

Yatıştırıcı ve Uyku Doğurucu İlaçlar

Prof.Dr. Ender YARSAN

A.Ü.Veteriner Fakültesi Farmakoloji ve Toksikoloji
Anabilim Dalı Öğretim Üyesi

- ✘MSS'nin ılımlı–hafif–orta derecede baskı altına alınması
- ✘Etkileri doza bağlıdır; hafif yatışma halinden derin anesteziye kadar beyini baskı altına alırlar
- ✘Ruhi gerginlik, endişe, korku, huzursuzluğun giderilmesi
- ✘Uyku dozunun 1/3–1/6'sı miktarlarda yatışma hali yaparlar
- ✘Uyku dozunun 5–10 katı miktarlarda ölümlle sonuçlanan uzun süreli anestezi

Nöroleptik ve trankilizanlardan fakları

- ✘Uyku ilaçlarının *nöroleptik* etkileri yoktur
- ✘*Trankilizan* etkileri vardır ve trankilizan ilaçlar gibi bağımlılık yaparlar
- ✘Ağrı kesici etkileri yoktur

✘Tüm hayvanlarda;

- Yatışma yapıcı
- Çırpınma önleyici
- Kes gevşetici
- Endişe giderici
- Genel anestezik

✘Uykunun fizyolojisi

- Hızlı göz hareketleri
- Hızlı göz hareketleri olmayan dönem

✘Uyku ilaçlarının farmakokinetiği

- Ağızdan uygulanırlar, sindirim kanalından kolay hızlı emilim

- Artık etki
- ME etkinliğini artırır

✘Bağımlılık ve Tolerans

- Psşik ve fiziki bağımlılık

Yatıştırıcı ilacın özellikleri

- Uyuşukluk ve uyuklama yapmamalı,
- Çevreye ilgiyi ve çevreden gelen uyarılara cevap veya tepki verme yeteneğini azaltmamalı,
- Kişinin zindeliğini günlük işlerinde verimlilik ve güvenliğini bozabilecek ölçüde düşürmemeli,
- Bağımlılık yapmamalıdır

Uyku ilacının özellikleri

- Etkisi çabuk başlamalı ve latent uyku dönemini kısaltmalı,
- Normal uyku kalıbının sırası ve sürelerinde belirgin bir değişiklik yapmamalı,
- Etkisi kişiyi yeterli bir süre uyutacak kadar uzun ama artık etki bırakmayacak kadar kısa sürmeli,
- Sağaltım güvenliği (uykuya ve ölüme yol açan miktarları arasındaki mesafe) büyük olmalı,
- Bağımlılık yapmamalı ve böylece kötü amaçla kullanılmaya elverişli olmamalıdır

Sınıflandırma

✘Barbitüratlar:

- Pentobarbital, amobarbital, allobarbital, siklobarbital, butabarbital, vinbarbital

✘Aldehidler:

- Paraldehid, kloralhidrat

✘Alkololler:

- Etilalkol, klorobutanol, amilenhidrat, etklorvinol gibi

✘Benzodiazepinler:

- Diazepam gibi

✘Kinazolinler:

- Metakualon, meklolon gibi

✘Piperidindionlar:

–Glutetimid, metiprilon gibi

✧**Monoüreidler:**

–Karbromal, kapurid gibi

✧**Diğerleri:**

–Zolpidem, antihistaminikler, atropin vb maddeler, klometiazol, etinamat, etomidat, meprobamat, benzoktamin, ksilazin gibi

Barbitüratlar

✧**Üre + malonik asit**

–Barbitürik asit (malonilüre)

Sınıflandırma

✧**Etki sürelerine göre**

- Uzun etkili olanlar: ≥ 6 saat: Çırpınma önleyici–yatıştırıcı
- Orta süreli etkili olanlar: 3–6 saat: Uyku ilacı
- Kısa etki süreli olanlar: < 3 saat: Anesteziye giriş
- Çok kısa etki süreli olanlar: 20 dk: Anesteziye giriş

✧**Yapılarına göre**

- Tiyo barbitüratlar: Tiyopental gibi
- Okso barbitüratlar: Pentobarbital gibi

•**Farmakokinetik**

- Ağız yoluyla uygulanırlar
- Kısa etki sürelerinde emilme 30 dk
- Uzun etki sürelerinde 30–60 dk
- Vücutta yeniden dağılım
- Karaciğerde ME etkinliğini artırır

•**Etki şekilleri**

- Yağ/su dağılım katsayıları büyük
- GABA–GABA reseptörü–Klor kanalı
- Klor kanallarını doğrudan etkileyerek

✧**Etkileri**

- Küçük dozlarda yatışma hali, orta dozlarda uyku ve büyük dozlarda anesteziye yol açarlar.
- Çırpınma önleyici etkileri vardır; bazılarında (fenobarbital gibi) bu etki kendilerine özeldir.
- Solunum merkezini ileri derecede baskı altına alırlar.
- Artık etkileri vardır.

–Ağrı kesici etkileri yoktur; hatta, küçük dozlarda ağrının algılanmasını kolaylaştırırlar.

–Plasentayı kolay geçerler.

–Çizgili kasları hafif derecede gevşetirler

- Sağaltım indeksleri dar ilaçlar
- Tehlikeli ilaçlar olarak kabul edilirler
- İlaç etkileşmeleri
- ME etkinliğini artırmalarıyla ilgili

•Fenobarbital

•Barbital

•Mefobarbital

•Amobarbital

•Pentobarbital

•Sekobarbital

Aldehidler

•Kloral türevleri

•Artık etki ve olumsuz etkileri önemsiz düzeyde

Kloralhidrat

•Genel anestezi olarak

Paraldehid

•Değişmemiş halde (%10–30)

akciğerlerden atılır

•Solunum havası kokar

Benzodiazepinler

•Tranklizan ilaçlardır

•Hafif yatışma hali, uyuşukluk, uyku ve motor faaliyetlerde bozulma

•Sağaltım güvenlikleri daha iyidir

•Barbitüratlar kadar tolerans gelişmez

•Artık etkileri ve kötüye kullanılmaları

Diazepam;

- Kedi ve köpeklere ağızdan, Dİ yolla 1–2 mg/kg

Kinazolinler

•Metakualon

- Yatıştırıcı, uyku doğurucu, çarpınma önleyici
- Kendini iyi hissetme hali oluşturur

Piperidindionlar

- Glutemid, Metilprilon

Alkoller

- Etil alkol yatıştırıcı–uyku doğurucu
- Klorbutanol
- Etklorvinol

Diğer ilaçlar

- Zolpidem, antihistaminikler, ksilazin

Uyku ilaçlarının genel kullanım yerleri

- ⌘Yatıştırıcı, kas gevşetici, endişe giderici, çarpınma önleyici, uyku doğurucu, genel anestezi
- ⌘Küçük dozlarda yatıştırıcı, orta dozlarda (yatıştırıcı dozun 3–6 katı) uyku doğurucu, yüksek dozlarda anestezi