

Тема лекции:

Адренергические средства (АС)

Доцент кафедры общей и клинической
фармакологии с курсом ФПК и ПК
Владимир Михайлович Концевой

Классификация АС

1. Адренопозитивные средства
2. Адренонегативные средства

Адренопозитивные средства

1. α и β -адреномиметики

Адреналина гидрохлорид

Норадреналина гидротартрат

2. α_1 -адреномиметики

Фенилэфрин

3. α_2 -адреномиметики

Нафазолин

Клонидин

4. β_1 , β_2 -адреномиметики

Изопреналин

5. β_1 -адреномиметики

Добутамин

6. β_2 -адреномиметики

Сальбутамол

Сальметерол

7. Симпатомиметики

Эфедрина гидрохлорид

Адренонегативные средства

1. α_1 и α_2 -адреноблокаторы

Фентоламина гидрохлорид

2. α_1 -адреноблокаторы

Празозин

3. α_2 -адреноблокаторы

Йохимбин

4. β_1 и β_2 -адреноблокаторы

Пропранолол

5. β_1 -адреноблокаторы

Метопролол

6. β_1 -адреноблокаторы с внутренней активностью

Талинолол

7. α_1 β_1 β_2 -адреноблокаторы

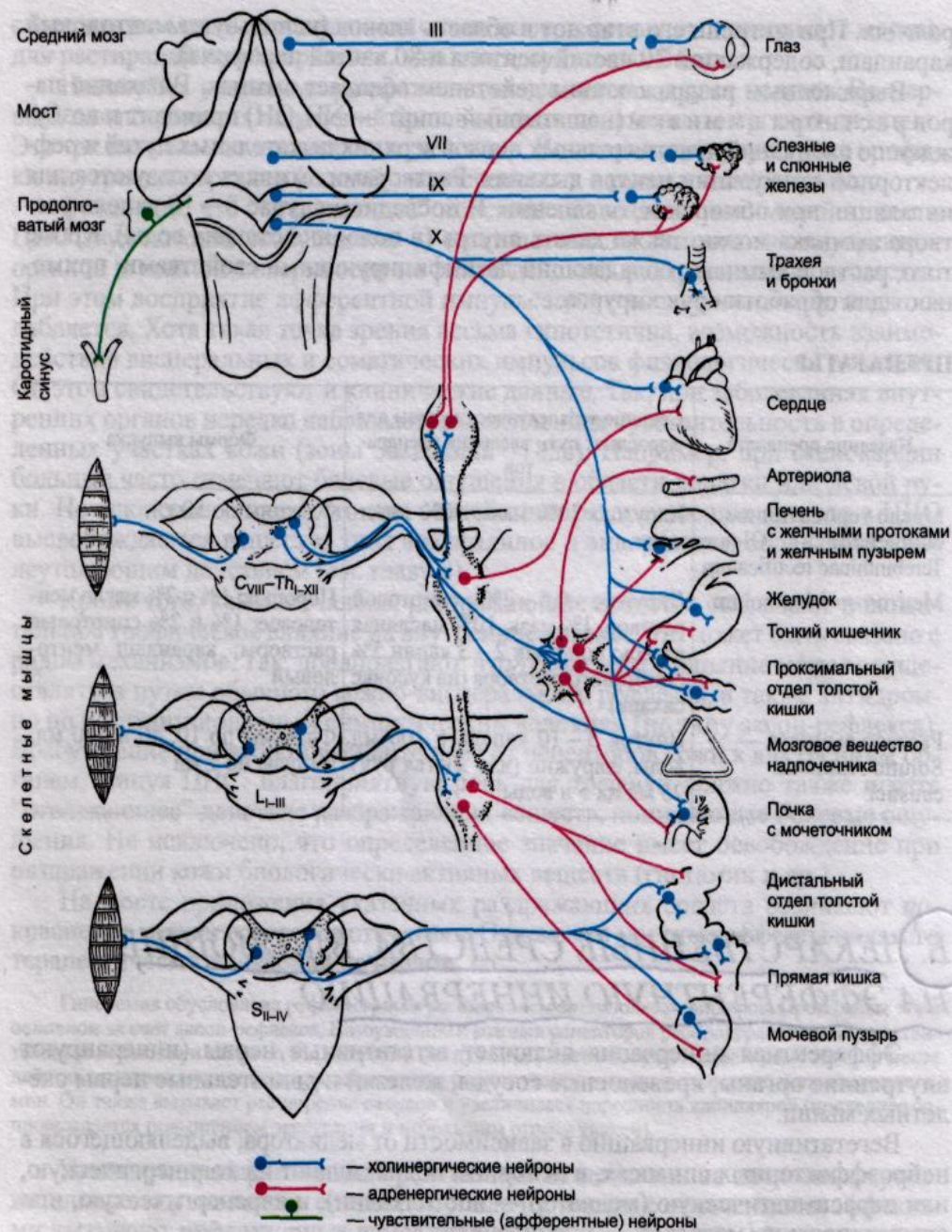
Лабеталол

8. Симпатолитики

Резерпин Гуанетидин

Адренергические средства действуют в адренергических синапсах, локализованных в области окончаний постганглионарных синаптических нервных волокон и в ЦНС.

Кроме того, они взаимодействуют с внесинаптическими адренорецепторами гладкой мускулатуры бронхов и сосудов.



Классификация адренорецепторов

α_1 -адренорецепторы

Локализуются в постсинаптических мембранах адренергических синапсов.

Они активируются фенилэфрином и блокируются празозином.

α_2 -адренорецепторы

Расположены в пресинаптических мембранах адренергических синапсов, в гладкомышечных клетках, ЦНС и др.

Их агонистом является клонидин и антагонистом йохимбин.

β_1 -адренорецепторы

Находятся в мембранах миокардиоцитов и др.

Их агонистом является добутамин, антагонистом – метопролол.

β_2 -адренорецепторы

Располагаются в мембранах клеток, которые не образуют синаптических контактов (гладкая мускулатура бронхов, сосудов и др.)

Их агонистами является сальбутамол, антагонистом – бутоксамин.

β_3 -адренорецепторы

Локализованы в липоцитах

Концентрация α -адренорецепторов и β -адренорецепторов в различных органах и тканях не одинакова. Эти различия определяют разное реагирование тканей на адренергические агонисты и антагонисты.

Адреналин возбуждает все типы
адренорецепторов ($\alpha_1, \alpha_2, \beta_1, \beta_2$)

Он вызывает эффекты, характерные
для действия симпатической
(адренергической) иннервации.

Эффекты адреналина

Орган	Эффект
<u>Глаз</u> Радиальная мышца радужки (Дилататор зрачка)	Сокращение (Расширение зрачка)
<u>Сердце</u> SA узел Предсердия AV узел Система Гиса-Пуркинье Желудочки	Увеличение частоты разрядов (тахикардия) Увеличение частоты и силы сокращений Увеличение скорости проведения Увеличение скорости проведения Увеличение скорости проведения, частоты и силы сокращений
Артерии Вены	Сужение (α_1 -адренорецепторов) Расширение (β_2 -адренорецепторов)

Орган	Эффект
Бронхи	Снижение тонуса (β_2 -АР)
<u>ЖКТ</u>	
Моторика, тонус	Снижение (α_1 α_2 β -АР)
Сфинктеры	Сокращение (α_1 -АР)
Почки	Увеличение (β_1 -АР)
Секреция ренина	Уменьшение (α_1 -АР)
Скелетные мышцы	Увеличение сократимости (β_2 -АР) гликогенолиза и поглощения ионов K^+
Секреция инсулина	Уменьшение (α_2 -АР) Увеличение (β_2 -АР)
Липоциты	Увеличение липолиза (β_3 -АР)
Печень	Гликогенолиз (α и β_2 -АР) Глюконеогенез (α и β_2 -АР)

Применение адреномиметиков

Адреналина гидрохлорид

1. Для устранения спазма бронхов и повышения АД при анафилактическом шоке (в/в)
2. Для снижения выделения медиаторов аллергии из тучных клеток (п/к)
3. Для повышения уровня глюкозы в крови при гипогликемии, вызванной избыточным введением инсулина
4. Добавляют к растворам местных анестетиков для сужения сосудов в месте введения (п/к, в/м)
5. Для повышения АД при отдельных формах гипотонии (в/в)
6. При остановке сердца
7. Для снижения внутриглазного давления при открытоугольной форме глаукомы (ГК)

Норадреналина (α_1 , α_2 , β_1 , β_2 -АМ) гидротартрат

Для повышения АД при коллапсе
(в/в)

Фенилэфрин (α_1 -АМ)

1. При коллапсе для сужения сосудов
(в/в)
2. С растворами местных анестетиков
(п/к, в/м)
3. Для снижения внутриглазного
давления при открытоугольной форме
глаукомы (ГК)

Нафазолин (α_2 -АМ)

Место для сужения сосудов при
рините (НК) и конъюнктивите
(ГК)

Клонидин (α_2 -АМ)

1. Для снижения АД при артериальной гипертензии (внутри в таблетках)
2. Для снижения внутриглазного давления при глаукоме (ГК)

Изопреналин (β_1, β_2 -АМ)

1. Для купирования приступа бронхиальной астмы (ингаляционно)
2. При А – V блокаде (ингаляционно, таблетки под язык)
3. При некоторых формах кардиогенного шока для увеличения МОК и снижения ОПСС (в/в)

Добутамин (β_1 -АМ)

Для кратковременного усиления
сокращений сердца при
декомпенсации сердечной
деятельности (в/в)

Сальбутамол (β_2 -АМ)

1. Для купирования приступов бронхиальной астмы (ингаляционно, таблетки)
2. Для снижения сократительной функции матки при бурных родах (ингаляционно)

Сальметерол (β_2 -АМ)

Для профилактики приступов
бронхиальной астмы

Действие развивается медленно,
но длится около 12 часов

Дофамин (агонист D_1 рецепторов)

При кардиогенном шоке для
увеличения кровотока в почках
и внутренних органах

Эфедрина гидрохлорид

Симпатомиметик

Высвобождает норадреналин из окончаний нервов. Проникает в ЦНС.

1. При бронхиальной астме
2. Для повышения АД
3. Как стимулятор ЦНС при сонливости, отравлении алкоголем и др.

Адренонегативные средства (Адреноблокаторы)

Это лекарственные вещества, которые являются антагонистами и блокируют адренорецепторы.

Они препятствуют действию на рецепторы норадреналина и адреналина.

Показания к применению

адреноблокаторов определяются их разной способностью блокировать различные типы адренорецепторов и эффектами, которые при этом возникают.

Применение адреноблокаторов

Празозин (α_1 -АБ)

Расширяет артериолы и венулы

1. Для снижения АД при артериальной гипертензии (таблетки)
2. При болезни Рейно (снимает спазм артерий)

Йохимбин (α_2 -АБ)

При психогенной импотенции

Фентоламин (α_1, α_2 -АБ)

1. При феохромоцитоме для снижения АД
2. При болезни Рейно

Дигидроэрготамин

(α_1 , α_2 -АБ и частичный агонист
5-НТ_{1D} рецепторов серотонина)

Для купирования приступа мигрени.

Возбуждает 5-НТ_{1D} рецепторы и
суживает расширенные
внутричерепные сосуды
(ингаляционно)

Пропранолол (β_1, β_2 –АР)

Основные эффекты:

1. Снижает автоматизм, возбудимость, проводимость и сократимость миокарда. Удлиняет рефрактерный период AV узла.
2. Снижает ЧСС, МОК, АД
3. Уменьшает потребность сердца в O_2
4. Блокирует β_1 -АР клеток ЮГА, снижает выделение ренина и образование ангиотензина II
5. Блокирует β_2 -АР печени, снижает гликогенолиз и содержание глюкозы в крови
6. Действуя на головной мозг, вызывает седативный эффект.

Применение:

1. Для снижения АД при артериальной гипертензии (таблетки, инъекции)
2. Как противоаритмическое средство
3. При ишемической болезни сердца

Метопролол (селективный β_1 -АБ)

Не повышает тонус бронхов, сосудов, не вызывает гипогликемии

Атенолол

Селективный β_1 -АБ длительного действия

Бисопролол

Селективный β_1 -АБ длительного действия

Эсмолол

Селективный β_1 -АБ короткого действия

Талинолол

Селективный β_1 -АБ с внутренней активностью
(частичный агонист)

Применение всех адреноблокаторов аналогичное пропранололу.

Лабеталол (α_1 и β_1, β_2 -АБ)

Для снижения АД при
артериальной гипертензии.

Блокаторы адренергических нейронов (симпатолитики)

Гуанетидин

Вытесняет НА из везикул адренергических нервов, снижает обратный захват НА. Снижает АД.

Применение:

1. Для снижения АД при АГ (таблетки)
2. При глаукоме (ГК)

Резерпин

По механизму действия сходен с гуанетидином, но проникает в ЦНС и оказывает седативное действие.

Для снижения АД при АГ (таблетки)

Благодарю
за внимание.