

АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

Кафедра фармакологии с
клинической фармакологией

Классификация адреноблокаторов

I. Прямого действия

1. α , β -адреноблокаторы
2. α –адреноблокаторы
3. β -адреноблокаторы

II. Непрямого действия (симпатолитики)

α -адреноблокаторы

1. Неизбирательные α_1 , α_2 -адреноблокаторы

- ***Дигидрированные алкалоиды спорыньи***

Дигидроэрготоксин

Дигидроэрготамин

- ***Синтетические***

Фентроламин

Тропафен

Пирроксан

Ницерголин

α -адреноблокаторы

2. Избирательные (селективные) α_1 -адреноблокаторы

празозин, доксазозин

α -адреноблокаторы

Фармакологические эффекты:

- расширение артерий
- расслабление прекапиллярных сфинктеров → улучшение внутриорганный кровообращения
- расширение вен → понижение АД по ортостатическому типу.

α -адреноблокаторы

Механизм гипотензивного действия:

- блокада α_1 и α_2 -адренорецепторов артерий и вен
- снижение центрального симпатического тонуса

Неселективные α -адреноблокаторы:

- Блокада пресинаптических α_2 -адренорецепторов → повышение выделения норадреналина, нарушение его нейронального и экстранейронального захвата →
 - ✓ \uparrow ЧСС, \uparrow сократимости → \uparrow потребности миокарда в кислороде
 - ✓ стимуляция секреции ренина действия
- ослабление гипотензивного

α -адреноблокаторы

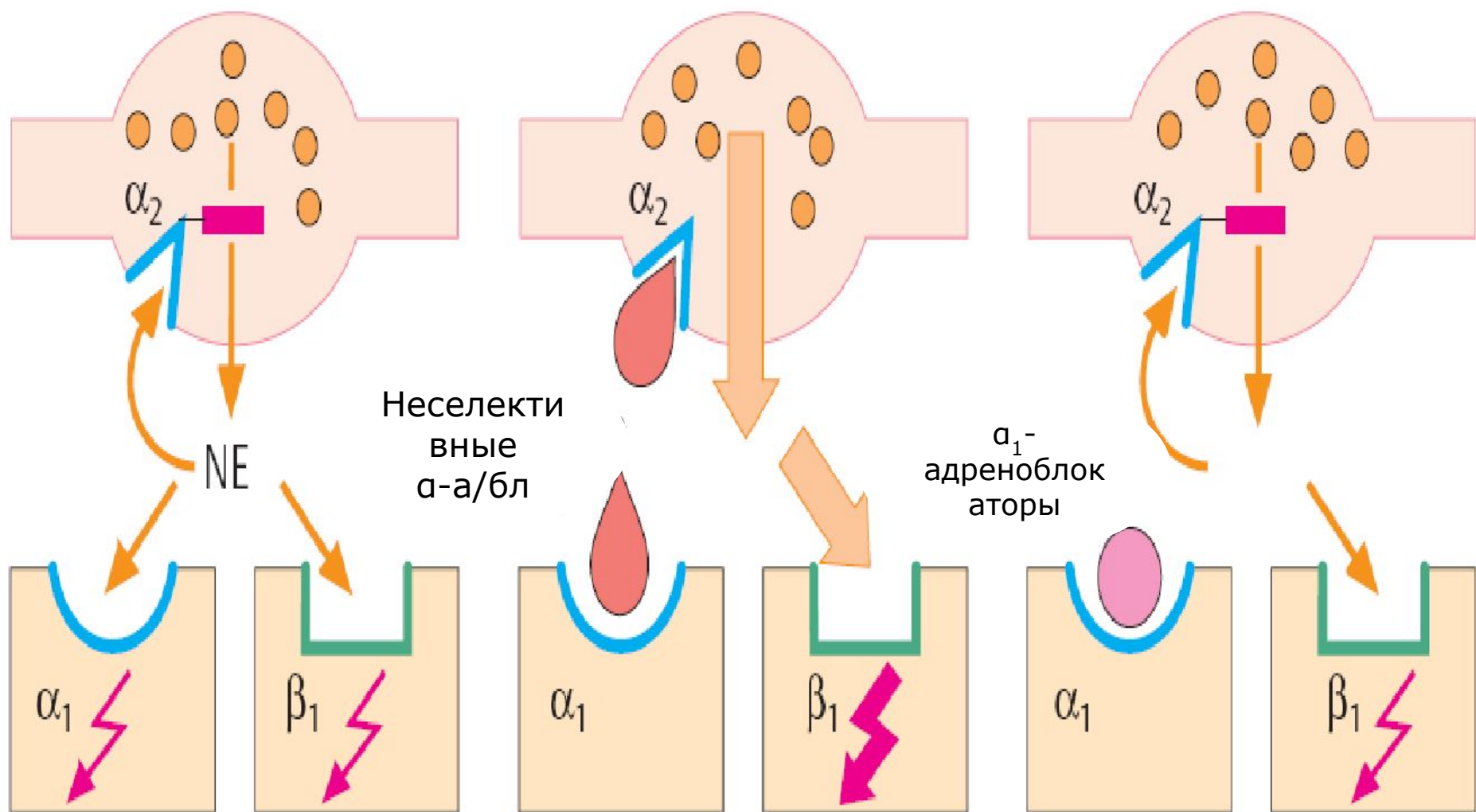
Селективные α_1 -адреноблокаторы:

- расширение сосудов \rightarrow \downarrow АД
- понижение преднагрузки и постнагрузки на сердце
- улучшение внутрисердечной гемодинамики

Доксазозин, тамсулозин, теразозин

- блок α_1 -адренорецепторов шейки мочевого пузыря, задней уретры и предстательной железы \rightarrow улучшение динамики мочеиспускания при доброкачественной аденоме предстательной железы

Влияние адреноблокаторов на высвобождение норадреналина

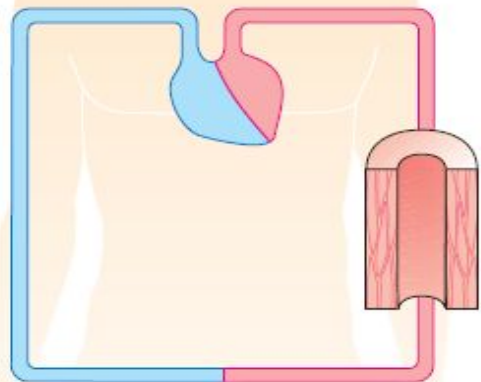


Применение

- Гипертонический криз
- Феохромоцитома
- Нарушения внутриорганный кровообращения при шоке (кардиогенном, травматическом, ожоговом)
- Нарушения периферического кровообращения
- Сердечная недостаточность
- Диэнцефальные кризы симпатоадреналового типа
- Доброкачественная аденома предстательной железы

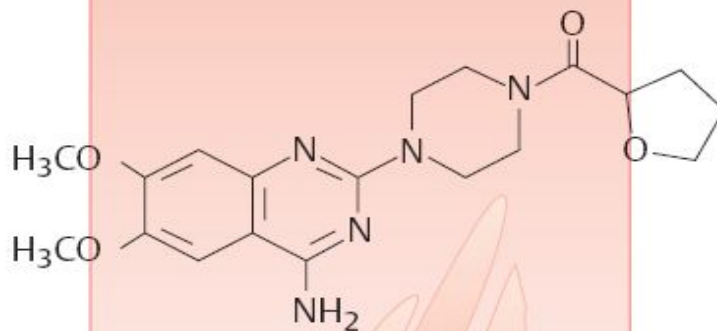
Основные показания к применению

Артериальная гипертензия



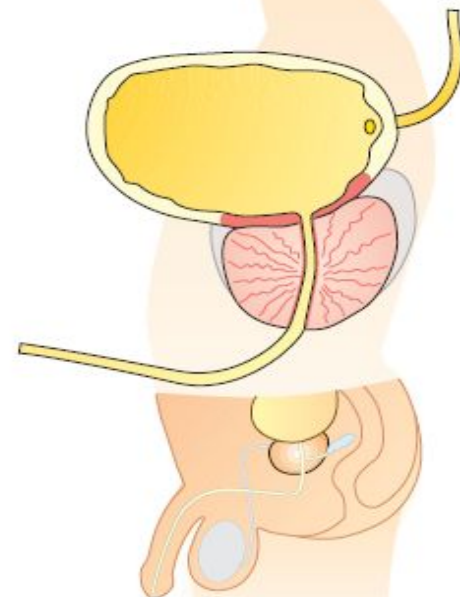
Резистивные
сосуды

α_1 -
адреноблокатор

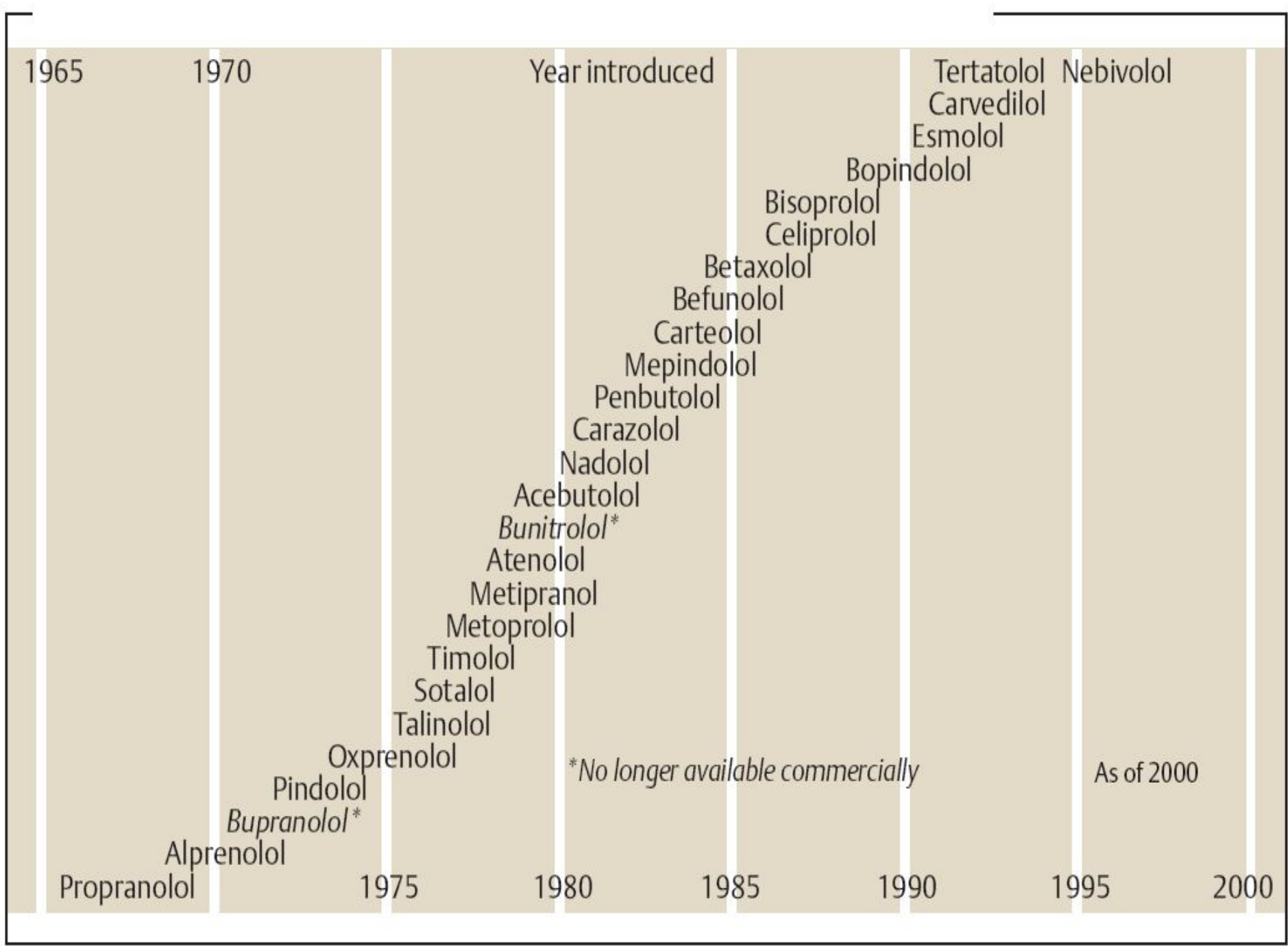


Угнетение
симпатической
иннервации
гл/м

Доброкачественная
гиперплазия
предстательной
железы



Мочевой пузырь
Предстательная железа



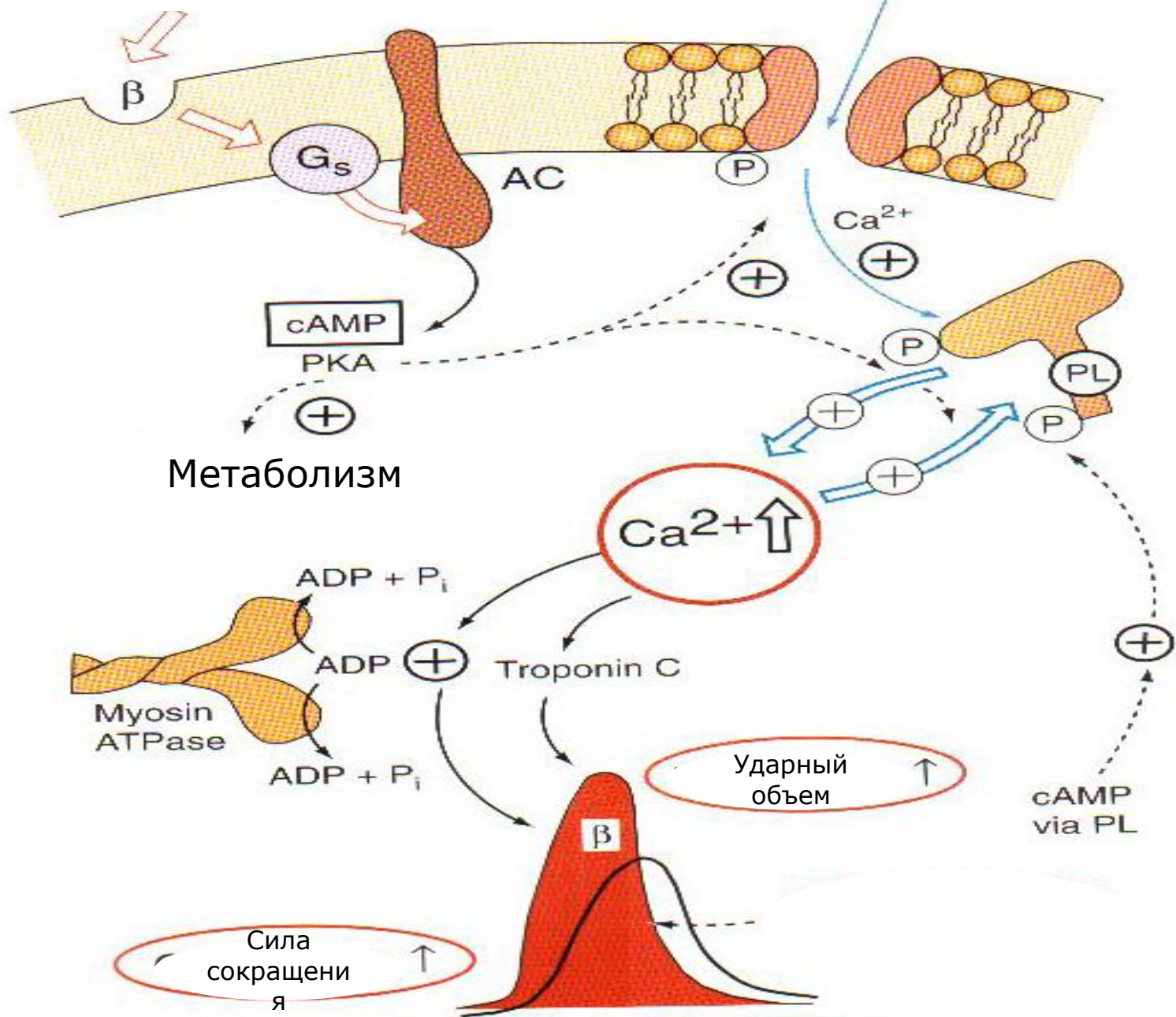
Классификация β -адреноблокаторов

- Неселективные блокаторы β_1 , β_2 -адренорецепторов
 - А) без внутренней адреномиметической активности:
пропранолол, надолол, соталол
 - Б) с внутренней адреномиметической активностью:
пиндолол
 - В) с вазодилатирующими свойствами:
пиндолол

Классификация β -адреноблокаторов

- Кардиоселективные блокаторы β_1 -адренорецепторов
 - А) без внутренней адреномиметической активности:
атенолол, бисопролол, метопролол, эсмолол,
бетаксолол
 - Б) с внутренней адреномиметической активностью:
ацебутол
 - В) с вазодилатирующими свойствами:
карведилол, небиволол

β-адреномиметик



Сокращение-расслабление

Фармакологические эффекты β -адреноблокаторов, связанные с блокадой β_1 -рецепторов

- Кардиальные эффекты:
 - отрицательное инотропное действие
 - отрицательное хронотропное действие
 - отрицательное дромотропное действие
 - отрицательное батмотропное действие
- Снижение секреция ренина и, соответственно АТII, вследствие блокады β_1 -рецепторов в клетках ЮГА почек.

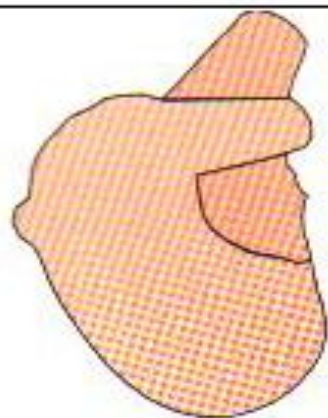
Фармакологические эффекты β -адреноблокаторов, связанные с блокадой β_2 -рецепторов

- повышение тонуса гл/м бронхов
- повышение сократительной активности матки
- повышение моторики ЖКТ (спастические боли в животе, рвота, поносы)
- повышение тонуса сосудов, соответственно повышение ОПСС и ухудшение периферического кровообращения, повышенная утомляемость и мышечная слабость
- активация синтеза гликогена, торможение гликогенолиза и гликонеогенеза, что может привести к гипогликемии, особенно на фоне приема гипогликемических средств у больных СД.

Фармакологические эффекты β -адреноблокаторов, связанные с блокадой β_3 -рецепторов

- торможение липолиза, повышение содержания ХС ЛПНП и понижение ЛПВП → повышение коэффициента атерогенности

Кардиоселективные β_1 -адреноблокаторы

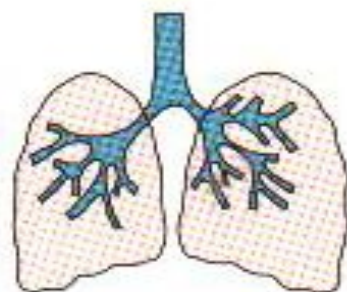


Брадикардия

Отрицательное инотропное действие

↓ АД

β_1 -адреноблокаторы



Менее выраженный бронхоспазм

Менее выраженные периферические эффекты

метаболические

Сосудистые

ФАРМАКОКИНЕТИКА

■ Липофильные бета-адреноблокаторы:

- обладают высокой биодоступностью при приеме внутрь;
- подвергаются пресистемному метаболизму;
- в значительной степени связываются с белками плазмы;
- могут быть назначены больным с нарушением функции почек;
- оказывают центральное действие

■ Гидрофильные бета-адреноблокаторы:

- плохо всасываются
- не инактивируются в печени
- плохо проникают в ЦНС
- не противопоказаны пациентам с печеночной недостаточностью

Показания к применению

- Ишемическая болезнь сердца
- Артериальная гипертензия
- Сердечные аритмии

Побочные эффекты

- **Кардиальные:**
 - брадикардия
 - АВ-блокада
 - сердечная недостаточность
 - гипотензия
- **Связанные с блоком β_2 -и β_3 -а/р:**
 - бронхоспазм
 - спазм сосудов
 - сокращение матки и ЖКТ
 - гипогликемия
 - повышение коэффициента атерогенности.
- **Синдром отдачи**