

Полтавський державний медичний університет

# АДРЕНЕРГІЧНІ АГОНІСТИ та АНТАГОНІСТИ





# ПЛАН ЛЕКЦІЇ

1. Екскурс в анатомію та фізіологію адренергічного відділу нервової системи.
  2. Класифікація адренергічної дії препаратів.
  3. Фармакологія адреноміметичних засобів.
  4. Фармакологія антиадренергічних засобів.
- 

ЕФЕРЕНТНА  
ПЦ

ІННЕРВАЦІЯ

СЦ

П

Н-хр

АХ

Н-хр  
АХ

М-хр

АХ

С

$\alpha, \beta$ -ар

НА

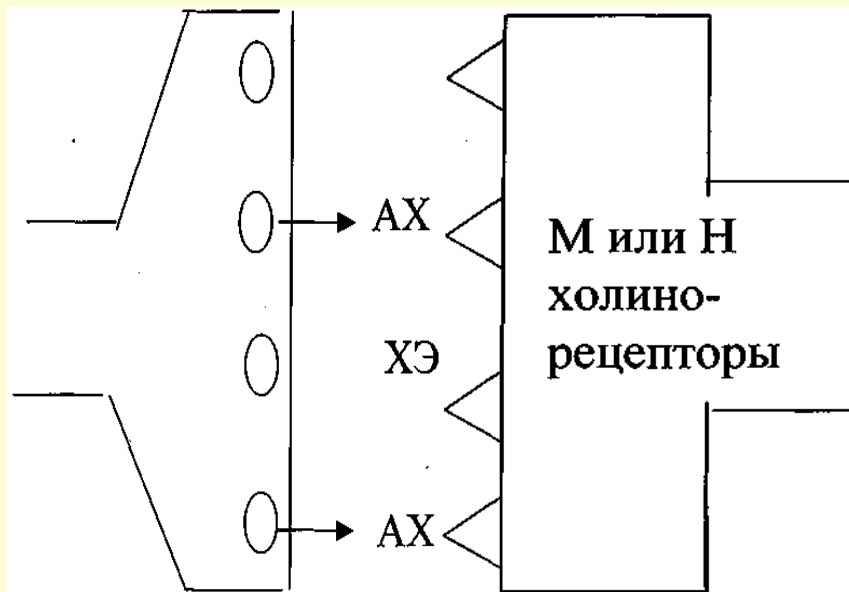
Р

Н-хр

АХ



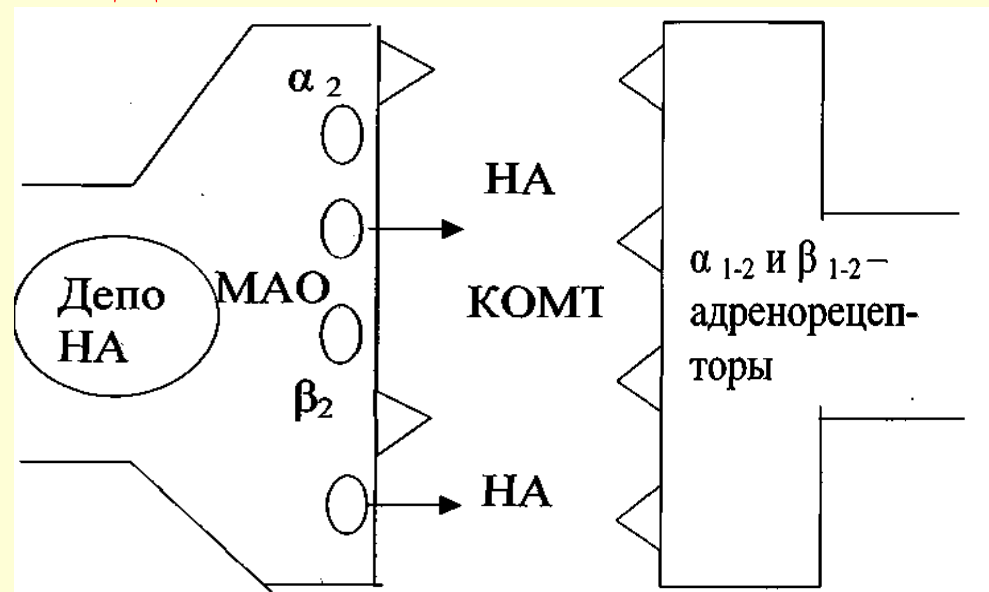
## ХОЛІНЕРГІЧНИЙ СИНАПС



**ХЕ** – фермент холінестераза

**АХ** – медіатор ацетилхолін

## АДРЕНЕРГІЧНИЙ СИНАПС



**НА** - медіатор норадреналін  
 $\alpha_2$  и  $\beta_2$  – адренорецептори гальмівні

**КОМТ** - катехол-о-метилтрансфераза

**МАО** - моноамінооксидаза

# ЕФЕКТИ ПРИ АКТИВАЦІЇ ВЕГЕТАТИВНИХ ВІДДІЛІВ

| <i>Нерв</i>              | <i>Орган</i>                                    | <i>Парасимпатичний відділ</i>                                                                                                                         | <i>Симпатичний відділ</i>                                                                                                                                  |
|--------------------------|-------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|
| Окоруховий<br>(III пара) | Око                                             |  міоз<br>спазм акомодатії<br>(близькозоркість)<br>↓ в/очного тиску |  мідріаз,<br>параліч акомодатії<br>(дальнозоркість)<br>↑ в/очного тиску |
| Лицьовий<br>(VII пара)   | Екзокзалози<br>(слинні, слъозні)                | Гіперсекреція                                                                                                                                         | Гіпосекреція                                                                                                                                               |
| Блукаючий<br>(X пара)    | Серце<br>Бронхи<br>ШКТ                          | Брадiкардія ↓<br>Спазм<br>↑ перистальтики                                                                                                             | Тахікардія<br>Ділатація<br>↓ перистальтики                                                                                                                 |
| Тазовий                  | Судини<br>Матка<br>Сечовий міхур<br>Пряма кишка |  розширення, ↓ АТ<br>↑ тонусу<br>↑ діурезу<br>↑ дефекації        |  спазм, ↑ АТ<br>↓ тонусу<br>↓ діурезу<br>↓ дефекації                  |

# Локалізація $\alpha$ -адренорецепторів

## $\alpha_1$ – адренорецептори (постсинаптичні)

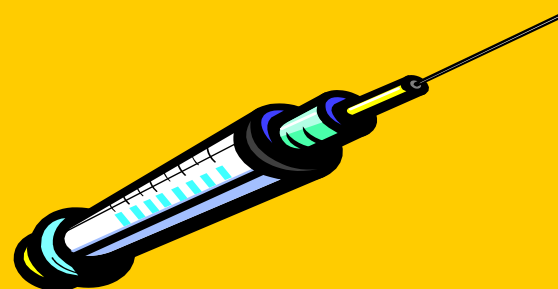
- артеріоли шкіри, слизових оболонок, брюшної порожнини, нирок, мозку
- сфінктери
- радіальний м'яз ока
- тіло матки

## $\alpha_2$ – адренорецептори (позасинаптичні)

- інтима судин (реагують на адреналін)

## $\alpha_2$ – адренорецептори (пресинаптичні, гальмівні)

- судиноруховий центр в ЦНС



# Локалізація $\beta$ - адренорецепторів

## $\beta_1$ – адренорецептори

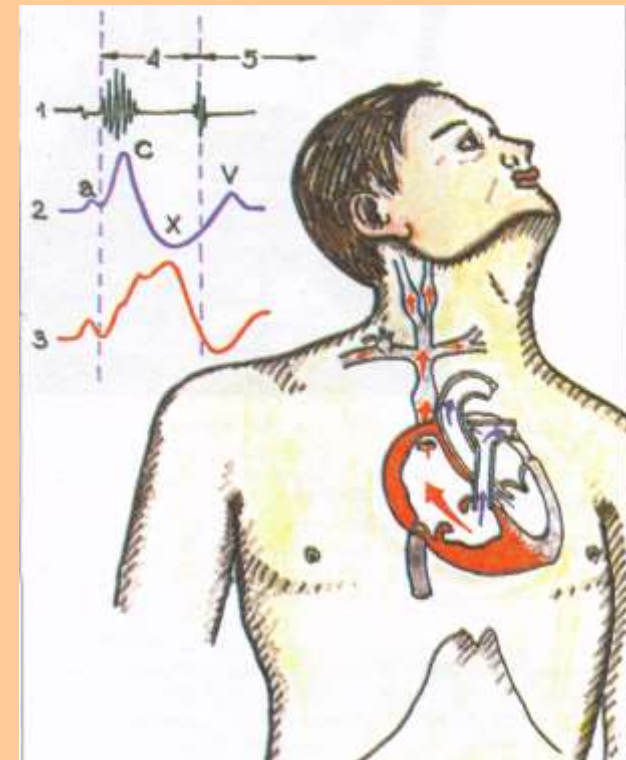
- **серце**

## $\beta_2$ – адренорецептори

- **судини** (аорта, крупні артерії)
- **гладком'язові органи**
- обмін вуглеводів (гліколіз)
- обмін жирів (ліполіз)

## $\gamma$ – адренорецептори

- **печінка**
- **скелетні м'язи**



# Адренопозитивні засоби

## *I. $\alpha, \beta$ – адреноміметики:*

1. Прямої дії – епінефрину гідротартрат (адреналін)
2. Непрямої дії – ефедрину гідрохлорид

## *II. $\alpha$ - адреноміметики:*

- норепінефрину гідротартрат ( $\alpha_{1-2}, \beta_1$ )  
(норадреналін)
- фенілефрин ( $\alpha_1, \alpha_2$ ) (мезатон)
- нафазолін, ксилометазолін ( $\alpha_2$ )

## *III. $\beta$ – адреноміметики:*

### *1. Неселективні ( $\beta_{1-2}$ )*

- ізопреналін (ізадрин, еуспіран)

### *2. Селективні ( $\beta_2$ )*

- сальбутамол
- фенотерол (партусистен), кленбутерол

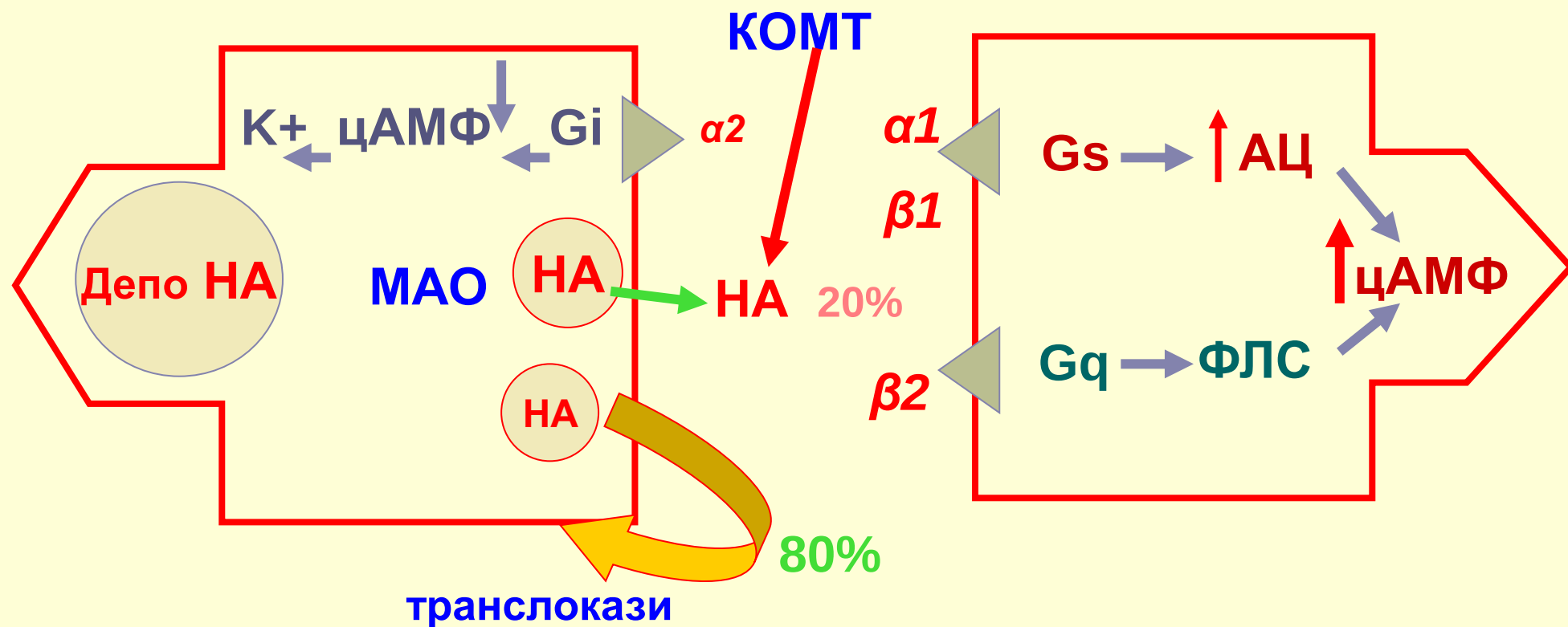
### *3. Селективні ( $\beta_1$ )*

- добутамін

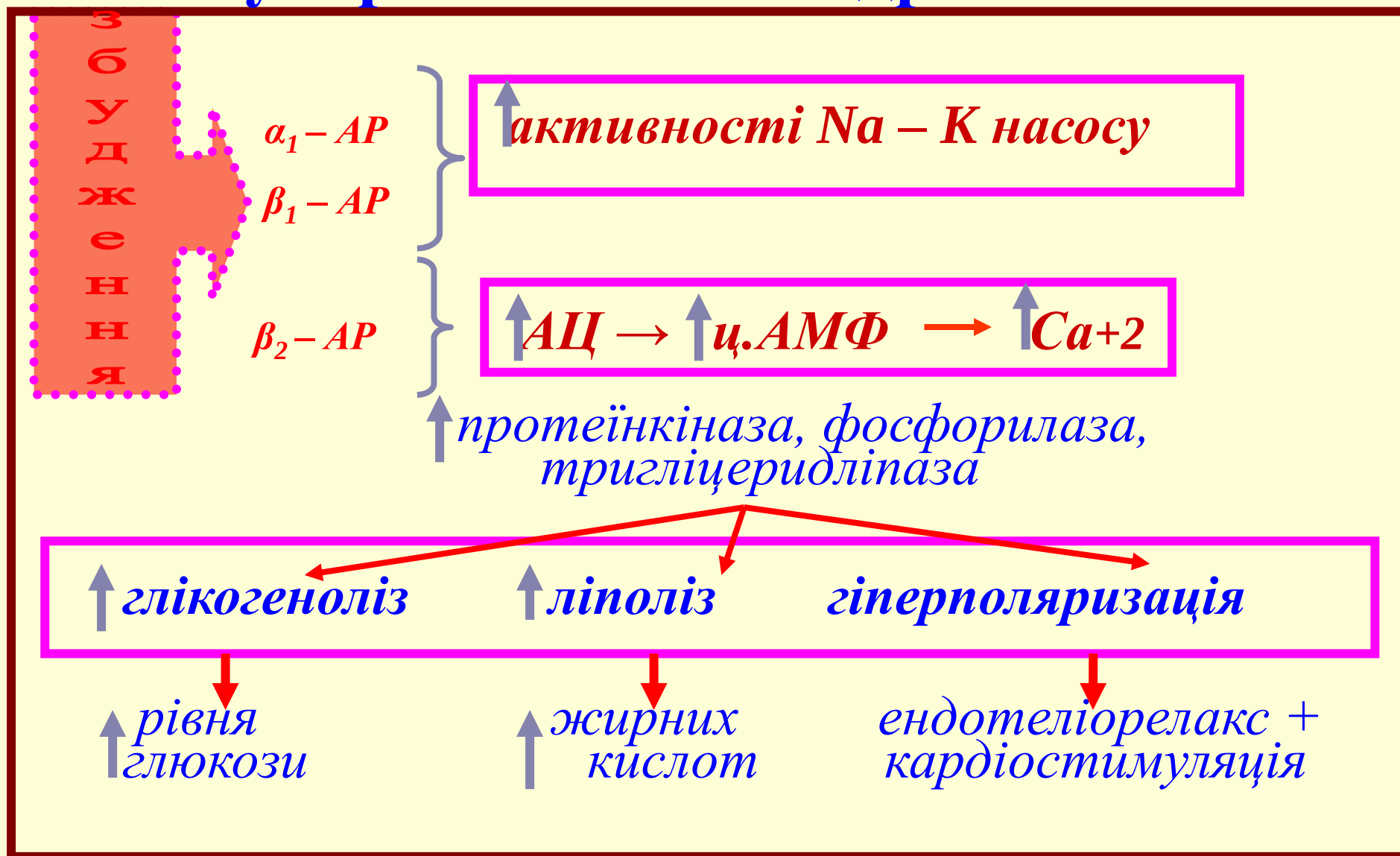
# Механізм адреноміметичної дії

Адреналін

ортодіоксибензол – фенілалкіламін  
- катехоламін



# Молекулярні механізми адреноміметиків

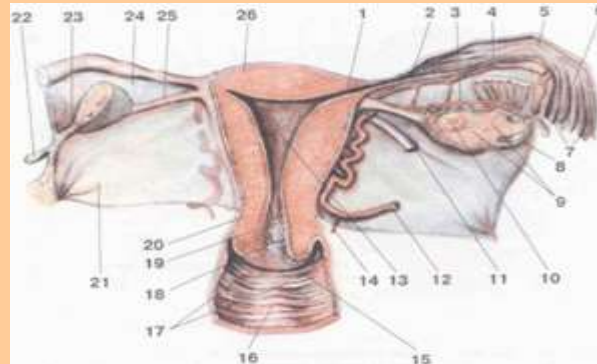


# Фармефекти Епінефрину

- Кардіостимулюючий
- Адреноміметичний
- Вазоконстрикторний
- Бронходилатуючий

- Мідріатичний
- Гіперглікемічний
- Гіперліпідемічний
- Токолітичний

## МАТКА



*невагітна*

↑ активність  $\alpha_1$

утеротонічний (↑ тонус)

*вагітна*

↑ активність  $\beta_2$

токолітичний (↓ тонус)



# Показання Епінефрину

- *Анафілактичний шок*
  - *Серцеві блокади та зупинка серця*
  - *Напади бронхіальної астми*
  - *Гіпоглікемічна кома*
  - *Пролонгування та посилення дії місцевих анестетиків (1 крапля на 5 мл анестетика)*
  - *Відкритокутова глаукома*
  - *Кон'юнктивіт, риніт*
- 

# Побічні ефекти Епінефрину

- Тахіаритмія
- $\uparrow$ АТ  $\longrightarrow$  набряк легень
- Ішемія, некроз органів
- Гіперглікемія,  $\downarrow$ інсуліну ( $\beta_2$  – АР)
- Синдром “рикошету” (бронхоспазм)
- Синдром “замикання” легень (набряк слизової бронхів)
- Синдром “німих легень” (ексудат у бронхах)

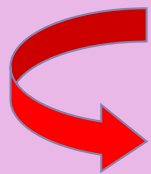


# Особливості Норепінефрину

Катехоламін –  $\alpha_{1-2}, \beta$ -адреноміметик

**В/В**

**Гіпертензивний ефект  
при судинному колапсі**



ПД: некроз тканин при п/шк і в/м введенні

**Заборонено при:**

ППК: кардіогенний шок, геморагічний шок,  
фторотанові аритмії



# Фармакологія Ефедрину

*Алкалоїд ефедри хвоцовой*

*Непрямий адреноміметик*

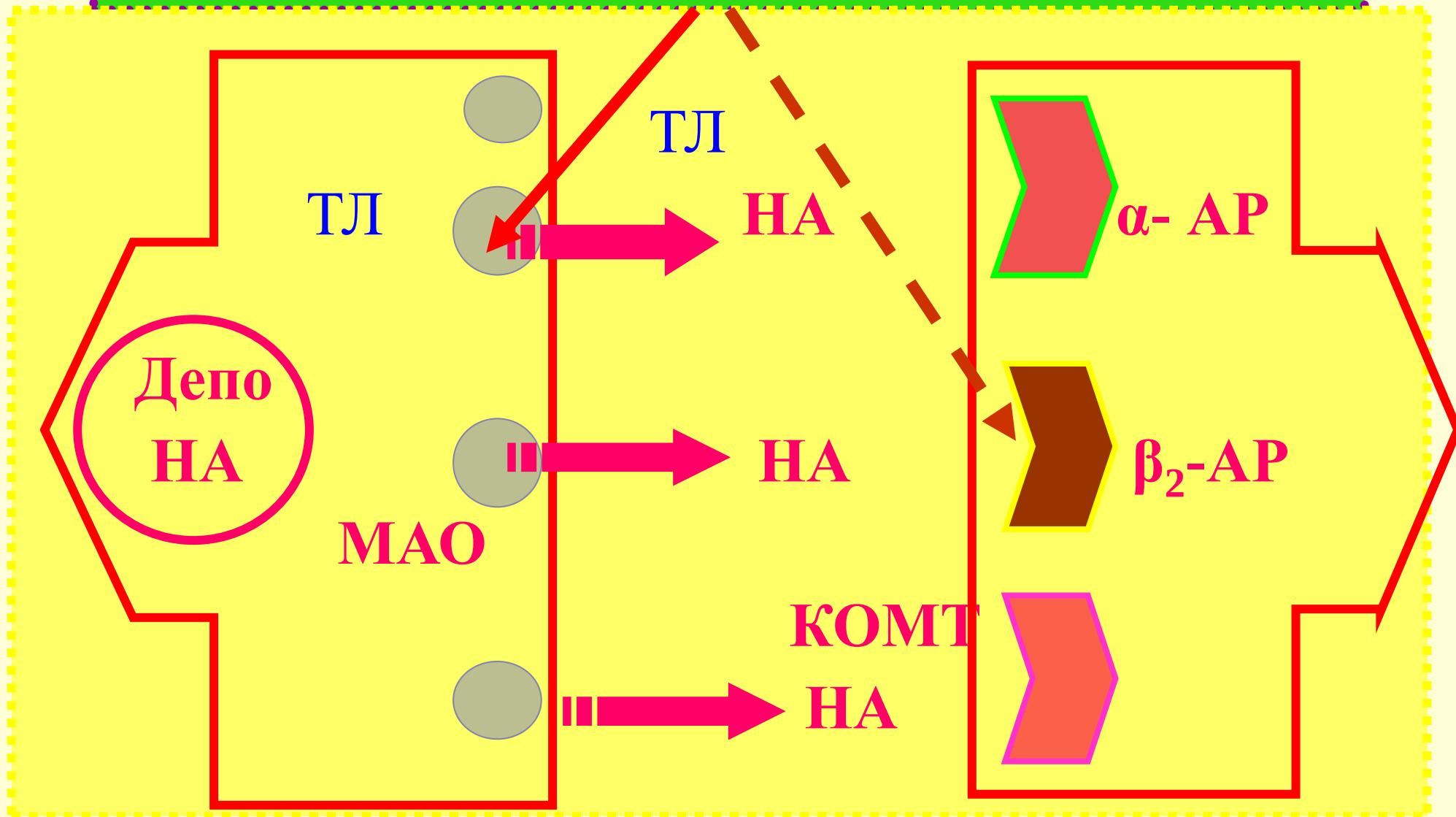
*Бронходілатуючий,  
психостимулюючий (наркотикоподібний)  
гіпертензивний*



*при бронхіальній астмі, гіпотонії, енурезі,  
отруєнні снодійними, наркотиками*

ПД: *безсоння, аритмії, тахіфілаксія*

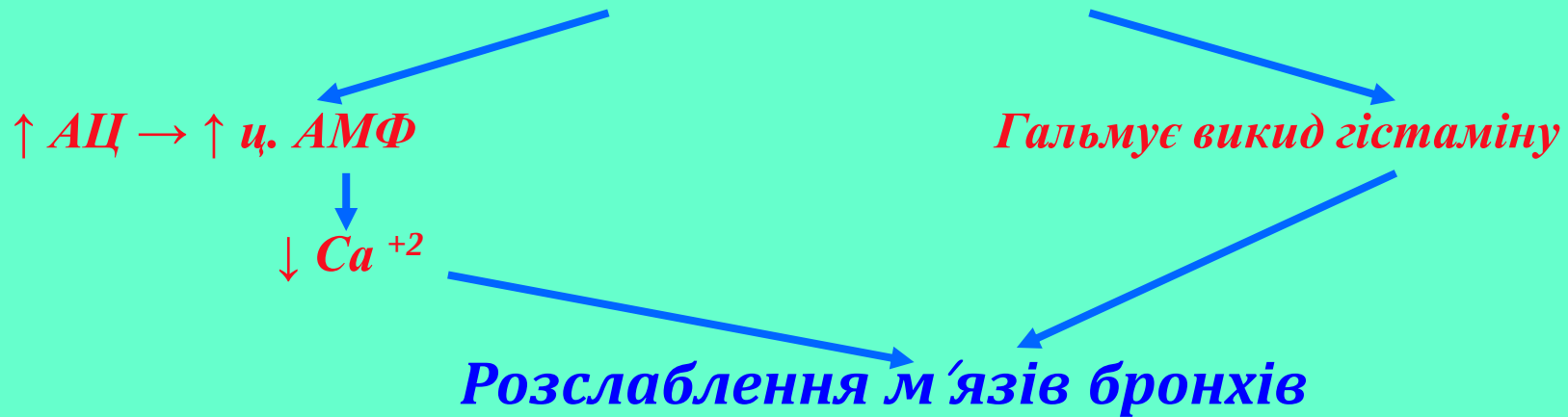
# Механізм дії ефедрину



# Особливості ізадрину

Аналог катехоламінів -  $\beta_1, \beta_2$  – адреноміметик

АНТИАРИТМІЧНИЙ, БРОНХОДІЛАТУЮЧИЙ, ГІПОТЕНЗИВНИЙ



ПК: БРОНХІАЛЬНА АСТМА, БЛОКАДИ СЕРЦЯ, БРАДІКАРДІЯ

ПД: АРИТМІЇ, ГІПЕРГЛІКЕМІЯ, ГІПОТОНІЯ

**сальбутамол**

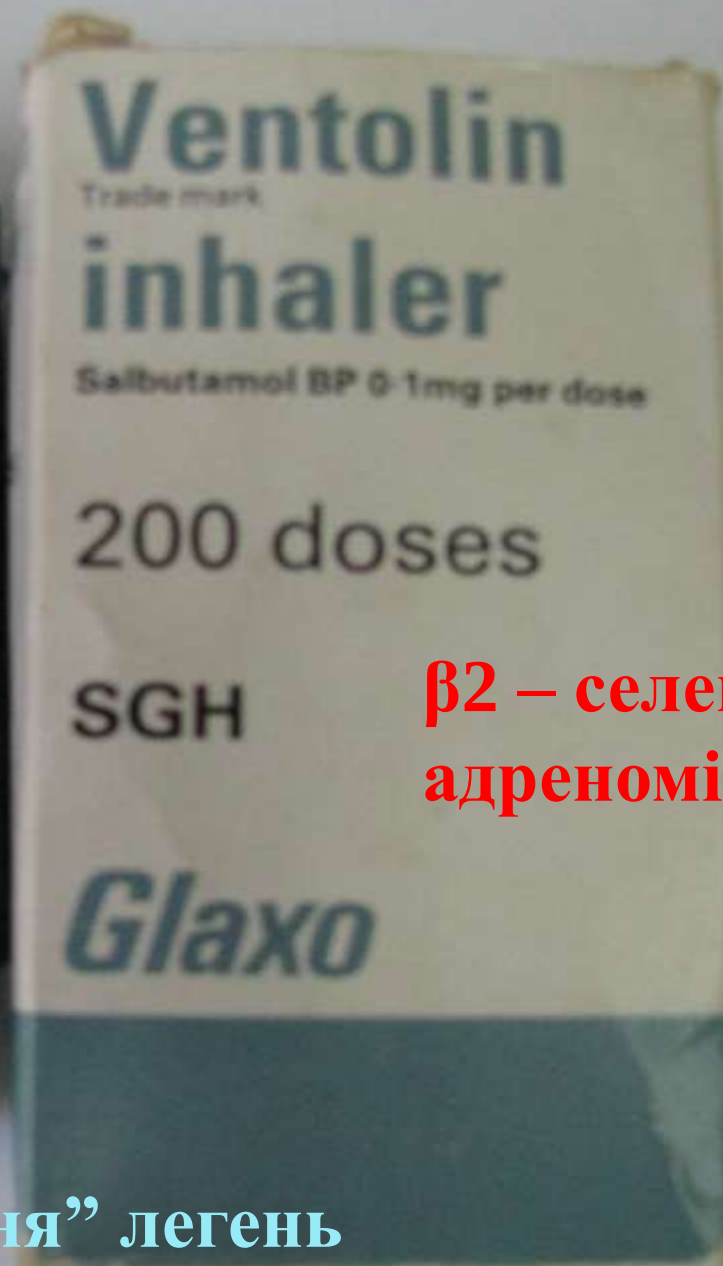
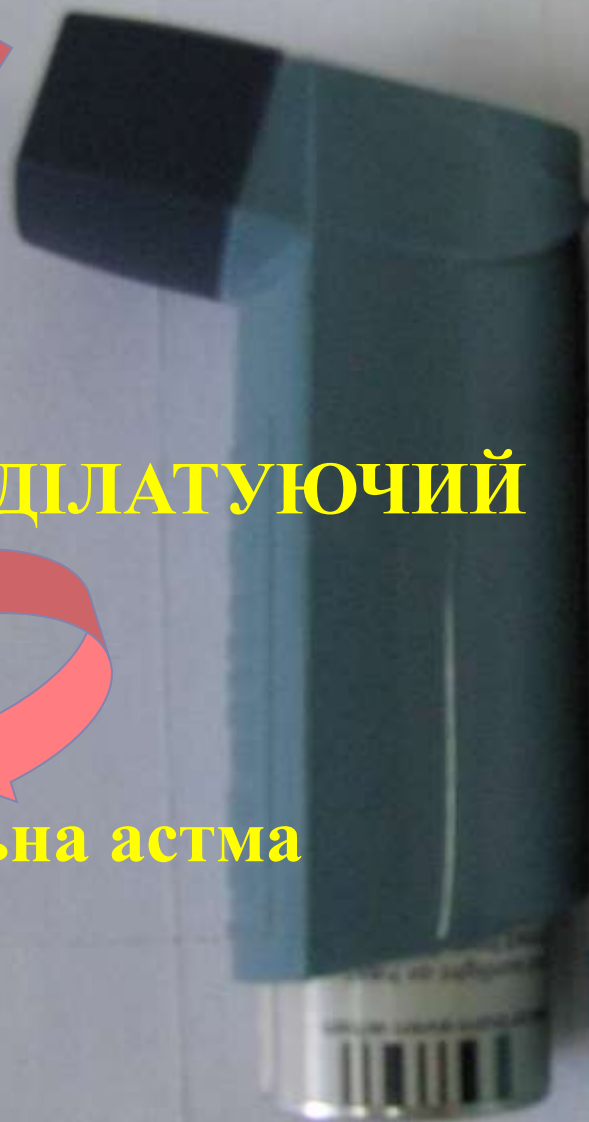


**БРОНХОДІЛАТУЮЧИЙ**



**бронхіальна астма**

**ПД: феномен “замикання” легень**



**$\beta$ 2 – селективний  
адреноміметик**

# Антиадренергічні засоби

**1. Альфа, бета-адреноблокатори:**  
**лабеталол (трандат), карведілол**

**2. Альфа-адреноблокатори:**

- дигідроерготамін
- тропафен
- фентоламіну гідрохлорид
- **празозин** (пратісол)
- доксазозин, теразозин
- ніцерголін (серміон)

# Антиадренергічні засоби

## 3. Бета-адреноблокатори:

- а) неселективні – анаприлін (пропранолол)
- б) селективні – метопролол, бісопролол, талінолол, атенолол, небіволол

## 4. Симпатолітики:

– резерпін, октадин, метилдофа



# ПРОПРАНОЛОЛ

$\beta_{1,2}$  – АДРЕНОБЛОКАТОР - індуктор мікросомального окислення

**ГІПОТЕНЗИВНИЙ, АНТИРЕНІНОВИЙ, АНТИАРИТМІЧНИЙ,  
АНТИАНГІНАЛЬНИЙ**

при **ГІПЕРТОНІЧНІЙ ХВОРОБИ, ТАХІАРИТМІЇ, СТЕНОКАРДІЇ,  
ФЕОХРОМОЦИТОМІ**

**ПД: БРОНХОСПАЗМ, ГІПОГЛІКЕМІЯ, КАРДІОБЛОКАДИ,  
ДЕПРЕСІЯ, ДИСПЕПСІЯ**

**ППК: БРОНХІАЛЬНА АСТМА,  
ЦУКРОВИЙ ДІАБЕТ**



# МЕТОПРОЛОЛ

**В1-селективний – АДРЕНОБЛОКАТОР**

**ГІПОТЕНЗИВНИЙ, АНТИАРИТМІЧНИЙ,  
АНТИАНГІНАЛЬНИЙ**



**при ГІПЕРТОНІЧНІЙ ХВОРОБІ,  
ТАХІАРИТМІЇ, СТЕНОКАРДІЇ**

**на фоні БРОНХІАЛЬНОЇ АСТМИ,  
ЦУКРОВОГО ДІАБЕТУ**





# НЕВІБОЛОЛ

$\beta 1$ -АБ +  $\uparrow$  NO (ERF)

вазоділатація

гіпотензія

антиагрегантність

люзітропність

(діастолічна кардіорелаксація)

ЕСЕНЦІАЛЬНА ГІПЕРТОНІЯ, ІХС



# ТЕСТ Крок 1

1. Лікар швидкої допомоги був викликаний до жінки 40-ка років з приводу нападу бронхіальної астми з явищами стенокардії, лікар ввів хворій належний препарат. Який із наведених препаратів найбільш ефективний для невідкладної допомоги?

**Сальбутамол**

Ефедрин

Адреналін

Атропін

Платифілін

2. Офтальмолог з діагностичною метою (розширення зіниць для огляду очного дна) використав 1% розчин мезатону. Мідріаз, викликаний препаратом, обумовлений:

**Активацією альфа1-адренорецепторів**

Активацією бета1-адренорецепторів

Активацією бета2-адренорецепторів

Блокадою бета1-адренорецепторів

Активацією М-холінорецепторів

