

ЛЕКАРСТВЕННЫЕ СРЕДСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА ЭФФЕРЕНТНУЮ ИННЕРВАЦИЮ

**Фармакология [Электронный ресурс] :
учебник / Д. А. Харкевич. - 11-е изд., испр. и
доп. - М. : ГЭОТАР-Медиа, 2015.**

**III. Частная фармакология. Глава 4.
Методичка Занятие 9,10**

**Лекарственные средства, влияющие на
адренергические синапсы
(адренергические лекарственные
средства)**

● **Лекарственных средства, действующие на адренергические структуры способствуют либо их активации, либо торможению, что может влиять на:**

- ✓ **состояние сосудистого тонуса,**
- ✓ **артериальное давление,**
- ✓ **величину сердечного выброса,**
 - ✓ **просвет бронхов,**
 - ✓ **углеводный обмен.**

Медиаторы адренергических структур

- В отличие от холинергических структур, где медиатором является одно вещество – ацетилхолин, в адренергических синапсах функционируют три медиатора –
 - ✓ **Норадреналин,**
 - ✓ **Адреналин**
 - ✓ **Дофамин**

Медиаторы адренергических структур

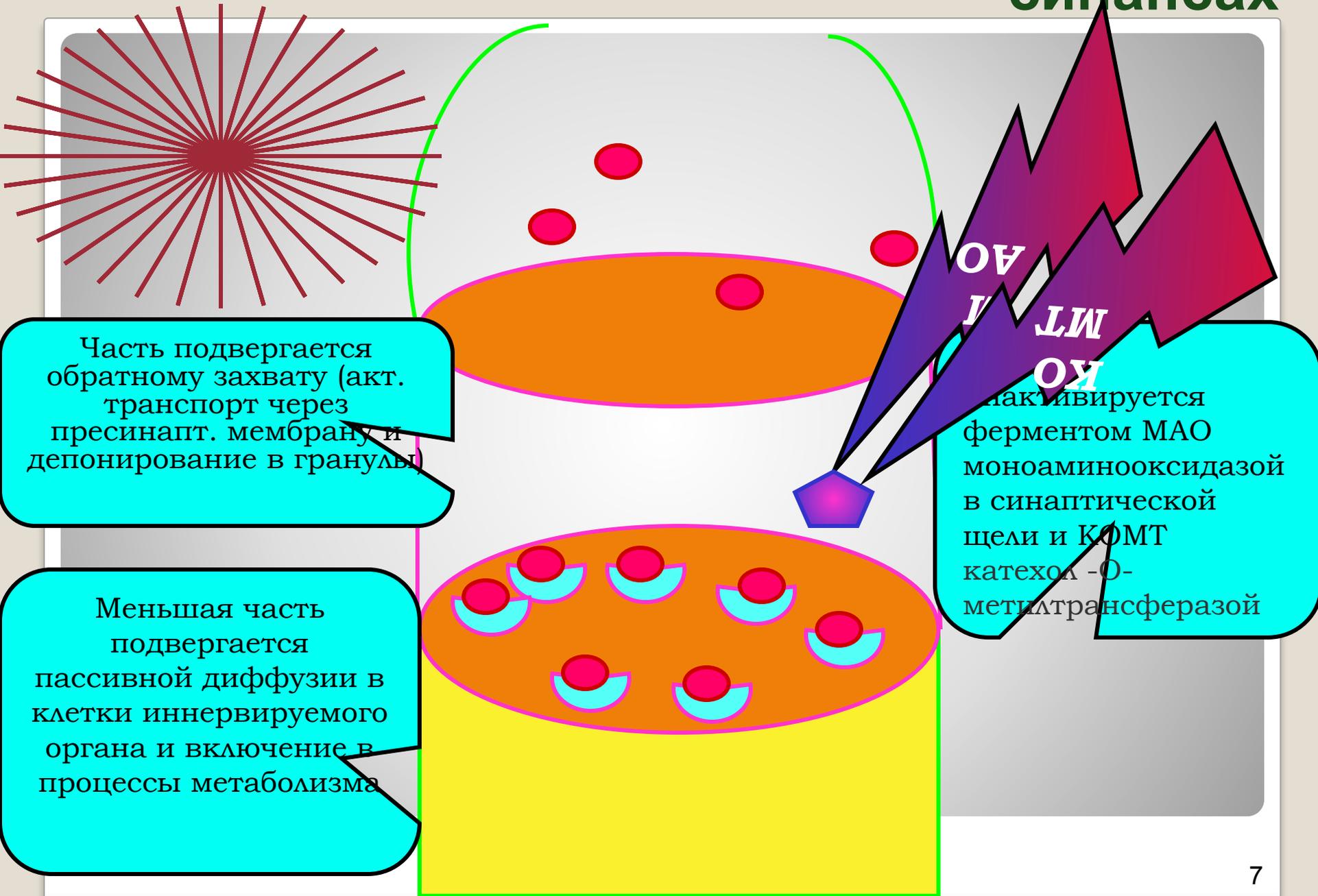
- **Норадреналин** –
основной из медиаторов
освобождается как в ЦНС, так и в
периферических
синапсах

- **Дофамин** –
в основном в ЦНС

Так же в ЦНС обнаружены и нейроны,
освобождающие при своем возбуждении
Адреналин.

Механизм передачи импульсов в синапсах





Часть подвергается обратному захвату (акт. транспорт через пресинапт. мембрану и депонирование в гранулы)

Меньшая часть подвергается пассивной диффузии в клетки иннервируемого органа и включение в процессы метаболизма

активируется ферментом MAO моноаминооксидазой в синаптической щели и КОМТ катехол - О - метилтрансферазой

АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ – α и β

- Адренорецепторы обладают неодинаковой чувствительностью к химическим соединениям.
- Соответственно существует два типа рецепторов - альфа и бета – α и β

Медиаторы адренергических структур

- Норадреналин, адреналин и дофамин являются катехоламинами.
- Эти три катехоламина взаимодействуют с разными типами рецепторов:
 α_1 , α_2 , β_1 , β_2 , β_3

Эффекты активации адренорецепторов

- Стимуляция альфа-рецепторов вызывает эффекты возбуждения
- Стимуляция бета-рецепторов вызывает, как правило, эффекты ингибирования, торможения.

Исключения - при активации α и β рецепторов

- В миокарде бета-адренорецепторы являются стимулирующими. Возбуждение бета-рецепторов сердца повышает скорость и силу сокращений миокарда, сопровождается повышением автоматизма и проводимости в атриовентрикулярном узле.
- Возбуждение альфа-адренорецепторов в ЖКТ проявляется ингибирующим действием, что приводит к расслаблению гладкой мускулатуры кишечника.

Основные эффекты, связанные со стимуляцией адренорецепторов

α -Адренорецепторы

Сужение сосудов (особенно кожи, почек, кишечника, коронарных, и др.)

Сокращение радиальной мышцы радужной оболочки (мидриаз)

↓ моторики и тонуса кишечника

Сокращение сфинктеров ЖКТ

Сокращение капсулы селезенки

Сокращение миометрия

β -Адренорецепторы

Расширение сосудов (особенно сосудов скелетных мышц, печени, коронарных и др.)

↑ частоты, силы сердечных сокращений, автоматизма и облегчение атриовентрикулярной проводимости

↓ тонуса мышц бронхов

↓ моторики и тонуса кишечника

↓ тонуса миометрия

Гликогенолиз

Липолиз

α -адренорецепторы

- подразделяются на $\alpha 1$ - и $\alpha 2$ -адренорецепторы:
- $\alpha 1$ -адренорецепторы локализуются в постсинаптической мембране,
- $\alpha 2$ — в пресинаптической мембране.

α -адренорецепторы

- Основная роль пресинаптических α_2 -адренорецепторов – регулирование освобождения норадреналина.
- Так, возбуждение этих рецепторов адреномиметиками тормозит освобождение норадреналина (по принципу обратной отрицательной связи) из окончаний адренергических нервов.

β_1 -адренорецепторы

Находятся в мембранах миокардиоцитов и др.

β_2 -адренорецепторы

Располагаются в мембранах клеток, которые не образуют синаптических контактов (гладкая мускулатура бронхов, сосудов и др.)

β_3 -адренорецепторы

Локализованы в липоцитах

Изменение функции органов при возбуждении адренорецепторов

Орган	Тип А-рецептор	Изменение функции при возбуждении
Сосуды -кожи -слизистых оболочек -почек -органов бр.полости	α^a	Сужение сосудов
Сосуды -мозга -легких -сердца -скелетных мышц	β_2	Расширение
Сердце	β_1	-↑ силы сокращения; -↑ частоты сокращений; -↑ потребности в кислороде; -Гликогенолиз (распад гликогена до глюкозы)
Легкие	β_2	Расширение бронхов Устранение бронхоспазма

Орган	Тип А-рецептора	Изменение функции при возбуждении
Глаз: радиальная мышца	α	Сокращение радиальной мышцы → мидриаз
ЖКТ	α, β	Сокращение сфинктеров пищеварительного тракта ; ↓ моторики и тонуса желудка и кишечника.
Селезенка	α	Сокращение капсулы селезенки (выброс депонированной крови);
Мочевой пузырь	α	Сокращение сфинктеров мочевого пузыря (торможение диуреза);
Печень Поджелудочная железа	β_3 β_2	Липолиз (повышение СЖК) Гликолиз (↑ уровня глюкозы в крови → гипергликемия) ↑ секреции инсулина
Матка	β_2	Расслабление гладких мышц матки, ↓ моторики

Возможности фармакологического воздействия на АЭ-передачу нервных импульсов разнообразны:

1. влияние на синтез НА
2. нарушение депонирования НА в везикулах и цитоплазме пресинаптических окончаний
3. угнетение ферментативной инактивации НА
4. влияние на выделение НА из окончаний
5. нарушение процесса обратного захвата НА пресинаптическими окончаниями
6. угнетение экстранейронального захвата НА
7. непосредственное воздействие на адренорецепторы
 - в-ва, стимулирующие АР – адреномиметики
 - в-ва, угнетающие АР - адреноблокаторы

наиболее

КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНЕРГИЧЕСКИХ СРЕДСТВ

1. Вещества, действующие непосредственно на адренорецепторы:

- **АДРЕНОМИМЕТИКИ**, то есть средства, стимулирующие адренорецепторы, действующие подобно медиатору НА, подражающие ему.
- **АДРЕНОБЛОКАТОРЫ** - средства, угнетающие адренорецепторы.

2. Вещества пресинаптического действия, влияющие на высвобождение и(или) депонирование норадреналина:

- **СИМПАТОМИМЕТИКИ (АДРЕНОМИМЕТИКИ НЕПРЯМОГО ДЕЙСТВИЯ)** – оказывающие стимулирующий эффект... ЭФЕДРИН
- **СИМПАТОЛИТИКИ** - оказывающие блокирующий эффект на адренергическую передачу с помощью непрямого механизма. ОКТАДИН, РЕЗЕРПИН, ОРНИД

КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНОМИМЕТИКОВ

1. СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ ОДНОВРЕМЕННО АЛЬФА- И БЕТА-АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ, то есть АЛЬФА, БЕТА-АДРЕНОМИМЕТИКИ:

АДРЕНАЛИН - прямой альфа, бета-адреномиметик;
НОРАДРЕНАЛИН - действующий как медиатор на альфа, бета-адренорецепторы, как лекарство - на альфа-адренорецепторы

2. СРЕДСТВА СТИМУЛИРУЮЩИЕ ПРЕИМУЩЕСТВЕННО АЛЬФА-АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ, то есть АЛЬФА-АДРЕНОМИМЕТИКИ: МЕЗАТОН (альфа-1), НАФТИЗИН (альфа-2), ГАЛАЗОЛИН (альфа-2).

3. СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ ПРЕИМУЩЕСТВЕННО БЕТА-АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ, БЕТА-АДРЕНОМИМЕТИКИ:

- а) НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ, то есть действующие и на бета-1, и на бета-2-адренорецепторы - ИЗАДРИН;
- б) СЕЛЕКТИВНЫЕ - САЛЬБУТАМОЛ (преимущественно бета-2-рецепторы), ФЕНОТЕРОЛ и др.

КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНОБЛОКАТОРОВ

1. АЛЬФА-АДРЕНОБЛОКАТОРЫ:

- а) НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ (α_1 , α_2) – тропafen, фентоламин, а также дигидрированные алкалоиды спорыньи – дигидроэрготоксин и дигидроэргокристин
- б) СЕЛЕКТИВНЫЕ (α_1) – празозин

2) БЕТА-АДРЕНОБЛОКАТОРЫ:

- а) НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ (бета-1 и бета-2) – анаприлин или пропранолол, окспренолол
- б) СЕЛЕКТИВНЫЕ (бета-1 или кардиоселективные) – метопролол

3) α - и β –адреноблокаторы

ЛАБЕТАЛОЛ (B_1 , B_2 , A_1)
КАРВЕДИЛОЛ (B_1 , B_2 , A_1)

Адренергические лекарственные средства

В-ва, действующие
непосредственно на
адренорецепторы

**Адреномимети
ки**
прямого д-я

НА
Гидрохлорид,
НА
Гидротартрат,
изадрин и др.

**Адреноблокатор
ы**

фентоламин,
анаприлин и
др.

Вещества
действующие на
высвобождение или
депонирование НА

**Симпатомимети
ки**
(адреномиметики
непрямого д-я)

эфедрина
гидрохлорид и
др.

**Симпатолитик
и**

октадин, резерпин²²
и др.

Адреномиметики

Эффекты адреномиметиков



Сосудосуживающий ($\alpha 1$, $\alpha 2$)

Прессорный ($\alpha 1, \alpha 2$)

Сокращение селезенки ($\alpha 1$)

глаз

Кардиотонический

Гладкая мускулатура

Метаболические

перераспределение клеток крови

мидриаз ($\alpha 1$)

\uparrow сокр-ти, \uparrow ЧСС ($\beta 1$)
расш. коронарных сос-в ($\beta 2$)

Бронхолитический ($\beta 2$)

Сокращение матки ($\alpha 1$)
 \downarrow тонуса матки ($\beta 2$)

Мочевой пузырь:
 \downarrow тонуса дна ($\beta 2$),
 \uparrow тонуса сфинктера ($\alpha 1$)

Понижение тонуса ЖКТ ($\alpha 1$)

Понижение уровня инсулина
повышение уровня глюкозы ($\alpha 2, \beta 2$)

Показания к применению адреномиметиков

Острая сердечная недостаточность

Острая сосудистая недостаточность

Остановка кровотечения

Бронхиты с астматическим
компонентом

Слабость родовой деятельности

Устранение спазма миометрия

Нарушение тонуса сфинктеров
мочевого пузыря

Показания к применению адреномиметиков

Остановка сердца.

В этом случае 0,5-0,7 мл раствора адреналина (лучше развести в 8-10 мл физиологического раствора) с помощью длинной иглы вводят в полость левого желудочка.

Анестезия.

Для удлинения времени действия и уменьшения токсичности местных анестетиков при проводниковой и терминальной анестезии (адреналин).

Противопоказания к применению адреномиметиков

- при болезнях сердца,
- склерозе мозговых и коронарных сосудов,
- гипертонической болезни,
- гипертиреозе и диабете.

Токсические эффекты адреномиметиков связаны с их сильным вазоконстрикторным действием и опасным подъемом кровяного давления. Это может вызвать перегрузку миокарда и острую сердечную слабость с развитием отека легких.

**СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ
ОДНОВРЕМЕННО АЛЬФА- И БЕТА-
АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ
АЛЬФА, БЕТА-АДРЕНОМИМЕТИКИ**

АДРЕНАЛИН (эпинефрин) (Adrenalinum hydrochloridum, в амп. 1 мл, 0, 1% раствор)

- оказывает прямой, непосредственный, возбуждающий эффект на все типы адренорецепторов.
- вызывает эффекты, характерные для действия симпатической (адренергической) иннервации.

АДРЕНАЛИН (эпинефрин)

- **При внутривенном введении**
- полностью проявляется влияние адреналина на α -адренорецепторы сосудов.
- Вследствие этого наступает выраженное сужение сосудов кожи и органов брюшной полости, что ведет к резкому повышению АД.
- Действие адреналина при введении в/в развивается практически на кончике иглы, но эффект кратковременный - всего до 5 минут.
- Сокращение капсулы селезенки сопровождается выбросом в кровь большого количества эритроцитов.

Адреналина гидрохлорид

Увеличивает все 4 функции сердца:

- 1.** силу сокращений (положительный инотропный эффект);
- 2.** частоту сокращений (положительный хронотропный эффект);
- 3.** проводимость (положительный дромотропный эффект);
- 4.** автоматизм (положительный батмотропный эффект).

Адреналина гидрохлорид – применение:

1. При анафилактическом шоке (в/в)
2. При аллергических реакциях немедленного типа.(п/к)
3. При гипогликемии.
4. Добавляют к растворам местных анестетиков для сужения сосудов в месте введения (п/к, в/м)
5. При остановке сердца
6. Для снижения внутриглазного давления при открытоугольной форме глаукомы.

Норадреналин

Noradrenalinii hydrotatis (амп. по 1 мл - 0, 2% раствора).

стимулирует альфа1-,альфа2- и бета1-адренорецепторы.

Основной путь введения - в/в капельно (в ЖКТ - разлагается; п/к - некроз на месте инъекции). Значительно повышает артериальное давление.

Норадреналин применяют как прессорное средство при артериальной гипотензии (внутривенно капельно).

**СРЕДСТВА СТИМУЛИРУЮЩИЕ
ПРЕИМУЩЕСТВЕННО АЛЬФА-
АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ
АЛЬФА-АДРЕНОМИМЕТИКИ**

Мезатон (фенилэфрин)

- **Mesatonum (амп. 1% раствора 1 мл, п/к, в/в, в/м).**
- **Суживает кровеносные сосуды. Повышает АД.**
- **Применяется в основном для повышения артериального давления при артериальной гипотензии, можно местно при ринитах (как деконгестант)**

α 2-АМ ПЕРИФЕРИЧЕСКОГО ДЕЙСТВИЯ

нашли широкое применение при лечении конъюнктивитов и ринитов, связанных с вирусными инфекциями и аллергическими состояниями. В связи с их способностью устранять отечность слизистых оболочек эти препараты получили также название **антиконгестантов.**

α2-AM

Ксилометазолин (Нафтизин, Галазолин, Санорин) *Naphthyzinum* (флаконы по 10 мл - 0, 05-0, 1%).

- вызывают длительное сужение периферических сосудов. Применяются главным образом при острых ринитах, гайморитах, аллергических конъюнктивитах.

Оксиметазолин (Назол)

- препарат нового поколения для применения в отоларингологии. При местном применении суживают артериолы оболочки носа на 10-12 ч, что приводит к уменьшению отека, гиперемии и экссудации.

- **Тетризолин (визин)**
- в офтальмологии.



Клонидин (α_2 -АМ центрального действия)

Клофелин

Для снижения АД при артериальной гипертензии (внутри в таблетках 0,075 мг и 0,15 мг)

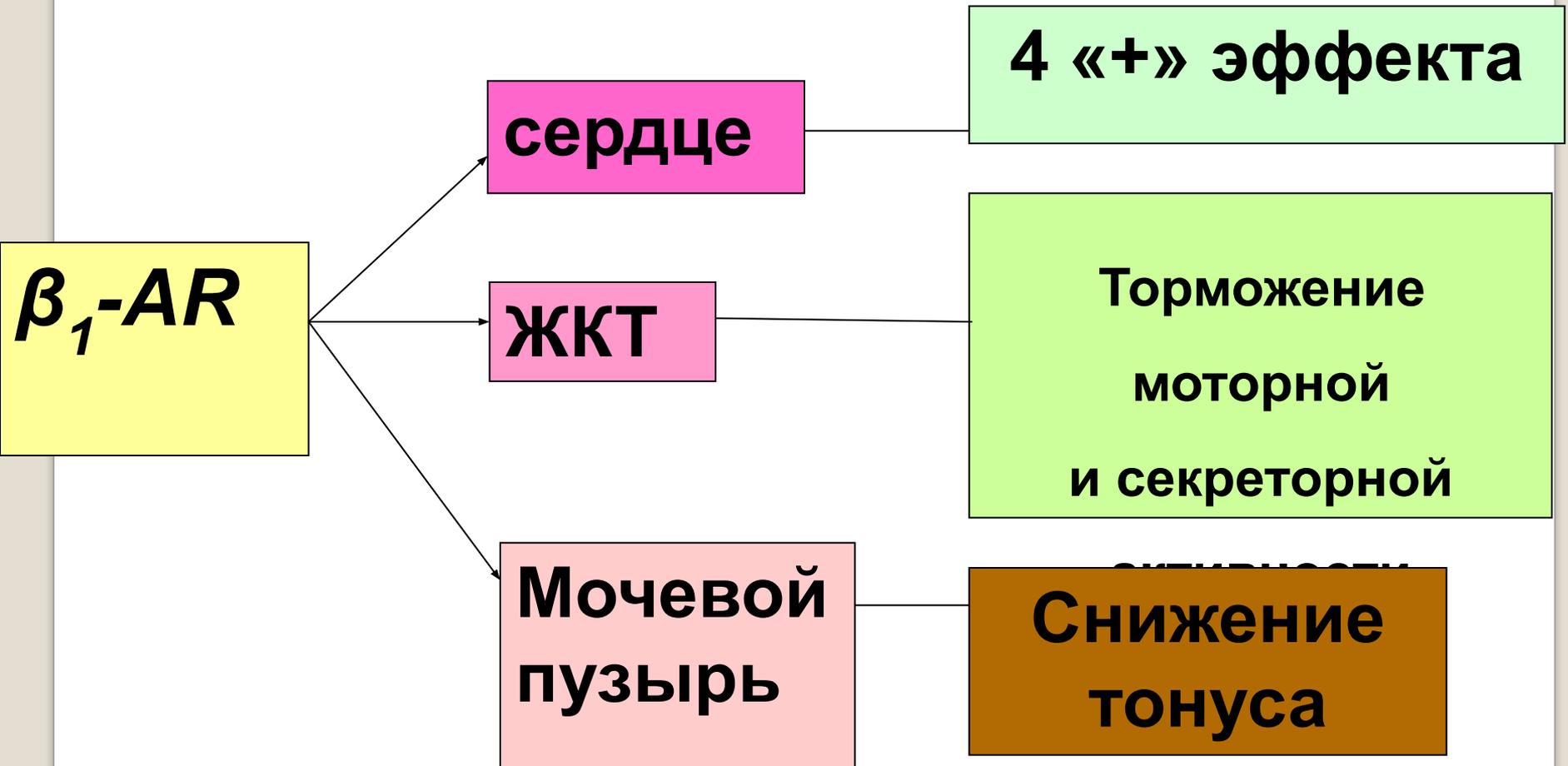
Для снижения внутриглазного давления при глаукоме (ГК)

СТИМУЛЯТОРЫ АЛЬФА, БЕТА И ДОФАМИН-РЕЦЕПТОРОВ

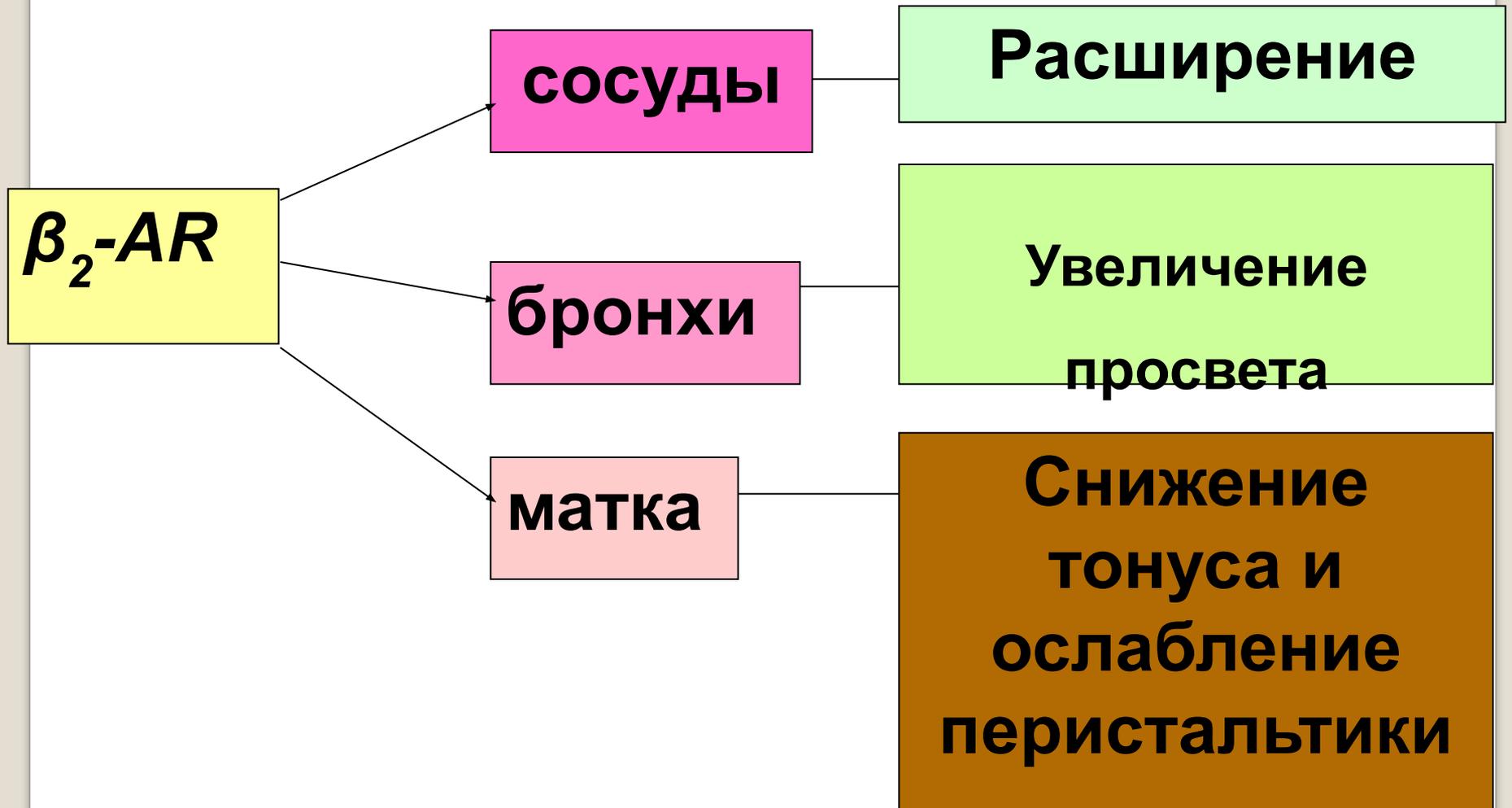
- Дофамин - биогенный амин, образующийся из L-тирозина. Он предшественник норадреналина.
- **ДОФАМИН либо допамин (лат. - Dofaminum - атр. 0, 5% - 5 ml)** стимулирует альфа-, бета- и Д-рецепторы (дофаминовые) симпатической нервной системы. Выраженность эффекта определяется дозой. В низких дозах действует на Д-рецепторы, что приводит к расширению сосудов почек и кишечника, мозговых и коронарных сосудов (мезентериальные сосуды), снижает общее периферическое сопротивление сосудов (ОПС), в более высоких - на адренорецепторы.
- **ПОКАЗАНИЯ:** шок, для увеличения кровотока в почках и внутренних органах. В/в. Действие прекращается через 10-15 минут после введения.

**СРЕДСТВА, СТИМУЛИРУЮЩИЕ
ПРЕИМУЩЕСТВЕННО БЕТА-
АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ (БЕТА-
АДРЕНОМИМЕТИКИ)**

Эффекты стимуляции



Эффекты стимуляции



БЕТА-АДРЕНОМИМЕТИКИ

- **ИЗАДРИН** (Изопреналин)
- - классический **неселективный** бета-адреномиметик.
- **Isadrinum** (флаконы по 25 мл и 100 мл соответственно 0,5% и 1% р-ров; таблетки по 0,005).
- Изадрин - один из мощных бронхолитиков. Способствует разжижению мокроты, стимулирует ресничковую очистку бронхов - активация мукоцилиарного транспорта.
- Изадрин повышает АВ – проводимость и проводимость по проводящей системе сердца.

БЕТА-АДРЕНОМИМЕТИКИ

- Учитывая ряд побочных эффектов изадрина (↑ ЧСС), синтезированы селективные бета-2-адреномиметики. Зачастую эти препараты представлены в виде аэрозолей:
- ОРЦИПРЕНАЛИН (синонимы - алупент, астмопент). Действует 2-4 часа. При использовании в ингаляциях действует также быстро, как и изадрин.
- ФЕНОТЕРОЛ (беротек, партусистен). Fenoterolum. Официальный препарат. Выпускается во флаконах по 15 мл, что составляет 300 разовых доз. Действует дольше, чем орципреналин примерно на 1 час.
- САЛЬБУТАМОЛ (Salbutamolium - табл. - 0, 002; флаконы с 0, 5% растворами для респираторов по 10 мл; есть р-ры для в/в введения).

β_1 -Адреномиметики –

Применяют внутривенно при острой сердечной недостаточности.

***β*2-Адреномиметики -**

основная группа препаратов,
используемых для купирования приступа
бронхиальной астмы и других болезней,
характеризующихся спазмом бронхов.

Современные бронхорасширяющие β 2-адреномиметики (бронхолитики) делятся на препараты:

- **короткого действия** (ингаляционные формы – сальбутамол, фенотерол, тербуталин),
- **длительного действия** (ингаляционные формы – салметерол, формотерол; пероральные формы сальбутамола замедленного высвобождения – вольмакс, сальтос и др.)

**СРЕДСТВА, БЛОКИРУЮЩИЕ
АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ
(АДРЕНОБЛОКАТОРЫ)**

СРЕДСТВА, БЛОКИРУЮЩИЕ АДРЕНОРЕЦЕПТОРЫ (АДРЕНОБЛОКАТОРЫ)

- Адреноблокаторы блокируют адренорецепторы, препятствуя действию на них медиатора норадреналина, а также адреномиметических средств. На синтез норадреналина адреноблокаторы не влияют.
- Адреноблокаторы делятся на 2 группы:
- **1) альфа-адреноблокаторы;**
- **2) бета-адреноблокаторы.**

Классификация
антиадренергич
еских
препаратов

Антиадренергич
ческие
препараты

Адреноблокаторы
(Прямого действия)

Симпатолитики
(Непрямого действия)

α_1

Празозин
Доксазозин
Теразозин

неселек
 β -

Анаприлин
Окспренолол

Резерпин
Октадин

α

Фентоламин
Тропафен,
Пироксан
Дигидроэрготамин

Кардиоселект.
 β_1

Метопролол
Талинолол

α, β

Лабеталол
Корведилол



Н
и
ю
а
-
о
Н
о
б
л
о
к
а
т
о

Спазм сосудов
головного мозга

Облитерирующий
эндартериит

Трофические язвы,
пролежни,
отморожения

Феохромоцитома

Г
И
А
Д
Р
Е
Н
О
Б
Л
О
К
А
Т
О
Р
В



Орто­ста­ти­че­ска
я
ГИПОТОНИЯ

Коллапс

α 1, α 2-Адреноблокаторы

Фентоламин (α_1, α_2 -АБ) (регитин) Phentolamini hydrochloridi (порошок в ампулах по 0,005 г; табл. 0, 025).

- 1. АД снижает умеренно. Однако при феохромоцитоме (опухоль мозгового слоя коры надпочечников - повышение АД обусловлено высоким уровнем эндогенного адреналина (катехоламинов) в циркуляции) действует прекрасно. После в/венного введения 0, 5% раствора при феохромоцитоме вызывает снижение АД через 2-5 минут на 35/20 мм рт. ст.**
- 2. При болезни Рейно, облитерирующем эндартериите, трофических язвах нижних конечностей, то есть при нарушениях периферического кровообращения**
- 3. Аналогичным, но более сильным препаратом, является тропофен.**

Фентоламин (α_1 , α_2 -АБ) (регитин)

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ:

1. тахикардия;
2. повышение тонуса ЖКТ (поносы);
3. головокружение;
4. зуд кожи, покраснение ее;
5. набухание слизистой оболочки носа;
6. при передозировке ортостатический коллапс.

Дигидрированные алкалоиды спорыньи

α 1, α 2-АБ

Спорынья - это гриб, паразитирующий на колосьях ржи (по французски спорынья - Ergot).

В 1918 г.– эрготамин.

В основе химической структуры –

D-лизергиновая кислота.

1. дигидроэрготоксин,
2. дигидроэрготамин
3. дигидроэргокриптин.

расширение периферических сосудов и снижение АД.

Алкалоиды спорыньи. Показания

Терапия нарушений периферического и мозгового кровообращения, мигрени, АГ как отдельные средства, так и в составе целого ряда комбинированных готовых лекарственных препаратов (редергин, синепрес, вазобрал, кристепин, бринердин).

Селективные α_1 - АБ

**Вазоактивные селективные α_1 - АБ
(празозин, доксазозин, теразозин)
блокируют α_1 -адренорецепторы как
сосудов, так и предстательной
железы.**

**Выраженное сосудорасширяющее
действие, снижают АД и вызывают
умеренную рефлкторную
тахикардию.**

Празозин (α_1 -АБ)

Prazosinum (табл. по 0,001, 0,002, 0,005). По блокирующей активности превосходит фентоламин в 10 раз. Расширяет артериолы и вены

1. Для снижения АД при артериальной гипертензии (таблетки)
2. При болезни Рейно (снимает спазм артерий)

Доксазозин и теразозин препараты 2-го поколения. Пролонгированный эффект

Доксазозин (кардура, тонокардин) – структурный аналог празозина. Выгодно отличается от празозина отсутствием изменений частоты сердечных сокращений.

Теразозин (корнам, хайтрин) применяется 1 раз в день.

Вазонеактивные α 1-АБ

(суперселективные α 1-АБ)

Альфузозин (дальфаз) снижает давление в уретре и уменьшает сопротивление току мочи; облегчает мочеиспускание. В терапевтических дозах не влияет на α 1- адренорецепторы сосудистой стенки.

Тамсулозин (омник)

имеет единственное показание – ДГПЖ.

Принимают по 1 капсуле (0,4 мг) в день.

БЕТА-АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

Эффекты β -адреноблокаторов

```
graph TD; A[Эффекты β-адреноблокаторов] --> B[Угнетение работы сердца (силы, проводимости)]; A --> C[Снижение АД]; A --> D[Повышение стойкости миокарда к нехватке кислорода];
```

Угнетение работы
сердца
(силы,
проводимости)

Снижение АД

Повышение
стойкости миокарда
к нехватке
кислорода

ФАРМАКОДИНАМИКА β -БЛОКАТОРОВ

ЧАСТОТА СЕРДЕЧНЫХ СОКРАЩЕНИЙ (ЧСС)

- ! БАБ за счет конкурентного антагонизма с β_1 адренорецепторами урежают ЧСС;
- ! Селективные β -адреноблокаторы менее активны в урежении пульса.

- ! **СОКРАТИМОСТЬ МИОКАРДА** уменьшается под влиянием β -адреноблокаторов за счет:
 - блокады симпатических влияний - в большей степени;
 - хинидиноподобного действия - в меньшей.

СЕРДЕЧНЫЙ ВЫБРОС - уменьшается.

ПОТРЕБЛЕНИЕ МИОКАРДОМ КИСЛОРОДА - уменьшается.

Н
И
Ю
В
-

Тахикардии

Ишемия миокарда

Артериальная
гипертензия

СС нарушения при
тиреотоксикозе

Слабость
родовой
деятельности

Н
О

О

Пропранолол (неселективный β_1, β_2 –АБ)

Основные эффекты:

1. Снижает автоматизм, возбудимость, проводимость и сократимость миокарда. Удлиняет рефрактерный период AV узла.
2. Снижает ЧСС, МОК, АД
3. Уменьшает потребность сердца в O_2

Применение:

1. Для снижения АД при артериальной гипертензии (таблетки, инъекции).
2. Как противоаритмическое средство.
3. При ишемической болезни сердца

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ - приступ бронхоспазма.

Метопролол (беталок, лопрессор, спесикор) (селективный β_1 -АБ)

Не повышает тонус бронхов, сосудов, не вызывает гипогликемии

Атенолол

Селективный β_1 -АБ длительного действия

Бисопролол

Селективный β_1 -АБ длительного действия

Применение всех β - адреноблокаторов аналогичное пропранололу.

Симпатомиметики

- К адреномиметикам непрямого действия - симпатомиметикам, опосредованно стимулирующим альфа- и бета-адренорецепторы, относится ЭФЕДРИН - алкалоид из листьев растения *Efedra*. Высвобождает норадреналин из окончаний нервов. Проникает в ЦНС.
- На Руси называлась Кузьмичева травка.
- Латинское название ***Efedrini hydrochloridum*** выпускается в табл. - 0, 025; амп. - 5% - 1 мл; 5% раствор наружно, капли в нос).

- Фармакологические свойства **эфедрина** весьма сходны с таковыми для адреналина.
- В отличие от А эфедрин действует более продолжительно, так как он устойчив к действию МАО, что позволяет в отличие от адреналина применять его внутрь, а не парентерально.
- При повторном введении эфедрина через 10-30 минут от первого введения развивается явление ТАХИФИЛАКСИИ, то есть снижение степени ответа.

Клиническое применение эфедрина

1. при приступах бронхиальной астмы.
2. при гипотонической болезни, коллапсах, шоках.
3. Благодаря наличию аналептической активности (эфедрин возбуждает сосудодвигательный и дыхательный центры) как стимулятор ЦНС при отравлении алкоголем и др..
4. В глазной практике эфедрин можно использовать для расширения зрачка.
5. Местно эфедрин назначают при насморке, ринитах (из-за сосудосуживающего действия).

Симпатолитики

- Симпатолитики нарушают передачу возбуждения на уровне варикозных утолщений адренергических волокон, то есть действуют пресинаптически.

- Резерпин

- Октадин

- Орнид

Эффекты
симпатолитиков

Снижение АД

Расширение
периферических
сосудов

С
И
М
П
Т
О
М
Ы



Симпатолитики

- **Резерпин**

- (рауседил)

- **Октадин**

- (гуанетидин)

- **Оказывают:**

- гипотензивное действие

- седативное действие

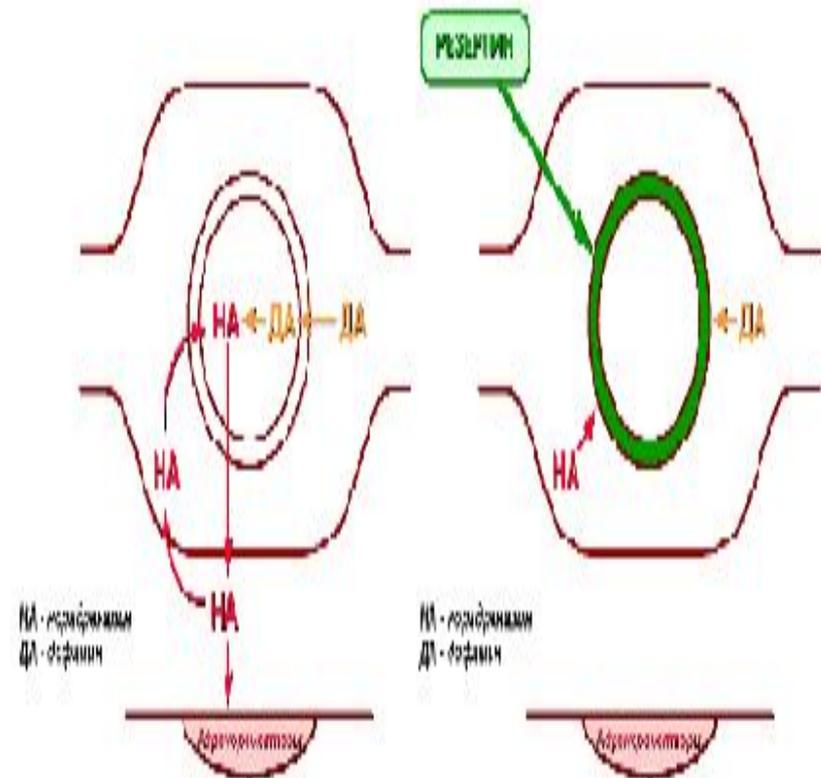
- слабое

- антипсихотическое

Механизм симпатолитического действия резерпина

Резерпин является алкалоидом из индийского растения *Rauwolfia serpentina*.

- Нарушает вход дофамина в везикулы (синтез норадреналина)
- угнетает обратный захват норадреналина
- действие необратимо (до 2-х недель)



Показания для резерпина Reserpinum (порошок и таблетки по 0, 00025, 0, 0001) :

Резерпин снижает АД двояко путем симпатолитического эффекта на периферии и воздействием на центральную нервную систему. За счет двоякого действия резерпин действует мягче, не вызывает ортостатических реакций.

1) Гипертоническая болезнь.

(в комбинации)

2) Слабые антипсихотические свойства (нейролептик).

3) Симптоматическое лечение тиреотоксикоза.

Октадин

(изобарин, исмелин, гуанетидин)

- препятствует обратному захвату норадреналина варикозными утолщениями
- истощает запасы медиатора норадреналина в окончаниях симпатических волокон.
- Октадин мало влияет на уровень катехоламинов в ЦНС (*плохо проникает через гематоэнцефалический барьер*)
- Octadinum (порошок и таблетки по 0, 025).
- используют лишь при тяжелых формах гипертонической болезни.

Орнид (бретилий)

- блокирует пресинаптическую мембрану, нарушая высвобождение медиатора.
- ингибирует МАО.
- угнетает обратный захват НА

Длительность действия значительно меньше, чем у октадина и резерпина (5-8 ч).

в качестве гипотензивного средства не используют,
(всасывается плохо, привыкание)

В некоторых случаях назначают при аритмиях сердца.

Тесты

- **α -, β -Адреномиметики:**

1. Сальбутамол.
2. Адреналин (эпинефрин).
3. Мезатон (фенилэфрин).
4. Галазолин (ксилометазолин).
5. Норадреналин (норэпинефрин).
6. Добутамин.

- **β -Адреномиметик длительного действия:**

1. Салметерол.
2. Фенотерол.
3. Добутамин.
4. Адреналин (эпинефрин).
5. Галазолин (ксилометазолин).
6. Сальбутамол.

Тесты

- **α -, β -Адреномиметики:**

1. Сальбутамол.
2. Адреналин (эпинефрин).
3. Мезатон (фенилэфрин).
4. Галазолин (ксилометазолин).
5. Норадреналин (норэпинефрин).
6. Добутамин.

- **β -Адреномиметик длительного действия:**

1. Салметерол.
2. Фенотерол.
3. Добутамин.
4. Адреналин (эпинефрин).
5. Галазолин (ксилометазолин).
6. Сальбутамол.

Тесты

- **Показания к применению празозина и доксазозина:**

1. Артериальная гипертензия. 2. Спазмы периферических сосудов. 3. Доброкачественная гиперплазия предстательной железы. 4. Бронхиальная астма. 5. Ишемическая болезнь сердца.

- **α-Адреноблокаторы:**

1. Анаприлин. 2. Метопролол. 3. Празозин. 4. Атенолол. 5. Тамсулозин. 6. Доксазозин.

Тесты

- Показания к применению празозина и доксазозина:

1. Артериальная гипертензия.
2. Спазмы периферических сосудов.
3. Доброкачественная гиперплазия предстательной железы.
4. Бронхиальная астма.
5. Ишемическая болезнь сердца.

- α -Адреноблокаторы:

1. Анаприлин.
2. Метопролол.
3. Празозин.
4. Атенолол.
5. Тамсулозин.
6. Доксазозин.

Тесты

- **Ортостатическая гипотензия - характерный побочный эффект:**
 1. Празозина.
 2. Доксазозина.
 3. Анаприлина (пропранолола).
 4. Метопролола.
 5. Бисопролола.
 6. Карведилола.

- **Симпатолитик:**
 1. Празозин.
 2. Тимолол.
 3. Резерпин.
 4. Анаприлин (пропранолол).

Тесты

- Ортостатическая гипотензия - характерный побочный эффект:
 1. Празозина.
 2. Доксазозина.
 3. Анаприлина (пропранолола).
 4. Метопролола.
 5. Бисопролола.
 6. Карведилола.

- Симпатолитик:
 1. Празозин.
 2. Тимолол.
 3. Резерпин.
 4. Анаприлин (пропранолол).