

ФЕДЕРАЛЬНОЕ ГОСУДАРСТВЕННОЕ БЮДЖЕТНОЕ ОБРАЗОВАТЕЛЬНОЕ
УЧРЕЖДЕНИЕ ВЫСШЕГО ПРОФЕССИОНАЛЬНОГО ОБРАЗОВАНИЯ
“ПЕРМСКИЙ ГОСУДАРСТВЕННЫЙ МЕДИЦИНСКИЙ УНИВЕРСИТЕТ ИМЕНИИ
АКАДЕМИКА Е.А.ВАГНЕРА“

Кафедра фармакологии

Антиангинальные средства

Работу выполнила:
студентка Ст-19-04
Долгиева Хава.Х

Преподаватель:
к.м.н.,старший преподаватель
Волков А.Г

- Антиангинальные средства (*angina pectoris* – «грудная жаба», *angere* - душить) – ЛС, применяющиеся для лечения ишемической болезни сердца (ИБС).
- Нитраты
- Блокаторы кальциевых каналов
- В-адреноблокаторы

Классификация антиангинальных средств

А. ЛС, ↓ потребление миокардом O₂ и ↑ доставку O₂ к миокарду

1. Органические нитраты:

препараты нитроглицерина (изосорбита тринитрат)

- короткого действия (25-30 мин):

- сублингвальные табл
- масляный раствор в капсулах,
- спиртовой 1% раствор во флаконах, спрей - нитроминт, нитролингвал

- пролонгированного действия (3-5 час)

- сополимерные пластинки – тринитролонг,
- таблетки - нитронг, сустак, сустонит, нитрогранулонг,
- буккальные таблетки - сусадрин, сускард,
- спансулы - гилустенон, нитро мак,
- мазь - нитро 2%, пластыри и диски-нитродерм TTS, депонит, нитродиск-8-12 ч

□ препараты изосорбита динитрата

- аэрозоли - изо мак спрей, изо кет спрей (1 час);
- табл. внутрь - нитросорбит, изо мак (3-5 ч), изо мак и кардикет ретард (8- 12 ч)
- сополимерные пластинки – динитросорбилонг (5-8 час),
- крем – изокет (12 час)

□ препараты изосорбида-5-мононитрата

- таблетки внутрь - изомонат, монозид, моно мак, моночинкве 8- 12час
- таблетки моно мак депо, моночинаве ретард – 12-24 час.

□ нитратоподобные соединения - молсидомин (сиднофарм)

2. Блокаторы медленных Са-каналов

□ производные дигидроперидина:

- 1 поколение: фенигидин,
- 2 поколение: амлодипин, исрадипин, фелодипин, никардипин;

□ производные фенилалкиламина

1 поколение: верапамил (изоптин),

2 поколение: галлопамил

□ бензотиазепина

1 поколение: дилтиазем,

2 поколение: клентиазем

3. Активаторы К-каналов: никорандил

4. Разные амиодарон

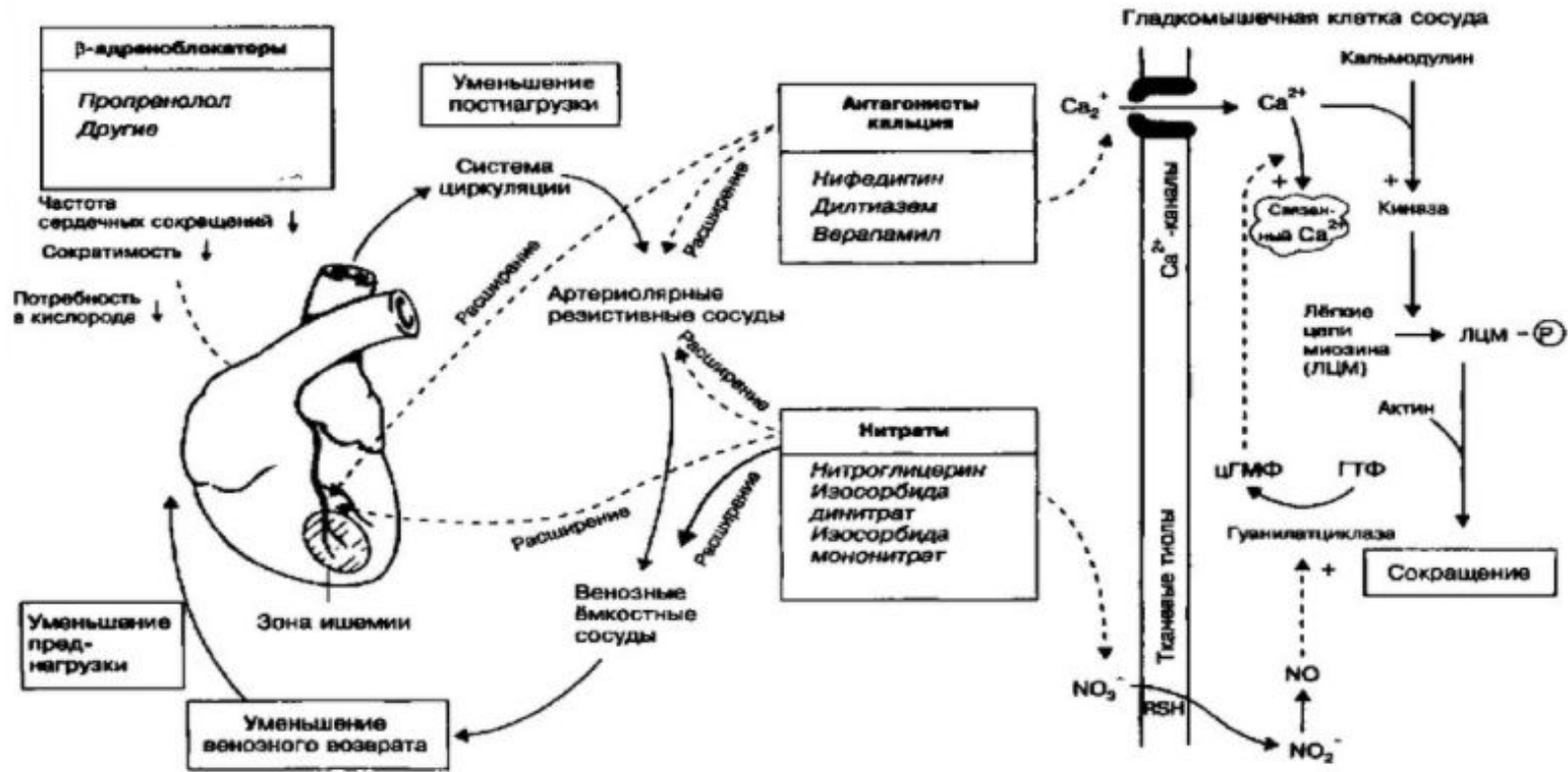
В. Средства, ↓ потребность миокарда в O₂

- Бета - АБл : Анаприлин, окспренолол
- Бета -1 – АБл: метопролол, атенолол, ацебутолол

С. Средства, ↑ доставку O₂ к миокарду(малоэффективны!!!)

- Сосудорасширяющие средства миотропного действия: Дипиридамол, карбакромен, но-шпа, папаверин, галидор
- Рефлекторного действия – Антигипоксанты: глио-6 валидол
- Специфические брадикардические: ивабрадин, алинидин, фалипамил
- Стабильные аналоги ПЦ: Айлопрост, карбациклин
- Атипичные бета-аАМ: нонахлазин, оксифедрин
- Атипичные бета-аАМ: нонахлазин, оксифедрин

Антиангинальные средства



Фармакодинамика нитратов

Гемодинамические эффекты Н. аналогичны действию ЭФРС – NO. ЭФРС – NO

- образуется в эндотелии сосудов в процессе метаболизма аргинина,
- $T_{1/2}$ – 6-30 мин.;
- окисляется в нитраты и нитриты;
- Выделение NO повышают АХ, СТ, БК, тромбин, глутаминовая кислота;
- NO расширяет сосуды и снижает АД;
- уменьшает агрегацию тромбоцитов;
- выполняет роль медиатора в ЦНС (участвует в формировании долгосрочной памяти, регуляции мозгового кровотока, выделяется под действием глутаминовой кислоты при возбуждении NMDA- рецепторов);

Механизм антиангинального действия нитратов



Классификация нитратов:

1 Препараты Нитроглицерина:

- Короткого действия: нитроглицерин;
- Пролонгированного действия: сустак, сустонит, нитронг, тринитронг, нитродерм ТТС.2

2 Препараты изосорбида динитрата:

- Короткого действия: нитросорбид, изо мак, изодинит;
- Пролонгированного действия: кардикс, кардикет, кардиогардSR, изо мак ретард;

3 Препараты изосорбида мононитрата:

- Короткого действия: моно мак, эфокс, моночинкве, оликард;
- Пролонгированного действия: кардикс моно, моно мак депо, эфокс лонг, моночинкве ретард.

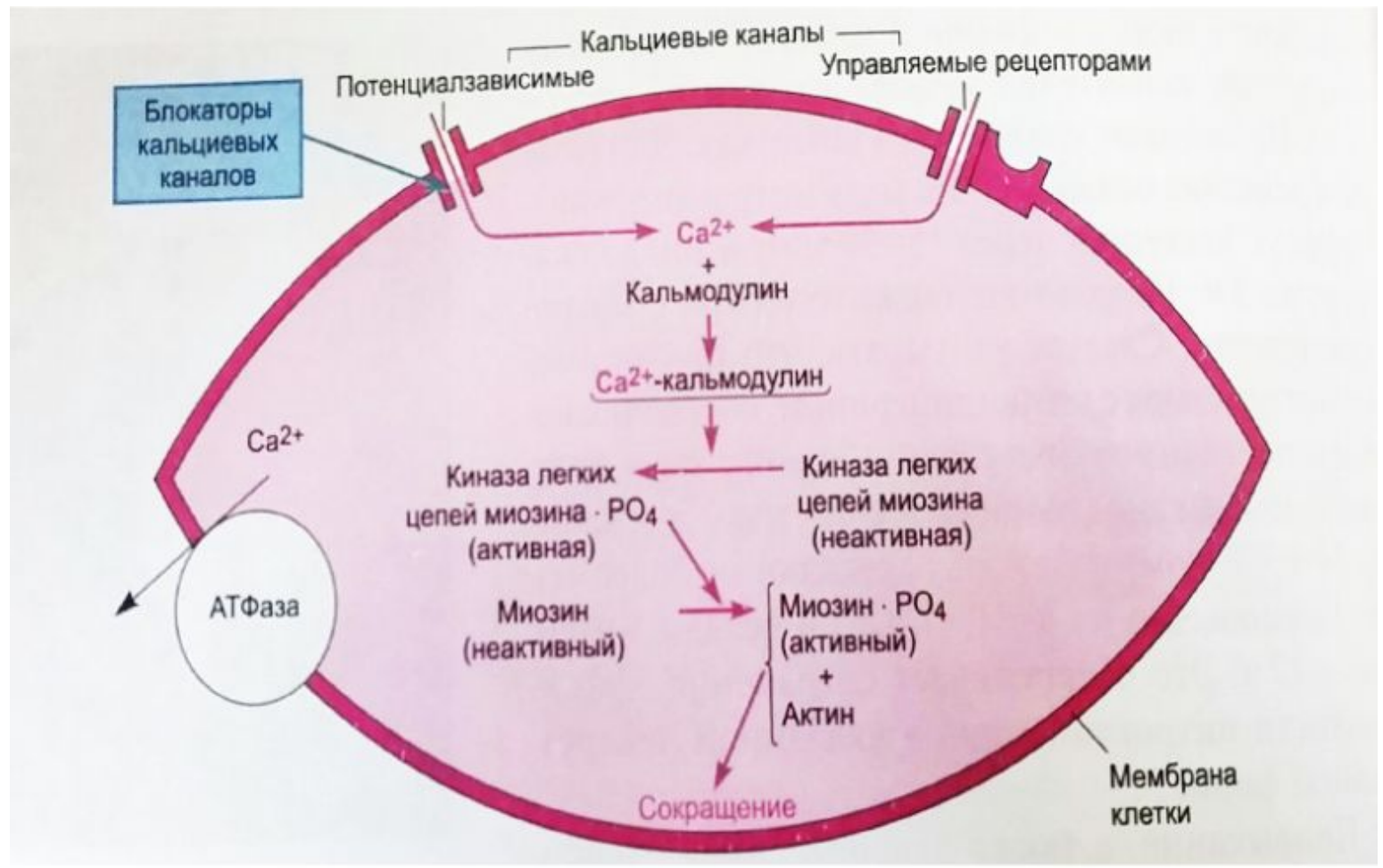
4 Нитратоподобные соединения (молсидомин, нитропруссид натрия)

Противопоказания к назначению нитратов

- Относительные противопоказания:
- С осторожностью назначать гипотоникам
- С острой левожелудочковой недостаточностью и больным кардиогенным
- Может ухудшить состояние больных с выраженным пролапсом митрального клапана и увеличить степень регургитации у них
- Абсолютные противопоказания:
 - 1 При повышенном внутричерепном давлении, кровоизлиянии в мозг.

Показания к назначению нитратов:

- Все формы стенокардии: стабильная стенокардия напряжения, вазоспастическая стенокардия, нестабильная стенокардия
- Острый инфаркт миокарда (для уменьшения признаков ишемии и ограничения его размеров). Нитраты особенно эффективны у больных острым инфарктом миокарда, у которых по тем или иным причинам не проводилось лечение тромболитиками.
- Хроническая сердечная недостаточность (для улучшения гемодинамики).
- Острая сердечная недостаточность (приступы сердечной астмы и отек легких).



МЕХАНИЗМ ДЕЙСТВИЯ АНТАГОНИСТОВ КАЛЬЦИЯ:

- Антагонисты кальция являются селективными блокаторами медленных кальциевых каналов (L-типа или потенциал-зависимых), локализованных в синоатриальных, атриовентрикулярных путях, волокнах Пуркинье, кардиомиоцитах, гладкомышечных клетках сосудов и других органов, скелетных мышцах.
- Фенилалкиламины-производные папаверина (верапамил, галлопамил, тиапамил);
- Бензотиазепины - дилтиазем, клентиазем;
- Дигидропиридины-нифедипин и его производные (нитрендипин, нимодипин, фелодипин, никардипин, амлодипин и т.д.). Верапамил и дилтиазем имеют тропность к миокарду и сосудам. Дигидропиридины избирательно тропны к коронарным сосудам (нисолдипин) и мозговым сосудам (нимодипин).

Блокаторы медленных Ca-каналов

Группа (специфичность)	I поколение	II поколение		III поколение
Дигидропиридины артерии > сердце	Нифедипин	Фелодипин Никардипин Исрадипин- БКК L- и R- типа Нисолдипин Нимодипин Нилвадипин Нитрендипин	Нифедипин SR/GITS Фелодипин ER Никардипин ER Исрадипин SR Нисолдипин ER	Амлодипин Лацидипин Леркадидипин Нигулдипин - открыватель K+ каналов
Бензотиазепины артерии=сердце	Дилтиазем	Дилтиазем SR	Клентиазем	
Фенилалкиламины проводящая система, кардиомиоциты	Верапамил	Верапамил SR	Галлопамил Анипамил Девапамил Ронипамил	Фалипамил- ингибитор синусового узла Тиапамил - блокатор Na каналов
Иная химическая структура			Дипротевверин Мибефрадил БКК T-, в меньшей степени L-типа	Бепредил Допропидил (блокаторы каналов) Монатепил (α 1-аб) Na-,K-

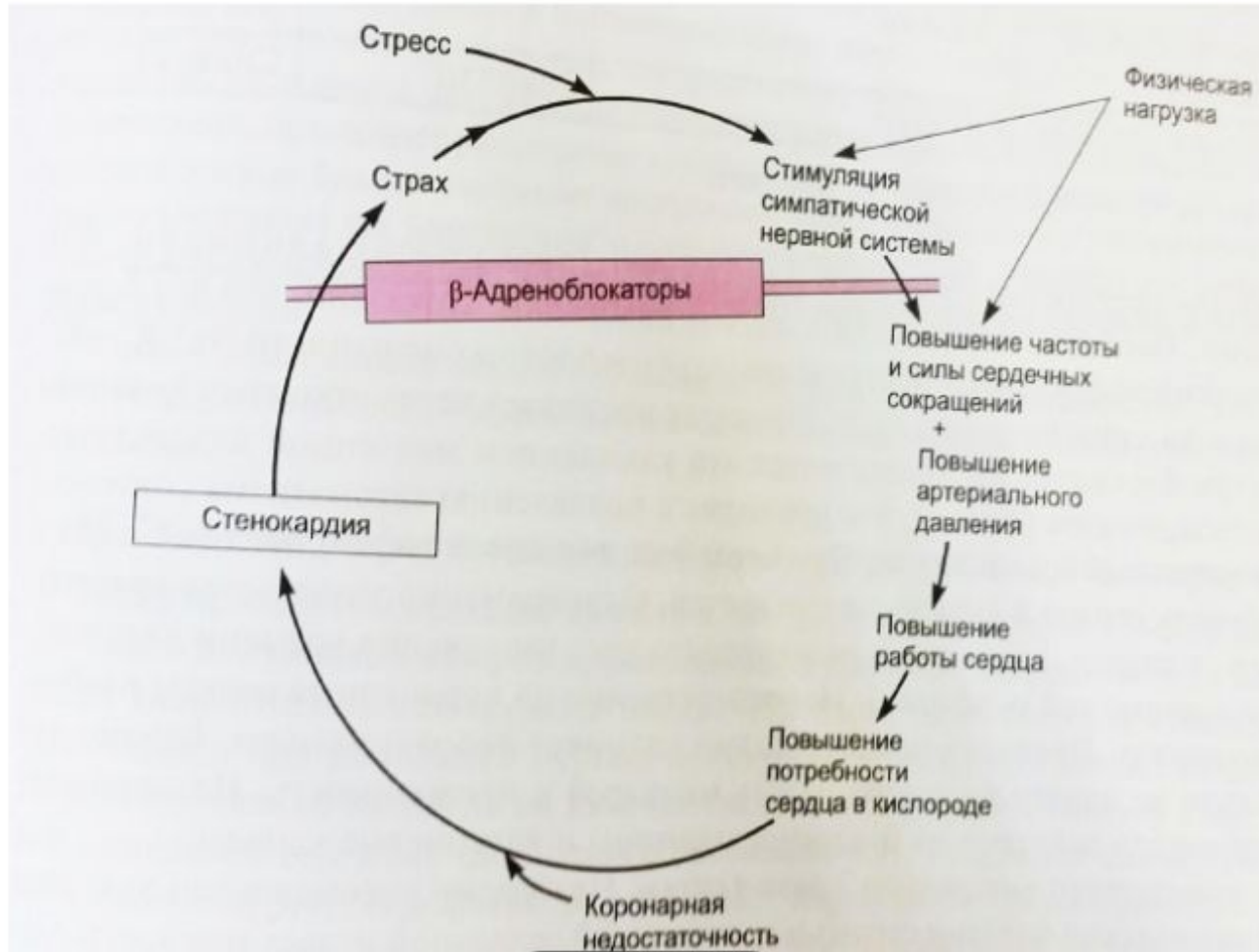
Показания

- стенокардия напряжения;
- вазоспастическая стенокардия;
- артериальная гипертензия;
- суправентрикулярная тахикардия(исключение дигидропиридины):верапамил и дилтиазем урежают ЧСС,подавляют функцию синусового и АВ-узлов;
- синдром Рейно.

Противопоказания:

- сердечная недостаточность II-III ст. систолической дисфункцией;
- критический аортальный стеноз;
- синдром слабости синусового узла;
 - АВ-блокада II-III ст.;
- синдром WPW с пароксизмами мерцанияили трепетания предсердий;
- беременность, грудное вскармливание

В-адреноблокаторы



- Бета-адреноблокаторами называются препараты, которые обратимо (временно) блокируют различные виды (β_1 -, β_2 -, β_3 -) адренорецепторов.
- Классификация адреноблокаторов:
- Альфа-адреноблокаторы:
 - α -1-адреноблокаторы – празозин, доксазозин;
 - α -2-адреноблокаторы – йохимбин;
 - α -1,2-адреноблокаторы – фентоламин, пирроксан, ницерголин.
- Бета-адреноблокаторы:
 - кардиоселективные (β -1) адреноблокаторы
 - атенолол, бисопролол;
 - неселективные β -1,2-адреноблокаторы – пропранолол, соталол, тимолол.
- Блокаторы и альфа-, и бета-адренорецепторов – лабеталол, карведилол

Показания к назначению бета-блокаторов:

- Повышение системного и внутриглазного (глаукома) давления;
- Гипертония с тахикардией;
- Ишемическая болезнь сердца (стенокардия, инфаркт миокарда);
- Предупреждение мигрени;
- Гипертрофическая кардиомиопатия;
- Феохромоцитома, тиреотоксикоз.

Противопоказания к назначению бета-блокаторов:

- тяжелая артериальная гипотония (АД меньше 90-100 ммрт. ст.),
- острая сердечная недостаточность (кардиогенный шок, отек легких и др.),
- ХСН (хроническая сердечная недостаточность) в стадии декомпенсации.

Бета-блокаторы защищают сердце от чрезмерной активации симпатoadренальной системы и увеличивают продолжительность жизни пациентов. Более подробно я расскажу о современных принципах лечения ХСН в теме про сердечные гликозиды.

- Снижение проводимости (снижение скорости проведения электрических импульсов по проводящей системе сердца) Бета-блокаторы могут нарушить предсердно-желудочковую проводимость (замедлится проведение импульсов от предсердий к желудочкам в AV-узле), что станет причиной атриовентрикулярной блокады (AV-блокады) различной степени (от I до III).