

**ХАРАКТЕРИСТИКА
АДРЕНОСТИМУЛЯТОРОВ,
МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ,
БРОНХОСИНДРОМ**

**Выполнил
Яруллин Наиль Эдуардович**

Адреномиметики

Прямого действия

Непрямого действия

Мезатон
Фетанол
Нафтизин

α

АДР-гх
НА-гт

α, β -

Изадрин
Орципреналин
Сальбутамол (β_2)
Добутамин (β_1)

β -

Эфедрин
Дофамин

α, β -

АЛЬФА1-АДРЕНОСТИМУЛЯТОРЫ

Основные физиологические эффекты многих адренергических средств обусловлены активацией α -адренорецепторов гладких мышц сосудов. В результате повышается ОПСС, что способствует поддержанию АД или приводит к его повышению. В клинике такие средства применяют нечасто — в основном при тяжелой артериальной гипотонии и при шоке.

Фенилэфрин и метоксамин оказывают прямое сосудосуживающее действие, обусловленное стимуляцией α -адренорецепторов.

Мефентермин и метараминол кроме прямого эффекта вызывают еще и высвобождение норадреналина из симпатических окончаний.

АЛЬФА2-АДРЕНОСТИМУЛЯТОРЫ

Препараты этой группы применяют главным образом при артериальной гипертонии. Их гипотензивное действие в какой-то степени парадоксально: во многих сосудах имеются α_2 -адренорецепторы, активация которых сопровождается вазоконстрикцией. Клонидин, в частности, был вначале разработан как средство от насморка (сужающее сосуды слизистой носа). Его гипотензивный эффект обусловлен стимуляцией центральных α_2 -адренорецепторов сердечно-сосудистого центра продолговатого мозга, сопровождающейся снижением симпатического тонуса.

БЕТА-АДРЕНОСТИМУЛЯТОРЫ

Препараты этой группы использовали при многих состояниях, но сегодня их основное применение — устранение бронхоспазма у больных с бронхиальной астмой и ХОЗЛ.

Бета-адреностимуляторы применяют для повышения частоты и силы сердечных сокращений. Их хронотропное действие важно для экстренного купирования таких аритмий, как пируэтная тахикардия, резкая брадикардия и АВ-блокада, а инотропное — в ситуациях, когда важно повысить сократимость сердца. Клиническое применение препаратов этой группы рассматривается ниже.

Адреналин стали впервые использовать в качестве бронходилататора в начале XX века. Эфедрин вошел в западную медицину в 1924 г., хотя в Китае он применялся до этого в течение нескольких тысяч лет (Chen and Schmidt, 1930). Следующим крупным шагом стала разработка в 1940-х гг. избирательного β -адреностимулятора изопреналина: появилась возможность применять при бронхиальной астме лекарственное средство, не обладающее α -адреностимулирующей активностью и соответствующими побочными эффектами. Наконец, были получены избирательные β_2 -адреностимуляторы — еще более ценные в терапевтическом отношении препараты. К их достоинствам относится высокая биодоступность при приеме внутрь, отсутствие α -адреностимулирующей активности и низкий риск побочных эффектов на сердечно-сосудистую систему.

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ И ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ

В основе механизма действия большинства фармакологических эффектов ЛС этой группы лежит, как явствует из названия, стимуляция различных адренергических рецепторов. Положительный инотропный эффект этих ЛС обусловлен воздействием на бета-адренорецепторы сердца, вазоконстрикция является результатом стимуляции альфа1-адренорецепторов сосудов, а вазодилатация обусловлена активацией как альфа2-, так и бета2-адренорецепторов. Некоторые адреностимуляторы этой группы (допамин и допексамин) помимо адренергических стимулируют и допаминовые рецепторы, что приводит к дополнительной вазодилатации и небольшому повышению сократимости сердца. Новое ЛС фенолдопам является селективным стимулятором DA1-рецепторов. Он обладает мощным избирательным действием на сосуды почек, вызывая увеличение ПК. Фенолдопам обладает очень слабым положительным инотропным эффектом в сочетании с вазодилатацией.

МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ И ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ

Адреномиметики оказывают выраженное влияние на гладкие мышцы внутренних органов. Стимулируя бета₂-адренорецепторы бронхов, они расслабляют гладкие мышцы бронхов и устраняют бронхоспазм. Тонус и моторика ЖКТ, матки под влиянием адреномиметиков снижается (за счет возбуждения альфа- и бета-адренорецепторов), сфинктеры тонизируются (стимуляция альфа-адренорецепторов). Адреномиметики оказывают благоприятное влияние на НМП, особенно на фоне утомления мышц, что связывают с повышением выделения из пресинаптических окончаний АХ, а также с прямым действием адреномиметиков на мышцу.