



ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА,
действующие на
эфферентные нервы.

ЛС, действующие в области
холинергических синапсов.

ЛЕКЦИЯ № 7

Ключевые слова:

- Миоз
- Мидриаз
- Атония
- Тахикардия
- Брадикардия
- Паралич
- Парез
- Гипертонический криз
- Спазм аккомодации
- Парез аккомодации
- Глаукома
- Премедикация
- Синапс , ганглий

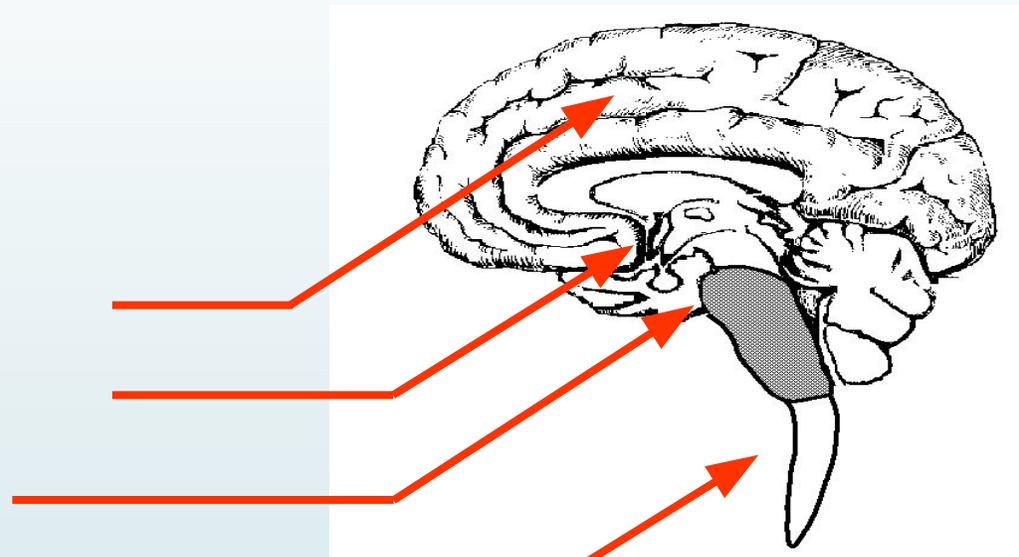
НЕРВНАЯ СИСТЕМА – система быстрой регуляции (генерация, переключение, и проведение нервных импульсов).

А. Центральная нервная система (ЦНС)

1. Головной мозг:

- а. Кора головного мозга
- б. Подкорковые центры
- в. Продолговатый мозг

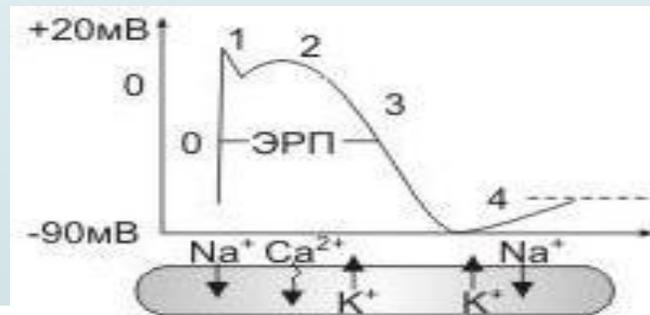
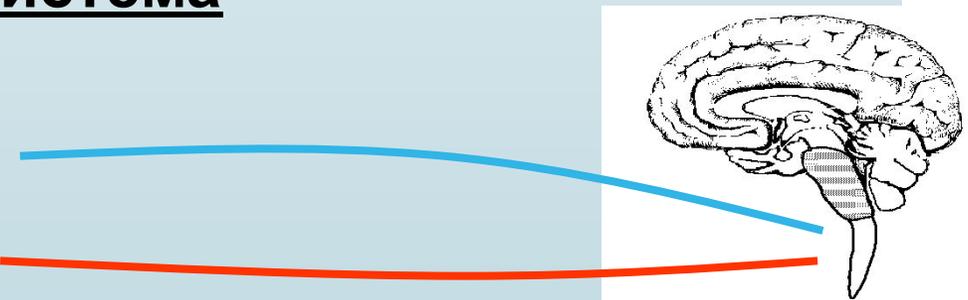
2. Спинной мозг



Б. Периферическая нервная система

1. Афферентная

2. Эфферентная



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).



Орган

Напряжение симпатических нервов

Напряжение парасимпатических нервов (Vagus nerve)

Зрачок

Расширение

Сокращение

Слезные железы

Подавление выделения

Стимуляция выделения

Слюнные железы

Конденсация (уменьшение в количестве)

Разбавление (возрастание в количестве)

Сердце

Стимуляция (ускорение)

Подавление (замедление)

Кровеносные сосуды

Сужение

Расширение

Коронарные артерии

Расширение

Сужение

Кровенное давление

Возрастание

Понижение

Бронхи и трахеи

Расслабление

Сокращение(кашель)

Работа желудка

Подавление

ускорение

Желудочная секреция

Уменьшение

Возрастание

Кишечник

Подавление деятельности (перистальтики)

Ускорение деятельности (перистальтики)

Поджелудочная железа

Уменьшение секреции

Возрастание секреции

Желчный пузырь

Расслабление

Сокращение

Мочевой пузырь

Расширение (подавление мочеиспускания)

Сокращение (подавление мочеиспускания)

Матка

Сокращение

Расслабление

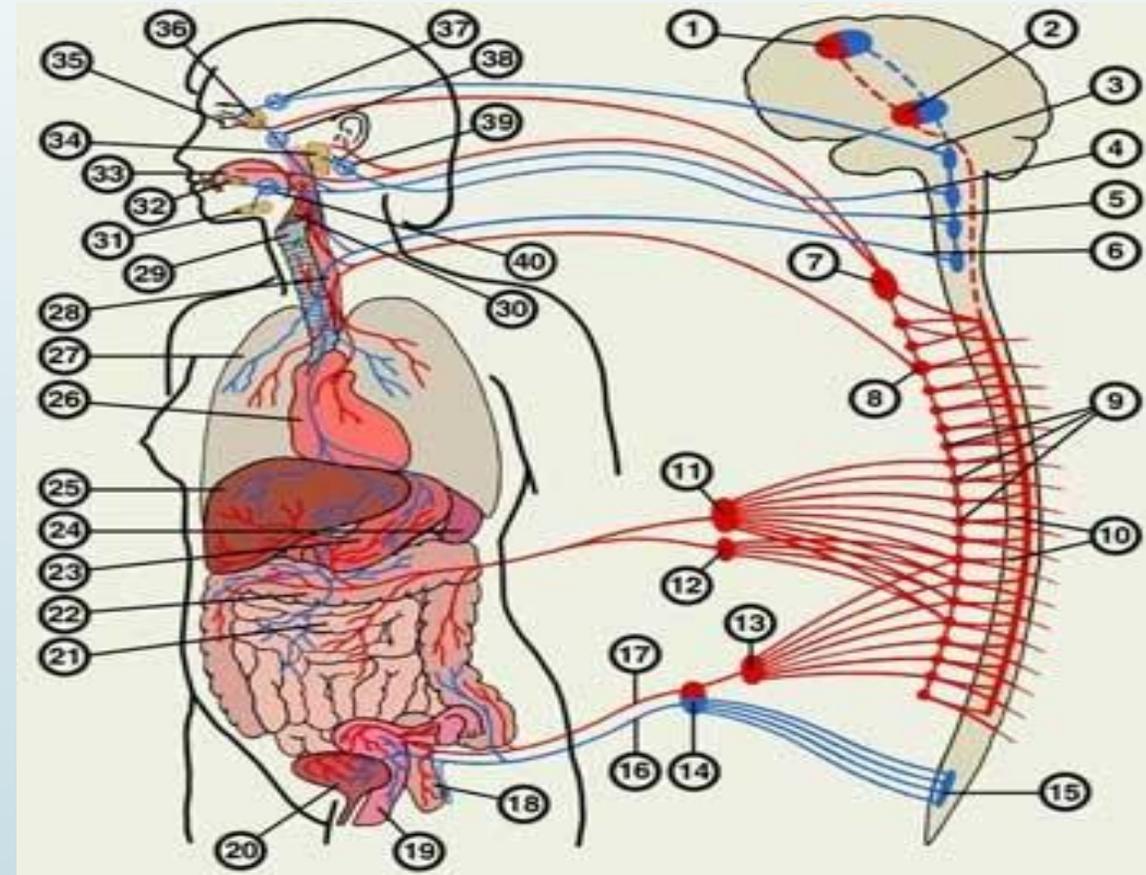
Потовые железы

Стимуляция выделения

Выделение холодного пота

Схематическое изображение строения вегетативной нервной системы человека и иннервируемых ею органов (красным цветом изображена симпатическая нервная система, синим — парасимпатическая; связи между корковыми и подкорковыми центрами и образованиями спинного мозга обозначены пунктиром).

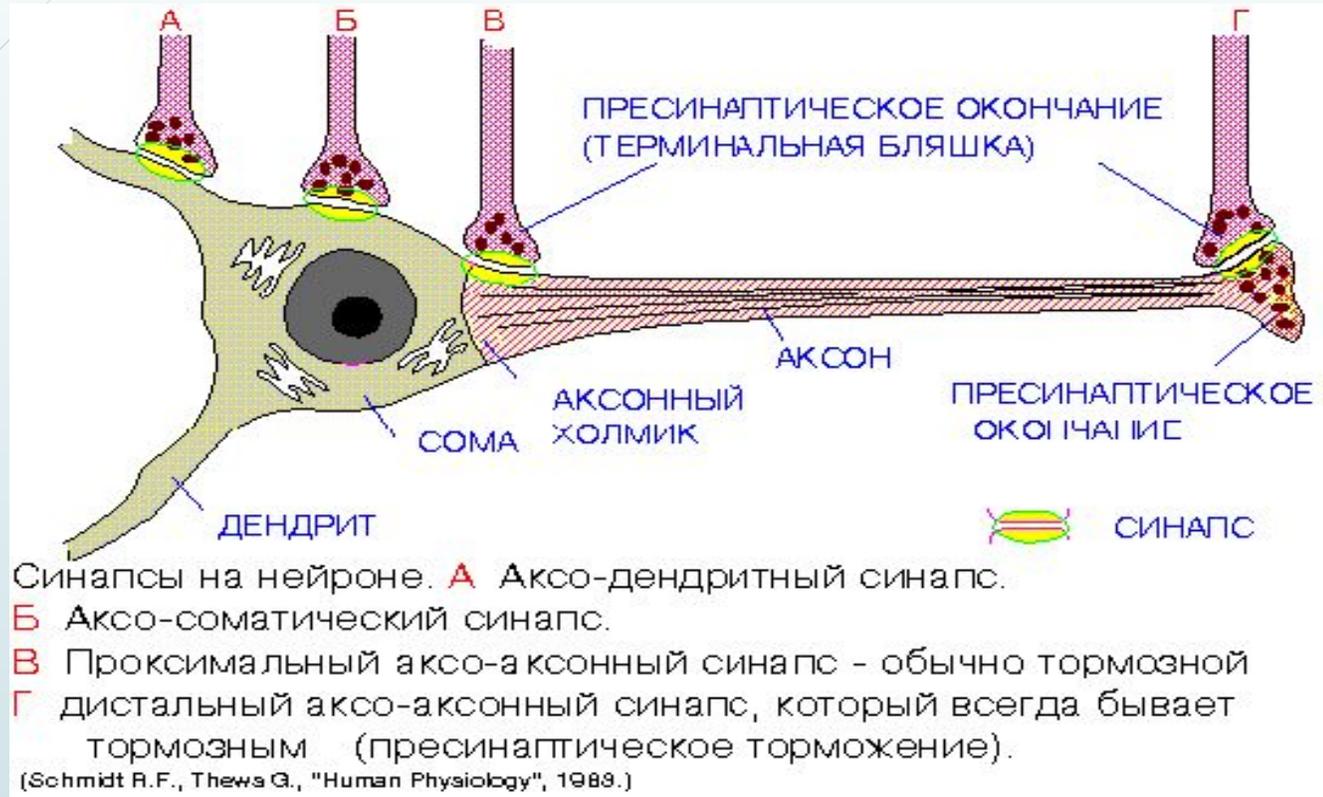
- 1 и 2 — корковые и подкорковые центры;
- 3 — глазодвигательный нерв;
- 4 — лицевой нерв;
- 5 — языкоглоточный нерв;
- 6 — блуждающий нерв;
- 7 — верхний шейный симпатический узел;
- 8 — звездчатый узел;
- 9 — узлы (ганглии) симпатического ствола;
- 10 — симпатические нервные волокна (вегетативные ветви) спинномозговых нервов;
- 11 — чревное (солнечное) сплетение;
- 12 — верхний брыжеечный узел;
- 13 — нижний брыжеечный узел;
- 14 — подчревное сплетение;
- 15 — крестцовое парасимпатическое ядро спинного мозга; 16 — тазовый внутренносный нерв;
- 17 — подчревный нерв;
- 18 — прямая кишка; 19 — матка; 20 — мочевого пузыря; 21 — тонкая кишка; 22 — толстая кишка; 23 — желудок; 24 — селезенка; 25 — печень; 26 — сердце; 27 — легкое; 28 — пищевод; 29 — гортань; 30 — глотка; 31 и 32 — слюнные железы;
- 33 — язык; 34 — околоушная слюнная железа; 35 — глазное яблоко; 36 — слезная железа; 37 — ресничный узел; 38 — крылоносовой узел; 39 — ушной узел; 40 — подчелюстной узел.



<i>Черепномозговой нерв</i>	<i>Название</i>	<i>Тип</i>	<i>Иннервируемый орган</i>	<i>Функция</i>
I	Обонятельный	Сенсорный	Орган обоняния	Обоняние
II	Зрительный	Сенсорный	Сетчатка	Зрение
III	Глазодвигательный	Моторный	Четыре глазные мышцы	Движения глаз
IV	Блоковый	Моторный	Одна глазная мышца	Движения глаз
V	Тройничный	Смешанный	Мышцы челюстей, зубы, кожа лица	Движения челюстей, рецепторы прикосновения и боли
VI	Отводящий	Моторный	Одна глазная мышца	Движения глаз
VII	Лицевой	Смешанный	Щеки, мышцы лица, язык	Слюноотделение, мимика, восприятие сладкого, кислого и соленого
VIII	Слуховой	Сенсорный	Улитка, полукружные каналы	Слух, равновесие
IX	Языкоглоточный	Смешанный	Язык, мускулатура глотки	Восприятие горького вкуса, глотание
X	Блуждающий	Смешанный	Гортань, глотка, сердце, кишечник	Речь, глотание, замедление ритма сердца, стимуляция перистальтики
XI	Добавочный	Моторный	Голова и шея	Движения головы
XII	Подъязычный	Моторный	Язык	Движения языка



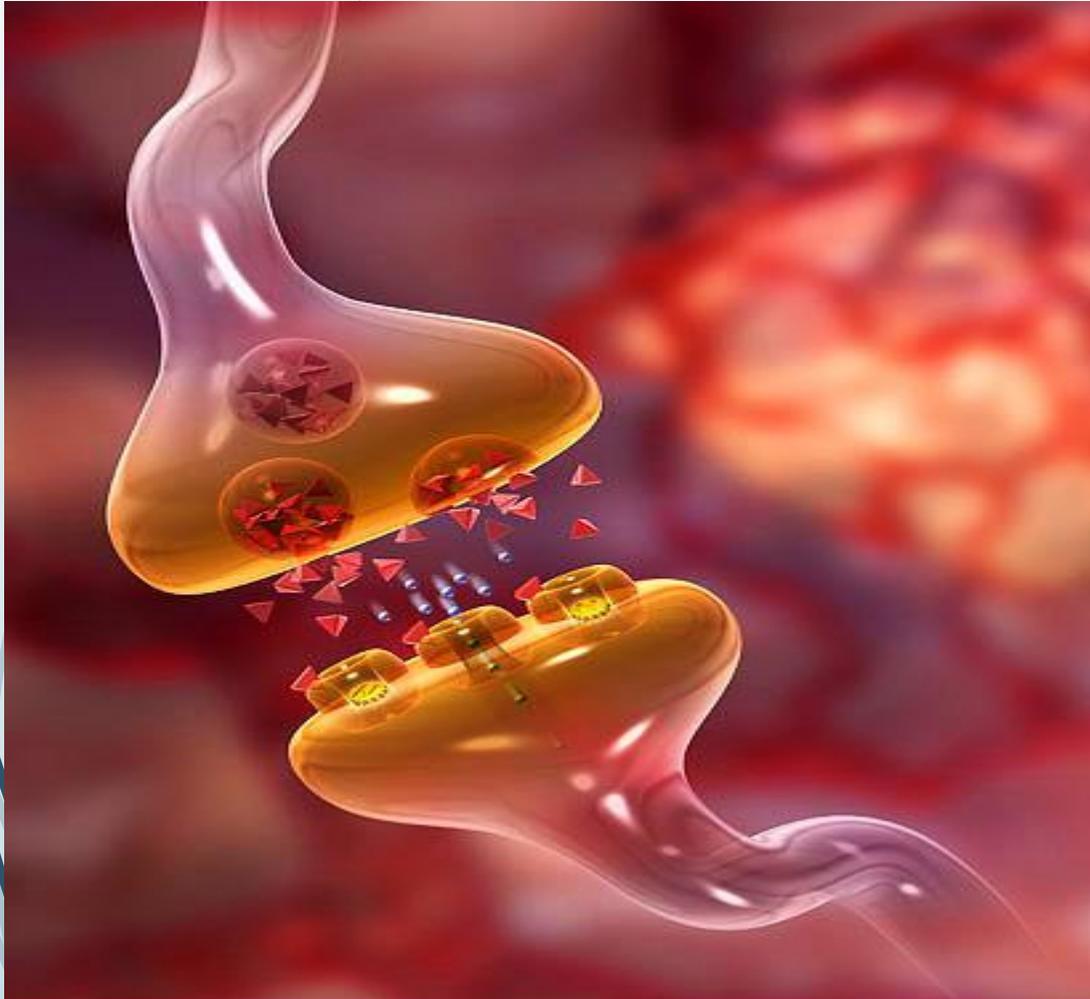
Нервные клетки связаны друг с другом и с клетками органов- мишеней посредством синапсов.



Синапс – это структурно -функциональное образование, которое обеспечивает передачу возбуждения или торможения с нервного волокна на иннервируемую клетку.



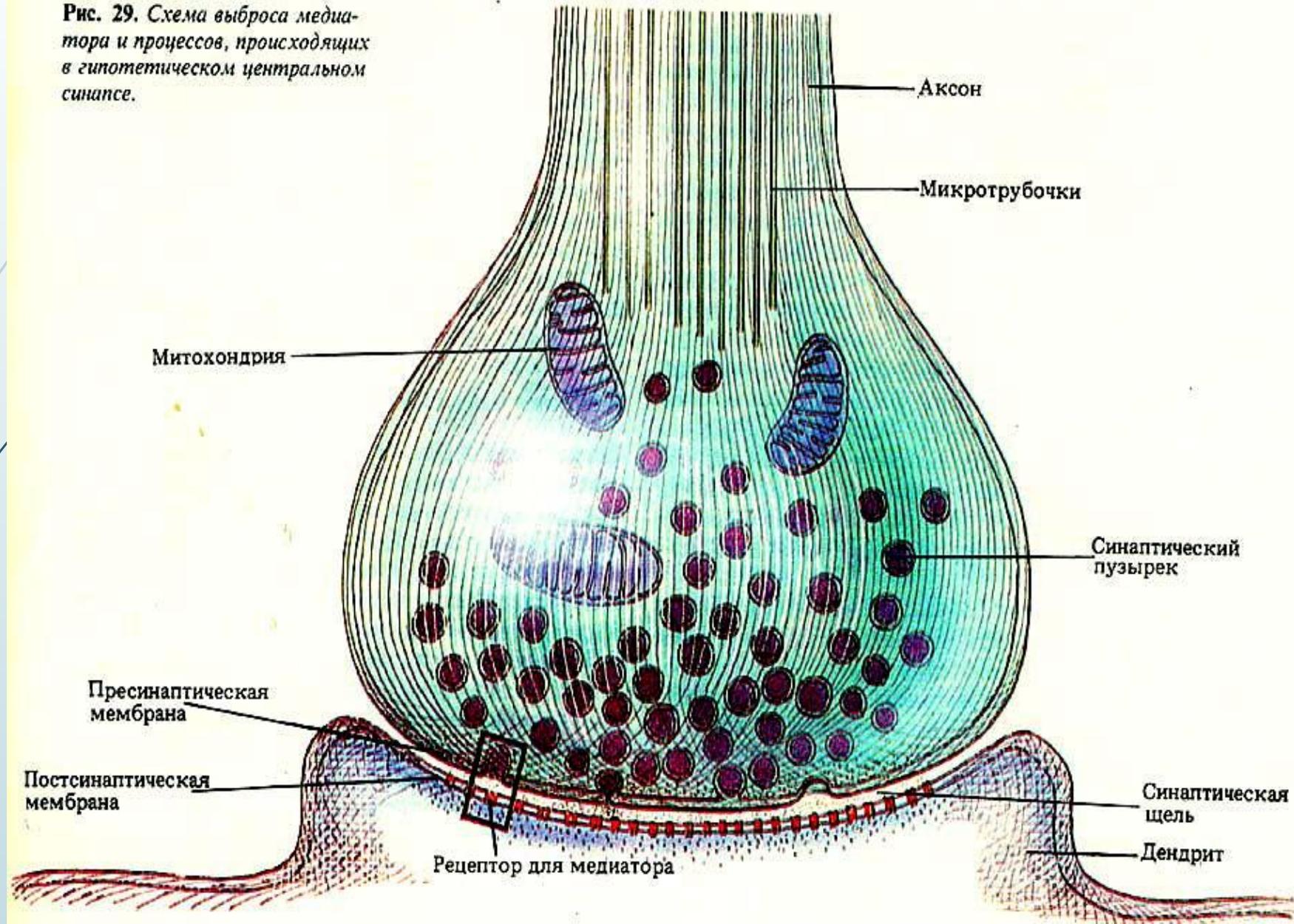
Синапс – место действия лекарств с преимущественным влиянием на эфферентный отдел нервной системы



Синапс состоит из трех основных компонентов:

- пресинаптической мембраны
- постсинаптической мембраны
- синаптической щели

Рис. 29. Схема выброса медиатора и процессов, происходящих в гипотетическом центральном синапсе.





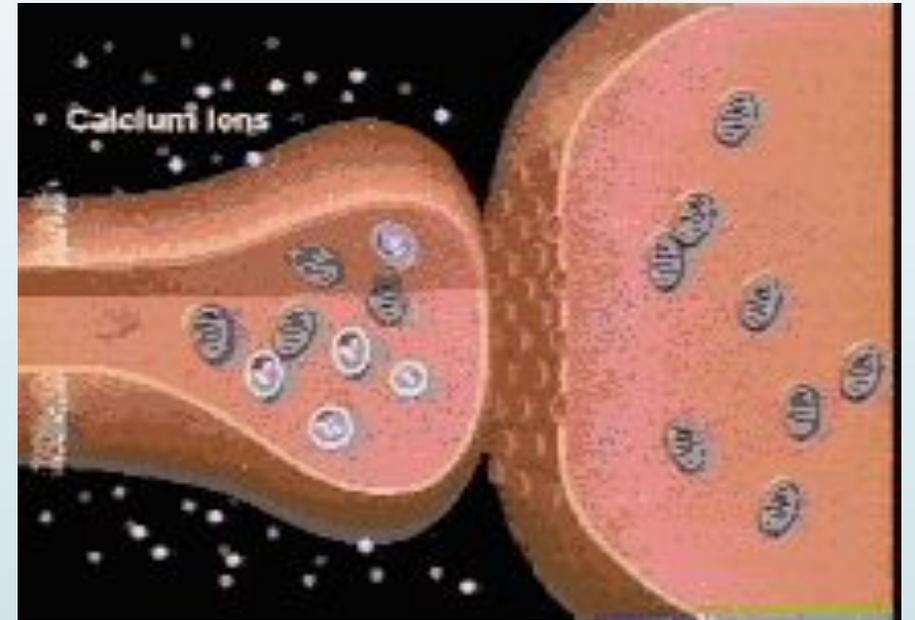
Функции эфферентных нервов обеспечивают медиаторы: АХ, НА, А, дофамин

Медиаторы передают возбуждение с нерва на клетку. В зависимости от вида медиатора периферические синапсы делятся на:

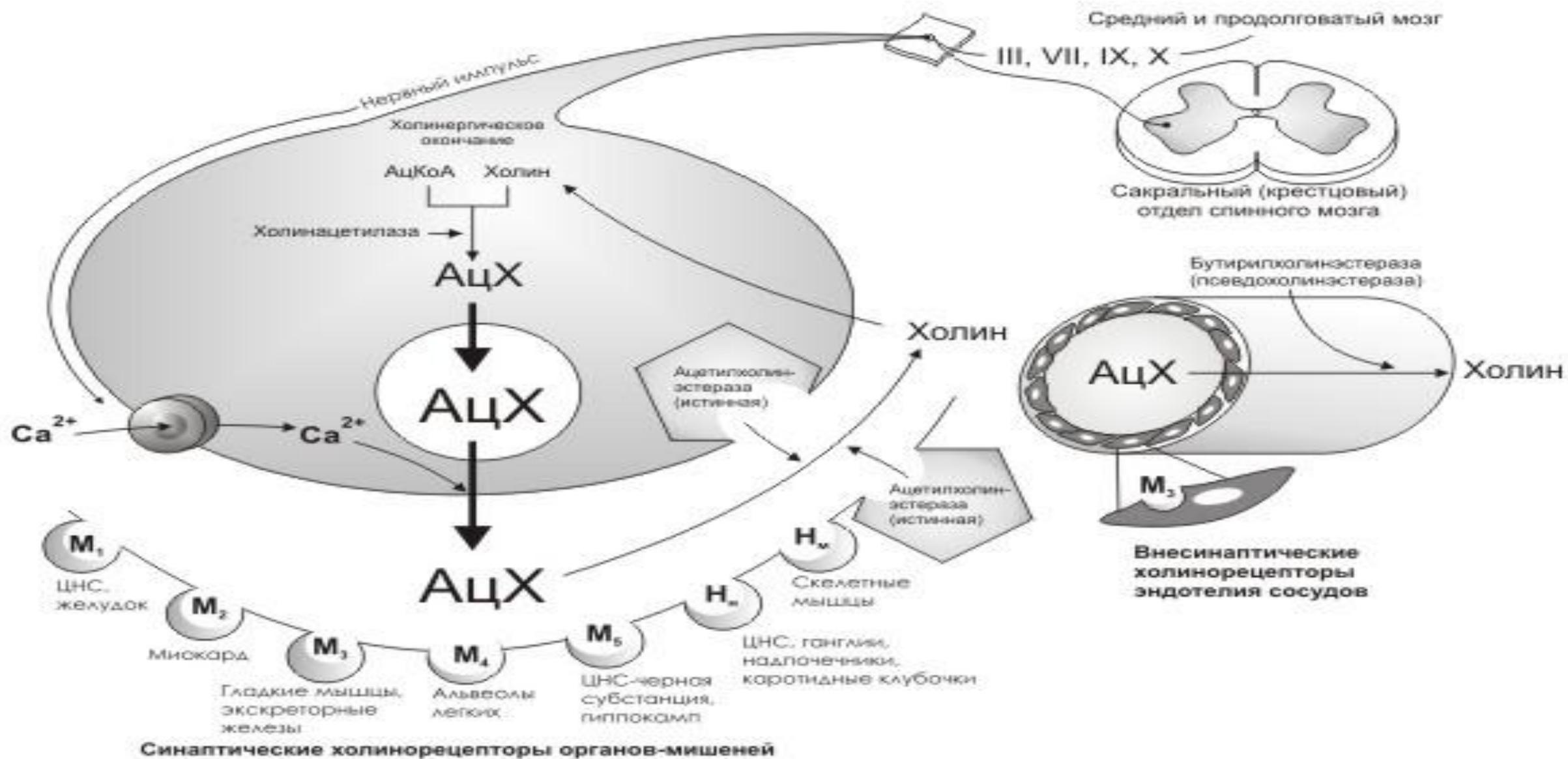
- холинергические (медиатор – ацетилхолин)
- адренергические (медиаторы – адреналин, норадреналин)

Холинергический синапс

- **Холинергический синапс**— место контакта между двумя нейронами или между нейроном и получающей сигнал клеткой в которых передача возбуждения осуществляется посредством ацетилхолина. Служит для передачи нервного импульса между двумя клетками.



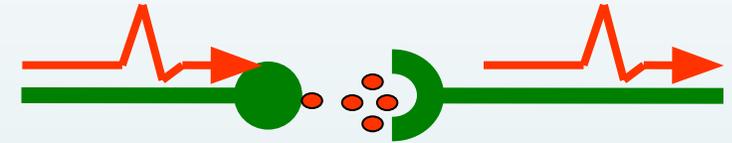
Холинергический синапс



Строение эфферентной иннервации

1. Эфферентные волокна (аксоны) С-типа

- Двухнейронное строение;
- Синапсы (химические контакты в разрывах);
- Медиаторы (передатчики).



2. Рецепторы (участки связывания медиатора)

Адренорецепторы

(медиатор норэпинефрин, место синтеза: 2-й нейрон симпатического нерва)

- $\alpha_{1A,B,C}$ -адренорецепторы;
- $\alpha_{2A,B,C}$ -адренорецепторы;
- $\beta_{1,2,3}$ -адренорецепторы.

Холинорецепторы

(медиатор ацетилхолин, место синтеза - все остальные эффекторные нейроны)

- $M_{1,2,3,4}$ - холинорецепторы;
- Н-холинорецепторы мышечного и нейронального типа.

Классификация холинорецепторов

По группам:

1. М-холинорецепторы (глаза, бронхи, сердце, кишечник, матка, мочевого пузырь, железы внешней секреции)
2. Н-холинорецепторы (ганглии, скелетные мышцы, надпочечники, ЦНС)

Классификация холинергических средств

1. Холиномиметики – подобные ацетилхолину.

- М-холиномиметики
- Н-холиномиметики
- М,Н- холиномиметики
(ацетилхолин)

Классификация холинергических средств

2. Холиноблокаторы

- М-холиноблокаторы
- Н-холиноблокаторы

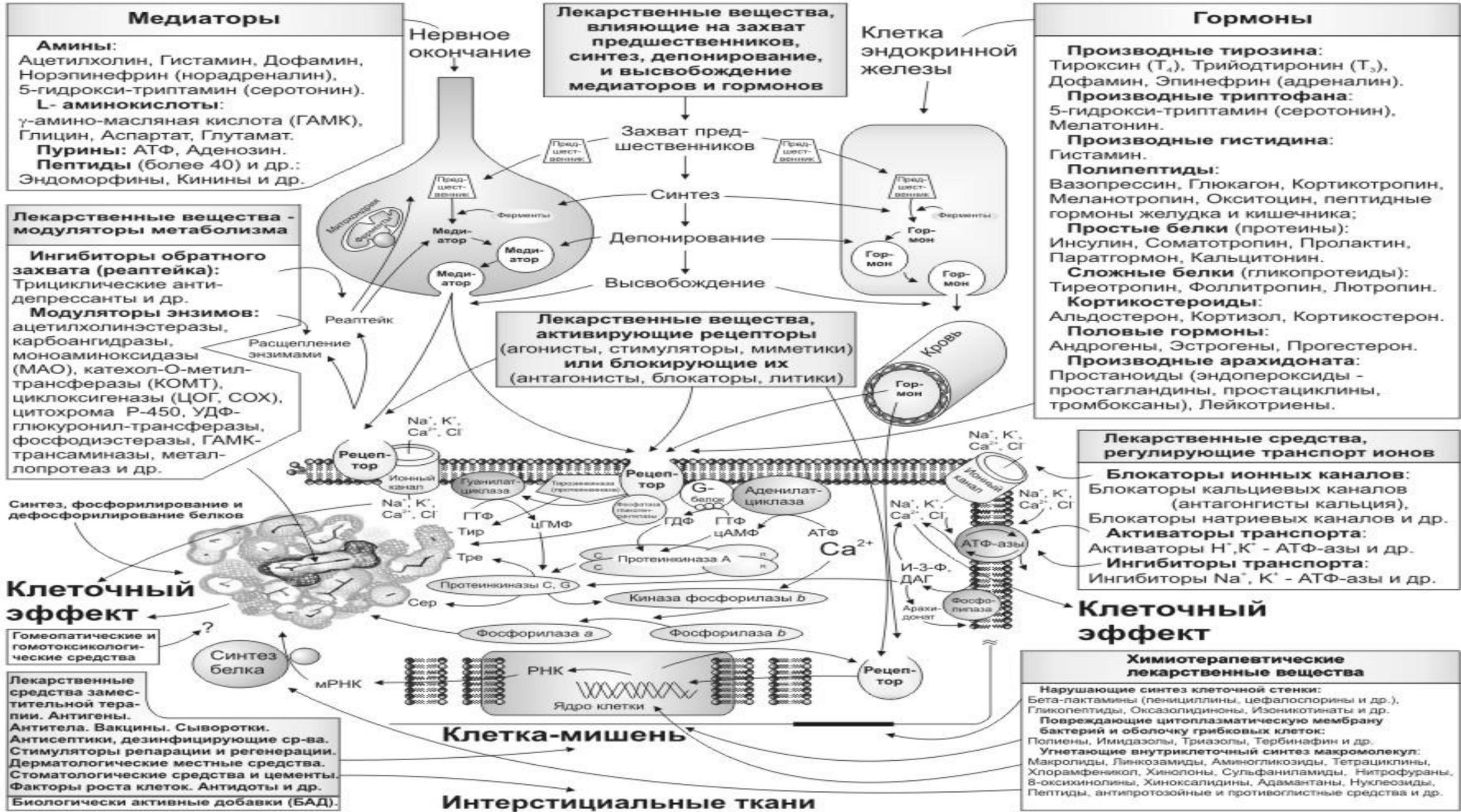
3. Антихолинэстеразные – временно блокируют фермент холинэстеразу, способствуют накоплению в синапсах ацетилхолина.

Эффекты стимуляции холинорецепторов

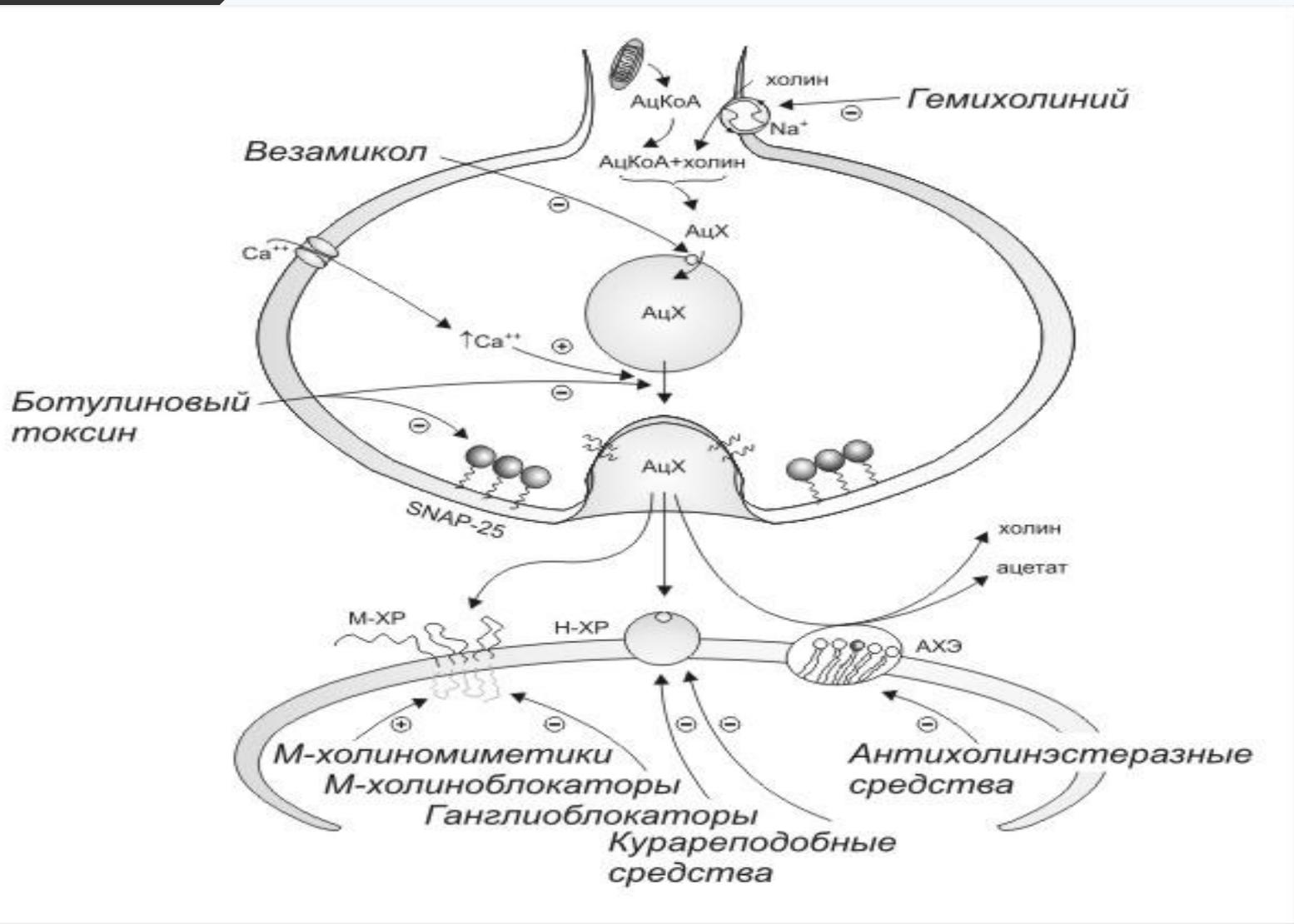
Тип холинорецептора	Локализация рецепторов	Эффекты, вызываемые стимуляцией холинорецепторов
М-холинорецепторы		
M1	ЦНС Энтерохромаффиноподобные клетки желудка	Выделение гистамина, который стимулирует секрецию хлористоводородной кислоты париетальными клетками желудка
M2	Сердце	Уменьшение частоты сердечных сокращений; угнетение атриовентрикулярной проводимости; снижение сократительной активности предсердий
	Пресинаптическая мембрана окончаний постганглионарных парасимпатических волокон	Снижение высвобождения ацетилхолина
M3 (иннервируемые)	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, слёзные, носоглоточные и потовые железы)	Повышение тонуса (за исключением сфинктеров) и усиление моторики желудка, кишечника и мочевого пузыря; Повышение секреции
M3 (неиннервируемые)	Эндотелиальные клетки кровеносных сосудов	Выделение эндотелиального релаксирующего фактора (NO), который вызывает расслабление гладких мышц сосудов
Н-холинорецепторы		
Nm	Скелетные мышцы	Сокращение
Nn	Вегетативные ганглии; энтерохромаффинные клетки мозгового вещества надпочечников; каротидные клубочки	Возбуждение ганглионарных нейронов; секреция адреналина и норадреналина рефлекторное возбуждение дыхательного и сосудодвигательного центров

Эффекты стимуляции холинорецепторов

1. Сужение зрачков (миоз) - сокращение круговой мышцы радужки глаза;
2. Спазм аккомодации (зрение устанавливается на ближнюю точку видения) - сокращение цилиарной (ресничной) мышцы глаза;
3. Уменьшение частоты сокращений сердца;
4. Повышение тонуса бронхов;
5. Повышение тонуса гладких мышц ЖКТ, мочевого пузыря, миометрия;
6. Увеличение секреции слезных, бронхиальных и пищеварительных желёз (слюнных желёз, желёз ЖКТ).



Холинергические средства



Стимуляторы рецепторов – «миметики».

Блокаторы рецепторов – «лититики»

«Литики – всегда сильнее миметиков»

Классификация

ЛС стимулирующие холинорецепторы (холиномиметики)	ЛС блокирующие холинорецепторы (холиноблокаторы)
М-холиномиметики: <ul style="list-style-type: none">• Pilocarpini hydrochloridum• Aceclidinum	М-холиноблокаторы: <ul style="list-style-type: none">• Atropini sulfas• Extractum Belladonnae siccum• Atroventum• Scopolamini hydrobromidum• Gastrocepinum• Platyphyllin hidrotartras
Н-холиномиметики: <ul style="list-style-type: none">• Cytitonum• Lobelini hydrochloridum	Н-холиноблокаторы: <ol style="list-style-type: none">1. <u>Ганглиоблокаторы</u><ul style="list-style-type: none">• Benzohexonium• Pentaminum• Hygronium2. <u>Миорелаксанты:</u> Dithylinum, <u>ЛИСТЕНОН</u><ul style="list-style-type: none">• Тубарин, Ардуан, Норкурон
Ацетилхолинэстеразные средства (АХЭ): <ul style="list-style-type: none">• Proserinum• Galantamini hydrobromidum	

M-холиномиметики

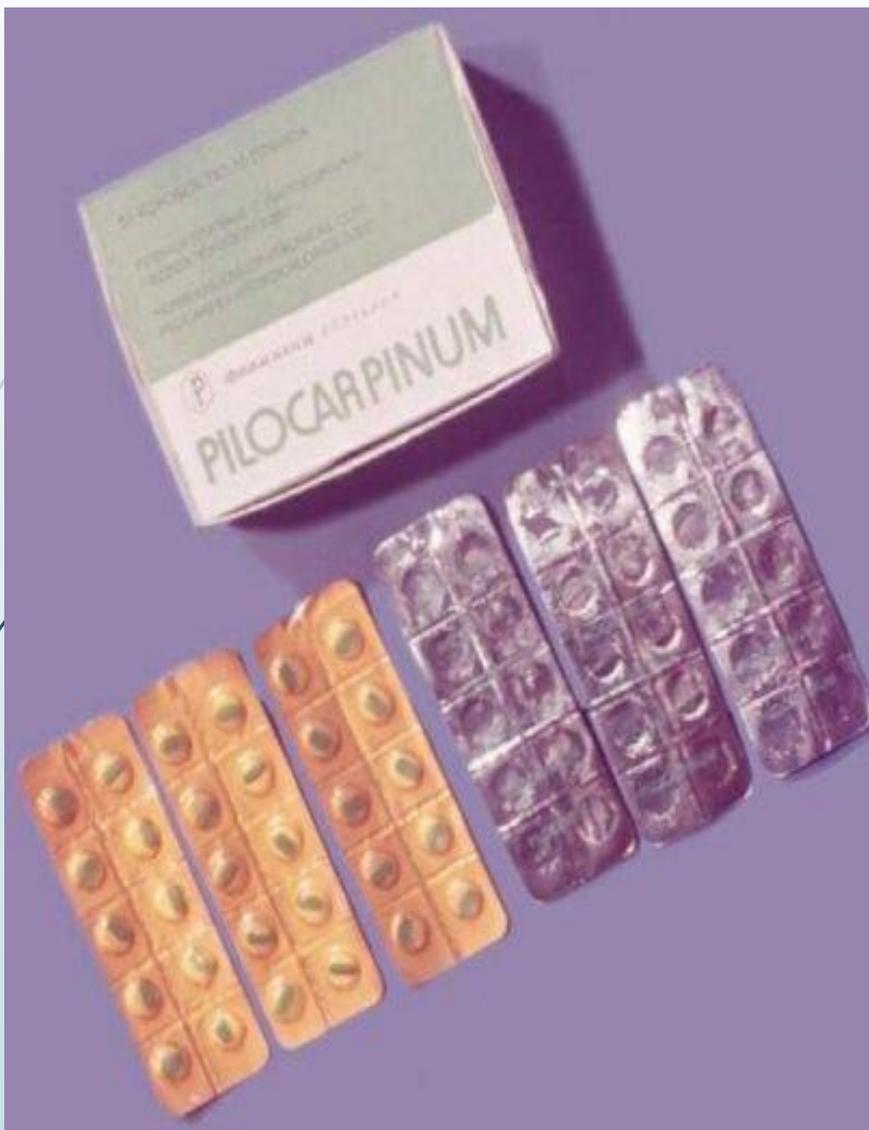
Механизм действия: _____ возбуждают M-холинорецепторы

Pilocarpini hydrochloridum.

Форма выпуска:

- 1% и 2% раствор по 5мл и 10мл – капли для глаз
- 1 и 2% мазь;
- пленка для глаз 0,0027г.





Основной Фармакологический эффект:
-снижение внутриглазного давления



Показания:
глаукома

Побочные эффекты:

- Сужение зрачка (миоз)
- Спазм аккомодации



Асеclidinum

Форма выпуска :

*1% - 5мл глазные капли

*3 и 5% мазь для глаз.

* 0,2% раствор для инъекций в ампулах
по 1 мл для в/м введения

Асеслiдинум

ОФЭ: :

- * снижение внутриглазного давления
- * повышение тонуса гладких мышц

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ:

- глазные капли - при глаукоме
- Раствор д/и - при атонии кишечника, мочевого пузыря или матки.



M-холиномиметики

Побочные эффекты:

- Брадикардия
- Бронхоспазм
- Усиление секреции желез желудка
- Слюнотечение

M-холиноблокаторы

Механизм действия: препятствуют действию ацетилхолина на M-холинорецепторы

К M-х/б относятся:

- Атропина сульфат
- Экстракт белладонны
- Вибуркол
- Атровент
- Скополамина гидробромид
- Гастроцепин
- Платифиллина гидротартрат

Atropini sulfas

Форма выпуска:

- Капли для глаз 1% - 5мл, действует 5-6 дней
- Раствор 0,1% - 1мл (в/м, в/в, п/к)

Основной фармакологический эффект:

- Снижает секрецию слюнных и желудочных желез
- спазмолитический (снижается тонус гладких мышц)
- ЧСС ↑
- расслабляет бронхи



Показания:

- ❖ премедикация
- ❖ колики (печёночные, почечные)
- ❖ брадикардия

Атропин не применяют при бронхиальной астме, а используют «Атровент» - ингалятор 10 ml; «Беродуал»

Побочные эффекты:

- ✓ сухость во рту
- ✓ тахикардия
- ✓ Атропиновый психоз



Platyphyllin hydrotartras

Форма выпуска:

- Таблетки 0,005 г
- Раствор в ампулах 0,2% - 1 мл, п/к
- Суппозиторий 0,01г

Действует избирательно на гладкие мышцы

Фармакологический эффект:

СПАЗМОЛИТИЧЕСКИЙ

Показания: спазм сосудов, колики, угроза выкидыша

Побочные действия: Такие же, как и у атропина, но в меньшей степени



Scopolamini hydrobromide

Форма выпуска:

- Раствор 0,05% - 1мл раствор в ампулах, п/к
- Таблетки

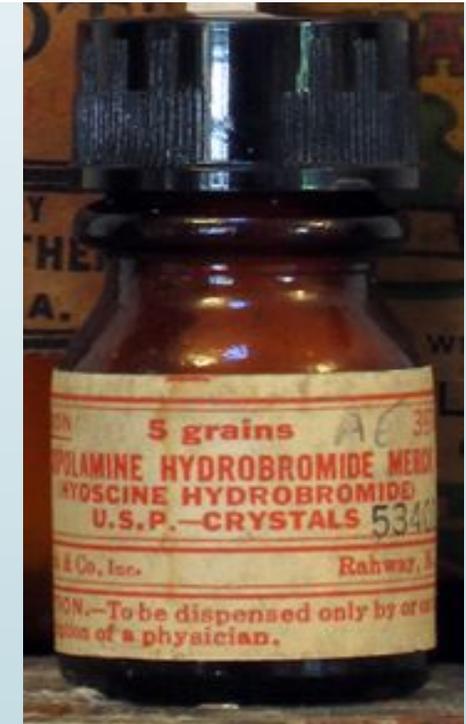
Фармакологический эффект:

расширение зрачков, паралич аккомодации, брадикардия, расслабление гладких мышц, уменьшение секреции пищеварительных и потовых желез, вызывает седативный (успокаивающий) эффект.

Показания: болезнь Паркинсона, рвота, при морской и воздушной болезни.

Противопоказания: глаукома

Побочные эффекты: возбуждение, галлюцинации (бред, видения, приобретающие характер реальности).



Gastrocepin

Форма выпуска:

- Таблетки по 25мг и 40мг
- Раствор в ампулах по 2 мл, в/м или в/в

Фармакологический эффект: уменьшает образование соляной кислоты в желудке .

Показания: язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки

Побочные действия редко сухость во рту, нарушения аккомодации, тахикардия, запор, диарея, задержка мочи, головная боль

Противопоказания: глаукома, доброкачественная гиперплазия предстательной железы, тахикардия.



Extractum Belladonnae siccum

Форма выпуска:

- порошок бурого цвета;
- таблетки «Бесопролол», «Белоспонт»,

Фармакологическое действие: спазмолитический.

Показания:

- Спазмы
- Колики
- Угроза выкидыша
- геморрой, трещины заднего прохода.



Viburkol

Форма выпуска: свечи

Фармакологическое действие: спазмолитическое

Показания:

- Кишечная колика, спазм
- лихорадочный синдром
- Угроза выкидыша
- метеоризм



АНТИХОЛИНЭСТЕРАЗНЫЕ СРЕДСТВА (АХЭ)

Механизм действия: временно блокируют холинэстеразу, способствуют накоплению в синапсах АЦХ

Proserinum

Форма выпуска:

- Раствор 0,05% 1 мл в ампулах, в/м, п/к, в\в капельно

Фармакологическое действие:

- повышает тонус гладких и скелетных мышц
- Улучшает нервно-мышечную передачу импульса
- Снижает внутриглазное давление



Показания:

- Атония кишечника и мочевого пузыря
- Миастения, парезы, параличи
- Глаукома
- Антидот миорелаксантов

При передозировке наблюдается:

Гиперсаливация (обильное слюноотделение), обильное потоотделение, диспепсические расстройства (расстройства пищеварения), частое мочеиспускание, нарушение зрения, головная боль, головокружение, подергивание мышц языка и скелетной мускулатуры, тошнота, рвота.

Противопоказания: Эпилепсия, брадикардия, бронхиальная астма, стенокардия, выраженный атеросклероз.



Galantamini hydrobromidum

Форма выпуска: раствор в ампулах 0,1% 0,25% 0,5% и 1% по 1мл. Вводят п/к

Фармакологическое действие – антихолинэстеразное

Показания к применению: Миастения, миопатия, неврит, остаточные явления после полиомиелита: психогенная и спинальная импотенция; при необходимости как антидот миорелаксантов.

Побочные действия: слюнотечение, головокружение, брадикардия.

Противопоказания: Эпилепсия, стенокардия, брадикардия, бронхиальная астма.



Н-холиномиметики

возбуждают н-холинорецепторы синокаротидного клубочка и хромоаффинной ткани надпочечников, что приводит к рефлекторному повышению тонуса дыхательного и сосудодвигательного центров, усилению выброса адреналина.

Рецепт

- Rp.: Sol. Lobelini hydrochloridi 1 % 1 ml
- D. t. d. N. 5 in ampullis.
- S. Вводить 0,5 мл внутривенно струйно медленно на физ. Растворе.





国药准字H31021342

盐酸洛贝林注射液

LOBELINE HYDROCHLORIDE INJECTION

1ml:3mg



上海禾丰制药有限公司

Harvest PHARMACEUTICAL CO., LTD.

上海外灘18號25樓 電話：021-51012312

傳真：021-51012311 郵政編碼：200002





□ **ЦИТИТОН** (*Cytisinum*) - 0,15 % раствор алкалоида цитизина. Цититон стимулирует рефлекторно дыхательный центр, действуя подобно лобелину гидрохлориду. Цититон повышает артериальное давление, возбуждая Н-холинорецепторы симпатических ганглиев и надпочечников. Цититон применяют при рефлекторных остановках дыхания, наступивших при операциях, травмах, коллаптоидных состояниях и др. Цититон противопоказан при артериальной гипертензии, атеросклерозе (из-за способности повышать артериальное давление). Форма выпуска: ампулы по 1 мл. Список Б.

Рецепт

- Rp.: Cytitoni 1 ml
- D. t. d. N. 10 in ampullis.
- S. По 1 мл внутривенно.





Цитизин (табекс), лобелин(лобесил), анабазин применяют для уменьшения абстиненции при отказе от курения.

□ **ТАБЕКС** (*Tabex*) - содержит цитизин (0,0015 г в таблетке) способствует отвыканию от курения. Табекс принимают по схеме: начинать с 6 таблеток в день, постепенно уменьшая дозу до 1-2 таблеток в день. Курс лечения 25 дней. Форма выпуска: таблетки. Список Б.





▣ **ЛОБЕСИЛ** (*Lobesyl*) - включает лобелина гидрохлорида 0,002 г, магния трисилаката 0,075 г, кальция карбоната 0,025 г. Лобесил облегчает состояние абстиненции при отказе от курения, способствует отвыканию от курения. Форма выпуска: таблетки. Список Б.

A dark blue arrow points to the right at the top left. Below it, several thin, curved lines in shades of blue and grey sweep across the left side of the slide.

H-холиноблокаторы

Вещества, которые блокируют никотин-чувствительные холинорецепторы.

К ним относят ганглиоблокаторы и миорелаксанты периферического действия (курареподобные средства).

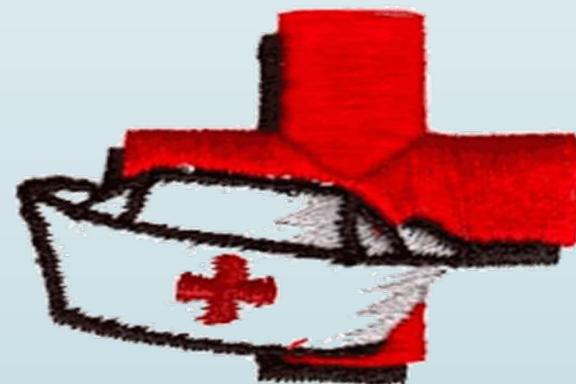


□ **Ганглиоблокаторы** - это средства, блокирующие передачу возбуждения в вегетативных ганглиях (парасимпатических и симпатических), а также Н-холинорецепторы клеток мозгового вещества надпочечников. Вследствие этого расширяются периферические сосуды и улучшается кровообращение, расширяются кровеносные сосуды (артериальные и венозные) и снижается артериальное давление, ухудшаются секреторная и моторная функции желудка и кишок.

Бензогексоний (Benzohexonium)

ампулы по 1 мл 2,5% раствора

- **Показания к применению:**
 - Гипертонический криз
 - управляемая гипотония (искусственное контролируемое снижение артериального давления).





Пентамин (Pentaminum) - Ганглиоблокирующее средство, блокирует н-холинорецепторы вегетативных ганглиев (симпатических и парасимпатических). Оказывает угнетающее влияние на каротидные клубочки и хромоаффинную ткань надпочечников. В больших дозах может блокировать н-холинорецепторы скелетных мышц и ЦНС. Оказывает гипотензивное, артерио- и венодилатирующее действие. Уменьшает выведение катехоламинов надпочечниками и ослабляет рефлекторные прессорные реакции, что вызывает тахикардию, парез аккомодации, мидриаз, расширение бронхов, снижение моторики органов желудочно-кишечного тракта и секреции желез, тонуса мочевого пузыря.

Показания к применению:

Гипертоническая болезнь (стойкий подъем артериального давления) I, II стадии и гипертонические кризы (быстрый и резкий подъем артериального давления).

ОАО «ДАЛЬХИМФАРМ»



650021, г. Хабаровск, ул. Тихоокеанская, 22, 119 (4112) 62-81-02

ПЕНТАМИН

Адрантин Бронх

раствор для инъекций 5%

10 ампул
по 1 мл

СВЕТЛО-ЖЕЛТЫЙ ЖЕЛТЫЙ
или ГОЛУБО-БЕЛЫЙ
или БЕЛЫЙ осадок

— 20 л
— 20 л

СТЕРИЛЬНО - ВНУТРИВЕННО - ВНУТРИМЫШЕЧНО



Хранить в защищенном от света месте
при температуре от 18 до 25°C
Применять по назначению врача
Сторожливо по рецепту врача
ФН 60213101-2000 от 25.04.2003



Миорелаксанты (лат. *myorelaxantia*; от мио - мускул + *relaxans, relaxantis* — ослабляющий, распускающий) — лекарственные средства, снижающие тонус скелетной мускулатуры с уменьшением двигательной активности вплоть до полного обездвиживания.



ТУБОКУРАРИНА ХЛОРИД (Tubocurarinum-chloridum) - Показания к применению тубокурарина

Тубокурарин применяется:

В хирургии и анестезиологии — как миорелаксант, вызывающий длительной расслабление мускулатуры;

В ортопедии и травматологии — при репозиции отломков, вправлении сложных вывихов и т. п.;

В психиатрии — для предупреждения травматических повреждений при судорожной терапии больных шизофренией.

Правила применения

Тубокурарина хлорид вводят внутривенно из расчета 0,4–0,5 мг/кг под ИВЛ.

Для более длительного расслабления мышц препарат вводят дополнительно в дозе, равной $\frac{2}{3}$ предыдущей (во избежание кумуляции тубокурарина).

При операции, продолжающейся 2–2,5 часа, вводят до 45 мг препарата.

Побочные явления

Введение тубокурарина требует осторожности, так как он может вызвать остановку дыхания. При необходимости для ослабления действия миорелаксанта вводят лекарственные средства-антагонисты (антидоты миорелаксантов), действие тубокурарина хлорида купирует [Прозерин](#).

Противопоказания к применению тубокурарина

Миастения, выраженное нарушение функций печени и почек, преклонный возраст.

Состав и форма выпуска

Тубокурарина хлорид — ампулы по 1,5 мл, содержащие 15 мг препарата, в упаковке по 25 ампул.

ДИТИЛИН (Dithylinum). - **Показания к применению:**

Принтиубации (введении трубки в гортань, трахею или бронхи для восстановления их проходимости или для проведения наркоза или искусственной вентиляции легких), эндоскопических процедурах (методах осмотра каналов и полостей тела при помощи оптических приборов /бронхо- и эзофагоскопия, цитоскопия и др./), кратковременных операциях. **Побочные действия:** Возможно угнетение дыхания.

Противопоказания:

Глаукома (повышенное внутриглазное давление). Нельзя смешивать растворы дитилина с растворами барбитуратов и донорской кровью.

Форма выпуска:

Ампулы по 5 и 10 мл 2% раствора в упаковке по 10 штук.



