

- **АДРЕНЕРГІЧНІ**
ЗАСОБИ

Орган

Напруга симпатичних нервів

Напруга парасимпатичних нервів (Vagus nerve)

Зіниця

Розширення (Мідріаз)

Звуження (Міоз)

Слізні залози

Придушення виділення

Стимуляція виділення

Слюнні залози

Конденсація (зменшення у кількості)

Розведення (зростання у кількості)

Серце

Стимуляція (прискорення)

Придушення (брадікардія)

Кровоносні судини

Звуження

Расширення

Коронарні артерії

Розширення

Звуження

Кров'яний тиск

Зростання

Зниження

Бронхи та трахеї

Розслаблення

Скорочення (звуження отвору та кашель)

Робота шлунка

Придушення

Зростання, активація

Шлункова секреція

Зменьшення

Активація, збільшення

Кишечник

Придушення діяльності (перистальтики)

Прискорення діяльності (перистальтики)

Подшлункова залоза

Зменьшення секреції

Збільшення секреції

Жовчний міхур

Розслаблення

Скорочення

Сечовий мухір

Розслаблення (придушення сечоспускання)

Скорочення (стимуляція сечоспускання)

Матка

Скорочення

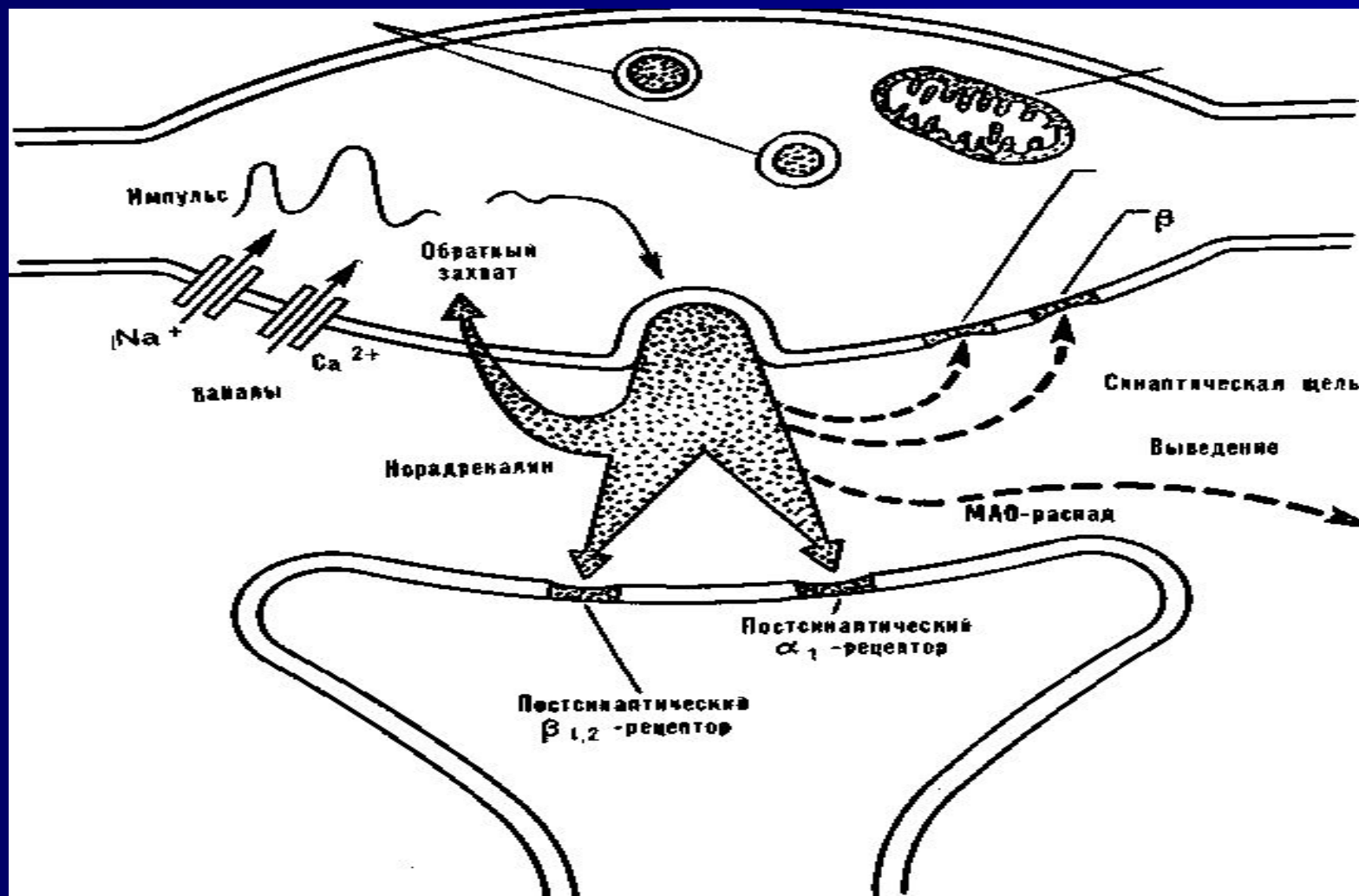
Розслаблення

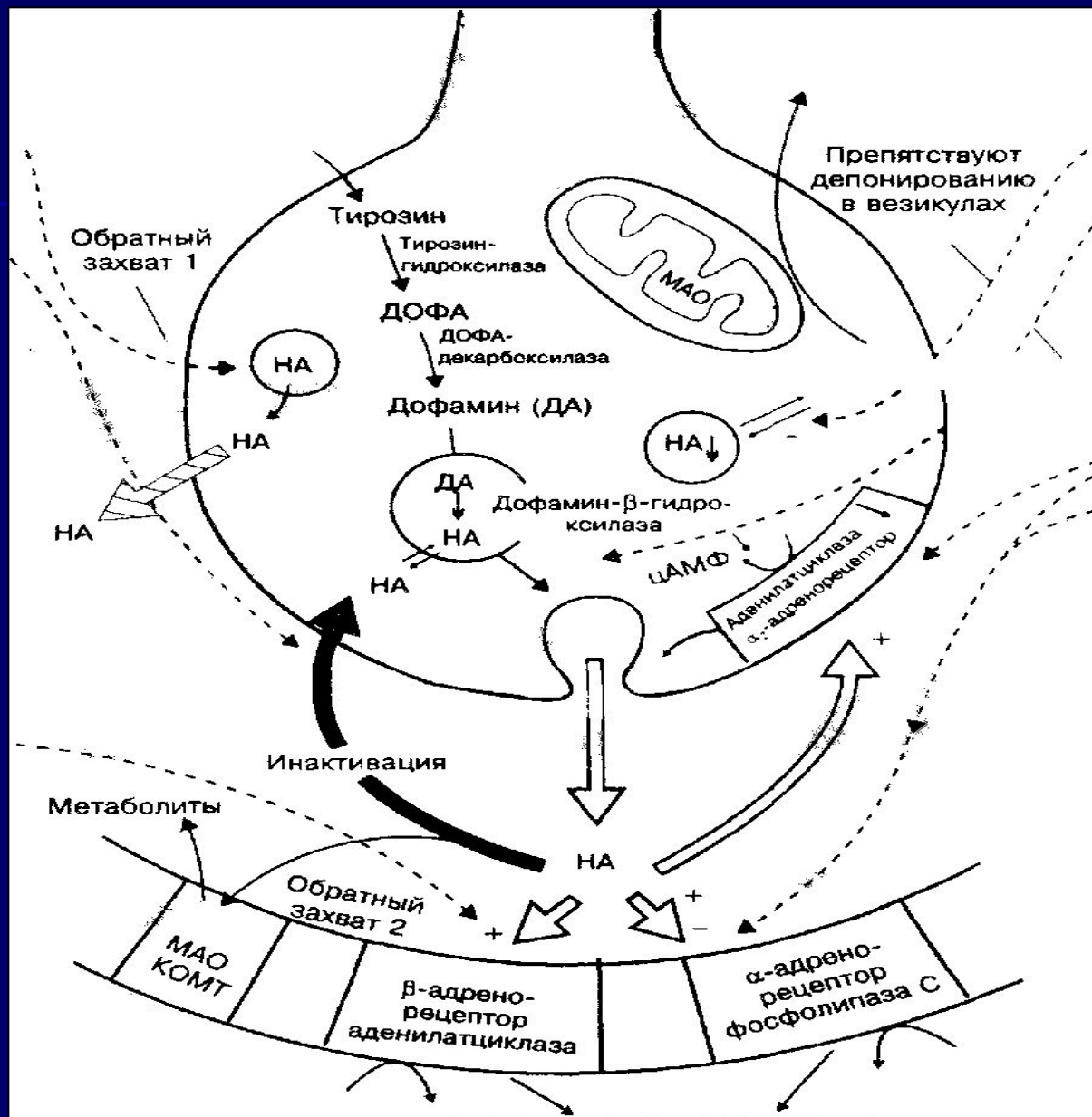
Потові залози

Стимуляція виділення

Виділення холодного поту

Виділення медіатора норадреналіну з потовщення постгангліонарного симпатичного нерва та дія його на пресинаптичні та постсинаптичні рецептори ефекторних клітин





Локалізація адренергічних рецепторів

α-1

Гладкі м'язи артерій, вен шкіри, внутрішніх органів черевної порожнини, серця (коронарні судини)

Гладкі м'язи трабекул селезінки, сім'явивідних проток, матки

Радіальний м'яз райдужки ока

Міокард (шлуночки)

Гепатоцити

Скелетна мускулатура

Звуження судин

Скорочення

Мідріаз

Збільшення сили скорочень

Глікогеноліз, гіперглікемія

Покращення нервово-м'язової передачі

Локалізація адренергічних рецепторів

α -2

Гладкі м'язи стінки судин

Звуження судин

Гладкі м'язи стінок шлунка та кишечника

Розслаблення

Пресинаптично розташовані адренорецептори

Зменшення імпульсного звільнення медіатора

Тромбоцити

Посилення агрегації

Локалізація адренергічних рецепторів

β -1

Серце (передсердя та шлуночки)

Гладкі м'язи стінок коронарних судин

Гладкі м'язи стінок кишечника

Гепатоцити

Підвищення автоматизму, збудливості, провідності, сили скорочень

Розслаблення

Розслаблення

Глікогеноліз, гіперглікемія

Локалізація адренергічних рецепторів

<u>β-2</u>	Гладкі м'язи стінок артеріол скелетної мускулатури, коронарних судин	Розслаблення
	Гладкі м'язи бронхів	Розслаблення
	Міометрій	Розслаблення
	Скелетна мускулатура	Глікогеноліз, збільшення сили та швидкості скорочень

Локалізація адренергічних рецепторів

β -3

Панкреатичні
острівці

Гладкі клітини
сполучної
тканини

Жирові клітини

Збільшення
секреції
інсуліну

Гальмування
дегрануляції

Посилення
ліполізу

Засоби, що діють на периферичні адренергічні процеси

1. Адреналін та адреноміметичні речовини

а) Засоби, що стимулюють α - та $\alpha+\beta$ -адренорецептори

1. Адреналін ($\alpha-1,2$; $\beta-1,2$)
2. Норадреналіну гідротартрат ($\alpha-1,2$; $\beta-1$)

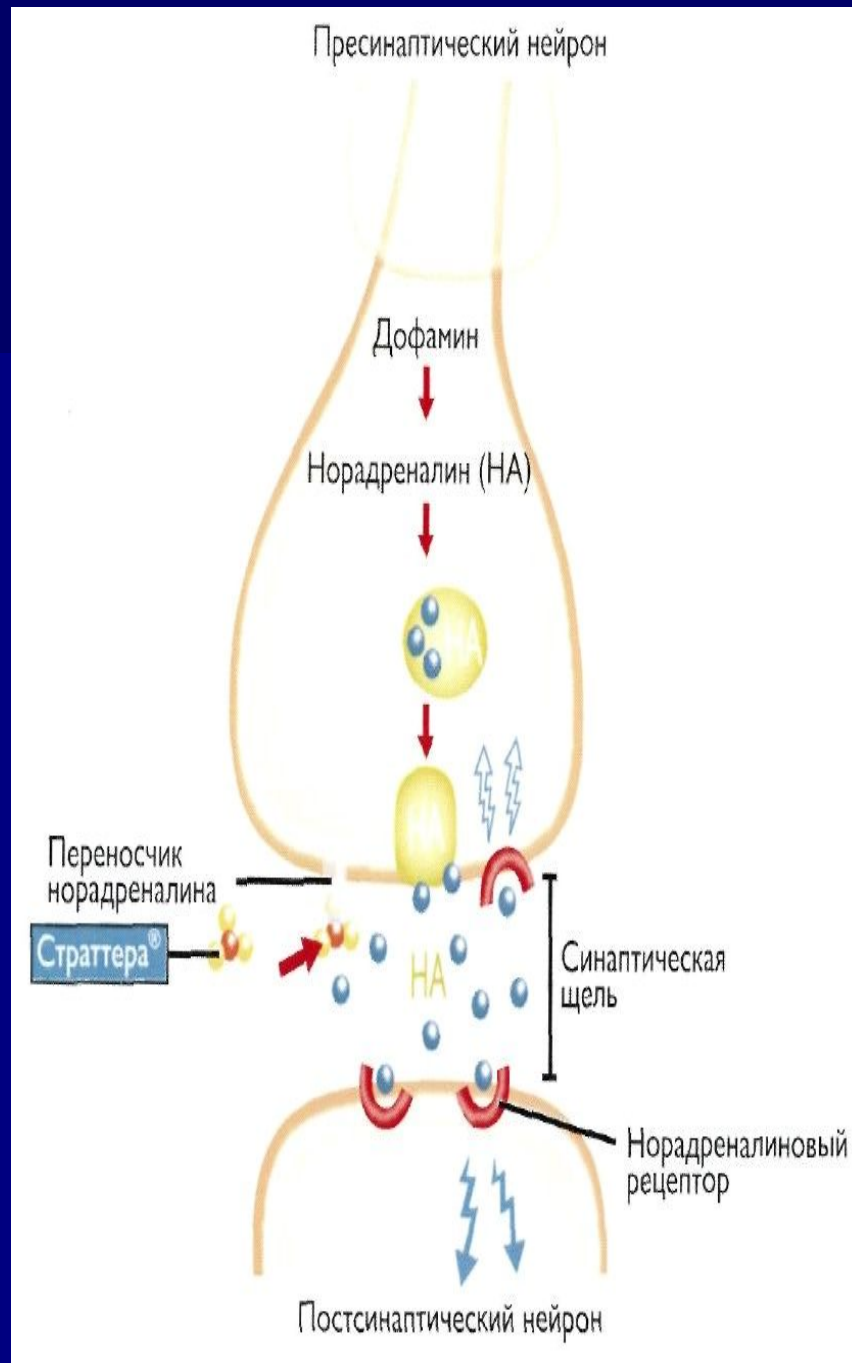
б) α -адреностимулятори

3. Мезатон ($\alpha-1$)
4. Нафтизін ($\alpha-2$)
5. Ксилометазолін ($\alpha-2$)

- Адреналін та норадреналін.
- Катехоламини естественного происхождения
- діють переважно шляхом прямої стимуляції адренорецепторів.
- Норадреналін сприяє нормальному кровообігу та підвищенню артеріального тиску при гіпотензивних станах
- В основному його вплив проявляється у звуженні периферичних судин, бере участь і в стимуляції міокарда.

Норадреналін

- На відміну від природного (ендогенного) норадреналіну, лікарський препарат цієї сполуки збуджує альфа-та бета-1-АР, не впливаючи практично на бета-2-АР.
- У зв'язку з збудженням альфа-АР норадреналін різко звужує кровоносні судини та підвищує артеріальний тиск.



Норадреналін

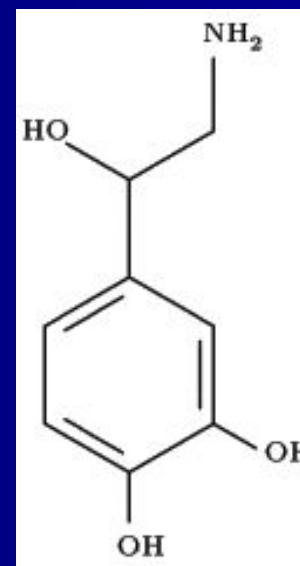
Дія препарату при внутрішньовенному введенні триває кілька хвилин,

для тривалого підвищення артеріального тиску розчин норадреналіну (зазвичай у 5% ізотонічному розчині глюкози) вводять внутрішньовенно краплинно.

Основне показання до призначення норадреналіну – гостре зниження артеріального тиску.

При застосуванні великих дозах можливе утруднення дихання, головний біль, серцеві аритмії.

Норадреналін **протипоказаний** при серцевій слабкості, вираженому атеросклерозі, атріовентрикулярній блокаді, фторотановому, циклопропановому наркозі.



Адреналін



гормон мозкового шару надниркових залоз, діє практично на всі гладком'язові органи, впливає на обмінні процеси в організмі.

Бета-2-АР судин більш чутливі до адреналіну, їх збудження триваліше порівняно з альфа-АР.

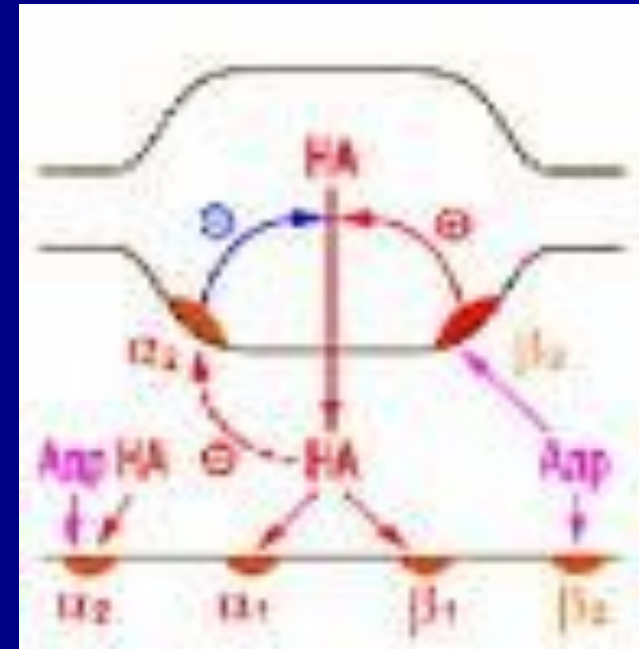
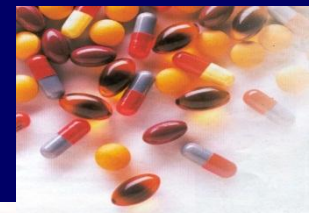
В умовах цілого організму адреналін викликає звуження судин шкіри, слизових оболонок, у великих дозах - адреналін викликає звуження судин внутрішніх органів і розширення судин серця, скелетних м'язів.

Адреналін посилює силу та підвищує частоту серцевих скоритчень, стимулює бета-1-АР, у зв'язку з чим трохи підвищує артеріальний тиск.

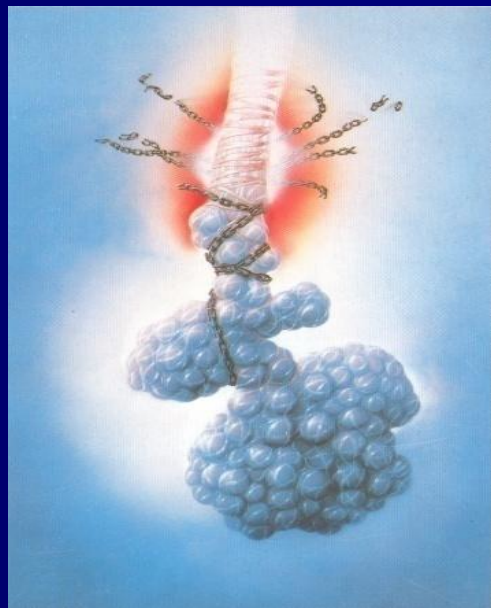
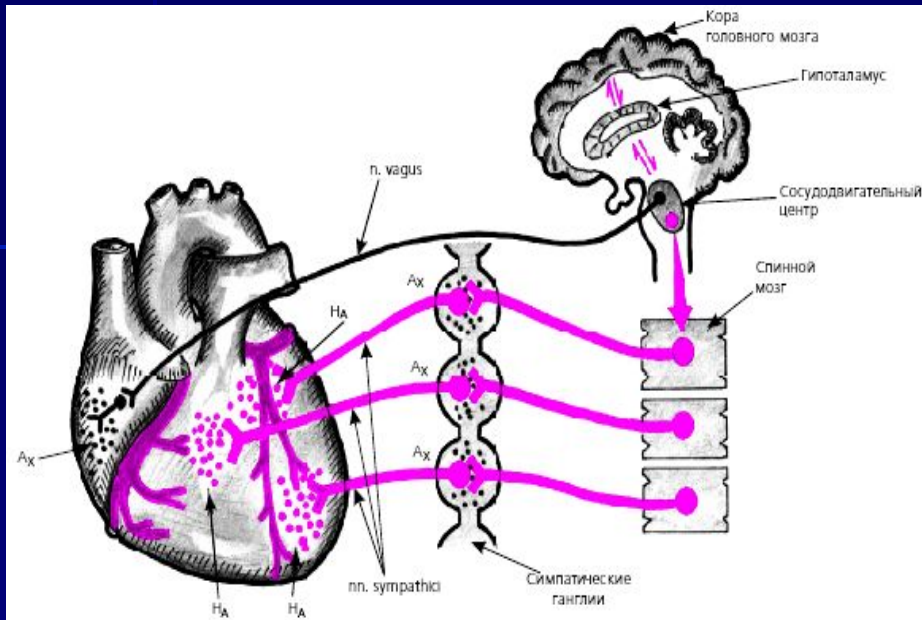
Адреналін підвищує збудливість та автоматизм серцевого м'яза та полегшує проведення збудження за провідною системою серця (збудження бета-1-АР).

При зупинці серця адреналін застосовують внутрішньосерцево.

Адреналін викликає розслаблення м'язів бронхів (збудження бета-2-АР), посилює глікогеноліз (розщеплення глікогену) та підвищує вміст цукру в крові.



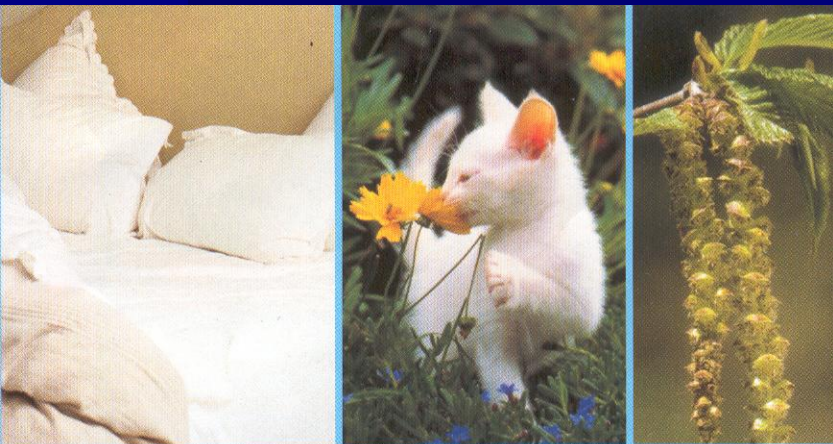
Адреналін

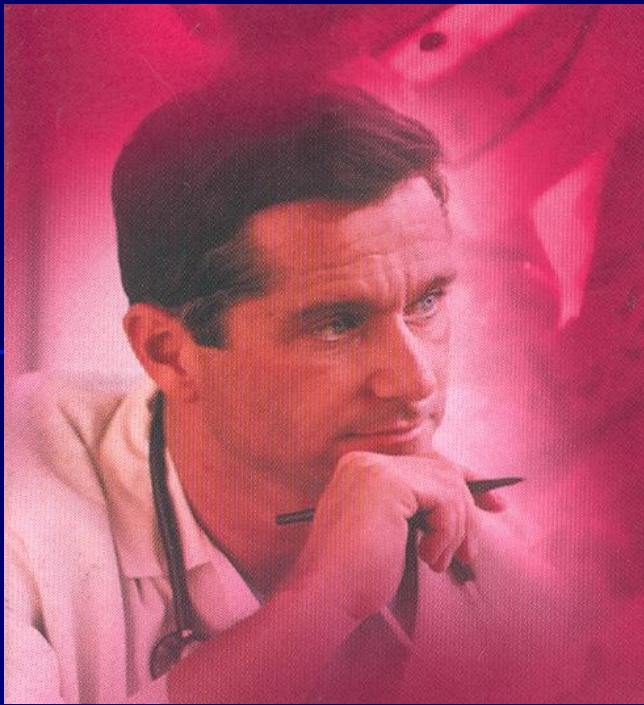


- Здатність препарату *зужувати судини, розслабляти бронхи та підвищувати артеріальний тиск*
- використовується при анафілактичному шоці (тяжкій алергічній реакції), що проявляється розширенням судин, падінням артеріального тиску, спазмом бронхів.



- Адреналін є антагоністом гістаміну.
- ефективний при лікуванні бронхоспазму
- При нападах бронхіальної астми адреналін вводять під шкіру, що призводить до припинення нападу.
- Підвищення артеріального тиску, серцебиття, аритмії у цьому разі є небажаними побічними ефектами.
- При передозуванні виникає страх, занепокоєння, тремор, біль голови. Можливі мозкові крововиливи внаслідок різкого підвищення артеріального тиску.





- **Судинозвужувальний ефект адреналіну використовують при додаванні його до розчинів місцевих знеболювальних засобів (новокаїну, лідокаїну) для зменшення їх всмоктування та подовження дії.**

*Засоби, що діють на периферичні
адренергічні процеси*

Засоби пресинаптичної дії

Сімпатоміметики

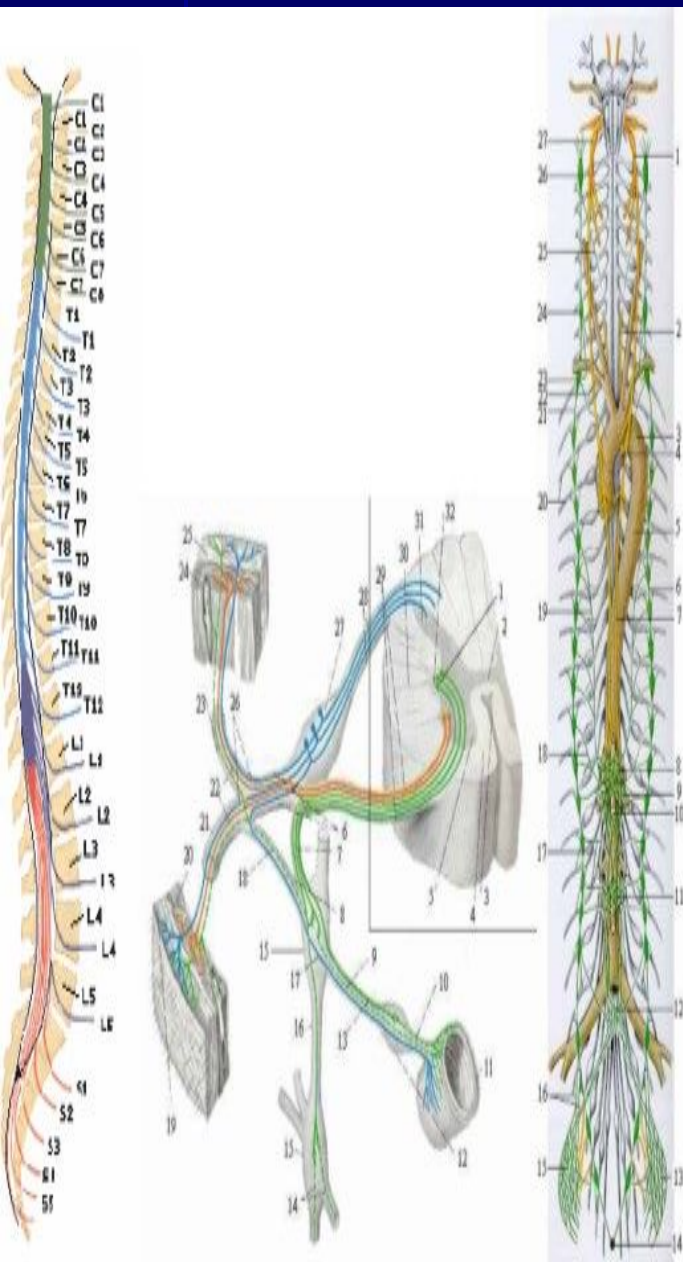
Ефедрін (α -1,2; β -1,2)

Дефедрін (α -1,2; β -1,2)

ЕФЕДРИН

- ЕФЕДРИН - алкалоїд чагарникової рослини ефедри, так званої "Кузмічової трави". З давніх часів та ж рослина під назвою "Ма-Хуанг" застосовується і в медицині Китаю. За хімічною будовою та фармакологічними ефектами схожий з адреналіном, але за механізмом дії істотно відрізняється від нього.
- Ефедрин посилює виділення медіатора закінченнями адренергічних нервових волокон і лише слабкою мірою надає безпосередню збудливу дію на АР.
- При виснаженні запасів медіатора у разі частих введень ефедрину та при призначенні симпатолітиків дія ефедрину послаблюється (тахіфілаксія).

сімпатоміметичні аміни



- Ефедрін має як непряму дію на симпатичні нервові закінчення, з яких він вивільняє норадреналін, так і пряму агоністичну дію на β -адренорецептори;
- ВИКОРИСТОВУЮТЬ ефедрін головним чином як бронходилататор, для зменшення набрякості слизової оболонки носових ходів, при лікуванні гіпотензивних станів.

- Ефедрин більш стійкий, порівняно з адреналіном, ефективний не тільки при парентеральному, але і при призначенні внутрішньо, діє тривало. Однак дія це слабша, ніж дія адреналіну.
- Застосовують ефедрин при бронхіальній астмі (для усунення нападів, препарат вводять під шкіру, для попередження - призначають внутрішньо); при таких алергічних захворюваннях, як сінна лихоманка, сироваткова хвороба; при ринітах (у вигляді крапель у ніс); при зниженні артеріального тиску.
- У той час, як пряма дія адреналіну на ЦНС проявляється постійно і нерізко, ефедрин збуджує ЦНС і насамперед вищі його відділи.



- Ефедрін знімає сонливість, пробуджує від сну, що викликається снодійними, збуджує дихання.



- При застосуванні ефедрину можливі побічні ефекти: нервове збудження, тремор (тремтіння) рук, серцебиття, підвищення артеріального тиску, затримка сечі, втрата апетиту.
- Ефедрін протипоказаний при артеріальній гіпертензії, атеросклерозі, тяжких органічних ураженнях серця, при порушеннях сну.

α -адреностимуляторы

Постсинаптические адренорецепторы на поверхности клеток эффекторных органов называли

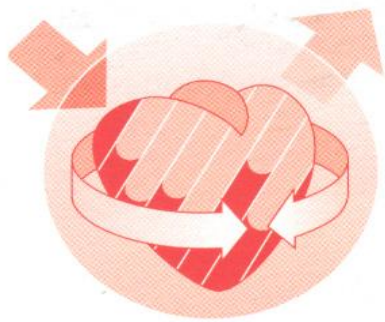
α адренорецепторами.

α -Адренорецепторы опосредуют:

- ***вазоконстрикцию,***
- ***расширение зрачков.***

Мезатон, метоксамин являются селективными α_1 -адреноагонистами;

ксилометазолин, нафтизин – α_2 -адреноагонистами.



α -адреностимулятори

- *Мезатон (селективний α -1-агоніст)*
- *Нафтизін (селективний α -2-агоніст)*
- *Ксилометазолін (селективний α -2-агоніст)*

Мезатон



- Мезатон звужує кровоносні судини та у зв'язку з цим підвищує артеріальний тиск. Тривалість дії – 1,5-2 години. Мезатон стійкий, його можна вводити не тільки парентерально (під шкіру, м'язи, вену), але і всередину.
- Застосовують препарат при зниженому артеріальному тиску, пов'язаному з розширенням судин, а також іноді при ринітах (нежить) у вигляді крапель у ніс.
- Протипоказання: гіпертонічна хвороба, атеросклероз, спазм судин.

β-адренорецептори

- *Бета1-АР* знаходяться у м'язі серця, при їх збудженні посилюються та частішають серцеві скорочення, полегшується проведення імпульсів від передсердь до шлуночків, підвищується автоматизм серця.
- У кровоносних судинах, бронхах, матці знаходяться *бета2-АР*, при їх збудженні відбувається розслаблення бронхіальних м'язів і матки.

Засоби, що діють на периферичні
адренергічні процеси

б) $\beta_{1,2}$ -Адреностимулятори

1. Ізадрин ($\beta_{-1,2}$)
2. Орципреналіну сульфат ($\beta_{-1,2}$)
3. Беродуал ($\beta_{-1,2}$)

б) β_2 -Адреностимулятори

4. Сальбутамол (β_{-2})
5. Фенотерол (β_{-2})
6. Тербуталін (β_{-2})

β_1 -Адреностимулятори

7. Добутамін (β_{-1})

ІЗОПРЕНАЛІН (Ізадрин)

- збуджує як бета-1, і бета-2-АР.
- У зв'язку з збуджуючим впливом на бета-2-АР бронхів, ізадрин має виражену бронхолітичну дію. Цей ефект використовується для лікування бронхіальної астми. При бронхіальній астмі періодично виникають напади ядухи, пов'язані зі спазмом бронхів. Для припинення (купування) цих нападів розчини ізадрину найбільш доцільно застосовувати інгаляційним шляхом у вигляді аерозолів.

ІЗОПРЕНАЛІН (Ізадрин)

- *Збільшує хвилинний об'єм серця та прискорює атріовентрикулярну провідність, збільшуючи автоматизм шлуночкових водіїв ритму.*
- *Застосовують при лікуванні блокади серця (у цьому випадку ізадрин призначають у вигляді таблеток під язик).*
- *Побічні ефекти: тахікардія, серцеві аритмії.*

ОРЦИПРЕНАЛІНУ СУЛЬФАТ

(алупент, астмопент)

- переважно збуджує бета-2-АР, застосовується для усунення або попередження розвитку нападу бронхіальної астми.

Добутамін

- Постсинаптичні бета-1-АР представлені в основному в міокарді, гладких клітинах кишечника, жирової тканини.
- Добутамін, споріднена з дофаміном речовина, що має відносну **селективну дію на b1-адренорецептори і сильніший вплив на скоротливість міокарда, ніж на частоту серцевих скорочень,**
- **Використовують при лікуванні застійної серцевої недостатності, часто в поєднанні з вазодилататорами**

Показання до призначення адреноміметиків

- *Гострі гіпотензії: шок, колапс (норадреналін, мезатон, фетанол, ефедрин);*
- *зупинка серця (адреналін);*
- *Кардіогенний шок, порушення атріовентрикулярної провідності (ізадрин, добутамін);*
- *Бронхіальна астма (всі бета-адреноміметики, особливо бета-2-адреноміметики);*
- *Для збереження вагітності (токолітики – бета-2-адреноміметики);*
- *Збільшення тривалості дії місцевих анестетиків (адреналін, мезатон);*
- *При запальних процесах: реніт, кон'юктивіт (альфа-адреноміметики: мезатон, нафтизин, галазолін);*
- *При гіпоглікемії внаслідок передозування інсулін (адреналін).*

Засоби, що діють на периферичні адренергічні процеси

Б. Антиадренергічні препарати

а) α -Адреноблокатори

Похідні алкалоїдів маткових ріжків (спориньї)

- | | |
|---|--|
| 1. Дигідроерготамін (<u>$\alpha-1,2$</u>) | 4. Вазобрал (<u>$\alpha-1,2$</u>) |
| 2. Дигідроерготоксин (<u>$\alpha-1,2$</u>) | 5. Ницерголін (<u>$\alpha-1,2$</u>) |
| 3. Синепрес (<u>$\alpha-1,2$</u>) | |

Синтетичні α -адреноблокатори

- | | |
|---|--|
| 1. Фентоламіну г/д (<u>$\alpha-1,2$</u>) | 3. Піроксан (<u>$\alpha-1,2$</u>) |
| 2. Тропафен (<u>$\alpha-1,2$</u>) | 4. Бутіроксан (<u>$\alpha-1,2$</u>) |

Вибіркові блокатори α_1 -адренорецепторів

- | | |
|---|--|
| 1. Празозин (<u>$\alpha-1$</u>) | 2. Доксазозин (<u>$\alpha-1$</u>) |
| 3. Тамсулозин (омник) (<u>$\alpha-1a$</u>) | |

Дигідроерготамін

- Фармакологічна дія - судинорозширювальна, протимігренозна.
- Механізм дії - стимулює 5-HT_{1D} серотонінові рецептори, блокує альфа1- та альфа2-адренорецептори судин.
- Є вазоконстриктором внутрішньочерепних судин і має виражені нейроінгібіторні властивості. Зменшує фототафонофобію. Деяко підвищує тонус вен. При інгаляційному введенні (назальний спрей) швидко всмоктується, що забезпечує його високу ефективність (купівання мігренозної атаки через 20-30 хв) і виводиться з організму (менший ризик небажаних ефектів). При прийомі внутрішньо (таблетки) біодоступність знижена.

Ницерголин

■ Альфа-адреноблокуючий засіб - синтетичний похідний алкалоїдів маточних ріжків, з присєднаним бромзаміщеним залишком нікотинової кислоти. Чинить вазодилатуючу (в т.ч. щодо мозкових артерій) дію. Покращує мікроциркуляцію. Залишок нікотинової кислоти, що міститься, надає пряму міотропну спазмолітичну дію на м'язову оболонку резистивних судин, підвищує їх проникність для глюкози, що найбільш яскраво проявляється щодо судин мозку і кінцівок. Покращує мозковий, легеневий та нирковий кровотік. Знижує судинний опір центральних судин, підвищує артеріальний кровотік, збільшує доставку кисню та глюкози. Покращує кровопостачання в кінцівках, особливо за недостатності кровообігу внаслідок функціональних артеріопатій. У терапевтичних дозах не впливає на АТ, у хворих з артеріальною гіпертензією може спричинити поступове помірне зниження АТ.

Фентоламіну г/д

Показання до застосування

- *Оклюзійні порушення периферичного кровообігу: хвороба Рейно, облітеруючий ендартеріїт, початкові стадії атеросклеротичної гангрени.*
- *Трофічні виразки кінцівок, вялозаживаючі рани, пролежні, відмороження.*
- *Феохромоцитома.*

Ницерголин

Показання до застосування:

- порушення мозкового кровообігу (атеросклероз судин головного мозку, тромбоз та тромбоемболія церебральних артерій, ішемія головного мозку, посттравматична енцефалопатія, психоорганічний синдром);
- мігрень;
- судинні розлади периферичної системи кровообігу (органічні та функціональні);
- артеріопатія кінцівок;
- облітеруючий ендартеріїт;
- хвороба Рейно;
- діабетична ангіопатія;
- дистрофічні захворювання рогівки ока;
- діабетична ретинопатія;
- ішемічна нейропатія зорового нерва.

Празозин

- Празозин є селективним периферичним постсинаптичним α_1 -адреноблокатором.
- Препарат знижує артеріальний тиск (АТ), призводить до зниження загального периферичного судинного опору. Хвилинний об'єм крові (ХОК) та систолічний об'єм залишаються без суттєвих змін. Празозин, зменшуючи перед навантаження на серце, дещо знижує тиск у малому колі кровообігу. Терапевтичний ефект препарату пов'язаний з α -адреноблокуючою дією. При тривалому застосуванні знижує концентрацію загального холестерину та холестерину ліпопротеїнів низької щільності.
- Показання для застосування:
Артеріальна гіпертензія (АГ), доброякісна гіперплазія передміхурової залози.

Засоби, що діють на периферичні адренергічні процеси

б) β -Адреноблокатори

Невибіркові (некардіоселективні) β -адреноблокатори

- | | |
|--|---|
| 1. Анаприлін (<u>β-1,2</u>) | 4. Біпіндолол (<u>β-1,2</u>) |
| 2. Надолол (<u>β-1,2</u>) | |
| 3. Піндолол (<u>β-1,2</u>) | 5. Тимолол (<u>β-1,2</u>) |

Вибіркові (кардіоселективні) β_1 -адреноблокатори

- | | |
|---|--|
| 1. Атенолол (<u>β-1</u>) | 3. Бісопролол (<u>β-1</u>) |
| 2. Метопролол (<u>β-1</u>) | 4. Бетаксоллол (<u>β-1</u>) |

«Гібридні» [α + β]-адреноблокатори

- | | |
|---|--|
| 1. Лабеталол (<u>α-1; β-1,2</u>) | 2. Карведілол (<u>α-1; β-1,2</u>) |
|---|--|

Пропранолол (Анаприлін)

Пропранолол – гіпотензивний, антиангінальний, антиаритмічний засіб.

- Механізм дії: Пропранолол блокує β_1 - і β_2 -адренорецептори, проявляє мембраностабілізуючу дію, пригнічує автоматизм синоатріального вузла, виникнення ектопічних ділянок у передсердях, атріовентрикулярному вузлі і меншою мірою – у шлуночках.
- Знижує частоту та зменшує силу серцевих скорочень, потребу міокарда у кисні.
- Знижує серцевий викид, артеріальний тиск, секрецію реніну, нирковий кліренс і швидкість клубочкової фільтрації.
- Пригнічує реакцію барорецепторів дуги аорти на зниження артеріального тиску.

Пропраналол (Анаприлін)

Показання до застосування:

- Контроль есенціальної та ниркової гіпертензії, стенокардія, довготривала профілактична терапія після перенесеного інфаркту міокарда, контроль більшості форм аритмій серця, профілактика мігрені, есенціальний тремор, контроль збудження та тахікардії збудження, додаткова терапія при тиреотоксикозі та тиреотоксичному кризі; у складі комбінованої терапії – феохромоцитома (тільки у поєднанні з α -адреноблокаторами).

Засоби, що діють на периферичні адренергічні процеси

Засоби пресинаптичної дії

Симпатолітики

Резерпін (α -1,2; β -1,2)

Альфа-метилдофа (α -1,2; β -1,2)

Октадин (α -1,2; β -1,2)

Орнід (α -1,2; β -1,2)