

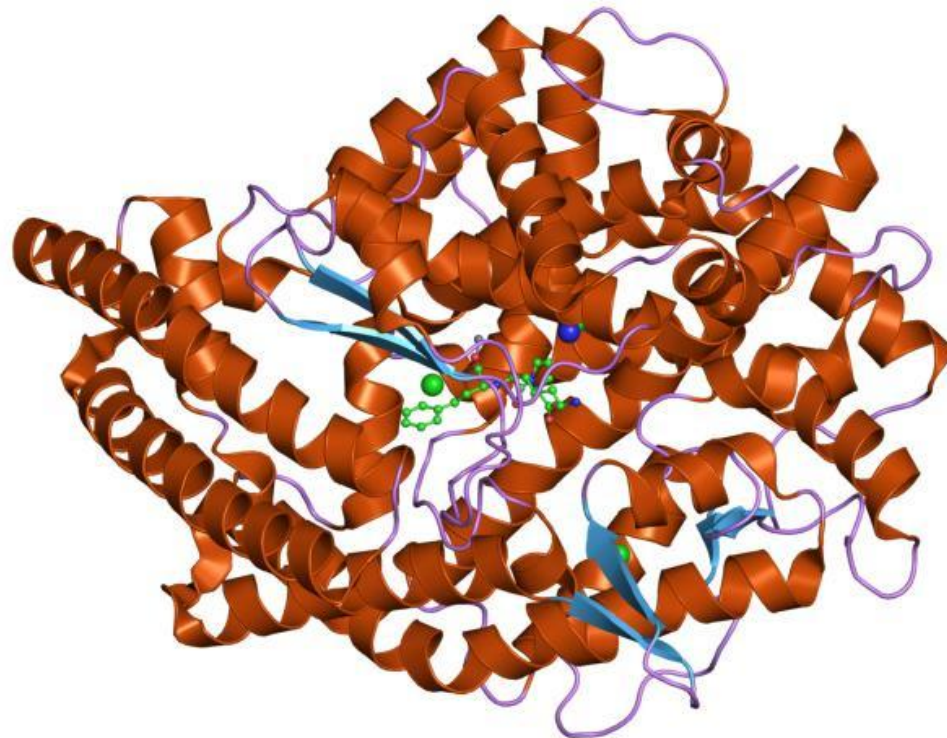
# Ингибиторы

АПФ  
Минаев Сергей  
2 группа ФВМ-3

---

**АПФ-** Ангиотензинпревращающий фермент — циркулирующий во внеклеточном пространстве фермент (экзопептидаза), катализирующий расщепление декапептида ангиотензина I до октапептида ангиотензина II. Обе формы ангиотензина играют важнейшую роль в ренин-ангиотензиновой системе, регулирующей кровяное давление в организме. Вторая важная функция АПФ — деактивация брадикинина.





- 
- Ингибиторы ангиотензин-превращающего фермента (АПФ) — это группа лекарств от гипертонии, которые воздействуют на активность системы ренин-ангиотензин-альдостерон.



# Механизм действия

---

Ингибиторы АПФ действуют, конкурентным способом связывая активный каталитический фрагмент этого фермента и блокируя, тем самым, переход ангиотензина I в биологически активный пептид ангиотензин II (АII). Первоначально созданный для ингибирования АПФ в плазме и снижения уровня АII в плазме, этот класс препаратов оказывает гипотензивное действие, вероятно, и через другие механизмы



# Механизм действия

---

Помимо контроля за продукцией ангиотензина II из ангиотензина I, АПФ является одним из ферментов, ответственных за деградацию брадикинина, который является не только мощным прямым вазодилататором, но и способствует освобождению из эндотелиальных клеток двух других дилататоров - эндотелий продуцируемого релаксирующего фактора (оксида азота - NO) и простагландинов.



# Механизм действия

---

Ингибиторы АПФ также уменьшают симпатическую активность, что позволяет их рассматривать как не прямые антиадренергические вещества, и предотвращают задержку соли и воды вследствие снижения уровня альдостерона. Таким образом, под влиянием ингибиторов АПФ происходит снижение продукции АII и секреции альдостерона, увеличивается AI, брадикинин и ренин.







# Классификация

---



Всего на данный момент зарегистрировано  
3824 препарата

---



Таблица 1. Фармакологические свойства различных ингибиторов АПФ [3]

Препарат	Пик действия, ч	Период полувыведения, ч	Выведение почками, %	Стандартная суточная доза, мг
<i>Содержащие сульфгидрильную группу</i>				
Каптоприл	1,0–1,5	2	95	25–100, 3 раза
Зофеноприл*	1,0	4,5	60**	7,5–30, 2 раза
Беназеприл*	1,0–2,0	11	85	2,5–20, 2 раза
<i>Содержащие карбоксильную группу</i>				
Спироприл*	2,0	1,6	50**	3–6, 1 раз
Квинаприл*	2,0	2–4	75	10–40, 1 раз
Цилазаприл		10	80	1,25–5, 1 раз
Эналаприл*	2,0–8,0	11	88	2,5–20, 2 раза
Лизиноприл*	6,0–8,0	12	70	2,5–10, 1 раз
Рамиприл*	1,0–2,0	8–14	85	2,5–10, 1 раз
Трандолаприл	1,0	16–24	15**	1–4, 1 раз
Периндоприл*	1,0–2,0	> 24	75	4–8, 1 раз
<i>Содержащие фосфинильную группу</i>				
Фозиноприл	1,0	12	50**	10–40, 1 раз

Примечания: \* — пролекарство; \*\* — в значительной степени выводится печенью.



# Клинические преимущества ингибиторов АПФ.

---

Ингибиторы АПФ не оказывают отрицательного влияния на целый ряд важных метаболических показателей и обладают дополнительными благоприятными эффектами, некоторые из которых не связаны со снижением АД.

При назначении этого класса сохраняется хорошее качество жизни в том числе у пожилого организма. Улучшение когнитивных функций на фоне ингибиторов АПФ в пожилом возрасте позволяет их более широко использовать у этой категории больных.

---



# Клинические преимущества ингибиторов АПФ.

---

Ингибиторы АПФ являются метаболически нейтральными препаратами: на фоне их применения нет изменений липидного профиля, мочевой кислоты, уровня глюкозы крови и инсулинорезистентности. Предполагается благоприятное влияние ингибиторов АПФ на некоторые параметры гемостаза (снижение уровня ингибитора тканевого активатора плазминогена). Таким образом, ингибиторы АПФ имеют либо нейтральное, либо благоприятное влияние на классические и новые факторы риска сердечно-сосудистых заболеваний .

---



# Клинические преимущества ингибиторов АПФ.

---

Большой опыт клинического применения показал, что ингибиторы АПФ отличаются хорошей переносимостью с общей частотой нежелательных эффектов менее 10 % . Кашель является наиболее часто сообщаемым побочным эффектом ингибиторов АПФ, который по разным оценкам встречается в 2-6 % случаев. Он, как правило, появляется в течение первых недель лечения, постепенно усиливается и может требовать полной отмены препарата. В других случаях его выраженность может постепенно уменьшаться до полного прекращения. При упорно сохраняющемся кашле целесообразно перевести больного на лечение блокаторами ангиотензивных рецепторов I типа.

---



---

## Органопротективные эффекты ингибиторов АПФ:

- Кардиопротективные
- Нефропротективные
- Васкулопротективные



# Противопоказания

---

- Препараты абсолютно противопоказаны для лечения АГ у беременных. Это в полной мере относится при указаниях на ангионевротический отек и подобные аллергические проявления в прошлом. В настоящее время нет клинического опыта использования ингибиторов АПФ у детей.
- Для предупреждения гипотонии первой дозы у больных с высокой активностью РАС (длительная диуретическая терапия, гипонатриемия, стеноз почечной артерии) предварительно отменить на 1-2 дня диуретики, восполнить потери жидкости и использовать малые дозы.



# Противопоказания

---

- У больных с фиксированным сердечным выбросом (выраженный митральный или аортальный стеноз) при применении ингибиторов АПФ может наступить неконтролируемое падение АД, так как снижение периферического сопротивления не может быть компенсировано из-за невозможности увеличения выброса сердца.
- Следует обращать внимание на гиперкалиемию, особенно в случаях почечной недостаточности, которая может увеличиться при назначении ингибиторов АПФ или может впервые появиться после их назначения. В последней ситуации причиной может быть нераспознанный ранее двухсторонний стеноз почечных артерий.

