

# Сравнительная характеристика МХБ

## М-холиноблокаторы



**М-холинорецепторы по отношению к М-холинорецепторам являются антагонистами, т.е. обладают аффинитетом, не обладают внутренней активностью и препятствуют действию агонистов. В условиях целого организма М-холиноблокаторы устраняют действие ацетилхолина, который выделяется из окончаний постганглионарных парасимпатических волокон. М-холиноблокаторы блокируют влияние парасимпатической иннервации; фармакологические эффекты М-холиноблокаторов противоположны эффектам возбуждения парасимпатической иннервации.**



# **M-холиноблокаторы:**

- 1) расширяют зрачки глаз;
- 2) вызывают паралич аккомодации;
- 3) учащают сокращения сердца;
- 4) облегчают атриовентрикулярную проводимость;
- 5) снижают тонус гладких мышц бронхов, желудочно-кишечного тракта, мочевого пузыря;
- 6) уменьшают секрецию слюнных, бронхиальных, пищеварительных, потовых желез.

К М-холиноблокаторам относятся атропин, скополамин, платифиллин, ипратропий, тропикамид, пирензепин, тригексифенидил.

Наиболее известным препаратом данной группы является **атропин**, поэтому всю группу нередко называют группой атропина, или **атропиноподобными средствами**.

**Атропин** — алкалоид, который содержится в белладонне (красавке), дурмане, белене. Препарат назначают внутрь, под кожу, внутривенно. Длительность действия атропина при энтеральном или парентеральном введении — около 6 ч. При применении атропина в офтальмологии длительность действия препарата — несколько суток.

### **Фармакологические эффекты атропина**

- 1) Расширение зрачков глаз (мидриаз).
- 2) Паралич аккомодации (циклоплегия).
- 3) Учащение сокращений сердца (тахикардия).
- 4) Облегчение атриовентрикулярной проводимости.
- 5) Расслабление гладких мышц бронхов, желудочно-кишечного тракта, мочевого пузыря.
- 6) Снижение секреции бронхиальных и пищеварительных желез.
- 7) Снижение секреции потовых желез.

## Применение атропина

### 1. Офтальмология.

Атропин применяют при иритах и иридоциклитах. Атропин можно использовать для исследования глазного дна (расширение зрачков) или определения истинной рефракции глаза. Однако длительность действия атропина на глаз около 7 сут, поэтому для указанных целей применяют М-холиноблокаторы более короткого действия, например, тропикамид (действует около 4 ч).

### 2. Кардиология.

Атропин применяют при брадиаритмиях и атриовентрикулярном блоке.

### 3. Пульмонология.

Атропин применяют при бронхиальной астме.

### 4. Гастроэнтерология.

- Атропин уменьшает секрецию HCl, так как блокирует: — M3-холинорецепторы париетальных клеток (уменьшается продукция HCl);

— M1-холинорецепторы энтерохромаффиноподобных клеток

— M3-холинорецепторы G-клеток, выделяющих гастрин

— M2-холинорецепторы D-клеток желудка, продуцирующих соматостатин

**Атропин эффективен при кишечной колике (болезненные спазмы кишечника), менее эффективен при печеночной колике и малоэффективен при почечной колике.**

### 5. Анестезиология.

**Атропин используют в порядке премедикации при хирургических операциях для предупреждения рефлекторной брадикардии, а также для уменьшения избыточной секреции слюнных и бронхиальных желез.**

**Атропин обладает высоким аффинитетом к М-холинорецепторам. Поэтому М-холиномиметики мало эффективны при отравлениях атропином.**

**Скополамин** — алкалоид, который содержится в тех же растениях, что и атропин; наиболее высокое его содержание в скополии. По химическому строению и фармакологическим свойствам скополамин сходен с атропином. **В отличие от атропина скополамин в терапевтических дозах оказывает отчетливое угнетающее влияние на ЦНС, действуя как седативное (успокаивающее) средство.**

**В практической медицине используют угнетающее влияние скополамина на вестибулярный аппарат.** Скополамин применяют при вестибулярных расстройствах (головокружение, нарушения равновесия, походки), для профилактики болезни движения (морская и воздушная болезнь). Скополамин входит в состав таблеток «Аэрон», которые принимают перед морскими поездками, полетами на самолетах. Продолжительность действия этих таблеток около 6 ч. При длительных поездках применяют трансдермальную терапевтическую систему со скополамином — пластырь, который выделяет скополамин в течение 72 ч; пластырь наклеивают на здоровую кожу за ухом.

Кроме того, скополамин используют в тех же случаях, что и атропин: перед наркозом для профилактики рефлексной брадикардии и уменьшения секреции слюнных и бронхиальных желез, а также в качестве спазмолитического средства.

**Тропикамид** применяют в офтальмологической практике в глазных каплях для исследования глазного дна и определения истинной рефракции глаз. Мидриаз и циклоплегия развиваются через 20—30 мин. Длительность действия 2—4 ч.

В офтальмологической практике используют также гоматропин, циклопентолат, которые действуют около 24 ч.



атратропии (атривент), применяется в виде аэрозоля при бронхиальной астме.

**Платифиллин** — алкалоид крестовника. Помимо М-холиноблокирующей активности, платифиллину свойственно миотропное спазмолитическое действие, т.е. расслабляющее влияние непосредственно на гладкие мышцы внутренних органов, кровеносных сосудов. Таким образом, способность платифиллина расслаблять гладкие мышцы внутренних органов обусловлена М-холиноблокирующей активностью и миотропными спазмолитическими свойствами.

В связи с миотропным спазмолитическим действием платифиллин в отличие от других М-холиноблокаторов расширяет кровеносные сосуды и может несколько снижать артериальное давление.

Применяют платифиллин (назначают внутрь или вводят под кожу) в основном при спазмах гладких мышц органов брюшной полости, язвенной болезни желудка и двенадцатиперстной кишки, бронхиальной астме.

**Пирензепин** (гастроцепин) блокирует преимущественно М1-холинорецепторы. В связи с блокадой М1-холинорецепторов энтерохромаффиноподобных клеток пирензепин снижает их способность выделять гистамин. Из-за уменьшения продукции гистамина снижается секреция хлористоводородной кислоты желудочного сока париетальными клетками.

В средних терапевтических дозах пирензепин мало влияет на величину зрачка, аккомодацию, сокращения сердца и вызывает лишь некоторую сухость во рту. Применяется при лечении язвенной болезни.

**Тригексифенидил** (циклодол) оказывает выраженное угнетающее влияние на М-холинорецепторы ЦНС. Применяется при болезни Паркинсона.

**Дарифенацин** избирательно блокирует М3-холинорецепторы; может быть применен в клинике для снижения тонуса мочевого пузыря.

**Все М-холиноблокаторы  
противопоказаны при глаукоме!**

**В стоматологии м-ХБ (атропин, метацин, скополамин) используют при операциях для снижения секреции слюнных желёз, предупреждения ларингоспазма, тошноты и других побочных эффектов, связанных с возбуждением блуждающего нерва. Иногда их назначают больным, страдающим повышенным слюноотечением (б. Паркинсона)**