

**Тема лекции:**

**Антиангинальные  
средства**

# Антиангинальные средства (АС)

Это лекарственные препараты для устранения или предупреждения приступов стенокардии.

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

**Стенокардия** — проявление ишемической болезни сердца (ИБС).

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

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

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.

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

# Принципы лечения при С

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

Классификация

АС

# 1. Донаторы оксида азота

## а) Органические нитраты

Нитроглицерин

Изосорбида динитрат и  
мононитрат

## б) Нитратоподобные средства

Молсидомин

# 2. $\beta_1$ -адреноблокаторы

Пропранолол

Метопролол

Атенолол и др.

# 3. Блокаторы

кальциевых каналов

Верапамил

Дилтиазем

Нифедипин

# Органические нитраты

# Классификация по длительности действия

## 1. Короткого действия

Нитроглицерин (сублингвальные  
таблетки, аэрозоль)

## 2. Длительного действия

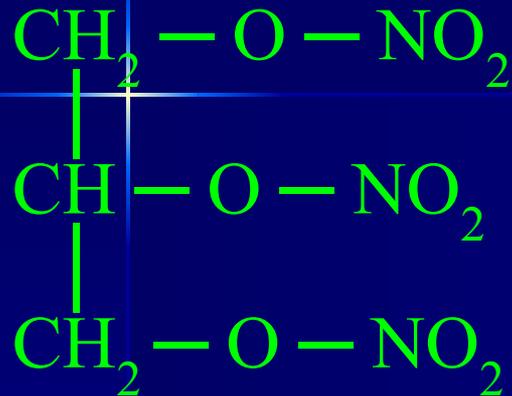
Изосорбида ди- и мононитрат

Сустак

Нитронг и др.

# 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.

# Механизм действия нитроглицерина

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

# Гемодинамические 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  $O_2$ .
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.

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.

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.

# Препараты нитроглицерина

# 1. Сублингвальные

Таблетки 0,0005

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*

# 4. Трансдермальные

Мазь 2%

*Нитродерм* (пластырь)

## 5. Внутривенные

*Перлинганит*

Ампулы 10 мг в 10 мл

Препараты  
нитроглицерина  
длительного  
действия

*Suctac mite* – 2,6 мг

*Suctac forte* – 6,4 мг

Вводят внутрь.

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

Другие  
препараты  
НИТРАТОВ

# Изосорбида динитрат

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.



# Блокаторы кальциевых каналов

# Нифедипин

*Nifedipine*

Синоним: Кордафен

Коринфарм

Таб. 10 мг 3 р/д внутрь или  
сублингвально.

Таб. с МВ, 30 и 60 мг, внутрь  
целиком 1 р/д.

# 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%)

# Фармакодинамика нифедипина

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

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.

# Показания к применению нифедепина

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

# Побочные действия нифедипина

1. Гиперемия лица, ощущение жара
2. Тахикардия
3. Гипотензия, головокружение, обморок
4. Нарушение кроветворения
5. Запор
6. Аллергические реакции и др.

# Противопоказания к применению нифедипина

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

# Дилтиазем

*Diltiazem*

Синоним: Алдиазем

Алтиазем

Таб. с МВ 60 и 90 мг внутрь  
целиком.

Блокирует  $\text{Ca}^{++}$  каналы.  
Уменьшает входение  $\text{Ca}^{++}$  в кардиомиоциты и ГМК. Сходен с нифедипином, но вызывает тахикардию, т.к. снижает функцию СА и АВ узлов. Применяют при ИБС, АГ и как противоаритмическое средство.

# Верапамил

*Verapamil*

Таб. 40 и 80 мг, внутрь.

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

Применение верапамила

при стенокардии может

вызвать AV-блокаду и

сердечную недостаточность.

Благодарю за  
внимание!