

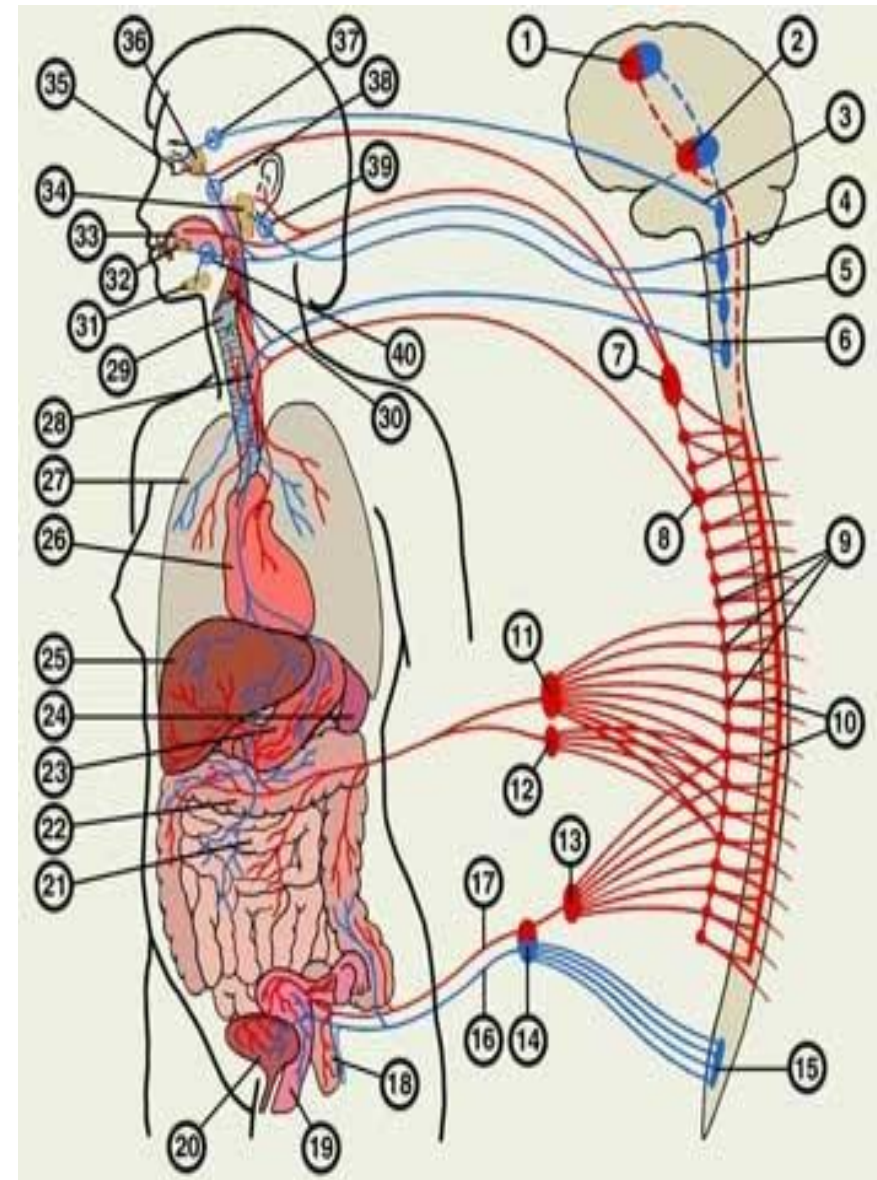
Адренергические средства



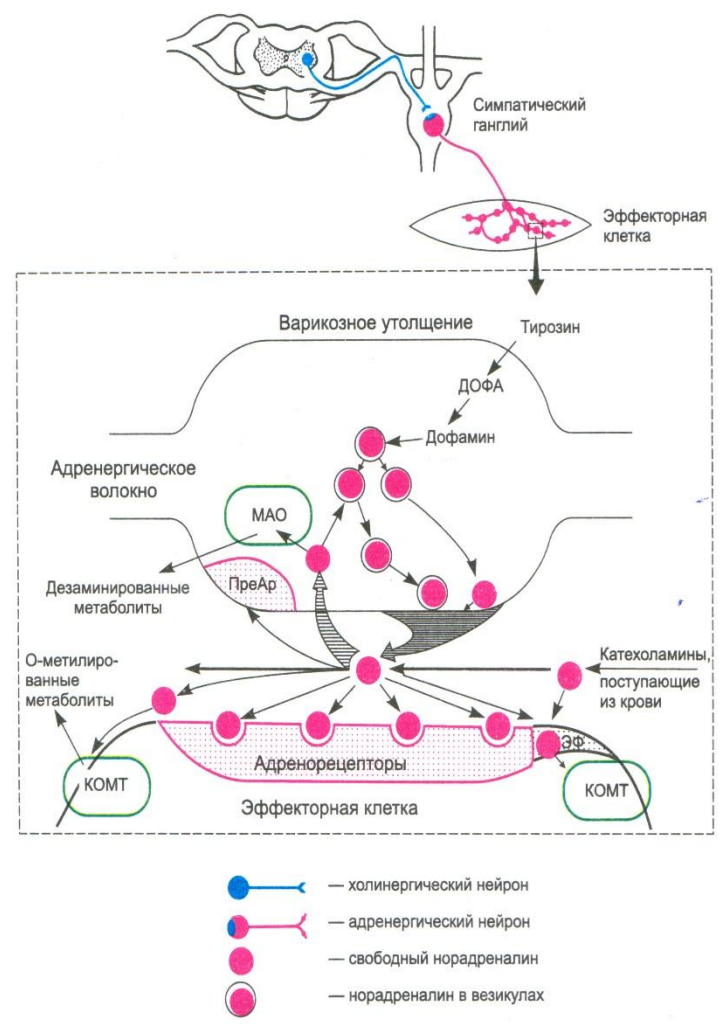
Кафедра общей и клинической фармакологии

Схематическое изображение строения вегетативной нервной системы человека и иннервируемых ею органов (красным цветом изображена симпатическая нервная система, синим — парасимпатическая; связи между корковыми и подкорковыми центрами и образованиями спинного мозга обозначены пунктиром).

- **1 и 2** — корковые и подкорковые центры;
- 3** — глазодвигательный нерв;
- 4** — лицевой нерв;
- 5** — языкоглоточный нерв;
- 6** — блуждающий нерв;
- 7** — верхний шейный симпатический узел;
- 8** — звездчатый узел;
- 9** — узлы (ганглии) симпатического ствола;
- 10** — симпатические нервные волокна (вегетативные ветви) спинномозговых нервов;
- 11** — чревное (солнечное) сплетение;
- 12** — верхний брыжеечный узел;
- 13** — нижний брыжеечный узел;
- 14** — подчревное сплетение;
- 15** — крестцовое парасимпатическое ядро спинного мозга; **16** — тазовый внутренносный нерв;
- 17** — подчревный нерв;
- 18** — прямая кишка; **19** — матка; **20** — мочевого пузыря; **21** — тонкая кишка; **22** — толстая кишка;
- 23** — желудок; **24** — селезенка; **25** — печень; **26** — сердце; **27** — легкое; **28** — пищевод; **29** — гортань;
- 30** — глотка; **31 и 32** — слюнные железы; **33** — язык; **34** — околоушная слюнная железа; **35** — глазное яблоко; **36** — слезная железа; **37** — ресничный узел; **38** — крылонебный узел; **39** — ушной узел; **40** — подчелюстной узел.

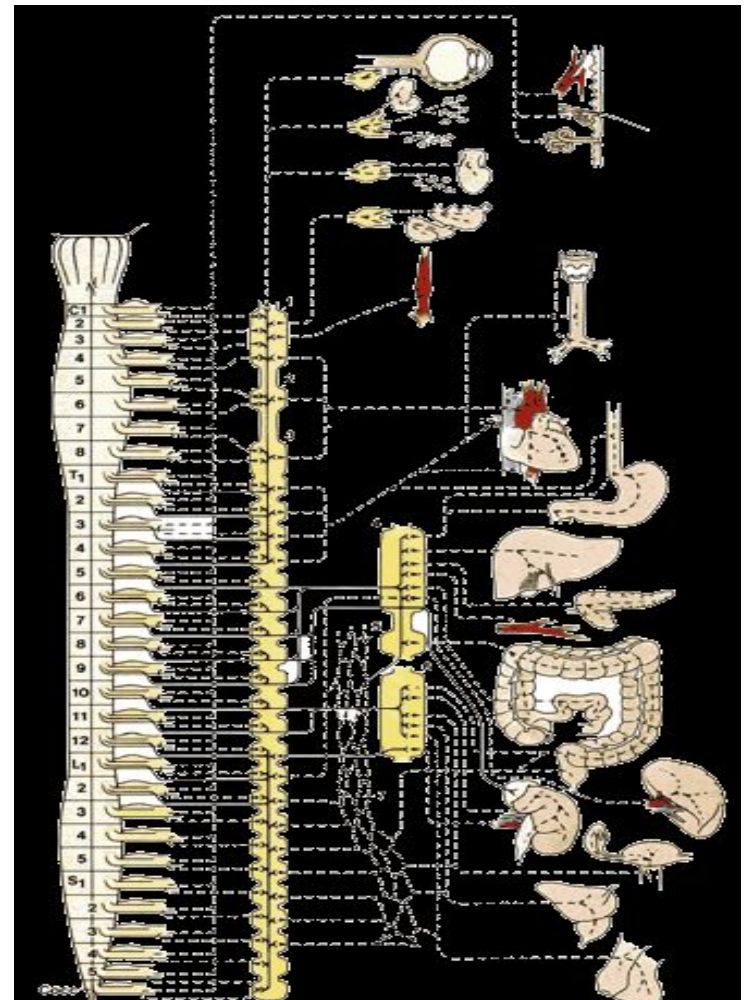


- Адренергические синапсы находятся в окончаниях симпатических нервов. Передача нервных импульсов в них осуществляется с помощью медиаторов *катехоламинов*: норадреналина, адреналина. Основным медиатором является норадреналин, который синтезируется в теле нейрона и депонируется в везикулах (гранулах) пресинаптической мембраны. Затем под влиянием пришедшего нервного импульса норадреналин высвобождается из нервного окончания и взаимодействует с адренорецепторами постсинаптической мембраны, что сопровождается развитием специфических фармакологических эффектов. Это действие кратковременно: несколько секунд. Инактивация медиатора осуществляется путем обратного захвата из синаптической щели нервным окончанием и с помощью ферментов моноаминоксидазы (МАО) и катехол-орто-метилтрансферазы (КОМТ).

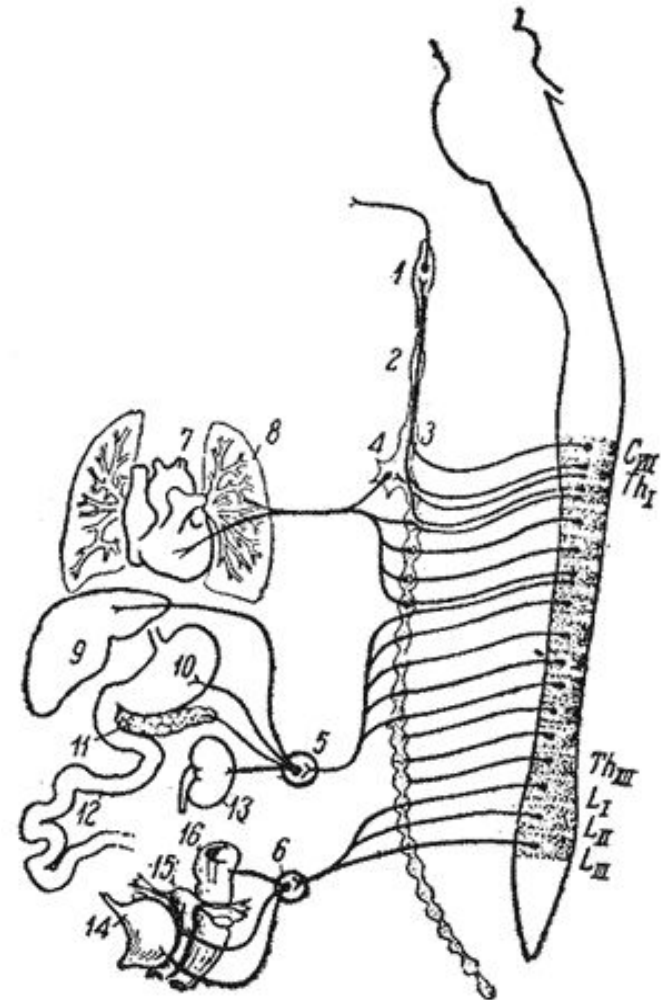


- МАО – моноаминоксидаза; КОМТ – катехол-О-метилтрансфераза; ПреАР – пресинаптические адренорецепторы; Эф – эффекторная клетка.

- Различают α - и β -адренорецепторы. Они находятся в одних и тех же органах, но в каждом преобладает один из этих типов рецепторов. В свою очередь они подразделяются на $\alpha 1$ – (сосуды, глаза) и $\alpha 2$ -адренорецепторы (ЦНС), $\beta 1$ - (сердце) и $\beta 2$ -адренорецепторы (бронхи, сосуды, матка, печень).
- При возбуждении $\alpha 1$ -адренорецепторов отмечаются сужение сосудов кожи, слизистых оболочек, что способствует уменьшению воспалительных явлений, снижению набухания и секреции слизистой и внутренних органов, расположенных в брюшной полости, при этом повышается тонус, артериальное и венозное давление, расширяются зрачки.
- При возбуждении $\alpha 2$ -адренорецепторов ЦНС понижается возбудимость сосудодвигательного центра, снижается тонус сосудов и падает артериальное давление.



- При возбуждении β_1 -адренорецепторов повышается скорость проведения импульсов в миокарде, увеличивается сила и частота сердечных сокращений.
- При возбуждении β_2 -адренорецепторов расслабляются гладкие мышцы бронхов, кишечника, желчных ходов и матки, расширяются сосуды скелетных мышц, легких, сердца и мозга, усиливается гликогенолиз (образование глюкозы из гликогена) в печени и мышцах.



- **Адренергические средства** могут влиять на синтез, депонирование и высвобождение медиаторов; взаимодействовать непосредственно с адренорецепторами; тормозить инактивацию и обратный захват медиатора.



адреноми метики

Прямого
действия

Не прямого
действия

Не

селективные

Альфа, бета-адреномиметики (альфа, бета-АМ), возбуждают одновременно альфа и бета-адренорецепторы адреналин.

Селективные

альфа₁-адреномиметики (альфа₁-АМ) мезатон,
альфа₂-адреномиметики (альфа₂-АМ) клофелин,
бета_{1,2}-адреномиметики (бета_{1,2}-АМ) изадрин,
бета₁-адреномиметики (бета₁-АМ) добутамин,
бета₂-адреномиметики (бета₂-АМ) сальбутамол.

Симпатомиметик
эфедрин

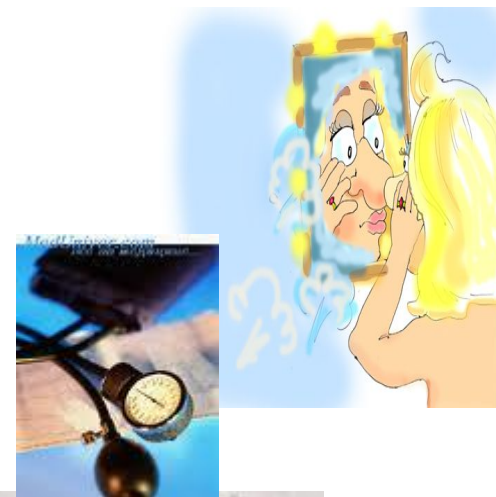
α - адреномиметики

- Лекарственные средства этой группы оказывают прямое возбуждающее действие на $\alpha 1$ - и $\alpha 2$ -адренорецепторы.
- Преимущественным действием на $\alpha 1$ -адренорецепторы обладает Фенилэфрин (мезатон), мало влияет на β -адренорецепторы сердца. Вызывает сужение артериол и повышение артериального давления. В отличие от адреналина и норадреналина мезатон не является катехоламином и мало подвержен действию фермента КОМТ, поэтому он более стоек, оказывает более длительный эффект. АС вызывает расширение зрачка и может понизить внутриглазное давление при открытоугольных формах глаукомы. Применяют мезатон для повышения артериального давления при коллапсе и гипотезии, при ринитах, конъюнктивитах, для расширения зрачка. Противопоказан при АГ, атеросклерозе и спазмах сосудов.



α - адреномиметики

- Мидодрин (гутрон) – периферический α_1 -адреномиметик. Повышает уровень артериального давления путем повышения тонуса артериол. Применяется при гипотензии, нарушениях регуляции кровообращения. Противопоказан при гипертензии, феохромоцитоме, тяжелой почечной недостаточности, глаукоме.
- Нафазолин (нафтизин, санорин) является α_1 , α_2 -адреномиметиком, оказывает длительный сосудосуживающий эффект. При нанесении на слизистые оболочки оказывает противовоспалительное (противоотечное) действие. При ринитах облегчает носовое дыхание. Нафазолин назначают только местно при насморке. Для общего действия на организм не используется в связи с его высокой токсичностью (угнетает ЦНС). При применении возможно явление тахифилаксии.



α - адреномиметики

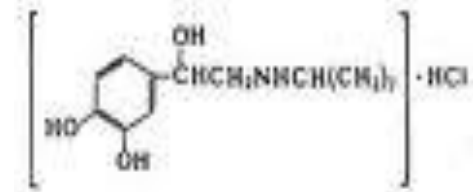


- Ксилометазолин (галазолин, ксимелин, длянос) действует аналогично нафазолину. Применяют его местно при острых ринитах. Оказывает некоторое раздражающее действие.
- В виде капель в нос и спрея выпускается Оксиметазолин (назол), Тетризолин (тизин).
- Клонидин (клофелин) – α_2 -адреномиметик центрального действия. Он стимулирует пресинаптические α_2 -адренорецепторы ЦНС, следствием которого является уменьшение симпатической импульсации к сосудам и сердцу, приводящее к снижению сердечного выброса, общего периферического сопротивления и падению АД. Применяется при артериальной гипертензии.



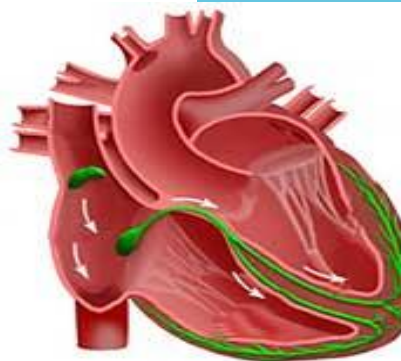
β - адреномиметики

- Лекарственные средства этой группы оказывают прямое возбуждающее действие на β_1 - и β_2 -адренорецепторы. Стимуляция β_1 -адренорецепторов, расположенных в миокарде, усиливает и учащает сердечные сокращения, повышает возбудимость, облегчает проводимость, увеличивает потребление кислорода миокардом. В связи с возбуждением β_2 -адренорецепторов появляется бронхорасширяющее действие, уменьшение отека в слизистой бронхов, понижается тонус беременной матки (токолитическое действие), расширяются сосуды головного мозга, сердца, скелетных мышц и печени, несколько снижается артериальное давление.
- **Изопреналина сульфат (изадрин, новодрин)** – первый представитель группы β -адреномиметиков. Является неселективным, его действие распространяется одновременно на β_1 - и β_2 -адренорецепторы. Основное применение изопреналина – купирование и предупреждение приступов бронхиальной астмы (ингаляционно в виде аэрозолей), а также нарушение атриовентрикулярной проводимости (сублингвально). Применяют также при некоторых формах кардиогенного шока. Нежелательные эффекты: тахикардия, различные аритмии, тремор, сухость во рту. Осторожно назначают при стенокардии.



β_1 - адреномиметики

- Добутамин (добужект, добутрекс) избирательно стимулирует β_1 -адренорецепторы миокарда и оказывает положительное инотропное действие (усиление систолы). Применяют при кардиогенном шоке, после операции на сердце, сердечной недостаточности. Нежелательные эффекты: тахикардия, экстрасистолия, повышение артериального давления, тошнота, головная боль.



β_2 - адреномиметики

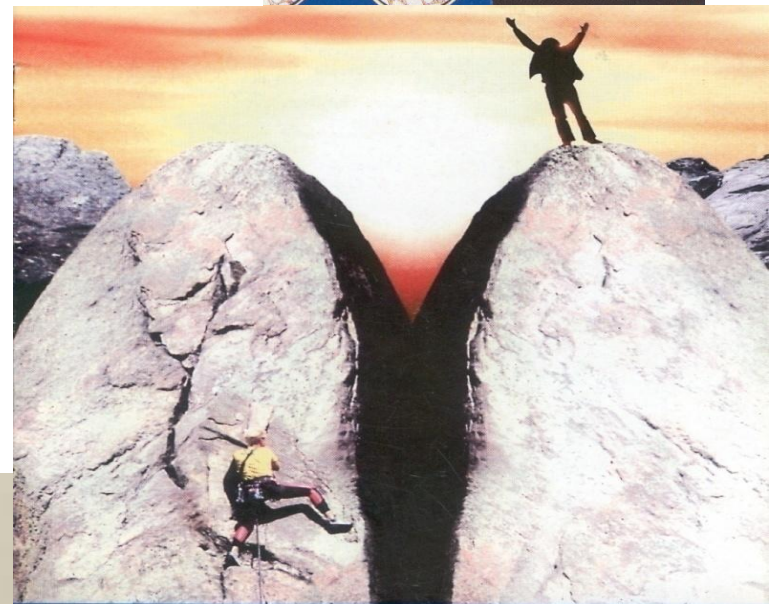
- К ним относятся ЛС с преимущественным влиянием на β_2 - адренорецепторы. Они более избирательно действуют на бронхи, не вызывают выраженной тахикардии и снижения артериального давления. При длительном применении селективность снижается.
- Орципреналина сульфат (алуцент, астмапент) оказывает более продолжительное бронходилатирующее действие, чем изопреналин. Обладает относительной селективностью. После ингаляции орципреналина эффект продолжается до 4-5 часов. Основные показания к применению: бронхиальная астма, астматические бронхиты, эмфизема легких. Назначают в виде ингаляций, под кожу, в мышцу. Возможные нежелательные эффекты такие же, как и для изопреналина.
- Сальбутамол (вентолин, сальбувент, сальгим, сальтос) применяют для купирования и предупреждения приступов бронхиальной астмы в виде аэрозолей. Длительность действия – 4-6 часов. В лечебных дозах обычно не вызывает тахикардии и изменений артериального давления. Оказывает также токолитическое действие.



Рис. 1. Дозированный аэрозольный ингалятор

β 2 - адреномиметики

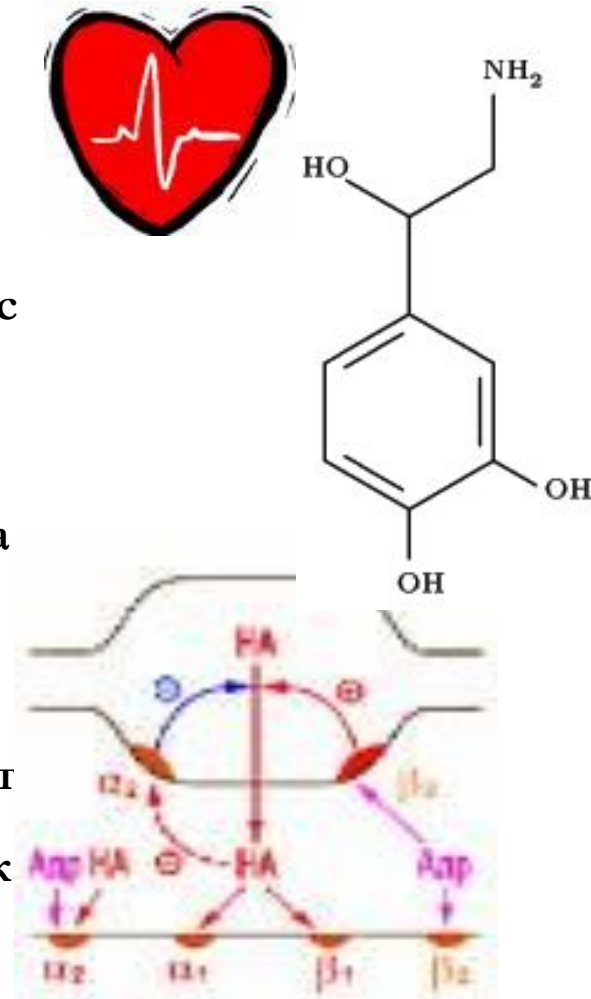
- Фенотерол (беротек) применяют в виде аэрозолей при бронхиальной астме, ингаляции производят с промежутками в 5 часов. Под названием Партусистен применяется при угрозе выкидыша.
- Аналогичным действием обладает Гексапреналин (ипрадол), а его ЛС Гинипрал обладает токолитическим действием.
- Лекарственные средства Кленбутерол (контраспазмин, спиропент), Формотерол (форадил), Сальметерол (серевент) оказывают более длительное бронхорасширяющее действие – до 10-12 часов. Применяются для поддерживающей терапии и с целью профилактики бронхоспазма.
- Нежелательные эффекты проявляются в виде головной боли, возбуждении, тахикардии, треморе.



*Новый подход к лечению
бронхиальной астмы*

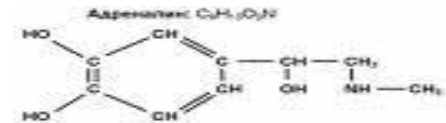
α , β - адреномиметики

- Лекарственные вещества этой группы возбуждают все типы адренорецепторов. Различают α , β -адреномиметики прямого и непрямого (симпатомиметики) действия. К ЛС прямого действия относятся норэпинефрин и эпинефрин.
- **Норэпинефрин** (норадреналин) соответствует естественному медиатору. Выпускается в виде норадреналина гидротартрата. Его действие связано с преимущественным влиянием на α_1 -адренорецепторы, с чем связано сужение сосудов и повышение артериального давления. Кардиотоническое действие норадреналина, связанное с его стимулирующим влиянием на β_1 -адренорецепторы сердца, маскируется рефлекторной брадикардией за счет повышения тонуса блуждающего нерва.
- Применяют норадреналин при многих состояниях, сопровождающихся острым снижением артериального давления. При введении внутрь легко разрушается, а при подкожном и внутримышечном введении вызывает сильный местный спазм сосудов, что может привести к некрозу ткани. В вену вводят капельно, т.к. в организме быстро инактивируется.
- Побочные эффекты при применении норадреналина наблюдаются редко. Возможны аритмии, головная боль, нарушение дыхания.



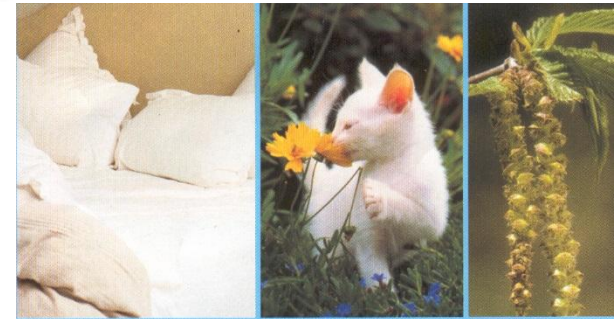
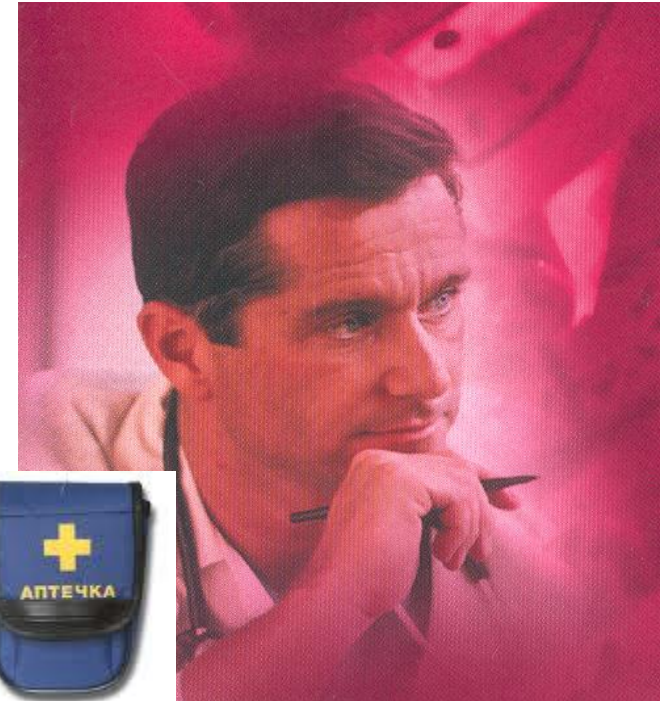
α , β - адреномиметики

- Эпинефрин (адреналин) получают синтетическим путем. Выпускается в виде адреналина гидрохлорида и адреналина гидротартрата. Адреналин оказывает прямое стимулирующее влияние на α - и β -адренорецепторы. Стимуляция α 1-адренорецепторов сосудов приводит к их сужению (сосуды внутренних органов, кожи), а активация β 2-адренорецепторов вызывает расширение сосудов скелетных мышц, при этом общее периферическое сопротивление сосудов может значительно снижаться. Тем не менее, среднее артериальное давление вследствие увеличения систолического давления повышается. В больших дозах преобладает влияние адреналина на α 1-адренорецепторы сосудов и повышается общее периферическое сопротивление. Затем прессорное действие адреналина обычно сменяется небольшой гипотензией, что связано с более длительным возбуждением β 2-адренорецепторов сосудов.
- Стимулируя β 1-адренорецепторы сердца, адреналин увеличивает силу и частоту сердечных сокращений и в связи с этим – ударный и минутный выброс крови, но при этом увеличивается потребление миокардом кислорода.



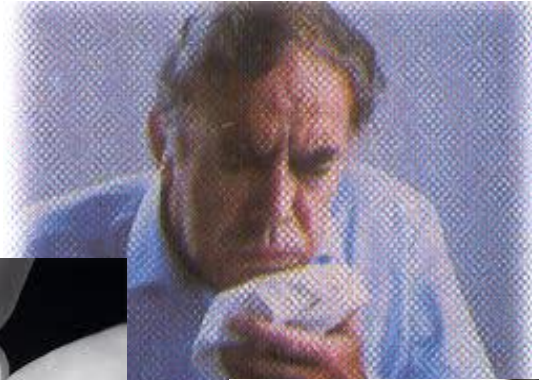
α , β - адреномиметики

- Адреналин вызывает расслабление мускулатуры бронхов и устраняет бронхоспазм, снижает тонус и моторику желудочно-кишечного тракта, расширяет зрачки и снижает внутриглазное давление. Под влиянием адреналина усиливается гликогенолиз (повышается сахар в крови) и липолиз (увеличивается в плазме крови содержание липидов). Адреналин улучшает функциональную способность скелетных мышц, особенно при их утомлении.
- На ЦНС адреналин в терапевтических дозах выраженного влияния не оказывает. Однако иногда могут наблюдаться беспокойство, головная боль, тремор.
- Назначают адреналин под кожу, в мышцу и местно, иногда вводят в вену; в случае острой остановки сердца – внутрисердечно. Внутрь адреналин не назначают, т.к. он разрушается в желудочно-кишечном тракте.



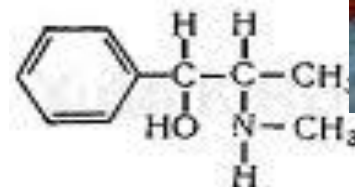
α , β - адреномиметики

- Применяют адреналин при анафилактическом шоке и других аллергических реакциях, при приступах бронхиальной астмы, при гипогликемической коме, остановке сердца. Иногда назначают при гипотензии и коллапсе. Как местное сосудосуживающее средство используется в офтальмологии, отоларингологии в составе капель и мазей, при капиллярных кровотечениях, добавляется к растворам местных анестетиков для пролонгирования их действия.
- При применении адреналина могут наблюдаться повышение артериального давления, аритмии, боли в области сердца, гипергликемия.
- Адреналин противопоказан при гипертензии, выраженном атеросклерозе, сахарном диабете, тиреотоксикозе, ИБС, беременности.



Симпатомиметики

- К α - β -адреномиметикам непрямого действия (симпатомиметикам) относится Эфедрин. Это алкалоид, содержащийся в различных видах эфедры. Получают из растительного сырья и синтетическим путем. Выпускается в виде эфедрина гидрохлорида. По химическому строению и фармакологическим эффектам эфедрин сходен с адреналином, но отличается по механизму действия: он стимулирует выброс медиатора и угнетает его обратный захват на уровне пресинаптической мембраны, поэтому активность эфедрина зависит от запасов медиатора. При частом введении возникает *тахифилаксия*, которая обусловлена истощением запасов медиатора. От адреналина эфедрин также отличается большей стойкостью и продолжительностью действия.



Симпатомиметики

- По фармакологическим свойствам эфедрин близок к адреналину. Он вызывает сужение сосудов, повышение артериального давления, расширение бронхов, повышение сахара в крови, расширение зрачка (не влияя на внутриглазное давление). По активности эфедрин значительно уступает адреналину. Эфедрин оказывает возбуждающее действие на ЦНС, обладает одурманивающим действием, при отравлении наркотическими и снотворными средствами оказывает пробуждающее действие.
- Применяют эфедрин чаще всего в качестве бронхолитика, при отравлениях наркотиками и снотворными, иногда при гипотензии. Назначают внутрь, инъекционно, а также местно при ринитах и для расширения зрачка.
- ЛС обычно хорошо переносится, иногда отмечается легкая дрожь, сердцебиение, нервное возбуждение.
- Противопоказан при гипертензии, атеросклерозе, органических заболеваниях сердца, сахарном диабете, тиреотоксикозе, беременности.
- Эфедрин входит в состав таблеток «Т-федрин», препаратов «Солутан», «Бронхолитин», «Бронхоцин».



Антиадренергические (адреноблокирующие) средства

α - адреноблокаторы	β -адреноблокаторы	α - β - адреноблокаторы	Симпатолитики
<p><i>α_1 - α_2-адреноблокаторы</i></p> <p>Фентоламин Дигидроэрготамин Дигидроэрготоксин Пирроксан</p>	<p><i>β_1 - β_2 - адреноблокаторы</i></p> <p>Пропранолол Окспренолол Пиндолол Соталол Тимолол Надолол</p>	<p>Лабеталол Карведилол</p>	<p>Резерпин Раунатин</p>
<p><i>α_1 - адреноблокаторы</i></p> <p>Празозин Теразозин Доксазозин</p>	<p><i>β_1 - адреноблокаторы</i></p> <p>Талинолол Атенолол Метопролол Бисопролол Небиволол</p>		
<p><i>α_2-адреноблокаторы</i></p> <p>Ницерголин</p>			

- Адреноблокаторы блокируют адренорецепторы, препятствуют действию на них медиатора норадреналина. На синтез норадреналина не влияют.

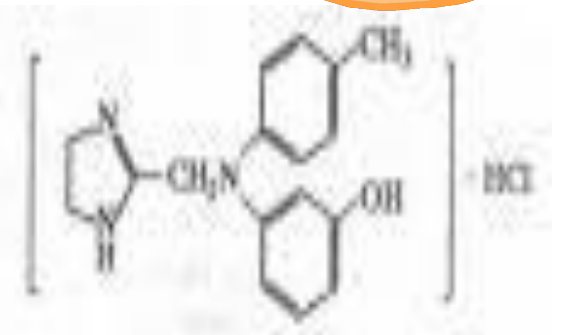
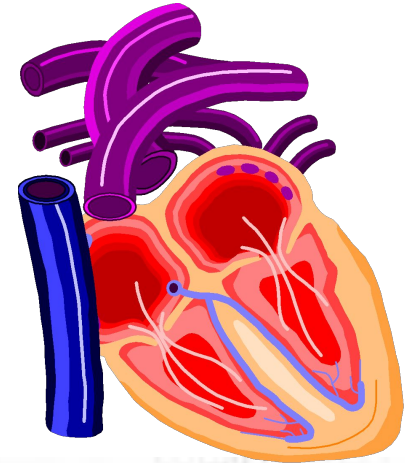


α - адреноблокаторы

- Эти ЛС блокируют α_1 - и α_2 -адренорецепторы и тормозят передачу возбуждения в адренергических синапсах. Блокада α_1 -адренорецепторов приводит к снижению тонуса артериальных и венозных сосудов, вызывая снижение периферического сопротивления сосудов и артериального давления, улучшение кровоснабжения периферических тканей. Они «извращают» (уменьшают) прессорный эффект адреналина, поскольку на фоне блокады α - адренорецепторов проявляется сосудорасширяющее действие адреналина за счет активации β_2 -адренорецепторов.

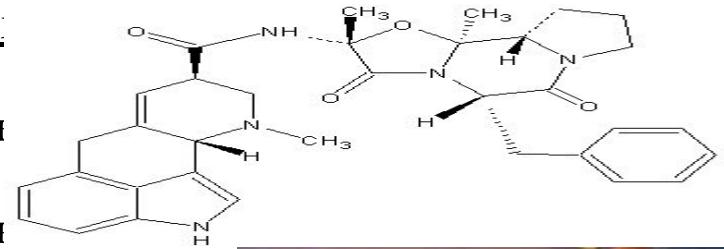
α - адреноблокаторы

- Фентоламин (регитин) является неселективным α -адреноблокатором. Блокирует одновременно α_1 - и α_2 -адренорецепторы. Его применяют при расстройствах периферического кровообращения (болезнь Рейно, эндартериит, начальные стадии атеросклеротической гангрены), для лечения трофических язв конечностей, пролежней, отморожений, простатите, а также при феохромоцитоме (опухоль мозгового вещества надпочечников, которая продуцирует большое количество адреналина, что ведет к значительному повышению артериального давления).
- При применении фентоламина возможны головокружение, покраснение кожи, набухание слизистой оболочки носа, тахикардия, диспепсия.
- ЛС противопоказано при органических изменениях сердца и сосудов.
- Аналогичным действием обладает Пирроксан.



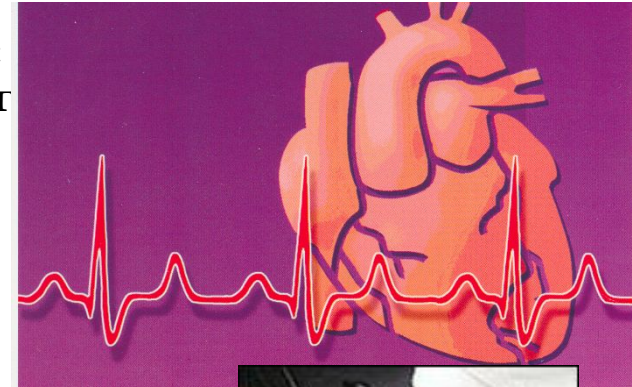
α - адреноблокаторы

- Дигидроэрготамин и дигидроэрготоксин (редергин) – полусинтетические ЛС дигидрированных алкалоидов спорыньи которые отличаются от естественных отсутствием стимулирующего влияния и миометрий. Обладают сильными α -адреноблокирующими свойствами. Они вызывают понижение артериального давления, расширение артериол и некоторое замедление сердечных сокращений.
- Применяют дигидрированные алкалоиды спорыньи при гипертензии, спазмах кровеносных сосудов.
- Дигидроэргокристин входит в состав комбинированных ЛС «Кристецин», «Бринердин», «Норматенс», «Неокристецин», применяемых для снижения артериального давления.



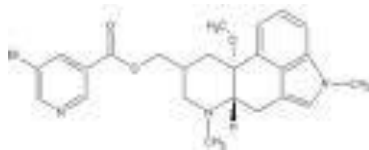
α - адреноблокаторы

- Празозин (минипресс) обладают избирательным действием на постсинаптические α_1 -адренорецепторы. Он оказывает одновременно артерио- и венорасширяющее действие, ограничивает в связи с этим венозный возврат крови к сердцу и облегчает его работу за счет уменьшения периферического сопротивления – другими словами, сокращает пре- и постнагрузку на миокард. Основным эффектом празозина – снижение артериального давления, связанный главным образом с периферической вазодилатацией. В отличие от обычных α -адреноблокаторов при приеме празозина тахикардия, как правило, не возникает.
- Применяют празозин при разных формах артериальной гипертензии. Эффективен при приеме внутрь. Первая доза не должна превышать 0,5 мг. При более высоких начальных дозах возможен ортостатический коллапс с потерей сознания («эффект первой дозы»). Стойкий эффект развивается постепенно, через несколько недель.
- Возможны нежелательные явления: головокружение, бессонница, слабость, тошнота. Противопоказан при беременности, детям до 12 лет.
- Аналогичным селективным действием обладают Доксазозин (кардура), Теразозин (сетегис).



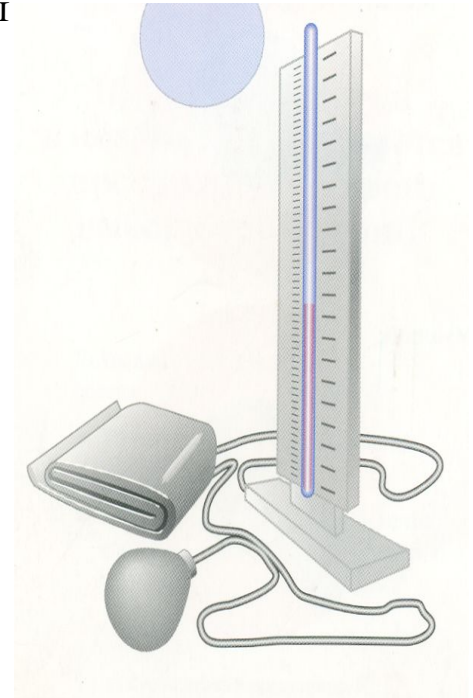
α - адреноблокаторы

- Ницерголин (сермион) является производным спорыньи и никотиновой кислоты. Обладает α_2 -адреноблокирующей и спазмолитической активностью, расширяет мозговые и периферические сосуды. Применяется при нарушениях мозгового и периферического кровообращения, при мигрени, ишемии зрительного нерва. Возможны нежелательные эффекты: гипотензия, головокружение, зуд, диспепсические явления.



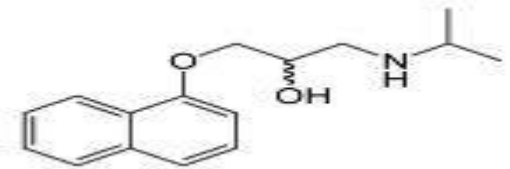
β - адреноблокаторы

- ЛС этой группы нарушают проведение нервных импульсов в адренергических синапсах за счет угнетения β -адренорецепторов. Блокада β_1 -адренорецепторов, расположенных в миокарде, вызывает ослабление силы и частоты сердечных сокращений, снижение сократительной способности миокарда и потребности сердца в кислороде, уменьшение сердечного выброса (ударного объема) и падение артериального давления. Угнетение β_2 -адренорецепторов может привести к спазму бронхов, повышению тонуса мускулатуры матки, уменьшению процессов гликогенолиза (снижается уровень сахара в крови).
- Некоторые из β -адреноблокаторов (пропранолол, тимолол, атенолол) обладают только блокирующим действием на β -адренорецепторы. Другие же (окспренолол, талинолол, пиндолол) оказывают некоторое стимулирующее действие на рецепторы, т.е. обладают внутренней симпатомиметической активностью и могут несколько стимулировать сердечную деятельность.
- ЛС этой группы широко применяются при различных сердечно-сосудистых заболеваниях: ишемической болезни сердца, тахикардиях, артериальной гипертензии и др.
- β -адреноблокаторы делятся на неселективные (действующие на β_1 - и β_2 -адренорецепторы) и кардиоселективные (действующие на β_1 -адренорецепторы). Но в больших дозах и при длительном применении селективность снижается.



β_1 - β_2 - адреноблокаторы

- Пропранолол (анаприлин, обзидан, индерал) являются широко применяемым лекарственным средством. Он блокирует β_1 - и β_2 -адренорецепторы сердца, бронхов, желудочно-кишечного тракта, матки и др. Основным является его влияние на миокард: снижение сократительной способности, величины сердечного выброса, потребности миокарда в кислороде. Применяют пропранолол для лечения стенокардии, нарушений сердечного ритма (тахикардиях), артериальной гипертензии, тиреотоксикозе, глаукоме (снижают секрецию внутриглазной жидкости).
- Пропранолол повышает тонус бронхов и может провоцировать бронхоспазм (за счет блокады β_2 -адренорецепторов бронхов), снижает также гликогенолиз и липолиз, повышает тонус матки, повышает тонус периферических сосудов (симптом холодных рук и ног).
- При применении пропранолола возможны побочные явления: брадикардия, общая слабость, головокружение, бронхоспазм, диспепсические расстройства.
- АС противопоказано при брадикардии, выраженной сердечной недостаточности, бронхиальной астме, беременности. С осторожностью назначают пропранолол больным сахарным диабетом из-за опасности гипогликемии, болезни Рейно.



β_1 - β_2 - адреноблокаторы

- Оксспренолол (тразикор) по действию близок к анаприлину, но оказывает менее выраженное влияние на силу и частоту сокращений миокарда. Является β -адреноблокатором с внутренней симпатомиметической активностью. Применяется аналогично пропранололу.
- К неселективным β -адреноблокаторам относятся также Пиндолол (вискен), Надолол (коргард), Соталол (соталекс), Тимолол (тимопстик) и другие ЛС.



β_1 - адреноблокаторы (кардиоселективные)

- Талинолол (корданум) избирательно блокирует β_1 -адренорецепторы сердца, уменьшает силу и частоту сердечных сокращений, проявляет антиаритмическое действие, снижает артериальное давление. Почти не влияет на β_2 -адренорецепторы бронхов и сосудов, в меньшей степени вызывает сужение периферических сосудов и бронхоспазм, не вызывает гипогликемии. Применяется для лечения стенокардии, нарушений сердечного ритма, артериальной гипертензии. Возможны нежелательные побочные эффекты: чувство жара, головокружение, диспепсия.
- Атенолол (атеносан, тенормин, аткардил) является селективным β_1 -адреноблокатором, уменьшает возбудимость и сократимость миокарда, оказывает гипотензивный эффект, снижает потребность миокарда в кислороде. Менее выражено влияние на бронхи и периферические артерии. Показания к применению аналогичны талинололу.
- Кардиоселективными β_1 -адреноблокаторами являются также Метопролол (беталок, эгилок, метокард, сеодол), Небиволол (небилет, небикард), Бисопролол (конкор) и др. Невиволол обладает также сосудорасширяющим действием.
- Прекращать применение β -адреноблокаторов следует постепенно во избежание «синдрома отмены».

α - β -адреноблокаторы

- Лекарственным средством, блокирующим оба типа адренорецепторов, является Лабеталол (коретон, трандат). Снижает общее периферическое сопротивление сосудов, обладает достаточно быстрым и выраженным гипотензивным эффектом. Применяют лабеталол в качестве антигипертензивного средства, в основном для купирования гипертензивных кризов.
- Карведилол (кардивас, таллитон, дилатренд) блокирует α - и β -адренорецепторы, обладает выраженным антиоксидантным действием. Применяется при стенокардии, инфаркте миокарда, хронической сердечной недостаточности, артериальной гипертензии.



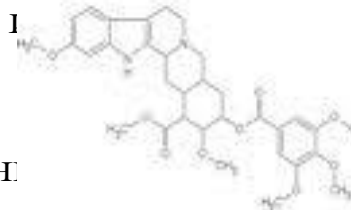
Симпатолитики

- Симпатолитики нарушают передачу возбуждения на уровне пресинаптической мембраны либо истощая запасы норадреналина в нервных окончаниях, либо предотвращая его высвобождение. Это приводит к уменьшению влияния симпатической нервной системы на кровеносные сосуды и сердце – сосуды расширяются, снижается сила сердечных сокращений и возникает брадикардия. Результатом этого является снижение артериального давления.
- Угнетение симпатической (адренергической) иннервации приводит к косвенному повышению активности парасимпатической и преобладанию холинергических эффектов. Это проявляется в усилении перистальтики желудочно-кишечного тракта, увеличении секреции желез желудка. Указанные эффекты расцениваются как нежелательные.



Симпатолитики

- Резерпин – алкалоид растений рода раувольфия, обладает выраженными симпатолитическими свойствами. Под влиянием резерпина происходит ускорение высвобождения норадреналина и других катехоламинов из везикул нервных окончаний. При применении резерпина постепенно снижается систолическое и диастолическое артериальное давление при разных формах и стадиях артериальной гипертензии. Гипотензивный эффект развивается постепенно (на 6-8 сутки) и относительно долго сохраняется после прекращения приема резерпина.
- Резерпин снижает содержание катехоламинов и серотонина в ЦНС, тем самым оказывает седативное и слабое антипсихотическое действие, способствует наступлению сна.
- При применении резерпина отмечаются нежелательные эффекты: сонливость, депрессия, заложенность носа, спазмы желудка и кишечника, понос, усиление секреции пищеварительных желез, боли в желудке.
- В настоящее время резерпин применяется в составе комбинированных ЛС для лечения артериальной гипертензии: «Адельфан», «Трирезид-К», «Кристепин», «Норматенс» и др. Выпускается лекарственное средство Раунатин, содержащее сумму алкалоидов раувольфии.



Контрольные вопросы

1. Классификация адренорецепторов и их локализация.
2. Какое действие характерно для α -адреномиметических средств? Показания к применению.
3. Какой принцип действия ксилометазолина при рините?
4. Селективные и неселективные β -адреномиметики, их фармакодинамика и применение.
5. Фармакодинамика и применение эпинефрина гидрохлорида и эфедрина гидрохлорида. Их сравнительная характеристика и особенности действия.
6. Какие ЛС применяют при бронхиальной астме?
7. Какая группа ЛС обладает токолитическим действием?
8. Как β -адреноблокаторы влияют на деятельность сердца? Каковы их показания к применению и побочные эффекты?
9. В чем заключается отличие в действии пропранолола и атенолола?
10. Назовите фармакологические группы ЛС, применяемые при артериальной гипертензии? В чем заключается механизм их гипотензивного действия.

Тесты для закрепления

1. *Какие эффекты связаны с возбуждением β - адренорецепторов?*
 - а) Тахикардия б) Брадикардия в) Спазм бронхов г) Расслабление мышц бронхов д) Сужение сосудов е) Расширение сосудов
2. *Указать средства, повышающие артериальное давление.*
 - а) Анаприлин б) Мезатон в) Адреналин г) Раунатин
3. *В каких случаях показано применение адреналина?*
 - а) При остановке сердца б) При бронхиальной астме в) При гипертензии г) При гипогликемии д) При стенокардии
4. *Какие ЛС применяют при бронхиальной астме?*
 - а) Эфедрин б) Адреналин в) Нафтизин г) Сальбутамол д) Анаприлин
5. *Отметить α - адреноблокаторы.*
 - а) Атенолол б) Фентоламин в) Ницерголин г) Мезатон д) Адреналин
6. *Применение β - адреноблокаторов, кроме:*
 - а) Стенокардия б) Бронхиальная астма в) Артериальная гипертензия г) Тахикардия
7. *Отметить кардиоселективные β - адреноблокаторы.*
 - а) Надолол б) Атенолол в) Пропранолол г) Метопролол
8. *Для какой группы ЛС характерен «синдром отмены»?*
 - а) Симпатолитики б) Симпатомиметики в) β - адреноблокаторы г) α - адреномиметики
9. *Какое влияние окажет адреналин на АД на фоне фентоламина?*
 - а) Повысит б) Снизит в) Не изменит

Правильные ответы:

- 1 – а,г,е;
- 2 – б,в;
- 3 – а,б,г;
- 4 – а,б,г;
- 5 – б,в;
- 6 – б;
- 7 – б,г;
- 8 – в;
- 9 – б.