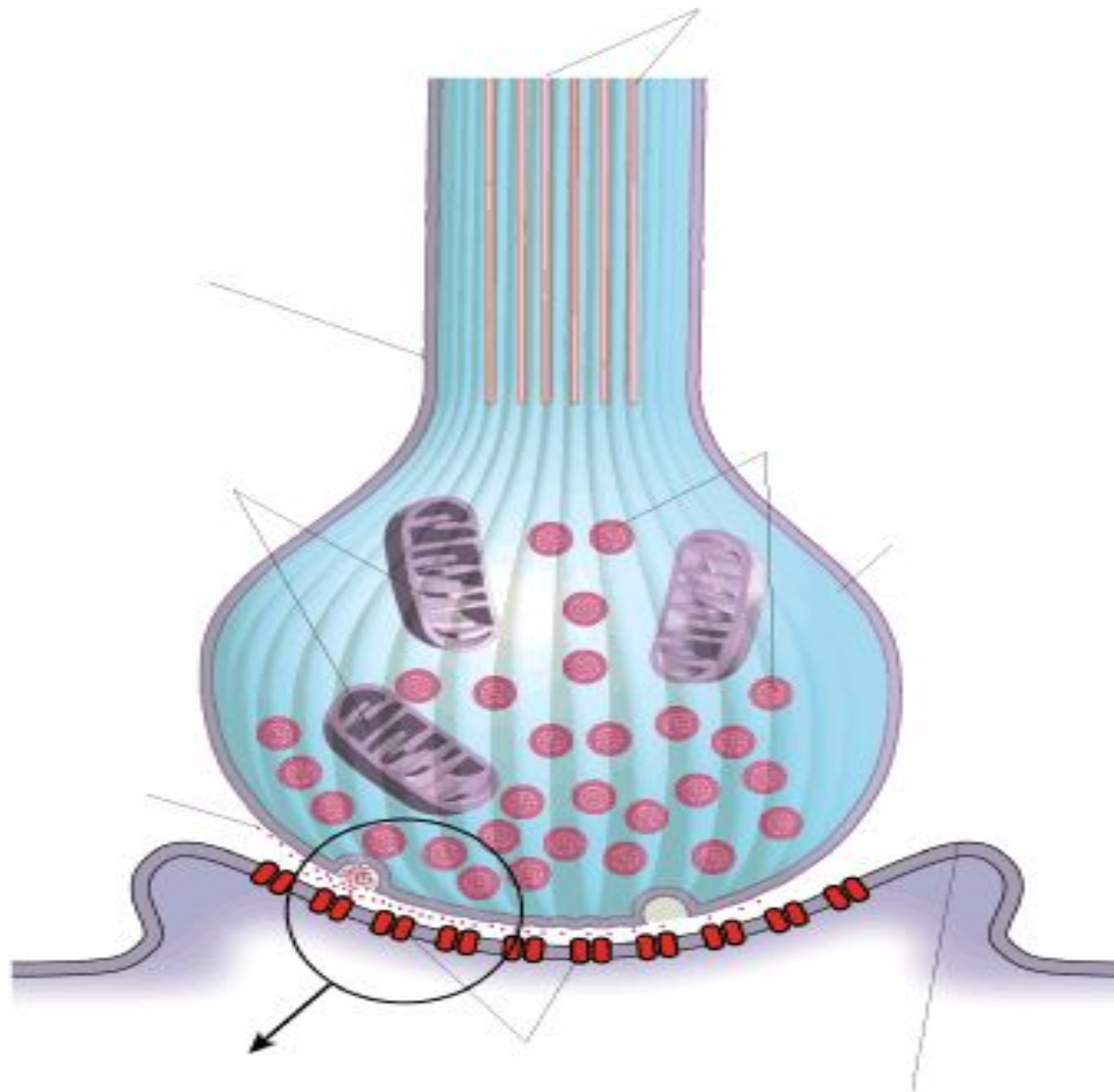
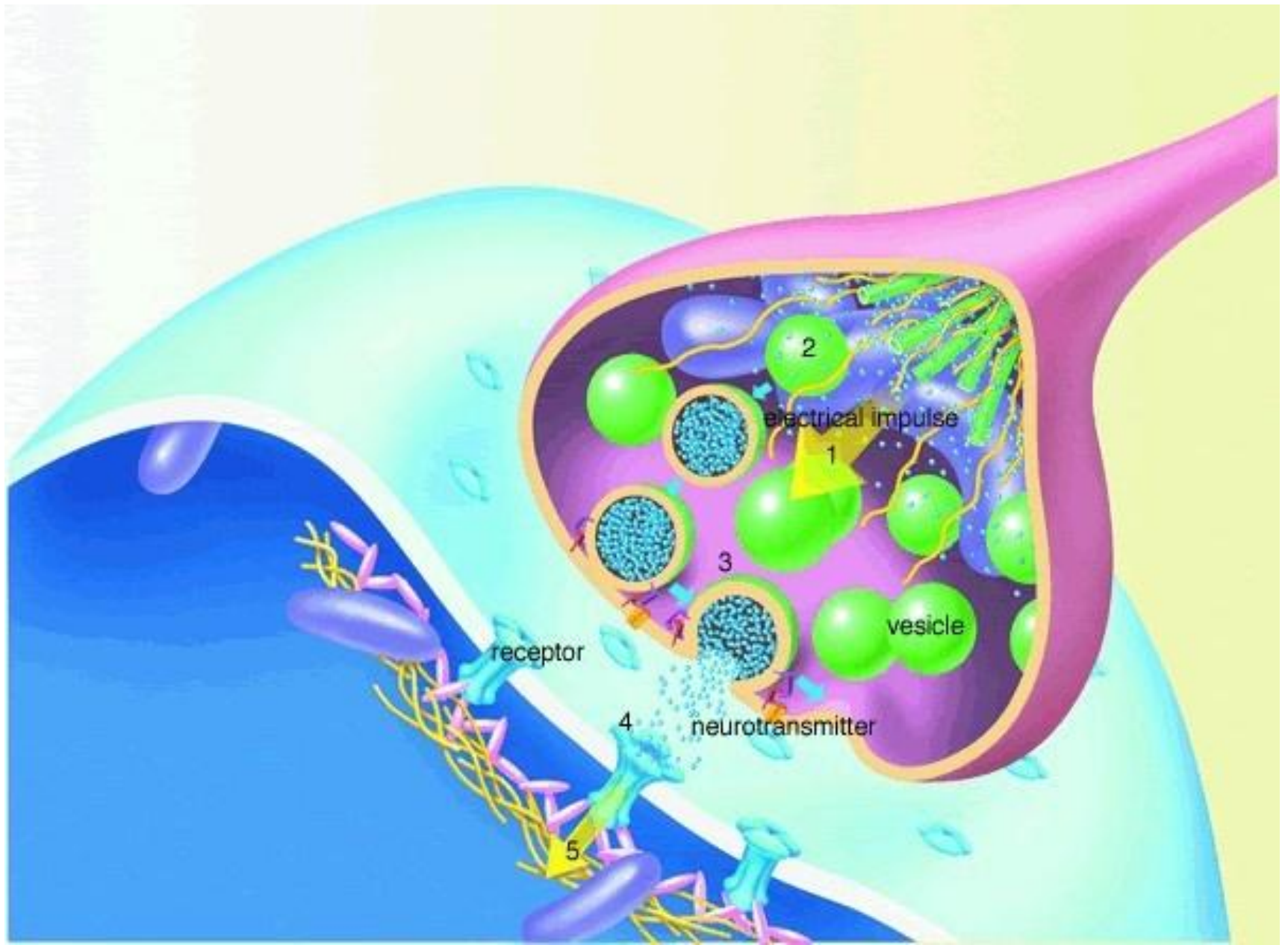
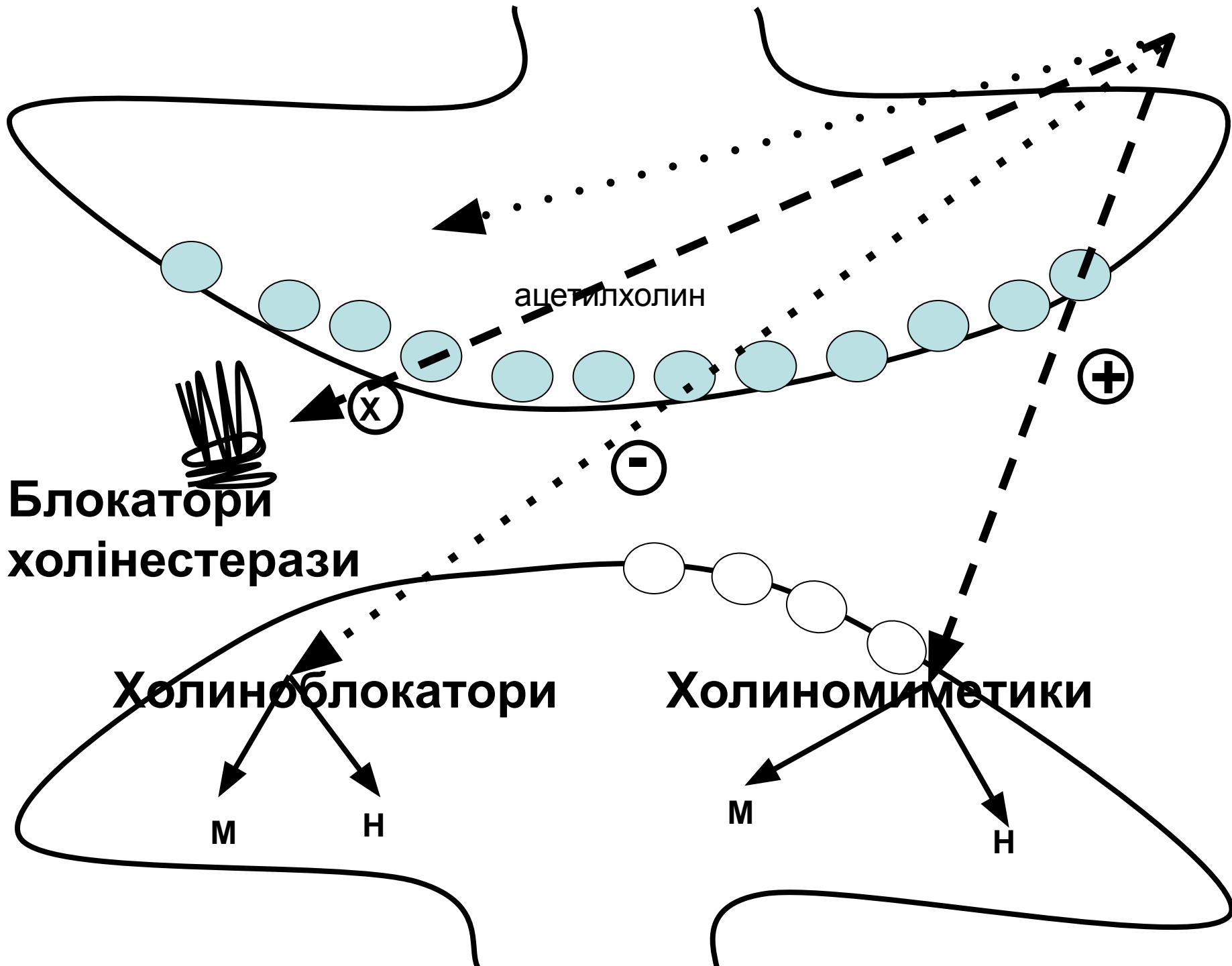


Handwritten text consisting of a yellow bracket above a green wavy line.







ацетилхолин

**Блокатори  
холинестерази**

**Холиноблокатори**

**Холиномиметики**

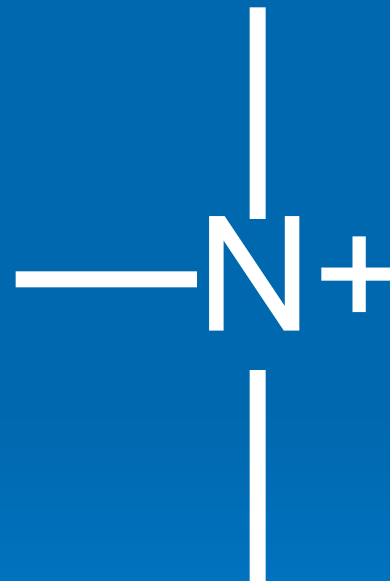
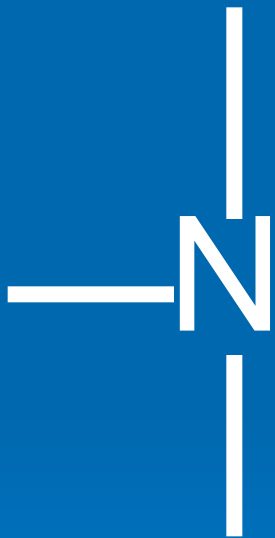
M

N

M

N

# Будова синаптичноактивних сполук



Третинна амонійна сполука

Четвертинна амонійна сполука

# Третинні сполуки:

- Добре всмоктуються в ШКТ
- Добре проникають через ГЕБ
- Мають периферичну та центральну дію
- Випускаються переважно в таблетках
- При передозуванні використовувати лише антидоти з центральною дією (також третинні сполуки)
- Зазвичай є алкалоїдами рослинного походження



# Четвертинні сполуки:

- Погано всмоктуються в ШКТ
- Погано проникають через ГЕБ
- Мають лише периферичну дію
- Випускаються переважно в ампулах
- При передозуванні використовувати лише антидоти з центральною та і периферичною дією
- Зазвичай є синтетичними сполуками

Рецептори, що знаходяться на післясинаптичній мембрані можуть активуватись алкалоїдом “**НІКОТИН**” чи алкалоїдом “**МУСКАРИН**”, тому вони мають назву нікотинхоліночутливі **Н-ХР** та мускаринхоліночутливі **М-ХР**.

речовини, яку підвищують нервову передачу у парасимпатичній нервовій системі називаються

***МІМЕТИКАМИ*** (підсилення передачі),

а які пригнічують передачу – називаються

***ЛІТИКАМИ (БЛОКАТОРАМИ)***

(пригнічення передачі)

# Засоби, що діють в парасимпатичній нервовій системі

- 1) М-,Н-холіноміметики
- 2) М-,Н- холіноблокатори
- 3) Антихолінестеразні засоби (непрямі Х-М)
- 4) М-холіноміметики
- 5) М-холіноблокатори
- 6) Н-холіноміметики
- 7) Н-холіноблокатори
  - а) гангліоблокатори
  - б) міорелаксанти

□ **1) М-,Н-холіноміметики**

(ацетилхолін, карбахолін);

□ **2) М-,Н- холіноблокатори**

(амізил, циклодол);

□ **3) Антихолінестеразні засоби**

*(непрямі М-, Н-холіноміметики)*

прозерин

IV структура

піридостигміну бромід

IV структура

галантаміну гідробромід

III структура

фізостигмину салицилат

III структура

фосфакол (фосфорорганічна сполука)

□ **4) М-холіноміметики**

(пілокарпін, ацеклідін);

□ **5) М-холіноблокатори**

(атропіну, платифіліну, скополаміну, метацин, іпратропій, пірензепін);

□ **6) Н-холіноміметики** (цититон, лобелін);

□ **7) Н-холіноблокатори**

а) гангліоблокатори (бензогексоній, пірілен, пентамін, гігроній, арфонад);

б) міорелаксанти (тубокурарин, пипекуроній, верокуроній, рокуроній, дитилін, меліктин).

# Мускаринові рецептори знаходяться в:

- ЦНС
- Серцево-судинна система
- Судини
- Гладенькі м'язи ШКТ
- Сфінктери ШКТ
- Секреторні залози шлунку
- Бронхи
- Залози зовнішньої секреції(шлункові, кишечні, бронхіальні, слинні, підшлункової залози)
- Орган зору

# Нікотинові рецептори знаходяться в:

- ЦНС
- Автономні ганглії
- Синокаротидна зона
- Наднирники(мозковий шар)
- Нервово-м'язова передача

# Клінічні прояви М-холіміметиків

- Брадикардія, блокується провідність
- Підвищується тонус гладеньких м'язів бронхів
- Розширення судин, головним чином шкіри і слизових оболонок
- Підвищується перистальтика і відбувається розслаблення сфінктерів
- Підвищується секреція усіх залоз зовнішньої секреції



# Засоби, що підсилюють нервову передачу у парасимпатичній НС

## 1) М-,Н-ХОЛІНОМІМЕТИКИ

- (Ацетилхолін, карбахолін);

## 2) АНТИХОЛІНЕСТЕРАЗНІ ЗАСОБИ

(непрямі М-, Н-холіноміметики)

- Неостигміну метилсульфат ІҮ структура
- Піридостигміну бромід ІҮ структура
- Галантаміну гідробромід ІІІ структура
- Фізостигміну саліцилат ІІІ структура
- Фосфакол, армін (фосфорорганічна сполука - ФОС)

## 3) М-ХОЛІНОМІМЕТИКИ

- (пілокарпін, ацеклідін);

## 4) Н-ХОЛІНОМІМЕТИКИ

- (цитітон, лобелін, нікотин);

# Засоби, що пригнічують нервову передачу у парасимпатичній НС

## 1 М-,Н- ХОЛІНОБЛОКАТОРИ

- (амізил, циклодол);

## 2 М-ХОЛІНОБЛОКАТОРИ

- (атропін, платифілін, скополамін, метацин, іпратропію бромід, пірензепін);

## 3 Н-ХОЛІНОБЛОКАТОРИ

### *а) гангліоблокатори*

- (бензогексоній, пірілен, пентамін, гігроній, арфонад);

### *б) міорелаксанти*

- (тубокурарину, пипекуроній, верокуроній, рокуроній, дитилін, меліктин).

# КЛАСИФІКАЦІЯ АНТИХОЛІНЕСТЕРАЗНИХ

## 1. ЗВОРОТНОЇ ДІЇ

- Неостигміну метилсульфат (прозерин)
- піридостигміну бромід
- галантаміну гідробромід
- фізостигміну саліцилат

## 2. НЕЗВОРОТНОЇ ДІЇ

- фосфакол (фосфорорганічна сполука - ФОС), армін

# КЛАСИФІКАЦІЯ АНТИХОЛІНЕСТЕРАЗНИХ

препарат	Структура	Походження	Проникнення в ЦНС	Дія
неостигмін	IV	Синтет.	-	Периферична
піридостигмін у бромід	IV	Синтет.	-	Периферична
галантаміну гідробромід	III	Алкалоїд	+	Центральна+ периферична
фізостигміну саліцилат	III	Алкалоїд	+	Центральна+ периферична

# Показання до застосування холіноміметиків(антихолінестеразних)

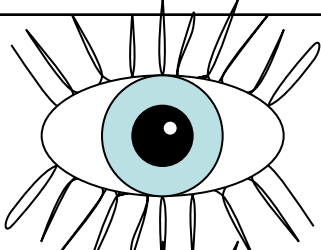

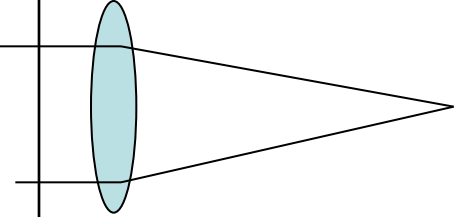
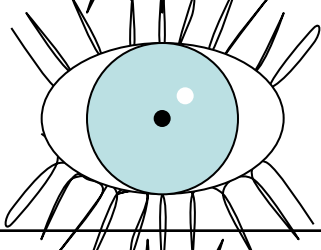
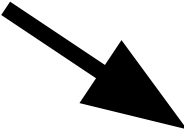
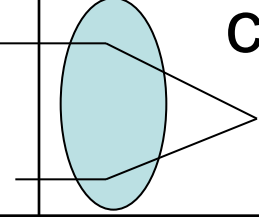
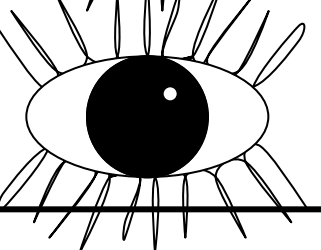
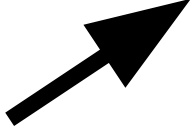
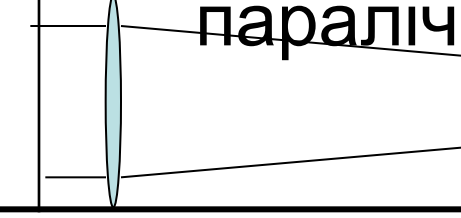
- параліч, парези центрального походження, глаукома, міастенія, атонія кишківника та сечового міхура, приступи пароксизмальної тахікардії, обстипація, копростаз,
- передозування міорелаксантами – тубокурарином и діплацином,
- при укусах змій (кобра)

Реактиватори холінстерази - препарати, що відновлюють активність ферменту після її пригнічення ФОС.

### Класифікація реактиваторів холінстерази

- Діпироксим - ІҮ
- Алоксим - ІҮ
- Ізонітрозин - ІІІ
- Діетиксим - ІІІ

# Вплив МХ-міметиків і МХ-блокаторів на орган зору

	Зіниця	Внутрішньо очний тиск	Фокусна віддаль
Інтактний		$N_{\text{орма}}$ 	
М-холіноміметики			 спазм
М-холіноблокатори			 параліч







# Клінічна картина отруєння міметиками (мускарин, ФОС)

- Збудження ЦНС
- Міоз (звуження зіниці)
- Профузне повиділення, салівація
- Бронхорея, бронхоспазм
- Кишкові коліки, тенезми, діарея,
- Брадикардія, гіпотензія (інколи)
- Почервоніння шкіри лица, та інших частин тіла
- На дотик шкіра волога та холодна
- Смерть настає від асфіксії
- (стійка деполяризації міжреберних дихальних м'язів, що призводить до їх паралічу)

# Лікування отруєнь мускарином, ФОС

- Загально відомі заходи по зменшенню отрути в організмі (промивання поверхні шкіри розчином соди, адсорбуючі, послаблюючі, сифонні клізми)
- При попанні у кров ФОС – застосування М-холіноблокаторів, реактиваторів холінестерази, які вводять парентерально.
- У зв'язку з виділення великої кількості слини, бронхіального секрету необхідно забезпечити прохідність дихальних шляхів.
- Симптоматична терапія

# Класифікація М-Х-блокаторів

## ЦЕНТРАЛЬНОГО ТИПУ ДІЇ

Атропін

Платифілін

Скополамін

Вплив на ЦНС

(має седативну дію)

## ПЕРИФЕРИЧНОГО ТИПУ ДІЇ

Метацин

Іпратропію бромід

Тіотропію бромід

Травентол

Пірензепін(селективний  $M_1$ -холіноблокатор)

# КЛІНІЧНІ ПРОЯВИ МХ-БЛОКАТОРІВ

- Пригнічення секреції усіх залоз зовнішньої секреції
- Пригнічення секреції слинних залоз та бронхіальних
- Розслаблення гладеньких м'язів бронхів
- Розслаблення гладеньких м'язів ШКТ
- Спазмолітична дія на жовчний міхур та сечовивідний канал
- Викликають тахікардію , але на провідність міокарду не впливають
- Мають слабку жовчогінну дію

# ПОКАЗАННЯ ДО ЗАСТОСУВАННЯ М - ХОЛІНОБЛОКАТОРІВ

Дослідження очного дна\*, травма очей,  
премедикація,  
колька печінкова та ниркова,  
при отруєнні ФОС разом с діпіроксимом,  
при синусовій брадикардії,  
для пониження секреції шлунка та кислотності  
шлункового соку\*\*,  
при хворобі Паркінсона.

\* у зв'язку з дуже тривалим періодом порушення акомодатії (8-12 днів) запропоновані препарати з більш коротким терміном впливу на окоматропін - L - 15 –20 ч і тропікамід – L - 2-6 ч.

\*\* доза, яка необхідна для пониження секреції залоз шлунка, неминуче викликає побічні ефекти

# Дурман



Дурман  
обыкновенный



# Красавка



КРАСАВКА (Белладонна) (11 ФЕВРАЛЯ - 19 ФЕВРАЛЯ)

# Блекота





# КЛІНІЧНА КАРТИНА ОТРУЄННЯ М-ХОЛІНОБЛОКАТОРАМИ(атропін)

- Спочатку збудження ЦНС, а потім пригнічення
- Сухість у роті, сильна спрага
- Тахікардія
- Мідріаз, фотофобія
- Шкіра на дотик суха, гаряча
- Температура тіла підвищена
- Смерть настає внаслідок зупинки дихання, що має центральне походження (параліч дихального та судиннорухового центру).

# Лікування отруєнь атропіном

- Заходи по виділенню отрути, який ще не всмоктався з організму(промивання шлунку, введення таніну та адсорбентів, призначення сольових проносних)
- Застосування заходів для прискорення виведення з організму отрути(форсований діурез, гемосорбція)
- Використання фізіологічних антагоністів (антихолінестеразних, проникають через ГЕБ)
- Проведення заходів по зниженню температури тіла
- Пацієнта помістити у затемненне приміщення

**М'ЯЗЕВІ РЕЛАКСАНТИ** – препарати, що використовуються при проведенні хірургічних втручань(курареподібні та деполяризуючі).

**Препарати** застосовують при операціях на органах грудної клітки, черевної порожнини, на верхніх та нижніх кінцівках; при інтубації трахеї, вправлення вивихів, репозиція кісток при переломах, лікування правця, при електросудомній терапії .

# КЛАСИФІКАЦІЯ М'ЯЗОВИХ РЕЛАКСАНТІВ

## 1. АНТИДЕПОЛЯРИЗУЮЧОЇ ДІЇ:

### *а) бензилхіноліни:*

- тубокурарину хлорид;
- атракурія бесилат (тракриум);
- мівакуронію бромід (мівакрон),

### *б) аміностероїди:*

- піпекуронію бромід (ардуан);
- векуроній (норкурон);
- рокуронію бромід (есмерон);
- панкуронію бромід (павулон).

## 2. ДЕПОЛЯРИЗУЮЧОЇ ДІЇ:

- суксаметонію бромід (дитилін, лістенон, сукцинілхолін).

## 3. ЗМІШАНОЇ ДІЇ:

- діоксоній.

# Класифікація м'язових релаксантів за тривалістю дії

## **1. КОРОТКОЧАСНОЇ ДІЇ (5-10 ХВ.)**

- дитилін
- мівакуроній

## **2. СЕРЕДНЬОЇ ТРИВАЛОСТІ ДІЇ (20-30 ХВ.)**

- атракурія бесилат
- венкуроній
- рокуронія бромід

## **3. ТРИВАЛОЇ ДІЇ (30-40 ХВ. І БІЛЬШЕ)**

- тубокурарину бромід
- піпекуронію бромід
- панкуронію бромід.

# тубокурарин

Антидеполяризуєчий міорелаксант (істинний блокатор) – блокує Н-холінорецептори на ПС мембрані.

Послідовність блокади м'язів: дрібні м'язи пальців, рук та ніг, вух та очей, м'язи кінцівок, шиї, тулуба, міжреберні м'язи, остання блокується діафрагма. Смерть настає від асфіксії.

У великих дозах блокує ганглії та мозковий шар наднирників.

Тубокурарин є гістамінолібератором і може викликати бронхоспазм, при повторному введенні препарат кумулює.

Не проникає через плацентарний бар'єр та через ГЕБ, не всмоктується у ШКТ.

Аміноглікозиди потенціюють дію препарату.

Абсолютним протипоказанням до введення тубокурарину є **міастенія**.

Антидотом при передозуванні препарату є антихолінієстерзні препарати (неостигміну метилсульфат).

# Сукцинілхолін (дитилін)

- Викликає стійку деполяризацію ПС мембрани протягом 5-7 хв.
- Руйнується псевдохолінестеразою крові
- Викликає брадикардію та підвищення АТ (стимуляція Н-ХР кори наднирників)
- Дія препарату не змінюється при одночасному прийому антибіотиків
- Антидотом при передозуванні сукцинілхлориду (дитиліну) є переливання крові, або введення донорської плазми

# Гангліоблокатори

- **Benzohexonium**
- **Pirilenum**
- **Repiria iodidum /Hygronium/**
- **Azamethonii bromide /Pentaminum/**
- **Arfonad**



# Trepirium iodidum /Hygronium/

- Має четвертину структуру, не проникає через ГЕБ
- Початок дії – 2-3 хв., тривалість 10-20 хв.

Застосовують при:

- гіпертонічній кризі
- для керованої гіпотензії
- при набряку легень