



# ФАРМАКОЛОГИЯ



ТЕМА

Холинергические средства.

лекция



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Цель** - Сформировать знания студентов о лекарственных средствах, влияющих на эфферентную нервную систему.

**Задачи:**

**Учебные** - изучить фармакотерапевтические действия лекарств по основным группам средств, влияющих на эфферентную нервную систему. (ПК. 3.2.)

**Развивающие** - развивать стремление к расширению своих профессиональных знаний (ОК.8)

**Воспитательные** - развивать аккуратность, добросовестность, интерес к профессии, интеллект, трудолюбие, стремление брать на себя ответственность за результат выполнения заданий. (ОК.7)



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Изучаемые вопросы

1. Классификация средств, влияющих на эфферентную нервную систему. Общая характеристика.
2. ЛС, блокирующие холинергические окончания эфферентных нервных волокон.
3. ЛС, стимулирующие холинергические окончания эфферентных нервных волокон.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Вопросы для контроля

1. Другие названия эфферентной части ПНС.
2. Классификация средств, действующих на эфферентную иннервацию.
3. Что такое анестетики, их терапевтические эффекты и показания к применению?
4. Препараты анестетиков, их синонимы, сравнительные характеристики.
5. Почему к анестетикам необходимо добавлять сосудосуживающие средства (назовите такое средство)?



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## ЭФФЕРЕНТНАЯ ИННЕРВАЦИЯ

### 1. Соматическая часть

(1 «мотонейрон»: скелетные мышцы)

### 2. Вегетативная часть

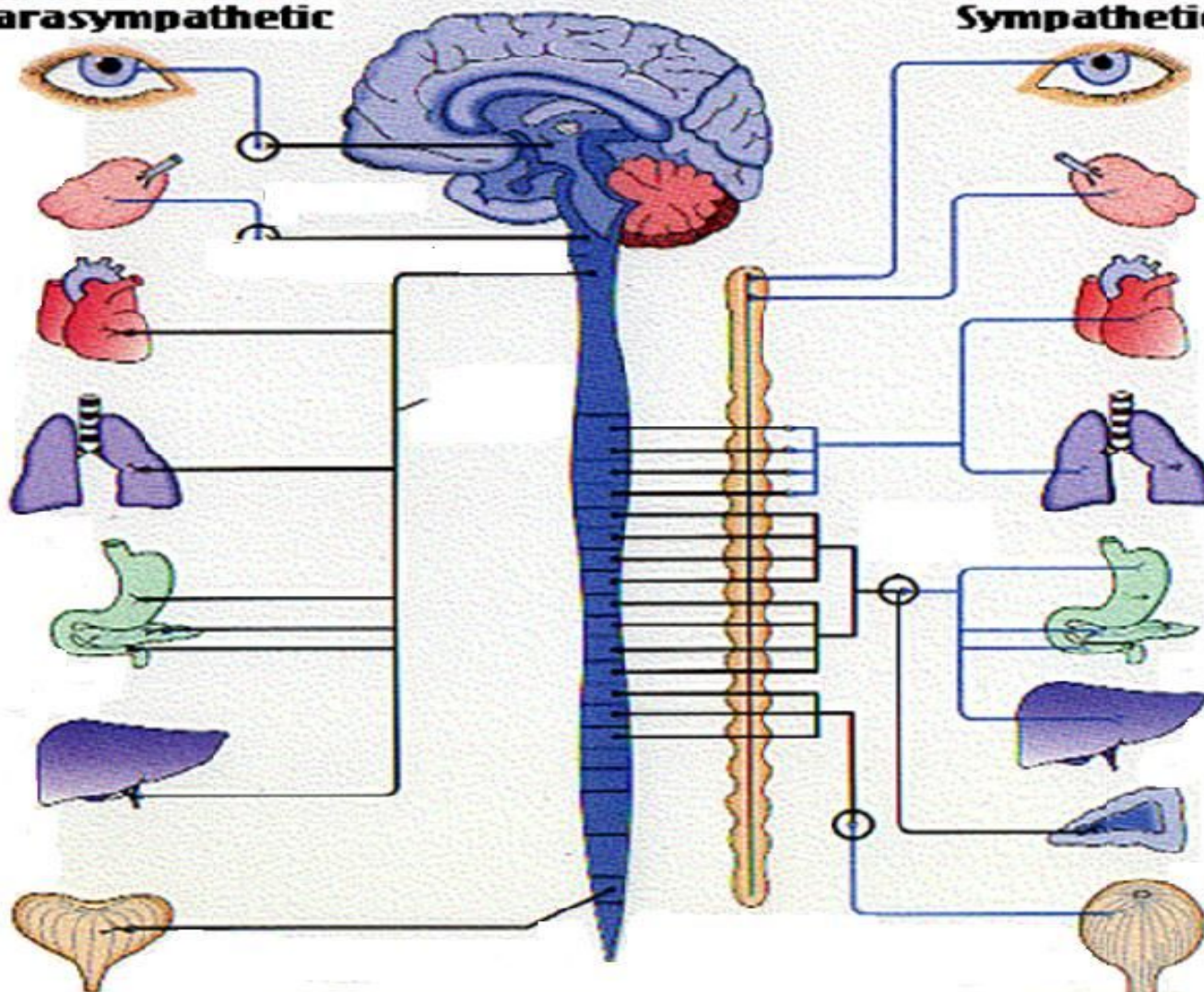
(2 нейрона: гладкие мышцы, железы)

- **Симпатическая** (*обычно – стимулирующая функция*);
- **Парасимпатическая** (*обычно – угнетающая функция*)



**Parasympathetic**

**Sympathetic**









# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Ацетилхолин** - это медиатор котрый высвобождающихся в окончаниях:

- всех преганглионарных волокон (симпатических и парасимпатических);
- всех постганглионарных парасимпатических волокон некоторых постганглионарных симпатических волокон (терморегуляция, секреция потвых желез и расширение сосудов скелетной мускулатуры): нервов иннервирующих мозговой слой надпочечников;
- соматических нервов, иннервирующих скелетную мускулатуру;
- некоторых нейронов ЦНС.



# Эффекты стимуляции холинорецепторов

Тип холинорецептора	Локализация рецепторов	Эффекты, вызываемые стимуляцией холинорецепторов
<b>М-холинорецепторы</b>		
<b>M1</b>	ЦНС Энтерохромаффиноподобные клетки желудка	Выделение гистамина, который стимулирует секрецию хлористоводородной кислоты париетальными клетками желудка
<b>M2</b>	Сердце	Уменьшение частоты сердечных сокращений; угнетение атриовентрикулярной проводимости; снижение сократительной активности предсердий
	Пресинаптическая мембрана окончаний постганглионарных парасимпатических волокон	Снижение высвобождения ацетилхолина
<b>M3 (иннервируемые)</b>	Круговая мышца радужной оболочки; Цилиарная (ресничная) мышца глаза;	Сокращение, сужение зрачков; сокращение, спазм аккомодации (глаз устанавливается на ближнюю точку видения)
	Гладкие мышцы бронхов, желудка, кишечника, желчного пузыря и желчных протоков, мочевого пузыря, матки; Экзокринные железы (бронхиальные железы, железы желудка, кишечника, слюнные, слезные, носоглоточные и потовые железы)	Повышение тонуса (за исключением сфинктеров) и усиление моторики желудка, кишечника и мочевого пузыря; Повышение секреции
<b>M3 (неиннервируемые)</b>	Эндотелиальные клетки кровеносных сосудов	Выделение эндотелиального релаксирующего фактора (NO), который вызывает расслабление гладких мышц сосудов
<b>Н-холинорецепторы</b>		
<b>Nm</b>	Скелетные мышцы	Сокращение
<b>Nn</b>	Вегетативные ганглии; энтерохромаффинные клетки мозгового вещества надпочечников; каротидные клубочки	Возбуждение ганглионарных нейронов; секреция адреналина и норадреналина рефлекторное возбуждение дыхательного и сосудодвигательного центров



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Локализация М-холинорецепторов и эффекты их возбуждения

<u>Органы</u>	<u>Эффекты возбуждения</u>
Глаз	Сокращение круговой, ресничной мышцы, миоз
Сердце	Урежение ритма, угнетение сократимости, проводимости
Трахея, бронхи	Повышение тонуса, усиление секреции
ЖКТ	Усиление моторики и секреции
Желчный пузырь	Сокращение
Мочевой пузырь	Сокращение



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Локализация М-холинорецепторов (продолжение)

Железы слюнные

Усиление секреции

Сфинктеры (жкт и др.)

Расслабление

Печень

Усиление секреции

Поджелудочная железа

Усиление секреции

Матка

Усиление сократительной  
активности

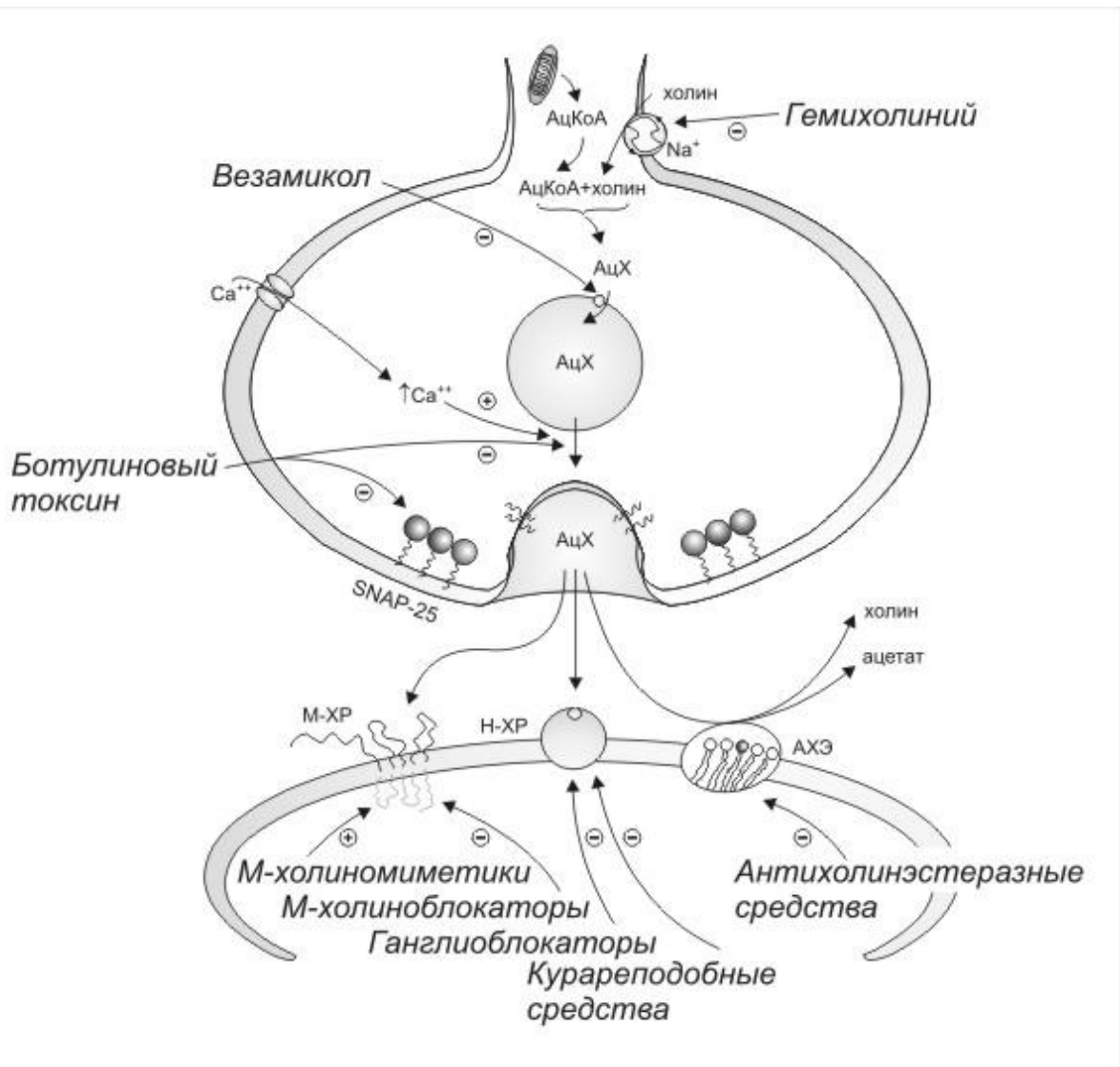
Сосуды

Расширение преимущ.

ЦНС

Различные

# Холинергические средства



Стимуляторы рецепторов – «миметики».

Блокаторы рецепторов – «лититики»

**«Литики – всегда сильнее миметиков»**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация холинергических средств:

### 1. Холиномиметики:

- *M-холиномиметики,*
- *H- холиномиметики,*
- *M,H- холиномиметики.*

### 2. Холиноблокаторы:

*M-холиноблокаторы,*

*H-холиноблокаторы:*

### 3. Антихолинэстеразные средства (*M,H-холиномиметики косвенного действия*).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Средства, влияющие на М-холинорецепторы

*М-холиномиметики:*

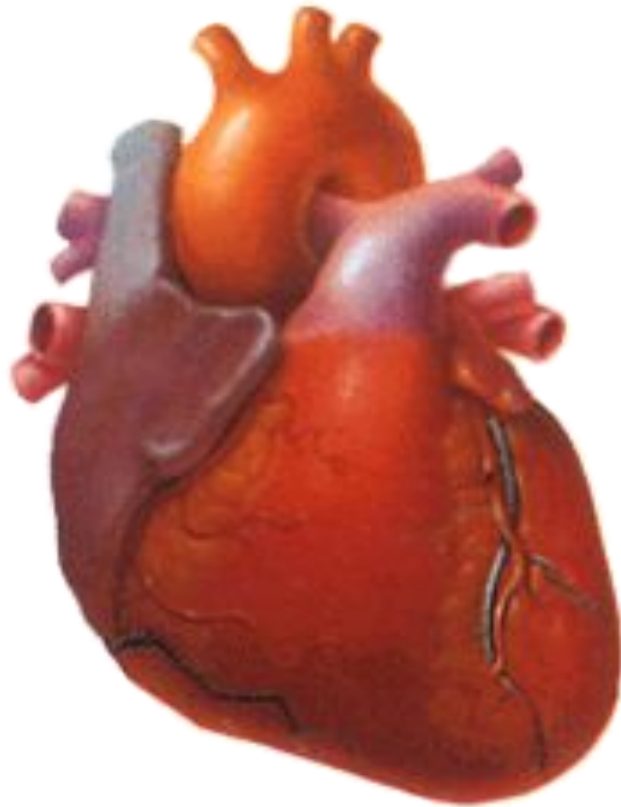
Ацеклидин,  
Пилокарпина гидрохлорид





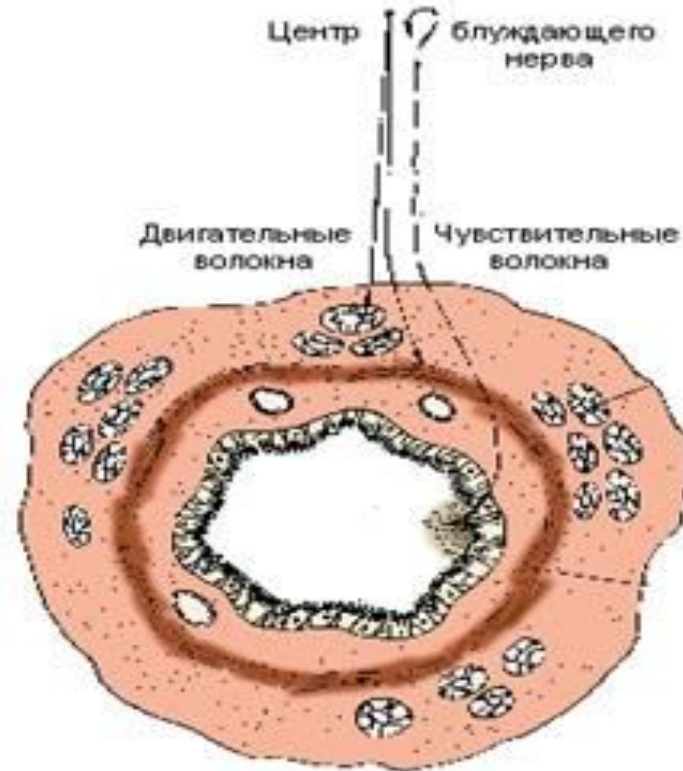
## Эффекты стимуляции холинорецепторов

$M_2$



**Уменьшение ЧСС**  
(брадикардия)

$M_3$



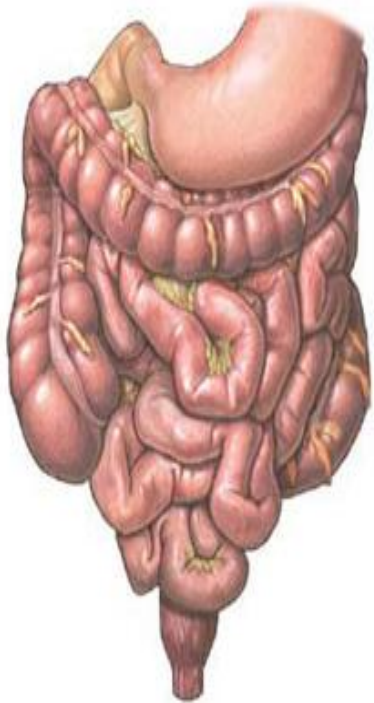
**Повышение тонуса бронхов и**  
**секреции (бронхоспазм)**



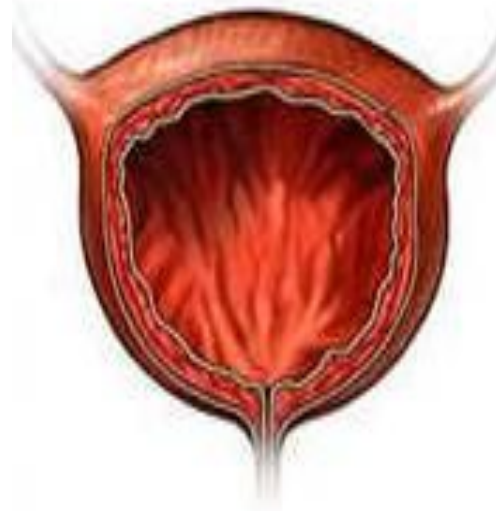
**Повышение тонуса гладких мышц (за исключением сфинктеров)**

**M<sub>3</sub>**

**ЖКТ**



**Мочевой пузырь**



**Матка**



**M<sub>1</sub>**

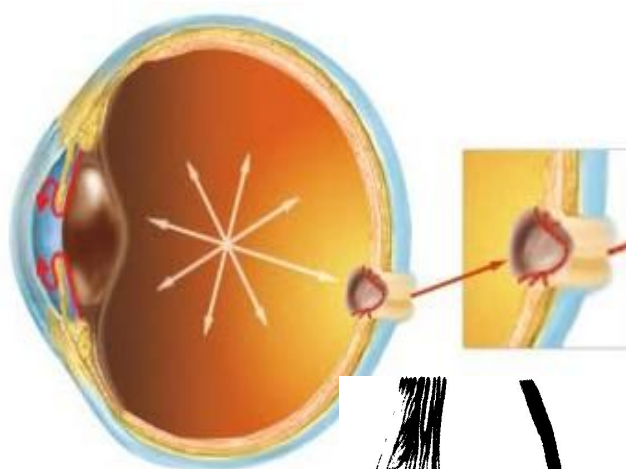
**Увеличение секреции  
потовых, слезных, слюнных, бронхиальных и желёз ЖКТ**

**Сужение зрачков**  
*(миоз)*

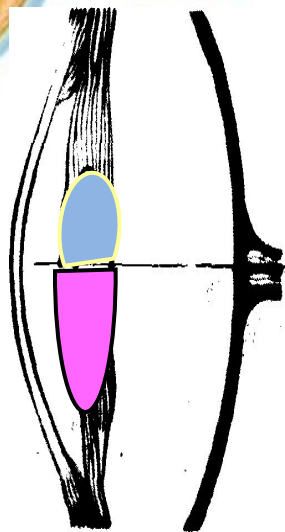


**M<sub>3</sub>**

**Снижение ВГД**



**Спазм аккомодации**  
*(ложная близорукость)*



**M<sub>3</sub>**



# Средства, влияющие на холинергические синапсы

М

М-холиномиметики

**ПИЛОКАРПИН**

Ацеклидин



*Amanita muscaria* var *muscaria*

Photo by Georg Mueller, © 2000 Erowid.org





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Показания к применению М-холинномиметиков



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Показания к применению М-холиномиметиков**

Глаукома, атония кишечника и мочевого пузыря,  
недостаточность родовой деятельности

## **Противопоказания**

Бронхиальная астма, тяжелые поражения сердца,  
кровотечения из ЖКТ, эпилепсия, гиперкинез,  
беременность





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Н-холиномиметики**

**1.ЦИТИТОН**

**2.ЛОБЕЛИН**

**Табекс Лобесил**

**Анабазин Гамибазин**

**Специфический лиганд – никотин**

**Локализация Н-холинорецепторов**

**Ганглии вегетативных нервов**

**Скелетная мускулатура**

**Синокаротидная зона**

**Мозговое вещество надпочечников**

**ЦНС**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **Показания к применению Н-холиномиметиков**

Дыхательные analeптики.

Отвыкание от курения

## **Противопоказания**

Выраженный атеросклероз, гипертензия, кровотечения из крупных сосудов, отек легких



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## **М,Н,-холиномиметики**

Ацетилхолин-хлорид

Карбахолин

### **Показания к применению М,Н,- холиномиметиков**

Глаукома, атония кишечника и мочевого пузыря, недостаточность родовой деятельности

### **Противопоказания**

Бронхиальная астма, тяжелые поражения сердца, кровотечения из ЖКТ, эпилепсия, гиперкинез, беременность



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Антихолинэстеразные средства (М,Н-холиномиметики косвенного действия):**

**Обратимого действия:**

Прозерин

Физостигмина салицилат

Пиридостигмина бромид (калимин)

Галантамина гидробромид

**Необратимого действия:**

• Армин (глазные капли)

• **Инсектициды**

• **Гербициды**

• **БОВ**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Показания к применению антихолинэстеразных средств

Глаукома

Атония кишечника

Атония мочевого пузыря

Миастения

Отравление миорелаксантами

Остаточные явления после перенесенного  
полиомиелита

Прогрессирующая деменция



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Симптомы отравления антихолинэстеразными (ФОС)

1 стадия – возбуждение, головокружение, головная боль, снижение остроты зрения, миоз, боли в животе, рвота, понос.

2 стадия – гиперкинезы, судороги

3 стадия - параличи





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Помощь при отравлении

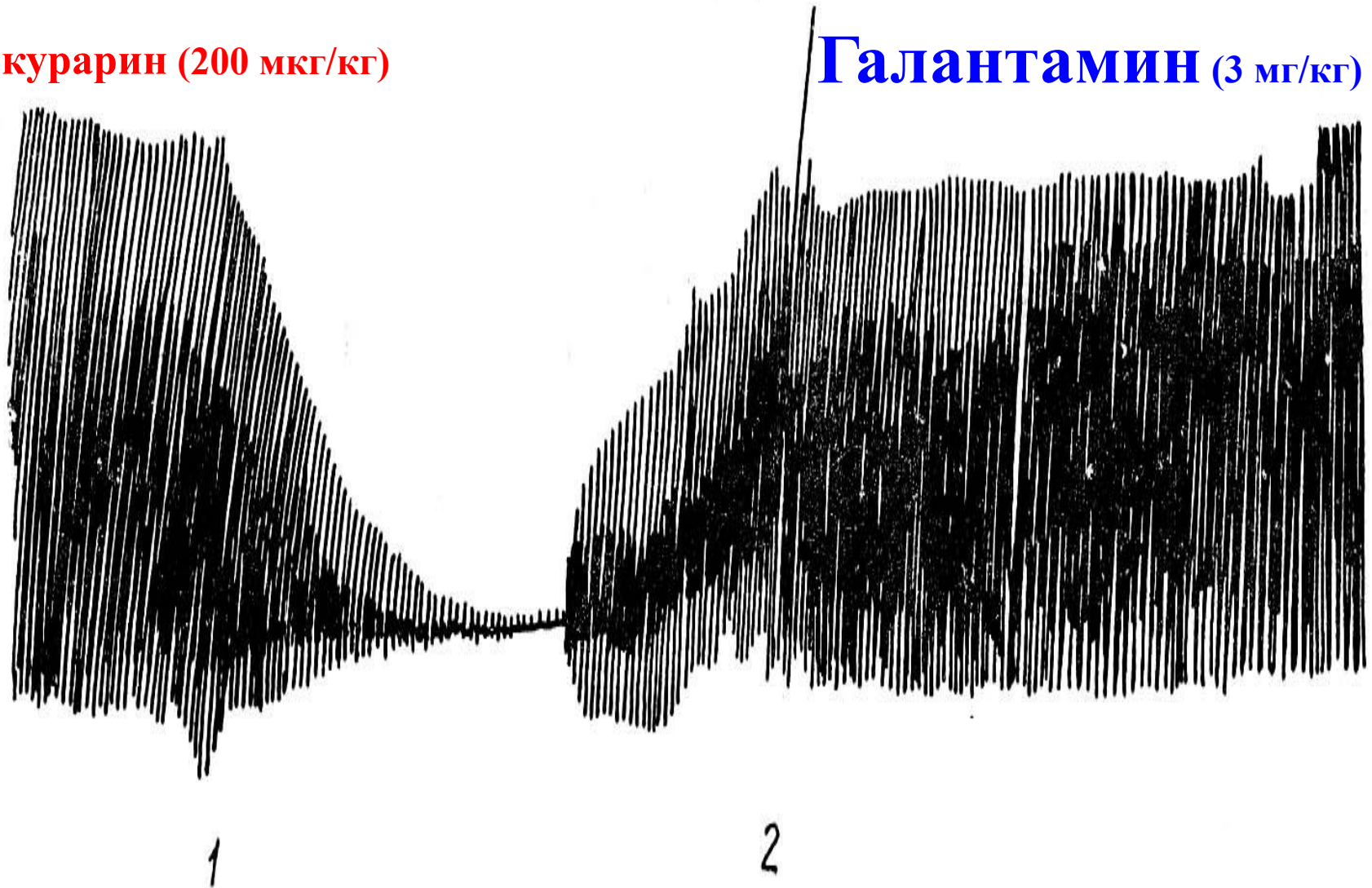
### антихолинэстеразными средствами (ФОС)

- Удаление яда с кожи, слизистых (промывание раствором натрия гидрокарбоната), из желудка.
- Удаление из крови (форсированный диурез, гемосорбция, гемодиализ)
- Назначение антагонистов (М-холиноблокаторов, реактиваторов холинэстеразы)

Нервно-мышечный блок (1), вызванный тубокурарином  
и снятие его (2) галантамином

Тубокурарин (200 мкг/кг)

Галантамин (3 мг/кг)



# Реактиваторы холинэстеразы специфические антидоты при отравлениях ФОС

## Дипироксим

• 15% - 1 мл

## Изонитрозин

• 40% - 3 мл





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Антихолинергические ЛС:

1. М-холиноблокаторы,
2. Н-холиноблокаторы:

Ганглиоблокаторы ( $H_N$ ),  
Миорелаксанты ( $H_M$ )



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## I. М-холиноблокаторы «атропиноподобные ЛС»

### ОПРЕДЕЛЕНИЕ М-холиноблокаторы

(блокаторы М-холинергических рецепторов) – это ЛС, являющиеся конкурентными антагонистами ацетилхолина и лекарственных средств - холиномиметиков в отношении М-холинорецепторов ЦНС и внутренних органов.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## СЛЕДСТВИЯ ПРИМЕНЕНИЯ М-ХОЛИНОБЛОКАТОРОВ:

1. М-холиноблокаторы нарушают функцию холинергических синапсов,
2. Синапсы прекращают влияние на органы, иннервируемые парасимпатической нервной системы,
3. Развивается дисбаланс медиаторных систем, что сопровождается преобладанием симпатических эффектов.





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация М-холиноблокаторов:

### А. Растительного происхождения

Все они - третичные амины (проникают в ЦНС).

**Атропин** ( $M_1$ -,  $M_2$ -,  $M_3$ -ХБ, алкалоид из растений семейства пасленовых – ягод и корней красавки (*Atropa belladonna*\*), листьев и корней белены (*Hyosciamus\* niger*), семян дурмана (*Datura stramonium*\*), и скополии (*Scopolia carniolica*).

**Атропинсодержащие препараты** красавки входят в состав таблеток «Бекарбон», «Бесалол», «Бепасал», «Беллалгин»; свечей «Бетиол», «Анузол»; «Капель Зеленина»; препарата «Солутан» и др.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Атропин** – Название красавки «Атропа Белладонна» составлено Карлом Линнеем из трех слов:

1. Атропос (неотвратимая), по имени древнегреческой богини судьбы, перерезавшей нить жизни человека, и
  - 2-3. Белла донна (красивая женщина) – итальянское слово, отражавшее обычай итальянок эпохи Возрождения закапывать в глаза сок красавки.
- 1831 г. – атропин выделен из красавки (Мейн).

# АТРОПИНА сульфат

Как алкалоид содержится в растениях:

1. красавка (*Atropa belladonna*)
2. дурман (*Datura stramonium*)
3. белена (*Hyoscyamus niger*)





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация М-холиноблокаторов:

### А. Растительного происхождения

Все они - третичные амины (проникают в ЦНС).

**Скополамин** - алкалоид белены, дурмана и мандрагоры,

**Платифиллин** - алкалоид крестовника широколистного  
- *Senecio platyphyllus*),

**Тропикамид** (Мидрум, Мидриацил),

**Аэрон** (камфарнокислые соли скополамина и гиосциамина)



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Атропин** – оказывает **2 вида действия**:

1. Местное (на глаз)
2. Резорбтивное.

**4 местных эффекта атропина** (на  $M_3$ )

- **Расширение зрачков** (мидриаз) – паралич круговой мышцы преобладание тонуса ее антагониста – радиальной мышцы. Длится 7-10 дней (скополамин 3-5 дней, платифиллин 5-6 ч.). Применяется при иритах (иммобилизация + анестезия) и для осмотра глазного дна.
- **Паралич аккомодации** (циклоплегия) - искусственная дальность зрения из-за расслабления цилиарной мышцы, которая натягивает циннову связку и капсулу хрусталика. Хрусталик уплощается и устанавливает фокусировку на дальнюю точку зрения. Длится 8-12 дней. Применяется для подбора очков.





# ФАРМАКОЛОГИЯ



- **Светобоязнь** (фотофобия) **Повышение ВГД** (глаукома) – угол передней камеры глаза закрывается утолщенной радужкой.
- **Резорбтивное действие атропина зависит от его ДОЗЫ:**

Доза	Эффекты
0,5 мг	Сухость кожи, небольшая сухость во рту, БРАДИКАРДИЯ
1 мг	Сухость во рту, жажда, ТАХИКАРДИЯ, умеренное расширение зрачков
2 мг	Сильная сухость во рту, тахикардия, выраженное расширение зрачков, паралич аккомодации
5 мг	Выражены те же симптомы + затруднение речи, глотания и мочеиспускания, беспокойство, угнетение перистальтики ЖКТ
10 мг и более	То же + бред, кома.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Б. Синтетические М-холиноблокаторы

**Метоциния йодид (Метацин)** – сильнее атропина подавляет секреторную функцию желез и расслабляет гладкие мышцы, но в меньшей степени влияет на глаза и сердце.

**Ипратропий бромид (Атровент, Итроп, ~ Тривентол)** –  $M_3$ -ХБ, используется в аэрозолях при бронхиальной астме, однако плохо всасывается со слизистой оболочки бронхов (90% дозы больные проглатывают)

**Тиотропия бромид (Спирива – капсулы для ингаляций)** -  $M_{1,3}$ -ХБ - действует до 24 часов, не вызывая тахикардию и сухость во рту.

**Гоматропин** (синтетический эфир тропина и миндальной кислоты) – третичный амин.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Б. Синтетические М-холиноблокаторы

**Пирензепин (Гастроцепин)** –  $M_1$ -ХБ – гастроцитопротектор - уменьшает секрецию пепсиногена и соляной кислоты, не подавляя продукцию слизи, тормозит протеолиз в эпителии, улучшает кровоснабжение и регенерацию слизистой ЖКТ.

**Перфиний бромид (Риабал детский)** –  $M_1$ -ХБ

**Тригексифенидил (Паркопан, Ромпаркин, Циклодол)** - центрального действия,

**Бипериден (Акинетон)** - центрального действия,

**Дифенилтропин (Тропацин)** - центрального действия.



# M<sub>1</sub>-холиноблокатор- **Гастроцепин**



## **M<sub>3</sub>-холиноблокатор**



- Р-р для ингаляций через небулайзер **старше 14 лет** назначают по 0.4-2 мл (8-40 капель) 3-4 раза/сут
- детям **до 6 лет** - по 0.4-1 мл (8-20 капель) 3-4 раза/сут



**Атровент®**  
ипратропиума бромид  
**дозированный  
аэрозоль**

Для ингаляции

В 15 мл содержится  
300 отдельных доз  
С трубкой для рта

 **Boehringer  
Ingelheim**

**Атровент®**  
ипратропиума бромид  
**дозированный  
аэрозоль**  
Для ингаляции  
В 15 мл содержится  
300 отдельных доз  
Хорошо встряхивать перед  
каждым применением  
Выпуск: только по  
назначению врача  
**Boehringer  
Ingelheim**



**Атровент® H**  
ипратропия бромид  
**дозированный  
аэрозоль**

10 мл

10 мл соответствует  
200 ингаляционным дозам  
Для ингаляции

 **Boehringer  
Ingelheim**

**Атровент H**  
ипратропия бромид  
**дозированный  
аэрозоль**  
10 мл соответствует  
200 ингаляционным  
дозам  
Для ингаляции  
**Boehringer  
Ingelheim**

*До 12 ингаляций в сутки*



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## СФЕРА ПРИМЕНЕНИЯ М-ХОЛИНОБЛОКАТОРОВ:

1. Премедикация (потенцированный наркоз). Обязательный минимум перед любой операцией с общим обезболиванием вводится литическая смесь - атропин + промедол (наркотик). Противорвотное действие, профилактика остановки сердца, уменьшение секреции слюнных и бронхиальных желез.
2. Профилактика и лечение вестибулярных расстройств (тошнота и рвота при морской и воздушной болезни)
3. Аритмии сердца – синусовая брадикардия, атриовентрикулярная блокада, брадисистолическая фибрилляция предсердий.
4. ХОБЛ
5. ЯБЖ и 12-п кишки.
6. Спазм гладкой мускулатуры (колики).



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Симптомы отравления атропином

LD для взрослых при приеме внутрь начинается с 100 мг

**для детей - с 2 мг**

• при парентеральном введении Атропин более токсичен

### *Низкие дозы (легкая степень)*

- задержка мочи
- атония кишечника
- **ЦИКЛОПЛЕГИЯ** (*паралич аккомодации*)
- мидриаз
- выраженная тахикардия
- **сухость слизистых** вследствие снижения потоотделения **кожные покровы сухие, горячие** (*гипертермия тела*), **красные** (*резкая гиперемия лица*)

### *Высокие дозы (тяжелая степень)*

- **фотофобия**
- **тошнота**
- **рвота**
- **гипертензия**
- **галлюцинации**
- **судороги**
- **паралич дыхания**





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Помощь при отравлении атропином

1. Удаление невсосавшегося яда с места попадания (промывание желудка, назначение активированного угля, слабительных средств)
2. Ускорение выведения вещества из организма (форсированный диурез, гемосорбция и гемодиализ) и поддержание жизненно важных функций (ИВЛ)
3. Назначение антагонистов  
Назначение М-холиномиметиков не эффективно - односторонний антагонизм  
Вводят антихолинэстеразные средства (прозерин)



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## 2. Ганглиоблокаторы (блокаторы $N_H$ -холинорецепторов)

Это ЛС, препятствующие действию АХ на  $N_H$ -холинорецепторы:

1. Вегетативных ганглиев (симпатических и парасимпатических)
2. Мозгового слоя надпочечников
3. Каротидных клубочков

Ганглиоблокаторы вызывают «**фармакологическую денервацию**» - неизбирательную блокаду симпатического и парасимпатического отделов вегетативной нервной системы.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Ганглиоблокаторы

Орган	Доминирует	Эффекты ганглиоблокаторов
Артерии, вены	Симпатическая НС	↑ кровотока, ↓ пред-, и постгрузки
Потовые железы	Симпатическая НС	Сухость кожи
Слюнные железы	Парасимпат.НС	Сухость во рту
Сердце	Парасимпат.НС	Тахикардия
ЖКТ	Парасимпат.НС	↓ тонуса и перистальтики, запор
Мочевой пуз.	Парасимпат.НС	Задержка мочи
Глаз	Парасимпат.НС	Мидриаз, циклоплегия



# ГАНГЛИОБЛОКАТОРЫ

- Третичные амины

## 1. Пирилен

– табл. 0,005

## 2. Пахикарпина гидроидид

– табл. 0,1

– амп. 3% - 2 мл

- Четвертичные амины

## 1. Бензогексоний

– табл. 0,1 и 0,25

– амп. 2,5% - 1 мл

## 2. Азаметония бромид (Пентамин)

– амп. 5% - 1 и 2 мл

## 3. Гигроний (пор. 0,1 в амп.)



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Классификация ганглиоблокаторов –**

**А. Четвертичные амины:** Четвертичные амины плохо всасываются в ЖКТ и не проникают через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ)

**Гексаметоний** (Бензоксоний) – п/кожу, в/м, внутрь (3-4 часа) – при ГБ, ЯБЖ, ХОБЛ

**Азаметония** бромид (Пентамин) – в/м, в/в (3-4 часа) – при отеке мозга, легких, ГБ

**Трепирий** йодид (Гигроний) – в/в (5-15 мин) – при ГБ, для управляемой гипотонии



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Классификация ганглиоблокаторов –**

**А. Четвертичные амины:** Четвертичные амины плохо всасываются в ЖКТ и не проникают через гематоэнцефалический барьер (ГЭБ)

**Димеколиний** йодид (Димеколин) – внутрь (5-6 часов) – ГБ, ЯБЖ, спазмы ЖКТ

**Триметидиния** метосульфат (Камфоний) – п/к, в/м, внутрь (3-4 ч.) – ГБ, ЯБЖ

**Триметофан** (Арфонад) – в/в (5-20 мин) – для управляемой гипотензии

**Имехин** – в/в (5-20 мин) – для управляемой гипотензии

**Кватерон** – внутрь (5-6 час.) - ЯБЖ



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**Классификация ганглиоблокаторов –**

**Б. Третичные амины:** Третичные резорбируются в ЖКТ и проникают через ГЭБ

**Пахикарпина** гидройодид – п/к, в/м, внутрь (6-8 час.) - ГБ, слабость родовой деятельности

**Темпидина** тозилат (Пирилен) – внутрь (10-12 час.) – ГБ, ЯБЖ

**Темехин** – внутрь (6-8 час.) – ГБ, ЯБЖ



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Эффекты ганглиоблокаторов

1. Снижается артериальное и венозное давление, что ведет к улучшению кровообращения в соответствующих областях, регионах, тканях
2. Расширяют периферические сосуды (артериальные и венозные). Кровь депонируется на периферии и снижается ее приток к правому сердцу, разгружается малый круг кровообращения и уменьшается гидростатическое давление в сосудах легких и мозга. («некровавое кровопускание»)
3. угнетение секреции слюнных желез, желез желудка
4. торможение моторики пищеварительного тракта



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Применение ганглиоблокаторов

**Спазм периферических сосудов** (*облитерирующий эндартериит*)

**Гипертонический криз** (*особенно, с левожелудочковой недостаточностью*)

**Острый отек легких, мозга**

**Язвенная болезнь желудка и 12-перстной кишки**



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Применение ганглиоблокаторов

### Управляемая гипотония

**Необходимо при выполнении операций на сердце, на крупных сосудах, на щитовидной железе, при операциях на молочной железе и др.**

С этой целью используют ганглиоблокаторы кратковременного действия (арфонад, гигроний), эффект которых длится 10-15 мин.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Осложнения при применении ганглиоблокаторов

Ортостатическое коллаптоидное состояние  
(резкое падение АД при переходе из  
горизонтального в вертикальное положение).

Рекомендуется лежать 1.5-2 часа после приема  
ганглиоблокаторов

атония кишечника и мочевого пузыря

запоры

светобоязнь

паралич аккомодации





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## 3. Периферические миорелаксанты

(«курареподобные ЛС») - обратимые блокаторы

$H_M$ -холинорецепторов (более древних, по сравнению с  $H_N$ )

**Кураре** – стрельный яд индейцев Южной Америки, вызывающий обратимый паралич скелетной мускулатуры.

Действующее вещество – алкалоид d-тубокурарин (смесь соков) и экстрактов деревьев *Strichnos toxifera* (токсиферины) и *Chondrodendron tomentosum* с добавлением яда змей.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## 3. Периферические миорелаксанты

(«курареподобные ЛС») - обратимые блокаторы  $N_M$ -холинорецепторов

Миорелаксанты используют в анестезиологии – в/в с 1942 г

### Порядок выключения мышц:

1. Мышцы глаз, пальцев рук и ног
2. Мышцы лица, шеи, конечностей, туловища, межреберные мышцы
3. Диафрагма



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация миорелаксантов

**А. Антидеполяризующие** («пахикураре», антагонисты–обратимые ИАХЭ):

*1. Длительного действия:*

**Тубокурарин** хлорид (Тубарин) – через 4-6 до 120 мин. – «**эталон**», М-холинолитик

**Панкурония** бромид (Мускурон, Павулон) – от 4-6 до 180 мин. – в 6 раз сильнее

**Пипекурония** бромид (Ардуан) – от 2-4 до 100 мин. – в 6 раз сильнее тубокур., ↓

ЧСС.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация миорелаксантов

**А. Антидеполяризующие** («пахикураре», антагонисты–обратимые ИАХЭ):

*2. Средней длительности действия:*

**Атракурия** бесилат (Тракриум) – от 2-4 до 40 мин.

**Цисатракурия** бесилат (Нимбекс) – от 2-4 до 40 мин.

**Векурония** бромид (Норкурон) – от 2-4 до 40 мин. – в 6 раз сильнее тубокурарина.

**Рокурония** бромид (Земурон) – от 1-2 до 40 мин. – в 0,8 раз слабее тубокурарина.

**Изоциурония** бромид – от 1-2 до 45 мин. – элиминация почками, ↑ ЧСС.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Классификация миорелаксантов

**А. Антидеполяризующие** («пахикураре», антагонисты–обратимые ИАХЭ):

*3. Короткого действия:*

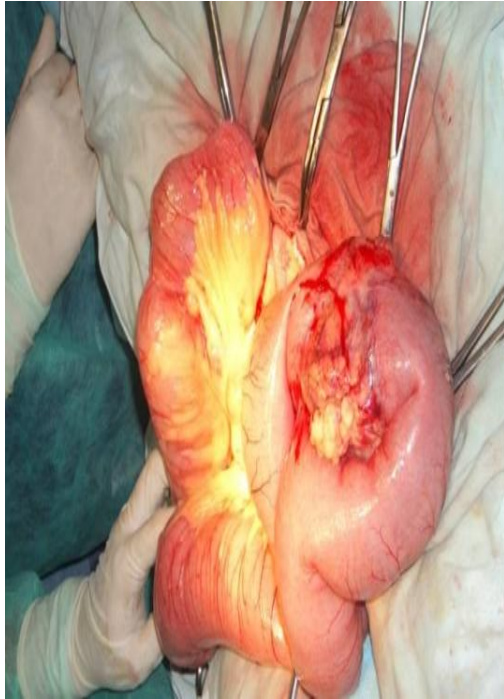
**Мивакурия** хлорид (Мивакрон) – от 2-4 до 20 мин. –

**Б. Деполяризующие** («лептокураре», не парализует полностью мышцы лица):

**Суксаметония** йодид (Дитилин) или хлорид (Листенон) – от 1-2 до 8 мин. – травмы мышц (боль через 12 часов),

**В. Препараты, нарушающие выделение АХ в синаптической щель:**

**Ботулинический токсин типа А** (Ботокс, Диспорт) – через 7 дней – до 6 мес.



**Антидеполяризующие миорелаксанты** экранируют н-холинорецептор и не дают ацетилхолину связаться с рецептором (при увеличении ацетилхолина (прозерин) проводимость восстанавливается)  
При внутривенном введении расслабление 30-60 мин

## **Сфера применения:**

интубация, вправление вывихов, полостные операции, столбняк, электросудорожная терапия, болезнь Паркинсона, энцефалит, арахноидит.

## **Противопоказания:**

миастения





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Осложнения при применении дитилина.

1. Мышечные послеоперационные боли
2. Повышение внутриглазного давления
3. Нарушение сердечного ритма

\*\*\* При передозировке (индивидуальной чувствительности - переливание свежей крови)

\*\*\* Применение возможно только при наличии ИВЛ.

# Центральные холиноблокаторы

1. Тригексифенидил (**Циклодол**, *Паркопан*)
2. Тропацин
3. Этпенал
4. Бипериден  
(*Акинетон*)





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Информационные источники

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.

«Фармакология с общей рецептурой»,

учебное пособие для мед. училищ,. – М.,

2015. Стр.34-53.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:**

Составление конспекта по теме:  
«Ганглиоблокирующие, курареподобные и  
вещества».

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.  
«Фармакология с общей рецептурой»,  
учебное пособие для мед. училищ,. – М.,  
2015. Стр.50 – 53.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выписать рецепты.

1. 10 ампул по 1 мл 0,1% раствора Атропина сульфата (*Atropini sulfas*). Назначить для подкожного введения по 0,5 мл 2 раза в сутки.

2. 10 ампул по 1 мл 0,2% раствора Платифиллина гидротартрата (*Platiphyllini hydrotartras*). Назначить для подкожного введения по 1мл 2 раза в сутки.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выписать рецепты.

3. 10 ампул по 1 мл 1% раствора Галантамина гидробромида (*Galantamini hydrobromidum*).

Назначить для подкожного введения по 0,5 мл 2 раза в сутки взрослому.

4. 10 ампул по 5 мл 2% раствора Суксаметония хлорид (*Suxamethonii chloridum*). Назначить для внутривенного введения в дозе 0,3 мг на 1 кг массы тела.



# ФАРМАКОЛОГИЯ



**СВР:** Выписать рецепты.

5. 10 ампул по 2 мл 5% раствора Азаметония бромиды (*Azamethonii bromidum*). Назначить для внутримышечного введения по 2 мл 3 раза в сутки.





# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Вопросы для контроля

1. Другие названия эфферентной части ПНС.
2. Чем представлена эфферентная иннервация (какими нервными волокнами)?
3. Какие медиаторы «работают» в эфферентной части ПНС?
4. Влияние симпатической и парасимпатической частей вегетативной нервной системы на АД, ЧСС, величину зрачка, секрецию желез, тонус гладкой мускулатуры, перистальтику ЖКТ.
5. Что такое миметики, блокаторы, литики?



# ФАРМАКОЛОГИЯ



## Вопросы для контроля

6. Какие рецепторы называются холинергическими, а какие адренергическими?

7. Назовите два вида холинорецепторов и объясните их названия.

8. Препараты, механизмы действия, синонимы, показания к применению, терапевтические и побочные эффекты: М- холиномиметиков; Н - холиномиметиков; М-, Н - холиномиметиков; антихолинэстеразных средств; М- холиноблокаторов; Н - холиноблокаторов.