



БЕТА- АДРЕНОБЛОКАТОРЫ

Подготовила : Елгондиева Мадина
Группа:777ВБ



Бета-адреноблокаторы

- **Бета-адреноблокаторы** — представляют собой группу фармакологических препаратов, при введении которых в организм человека происходит блокирование бета-адренорецепторов

бета₁-адренорецепторы

- находящиеся в основном в сердце, кишечнике, ткани почек, в жировой ткани, ограниченно

Бета₂-адренорецепторы

- находятся в гладкой мускулатуре сосудов и бронхов, в желудочно-кишечном тракте

Механизм действия бета-адреноблокаторов

- Препараты, связываясь с β_1 -адренорецепторами сердца, препятствуют действию на них норадреналина, адреналина, снижают активность аденилатциклазы. Снижение активности фермента приводит к уменьшению синтеза цАМФ и угнетение поступления Ca^{2+} в кардиомиоциты. Таким образом реализуются основные эффекты β -адреноблокаторов:
- отрицательный инотропный эффект (уменьшается сила сердечных сокращений);
- отрицательный хронотропный эффект (уменьшается частоты сердечных сокращений);
- отрицательный дромотропный эффект (подавляется проводимость);
- отрицательный батмотропный эффект (уменьшается автоматизм).
- обладают антиангинальным, антигипертензивным и антиаритмическим действием.

Механизм действия бета-адреноблокаторов





Тип адренорецептора	Локализация	Результат стимуляции
β1-рецепторы	Синусовый узел	Повышение возбудимости, увеличение частоты сердечных сокращений
	Миокард	Увеличение силы сокращений
	Коронарные артерии	Расширение
	Атриовентрикулярный (АВ) узел	Увеличение проводимости
	Пучок и ножки Гиса	Повышение автоматизма
	Печень, скелетные мышцы	Увеличение гликогенеза
β2-рецепторы	Артериолы, артерии, вены	Релаксация
	Мускулатура бронхов	Расслабление
	Матка беременной женщины	Ослабление и прекращение сокращений
	Островки Лангерганса (β-клетки)	Повышение секреции инсулина
	Жировая ткань (также в жировой ткани есть β3-адренорецепторы)	Увеличение липолиза
β1- и β2-рецепторы	Юкстагломерулярный аппарат почек	Увеличение высвобождения ренина




Классификация

- 1. Неселективные
 - А. Без собственной симпатомиметической активности - Пропранолол, Тимолол, Надолол, Соталол
 - Б. С собственной симпатомиметической активностью - Окспренолол, Пиндолол, Пенбутолол, Алпренолол
 - С. с вазодилатирующими свойствами - Картеолол, Карведилол
- 2. Кардиоселективные
 - а. Без собственной симпатомиметической активности - Атенолол, Метопролол, Бетаксолол, Талинолол
 - б. С собственной симпатомиметической активностью- Ацебутолол
 - с. с вазодилатирующими свойствами - Целипролол, Бевантолол
- 3. Новые различного механизма действия
 - Небиволол, Флестолол
- 4. Альфа-бета-адреноблокаторы
 - Лабеталол, Проксодолол



Липофильные и гидрофильные препараты

- **Липофильные** средства входят в группу жирорастворимых. Они легче проникают через барьер, расположенный между кровеносной и центральной нервной системами. В переработке таких препаратов активно участвует печень. Эта группа включает **метопролол, пропранолол**.
- **Гидрофильные** средства легко растворяются в воде. Они не так перерабатываются печенью и выводятся практически в первоначальном виде. Подобные средства имеют более продолжительное воздействие, поскольку дольше находятся в организме. К ним стоит отнести **атенолол и эсмолол**.



Показания к использованию бета-адреноблокаторов

- стенокардия напряжения,
- острый коронарный синдром,
- АГ и первичная профилактика инсульта и ИБС у больных АГ,
- профилактика желудочковых и наджелудочковых аритмий,
- профилактика повторного инфаркта миокарда,
- профилактика внезапной смерти у больных с синдромом удлиненного интервала Q-T,
- хроническая сердечная недостаточность (карведилол, метопролол, бисопролол, небиволол),
- системные заболевания с повышенным влиянием симпатической нервной системы,
- тиреотоксикоз,
- эссенциальный тремор,
- алкогольная абстиненция,
- расслаивающая аневризма аорты,
- гипертрофическая кардиомиопатия,
- дигиталисная интоксикация,
- митральный стеноз (тахисистолическая форма),
- пролапс митрального клапана,
- тетрада Фалло.



Препарат	β_1 - селектив- ность	ВСА/ α -адрено- блокада	$T_{1/2}$ (час)	Связывание с белками плазмы (%)	Элиминация	
					Печенью	Почками
Алprenолол	0	+2/0		85	100	0
Бевантолол	+2	0/0	2-4	95	100	0
Небиволол	+8	0/0	10-50	98	99,5	0,5
Бетаксолол	+2	0/0	16-22	50	85	15
Карведилол	+1	0/+1	6-7		100	0
Лабетолол	0	+1 β_2 /+2	3-4	50	100	0
Метопролол	+2	0/0	3-4	10	100	0
Оксipренолол	0	+2 β_1 - β_2	1-4	80	100	0
Пропранолол	0	0/0	2-5	93	100	0
Тимолол	0	0/0	4-5	10	80	20




Противопоказания

- ! **Абсолютные противопоказания** к назначению β -блокаторов:
- застойная сердечная недостаточность, не компенсируемая сердечными гликозидами и диуретиками;
 - бронхиальная астма и тяжелая обструктивная дыхательная недостаточность (для некардиоселективных β -адреноблокаторов);
 - брадикардия при частоте сердечных сокращений ниже 50 в мин;
 - артериальная гипотензия (систолическое АД 100 мм рт. ст. и ниже);
 - синдром слабости синусового узла;
 - атриовентрикулярная блокада II и III степени.



- **Относительные противопоказания** к назначению β -блокаторов:
 - инсулинзависимый сахарный диабет;
 - язвенная болезнь желудка и двенадцатиперстной кишки в фазе обострения;
 - дислипотеинемии.



МЕТОДЫ КОНТРОЛЯ ЗА ТЕРАПИЕЙ β-БЛОКАТОРАМИ

- ! ЧСС, измеренная через 2 ч после приема очередной дозы не должна быть менее 50-55 уд/мин;
- ! Снижение АД контролируется измерениями по Короткову или появлением субъективных симптомов: головокружением, общей слабостью, головной болью;
- ! Удлинение интервала PQ на ЭКГ указывает на возникшие нарушения атриовентрикулярной проводимости;
- ! Контроль сократительной функции (эхокардиография);
- !(Хрипы в легких, одышка, отеки могут свидетельствовать о сердечной недостаточности).
- ! Контроль дыхательной функции (аускультация).



Побочные эффекты	Абсолютные противопоказания	Состояния, требующие особой осторожности
<p>Кардиальные:</p> <ul style="list-style-type: none">• выраженная синусовая брадикардия,• остановка синусового узла,• полная атрио-желудочковая блокада,• снижение систолической функции левого желудочка. <p>Неврологические:</p> <ul style="list-style-type: none">• депрессия,• бессонница,• кошмарные сновидения. <p>Желудочно-кишечные:</p> <ul style="list-style-type: none">• тошнота,• рвота,• метеоризм,• запоры,• диарея. <p>Бронхострикция (у лиц с бронхиальной астмой, ХОБЛ).</p>	<p>Индивидуальная гиперчувствительность.</p> <p>Бронхиальная астма.</p> <p>ХОБЛ с бронхообструкцией.</p> <p>Атрио-желудочковая блокада I-II ст.</p> <p>Брадикардия с клиническим проявлением.</p> <p>Синдром слабости синусового узла.</p> <p>Кардиальный шок.</p> <p>Тяжелые поражения периферических артерий.</p> <p>Гипотензия с клиническими проявлениями.</p>	<p>Сахарный диабет.</p> <p>ХОБЛ без бронхообструкции.</p> <p>Поражение периферических артерий.</p> <p>Депрессии.</p> <p>Дислипидемии.</p> <p>Бессимптомная дисфункция синусового узла.</p> <p>Атрио-желудочковая блокада I ст.</p>

A photograph of medical supplies including a blister pack of white pills, a white pill bottle with a label, and a white envelope with text, all on a light surface. The text on the envelope is partially legible and includes 'NOT' and '13-0640'.

При сахарном диабете

- Пациенты с сахарным диабетом, страдающие сердечными патологиями, обязательно должны использовать эти препараты. Нужно учитывать, что неселективные средства приводят к усилению метаболического ответа на инсулин. Именно поэтому их не рекомендуется использовать.



Бета-блокаторы и беременность

- Наиболее безопасными в этот период считаются атенолол и метопролол. Причем эти средства назначают, как правило, только в течение третьего триместра беременности.
- Нужно учитывать, что такие препараты могут вызывать задержку роста плода — особенно, если принимать их в первом и втором триместре беременности.



Взаимодействие лекарств

- Сочетание бета-адреноблокаторов с другими лекарственными препаратами, проявляет отрицательный ино-и хронотропный эффект, может привести к тяжелым побочным реакциям. При сочетании β -адреноблокаторов с клонидином развивается выраженное снижение артериального давления и брадикардия, особенно при горизонтальном положении больных.
- Сочетание назначения бета-адреноблокаторов с верапамилом, амиодароном, сердечными гликозидами может привести к резкой брадикардии и нарушения AV-проводимости.
- Сочетание бета-адреноблокаторов с нитратами или блокаторами кальциевых каналов обоснованно, поскольку первые уменьшают потребность миокарда в кислороде, а другие, снижая тонус периферических и коронарных сосудов, обеспечивают гемодинамические разгрузки миокарда и увеличение коронарного кровотока.

















