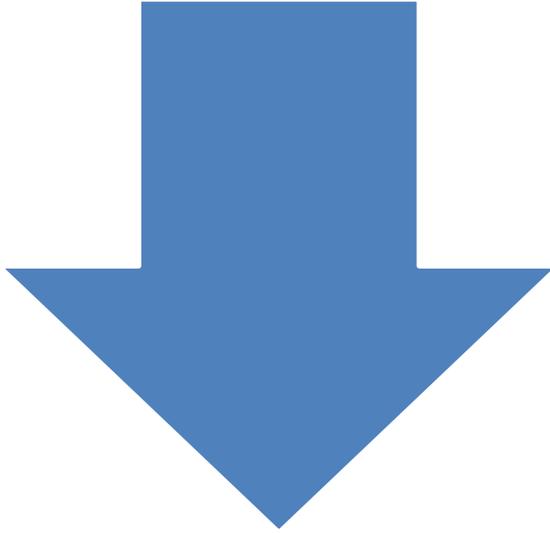


Бронхолитики

- **Бронхолитики** — фармакологическая группа симптоматических лекарств, непосредственно снимающих бронхоспазм, и применяющиеся при лечении бронхиальной астмы и хронической обструктивной болезни лёгких и некоторых других заболеваниях.

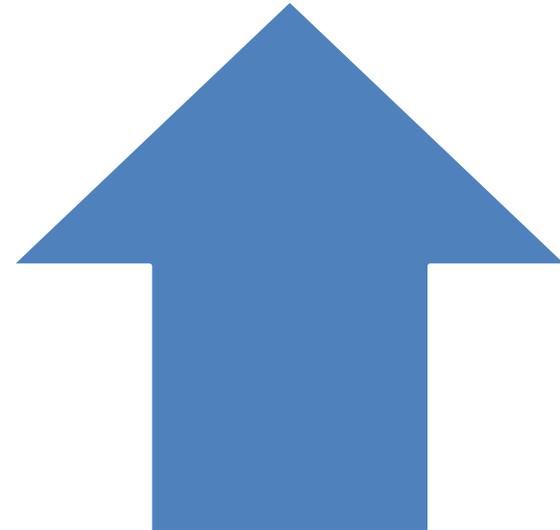


Бронхолитики нейротропного действия:

- а) адренергические – β_1 и β_2 – адреномиметики
 - неселективные - изопреналин (изадрин), орципреналин (астмопент, алупент).
 - селективные - β_2 – адреномиметики
 - фенотерол (беротек), сальбутамол (вентолин, саламол), тербуталин и др
- б) холинергические – М – холиноблокаторы
 - селективные - ипратропия бромид (атровент), тиотропия бромид.



Бронхолитики миотропного действия
–(ингибиторы фосфодиэстеразы - метилксантины) – аминофиллин (эуфиллин), теофиллин (теотард)



α -адреномиметики

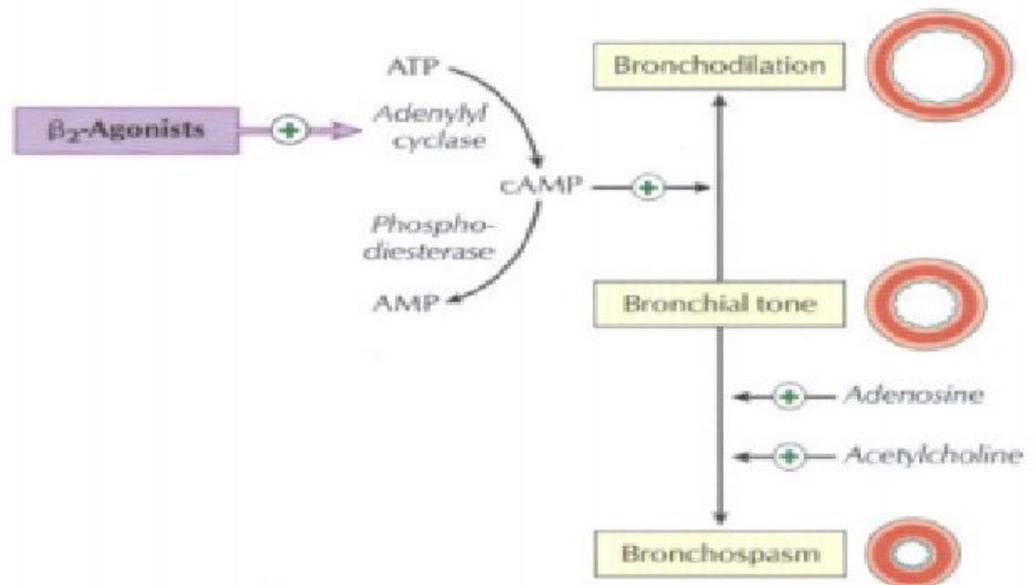
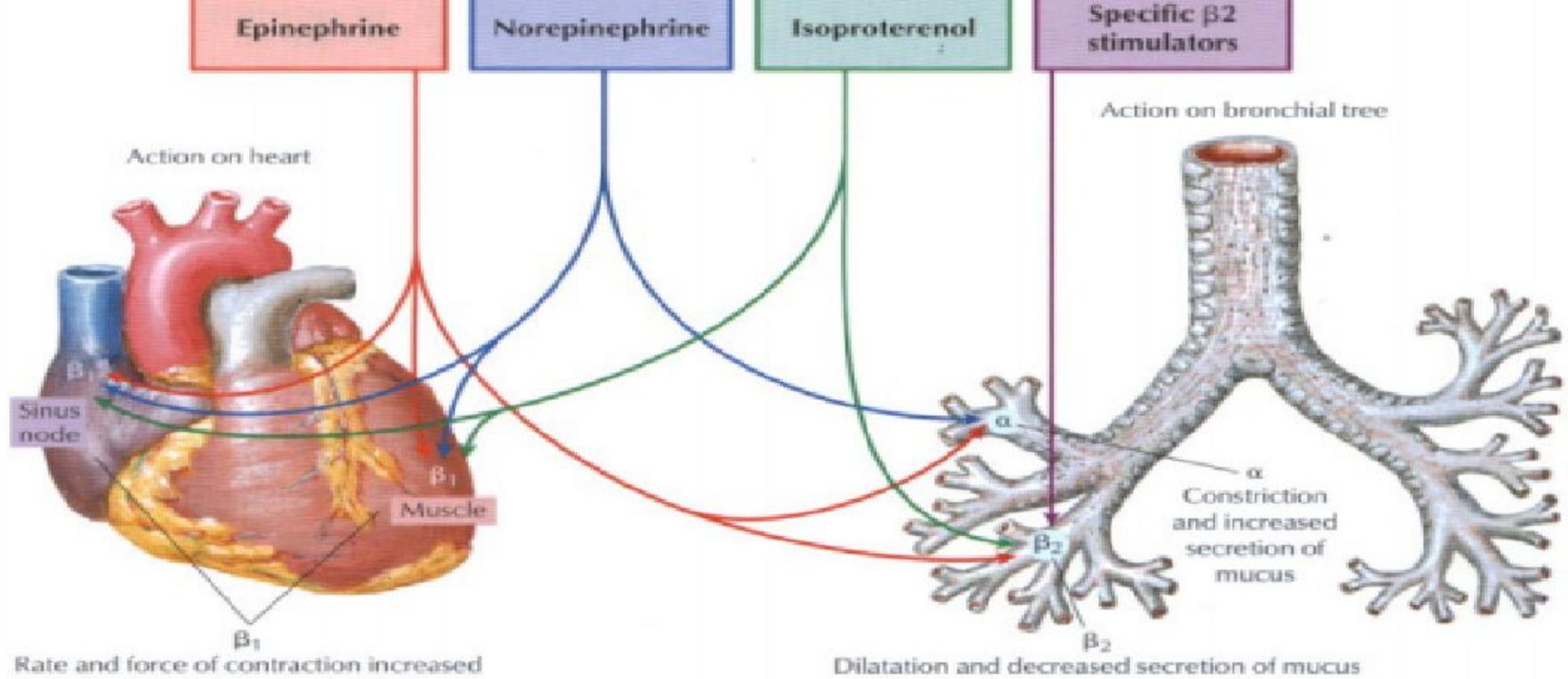
- Норадреналин Агетат. Форма выпуска: р-р в ампулах. Применяется для лечения бронхиальной астмы.



Тонус гладких мышц бронхов регулируется различными рецепторами

β₂-адренорецепторы. Их активация приводит к расширению бронхов. β₂-рецепторы функционируют через активацию аденилатциклазы, что приводит к увеличению в гладкомышечной клетке уровня цАМФ, снижение которого приводит к расслаблению гладких мышц бронхов.

М-холинорецепторы. Их активация выделяет ацетилхолин из окончания блуждающего нерва ацетилхолин приводит к активации гуанилатциклазы, которая переводит гуанилаттрифосфат в цАМФ. В результате повышается вход кальция в клетку, активируются протеинкиназы с фосфорилированием внутриклеточных белков, усиливается взаимодействие актина и миозина и возникает бронхоспазм.



F. Netter M.D.
J. Perkins
 MS, MBA
 © IBN
 1997

- **Бета 2-адреномиметики**
- Наиболее часто для лечения бронхоспазма применяют ингаляционные адреномиметики, особенно селективные по отношению к бета 2-адренорецепторам.
- Они эффективно устраняют практически все виды бронхоспазма.
- Чаще используются в виде ингаляций.

Применение:





Сальбутамол.
Форма выпуска:
аэрозоль для
ингаляций.
Применяется
для купирования
приступов
бронхиальной
астмы.

Изадрин. Форма
выпуска: таблетки,
р-р во флаконах.

Беротек. Форма
выпуска:
аэрозольный
баллончик,
флакон-
капельница из
темного стекла.



ПЭ

При передозировке появляются аритмии, увеличивается потребность миокарда в кислороде.



Характерно развитие синдрома «рикошета».



Клинически проявляется вначале уменьшением времени эффективной бронходилатации, в последующем - бронхоспазмом на фоне ингаляции этих препаратов.

- М- холиноблокаторы
- Ипратропиума бромид = Атровент
- Начало действия через 30 минут,
продолжительность действия 3-6 часов.

Применение: Профилактика и лечение различных бронхоспастических состояний. Не рекомендуется применять в монотерапии для экстренного купирования удушья, т.к. эффект развивается медленнее, чем β – адреномиметиков.

Побочные эффекты: сухость во рту, повышение вязкости мокроты.

Противопоказания: закрытоугольная глаукома и беременность

- Беродуал. Форма выпуска: аэрозоль для ингаляций, р-р для ингаляций.
Применяется для лечения бронхиальной астмы, ХОБЛ, сужении бронхиального дерева при остром бронхите .
- Вагос. Форма выпуска: р-р для ингаляций, капсулы с порошком.
Применяется для лечения ХОБЛ, бронхиальной астмы любой тяжести, бронхоспазма

Бронхолитики миотропного действия –(ингибиторы фосфодиэстеразы - метилксантины)



Теofilлин

- Назначается для систематического лечения бронхиальной астмы и для профилактики приступов бронхоспазма внутрь в таблетках (4 раза в сутки).
- Лучший эффект часто наблюдается при применении препарата в виде ректальных свечей, так как при этом пути введения он в малой степени подвергается метаболизму в печени.

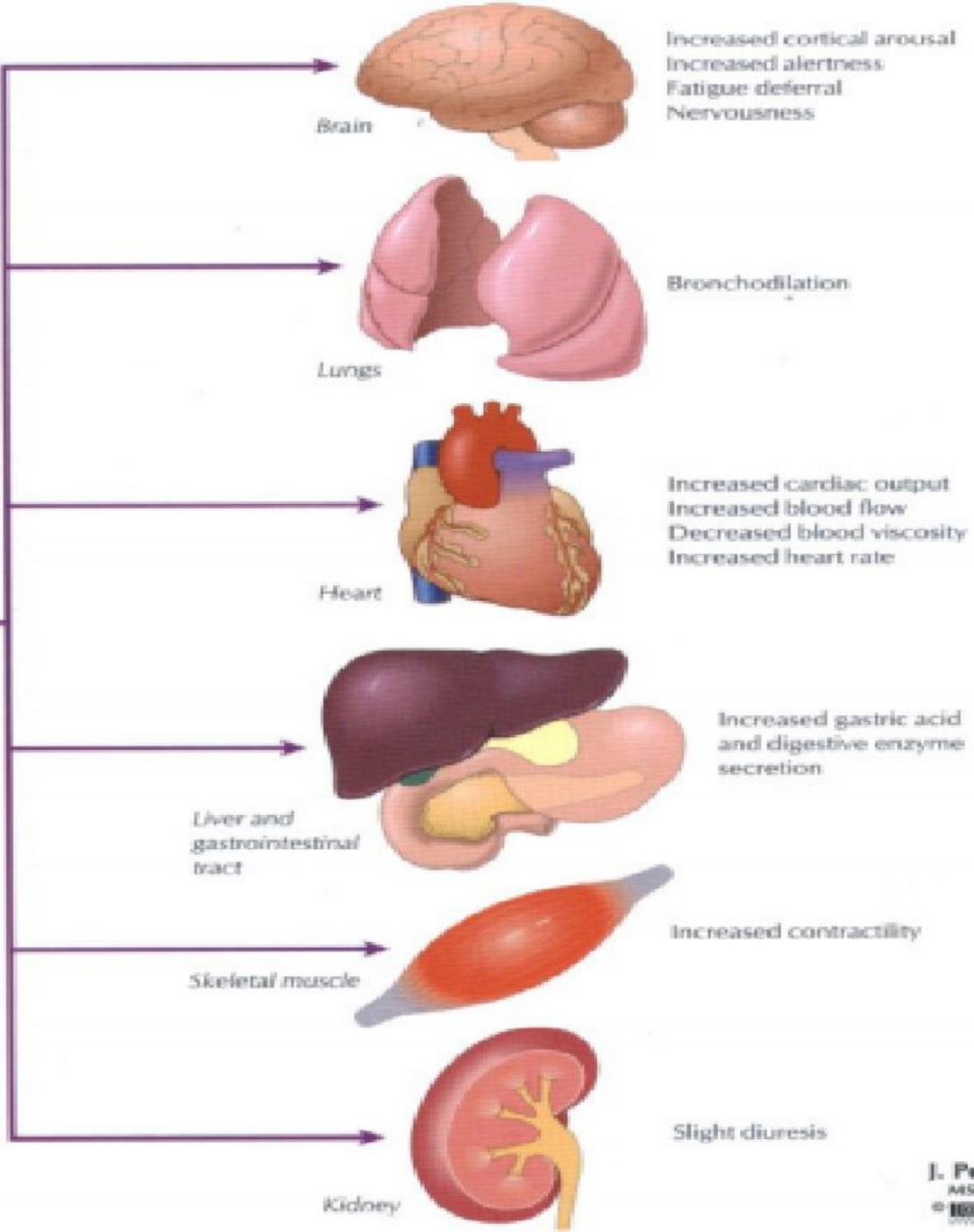
Применение:

- Как лечебное и профилактическое средство при бронхиальной астме.
- Побочные эффекты:
- В отдельных случаях отмечаются: изжога, тошнота, рвота, понос, головная боль.
- При передозировке препарата могут возникнуть эпилептоидные припадки.
- Для предупреждения подобных побочных явлений не рекомендуется применять препарат длительно.

Противопоказаны:

- При гиперфункции ЩЖ, остром инфаркте миокарда, субаортальном стенозе, экстрасистолии, эпилепсия, беременность. Осторожно при ЯБЖ и 12- перстной кишки.
- Препараты теofilлина пролонгированного действия: теофедрин Н, теотард, теопэк, эуфилонг и др.

Methylxanthines



- **М-ХОЛИНОЛИТИКИ**
- В регуляции бронхиального тонуса большое значение имеет парасимпатическая нервная система.
- По блуждающему нерву передаются влияния, вызывающие сокращения гладких мышц бронхов.

- Холинергические рецепторы тесно связаны с ирритантными, холодовыми и другими рецепторами.
- Поэтому при их блокаде происходит не только бронходилатация, но и предупреждается появление бронхоспазма в ответ на вдыхание мелкодисперсной пыли, при контрастном изменении температуры вдыхаемого воздуха.

- Наиболее часто применяют ингаляционные холинолитики.
- Препараты плохо растворимы в липидах, практически не проникают через биологические мембраны и не всасываются с поверхности слизистой оболочки бронхов

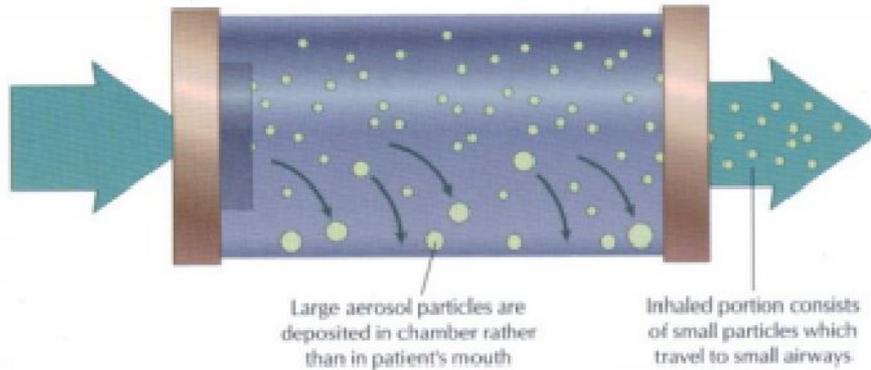
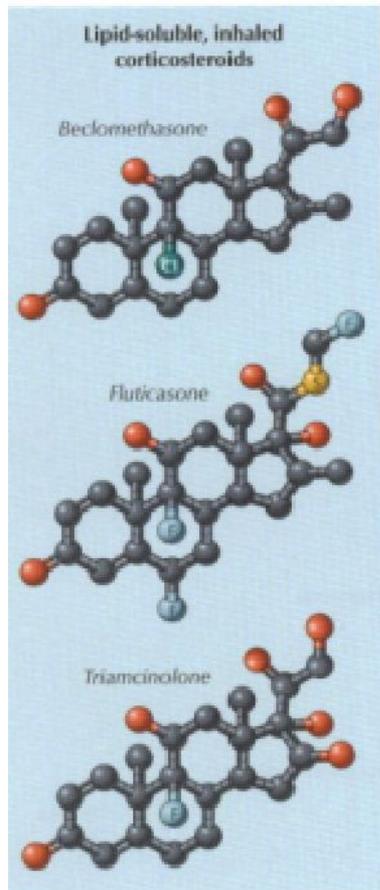
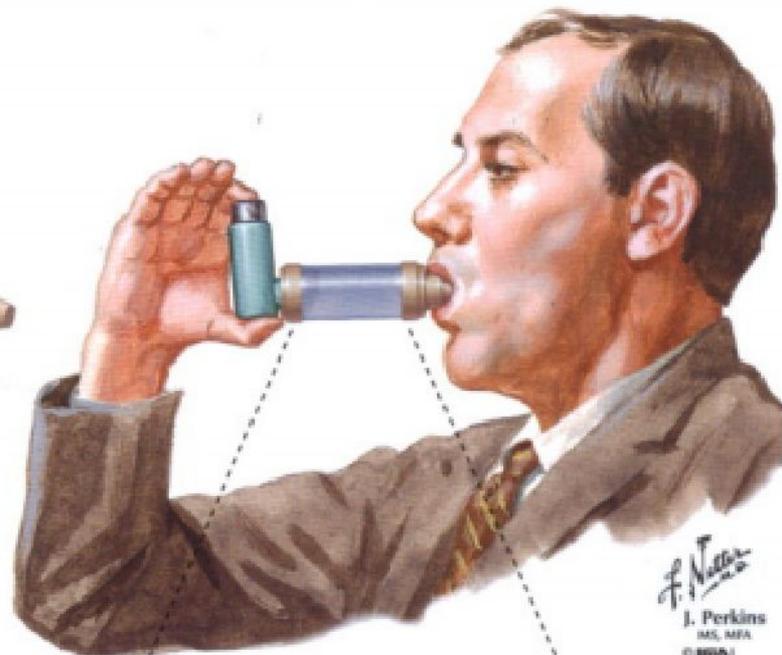
Ипратропиума бромид = Атровент

Начало действия через 30 минут, продолжительность действия 3-6 часов.

Профилактика и лечение бронхоспастического синдрома при хроническом обструктивном бронхите, бронхиальной астме и др. бронхоспастических состояниях. Не рекомендуется применять в монотерапии для экстренного купирования удушья. Т.к. эффект развивается медленнее, чем β – адреномиметиков.

Возможные побочные эффекты: сухость во рту, повышение вязкости мокроты.

Противопоказания: закрытоугольная глаукома и беременность



- . В настоящее время ИГКС являются наиболее эффективными противовоспалительными средствами для лечения персистирующей БА. В исследованиях показано, что они эффективно уменьшают выраженность симптомов БА , улучшают качество жизни функцию легких , уменьшают бронхиальную гиперреактивность , угнетают воспаление в дыхательных путях [11], снижают частоту и тяжесть обострений и частоту смертей при БА. Однако эти препараты не излечивают БА, и в случае их отмены у части пациентов в течение недель или месяцев происходит ухудшение состояния

- Эффективность некоторых препаратов изменяется при использовании разных типов ингаляторов .Основной эффект ИГКС у взрослых достигается при применении сравнительно низких доз, эквивалентных 400 мкг будесонида в сутки

- Системные побочные эффекты длительной терапии высокими дозами ИГКС включают склонность к образованию синяков , угнетение коры надпочечников и снижение минеральной плотности костной ткани . В одномоментных (поперечных) исследованиях также была отмечена взаимосвязь терапии ингаляционными ГКС с развитием катаракты и глаукомы , но данные проспективных исследований не показали увеличения риска задней подкапсульной катаракты

БЕРОДУАЛ И ДИТТОК. КОМБИНИРОВАННЫЕ ПРЕПАРАТЫ

В состав беродуала
входят:

- β_2 -
адреномиметик -
ФЕНОТЕРОЛ;

- М-холиноблокатор
- ИПРАТРОПИУМА
БРОМИД
(атровент)

В состав дитэка входят:



```
graph TD; A[В состав дитэка входят:] --- B["- β2 -адреномиметик - ФЕНОТЕРОЛ (беротек), обладающий бронхолитическим действием;"]; A --- C["- противоаллергический препарат - КРОМОЛИН НАТРИЯ (интал), ингибирующий развитие аллергической реакции ГНТ."]
```

- β_2 -адреномиметик -
ФЕНОТЕРОЛ (беротек),
обладающий
бронхолитическим
действием;

- противоаллергический
препарат - КРОМОЛИН
НАТРИЯ (интал),
ингибирующий развитие
аллергической реакции
ГНТ.

Формы и дозы

	Ингаляционные формы (мкг)	Раствор для небулайзера (mg/ml)	Внутрь (per os)	Парентеральные формы (мг)	Длительность действия (часы)
--	---------------------------	---------------------------------	-----------------	---------------------------	------------------------------

B₂ - агонисты***Короткого действия***

Сальбутамол (УД – А)	100-200 (ДАИ, СПИ)	5		0,1; 0,5	4-6
----------------------	--------------------	---	--	----------	-----

Длительного действия

Формотерол (УД – В)	4,5-12 (ДАИ, СПИ)	0.01			12
Индакатерол	75-300 (СПИ)				24
Сальметерол (УД – В)	25-50 (ДАИ, СПИ)				12
Олодатерол (УД – В)	5 (МТИ)				24

Антихолинэргические препараты***Короткого действия***

Ипратропиума бромид (УД – А)	20,40 (ДАИ)	0.25-0.5			6-8
------------------------------	-------------	----------	--	--	-----

Длительного действия

Тиотропиума бромид (УД – А)	18 (СПИ), 5 (МТИ)				24
Умеклидиний (УД – В)	62,5 (СПИ)				24
Гликоперония бромид (УД – В)	44 (СПИ)				

Комбинированные короткого действия В₂ – агонисты и антихолинергические препараты

Фенотерол/ипротропиум а бромид (УД – А)	200/80 (ДАИ)				6-8
--	-----------------	--	--	--	-----

Комбинированные длительного действия В₂–агонисты и антихолинергические препараты

Индакатерол/гликопирро ний (УД – В)	85/43 (СПИ)				24
Вилантерол/ умеклидиний (УД – В)	25/62,5 (СПИ)				24
Олодатерол/Тиотропиум	5/5 (МТИ)				

Метилксантины

Аминофиллин (УД – В)			200-600 мг	240	варьирует до 24
Теофиллин (пролонгированный) (УД – В)			100-600 мг		варьирует до 24

Ингаляционные глюкокортикостероиды

Беклометазон (УД – В)	50-400 (ДАИ, СПИ)	0,2-00,4			
Будесонид (УД – В)	100,200,400 (СПИ)	0,20;0,25;0, 5			
Флютиказон (УД – В)	50-500 (ДАИ, СПИ)				

**Комбинированные длительного действия B_2 – агонисты и ингаляционные
кортикостероиды**

Формотерол/Будесонид (УД – В)	4.5/160, 9/320 (ДАИ, СПИ)				
Сальметерол/Флютиказо на (УД – В)	50/100, 250, 500 (СПИ)				
Вилантерол/Флютиказон а фуроат (УД – В)	25/100 (22/92) (СПИ)				

Системные кортикостероиды

Преднизолон (УД – В)			5-60 мг		
Метилпреднизолон (УД – В)			4,8,16 мг		