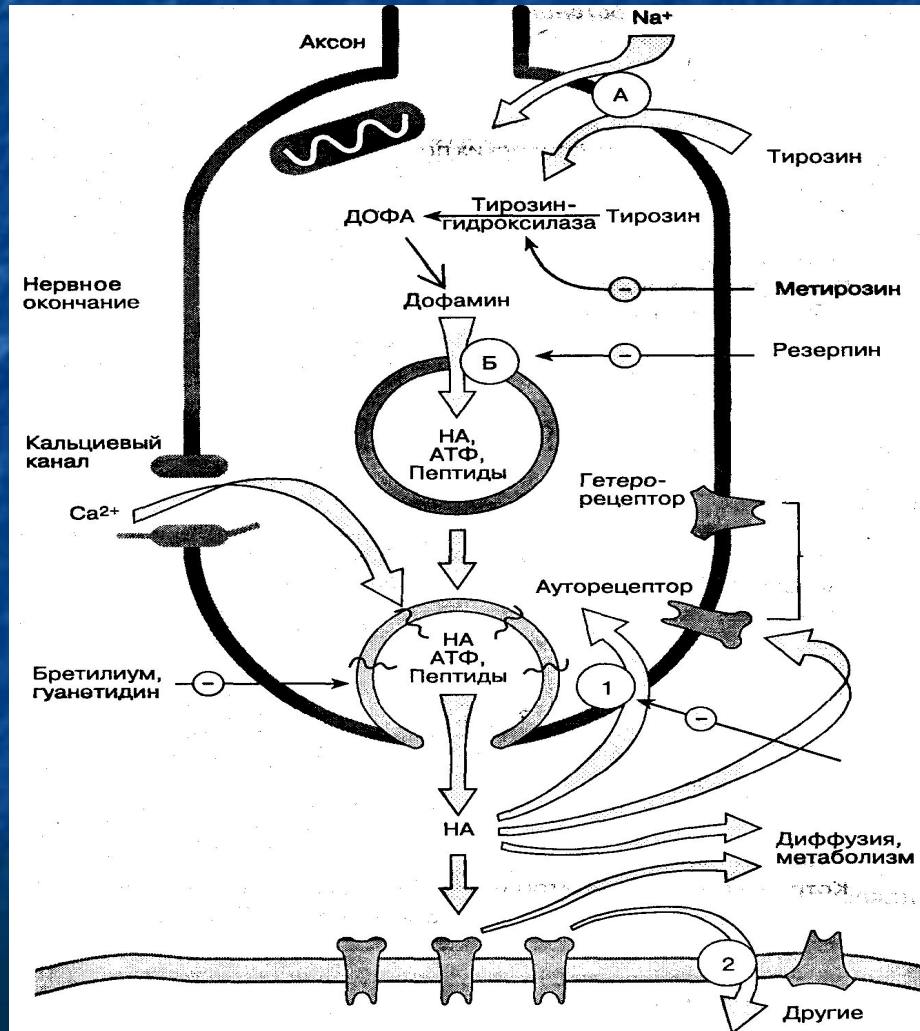


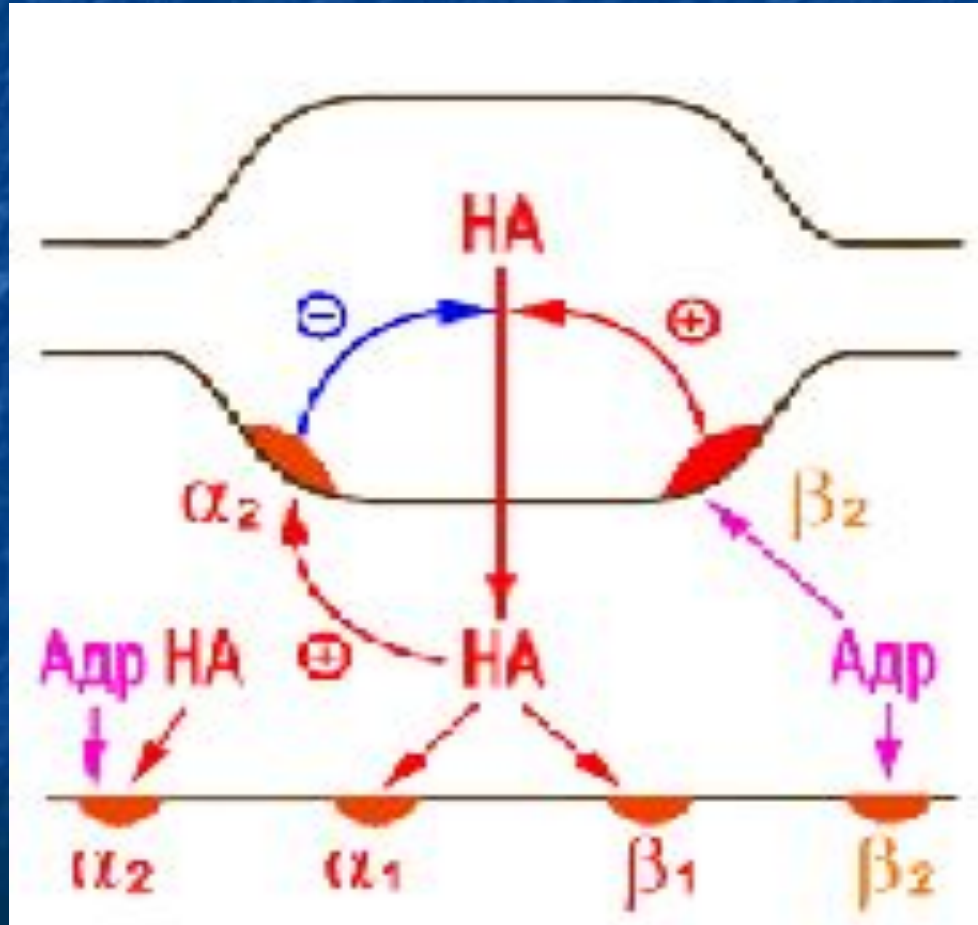
**ВЕЩЕСТВА, ВЛИЯЮЩИЕ НА  
АДРЕНЕРГИЧЕСКУЮ  
ИНЕРВАЦИЮ**

**АДРЕНОМИМЕТИКИ  
СИМПАТОМИМЕТИКИ**

# АДРЕНЕРГИЧЕСКИЙ СИНАПС



# ЛОКАЛИЗАЦИЯ АДРЕНОРЕЦЕПТОРОВ



**После высвобождения медиатора в межсинаптическую щель он может:**

- **Взаимодействовать с адренорецепторами**
- **Разрушаться КОМТ**
- **Подвергаться пренейрональному захвату и пополнять депо**
- **Разрушаться в аксоплазме нервного волокна (МАО)**
- **Подвергаться экстронейрональному захвату тканями в том числе попадать в кровяное русло, где он разрушается МАО и КОМТ**

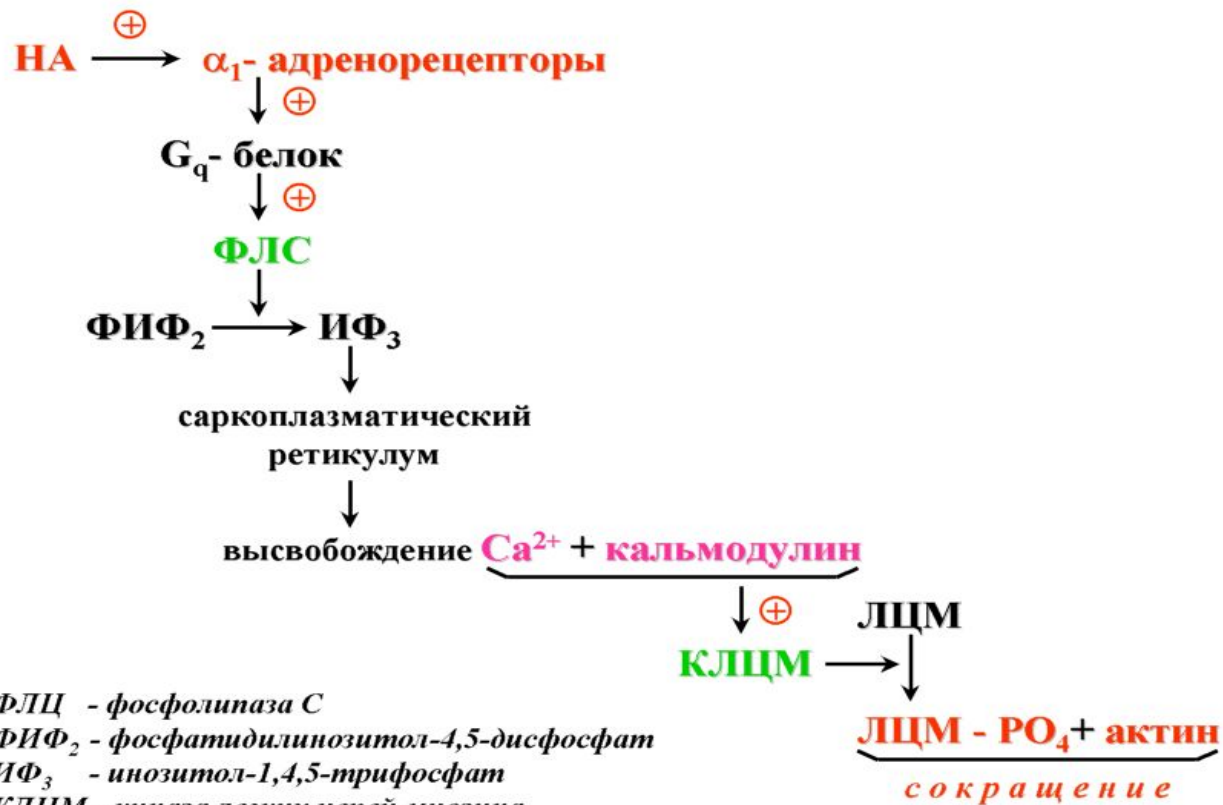
# КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНОРЕЦЕПТОРОВ



# $\alpha_1$ адренорецепторы

Локализация Исполнительные органы	Эффекты
<p><u>Расположены только постсинаптически</u></p> <ul style="list-style-type: none"><li>• <i>Сосуды (кожи, слизистых, почек, сосуды по ходу чревного нерва)</i></li><li>• <i>Трабекулы селезенки</i></li><li>• <i>Радиальная мышца зрачка</i></li><li>• <i>Кишечник</i></li><li>• <i>Сфинктеры ЖКТ</i></li><li>• <i>Миометрий</i></li><li>• <i>Мышцы, поднимающие волосы</i></li><li>• <i>Мышцы задней стенки глаза</i></li><li>• <i>Слюнные железы</i></li></ul>	<ul style="list-style-type: none"><li>↑ <i>Сужение</i></li><li>↑ <i>Сокращение капсулы селезенки и выброс депонированной крови</i></li><li>↑ <i>Мидриаз</i></li><li>↓ <i>Снижение тонуса и моторики</i></li><li>↑ <i>Сокращение сфинктеров</i></li><li>↑ <i>Сокращение миометрия</i></li><li>↑ <i>Сокращение мышц</i></li><li>↑ <i>Экзофтальмия</i></li><li>↑ <i>Повышение секреции</i></li></ul>

# Стимуляция $\alpha_1$ -адренорецепторов

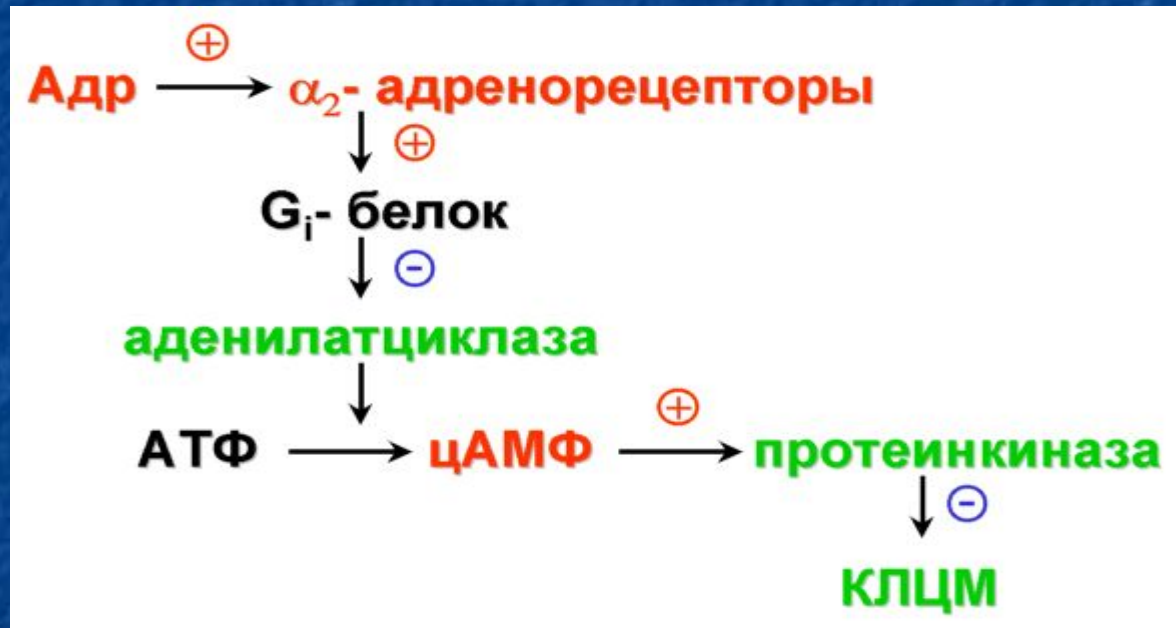


# $\alpha_2$ адренорецепторы

Локализация	Эффекты
<p><i>Пресинаптическая мембрана</i></p> <ul style="list-style-type: none"><li><i>· Неиннервируемый (внутренний) слой сосудов</i></li><li><i>· Тромбоциты</i></li></ul> <p><i>ЦНС</i></p>	<p><i>Отвечают за обратную отрицательную связь – торможение высвобождения НА в межсинаптическую щель</i></p> <p><i>Сужение сосудов</i></p> <p><i>Агрегация тромбоцитов</i></p> <p><i>Успокоение, анальгезия, угнетение структур, активирующих с.с.с. → ↓ АД</i></p>



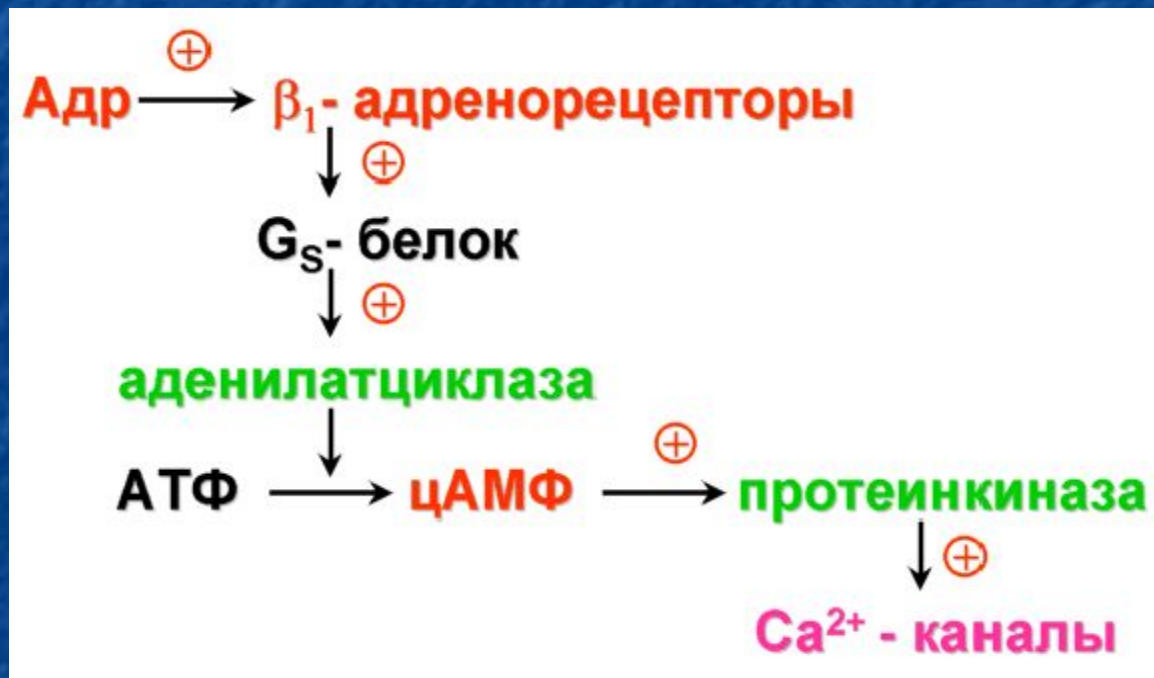
# Стимуляция $\alpha_2$ -адренорецепторов



# $\beta_1$ адренорецепторы

Локализация Исполнительные органы	Эффекты
<p data-bbox="112 606 879 654"><u>Постсинаптическая мембрана</u></p> <ul data-bbox="112 792 396 1220" style="list-style-type: none"><li data-bbox="112 792 280 842">• Сердце</li><li data-bbox="112 1178 396 1220">• Кишечник</li></ul>	<p data-bbox="985 671 1758 778">↑ сократимости, возбудимости, проводимости →</p> <p data-bbox="985 792 1748 971">↑ потребность миокарда в O<sub>2</sub> т.е.- ↑ ч.с.с., ↑ сила с.с., ↑ V<sub>min</sub>, АДсист.</p> <p data-bbox="985 1178 1497 1235">↓ тонуса и моторики</p>

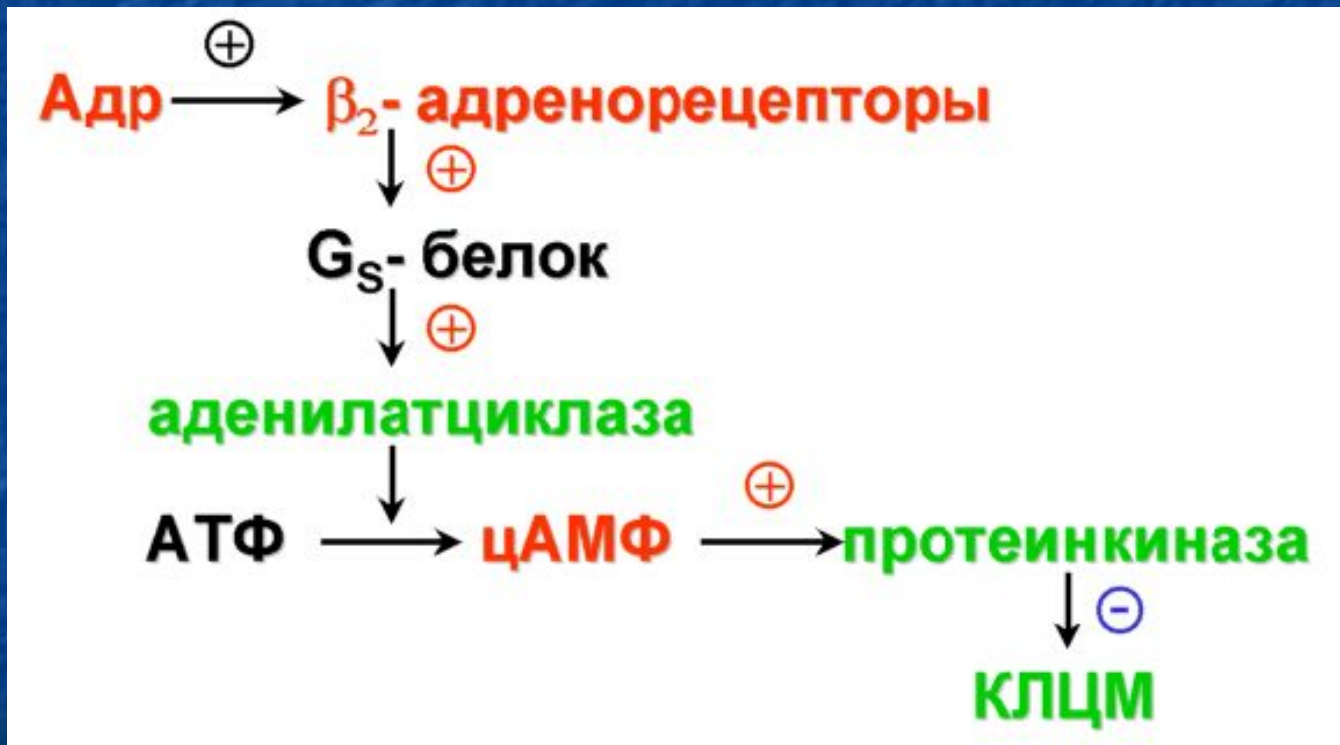
# Стимуляция $\beta_1$ -адренорецепторов



# $\beta_2$ адренорецепторы

<b>Локализация</b> <b>Исполнительные органы</b>	<b>Эффекты</b>
<p><u>Постсинаптическая мембрана</u></p> <ul style="list-style-type: none"><li>• <i>Сосуды</i> (скелетной мускулатуры, мозга, легких, печени)</li><li>• <i>Бронхи</i></li><li>• <i>Миометрий</i></li><li>• <i>Мочевой пузырь</i></li><li>• <i>Печень</i></li> <li>• <i>Тромбоциты</i></li></ul>	<p>↓ <i>Расширение сосудов</i></p> <p>↓ <i>Тонуса бронхов</i></p> <p>↓ <i>Тонуса матки</i></p> <p>↓ <i>Тонуса мочевого пузыря</i></p> <p>↑ <i>Гликогенолиза, ↑ уровня глюкозы в крови</i></p> <p>↓ <i>агрегации</i></p>
<p><u>Пресинаптическая мембрана</u></p>	<p><i>Отвечают за обратную положительную связь – стимуляцию высвобождения НА в межсинаптическую щель</i></p>

# Стимуляция $\beta_2$ -адренорецепторов



# $\beta_3$ адренорецепторы

Локализация Исполнительные органы	Эффекты
<u>Постсинаптическая мембрана</u>  • <i>Адипоциты жировой ткани</i>	$\uparrow$ <i>Липолиза, <math>\uparrow</math> термогенеза</i>

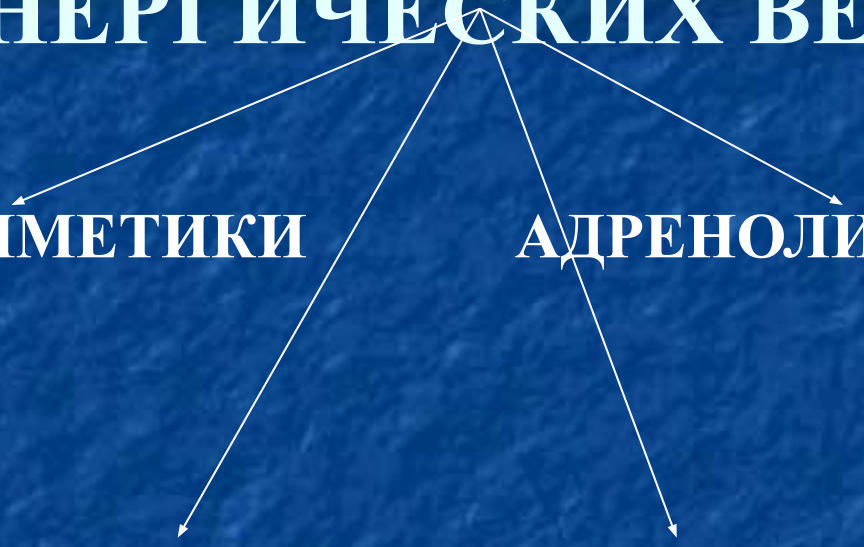
# КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНЕРГИЧЕСКИХ ВЕЩЕСТВ

АДРЕНОМИМЕТИКИ

АДРЕНОЛИТИКИ

СИМПАТОМИМЕТИКИ

СИМПАТОЛИТИКИ



# КЛАССИФИКАЦИЯ АДРЕНОМИМЕТИКОВ





# $\alpha\beta$ - адреномиметики

- Эпинефрин (адреналин)
- Норэпинефрин (норадоеналин)

# ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА

## СЕРДЦЕ ( $\beta_1$ -адренорецепторы)

- ↑ возбудимости синусового узла (тахикардия)
  - ↑ сократимости миокарда
  - ↑ проводимости
  - ↑ работы сердца → ↑ потребности миокарда в кислороде
- Столкновение двух медиаторов АХ и НА → аритмии
  - ↑ возбудимости и проводимости –  $\rightarrow$  прямое действия
  - ↑ тонуса блуждающего нерва – рефлекторное
    - конечный результат зависит от дозы

## СОСУДЫ

- стимуляция  $\alpha_1$   $\alpha_2$  -адренорецепторов → сужение сосудов кожи, слизистых, сосудов по ходу чревного нерва, почек
- стимуляция  $\beta_2$  рецепторов → расширение сосудов скелетной мускулатуры, мозга, легких, печени

## АД

- ↑ АД систолического
- ↓ АД диастолического

# ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА

## СЕРДЦЕ ( $\beta_1$ -адренорецепторы, $\beta_2$ -адренорецепторы )

- ↑возбудимости синусового узла → ↑ч.с.с.-тахикардия  
↑сократимости миокарда → ↑ работы сердца → ↑ ударного выброса → резкое ↑ минутного выброса → ↑ давления в дуге аорты → возбуждение механо рецепторов → стимуляция блуждающего нерва → замедление работы сердца → тахикардия сохраняется, но менее выражена
- ↑ работы сердца → ↑потребности миокарда в кислороде
- Столкновение двух медиаторов АХ и НА → аритмии  
↑ возбудимости и проводимости – прямое действие  
↑ тонуса блуждающего нерва – рефлекторное



кончный результат зависит от дозы

# ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА

## СОСУДЫ

- стимуляция  $\alpha_1$   $\alpha_2$  -адренорецепторов → сужение сосудов кожи, слизистых, сосудов по ходу чревного нерва, почек ⇒
- стимуляция  $\beta_2$  рецепторов → расширение сосудов: скелетной мускулатуры (увеличение сосудистого ложа), мозга, легких, печени

АД

↑ АД систолического

↓ АД диастолического

# Влияние эпинефрина на АД



# ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА (продолжение)

## ГЛАДКОМЫШЕЧНЫЕ ОРГАНЫ

- расслабление тонуса бронхов ( $\beta_2$ - рецепторы)
- ↓тонуса ЖКТ ( $\alpha_1$ - и  $\beta_1$ -рецепторы)
- матка:  $\alpha_1$ -рецепторы - повышение тонуса,  $\beta_2$ -рецепторы - понижение тонуса. Конечный эффект зависит от гормонального фона
- сокращение капсулы селезенки → выброс депонированной крови

## ГЛАЗ

- ↑тонуса радиальной мышцы зрачка → расширение зрачка (мидриаз)
- стимуляция мышц задней стенки глазницы → экзофтальм

## ОБМЕН ВЕЩЕСТВ

- активация гликолиза и гликогенолиза в печени и скелетных мышцах

## АНТГОНИЗМ С ГИСТАМИНОМ

## ↑ТОНУСА СКЕЛЕТНОЙ МУСКУЛАТУРЫ

- увеличение кровотока, повышение глюкозы крови → ↑работы скелетной мускулатуры
- прямого действия нет

## ↑ТОНУСА МЫШЦ, ПОДНИМАЮЩИХ ВОЛОСЫ

## ЦНС

- экзогенный адреналин – почти не проходит ГЭБ
- эндогенный адреналин – сильнейшая стимуляция ЦНС

# ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ ЭПИНЕФРИНА АНТАГОНИЗМ С ГИСТАМИНОМ

## ■ ГИСТАМИН

- БРОНХОСПАЗМ
- ↓ АД
- ↑ ПРОНИЦАЕМОСТИ СОСУДИСТОЙ СТЕНКИ (ОТЕК)
- ↑ ТОНУСА МАТКИ
  
- УГНЕТЕНИЕ ЦНС

## ■ АДРЕНАЛИН

- УСТРАНЯЕТ
- ↑ АД
- ↓ ПРОНИЦАЕМОСТИ СОСУДИСТОЙ СТЕНКИ
  
- УСТРАНЯЕТ ЭТО ДЕЙСТВИЕ
- СТИМУЛИРУЕТ ЦНС

# ПОКАЗАНИЯ К НАЗНАЧЕНИЮ ЭПИНЕФРИНА

- Остановка сердца (интракардиально)
- Отек слизистых
- Для усиления и удлинения действия местных анестетиков
- При передозировке инсулина
- Анафилактический шок
- Тяжелый приступ бронхиальной астмы
- Для расширения зрачка при открытоугольной форме глаукомы



# **ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ К ПРИМЕНЕНИЮ ЭПИНЕФРИНА**

- **Инфаркт миокарда и ишемическая  
болезнь сердца**
- **Гипертоническая болезнь**
- **Коллапс**
- **Тиреотоксикоз**

# НОРЭПИНЕФРИН

Адреналин  $\rightarrow \beta_1 \beta_2 \alpha_1 \alpha_2$   
НА  $\rightarrow \alpha_1 \alpha_2 ; \beta_1$  —слабо;  $\beta_2$  - нет

## ОСНОВНЫЕ ЭФФЕКТЫ

- АД и систолического и диастолического

- Брадикардия

## ■ ПОКАЗАНИЯ

- Коллапс

- Совместно с местными анестетиками

## ■ ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

- Гипертония

- Тиреотоксикоз

- Кардиогенный шок

# Фенилэфрин (мезатон)

*А1 -адреномиметик*

- **Показания:**
- **Хроническая гипотония (per os)**
- **Коллапс (п/к, в/м, в/в)**
- **Совместно с местными анестетиками**
- **Для сужения сосудов слизистых и уменьшения отека**
- **Для расширения зрачка без влияния на аккомодацию и внутриглазное давление**

# Мидодрин (гутрон)

*A1 -адреномиметик*

## Показания:

- Ортостатическая гипотензия (в/м, в/в)
- Гипотензивные реакции при изменениях погоды (внутри)
- Самопроизвольное мочеиспускание при нарушении функции сфинктера мочевого пузыря (внутри)

## $\alpha_2$ - адреномиметики

- Метилдопа (допегит)
- Клонидин (клофелин)
- Гуанфацин (эстурлик)
- Тизанидин
- Нафазолин (нафазол-хемофарм, нафтизмна раствор)
- Оксиметазолин (називин, назол)

# Клонидин (Клофелин)

## Механизм действия

- Стимуляция  $\alpha_2$ -адренорецепторов в ЦНС → стимуляция центра вагуса и угнетение сосудодвигательного центра
- Стимуляция пресинаптических  $\alpha_2$ -адренорецепторов - торможение высвобождения нейромедиаторов (АХ, НА, дофамина) и возбуждающих аминокислот (глутаминовой, аспарагиновой)

## Основные эффекты

- Снижение АД
- Снижение силы и частоты сердечных сокращений
- Анальгезия
- Седативный эффект
- Уменьшение продукции внутриглазной жидкости

# Клонидин (Клофелин)

## Показания

- Артериальная гипертензия
- Обезболивание при ортопедических операциях, родах, инфаркте миокарда, злокачественных опухолях (эпидурально)
- Открытоугольная глаукома
- Опиатная и алкогольная абстиненция

## Побочные эффекты

- При резкой отмене возможно развитие гипертонического криза
- Повышение АД при резком в/в введении
- Брадикардия
- Сонливость, усталость
- Сухость во рту
- Запор

# Тизанидин

## Механизм действия

- Стимуляция  $\alpha_2$ -адренорецепторов в основном на уровне спинного мозга.
- Снижение выброса возбуждающих аминокислот из промежуточных нейронов спинного мозга

## Основные эффекты

- Центральный миорелаксант – избирательно подавляет полисинаптические механизмы, отвечающие за мышечный гипертонус

## Показания

- Болезненные спазмы мышц при заболеваниях позвоночника, после хирургических операций

## Побочные эффекты

- Сонливость, усталость, головокружение
- Тревога, расстройства сна галлюцинации
- Незначительное снижение или повышение АД
- Брадикардия
- Сухость во рту
- Расстройства ЖКТ



# Нафазолин (Нафтизин)

- При в/в введении хорошо проходит ГЭБ, вызывает угнетение ЦНС
- **ПРИМЕНЕНИЕ:**  
при ринитах различной этиологии для снижения отечности слизистых (капли в нос)

# Изопреналин (Изадрин)

## Основные эффекты

- бронхорасширяющий,
- увеличение сердечного выброса и усиление сокращений,
- уменьшение периферического сопротивления сосудов (артериальная вазоплегия) → снижение АД → уменьшение наполнения желудочков,
- расширение сосудов брюшной полости, кожи, слизистых оболочек (носа),
- повышение потребности миокарда в кислороде,
- уменьшение почечного кровотока,
- торможение сокращений матки,
- не повышает АД и практически не вызывает фибрилляции желудочков.

# Изопреналин (Изадрин)

## Показания

- Брадиаритмии, атриовентрикулярный блок (сублингвально, п/к, в/м, в/в).
- Бронхиальная астма (ингаляционно); как бронхорасширяющее средство при астматических и эмфизематозных бронхитах, пневмосклерозе, бронхографии, бронхоскопии.
- Кардиогенный шок (с пониженным выбросом и высоким периферическим сопротивлением),
- Во время кардиохирургических операций при наличии брадикардии на фоне узлового и желудочкового ритма

## Побочные эффекты

- - тахикардия;
- - аритмия;
- - тремор;
- - артериальная гипотензия;
- - тошнота, рвота, сухость во рту.

# ДОБУТАМИН

## ■ Основные эффекты

- усиливает и в меньшей степени учащает сокращения сердца

## ■ Показания

- в качестве кардиотонического средства для кратковременного усиления сокращений сердца (в/в инфузионно)
- при декомпенсации сердечной деятельности при органических заболеваниях или после хирургического вмешательства
- некоторые формы сердечной недостаточности.

## ■ Побочные эффекты

- тахикардия,
- повышение артериального давления,
- эктопические желудочковые аритмии,
- тошнота, головная боль, боль в области сердца.

# В2-адреномиметики

*Сальбутамол, Фенотерол (беротек), Тербутали, Сальметерол, Формотерол, Кленбутерол*

## Основные эффекты

- расслабляют гладкие мышцы бронхов
- снижают тонус и ритмическую сократительную активность миометрия
- Расширяют сосуды скелетных мышц, печени, коронарные
- Относительно мало влияют на  $\beta$  1-адренорецепторы сердца.

## Показания к применению

- - для купирования и предупреждения приступов бронхиальной астмы;
- - в акушерстве:
  - 1) при начинающихся преждевременных родах;
  - 2) при чрезмерно бурной родовой деятельности.

## Основные побочные эффекты

- - умеренная тахикардия;
- - головокружение;
- - тремор.

## Препараты сложного состава

Бетадрин (дифенгидрамин+нафазолин) - гл. капли

Колдакт Флю Плюс (хлорфенамина малеат+ парацетамол+фенилэфрин гидрохлорид) капсулы

Проксофелин (проксодолол+клофелин) гл. капли

Аскорил экспекторант (сальбутамол+ бромгексин+ гвайфенезин+ментол) сироп

Беродуал (фенотерол+ипратропия бромид) ингал.

Дитек (фенотерол+кромоглициевая кислота) ингал.

Серетид (сальметерол+флютиказол) ингал.

# Симпатомиметики

*Эфедрина гидрохлорид*

*Псевдоэфедрин*

*Амфетамин (фенамин)*

*Фенилпропаноламин*

# Эфедрин

## Механизм действия

- Повышает выброс катехоламинов из пресинаптической мембраны
- Угнетает обратный нейрональный захват НА
- Ингибирует МАО и КОМТ
- Повышает чувствительность адренорецепторов к медиаторам
- Прямое стимулирующее действие на адренорецепторы подобное адреналину (слабое)

## Основные эффекты

- сужение сосудов,
- повышение артериального давления,
- расширение бронхов,
- торможение перистальтики кишечника,
- расширение зрачков,
- повышение содержания глюкозы в крови,
- стимуляция ЦНС.



# Эфедрин

## Показания

- бронхиальная астма,
- артериальная гипотензия,
- риниты (местно)
- атриовентрикулярный блок
- энурез (сон становится более поверхностным, облегчается просыпание при появлении позывов на мочеиспускание)
- отравления снотворными и наркотиками
- нарколепсия
- для расширения зрачка

## Побочные эффекты

- артериальная гипертензия,
- тахикардия,
- бессоница,
- тремор.

# ***Псевдоэфедрин***

**По фармакологическим свойствам близок к эфедрину, но менее активен и токсичен.**

## **Показания:**

- бронхиальная астма, обструктивный бронхит**
- отечность слизистой носа, околоносовых пазух, евстахиевой трубы при рините, синусите, отите и др заболеваниях.**

# Фенилпропаноламин

## Механизм действия

Стимулируют высвобождение норадреналина из нервных окончаний

Возбуждает преимущественно центральные альфа-адренорецепторы

Угнетает гипоталамический центр аппетита

## Основные эффекты

Снижение аппетита (анорексигенный эффект)

Сосудосуживающее действие

## Показания

Для снижения аппетита

# Фенилпропаноламин

## Побочные эффекты

Диспептические явления  
Обострение ИБС,  
гипертонической болезни  
Головная боль  
Тремор  
Психомоторные  
нарушения  
Головокружение  
Бессонница  
Повышенная  
возбудимость

## Противопоказания

Гиперчувствительность  
ИБС, сердечная  
недостаточность  
Артериальная гипертензия  
Заболевания ЦНС  
Бронхиальная астма  
Глаукома  
Гипертиреоз  
Сахарный диабет  
Гиперплазия предстательной  
железы  
Беременность, кормление  
грудью  
Детский возраст (до 12 лет)

**СПАСИБО ЗА ВНИМАНИЕ!**