

# АНТИАДРЕНЕРГИЧЕСКИЕ СРЕДСТВА

АДРЕНОЛИТИКИ

*(Ветеринария)*

# Антиадренергические препараты.

## ■ **АДРЕНОБЛОКАТОРЫ**

(Препараты, действующие на рецепторы)

*преимущественно  
периферического  
типа действия*

## ■ **СИМПАТОЛИТИКИ**

(Препараты, действующие внутри нейрона )

- **резерпин\***
- **гуанетидин (октадин, исмелин)**
- **Бретилия тозилат (орнид)**

# Различия между адреноблокаторами и симпатолитиками.

	Адреноблокаторы	Симпатолитики
<b>Место действия</b>	Адренергический рецептор на эффекторной клетке	Нейрон, пресинаптическая мембрана
<b>Эффект стимуляции адренергических нервов</b>	Блокада (менее полная)	Блокада (более выраженная)
<b>Эффект введения адреналина</b>	Блокирование эффектов	Нет блокирования, может быть потенцирование
<b>Действие лекарств</b>	Или $\alpha$ , или $\beta$ ( <i>исключение</i> лабеталол, карведилол)	Функция симпатической системы снижается не зависимо от типа рецептора
<b>Примеры :</b>	<i><math>\alpha</math>-рецепторы</i> - фентоламин <i><math>\beta</math>-рецепторы</i> - пропранолол	Резерпин, гуанетидин, бретилий

# Классификация адреноблокаторов

## альфа-адреноблокаторы

### *α1α2-блокаторы*

фентоламин\*  
тропафен  
феноксibenзамин \*  
пророксан (пирроксан)

### *α1 – блокаторы*

празозин (адверзутен)\*  
доксазозин (тонокардин, кардура)  
теразозин  
тамсулозин (омник)

### *α2-блокаторы*

иохимбин\*  
антипамезол (антиседан)\*

### дигидрированные алкалоиды спорыньи

дигидроэрготамин\*  
дигидроэрготоксин\*  
вазобрал  
ницерголин\*

## β-адреноблокаторы

### *β1β2 -блокаторы*

Пропранолол (анаприлин)\*  
Соталол  
Тимолол  
Надолол  
  
Окспрененолол  
Алпренолол  
Пиндолол

### *β1 -блокаторы*

атенолол (бетадур)\*  
метопролол\*  
талинолол  
бисопролол (конкор)  
бетаксоллол  
эсмолол\*  
небиволол  
  
ацебутолол  
практолол

## α-β-адреноблокаторы (α1, β1, β2)

лабеталол  
карведилол\*  
проксодолол

# Классификация адреноблокаторов

## альфа-адреноблокаторы

### *$\alpha_1\alpha_2$ -блокаторы*

фентоламин\*  
тропафен  
феноксбензамин \*  
пророксан (пирроксан)

### *$\alpha_1$ – блокаторы*

празозин (адверзутен)\*  
доксазозин (тонокардин, кардура)  
теразозин  
тамсулозин (омник)

### *$\alpha_2$ -блокаторы*

иохимбин\*  
антипамезол (антиседан)\*

### *дигидрированные алкалоиды спорыньи*

дигидроэрготамин\*  
дигидроэрготоксин\*  
вазобрал  
ницерголин\*

## $\beta$ -адреноблокаторы

### *$\beta_1\beta_2$ -блокаторы*

Пропранолол (анаприлин)\*  
Соталол  
Тимолол  
Надолол  
  
Окспренилол  
Алпренолол  
Пиндолол

### *$\beta_1$ -блокаторы*

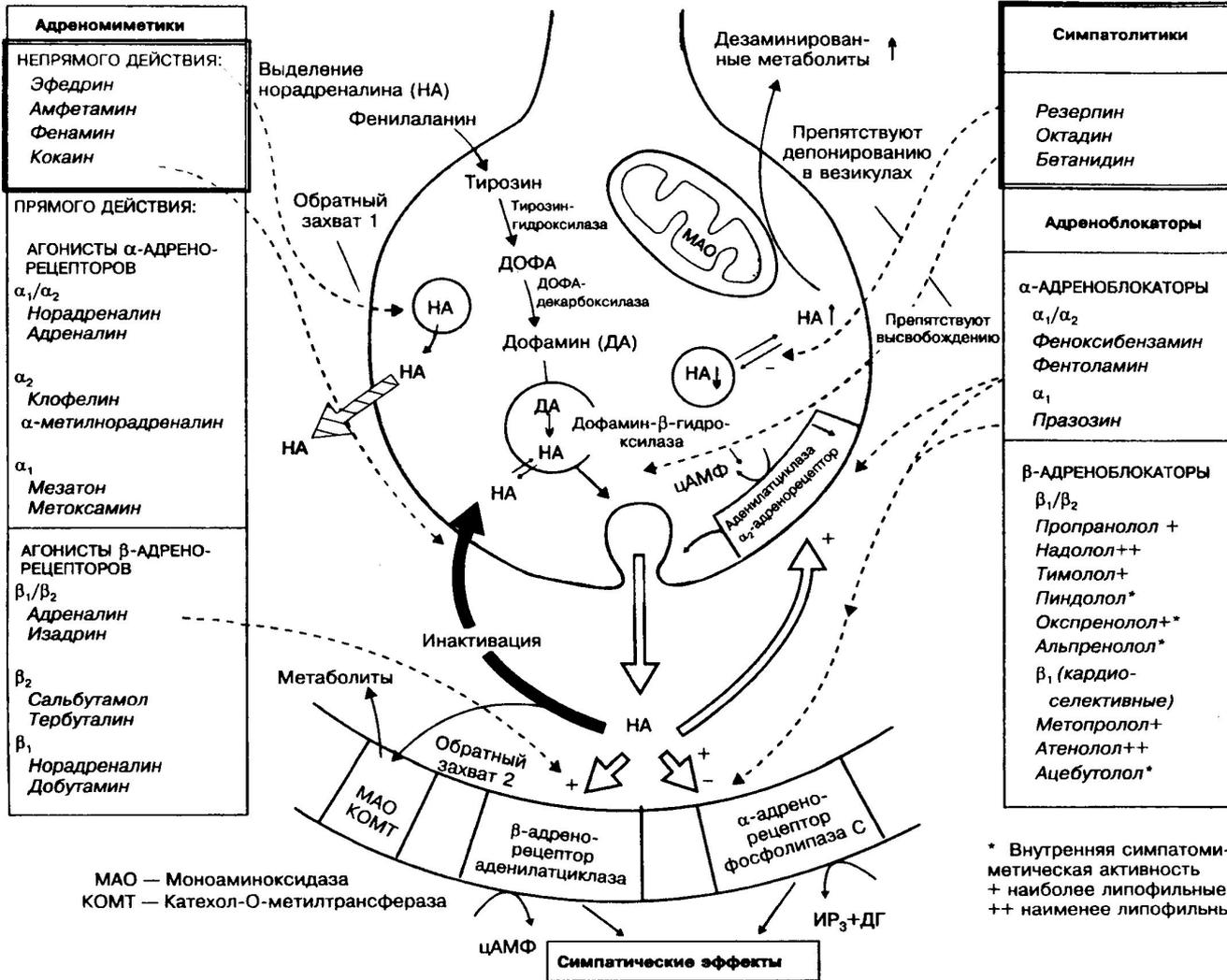
атенолол (бетадур)\*  
метопролол\*  
талинолол  
биспролол (конкор)  
бетаксоллол  
эсмолол\*  
небиволол  
  
ацебутолол  
практиолол

## $\alpha$ - $\beta$ -адреноблокаторы ( $\alpha_1, \beta_1, \beta_2$ )

лабеталол  
карведилол\*  
проксодолол

# Адренергические средства

## Окончание норадренергического нерва



# НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

**Фентоламин** (пор., таб. 0,025; 0,005, а. 5%-1мл; внутрь, п/к, в/м, в/в)

**Торопафен** (пор., а. 0,02; п/к, в/м, в/в)

**Феноксизамин** (капс. 0,01) **D,C,H**

**Пророксан** (Пирроксан) ( т. 0,015, а. 1%-1мл, внутрь, п/к)

## ■ ЭФФЕКТЫ:

- ↓ периферического сосудистого сопротивления → ↓ АД (по ортостатическому типу) → компенсаторное ↑ ЧСС
- ↑ ЧСС (компенсаторное и  $\beta_1$  рец. - извращение действия адреналина и НА)
- Отечность слизистых
- Миоз, блокада ретракции век и сокращения мигательной перепонки ( блокада  $\alpha$ -адр. рецепторов и ↑ тонуса вагуса)
- ↑ ЖКТ
- ↑ Секреции
- ↓ Потоотделения ( снижение влияния симпатической н.с.)
- ↓ Почечного кровотока → задержка Na и воды → отеки
- ↓ сопротивления при мочеиспускании ( блок.  $\alpha_1$  - рецепторов дна мочевого пузыря)
- импотенция

# НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

## ПОКАЗАНИЯ:

- Для снижения тонуса внутреннего уретрального сфинктера (феноксibenзамин)
- Лечение секреторной диареи у лошадей (феноксibenзамин)
- Профилактика и лечение ламинита у лошадей (феноксibenзамин)
- Лечение гипертензии на фоне феохромоцитомы (феноксibenзамин)
- Купирование гипертонических кризов (фентоламин, тропafen)
- Диагностика феохромоцетомы, купирование ее обострения, криза (фентоламин, тропafen)
- Для прекращения действия местных анестетиков (фентоламин, тропafen)
- Шок геморрагический, кардиогенный (периферические сосуды спазмированы) (фентоламин, тропafen)
- Нарушение периферического кровообращения (тропафен, феноксibenзамин)
- Вестибулярные расстройства; для снижения психического напряжения, тревоги (пирроксан)

# НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

- **ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ:**
- Ортостатическая гипотензия
- Тахикардия
- Отечность слизистых
- Тошнота, рвота
- Диарея (у лошадей – констипация)
- Миоз
- Повышение внутриглазного давления
- Нарушение эякуляции
- Слабость головокружение

# НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

## дигидрированные алкалоиды спорыньи и их производные

Хорошо проходят ГЭБ  $\rightarrow$   $\downarrow$ с.д.ц.  $\rightarrow$  нет чсс; более стабильное действие на периферические сосуды

Отличие от естественных алкалоидов спорыньи:

- более выраженная блокада альфа адренорецепторов,
- не стимулируют миометрий
- не повышают тонуса сосудов,
- менее токсичны

### ■ Дигидрированные алкалоиды спорыньи

- Дигидроэрготоксин («Редергин», «Синепрес»)
- Дигидроэрготамин
- дигидроэргокристин

### ■ Производные алкалоидов спорыньи

- Ницерголин (+ миотропное спазмолитическое д-е) (Нилогрин)
- Вазобрал (дигидроэргокристин + кофеин)

# НЕСЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

## дигидрированные алкалоиды спорыньи и их производные

### ■ ПОКАЗАНИЯ:

#### Дигидрированные алкалоиды спорыньи

- нарушение периферического кровообращения
- мигрень
- для снижения кровяного давления

#### Производные алкалоидов спорыньи

- хронические нарушения мозгового кровообращения
- мигрень
- расстройства периферического кровообращения в т.ч. и глаза
- гипертрофия предстательной железы

### ■ Побочное действие:

- головная боль, головокружение
- желудочно-кишечные расстройства
- нарушение сна и сонливость
- кожный зуд

# СЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha_1$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

- Празозин
- Доксазозин (*кардуа, тонокардин*)
- Теразозинн
- Тамсулазин (*омник*)

## Отличие от неселективных $\alpha$ -адреноблокаторов:

- редко вызывают тахикардию ( нет выброса НА и его извращенного эффекта)
- не вызывают или редко вызывают ортостатическую гипотонию
- в основном действуют на артериальные (меньше на венозные сосуды)  $\rightarrow$   $\downarrow$  венозного возврата к сердцу  $\rightarrow$   $\downarrow$  работы сердца, возможно небольшое  $\uparrow$  ЧСС)
- $\downarrow$  уровень холестерина и глюкозы в крови (доксазозин)

## Показания: в вет. практике применяют только празозин у собак

- застойная сердечная недостаточность ( празозин, доксазозин) *при невозможности назначения гидролазина (апрессина)*
- лечение артериальной гипертензии ( празозин, доксазозин)

Для человека:

- нарушение периферического кровообращения ( празозин, доксазозин)
- аденома предстательной железы (теразозин, тамсулазин)

# СЕЛЕКТИВНЫЕ $\alpha_1$ -АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

## ПОБОЧНОЕ ДЕЙСТВИЕ :

- Эффект первой дозы
- Головокружение, головная боль, бессонница или летаргия
- Слабость, тошнота, диарея, констипация
- Рефлекторная тахикардия
- Учащенное мочеиспускание

# Йохимбин

## $\alpha_2$ -адреноблокатор

*Алкалоид раувольфии, по химической структуре близок к резерпину*

### ■ **Эффекты:**

- $\uparrow$  ЧСС
- $\uparrow$  АД
- Стимулирует ЦНС
- Антидиуретическое действие
- Гиперинсулинемическое действие
- Усиливает симпатический выброс норадреналина (блокада центральных  $\alpha_2$ -адренорецепторов)

### ■ **Применение:**

- Для отмены эффектов ксилазина и др.  $\alpha_2$ -адреномиметиков

# Антипамезол (антиседан)\*

$\alpha_2$ -адреноблокатор

- **Эффекты:** аналогичны йохимбину
- **Показания:** устранение седативного и анальгезирующего действия медетомидина (домитор) у собак и кошек и его побочных эффектов на ссс и дыхание
- *Форма выпуска: флаконы по 10 мл - 0,5% р-ра (5мг/мл)  
в/м однократно через 15-60 мин после домитора  
(возможно повторное введение через 10-15 минут)  
собаки: 0,4 мл/10 кг ( при дозе домитора 0,4 мл/10кг)  
кошки: 0,2 мл/5кг (при дозе домитора 0,4 мл/5кг)*

# Классификация $\beta$ -адреноблокаторов

## Неселективные ( $\beta_1+\beta_2$ ):

- А. без внутренней симпатомиметической активности – пропранолол (утеротон, анаприлин, обзидан, индерал), соталол, тимолол, надолол (коргард);
- Б. с внутренней симпатомиметической активностью – пиндолол (виксен), окспренолол (тразикор), алпренолол (аптин);

## Кардиоселективные ( $\beta_1$ ):

- А. без внутренней симпатомиметической активности – атенолол (хайпотен, тенормин), метопролол (метокард, беталок), бисопролол, небиволол, бетаксолол, талинолол, эсмолол;
- Б. с внутренней симпатомиметической активностью – ацебутолол, практолол;

# Фармакологические эффекты $\beta$ -адреноблокаторов

## Блокада $\beta_1$ рецепторов сердца

- - ослабление силы сердечных сокращений
- - снижение автоматизма синусового узла  $\rightarrow$   $\downarrow$  ЧСС
- - угнетение атриовентрикулярной проводимости
- - снижение автоматизма атриовентрикулярного узла и волокон Пуркинье



- Снижение сердечного выброса (минутного объема), работы сердца и потребности миокарда в кислороде

## Блокада $\beta_1$ рецепторов юкстагломерулярных клеток почек

- - уменьшение секреции ренина, ангиотензина, альдостерона  $\rightarrow$   $\downarrow$  АД



**АНТИГИПЕРТЕНЗИВНОЕ, АНТИАНГИНАЛЬНОЕ, АНТИАРИТМИЧЕСКОЕ ДЕЙСТВИЕ**

# Фармакологические эффекты $\beta$ -адреноблокаторов (ПРОДОЛЖЕНИЕ)

- Глаз – снижение секреции глазной жидкости.  $\beta_2$   
Не изменяется размер зрачка и аккомодация.  
Применяется при лечении глаукомы.
- ЦНС - седация, сонливость, заторможенность,  
депрессивные состояния.
- Половая функция- снижение либидо, снижение  
потенции.

# Фармакологические эффекты $\beta$ -адреноблокаторов

## Неселективные так же вызывают:

- Бронхоспазм
- Повышение тонуса матки
- Вазоконстрикция периферических сосудов
- Ингибируют гликогенолиз, что приводит к гипогликемии, особенно на фоне приема инсулина, но снижают чувствительность рецепторов периферических тканей к инсулину и могут вызывать гипергликемию у больных с сахарным диабетом II типа.
- Блокируют стимулированный липолиз и повышают содержание свободных жирных кислот, триглицеридов и отношение ЛПНП/ЛПВП (ЛПНП – липопротеины низкой плотности, ЛПВП – липопротеины высокой плотности) в плазме.

# Побочные эффекты

- Гипотония.
- Брадикардия.
- Обострение хронических обструктивных легочных заболеваний, провоцирование обострения бронхиальной астмы.
- Гипогликемия на фоне введения препаратов инсулина.
- Гипергликемия у больных ИНЗСД.
- Нарушение профиля липидов в крови. Кардиоселективные  $\beta$ -блокаторы и блокаторы с внутренней симпатомиметической активностью не изменяют липидного профиля плазмы крови.
- Полная блокада проводящей системы сердца.
- Утомляемость и снижение работоспособности.
- Нарушение периферического кровообращения.
- Нарушения со стороны ЖКТ, ночные кошмары и другие
- Синдром отмены.

# Показания

- **Артериальная гипертензия !**
- Ишемическая болезнь сердца – гипертрофическая кардиомиопатия (лечение и профилактика) !
- **Тахикардии !**
- **ХСН !**
- Глаукома (тимолол, проксодолол)
- **Усиление родовой деятельности,(Утеротон)**  
остановка маточных кровотечений
- Профилактика некоторых форм тремора

# Противопоказания

- Атриовентрикулярный блок
- Гиперчувствительность к препаратам этого класса
- Выраженная сердечная недостаточность