



ФАРМАКОЛОГИЯ



ТЕМА

Антиангинальные средства.

лекция



ФАРМАКОЛОГИЯ



Цель - Сформировать знания студентов о фармакокинетике и фармакодинамике Антиангинальных средств.

Задачи:

Учебные - изучить фармакотерапевтические действия лекарств по основным группам Антиангинальных средств. (ПК. 3.2.)

Развивающие - развивать стремление к расширению своих профессиональных знаний (ОК.8)

Воспитательные - развивать аккуратность, добросовестность, интерес к профессии, интеллект, трудолюбие, стремление брать на себя ответственность за результат выполнения заданий.(ОК.7)



ФАРМАКОЛОГИЯ



Изучаемые вопросы

- 1. Классификация Антиангинальных средств. Общая характеристика.**
- 2. Донаторы оксида азота**
 - а) Органические нитраты
 - б) Нитратоподобные средства
- 3. Блокаторы кальциевых каналов (БКК)**



ФАРМАКОЛОГИЯ



Антиангинальные средства (АС)

Это лекарственные препараты для устранения или предупреждения приступов стенокардии.

Название (АС) происходит от латинского **angina pectoris** – грудная жаба или стенокардия (С).



ФАРМАКОЛОГИЯ



Стенокардия – проявление ишемической болезни сердца (ИБС).

Ischaemia от греческих слов **ischo** – задерживать, **haema** – кровь.

Ишемия – местное малокровие, возникающее при сужении или закрытии приносящей артерии.



ФАРМАКОЛОГИЯ



При ИБС поражаются коронарные артерии сердца (КАС).

Другое название ИБС – коронарная болезнь сердца.

Основные причины ишемии

1. Атеросклеротический стеноз КАС.
2. Тромбоз КАС.
3. Спазм КАС.



ФАРМАКОЛОГИЯ



При сужении или закрытии КАС возникает зона **ишемии миокарда**, снижается поступление кислорода в миокард. Это приводит к накоплению в зоне ишемии аллогенных веществ, которые раздражают окончания чувствительных нервов. В итоге возникает ощущение боли и сжатия в груди – приступ стенокардии.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Принципы лечения при Стенокардии

1. Уменьшить потребность сердца в кислороде.
2. Увеличить доставку кислорода в зоне ишемии.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Классификация АС

1. Донаторы оксида азота

а) Органические нитраты:

Нитроглицерин, Изосорбида динитрат и мононитрат

б) Нитратоподобные средства:

Молсидомин

2. β_1 -адреноблокаторы

Пропранолол, Метопролол, Атенолол и др.

3. Блокаторы кальциевых каналов (БКК):

Верапамил, Дилтиазем, Нифедипин



ФАРМАКОЛОГИЯ



Органические нитраты

(классификация по длительности действия)

1. Короткого действия

Нитроглицерин (сублингвальные таблетки, аэрозоль)

2. Длительного действия

Сустак

Нитронг

Изосорбида ди- и мононитрат и др.

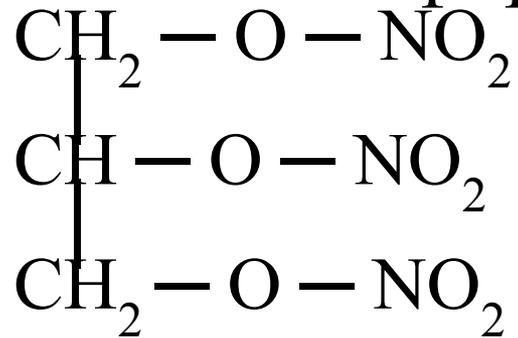


ФАРМАКОЛОГИЯ



Нитроглицерин

Является эфиром глицерина и азотной кислоты



Маслянистая жидкость, взрывоопасен. При нанесении на слизистые оболочки и кожу быстро всасывается в кровь.

Для купирования приступа стенокардии вводят сублингвально в таблетках по 0,0005.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Механизм действия нитроглицерина

Проникнув в ГМК сосудов, нитроглицерин разрушается с образованием оксида азота (NO), который расширяет артериальные и венозные сосуды.

Фармакологические эффекты нитроглицерина

1. Расширение венозных сосудов снижает венозный возврат к сердцу. Уменьшается растяжение стенок сердца, уменьшается преднагрузка. В итоге снижается работа сердца и его потребность в O_2 .



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакологические эффекты нитроглицерина

2. Расширение артериол **снижает** **постнагрузку**, уменьшает периферическое сопротивление и АД. Это также способствует **снижению работы и потребности в O_2** .
3. Расширение коронарных артерий **увеличивает** коронарный кровоток и **доставку O_2** к зоне ишемии.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Снижение пред- и постнагрузки, усиление коронарного кровотока, увеличение снабжения миокарда кислородом ликвидирует ишемию и **устраняет приступ стенокардии.**

Нитроглицерин снижает тонус ГМК не только сосудов, но и других органов: ЖКТ, желче- и мочевыводящие пути, бронхи и др.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Спазмолитическое действие нитроглицерина развивается через 1-2 минуты после сублингвального применения и длится до 30 мин. При частом применении нитроглицерина к нему развивается толерантность (тахифилаксия). Механизм развития толерантности — истощение запасов в ГМК соединения содержащего SH-группы, которое необходимо для активирования нитроглицерина..



ФАРМАКОЛОГИЯ



Препараты нитроглицерина

1. Сублингвальные:

Таблетки, Капсулы 0,0005,

Раствор в спирте 1%-10 мл.

2. Буккальные

Тринитролонг – полимерные пластинки, содержащие по 1,2 и 4 мг нитроглицерина.

3. Ингаляционные

Аэрозоль *Нитролингвал*



ФАРМАКОЛОГИЯ



Препараты нитроглицерина

4. Трансдермальные

Мазь 2%

Нитродерм (пластырь)

5. Внутривенные

Перлинганит Ампулы 10 мг в 10 мл



ФАРМАКОЛОГИЯ



Препараты нитроглицерина длительного действия

Sustac mite – 2,6 мг

Sustac forte – 6,4 мг

Вводят внутрь.

Действие развивается в течение 30 минут и длится 6-8 часов.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Другие препараты нитратов

Изосорбида динитрат (Нитросорбид)

Таблетки по 5, 10 и 20 мг

Ампулы 1%-10 мл в/в

По механизму действия является донатором оксида азота.

Применяют внутрь для предупреждения приступов стенокардии.

Эффект развивается через 30 минут и длится 5-8 часов.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Показания к применению нитроглицерина

- купирование приступов стенокардии (в положении сидя);
- профилактика приступов стенокардии (препараты длительного действия).



ФАРМАКОЛОГИЯ



Побочные эффекты нитроглицерина

- сильная головная боль, связанная с параличом (резким расширением) сосудов головного мозга и сдавлением болевых рецепторов. (купировать болевой синдром: анальгин, кофеин);
- резкое падение АД; слабость;
- рефлекторная тахикардия;
- повышение внутричерепного и внутриглазного давления;
- ощущение жара, покраснение лица и кожи верхней половины туловища.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Нитратоподобные

Молсидомин

Таблетки по 2, 4 и 8 мг

Применяют внутрь и сублингвально.

Активируется без участия SH- соединений.

Действие развивается через 5-30 минут и длится 6-7 часов.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Блокаторы кальциевых каналов

Нифедипин

Синоним: **Кордафен**

Коринфарм

Таб. 10 мг 3 раз в день внутрь или сублингвально.

Таб. с МВ, 30 и 60 мг, внутрь целиком 1 раз в день.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакокинетика Нифедипина.

1. Быстро и полностью всасывается в ЖКТ.
2. С тах. в плазме создается через 30 мин.
3. Биодоступность 40-60%, т.к. разрушается в печени
4. $T_{1/2}$ 2-4 ч.
5. Неактивные метаболиты выводятся почками (80%)



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакодинамика Нифедипина

1. Блокирует Ca^{++} каналы в мембранах кардиомиоцитов, в ГМК сосудов и внутренних органов (ЖКТ, бронхи, матка и др.)
2. Снижает трансмембранное поступление Ca^{++} в кардиомиоциты и ГМК
3. Расширяет коронарные артерии. Увеличивает коронарный кровоток.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Фармакодинамика Нифедипина

4. Уменьшает силу сокращений и работу сердца. Снижает потребность миокарда в O_2 .
5. Расширяет артериолы. Снижает артериальное давление в большом круге и легочной артерии.
6. Угнетает агрегацию тромбоцитов.
7. Увеличивает выведение натрия и воды.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Показания к применению Нифедипина

1. ИБС
2. Артериальная гипертензия
3. Гипертрофическая кардиомиопатия
4. Болезнь Рейно
5. Бронхообструктивный синдром



ФАРМАКОЛОГИЯ



Побочные действия Нифедипина

Гиперемия лица, ощущение жара.

Снижение АД,

рефлекторная тахикардия,

головокружение, головные боли,

мышечная слабость,

тошнота, запоры,

отеки лодыжек.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Противопоказания к применению Нифедипина

1. Гиперчувствительность
2. Острый период инфаркта миокарда
3. Кардиогенный шок
4. Артериальная гипотензия
5. Тахикардия
6. Беременность и кормление грудью



ФАРМАКОЛОГИЯ



Дилтиазем (*Diltiazem*)

Синоним: Алдиазем

Алтиазем

Таб. по 60 и 90 мг внутрь целиком.

Сходен с нифедипином и оказывает влияниенамиокард (ослабляет и урежает сердечные сокращения). Применяют при ИБС, АГ и как противоаритмическое средство.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Верапамил *Verapamil*

Таб. 40 и 80 мг, внутрь.

Сходен с дилтиаземом, но сильнее снижает Атриовентрикулярную (AV) проводимость, вызывает брадикардию. Применяют при мерцательной аритмии.

Применение Верапамила при стенокардии может вызвать AV-блокаду и сердечную недостаточность



ФАРМАКОЛОГИЯ



Средства типа **Валидола** имеют рефлекторный тип действия.

В состав этого препарата входит **ментол** (25% раствор ментола в ментоловом эфире изовалериановой кислоты).

Является слабым антиангинальным средством, оказывает седативное действие и умеренный рефлекторный сосудорасширяющий эффект.

Показан при легких формах стенокардии.



ФАРМАКОЛОГИЯ



При лечении больных ИБС находит применение препарат **Дипиридамол (курантил)**- производное пиримидина. Этот препарат действует на микроциркуляцию крови в мелких сосудах, препятствуя агрегации тромбоцитов, увеличивает интенсивность кровотока, однако, может вызвать симптом "обкрадывания", особенно при внутривенном введении у больных с выраженным коронарным атеросклерозом, так как препарат вызывает расширение тех сосудов, которые не поражены склерозом. Показан больным, у которых повышена свертываемость крови.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Информационные источники

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.

«Фармакология с общей рецептурой»,
учебное пособие для мед. училищ,. –
М., 2015. Стр.113-119.



ФАРМАКОЛОГИЯ



СВР:

Составление конспекта по теме:
«Противоаритмические средства».

Майский В.В., Аляутдин Р.Н.
«Фармакология с общей рецептурой»,
учебное пособие для мед. училищ,. – М.,
2015. Стр.107 – 113.



ФАРМАКОЛОГИЯ



Вопросы для контроля

1. Что такое антиангинальные средства?
2. Классификация антиангинальных средств, препараты, механизмы действия, основные эффекты, показания к применению, побочные эффекты?