

# АДРЕНЕРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

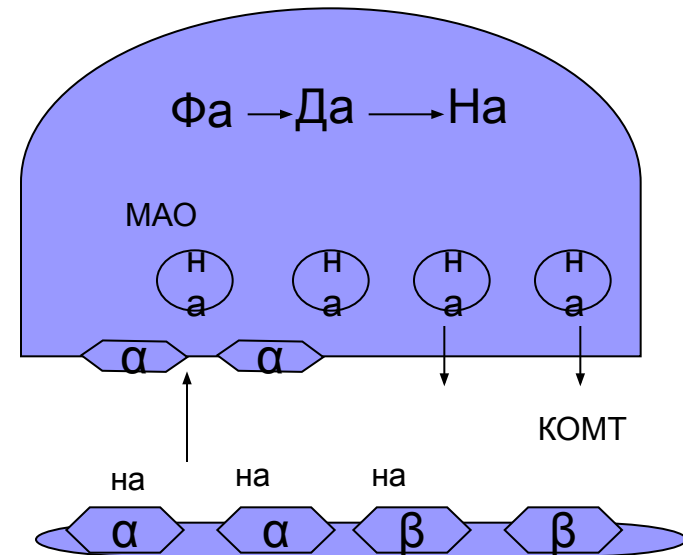
# АДРЕНЕРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

(Адреномиметические и адреноблокирующие средства)

- это средства, влияющие на передачу возбуждения в адренергических синапсах.

- В адренергических синапсах передача возбуждения осуществляется посредством медиатора норадреналина (НА).
- В пределах периферической иннервации норадреналин принимает участие в передаче импульсов с адренергических (симпатических) нервов на эффекторные клетки.
- В ответ на нервные импульсы происходит освобождения норадреналина в синаптическую щель и последующее взаимодействие его с адренорецепторами постсинаптической мембраны.
- Адренергические рецепторы находятся в ЦНС и на мембранах эффекторных клеток, иннервируемых постганглионарными симпатическими нервами.

## ■ Адренергический синапс



$\alpha$ -рецепторы относятся к рецепторам возбуждающим, а  $\beta$ -рецепторы - рецепторам тормозного плана, однако из этого правила имеются определенные исключения. Так, в сердце, в миокарде преобладающие  $\beta$  - адренорецепторы являются стимулирующими по характеру. Возбуждение  $\beta$  - рецепторов сердца повышает скорость и силу сокращений миокарда, сопровождается повышением автоматизма и проводимости в AV-узле. В ЖКТ и  $\alpha$  - и  $\beta$  -рецепторы являются ингибирующими.

<p><b>Преимущественно <math>\alpha</math>-рецепторы:</b>          Сосуды кожи, слизистых, мозга – <b>сужение</b>          Радиальная мышца зрачка – <b>мидриаз</b>          Слюнные железы – <b>сгущение секрета</b>          Сокращение капсулы селезенки – выброс эритроцитов в кровь</p>	<p><b>Преимущественно <math>\beta</math> – рецепторы:</b>  <math>\beta</math> 1-сердце – <b>учащение ритма, повышение сократимости, проводимости, автоматизма</b>  <math>\beta</math> 2- <b>бронхиальная мускулатура и миометрий – релаксация</b></p>	<p><b><math>\alpha</math> и <math>\beta</math> –рецепторы:</b>          ЖКТ <math>\alpha_2</math> и <math>\beta_2</math> –<b>снижение тонуса и перистальтики</b>  <math>\alpha</math> – <b>сокращение сфинктеров</b>          Мочевой пузырь – <b>сокращение, при расслаблении детрузора</b>          Сосуды :  <math>\alpha</math> - <b>сужение</b>  <math>\beta_2</math> – <b>расширение</b>          Адипоциты <math>\alpha_2</math> и <math>\beta_1</math> – <b>липолиз</b>          Гепатоциты <math>\alpha</math> и <math>\beta_2</math> – <b>гликогенолиз, неоглюкогенез</b>          Тромбоциты <math>\alpha_2</math> -<b>агрегация</b></p>
---	---	---

## Направленность действия веществ может быть следующей:

- 1) влияние на синтез норадреналина;
- 2) нарушение депонирования норадреналина в везикулах;
- 3) угнетение ферментативной инактивации норадреналина;
- 4) влияние на выделение норадреналина из окончаний;
- 5) нарушение процесса обратного захвата норадреналина пресинаптическими окончаниями;
- 6) угнетение экстранейронального захвата медиатора;
- 7) непосредственное воздействие на адренорецепторы эффекторных клеток.

# КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНЕРГИЧЕСКИХ СРЕДСТВ

## **$\alpha$ - $\beta$ -адреномиметики**

- а) Прямого действия - адреналин
- б) Непрямого действия (**симпатомиметики**)
  - эфедрин

## **$\alpha$ - $\beta$ -адреноблокаторы** - лабеталол

## **$\alpha$ -адреномиметики:**

- норадреналин
- мезатон
- нафтизин
- галантамин

## **$\beta$ -адреномиметики**

- а) Неселективные - изадрин
- б) Селективные:
  - сальбутамол
  - Тербуталин
  - Орципреналин

## **$\alpha$ -адреноблокаторы**

- а) Неселективные:
  - тропafen
  - фентоламин
  - дигидроэрготоксин
- б) селективные:

- Празозин
- доксоазин

## **$\beta$ -адреноблокаторы**

- а) Неселективные:
  - пропранолол (анаприлин)
- б) Селективные:

- метопролол
- атенолол
- пиндолол

## **Симпатолитики:**

- октадин
- резерпин
- орнид

## $\alpha$ , $\beta$ -адреномиметик – ЭПИНЕФРИН или АДРЕНАЛИНА ГИДРОХЛОРИД (Adrenalini hydrochloridum)

- **МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ:** оказывает прямой, непосредственный, возбуждающий эффект на  $\alpha$ - и  $\beta$  -адренорецепторы, поэтому он прямой адреномиметик.

### ЭФФЕКТЫ АДРЕНАЛИНА ПРИ ДЕЙСТВИИ НА $\alpha$ -АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ

- Адреналин **суживает** большинство кровеносных сосудов, особенно сосудов кожи, слизистой, органов брюшной полости и пр.
- Адреналин **повышает АД**.
- Действие адреналина при введении в/в развивается практически на «кончике иглы», но развивающийся эффект **кратковременный** всего до 5 минут.
- Стимулируя симпатическую иннервацию радиальной мышцы радужки глаза - m. dilatator pupillae - адреналин **расширяет зрачок (мидриаз)**. Данный эффект кратковременен, практического значения не имеет, имеет только физиологическое значение (чувство страха, "у страха глаза велики").
- **Сокращение капсулы селезенки** сопровождается выбросом в кровь большого количества эритроцитов. Это носит защитный характер при реакциях напряжения, например, вследствие гипоксии и кровопотери.

# ЭФФЕКТЫ, СВЯЗАННЫЕ С ДЕЙСТВИЕМ ЭПИНЕФРИНА (АДРЕНАЛИНА) НА $\beta$ (бета)-адренорецепторы:

**Возбуждая  $\beta_1$ -адренорецепторы, ЭПИНЕФРИН (адреналин) увеличивает все 4 функции сердца:**

- повышает силу сокращений, то есть увеличивает сократимость миокарда (положительный инотропный эффект);
- повышает частоту сокращений (положительный хронотропный эффект);
- улучшает проводимость (положительный дромотропный эффект);
- повышает автоматизм (положительный батмотропный эффект).
- В результате **увеличиваются ударный и минутный объемы**. Это сопровождается повышением метаболизма в миокарде и увеличением потребления кислорода им, снижается эффективность работы сердца.
- Сердце работает неэкономно, КПД становится низким.

# ЭФФЕКТЫ, СВЯЗАННЫЕ С ДЕЙСТВИЕМ ЭПИНЕФРИНА (АДРЕНАЛИНА) НА $\beta$ (бета)-адренорецепторы:

- Возбуждение  $\beta$ 2-адренорецепторов - бронходилатация. Особенно выражено действие адреналина на бронхи, если они находятся в спазме.
- Эпинефрин уменьшает секрецию желез трахеобронхиального дерева (особенно сильно за счет сужения сосудов слизистой оболочки бронхов).
- Расширение под действием эпинефрина коронарных, легочных сосудов, сосудов скелетных мышц, мозга.
- Препарат оказывает слабое возбуждающее действие на ЦНС

## СО СТИМУЛЯЦИЕЙ $\beta$ 1- И $\beta$ 2-АДРЕНОРЕЦЕПТОРОВ СВЯЗАНЫ И МЕТАБОЛИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА:

- Эпинефрин стимулирует ГЛИКОГЕНОЛИЗ (распад гликогена), что ведет к повышению сахара в крови (гипергликемия).
- В крови повышается содержание молочной кислоты, калия, уровень свободных жирных кислот (ЛИПОЛИЗ).



## ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ЭПИНЕФРИНА:

- Как противошоковое средство (при острой гипотонии, коллапсе, шоке) – в/в
- Как противоаллергическое средство (анафилактический шок, бронхоспазм аллергического генеза) - в/в
- Совместно с растворами местных анестетиков для удлинения их эффекта и снижения всасывания (токсичности).
- При остановке деятельности сердца – в/с, в/в.
- При самых тяжелых формах AV-блокады сердца - в/с, в/в.
- Для купирования бронхоспазма у больного с бронхиальной астмой – п/к.
- Для устранения гипогликемической комы – п/к.

## ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА:

- 1) При в/в введении эпинефрин может вызвать аритмии сердца, в виде желудочковой фибрилляции. Аритмии особенно опасны при введении адреналина на фоне действия средств, сенсibiliзирующих к нему миокард (средства для наркоза, например современные фторсодержащие общие анестетики фторотан, циклопропан).
- 2) Легкое беспокойство, тремор, возбуждение (проявление данных эффектов кратковременное).
- 3) При введении эпинефрина может возникнуть отек легких .

## ЭФЕДРИН (Effedrini hydrochloridum) - алкалоид из листьев растения Effedra

### Механизм действия:

- влияя пресинаптически на варикозные утолщения симпатических нервов, он способствует освобождению медиатора норадреналина. Поэтому он называется **симпатомиметиком**.

### ПО ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИМ ЭФФЕКТАМ - аналогичен эпинефрину:

- ✓ Стимулирует деятельность сердца,
  - ✓ повышает АД,
  - ✓ вызывает бронхолитический эффект,
  - ✓ подавляет перистальтику кишечника,
  - ✓ расширяет зрачок,
  - ✓ повышает тонус скелетных мышц,
  - ✓ вызывает гипергликемию.
- 
- ❖ Эффекты развиваются медленнее, но продолжаются более длительно (По влиянию на АД эфедрин действует более длительно - примерно в 7-10 раз).
  - ❖ По активности уступает эпинефрину.
  - ❖ Активен при приеме внутрь.
  - ❖ Хорошо проникает в ЦНС, выражено стимулирует ЦНС. Это находит применение в психиатрической и анестезиологической практике.

## Побочные эффекты эфедрина:

- Повышение артериального давления
- Сердцебиение, тахикардия
- Приступы стенокардии
- Головная боль
- Тремор, напряжение
- Возбуждение, спутанность сознания
- Нарушение сна
- Психоз, галлюцинации
- депрессия
- При повторном введении эфедрина через 10-30 минут от первого введения развивается явление ТАХИФИЛАКСИИ, то есть снижение степени ответа. Связано это с тем, что наступает истощение запасов норадреналина в депо.
- Лекарственная зависимость (психическая).

## ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ЭФЕДРИНА:

- как бронхолитическое средство - при бронхиальной астме, при сенной лихорадке, сывороточной болезни;
- для повышения АД при хронической гипотонии;
- при насморке, т. е. ринитах, когда закапывают раствор эфедрина в носовые ходы (местное суживание сосудов, снижается секреция слизистой носа);
- при AV-блоке;
- в офтальмологии для расширения зрачка (капли);
- в психиатрии при лечении больных с нарколепсией (особое психическое состояние с повышенной сонливостью и апатией);
- при отравлениях снотворными и наркотическими средствами, то есть - средствами, угнетающими ЦНС;
- в анестезиологии при проведении спинномозговой анестезии (профилактика снижения АД).

## НОРЭПИНЕФРИН или НОРАДРЕНАЛИНА ГИДРОТАРТРАТ (НА):

На  $\alpha$ - и  $\beta$ -рецепторы действует как медиатор;  
как лекарство, влияет только на  $\alpha$ -рецепторы.

- Основным эффектом НА является выраженное, но непродолжительное (в течение нескольких минут) повышение АД.
- **Механизм действия:** Это обусловлено прямым стимулирующим влиянием НА на  $\alpha$ -рецепторы сосудов и повышением их периферического сопротивления. В отличие от адреналина повышается систолическое, диастолическое и среднее артериальное давление. Вены под влиянием НА суживаются.
- В ответ на быстро наступающую гипертензию вследствие стимуляции барорецепторов каротидного синуса на фоне НА существенно урежается ритм сердечных сокращений, что является рефлексом с каротидного синуса на центры блуждающих нервов.
- Под влиянием норадреналина сердечный выброс (минутный объем) практически не меняется, но ударный объем возрастает.
- На гладкие мышцы внутренних органов, обмен веществ и ЦНС препарат оказывает однонаправленное с эпинефрином действие, но существенно уступает ему.
- Основной путь введения норадреналина - в/в (в ЖКТ - разлагается; п/к - некроз на месте инъекции). Вводят в/в, капельно, так как действует коротковременно.

## ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ НОРАДРЕНАЛИНА:

- Используют при состояниях, сопровождающихся острым падением АД. Все виды шока, кроме кардиогенного и геморрагического.
- При кардиогенном (инфаркт миокарда) и геморрагическом шоке (кровопотеря) с выраженной гипотензией норадреналин применять **нельзя**, так как в еще большей степени ухудшится кровоснабжение тканей из-за спазма артериол, то есть наступит ухудшение микроциркуляции.

## ПОБОЧНЫЕ РЕАКЦИИ:

- 1) нарушение дыхания;
- 2) головная боль;
- 3) проявление аритмий сердца при сочетании со средствами, повышающими возбудимость миокарда;
- 4) на месте п/к, в/м инъекций возможно появление некроза тканей (спазм артериол), поэтому вводят в/в, капельно.

## СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ ПРЕИМУЩЕСТВЕННО АЛЬФА-АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ: Фенилэфрин (Мезатон), Нафазолин (нафтизин), Ксилометазолин галазолин.

- Фенилэфрин обладает мощным стимулирующим эффектом на  $\alpha$ -адренорецепторы.
- Прессорное его действие ведет к повышению АД. При п/кожном введении эффект длится до 40-50 минут, а при в/венном - в течение 20 минут. Повышение АД сопровождается брадикардией вследствие рефлекторной стимуляции блуждающего нерва.
- На сердце непосредственно не действует.
- На ЦНС оказывает незначительное стимулирующее влияние.

**ПОКАЗАНИЯ ДЛЯ ПРИМЕНЕНИЯ** такие же, что и НА:

НАФТИЗИН и ГАЛАЗОЛИН нашли широкое применение местно в виде капель для закапывания в нос:

- По сравнению с НА и мезатоном вызывают более длительный сосудосуживающий эффект.
- Вызывая спазм сосудов слизистой носа, препараты существенно снижают секрецию экссудата, улучшают проходимость воздухоносных (верхних дыхательных) путей.
- На ЦНС оказывают угнетающее действие.
- В ЛОР практике применяют местно при острых ринитах, аллергических ринитах, синуситах, при воспалении среднего уха с обтурацией слуховой трубы, ларингитах, воспалении гайморовой пазухи (гайморит).



# СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ ПРЕИМУЩЕСТВЕННО $\beta$ -АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ ( $\beta$ -АДРЕНОМИМЕТИКИ):

## ИЗАДРИН – неселективный $\beta$ -адреномиметик

ОСНОВНЫЕ ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ ИЗАДРИНА:

Возбуждая  $\beta_2$ -адренорецепторы бронхов приводит:

- к снижению тонуса бронхов,
- способствует выбрасыванию воды железами слизистой (разжижение мокроты), стимулирует ресничковую очистку бронхов (мукоцилиарный транспорт).
- приводит к в расслаблению мышц матки - токолитический эффект.

Возбуждая  $\beta_1$ -адренорецепторы сердца приводит:

- к снижению легочного и системного сосудистого сопротивления (снижение ОПС), повышению минутного объема кровообращения за счет увеличения ударного объема, а также тахикардии.
- Стимулирует ЦНС, на обмен веществ влияет аналогично адреналину.

ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ:

- для купирования приступов бронхиальной астмы. При ингаляции изадрина бронхолитический эффект развивается очень быстро и сохраняется примерно 1 час.
- при сердечных блокадах, в частности AV-узла, а также при синдроме Адамса-Стокса.

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ: тахикардия, сердцебиение, аритмии, изъязвление слизистой рта при приеме под язык, головная боль, тремор конечностей.

## **СЕЛЕКТИВНЫЕ $\beta_2$ -АДРЕНОМИМЕТИКИ: ОРЦИПРЕНАЛИН (алупент, астмопент), САЛЬБУТАМОЛ, ФЕНОТЕРОЛ (беротек)**

- Препараты отличаются значительно менее выраженным стимулирующим влиянием на  $\beta_1$ -адренорецепторы сердца (селективность не абсолютна).
- препараты эффективны при энтеральном применении и по сравнению с изадрином действие их сохраняется более продолжительное время.

### **ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ:**

- 1) как для купирования, так и для профилактики (хронического лечения) приступов бронхиальной астмы (ингаляционно, внутрь, парентерально);
- 2) для снижения сократительной активности миометрия (токолитики) с целью профилактики преждевременных родов.

## СРЕДСТВА, БЛОКИРУЮЩИЕ АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ.

**Механизм действия:** Адреноблокаторы блокируют адренорецепторы, препятствуя действию на них медиатора норадреналина, а также адреномиметических средств.

### $\alpha$ –АДРЕНОБЛОКАТОРЫ:

К синтетическим препаратам, блокирующим  $\alpha_1$ - и  $\alpha_2$ -адренорецепторы, относятся фентоламин и тропafen.

В связи с тем, что  $\alpha$ -адренорецепторы преимущественно сосредоточены в сосудах, основные фармакологические эффекты данной группы средств связаны с их влиянием на сосудистый тонус.

**ФЕНТОЛАМИН** (регитин) характеризуется выраженным, но кратковременным  $\alpha$ -адреноблокирующим действием.

При внутривенном введении эффект длится 10-15 минут (до 40 минут).  
При в/м, per os введении - эффект длится до 3-4 часов.

### **Фармакологические эффекты:**

- Артериальное давление снижает умеренно
- приводит к купированию спазмов и расширению периферических сосудов, особенно артерий и прекапилляров
- улучшает кровоснабжение мышц, кожи, слизистых.

## ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ:

Фентоламин в настоящее время используют относительно редко:

- 1) при диагностике феохромоцитомы;
- 2) при болезни Рейно, облитерирующем эндартериите, трофических язвах нижних конечностей, то есть при различных заболеваниях, связанных с нарушением периферического кровообращения;
- 3) при геморрагическом, кардиогенном шоке, когда наблюдается спазм артериол;
- 4) при тяжелых гипертонических кризах (редко в инъекционной форме);
- 5) при пролежнях, обморожениях.

**Блокада альфа-2-пресинаптических рецепторов** нарушает механизм обратной отрицательной связи и медиатор норадреналин постоянно поступает в синаптическую щель. С этим связаны **ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ**:

- тахикардия;
- повышение тонуса ЖКТ (поносы);
- головокружение;
- зуд кожи, покраснение ее;
- набухание слизистой оболочки носа;
- при передозировке - ортостатический коллапс.

**Дигидрированные алкалоиды спорыньи:** эргокриптин, эрготоксин, эрготамин.

- Спорынья - гриб, паразитирующий на колосьях ржи.
- Препараты являются альфа-адреноблокаторами, стимулируют сокращение гладкой мускулатуры сосудов, матки.
- Самостоятельно препараты практически не применяют, а используют их лишь в комбинации с другими веществами как антигипертензивные средства.

**Селективные  $\alpha$ -адреноблокаторы: ПРАЗОЗИН (минипресс), ДОКСАЗОЗИН (кардура)** блокируют преимущественно постсинаптические  $\alpha_1$ -адренорецепторы.

По блокирующей активности **празозин** превосходит фентоламин в 10 раз. Основной фармакологический эффект празозина - снижение артериального давления. Данный эффект обусловлен падением тонуса артериальных и, в меньшей степени, венозных сосудов, уменьшением венозного возврата и работы сердца.

Частота сердечных сокращений изменяется не существенно;

Препарат эффективен при введении внутрь. Действие его наступает через 30-60 минут и продолжается 6-8 часов.

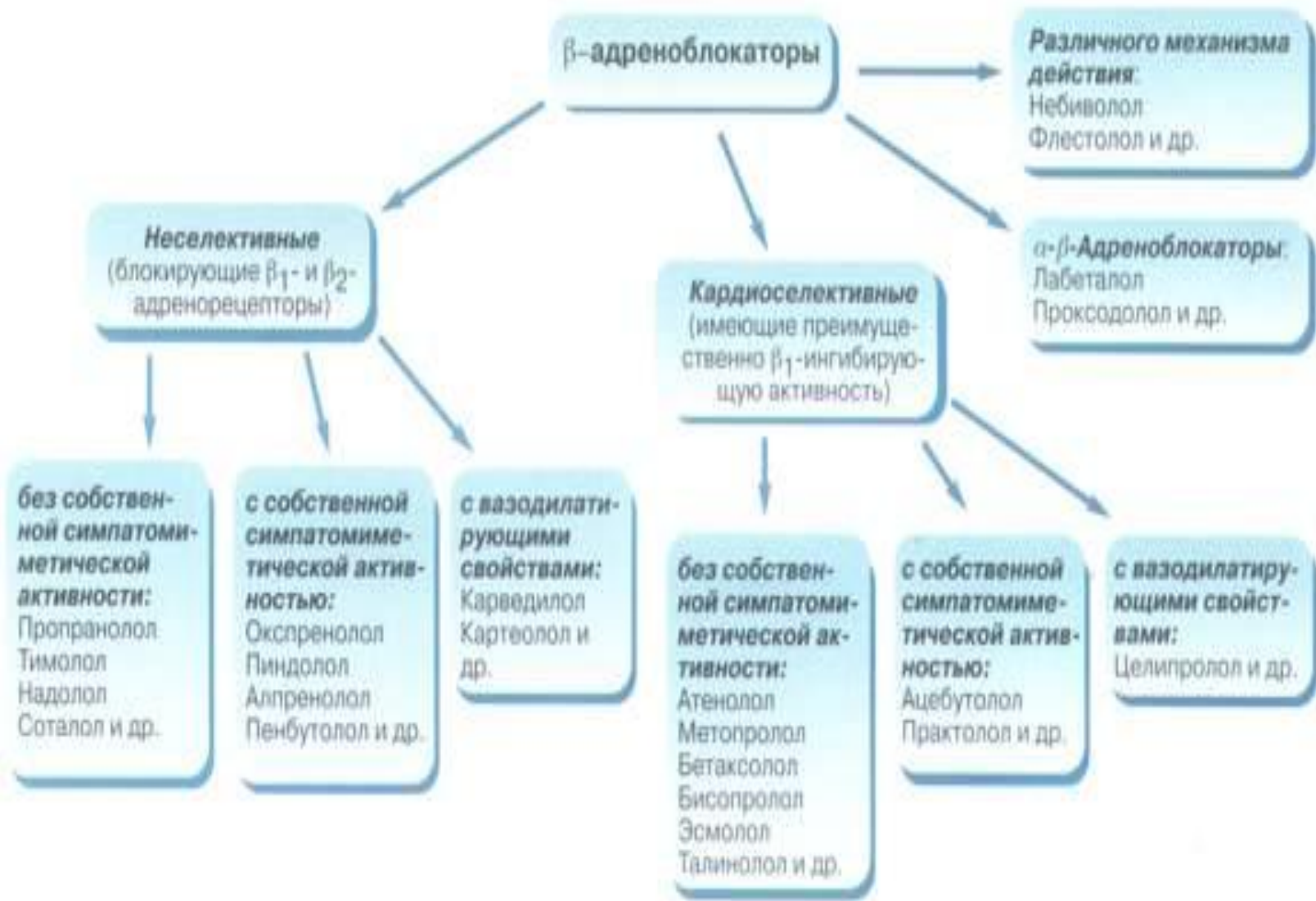
Празозин применяют в качестве антигипертензивного средства при гипертонической болезни (средней степени тяжести).

**Доксазозин** показан при ДГПЖ, АГ.

## **β-АДРЕНОБЛОКАТОРЫ:**

**пропранолол, оксиренолол, пиндолол, соталол, алпренолол, ацебуталол, сектрал, вискен, тразикор, тимолол, атенолол, лабетолол**

- **МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ:** Препараты этой группы избирательно и конкурентно блокируют действие катехоламинов, опосредуемое через бета-адренорецепторы. Так, стимулирующее действие адреналина на бета-рецепторы, а также действие изадрина, блокируется, но положительные инотропные эффекты кальция, теофиллина, сердечных гликозидов не изменяются.
- Под действием этих препаратов происходит ингибирование активности мембранного фермента аденилатциклазы и, таким образом, снижение продукции цАМФ.



# ФАРМАКОЛОГИЧЕСКИЕ ЭФФЕКТЫ $\beta$ -АДРЕНОБЛОКАТОРОВ

на примере **ПРОПРАНОЛОЛА (анаприлин)**

Блокируя  $\beta_1$ -адренорецепторы, **пропранолол:**

- снижает сократимость миокарда,
- подавляет автоматизм,
- замедляет предсердно-желудочковую проводимость,
- ослабляет возбудимость (антиаритмическое действие).
- Снижает потребность миокарда в кислороде и повышает переносимость физических нагрузок у больных, страдающих стенокардией (антиангинальное действие).
- Снижение насосной функции сердца, сердечного выброса приводит к тому, что анаприлин вызывает снижение АД (гипотензивное действие). Гипотензивному эффекту способствует также то, что анаприлин понижает активность ренина (уменьшает выработку его) и обладает центральным гипотензивным действием.



# ПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ $\beta$ -АДРЕНОБЛОКАТОРОВ

- для хронического лечения больных со стенокардией как антиангинальные средства для предупреждения приступов стенокардии;
- как антиаритмические средства при тахиаритмиях предсердного характера (мерцание и трепетание предсердий); пропранолол тормозит проведение импульса через AV-узел и увеличивает время проведения возбуждения от предсердий к желудочкам.
- пропранолол используется при устранении тахикардий различного генеза (при митральном стенозе, тиреотоксикозе, при аритмиях, вызванных адреномиметиками или гликозидами наперстянки);
- в лечении больных с гипертонической болезнью; как гипотензивные средства, инъекции - при кризе;
- иногда для лечения больных хронической открытоугольной формой глаукомы (закапывают в глаз 1-2 раза в сутки).

# ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- Блокада  $\beta_2$ -адренорецепторов бронхов у больных с бронхиальной астмой может спровоцировать приступ бронхоспазма.
- Длительный прием препаратов может довести до сердечного блока, особенно у больных с серьезными нарушениями проводимости.
- Прием бета-адреноблокаторов может вызвать недостаточность сердца.
- При отмене препаратов дозу препарата снижают постепенно, так как при резкой отмене может развиваться инфаркт миокарда.
- С осторожностью надо назначать у больных сахарным диабетом, так как они пролонгируют лекарственную гипогликемию, способствуют развитию атеросклероза.

**Особый интерес представляют соединения, блокирующие преимущественно  $\beta_1$ -адренорецепторы сердца (кардиоселективные).**

**МЕТОПРОЛОЛ** (беталок, лопрессор, спесикор), **АЦЕБУТАЛОЛ**, **АТЕНОЛОЛ**, **БИСОПРОЛОЛ**.

Наиболее часто селективные адреноблокаторы применяют у больных, имеющих хронические обструктивные заболевания легких, сахарный диабет, болезнь Рейно.

Используют при артериальных гипертензиях, стенокардии, суправентрикулярных аритмиях. Побочные эффекты возникают реже.

В последние годы созданы бета-адреноблокаторы с вазодилатирующими свойствами (лабетолол, пиндолол, целипролол), которые имеют важное практическое значение для лечения больных с гипертонической болезнью.

# СИМПАТОЛИТИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА (СИМПАТОЛИТИКИ)

## Механизм действия **Октадина**:

- препятствует обратному захвату норадреналина варикозными утолщениями: происходит блокирование выделения НА в ответ на нервный импульс и его обратного транспорта в окончание симпатического волокна в результате которого тормозятся развитие деполяризации мембраны окончания и активность ее транспортных ферментных механизмов - уменьшение содержания норадреналина в сердце, сосудах и других органах.

## Фармакологические эффекты **Октадина**:

- постепенно развивающееся (в течение нескольких дней) стойкое снижение АД. Этому способствует и уменьшение средечного выброса, развитие брадикардии, угнетение прессорных рефлексов.
- Его полувыведения из организма составляет 120-240 часов (5-10 суток). Максимальный антигипертензивный эффект развивается через 4 часа после перорального приема препарата.
- Стойкое терапевтическое действие возникает лишь через 5-8 дней приема октадина. Постепенность действия связана с тем, что необходимо определенное время для истощения запасов НА в симпатических окончаниях.
- Несмотря на медленное действие октадина, его антигипертензивное действие мощное, длительное, поддерживающее.
- В ЦНС октадин не проникает, его антигипертензивное действие имеет периферическое происхождение.

# Побочные эффекты Октадина

- Главный недостаток октадина - ортостатическая гипотония.
- Общая слабость, адинамия, рефлексорная задержка жидкости в организме.
- Механическое превалирование парасимпатического тонуса ведет к возникновению брадикардии, усилению перистальтики кишечника вплоть до поноса, возникновению тошноты и рвоты. Может возникать сильное набухание слизистой оболочки носа.
- Со снижением симпатического тонуса связаны нарушения эякуляции, страдает половая функция. Поэтому октадин используют лишь при тяжелых формах гипертонической болезни.

## **РЕЗЕРПИН (синонимы - рауседил, серпазил).**

### **Механизм действия.**

- нарушает захват и депонирование НА в везикулах пресинаптических окончаний симпатических нервов,
- в окончаниях симпатических нервов снижается количество норадреналина.

### **Фармакологические свойства**

- Гипотензивное действие. АД при введении резерпина снижается постепенно и максимальный эффект наблюдается через несколько дней, не вызывает ортостатических реакций.
- Нейролептический эффект - оказывает мощное успокаивающее (седативное) и слабое антипсихотическое действие, в связи с чем его относят также и к группе нейролептиков.

### **Побочные эффекты:**

- Усиление перистальтики кишечника (вплоть до поноса), спазмы кишечника (усиление освобождения ацетилхолина из окончаний блуждающего нерва), гиперацидные состояния, обострение гастрита и язвенной болезни (ульцерогенный эффект).
- Усиление эффектов гистамина способствует набуханию слизистой оболочки носа и затруднению носового дыхания.
- Угнетение ЦНС, слабость, развитие депрессивных состояний.
- Угнетает дыхание, снижает температуру тела.
- Вызывает бронхоспазм у больных бронхиальной астмой.

### **Показания к применению**

- Для лечения больных с легкими и средней тяжести формами гипертонической болезни, а также и симптоматических гипертензий. Особенно эффективен препарат у детей и подростков.

- 
- Спасибо за внимание