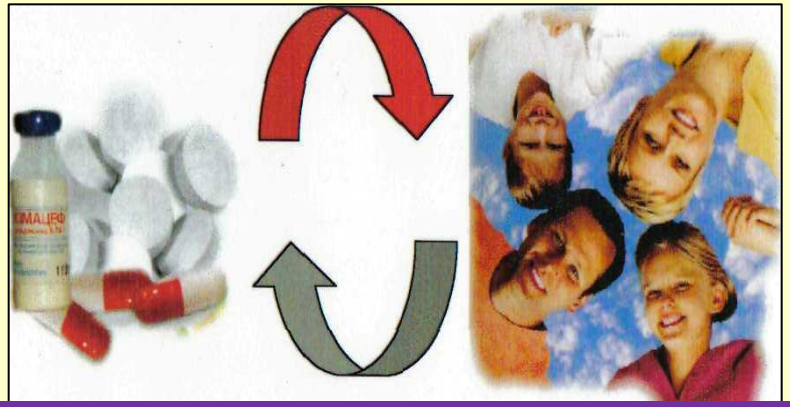


Лекція №2

Фармакологія холіно- і адренотропних засобів

Загальна класифікація лікарських засобів

Засоби, що впливають на периферичну нервову систему

Засоби, що впливають на виконавчі органи

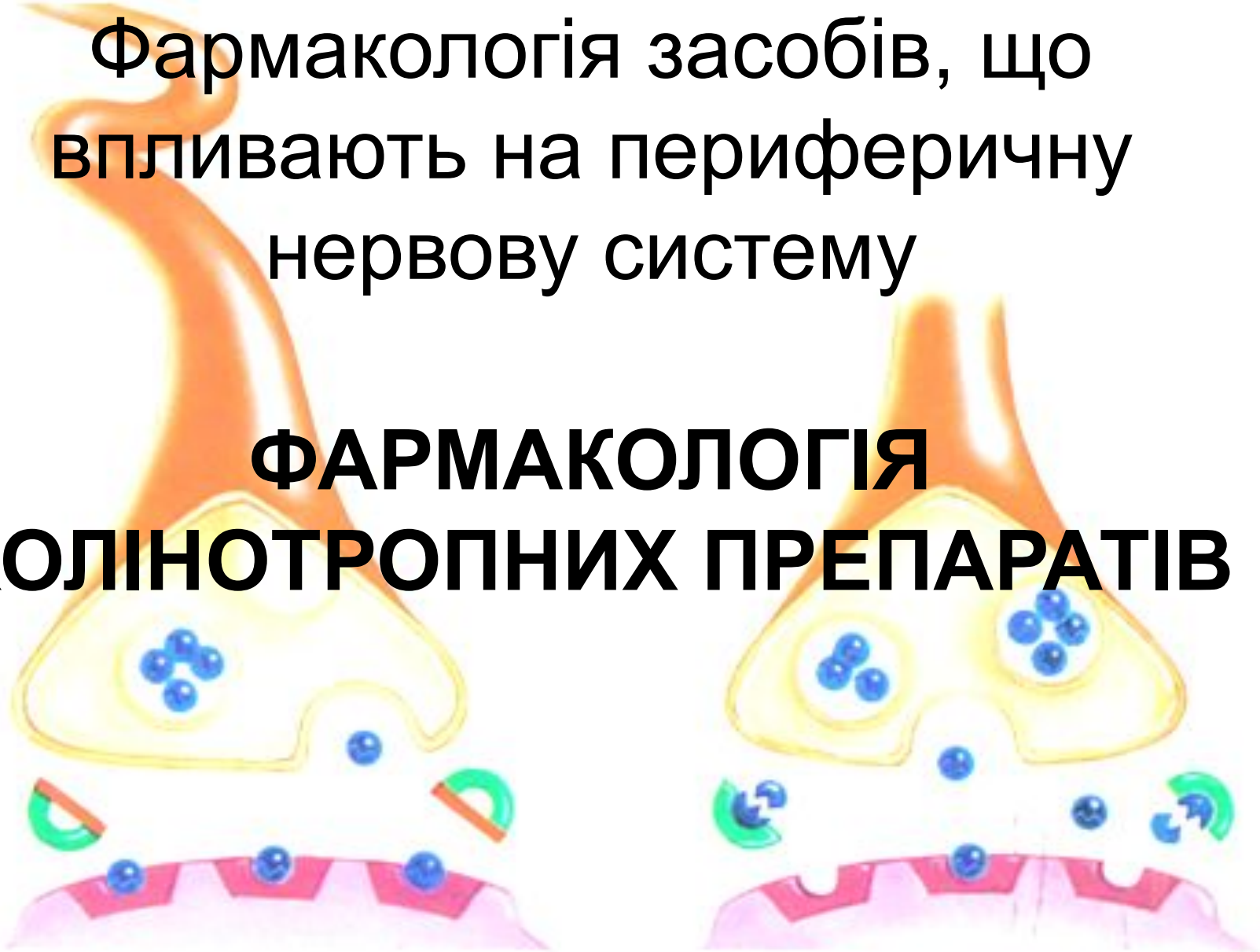
Засоби, що впливають на центральну нервову систему

Засоби для боротьби із збудниками інфекційних захворювань

Засоби, що впливають на метаболічні процеси

Фармакологія засобів, що впливають на периферичну нервову систему

ФАРМАКОЛОГІЯ ХОЛІНОТРОПНИХ ПРЕПАРАТІВ



НЕРВОВА СИСТЕМА

Централна нервова система (ЦНС)

Периферична нервова система

еферентна

аферентна

соматична

автономна (вегетатат

симпатична

парасимпатична

Анатомічні відмінності симпатичної та парасимпатичної нервової системи

1. Місце виходу з ЦНС

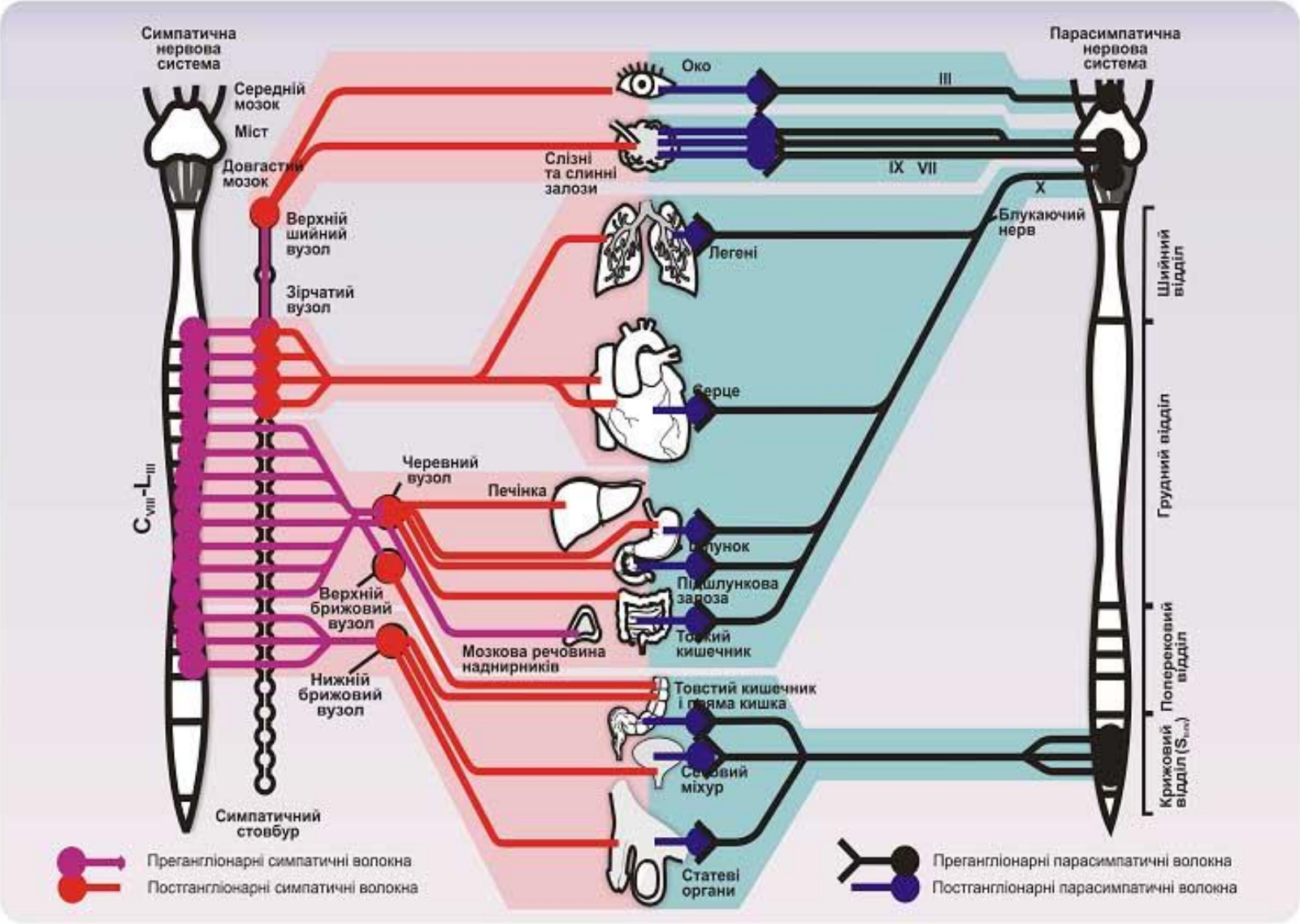
Парасимпатична: Краніальна частина ЦНС-

III - n. oculomotorius
VII - n.facialis (chorda tympany)
IX - n. glossopharyngeus
X - n. vagus;

Сакральна: n.pelvicus

Симпатична: **Thoraco-lumbalis (truncus sympathicus)**

Будова периферичної вегетативної нервової системи



2. Місце локалізації гангліїв та довжина пре- і постгангліонарних волокон

Парасимпатичні ганглії розташовані інтраорганно або поблизу органів, які іннервуються ,прегангліонарні волокна – довгі, постгангліонарні – короткі

Симпатичні ганглії розташовані поблизу виходу зі спинного мозку; таким чином прегангліонарні волокна короткі, а постгангліонарні волокна - довгі.

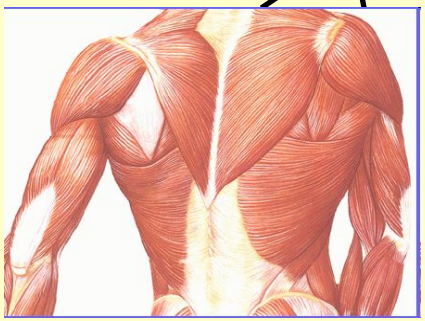
М-х.р.

Н-х.р.

ЦНС

Соматичні

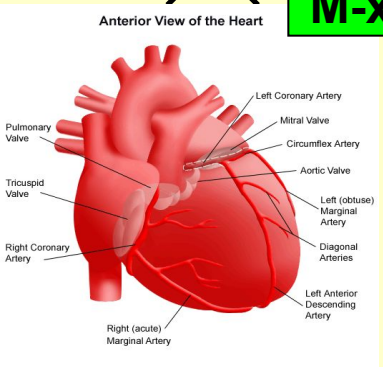
Н-х.р.



Парасимпатичні

Н-х.р.

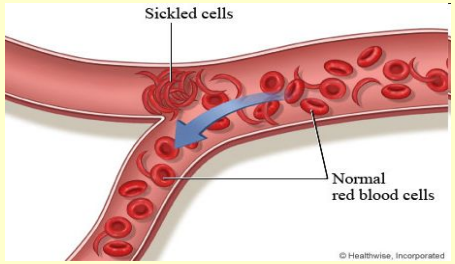
М-х.р.



Симпатичні

Н-х.р.

адренорецептори



Фізіологічні відмінності

Симпатична та парасимпатична нервові системи є антагоністами по відношенню до більшості волокон, що іннервуються

ХОЛІНЕРГІЧНИЙ СИНАПС

ТОЧКИ ПРИКЛАДАННЯ ДІЇ ХОЛІНОТРОПНИХ ЗАСОБІВ

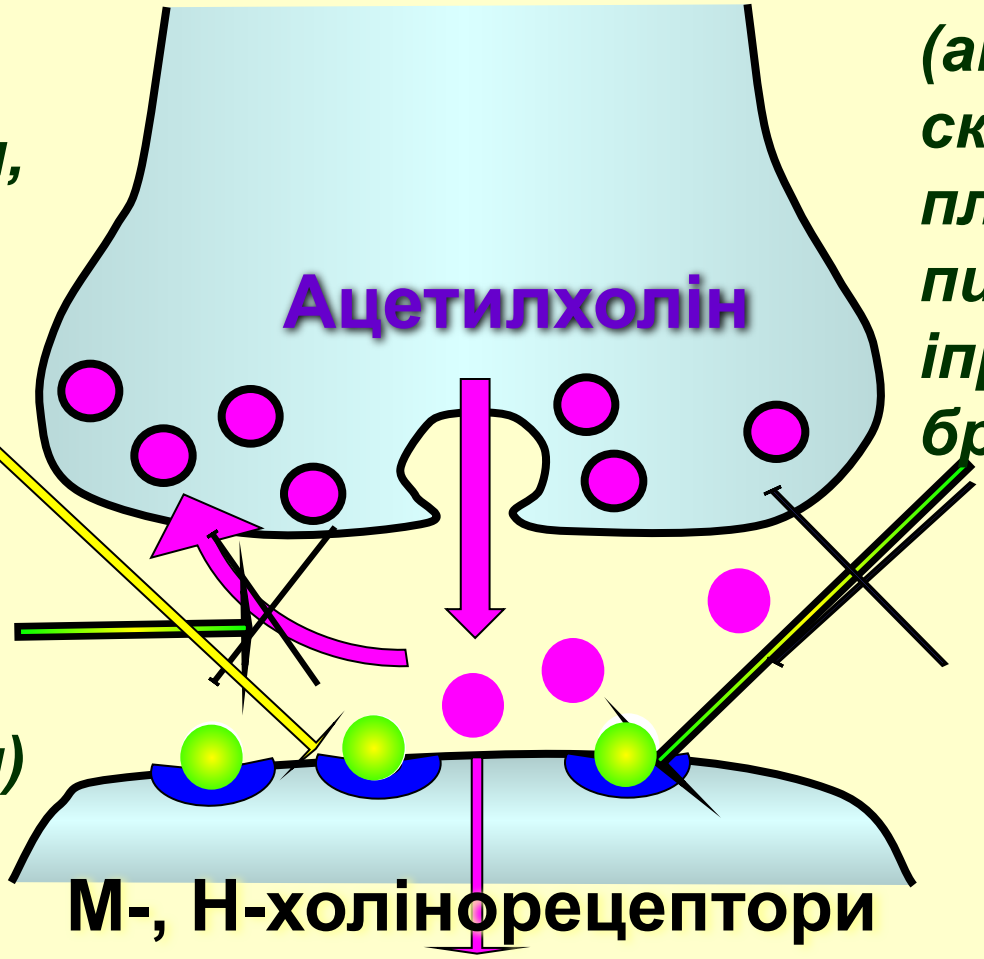
М-холіноміметики - агоністи

М-холінолітики - антагоністи

дії:

прямої ***(ацетилхолін, карбахолін, пілокарпин, мускарин)***

непрямої ***(фізостигмін, галантамін, прозерин, піридостигмін)***



(атропін, скополамін, платифілін, пирензепін, іпратропію бромід)

ТОЧКИ ПРИКЛАДАННЯ ДІЇ ХОЛІНОТРОПНИХ ЗАСОБІВ

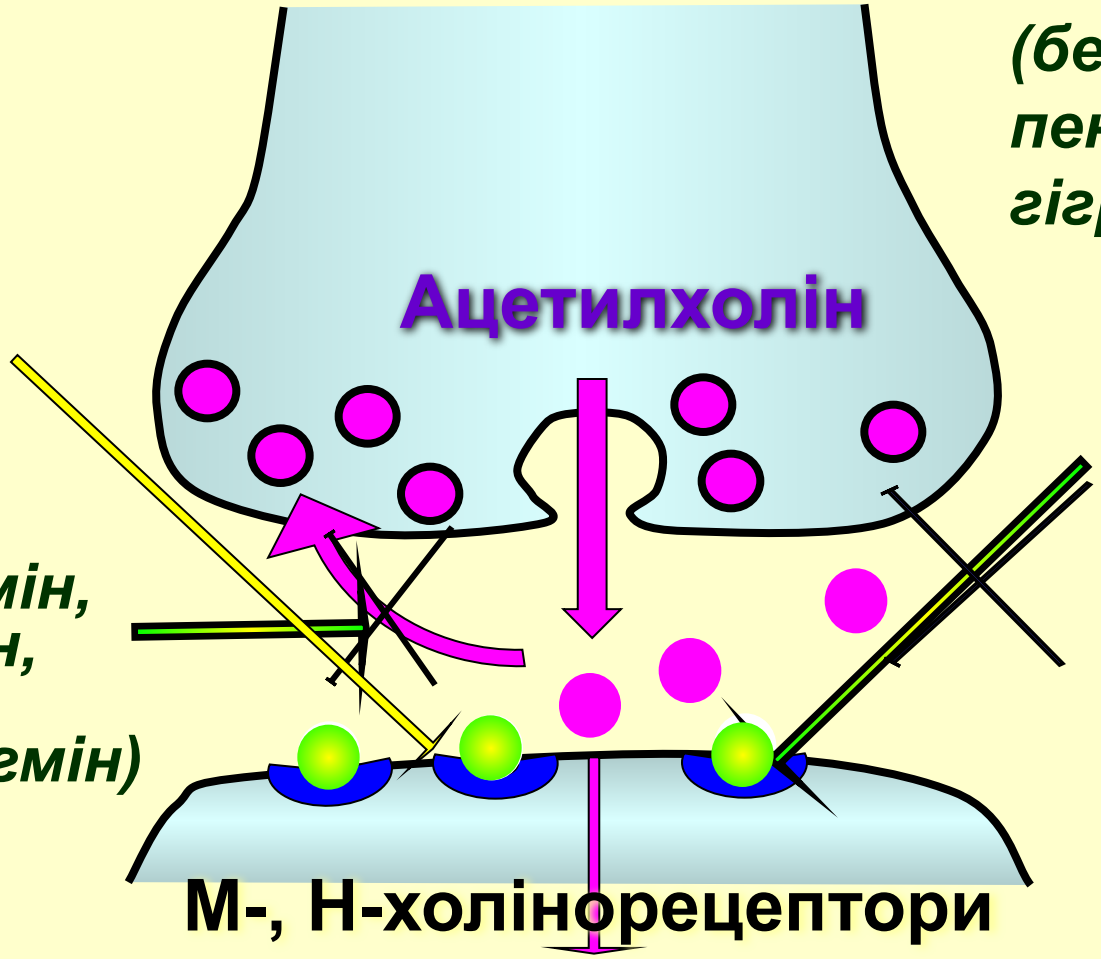
Н-холіноміметики - агоністи

Н-холінолітики - антагоністи

дії:

прямої ***(дитилін, никотин, цитизин)***

непрямої ***(фізостигмін, галантамін, прозерин, піридостигмін)***



(бензогексоній пентамін, гігроний)

Класифікація ХОЛІНЕРГІЧНИХ РЕЦЕПТОРІВ

М-хр

(*мускарин-чутливі*)

Н-хр

(*нікотин-чутливі*)

Збудження цих рецепторів АХ або холінотропними засобами посилює функцію клітин, тканин, органів;

Блокада – навпаки, послаблює, гальмує

Локалізація холінорецепторів

М-холінорецептори переважно розташовані в органах, які отримують **постгангліонарну парасимпатичну** іннервацію:

- **гладенька мускулатура внутрішніх органів (бронхи, шлунок, кишечник, матка, сечовий міхур, внутрішні м'язи ока (*m.ciliaris, m.sphincter pupillae*) міокард.**
- **в усіх зовнішньосекреторних залозах (бронхіальних, слізних, слинних, потових, сальних, молочних, залозах ШКТ)**
- **в ЦНС**

Ефекти, що виникають при дії на М-холінорецептори

Орган	Ефект	
	збудження	блокада
Око m. sphincter pupillae Акомодація Внутрішньоочний тиск	Скорочення (міоз) Спазм аккомодації Зниження	Розширення (мідріаз) Параліч аккомодації Підвищення
Слинні залози	Підвищення секреції	Зниження секреції
Бронхи Гладка мускулатура Залози	Скорочення (бронхоспазм) Підвищення секреції	Розслаблення Зниження секреції
Серце	Пригнічення роботи (зниження збудливості, провідності,брадикардія	Стимуляція роботи (підвищення провідності, збудливості, тахікардія
ШКТ Моторика Сфінктери Секреція екскреторних залоз	Посилення Розслаблення Підвищення	Зменшення Спазм Зниження
Сечовий міхур Детрузор Сфінктер	Скорочення Розслаблення	Розслаблення Скорочення

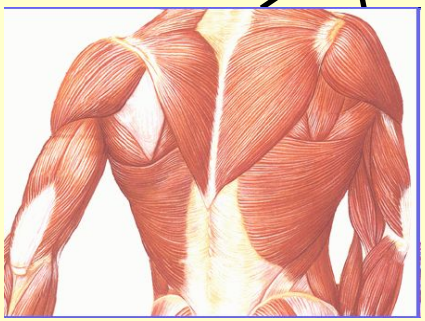
М-х.р.

Н-х.р.

ЦНС

Соматичні

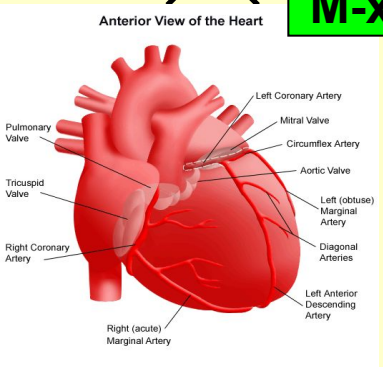
Н-х.р.



Парасимпатичні

Н-х.р.

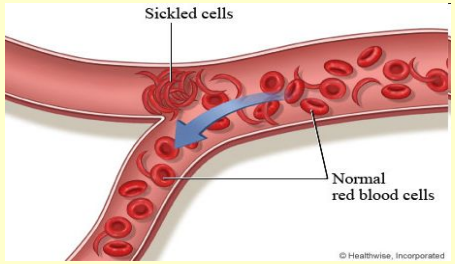
М-х.р.



Симпатичні

Н-х.р.

адренорецептори



Н-холінорецептори в організмі переважно знаходяться:

- в **нервово-м‘язових** синапсах (в скелетній мускулатурі, в закінченнях соматичних нервів)
- в симпатичних та парасимпатичних **гангліях**
- в гангліоподібних утвореннях (сино-каротидному клубочку, нейрогіпофізі, мозковому шарі наднирників)

Ефекти, що виникають при дії на Н-холінорецептори

Орган	Ефект	
	Стимуляція	Блокада
Скелетні м’язи	Підвищення тонусу скелетної мускулатури	Зниження тонусу скелетної мускулатури (релаксація)
Вегетативні ганглії	Покращення провідності імпульсів через ганглії	Погіршення провідності імпульсів через ганглії
АТ	Посилення утворення адреналіна в мозковому шарі наднирників, підвищення АТ	Зниження утворення адреналіна в мозковому шарі наднирників, зниження АТ
Дихальний центр	Збудження каротидних синусів → рефлекторне збудження дихального центру → тахіпное	-
ЦНС	Збудження ЦНС	Пригнічення ЦНС

“Обьясните людям значение слов и половина недоразумений и споров исчезнут сами собой”

Декарт

ХОЛІНОТРОПНІ ПРЕПАРАТИ

Міметики – засоби, що збуджують рецептори

Блокатори - засоби, що пригнічують (блокують) рецептори

Ацетилхолін збуджує М- і Н-холінорецептори, тобто є М, Н-холіноміметиком

Подібно до ацетилхоліну, на М- и Н-холінорецептори діють деякі лікарські засоби

Класифікація засобів, що діють в ділянці холінергічних синапсів

I. Холіноміметики (збуджують холінорецептори)

1. М – Холіноміметики
2. Н – Холіноміметики

3. М, Н – Холіноміметики

II. Антихолінестеразні (блокують холінестеразу)

1. Зворотньої дії
2. Незворотньої дії (інсектициди, БОР)

III. Реактиватори холінестерази

IV. Холіноблокатори (блокують холінорецептори)

1. М – Холіноблокатори
2. Н – Холіноблокатори:
   - а. Гангліоблокатори
   - б. Курареподобні (м`язові релаксанти)

М-холіноміметики

Pilocarpini hydrochloridum

Aceclidinum

Pilocarpini hydrochloridum

Фармакодинаміка

- **Звуження зіниці (міоз),**
- **Спазм акомодації (ближнє бачення)**
- **<u>Зниження внутрішньоочного тиску,</u>**

Застосування (тільки місцево)

- **<u>Лікування глаукоми</u>**
- **Покращення трофіки ока при тромбозі центральної артерії сітківки, атрофії зорового нерва**

Системна (резорбтивна) дія препарата не використовується у зв'язку з високою токсичністю (бронхоспазм, порушення роботи серця)

Н-холіноміметики

Cytitonum
(містить алкалоїд цитизин)

Цитизин

Фармакодинаміка

Рефлекторна стимуляція дихального та судино-рухового центру довгастого мозку через збудження хеморецепторів каротидних синусів

Застосування

Входить до складу таблеток

«Теофедрин» (Theophedrinum), який застосовують для лікування бронхіальної астми;

«Табекс» (“Tabex”) - застосовуть з метою полегшення відвикання від паління

Антихолінестеразні препарати

Зворотньої дії (блокують холінестеразу на декілька годин)

- **Proserinum,**
- **Galanthamini hydrobromidum,**
- **Pirydostigmini bromidum**

Незворотньої дії (блокують холінестеразу на термін до 30 діб)

ФОС (дихлофос карбофос, метафос)

Бойові отруйні речовини нервово-паралітичної дії (Зарин, Зоман, табун, V-гази)

Відмінності антихолінестеразних препаратів від холіноміметиків

- Діють як на М- так і на Н-холінорецептори
- Дія більш м'яка, більш фізіологічна
- Володіють вибірковістю дії (діють тільки в тих синапсах, де є недостатність ацетилхоліну)

Фармакодинаміка антихолінестеразних препаратів

- ☒ Звуження зіниці і зниження внутрішньоочного тиску;
- ☒ Викликають спазм акомодації
- ☒ ↑ тонус бронхів та інших гладком’язевих органів
- ☒ ↑ секрецію залоз;
- ☒ Викликають брадикардію та пригнічення роботи серця;
- ☒ Покращують передачу імпульсів з соматичних нервів на скелетні м’язи
- ☒ Покращуть провідність в гангліях
- ☒ Стимулюють виділення катехоламінів в наднирниках;

NB! На ЦНС діють лише речовини, що містять в структурі третинний атом нітрогену (галантамін, ФОС)

Покази до застосування антихолінестеразних засобів

- Міастенія, периферичні паралічі та парези, наслідки травм, поліомієлітів
- Післяопераційна атонія ШКТ, матки та сечового міхура, атонічні закрепи
- Глаукома
- Передозування та отруєння холіноблокаторами (атропіном), курареподібними препаратами поляризуючої дії (Диплацин)

Побічні ефекти

- Звуження зіниці, спазм акомодації;
- Гіперсалівація;
- Нудота;
- Часте сечовипускання
- Проноси (посилення перистальтики)

Протипокази

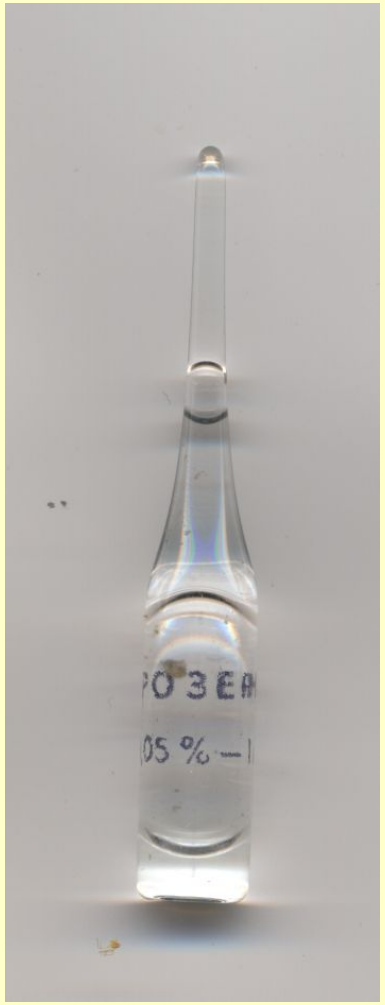
- Бронхіальна астма;
- Стенокардія;
- Епілепсія;
- Гіперкінези

Proserinum (*Neostigmini methylsulfas*)

Є антихолінестеразним препаратом зворотньої дії, ефект триває 2,5-4 години

Показання до застосування

- **Для покращення провідності по периферичних нервах, лікування невритів, наслідків поліомієліта, паралічів, парезів, травм**
- **Передозування М-холіноблокаторів**



Galanthamini hydrobromidum

Тривалість дії довше, ніж у прозерину, тому призначається 1-2 рази на день

Покази до застосування

Порушення провідності по нервових волокнах після поліомієлітів, паралічів, невритів, передозування М-холіноблокаторів

Pirydostigmini bromidum (Calimin)

Покази до застосування

- **Myastenia gravis**
- **Наслідки травм, невритів, паралічів та парезів**
- **Відновний період після поліомієлітів, енцефалітів**

Cholini alfosceras

(*Гліятон, Церетон, Гліатилін*)

Центральний холіноміметик непрямої дії з переважним впливом на ЦНС

Механізм дії: **розщеплюється до холіну і гліцерофосфату:**

-холін приймає участь в біосинтезі ацетилхоліну ;

-гліцерофосфат є попередником фосфатидилхоліну мембрани нервових клітин.

- **Покращує передачу нервових імпульсів в холінергічних нейронах, нервову пластичність**
- **Покращує церебральний кровообіг, метаболічні процеси в головному мозку, відновлює свідомість при травмах ЦНС.**

Показання до застосування:

- **Гострий період ЧМТ**
- **Дегенеративно-інволюційні мозкові синдроми або наслідки цереброваскулярної недостатності (порушення розумової діяльності, памяті, дезорієнтація, емоційні розлади і т.п.)**

Побічні ефекти

Нудота (внаслідок вторинної дофамінергічної активації), біль в животі, порушення свідомості

Протипокази: **індивідуальна непереносимість препарату**

М-холіноблокатори

- Atropini sulfas
- Tropicamidum
- Plathyphyllini hydrotartras
- Pirensepinum (Gastrocepin)
- Ipratropii bromidum (Atrovent)
- Butylscopolamine (Spasmobru),
- Prifinium bromide (Riabal)
- Mebeverine (Duspatalin)

Atropa belladonna L.

Datura stramonium L.

Hyoscyamus
niger L.

Scopolia
carniolica

Вплив М – ХОЛІНОБЛОКАТОРІВ на органи та системи

Око

Розширення зіниці, циклоплегія (параліч акомодації), підвищення внутрішньоочного тиску

Зовнішньосекреторні залози

Пригнічення секреції (слинних, потових, бронхіальних, шлункових залоз)

Серцево-судинна система

Тахікардія, покращення провідності

Шлунково-кишковий тракт

Зменшення шлункової секреції. Спазмолітична дія, атонія ШКТ

Сечостатева система

Порушення сечовипускання (затримка сечі)

Зниження тонуса міометрія

ЦНС

Практично відсутній, тому що погано проходить через гематоенцефалічний бар’єр

Покази до застосування М - ХОЛІНОБЛОКАТОРІВ

- Спазм гладенької мускулатури внутрішніх органів (бронхоспазм, коліки) (Дуспаталін, Спазмобрю, Ріабал, Платифілін)
- Офтальмологія - при травмах ока, при підборі окулярів (Атропін (діє до 5 днів), Тропікамід (діє до 4 годин)
- Захворювання з підвищеною секрецією: гастрит, виразкова хвороба (Пірензепін)
- Для премедикації при операціях (Атропін)
- Попередження та купірування брадикардії та блокад серця (Атропін)
- Бронхіальна астма (Іпратропію бромід)
- Передозування та отруєння холіноміметиками, ФОС (пестицидами) (Атропін)

Покази до застосування М - ХОЛІНОБЛОКАТОРІВ

- Спазм гладенької мускулатури внутрішніх органів (бронхоспазм, коліки), при травмах ока, при підборі окулярів.
- Захворювання з підвищеною секрецією: гастрит, виразкова хвороба *(гастроцепін)*
- Для премедикації при операціях

  в т.ч. В СТОМАТОЛОГІІ
- Попередження та купірування брадикардії та блокад серця
- Бронхіальная асма *(атровент)*
- Передозування та отруєння холіноміметиками, ФОС (пестицидами).

Пірензепін
Гастроцепін (Gastrocepinum)

Побічні ефекти
М - ХОЛІНОБЛОКАТОРІВ

- паралич акомодації
- розширення зіниці, фотофобія
- підвищення внутрішньоочного тиску
- сухість слизових оболонок
- тахікардія
- атонія ШКТ (закрепи)
- затримка сечовипускання

Н-холіноблокатори

Гангліоблокатори

Benzohexonium, Pentaminum, Hygronium

Курареподібні засоби (м’язові релаксанти)

Tubocurarini chloridum, Dithylinum, Pipecuronii bromidum

Гангліоблокатори

Фармакодинаміка - блокують Н-холінорецептори вегетативних гангліїв як симпатичної, так і парасимпатичної нервової системи, знижують АТ, секрецію, тонус гладком'язових органів

Покази до застосування - гіпертонічна хвороба, гіпертонічний криз, керована гіпотонія; набряк легень

Побічні ефекти - ортостатичний колапс, парез кишечника, закрепи, сухість в роті, загальна слабкість, головокружіння, серцебиття.

М’язові релаксанти

Фармакодинаміка - блокують Н-холінорецептори скелетної мускулатури

- антидеполяризуючої дії *(Tubocurarini chloridum, Pipecuronii bromidum (Arduan)* є конкурентними антагоністами ацетилхоліна

- деполяризуючої дії *(Ditilinum)* викликають стійку поляризацію постсинаптичної мембрани внаслідок подібності молекул дитиліна та ацетилхоліна та активації Н-холінорецепторів.

покази до застосування:

- Операції на серці, легенях, стравоході та інших органах з використанням штучної вентиляції легень
- Вправлення вивихів, репозиція відломків кісток.
- Ендоскопічні процедури (бронхоскопія, цистоскопія та ін.)

Побічні ефекти- пригнічення дихання, гіпотонія, брадикардія, алергія

2
3
5
4
4
7
6
1
4
4
1

Недостатність **бутирилхолінестерази** (генетична патологія)

Супроводжується різким подовженням ефекту дитиліна (до кількох годин замість 10 хвилин), у пацієнта не відновлюється самостійне дихання

Допомога

Переливання свіжоцитратної крові (яка містить холінестеразу)

фармакологія адренотропних препаратів

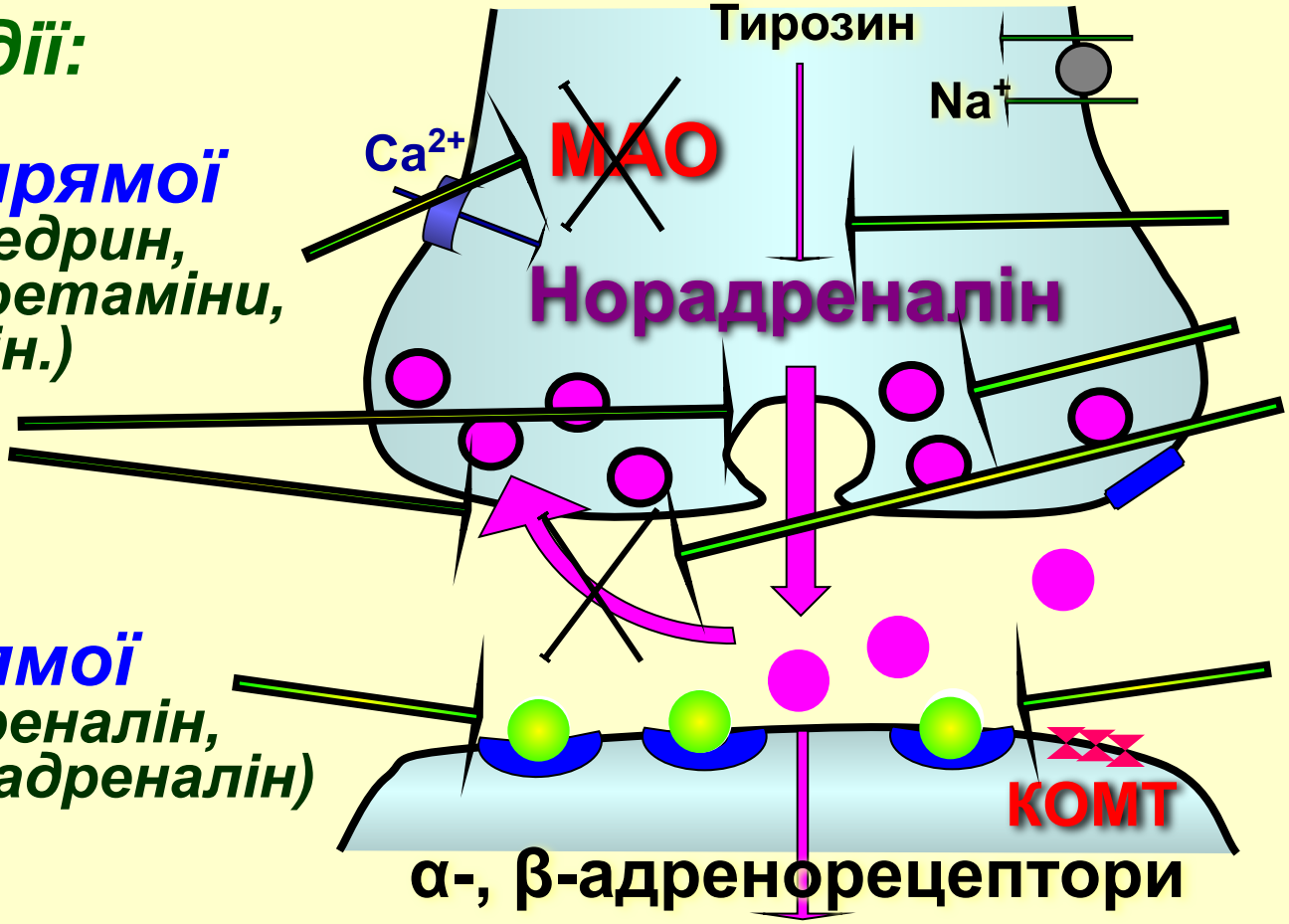
АДРЕНЕРГІЧНИЙ СИНАПС

ТОЧКИ ПРИКЛАДАННЯ ДІЇ АДРЕНОТРОПНИХ ЗАСОБІВ

Адреноміметичні засоби - агоністи	Антиадренергічні засоби - антагоністи

дії:

непрямої *(ефедрин, амфетаміни, та ін.)*



дії:

непрямої – **симпатолі-тики** *(резерпін)*

прямої *(адреналін, норадреналін)*

прямої *(празозин, пропранолол, атенолол та ін.)*

Переважна локалізація адренорецепторів

α_1 – адренорецептори:

- мілкі периферичні судини (шкіри, слизових оболонок, мезентеріальні)
- капсула та трабекули селезінки,
- матка, сфінктери ШКТ,
- радіальний м′яз ока (m.dilatator pupillae),

α_2 – адренорецептори:

- на гальмівних нейронах в ЦНС,
- сфінктери ШКТ

β_1 – адренорецептори:

- міокард
- печінка
- жирова тканина
- скелетна мускулатура

β_2 – адренорецептори

- гладенька мускулатура бронхів
- матка
- центральні судини (мозкові, коронарні, легеневі)
- судини скелетних м`язів

Класифікація засобів, що збуджують адренорецептори

Адреноміметики (адреностимулятори)

1. **Прямої дії**

   а) **α - адреноміметики (Noradrenalini hydrotartras, Mesatonum, Naphthyzinum, Galazolinum) центральні α_2- (Clophellinum)**

   б) **β – адреноміметики**

   - **неселективні *(β_1+ β_2)*: Orciprenalini sulfas,**
   - **селективні *(β_1)*: Dobutaminum**
   - **селективні *(β_2)*:**
     ***короткої дії (3-8 год)* – Salbutamolum, Fenoterolum;**
     ***тривалої дії (10-12 год)* – Formoterolum**

   в) **α и β – адреноміметики (Adrenalini hydrochloridum)**

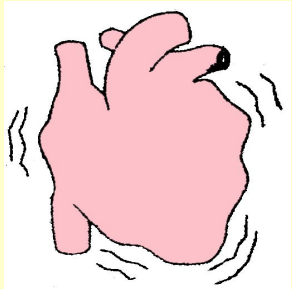
2. **Непрямої дії (симпатоміметики)**
   (Ephedrini hydrochloridum)

Основні властивості адреноміметиків

судини

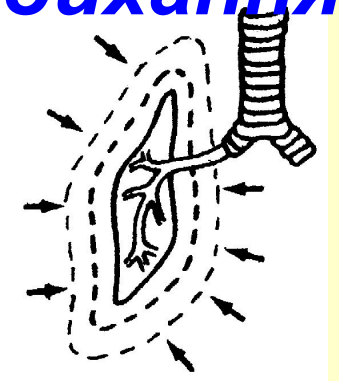
шкіри (α) > нирок (D_1, α) > кишечника (α) > скелетної мускулатури (β_2, α) > легенів (β_2) > мозку (α_2) > серця (β_1)

серце



Стимуляція роботи серця (підвищення збудливості, провідності, ↑ потреби міокарда в кисні)

дихання

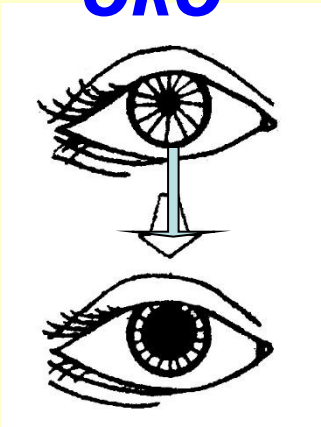


(β_2, судини дихальних шляхів – α_1)

бронходилатація, протинабрякова (деконгестивна)

Основні властивості адреноміметиків

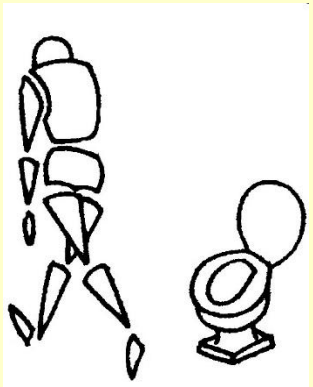
око



Звуження зіниці (мідріаз),
α-агоністи – ↑ відтік рідини,
↓ внутрішньоочного тиску
β-агоністи – ↑ продукції

ШКТ

моторика – зменшення,
сфінктери – скорочення



сечостатева система

матка (α- и β_2) – розслаблення (токолітична дія),
сечовий міхур (β_2) - розслаблення,
сфінктер уретри і простата (α) – скорочення

Основні властивості адреноміметиків

метаболізм

↑ глікогенолізу, ↑ глюкози крові, β3 – жирові клітини ⇒ ↑ліполізу

ендокринна система

модулюють секрецію тироксину, паратиреоїдного гормону, кальцитоніну, гастрину, інсуліну та реніну

ЦНС

Погано або зовсім на проходять крізь ГЕБ (катехоламіни та ін.) – нервозність, «відчуття неминучої катастрофи» (великі дози),

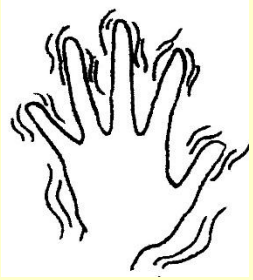
Добре проходять крізь ГЕБ (непрямої дії – ефедрин, амфетаміни та ін.) – психостимуляція, безсоння та ін.

Покази до застосування адреноміметиків

- Зупинка серця – *адреналін внутрішньосерцево*
- Гіпотонія, колапс - *норадреналін, дофамін, мезатон*
- Кардіогенний шок – *добутамін*
- Анафілактичний шок – *адреналін*
- Гіпоглікемія і передозування інсуліну – *адреналін*
- Подовження дії місцевих анестетиків, для зменшення кровоточивості *(адреналін, мезатон)*
- Бронхіальная астма - β-адреноміметики *(сальбутамол, орципреналін)*
- Загроза передчасних пологів – *фенотерол, гексопреналін*
- Риніти, синусити (крапли в ніс) *оксиметазолін, нафтизин*
- Офтальмологія (розширення зіниці, глаукома) – *мезатон, адреналін та ін.*

Побічні ефекти адреноміметиків

- ↑ АТ (інсульти, набряк легень)
- аритмії, гостра лівошлуночкова недостатність, інфаркт міокарда
- Збудження, безсоння, тремор, (ефедрин)
- Розвиток некрозу при п/ш введенні (норадреналін)
- Сухість в роті (β-адреноміметики),
- Сухість в носі (α-адреноміметики)
- Розширення зіниці (мідріаз)
- Тахіфілаксія (ефедрин та ін.)
- Толерантність (десенситізація) рецепторів
- Психічна і фізична залежність (ефедрин, амфетаміни)



Протипокази:

- гіпертонічна хвороба,
- виражений атеросклероз,
- серцева недостатність,
- аритмії, гіпертиреоз.

Адреналіну гідрохлорид (Епінефрин) – α+β

- **Кардіостимулятор** (+ хроно-, інотропна дія, різке ↑ потреби міокарда в кисні).
- **Вазоконстриктор (мілкі судини, α_1-ар),** однак **розширює** судини скелетної мускулатури, серця, головного мозку, печінки, легень) **(β_2-ар),**
- ↑ САТ, **та** ↑ ДАТ (в/в – дія до 5 хвилин), потім ↓ АТ (збудження **α_2-ар** гальмівних нейронів довгастого мозку)
- **Бронходилататор (в малих дозах, β_2-ар)**
- **Функціональний антагоніст інсуліну**
- ↓ **внутрішньоочного тиску, розширення зіниці (мідріаз)**

Норадреналін (Норепінефрин) – $\alpha_1 = \alpha_2 > \beta_1 > \beta_2$

- **вазоконстриктор (↑ САТ, ↑ ДАТ, ↑ периферичного опору)**
- **+ інотропний ефект**
- **тільки в/в введення !**

Мезатон (Фенілефрин) – α

- **Вазоконстрикторна дія (↑ САТ, ↑ ДАТ)**
- **Мідриатична**
- **Протинабрякова дія (антиконгестантна)**
- ***не інактивується КОМТ, тому діє довше !***

Основні властивості β-адреноміметиків

- **стимуляція роботи серця** (збільшують силу та частоту скорочень, підвищують збудливість та провідність), підвищують **потребу міокарда в кисні**
- **розслаблення гладенької мускулатури** бронхів, матки

Покази до застосування бета-адреноміметиків

- брадикардії, атріо-вентрикулярні блокади,
- бронхіальна астма, астматичний бронхіт,
- загроза переривання вагітності

<u>Протипокази:</u>

- стенокардія,
- тахіаритмії,
- тіреотоксикоз

Добутамін – β_1

Потужна кардіостимулююча дія
(+ хроно-, інотропний ефекти)

Орципреналін (Алупент, Астмопент) $\beta_1+\beta_2$

Сальбутамол
(Вентолін) - β_2

Фенотерол
(Беротек) - β_2

Бронходилататори, токолітики

Антиадренергічні засоби

(адреноблокатори, симпатолітики)

Класифікація антиадренергічних засобів

1. **Адреноблокатори**

а) α - адреноблокатори Празозин *(Prazosinum)*, Доксазозин *(Doxazosinum)*, Теразозин - *Terasosinum*

б) β – адреноблокатори

Системні: Анаприлін – Anaprilinum (*Пропранолол)*

Кардіоселективні: Метопролол (Metoprololum), Атенолол (Atenololum), Бісопролол (Bisoprololum)

З внутрішньою симпатоміметичною активністю:

Окспренолол (Oxprenololum), Піндолол (Pindololum)

в) гібридні (α и β – адреноблокатори) - Лабеталол – Labetalolum

2. **Симпатолітики**

Резерпін (*Reserpinum)*, Раунатин (Raunatinum), Метилдофа (Methyldopa)

Основні ефекти α-АДРЕНОБЛОКАТОРІВ

Судини – **різка гіпотензія (ортостатичний колапс!), покращення мікроциркуляції**

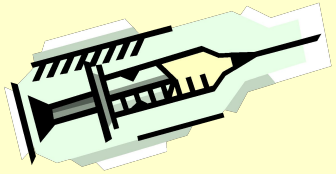
Серце – **рефлекторна тахікардія**

ШКТ – **моторика – ↑, сфінктери – ↓, секреція – ↑**

Око – **міоз**

Залози – **↓ потовиділення, закладеність носа**

Сечостатева система **– розслаблення сфінктерів і м’язів, ↑ ерекції**



Покази до застосування альфа-адреноблокаторів

- лікування артеріальної гіпертензії
- мозкові та периферичні судинні розлади
- мігрень, вестибулярні розлади
- гіпертрофія передміхурової залози (доксазозін, теразозін)

БЕТА-АДРЕНОБЛОКАТОРИ

Джеймс Блэк в 1964 році розробив перший адреноблокатор (пропранолол) і гістаминоблокатор (циметидин) *(Нобелевский лауреат, 1988 г.)*

Классификація:

- ***неселективні (β_1+ β_2):*** **пропран<u>олол</u> (анаприлін), над<u>олол</u>, тим<u>олол</u>**
- ***кардіоселективні (β_1):*** **атенолол, метопролол, бісопролол, ацебут<u>олол</u>, целіпр<u>олол</u>**
- ***з внутрішньою симпатоміметичною активністю:*** **окспрен<u>олол</u>, інд<u>олол</u>**

β-АДРЕНОБЛОКАТОРИ

блок β-рецепторів юкстагломе-рулярного апарату нирок

блок β-рецепторів судин

↓ центральних ланок симп. НС

блок β-рецепторів серця

↓ секреції реніну

↓ сили і ЧСС

↓ ударного і хвилинного викиду

↓ автоматизму, провідності і збудливості міокарда

↓ тонусу периферичних судин

↓ потреби міокарду в O_2

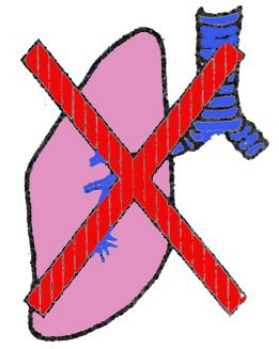
гіпотензивний

анти-ангінальний

проти-аритмічний

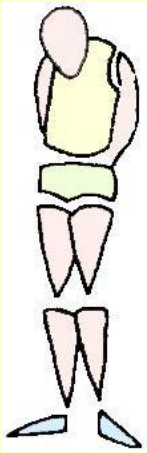
β-АДРЕНОБЛОКАТОРИ

фармакодинаміка:



дихання – **бронхоспазм (особливо неселективні)**

ЦНС – **Проходять крізь ГЕБ (анаприлін, метопролол та ін.) – стрес-протективна дія**



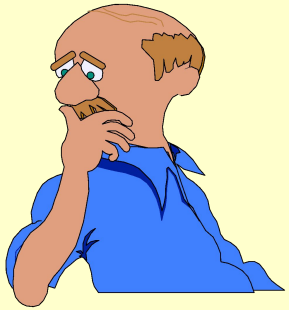
око – **↓ Внутрішньоочного тиску**

метаболізм – **↓ цукру крові, ↑ холестерину, ↓ ліполізу, ↓ вироблення реніну**

β-АДРЕНОБЛОКАТОРИ

покази до застосування:

- артеріальні гипертензії
- ІХС
- тахіаритмії,
- кровотечі з варикозних вен стравоходу, портальна гіпертензія (пропранолол)
- глаукома (тимолол)
- гіпертиреоз – пропранолол
- неврологічні розлади (мігрень, алкогольна абстиненція) (пропранолол



Побічні ефекти β-адреноблокаторів

- ССС: аритмогенна дія (порушення AV-провідності, брадикардія та ін.), серцева недостатність, гіпотензія, набряки (↓ реніну)
- бронхоспазм
- спазм коронарних та периферичних судин
- гіпоглікемія
- порушення функції щитовидної залози
- атерогенна дія
- ↓ агрегації тромбоцитів
- ↑ перистальтику кишечника
- скорочення вагітної матки
- десенситизація рецепторів
- синдром «віддачі» з ↑ ішемії міокарда

β-АДРЕНОБЛОКАТОРИ

Особливості препаратів з внутрішньою симпатоміметичною активністю

окспренолол, піндолол та ін.

- **Менш виразно ↓ ЧСС та силу скорочень, серцевий викид**
- **Слабкіше звужують коронарні, периферичні артерії і бронхи**
- **менше ↓ АТ**
- **помірна кардіопротективна дія**
- **не погіршують перебіг атеросклерозу**
- **рідше викликають синдром «віддачі»**

Симпатолітики

Резерпін – *Reserpinum*
Раунатин – *Raunatinum*
Метилдофа – *Methyldopa*

Основні властивості: зменшують тонус симпатичної нервової системи, підвищують тонус вагуса, знижують АТ

покази до застосування:
гіпертонічна хвороба

Дякую за увагу!