

# АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

---

Кафедра фармакологии с  
клинической фармакологией

# Классификация адреноблокаторов

---

## *I. Прямого действия*

1.  $\alpha$ ,  $\beta$ -адреноблокаторы
2.  $\alpha$  –адреноблокаторы
3.  $\beta$ -адреноблокаторы

## *II. Непрямого действия (симпатолитики)*

# ***$\alpha$ -адреноблокаторы***

---

## **1. Неизбирательные $\alpha_1$ , $\alpha_2$ -адреноблокаторы**

- ***Дигидрированные алкалоиды спорыньи***

Дигидроэрготоксин

Дигидроэрготамин

- ***Синтетические***

Фентроламин

Тропафен

Пирроксан

Ницерголин

# ***$\alpha$ -адреноблокаторы***

---

## **2. Избирательные (селективные) $\alpha_1$ -адреноблокаторы**

**празозин, доксазозин**

# ***$\alpha$ -адреноблокаторы***

---

Фармакологические эффекты:

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

# ***$\alpha$ -адреноблокаторы***

Механизм гипотензивного действия:

- блокада  $\alpha_1$  и  $\alpha_2$ -адренорецепторов артерий и вен
- снижение центрального симпатического тонуса

Неселективные  $\alpha$ -адреноблокаторы:

- Блокада пресинаптических  $\alpha_2$ -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

# ***$\alpha$ -адреноблокаторы***

---

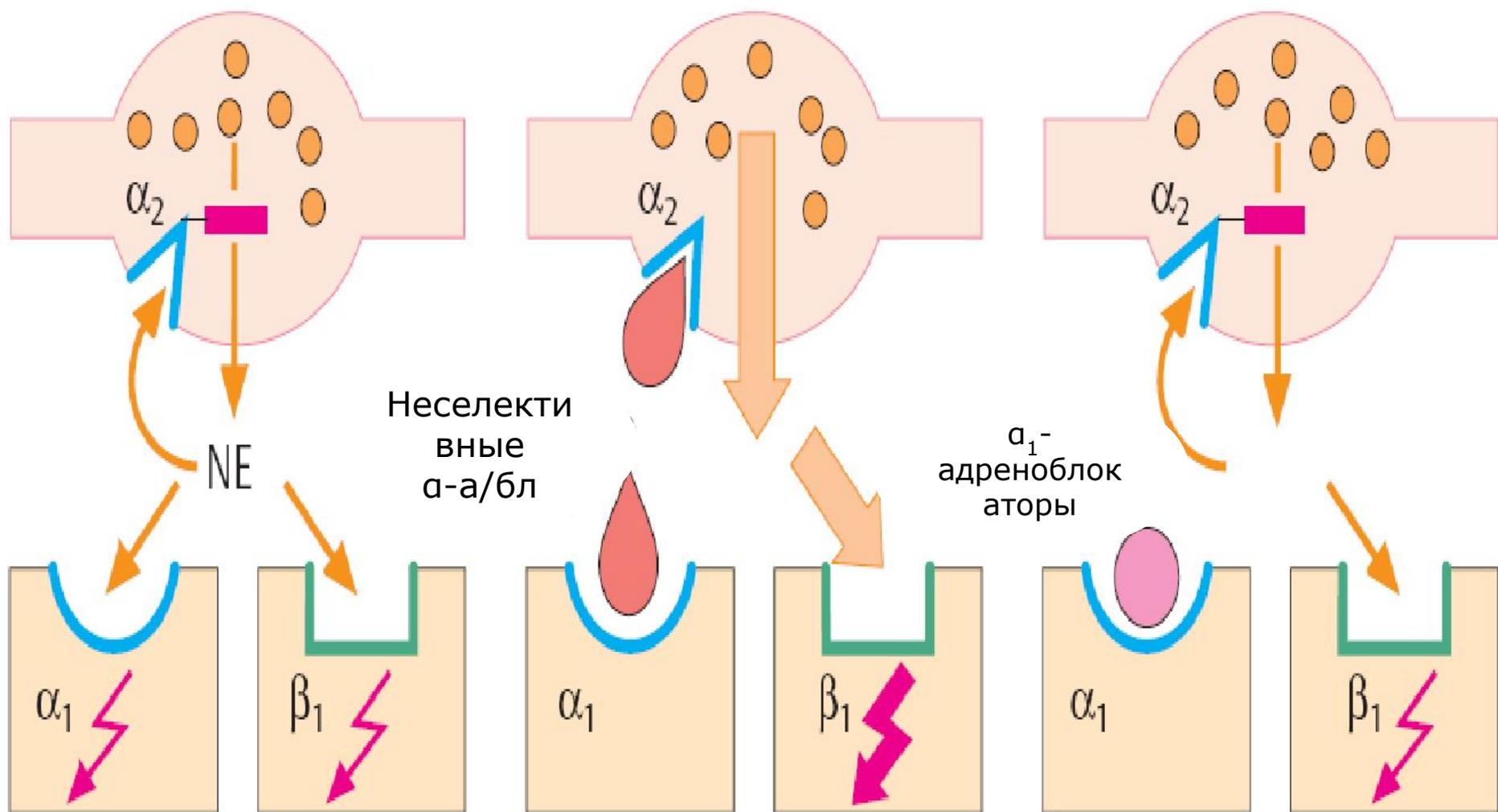
Селективные  $\alpha_1$ -адреноблокаторы:

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

## **Доксазозин, тамсулозин, теразозин**

- блок  $\alpha_1$ -адренорецепторов шейки мочевого пузыря, задней уретры и предстательной железы  $\rightarrow$  улучшение динамики мочеиспускания при доброкачественной аденоме предстательной железы

# Влияние адреноблокаторов на высвобождение норадреналина



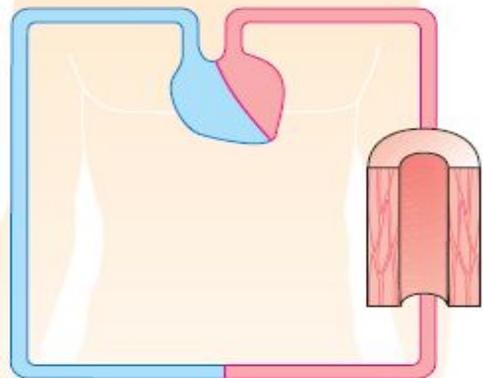
# Применение

---

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

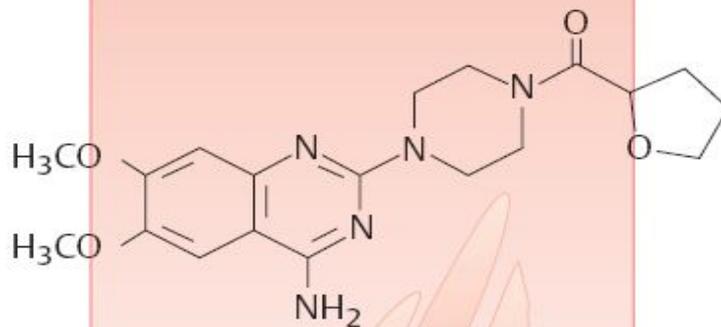
# Основные показания к применению

Артериальная гипертензия



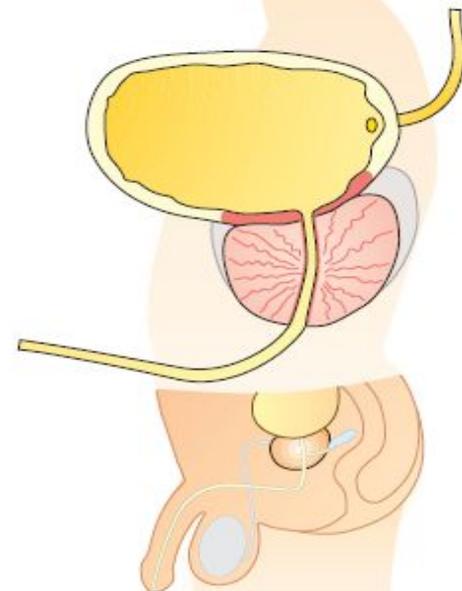
Резистивные  
сосуды

$\alpha_1$ -  
адреноблокатор

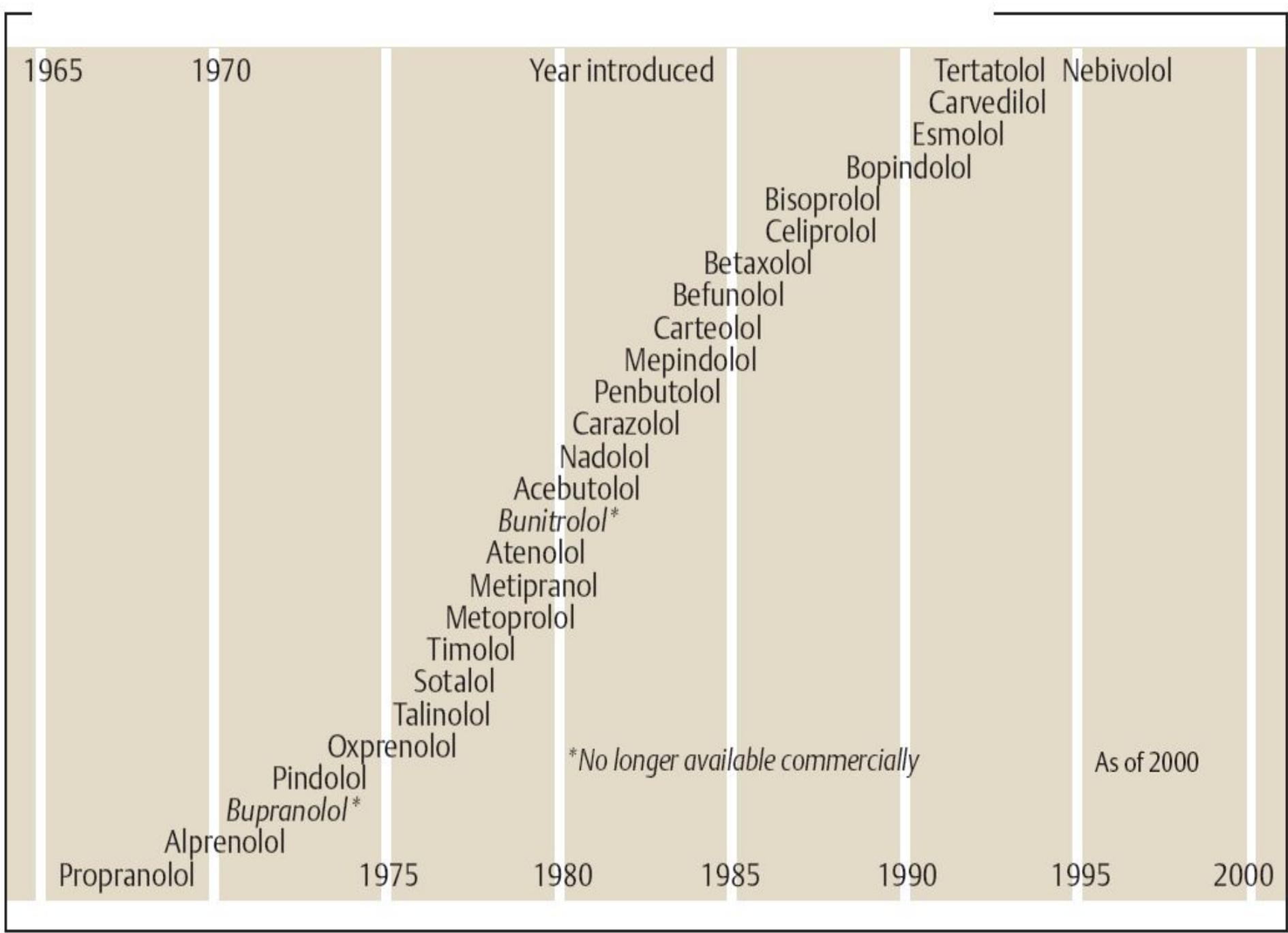


Угнетение  
симпатической  
иннервации  
гл/м

Доброкачественная  
гиперплазия  
предстательной  
железы



Мочевой пузырь  
Предстательная железа



# Классификация $\beta$ -адреноблокаторов

---

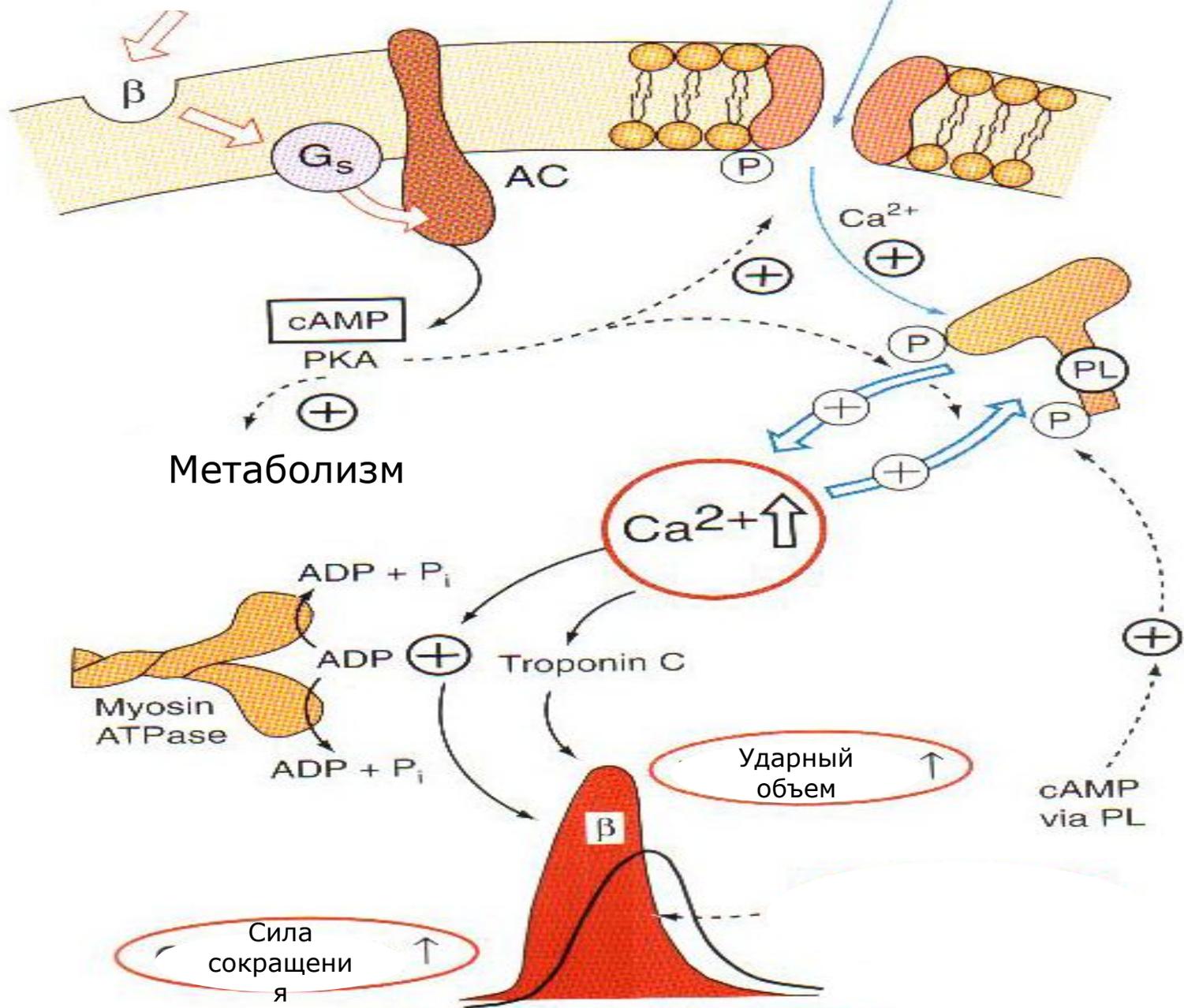
- Неселективные блокаторы  $\beta_1$ ,  $\beta_2$ -адренорецепторов
  - А) без внутренней адреномиметической активности:  
пропранолол, надолол, соталол
  - Б) с внутренней адреномиметической активностью:  
пиндолол
  - В) с вазодилатирующими свойствами:  
пиндолол

# Классификация $\beta$ -адреноблокаторов

---

- Кардиоселективные блокаторы  $\beta_1$ -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 $\beta$ -адреноблокаторов, связанные с блокадой $\beta_1$ -рецепторов

- Кардиальные эффекты:
  - отрицательное инотропное действие
  - отрицательное хронотропное действие
  - отрицательное дромотропное действие
  - отрицательное батмотропное действие
- Снижение секреция ренина и, соответственно АТII, вследствие блокады  $\beta_1$ -рецепторов в клетках ЮГА почек.

# Фармакологические эффекты $\beta$ -адреноблокаторов, связанные с блокадой $\beta_2$ -рецепторов

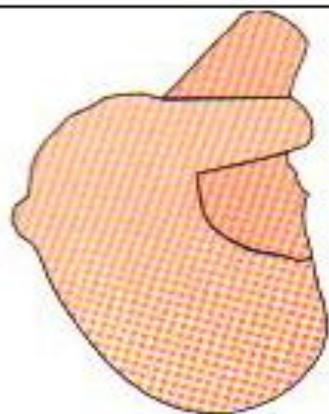
- повышение тонуса гл/м бронхов
- повышение сократительной активности матки
- повышение моторики ЖКТ (спастические боли в животе, рвота, поносы)
- повышение тонуса сосудов, соответственно повышение ОПСС и ухудшение периферического кровообращения, повышенная утомляемость и мышечная слабость
- активация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

## Фармакологические эффекты $\beta$ -адреноблокаторов, связанные с блокадой $\beta_3$ -рецепторов

---

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

# Кардиоселективные $\beta_1$ -адреноблокаторы

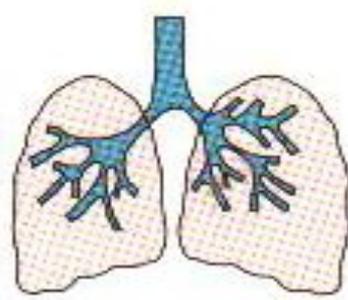


Брадикардия

Отрицательное инотропное действие

↓ АД

$\beta_1$ -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  $\beta_2$ -и  $\beta_3$ -а/р:**
  - бронхоспазм
  - спазм сосудов
  - сокращение матки и ЖКТ
  - гипогликемия
  - повышение коэффициента атерогенности.
- **Синдром отдачи**