 25, 115

Jpn. Kokai Tokkyo Koho, 17258251, 09 Oct 1995

## Siklobenzaprin

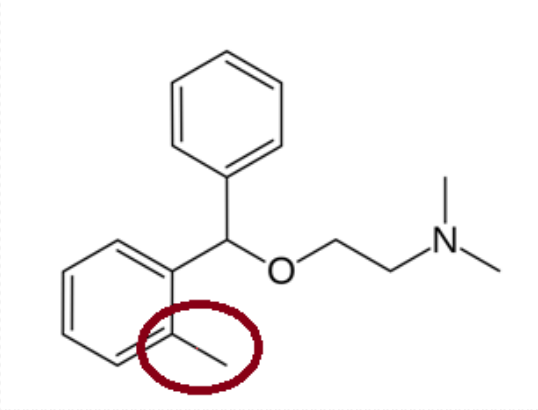


3-(5H-dibenzo[a,d]siklohepten-5-iliden)- *N,N*-dimetil-1-propanamin

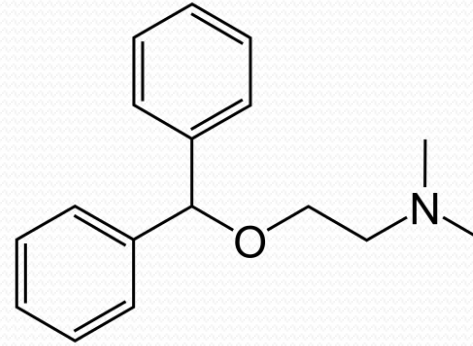
Yapısı trisiklik antidepresanlara benzeyen santral etkili bir kas gevşeticidir. Kas-iskelet sistemi ile ilgili ağrılı kas spazmlarının tedavisinde kullanılır.



## Orfenadrin



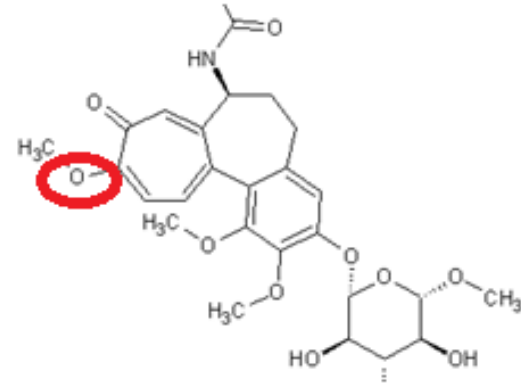
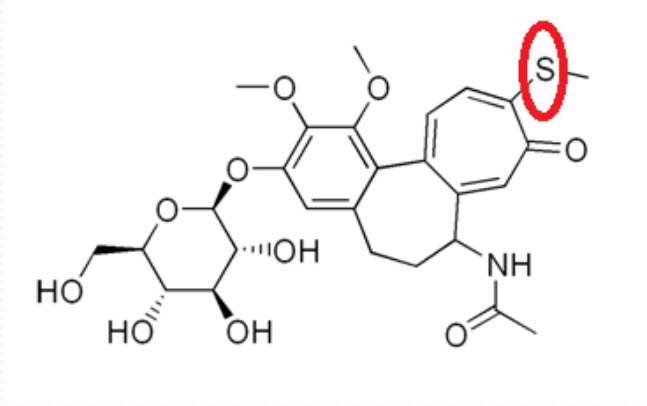
## Difenhidramin



*N,N*-dimetil-2-[(2-metilfenil)-fenil-metoksi]-etanamin

Oral veya paranteral kullanılır. **Antihistaminik difenhidramin**'in *o*-**metil analogu**dur. Kas iskelet sistemi ile ilgili akut ağrılı durumlarda yardımcı tedavi olarak kullanılır.

## Tiyokolşikozit



kolşikozit

*N*-[(7*S*)-3-(β-D-Glukopiranoiloksil)-1,2-dimetoksi-10-(metilsulfanil)-9-okso-5,6,7,9-tetrahidrobenzo[*a*]heptalen-7-il]asetamid

Doğal bir ilaç olan **kolşikozitin** **kükürtlü yarı sentetik türevidir**. Ağrılı kas spazmlarının semptomatik tedavisi için lokal, oral veya paranteral kullanılır.

**\*Piyasadan çekilen preparatları mevcut (2021)**