ФГБОУ ВО Казанский государственный медицинский университет

Министерства Здравоохранения РФ

Медико-фармацевтический колледж

Методическая разработка

для преподавателей к теоретическому занятию № 11-12

**Тема 2.2.3. – 2.2.4. Адреномиметики и симпатомиметики. Адренолитики и симпатолитики**

**ПМ 01. ОПТОВАЯ И РОЗНИЧНАЯ ТОРГОВЛЯ ЛЕКАРСТВЕННЫМИ СРЕДСТВАМИ И ОТПУСК ЛЕКАРСТВЕННЫХ ПРЕПАРАТОВ**

**ДЛЯ МЕДИЦИНСКОГО И ВЕТЕРИНАРНОГО ПРИМЕНЕНИЯ**

**МДК 01.04. Лекарствоведение с основами фармакологии**

Составитель: О.С. Калинина

Методическая разработка рассмотрена на заседании ЦМК профессиональных модулей по специальности «Фармация»

Протокол заседания №1 от «29» августа 2024 г.

специальность 33.02.01 «Фармация»

**Казань 2024г.**

**Тема 2.2.3. – 2.2.4. Адреномиметики и симпатомиметики. Адренолитики и симпатолитики**

**Занятие №11-12**

**Тип занятия:** комбинированное занятие

**Цели занятия:**

**Учебные:**

* Освоить общие и профессиональные компетенции
* Добиться формирования знаний и способности применять знания в решении новых профессиональных задач
* Закрепить изучаемый материал
* Проверить понимание материала обучающимися.

**Воспитательные:**

* Воспитание трудолюбия, аккуратности, дисциплинированности
* Воспитание чувства ответственности и самостоятельности
* Воспитание познавательных интересов
* Воспитание любви к будущей профессии

**Развивающие:**

* Развитие логического и самостоятельного мышления
* Развитие привычек запоминания – смысловая группировка материала, выделение опорных пунктов
* Развитие инициативы, уверенности в своих силах, настойчивости, умения преодолевать трудности для достижения цели.

**Межпредметные связи:** МДК 01.01. Организация деятельности аптеки и ее структурных подразделений, МДК 01.02. Розничная торговля лекарственными препаратами и отпуск лекарственных препаратов и товаров аптечного ассортимента, МДК 01.05. Лекарствоведение с основами фармакогнозии.

**Внутрипредметные связи:**

*Обеспечивающие темы:* 1.2. Общая фармакология.

*Обеспечиваемые темы:* Раздел 4. Лекарственные препараты, влияющие на функцию исполнительных органов

**Время занятия:** 180 минут.

**Место проведения занятия:** лаборатория «Лекарствоведение с основами фармакологии»

**Оснащенность:**

1. Методическая разработка для преподавателя
2. Ноутбук
3. Презентация

**Перечень профессиональных и общих компетенций, которыми должен овладеть обучающийся:**

|  |  |
| --- | --- |
| **Код** | **Наименование общих компетенций** |
| ОК 01 | Выбирать способы решения задач профессиональной деятельности применительно к различным контекстам. |
| ОК 02. | Использовать современные средства поиска, анализа и интерпретации информации, и информационные технологии для выполнения задач профессиональной деятельности. |
| ОК 03. | Планировать и реализовывать собственное профессиональное и личностное развитие, предпринимательскую деятельность в профессиональной сфере, использовать знания по правовой и финансовой грамотности в различных жизненных ситуациях. |
| ОК 04. | Эффективно взаимодействовать и работать в коллективе и команде. |
| ОК 05. | Осуществлять устную и письменную коммуникацию на государственном языке Российской Федерации с учетом особенностей социального и культурного контекста |
| ОК 07. | Содействовать сохранению окружающей среды, ресурсосбережению, применять знания об изменении климата, принципы бережливого производства, эффективно действовать в чрезвычайных ситуациях. |
| ОК 09. | Пользоваться профессиональной документацией на государственном и иностранном языках. |

|  |  |
| --- | --- |
| **Код** | **Наименование профессиональных компетенций** |
| ВД 1 | Оптовая и розничная торговля лекарственными средствами и отпуск лекарственных препаратов для медицинского и ветеринарного применения |
| ПК 1.1. | Организовывать подготовку помещений фармацевтической организации для осуществления фармацевтической деятельности |
| ПК 1.2. | Осуществлять мероприятия по оформлению торгового зала |
| ПК 1.3. | Оказывать информационно-консультативную помощь потребителям, медицинским работникам по выбору лекарственных препаратов и других товаров аптечного ассортимента |
| ПК 1.4. | Осуществлять розничную торговлю и отпуск лекарственных препаратов населению, в том числе по льготным рецептам и требованиям медицинских организаций |
| ПК 1.5. | Осуществлять розничную торговлю медицинскими изделиями и другими товарами аптечного ассортимента |
| ПК 1.9. | Организовывать и осуществлять прием, хранение лекарственных средств, лекарственного растительного сырья и товаров аптечного ассортимента в соответствии с требованиями нормативно-правовой базы |
| ПК 1.11. | Соблюдать правила санитарно-гигиенического режима, охраны труда, техники безопасности и противопожарной безопасности, порядок действия при чрезвычайных ситуациях |

**Перечень личностных результатов реализации программы воспитания обучающихся**

|  |  |
| --- | --- |
| ЛР 4 | Проявляющий и демонстрирующий уважение к людям труда, осознающий ценность собственного труда. Стремящийся к формированию в сетевой среде личностно и профессионально конструктивного «цифрового следа». |
| ЛР 7 | Осознающий приоритетную ценность личности человека; уважающий собственную и чужую уникальность в различных ситуациях, во всех формах и видах деятельности. |
| ЛР 9 | Соблюдающий и пропагандирующий правила здорового и безопасного образа жизни, спорта; предупреждающий либо преодолевающий зависимости от алкоголя, табака, психоактивных веществ, азартных игр и т.д. Сохраняющий психологическую устойчивость в ситуативно сложных или стремительно меняющихся ситуациях. |
| ЛР 13 | Демонстрирующий готовность и способность вести диалог с другими людьми, достигать в нем взаимопонимания, находить общие цели и сотрудничать для их достижения в профессиональной деятельности. |
| ЛР 14 | Проявляющий сознательное отношение к непрерывному образованию как условию успешной профессиональной и общественной деятельности. |
| ЛР 15 | Соблюдающий врачебную тайну, принципы медицинской этики в работе с пациентами, их законными представителями и коллегами. |
| ЛР 16 | Проявляющий сознательное отношение к непрерывному образованию как условию успешной профессиональной и общественной деятельности. |
| ЛР 17 | Способный планировать и реализовывать собственное профессиональное и личностное развитие. |

**Хронологическая карта теоретического занятия:**

1. Организационный момент – 5 минут
2. Проверка уровня знаний обучающихся + мотивация учебной деятельности – 10 минут
3. Основная часть теоретического занятия – 140 минут
4. Закрепление – 5 минут
5. Задания и задачи – 10 минут
6. Подведение итогов – 5 минут
7. Задание на дом – 5 минут

**1. Организационный момент – 5 минут**

* проверка отсутствующих
* выявление неясных вопросов
* изложение плана и целей занятия

**2.Проверка уровня знаний обучающихся по теме – 5 минут**

1. Опишите процессы, происходящие в холинергическом синапсе.
2. Что такое холиномиметики? Антихолинэстеразные средства?
3. Классификация холиномиметиков и локализация их действия.
4. Подвиды М-холинорецепторов. Эффекты стимуляции холинорецепторов.
5. Что такое глаукома? Каким образом влияют холиномиметики на глаз?
6. Меры помощи при отравлении холиномиметиками.
7. Опишите влияние никотина на организм. Какие ЛП применяются для лечения никотиновой зависимости?
8. Холинэстераза и механизм действия АХЭ-средств.
9. Применение АХЭ-препаратов.
10. Классификация холиноблокаторов.
11. Влияние атропина на глаз.
12. Побочные эффекты холиноблокаторов.
13. Противопоказания для применения холиноблокаторов.
14. Селективные холиноблокаторы для лечения заболеваний дыхательной системы.
15. Какие препараты из группы холиноблокаторов применяются для лечения недержания мочи?
16. Механизм действия и применение ганглиоблокаторов.
17. Для чего применяются миорелаксанты? Приведите примеры.

**Мотивация – 5 минут**

Периферическая нервная система (ПНС) делится на два больших отдела – на афферентную, или чувствительную, несущую импульсы с периферии в ЦНС, и эфферентную, или двигательную, несущую импульсы из ЦНС на периферию. Каждый из этих отделов ПНС имеет свою особую функцию, которую в обобщен­ном виде можно определить следующим образом. Для афферентной иннервации — это снабжение ЦНС информацией со всех поверхностей и органов тела (кожа, слизистые, кишечник, сердце, скелетные мышцы и т.д.) об их состоянии и функ­ционировании. Для эфферентной иннервации — это управление всеми органами и тканями на основании информации, полученной через афферентные нервы.

В большинстве случаев передача импульса с нервной клетки на другую нервную клетку или эффекторный орган происходит посредством химических посредников – медиаторов. Медиаторы выделяются в определенном количестве в межклеточное пространство и, достигая поверхности другой клетки, вступают во взаимодействие со специфическими белками – рецепторами, возбуждают их, что и обеспечивает контакт. Используя лекарственные препараты, которые усилива­ют или ослабляют действие медиаторов, активируют или блокируют рецепторы, мы можем избирательно влиять на функционирование тех или иных органов или систем.

**3.Основная часть теоретического занятия – 140 минут**

Материал основной части теоретического занятия в приложении 1

**4. Закрепление – 5 минут**

Вопросы для закрепления темы

1. Механизм действия адреномиметиков.
2. Какие эффекты на организм оказывает стимуляция различных типов адренорецепторов?
3. Классификация адреномиметиков.
4. Препараты, применяемые при рините. Отличия, применение в детском возрасте.
5. Характеристика стимулятора β1- и β2-адренорецепторов добутамина.
6. Какие препараты данной группы могут применяться только для предупреждения приступа? Почему?
7. Основные фармакологические эффекты адреналина.
8. Основные фармакологические эффекты норадреналина.
9. Что такое симпатомиметик? Каков механизм его действия?
10. Основные эффекты эфедрина гидрохлорида. Почему препарат имеет ограниченное применение?
11. Механизм действия адреноблокаторов.
12. Классификация адреноблокаторов.
13. Применение альфа-адреноблокаторов при заболеваниях предстательной железы.
14. Применение альфа-адреноблокаторов для лечения артериальной гипертензии.
15. Фармакологические эффекты и применение тимолола.
16. Влияние бета-адреноблокаторов на организм. В чем различие между селективными и неселективными бета-адреноблокаторами?
17. Фармакологические эффекты кардиоселективных бета-адреноблокаторов.
18. Механизм действия бета-адреноблокаторов.
19. Применение бета-адреноблокаторов при заболеваниях сердца.
20. Симпатолитики. Характеристика на примере резерпина.

**5. Задания и задачи – 10 минут**

1. Больному с жалобами на периодически возникающие приступы тахикардии и предрасположенному к бронхиальной астме был назначен лекарственный препарат. Тахикардия исчезла, но появились приступы удушья. Какой препарат был назначен? Какова причина удушья? Назовите другие заболевания, на фоне которых нежелательно назначение представителей данной фармакологической группы? Предложите более адекватный в данной клинической ситуации препарат.

2. Больному с гипертензией неясной этиологии был введен лекарственный препарат, снизивший АД, после чего была назначена дозированная физическая нагрузка, что привело к резкому падению давления. Был поставлен диагноз – феохромоцитома. Какой препарат был применен? Объясните смысл данной функциональной пробы.

**6. Подведение итогов – 5 минут**

Преподаватель делает обобщение темы, дает оценку деятельности обучающихся, делает выводы, достигнуты ли цели занятия.

**7. Задание на дом – 5 минут**

Адреномиметики и адренолитики.

*Литература:*

**Основные печатные издания**

1. Аляутдин, Р. Н. Лекарствоведение: учебник / Аляутдин Р. Н. [и др.]. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2022. - 1072 с.

**Основные электронные издания**

1. Аляутдин, Р. Н. Лекарствоведение: учебник / Аляутдин Р. Н. [и др.]. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2019. - 1056 с. - ISBN 978-5-9704-5150-2. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970451502.html> - Режим доступа: по подписке.
2. Аляутдин, Р. Н. Фармакология: руководство к практическим занятиям: учебное пособие / Аляутдин Р. Н., Преферанская Н. Г., Преферанский Н. Г.; под ред. Аляутдина Р. Н. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2021. - 608 с. - ISBN 978-5-9704-5888-4. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970458884.html> - Режим доступа: по подписке.
3. Аляутдин, Р. Н. Фармакология: учебник / Аляутдин Р. Н., Преферанский Н. Г., Преферанская Н. Г. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2020. - 688 с. - ISBN 978-5-9704-5598-2. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970455982.html> - Режим доступа: по подписке.
4. Воронков, А. В. Фармакология с общей рецептурой: учебное пособие / Воронков А. В. и др.; под ред. А. В. Воронкова. - Ростов н/Д: Феникс, 2020. - 302 с. (Среднее медицинское образование) - ISBN 978-5-222-35196-3. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785222351963.html>. - Режим доступа: по подписке.
5. Петров, В. Е. Лекарствоведение: рабочая тетрадь: учеб. пособие / В. Е. Петров, С. Л. Морохина, С. Е. Миронов. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2019. - 392 с. - ISBN 978-5-9704-4927-1. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента»: [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970449271.html> - Режим доступа: по подписке.
6. Федюкович, Н. И. Фармакология: учебник / Федюкович Н. И., Рубан Э. Д. - Ростов н/Д: Феникс, 2020. - 703 с. (Среднее медицинское образование) - ISBN 978-5-222-35174-1. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785222351741.html> - Режим доступа: по подписке.
7. Харкевич, Д. А. Фармакология с общей рецептурой: учебник / Д. А. Харкевич. - 3-е изд., испр. и доп. - Москва: ГЭОТАР-Медиа, 2018. - 464 с.: ил. - 464 с. - ISBN 978-5-9704-4491-7. - Текст: электронный // ЭБС "Консультант студента": [сайт]. - URL: <https://www.studentlibrary.ru/book/ISBN9785970444917.html>. - Режим доступа: по подписке.

**Дополнительные источники:**

1. Справочник ВИДАЛЬ. Лекарственные препараты в России. – Москва: Видаль Рус, 2021. – 1120 с.
2. Регистр лекарственных средств России. Энциклопедия лекарств / под ред. Г.Л. Вышковского. – Москва: Ведана, 2019. – 860 с.
3. Федеральная служба по надзору в сфере здравоохранения [Электронный ресурс]. URL: [https://roszdravnadzor.gov.ru/](https://roszdravnadzor.gov.ru/%20)
4. Министерство здравоохранения Российской Федерации [Электронный ресурс]. URL: https://minzdrav.gov.ru/
5. Федеральная электронная медицинская библиотека [Электронный ресурс]. URL: https://femb.ru/

*Приложение 1*

**Тема 2.2.3. – 2.2.4. Адреномиметики и симпатомиметики. Адренолитики и симпатолитики.**

1. Адренергический синапс и адренорецепторы
2. Классификация и характеристика адреномиметиков и симпатомиметиков
3. Классификация и характеристика адренолитиков и симпатолитиков
4. **Адренергический синапс и адренорецепторы**

* Адренергические синапсы находятся в окончаниях симпатических нервов.
* Передача нервных импульсов в них осуществляется с помощью медиаторов *катехоламинов*: норадреналина, адреналина.
* Основным медиатором является норадреналин, который синтезируется в теле нейрона и депонируется в везикулах (гранулах) пресинаптической мембраны.
* Затем под влиянием пришедшего нервного импульса норадреналин высвобождается из нервного окончания и взаимодействует с адренорецепторами постсинаптической мембраны, что сопровождается развитием специфических фармакологических эффектов. Это действие кратковременно: несколько секунд.
* Инактивация медиатора осуществляется путем обратного захвата из синаптической щели нервным окончанием и с помощью ферментов моноаминооксидазы (МАО) и катехол-орто-метилтрансферазы (КОМТ).

*Подтипы адренорецепторов*

* Различают α- и β-адренорецепторы.

В свою очередь они подразделяются на

* α1 – (сосуды, глаза)
* α2-адренорецепторы (ЦНС),
* β1- (сердце)
* β2-адренорецепторы (бронхи, сосуды, матка, печень).
* Возбуждение α1-адренорецепторов (сужение сосудов кожи, слизистых оболочек уменьшение воспалительных явлений, снижение набухания и секреции слизистой и внутренних органов, повышение давления, расширение зрачков)
* Возбуждение α2-адренорецепторов (снижение ЦНС и возбудимости сосудодвигательного центра, снижение тонус сосудов и артериального давления)

При возбуждении β1-адренорецепторов:

* повышается скорость проведения импульсов в миокарде,
* увеличивается сила и частота сердечных сокращений.

При возбуждении β2-адренорецепторов:

* расслабляются гладкие мышцы бронхов, кишечника, желчных ходов и матки,
* расширяются сосуды скелетных мышц, легких, сердца и мозга,
* усиливается гликогенолиз (образование глюкозы из гликогена) в печени и мышцах.

1. **Классификация и характеристика адреномиметиков и симпатомиметиков**

*Адреномиметики прямого действия*

Фенилэфрин

Нафазолин

Ксилометазолин

Оксиметазолин

Тетризолин

Трамазолин

(α-адреномиметики)

АДР-гх

НА-гт

(α и β-адреномиметики)

Сальбутамол (β2)

Фенотерол (β2)

Формотерол (β2)

Добутамин (β1)

*Непрямого действия*

Эфедрин

(α и β- адреномиметики)

*Фенилэфрин*

* Обладает преимущественным действием на α1- адренорецепторы.
* Вызывает сужение артериол и повышение артериального давления.
* Не является катехоламином и мало подвержен действию фермента КОМТ, поэтому он более стоек, оказывает более длительный эффект.
* ЛП вызывает расширение зрачка и может понизить внутриглазное давление при открытоугольных формах глаукомы.
* Применяют для повышения артериального давления при коллапсе и гипотензии (р-р д/ин.), при ринитах, конъюнктивитах, для расширения зрачка (капли назальные/глазные).
* ПЭ: чувство жжения, пощипывания или покалывания в носу, головная боль, головокружение, сердцебиение, аритмия, повышение АД, потливость, бледность, тремор, нарушение сна.
* Противопоказан при АГ, атеросклерозе, тахикардии и спазмах сосудов.

*Нафазолин*

* Является α1, α2-адреномиметиком, оказывает длительный сосудосуживающий эффект.
* При нанесении на слизистые оболочки оказывает противовоспалительное (противоотечное) действие.
* При ринитах облегчает носовое дыхание.
* Нафазолин назначают только местно при насморке.
* Для общего действия на организм не используется в связи с его высокой токсичностью (угнетает ЦНС).
* При применении возможно явление тахифилаксии.
* У детей старше 1 года применяют 0,05% раствор

*Ксилометазолин*

* При нанесении на слизистые оболочки вызывает сужение сосудов, уменьшая местную гиперемию и отек.
* При ринитах облегчает носовое дыхание.
* Действие наступает через несколько минут и продолжается в течение нескольких часов.

Применение:

* Острый инфекционный и аллергический ринит, синусит, средний отит (в составе комбинированной терапии для уменьшения отека слизистой носоглотки), поллиноз; подготовка пациента к диагностическим процедурам в полости носа
* Детям от 2 лет

*Оксиметазолин*

* При интраназальном применении уменьшает отечность слизистой оболочки верхних отделов дыхательных путей, облегчает носовое дыхание, снижает приток крови к венозным синусам.
* При закапывании в конъюнктивальный мешок уменьшает отечность конъюнктивы. Действие начинается через 15 мин после аппликации, продолжительность — 6–8 ч.

Применение:

* Острый ринит (в т.ч. аллергический), вазомоторный ринит, параназальный синусит, евстахиит, средний отит; для сужения сосудов слизистой оболочки с диагностической целью (под наблюдением врача).
* Капли 0,01% могут применяться у детей до 1 года

*Тетризолин*

* При местном применении в виде глазных капель уменьшает отек конъюнктивы, ощущение жжения, раздражения, зуда, болезненности слизистой оболочки глаз, слезотечение.
* При использовании в виде назальных капель вызывает сужение мелких артериол носовых ходов, уменьшает отечность слизистой носа и снижает секрецию.
* Практически не всасывается. Эффект развивается через несколько минут и продолжается 4–8 ч.

Применение:

* Отек конъюнктивы, вторичная гиперемия при аллергических заболеваниях глаз, раздражение конъюнктивы (в результате воздействия химических и физических факторов, в т.ч. таких как дым, пыль, хлорированная вода, яркий свет, косметические средства, контактные линзы)

Противопоказания:

* тяжелые заболевания глаз (глаукома, синдром «сухого глаза»), детский возраст до 2 лет.

*Лазолван Рино*

* Уменьшает отечность слизистой оболочки полости носа, заложенность носа при «простуде» и сенной лихорадке (поллинозе).
* Начало действия — через 5 мин, продолжительность действия — 8–10 ч.

Показания:

* Ринит, сенная лихорадка, синусит, средний отит с евстахиитом.
* От 6 лет

*β-адреномиметики*

Оказывают прямое возбуждающее действие на β1- и β2-адренорецепторы.

Стимуляция β1-адренорецепторов, расположенных в миокарде, усиливает и учащает сердечные сокращения, повышает возбудимость, облегчает проводимость, увеличивает потребление кислорода миокардом.

В связи с возбуждением β2-адренорецепторов появляется бронхорасширяющее действие, уменьшение отека в слизистой бронхов, понижается тонус беременной матки (токолитическое действие), расширяются сосуды головного мозга, сердца, скелетных мышц и печени, несколько снижается артериальное давление.

*Добутамин*

Добутамин избирательно стимулирует β1- адренорецепторы миокарда и оказывает положительное инотропное действие (усиление систолы).

Применяют при кардиогенном шоке, после операции на сердце, сердечной недостаточности.

Нежелательные эффекты: тахикардия, экстрасистолия, повышение артериального давления, тошнота, головная боль.

*Сальбутамол*

* Бронхолитический эффект обусловлен расслаблением гладкой мускулатуры бронхов.
* Не разрушается легочной катехол-О-метилтрансферазой (КОМТ) и поэтому действует длительно.
* Релаксирует матку, тормозит сократительную активность миометрия, предупреждает преждевременные роды.
* Максимальная быстрота действия (снятие бронхоспазма) достигается при ингаляционном пути введения. Бронходилатация наступает уже на 4–5-й минуте, возрастает к 20-й минуте и достигает максимума через 40–60 мин; продолжительность эффекта составляет 4–5 ч.
* Наиболее выраженный результат получают после ингаляции 2 доз, дальнейшее повышение дозы увеличивает вероятность развития побочных явлений.

Применение:

Профилактика и купирование бронхоспазма при бронхиальной астме, симптоматическое лечение бронхообструктивного синдрома (в т.ч. хронический бронхит, хроническая обструктивная болезнь легких, эмфизема), ночная астма (пролонгированные таблетированные формы); угроза преждевременных родов (на сроках беременности от 16 до 38 нед).

Побочные эффекты:

* тремор,
* повышенная возбудимость,
* головная боль,
* тахикардия,
* изменения давления,
* тошнота,
* парадоксальный бронхоспазм,
* затруднение мочеиспускания,
* отек лица.

Противопоказания: беременность (при использовании в качестве бронхолитика), грудное вскармливание, детский возраст (до 2 лет — для приема внутрь и для дозированного аэрозоля без спейсера, до 4 лет — для порошка для ингаляций, до 18 мес — для раствора для ингаляций), тахиаритмия. Для в/в введения в качестве токолитика (дополнительно): инфекции родовых путей, внутриутробная гибель плода, пороки развития плода, кровотечение при предлежании плаценты или преждевременной отслойке плаценты; угрожающий выкидыш (в I–II триместре беременности).

*Фенотерол*

* Расслабляет гладкую мускулатуру бронхов, стабилизирует мембраны тучных клеток (снижается высвобождение биологически активных веществ).
* Увеличивает частоту и силу сердечных сокращений.
* Обладает токолитическим эффектом.
* В качестве токолитического средства применяется внутрь и в/в.
* Наряду с понижением тонуса и сократительной активности миометрия улучшает маточно-плацентарный кровоток, что приводит к увеличению концентрации кислорода в крови плода.

Применение: Бронхообструктивный синдром: бронхоспазм при физической нагрузке, спастический бронхит у детей, бронхиальная астма, хронический обструктивный бронхит, эмфизема легких; бронхолегочные заболевания (силикоз, бронхоэктатическая болезнь, туберкулез).

В акушерстве: угроза преждевременных родов, угроза самопроизвольного выкидыша после 16 нед. беременности, осложненные роды, внутриутробная гипоксия плода, неотложные акушерские состояния; кесарево сечение (необходимость расслабления матки).

От 6 лет

*Формотерол*

* показан для длительной (дважды в сутки — утром и вечером) поддерживающей терапии при бронхиальной астме и предупреждения (у взрослых и детей 5 лет и старше) бронхоспазма при обратимых обструктивных болезнях дыхательных путей, в т.ч. у пациентов с симптомами ночной астмы.
* применение формотерола фумарата «по требованию» (при необходимости) показано взрослым и детям 5 лет и старше для быстрого предупреждения бронхоспазма, вызванного физической нагрузкой.
* не рекомендован пациентам, у которых удается контролировать бронхиальную астму только не систематическими ингаляциями короткодействующих агонистов бета2-адренорецепторов.
* адекватных контролируемых исследований у беременных женщин, в т.ч. во время родов не проводилось.

*Адреналин*

* На клеточном уровне действие обусловлено активацией аденилатциклазы на внутренней поверхности клеточной мембраны, повышением внутриклеточной концентрации цАМФ и Ca2+. Преимущественно влияет на α1-адренорецепторы.
* В очень низких дозах, при скорости введения меньше 0,01 мкг/кг/мин может снижать АД вследствие расширения сосудов скелетной мускулатуры; выше 0,02 мкг/кг/мин суживает сосуды, повышает АД .
* При скорости введения 0,04–0,1 мкг/кг/мин увеличивает ЧСС и силу сердечных сокращений.
* Расслабляет гладкие мышцы бронхов.
* Расширяет зрачки, способствует снижению продукции внутриглазной жидкости и внутриглазного давления.
* Вызывает гипергликемию и повышает содержание в плазме свободных жирных кислот.
* Повышает проводимость, возбудимость и автоматизм миокарда.
* Увеличивает потребность миокарда в кислороде.
* Действуя на альфа-адренорецепторы, расположенные в коже, слизистых оболочках и внутренних органах, вызывает сужение сосудов, снижение скорости всасывания местноанестезирующих средств, увеличивает продолжительность и снижает токсическое влияние местной анестезии.

Показания:

* аллергические реакции немедленного типа (в т.ч. крапивница, ангионевротический шок, анафилактический шок);
* бронхиальная астма (купирование приступа),
* асистолия;
* кровотечение из поверхностных сосудов кожи и слизистых оболочек (в т.ч. из десен),
* артериальная гипотензия, не поддающаяся воздействию адекватных объемов замещающих жидкостей (в т.ч. шок, травма, бактериемия, операции на открытом сердце, почечная недостаточность, ХСН, передозировка ЛП),
* необходимость удлинения действия местных анестетиков;
* гипогликемия (вследствие передозировки инсулина);
* внутриглазная гипертензия,
* остановка кровотечения;

Противопоказания:

* феохромоцитома, артериальная гипертензия, тахиаритмия, ИБС, фибрилляция желудочков, атеросклероз, сахарный диабет, беременность, период лактации.

Побочные эффекты:

* Нарушения ритма сердца, изменение АД, головная боль, тремор, тошнота, головокружение

*Норадреналин*

* Проявляет выраженное α1-, α2-адреностимулирующее действие, слабо возбуждает β1-адренорецепторы, а на β2-адренорецепторы практически не влияет.
* Преобладание α-адреномиметического действия приводит к сужению сосудов и увеличению системного АД.
* Несмотря на снижение ЧСС, положительное инотропное действие на сердце сохраняется.
* Норэпинефрин способен вызывать сужение сосудов брыжейки, что может приводить к ишемии внутренних органов и способствовать проникновению бактерий из просвета кишечника.
* Повышает также сопротивление почечных сосудов.

Показания:

Острое снижение АД при травмах, хирургических вмешательствах, отравлениях, кардиогенном шоке средней тяжести.

Противопоказания:

Артериальная гипотензия, тромбоз сосудов, выраженная гипоксия

Побочные эффекты:

Ишемические нарушения (вызванные вазоконстрикцией и гипоксией тканей), рефлекторная брадикардия, аритмия, тревожность, транзиторная головная боль, затруднение дыхания, некрозы при попадании под кожу, выраженное повышение АД

*Эфедрин*

* α-β-адреномиметик непрямого действия (симпатомиметик)
* алкалоид, содержащийся в различных видах эфедры.
* по химическому строению и фармакологическим эффектам сходен с адреналином, но отличается по механизму действия: стимулирует выброс медиатора и угнетает его обратный захват на уровне пресинаптической мембраны, поэтому активность эфедрина зависит от запасов медиатора.
* от адреналина эфедрин также отличается большей стойкостью и продолжительностью действия.
* вызывает сужение сосудов, повышение артериального давления, расширение бронхов, повышение сахара в крови, расширение зрачка (не влияя на внутриглазное давление).
* оказывает возбуждающее действие на ЦНС, обладает одурманивающим действием, при отравлении наркотическими и снотворными средствами оказывает пробуждающее действие.
* применяют чаще всего в качестве бронхолитика, при отравлениях наркотиками и снотворными, иногда при гипотензии. Назначают внутрь, инъекционно, а также местно при ринитах и для расширения зрачка.
* обычно хорошо переносится, иногда отмечается легкая дрожь, сердцебиение, нервное возбуждение. При частом введении возникает  *тахифилаксия*, которая обусловлена истощением запасов медиатора.
* Противопоказан при гипертензии, атеросклерозе, органических заболеваниях сердца, сахарном диабете, тиреотоксикозе, беременности.
* входит в состав некоторых препаратов, например, «Бронхолитин».

1. **Классификация и характеристика адренолитиков и симпатолитиков**

Классификация

|  |  |  |  |
| --- | --- | --- | --- |
|  **- адреноблокаторы**  ***1-*** ***2-адреноблокаторы***  ***1- адреноблокаторы***  Алфузозин  Теразозин  Тамсулозин  Силодозин  Доксазозин  Ницерголин |  **-адреноблокаторы**  ***1 -*** ***2 - адреноблокаторы***  Пропранолол  Соталол  Тимолол  ***1 - адреноблокаторы***  Атенолол  Бетаксолол  Метопролол  Бисопролол  Небиволол  Эсмолол |  **-**  **- адреноблокаторы**  Проксодолол  Карведилол | **Симпатолитики**  Резерпин (в составе комбинированных препаратов)  Раунатин |

α-адреноблокаторы

* блокируют α1- и α2-адренорецепторы и тормозят передачу возбуждения в адренергических синапсах.
* блокада α1-адренорецепторов приводит к снижению тонуса артериальных и венозных сосудов, вызывая снижение периферического сопротивления сосудов и артериального давления, улучшение кровоснабжения периферических тканей.
* уменьшают прессорный эффект адреналина, поскольку на фоне блокады α - адренорецепторов проявляется сосудорасширяющее действие адреналина за счет активации β2-адренорецепторов.

*Алфузозин, Тамсулозин, Силодозин*

* Нормализуют нарушенное мочеиспускание, в т.ч. при гиперплазии предстательной железы.
* Селективно блокируют постсинаптические альфа1-адренорецепторы в зоне предстательной железы, уретры и «треугольника» мочевого пузыря.
* Понижают давление в уретре и уменьшают сопротивление току мочи; облегчают мочеиспускание и устраняют дизурию (нарушение процесса мочеиспускания).

Применение: Функциональные нарушения мочеиспускания при доброкачественной гиперплазии предстательной железы (ДГПЖ)

ПЭ: головная боль, сонливость; ортостатическая гипотензия, тахикардия, обострение симптомов стенокардии (у пациентов с ИБС); диспепсия, аллергия, отеки.

ПП: ортостатическая гипотензия (в анамнезе), тяжелые нарушения функции печени и почек, одновременный прием других альфа-адреноблокаторов.

*Теразозин, доксазозин*

* избирательно блокируют альфа1-адренорецепторы гладкой мускулатуры сосудов, предстательной железы и шейки мочевого пузыря.
* расширяют крупные резистивные сосуды (гипотензия).
* расслабляют гладкую мускулатуру шейки мочевого пузыря и сократительные элементы простаты, способствует уменьшению дизурических явлений при ее аденоме.
* нормализуют липидный профиль плазмы (снижают содержание общего холестерина).
* при длительном использовании вызывают регрессию гипертрофии левого желудочка.
* гипотензивный эффект проявляется через 15 мин после приема однократной дозы (через 1–2 ч – доксазозин)

Применение: симптоматическая терапия ДГПЖ, артериальная гипертензия (в виде монотерапии или в составе комбинированной терапии).

ПЭ: Слабость, головная боль, снижение либидо, нарушение зрения, «феномен первой дозы» (резкое понижение АД, вплоть до ортостатического коллапса, после первого приема, чаще при комбинированной терапии с диуретиками или бета-адреноблокаторами), гипотензия, аритмии, периферические отеки. ПП: артериальная гипотензия

*Ницерголин*

* улучшает метаболические и гемодинамические процессы в головном мозге,
* снижает агрегацию тромбоцитов,
* улучшает гемореологические показатели крови,
* повышает скорость кровотока в верхних и нижних конечностях,
* у больных с артериальной гипертензией может вызывать постепенное умеренное снижение давления.

Применение: острые и хронические церебральные метаболические и сосудистые нарушения (вследствие атеросклероза, артериальной гипертензии, тромбоза или эмболии сосудов головного мозга и т.д.); острые и хронические периферические метаболические и сосудистые нарушения.

ПЭ: Выраженное снижение АД, головокружение, ощущение жара, аллергические реакции, нарушения сна.

ПП: недавно перенесенный инфаркт миокарда, кровотечения, брадикардия, ортостатическая гипотензия.

Хранят при температуре 2–10 °C.

*β - адреноблокаторы*

* нарушают проведение нервных импульсов в адренергических синапсах за счет угнетения β-адренорецепторов.

Блокада β1-адренорецепторов, расположенных в миокарде, вызывает:

* ослабление силы (отрицательный инотропный эфффект) и частоты сердечных сокращений (отрицательный хронотропный эффект),
* уменьшение проводимости (отрицательный дромотропный эффект),
* снижение автоматизма (отрицательный батмотропный эффект),
* снижение сократительной способности миокарда и потребности сердца в кислороде,
* уменьшение сердечного выброса (ударного объема)
* падение артериального давления
* угнетение β2-адренорецепторов может привести к спазму бронхов, повышению тонуса мускулатуры матки, уменьшению процессов гликогенолиза (это биохимический процесс расщепления гликогена до глюкозы, при замедлении процесса снижается уровень сахара в крови).

β1, β2 - адреноблокаторы (неселективные)

*Анаприлин*

* Оказывает гипотензивный эффект, который стабилизируется к концу 2-й недели курсового назначения.
* Усиливает сокращения матки, что способствует уменьшению кровотечения при родах и в послеоперационный период.
* Повышает тонус бронхов.
* В больших дозах вызывает седативный эффект.
* Снижает внутриглазное давление за счет угнетения продукции водянистой влаги в камере глаза, не влияет на размеры зрачка и аккомодацию.

Применение: артериальная гипертензия; стенокардия; тахикардия (в т.ч. при гипертиреозе); наджелудочковая и желудочковая экстрасистолия; сердечно-сосудистые нарушения при диффузном токсическим зобе; профилактика приступов мигрени.

ПЭ: брадикардия, бронхоспазм, сердечная недостаточность, повышенная утомляемость, боли в эпигастральной области, спазм периферических артерий, изменения уровня сахара в крови

ПП: гипотензия, острая сердечная недостаточность, инфаркт миокарда, заболевания периферических артерий, бронхиальная астма, сахарный диабет.

*Соталол*

* Неселективно блокирует бета-адренорецепторы и калиевые каналы (в высоких дозах)
* Антиаритмическое действие начинается через 1 ч после приема внутрь, достигает максимума спустя 2,5–4 ч и продолжается 24 ч

Применение: Желудочковые аритмии; наджелудочковые аритмии; тахикардия при тиреотоксикозе; стенокардия напряжения; артериальная гипертензия; профилактика и лечение инфаркта миокарда (при стабильном состоянии больного).

*Тимолол*

При местном применении понижает секрецию водянистой влаги и способствует ее оттоку, уменьшая внутриглазное давление (как повышенное, так и нормальное).

Позволяет контролировать внутриглазное давление во время сна.

При инстилляции действие начинается через 10–30 мин и продолжается до 12–24 ч

Хорошо всасывается через сетчатку глаза и слизистую оболочку носа (возможно развитие системных эффектов).

Применение: повышенное внутриглазное давление, глаукома (в т.ч. открытоугольная, вторичная).

ПЭ: раздражение глаз, нарушение зрения, сухость слизистой оболочки глаз; преходящее затуманивание зрения, ощущение инородного тела в глазу, слезотечение, светобоязнь, воспаление краев век, конъюнктивит, заложенность носа.

ПП: дистрофические заболевания роговицы, тяжелые аллергические воспаления слизистой оболочки носа.

β1 - адреноблокаторы (кардиоселективные)

* Фармакологическое действие - антиангинальное, гипотензивное, антиаритмическое.
* Обладают отрицательным инотропным, хронотропным, батмотропным и дромотропным эффектами.
* Особенно хорошо действуют при физической и эмоциональной нагрузке.
* Устраняют влияние циркулирующего в крови адреналина на сердце, вследствие чего уменьшают автоматизм.
* Предпочтительны при наличии бронхообструктивных заболеваний, эндартериита, сахарного диабета.
* При назначении больших доз могут влиять и на β2-адренорецепторы.
* Прекращать применение β-адреноблокаторов следует постепенно во избежание «синдрома отмены».

*Механизм действия бета-адреноблокаторов*

Блокада бета-адренорецепторов

-Уменьшение секреции ренина в юкстагломерулярном аппарате почек

-Снижение проводимости и возбудимости миокарда

-Антигипертензивный,антиангинальный эффекты

-Антиаритмический эффект

-Уменьшение сократимости и автоматизма сердца

ПОБОЧНЫЕ ЭФФЕКТЫ

/ Депрессия

/ Сонливость

/ Усталость

/ Половая дисфункция

/ Синдром отмены

/ Ортостатическая гипотензия

/ Маскируют симптомы тиреотоксикоза, гипогликемии

ПРОТИВОПОКАЗАНИЯ

/ Синдром короткого PQ

/ Беременность и кормление грудью

/ Легочная гипертензия

/ Вариантная стенокардия

/ Брадикардия

/ Сидром слабости синусного узла

/ Блокады AV-соединения

/ Сердечная недостаточность (ФВ<30%)

/ Артериальная гипотензия

/ Болезнь Рейно и подобные синдромы

/ Бронхообструктивные синдромы

α,β- адреноблокаторы

*Проксодолол*

Внутрь: артериальная гипертензия, стенокардия (профилактика), аритмия, компенсированная хроническая сердечная недостаточность (в составе комбинированной терапии).

Парентерально: гипертонический криз.

Конъюнктивально: глаукома (открыто- и закрытоугольная, вторичная).

*Карведилол*

Артериальная гипертензия (монотерапия или в комбинации с другими антигипертензивными препаратами), стабильная стенокардия.

Обладает выраженным антиоксидантным действием.

*Симпатолитики*

* Нарушают передачу возбуждения на уровне пресинаптической мембраны либо истощая запасы норадреналина в нервных окончаниях, либо предотвращая его высвобождение.
* Это приводит к уменьшению влияния симпатической нервной системы на кровеносные сосуды и сердце – сосуды расширяются, снижается сила сердечных сокращений и возникает брадикардия.
* Результатом этого является снижение артериального давления.
* Угнетение симпатической (адренергической) иннервации приводит к косвенному повышению активности парасимпатической и преобладанию холинергических эффектов.
* Это проявляется в усилении перистальтики желудочно-кишечного тракта, увеличении секреции желез желудка. Указанные эффекты расцениваются как нежелательные.

*Резерпин*

* Резерпин – алкалоид растений рода раувольфия, обладает выраженными симпатолитическими свойствами.
* Под влиянием резерпина происходит ускорение высвобождения норадреналина и других катехоламинов из везикул нервных окончаний. Высвобожденные катехоламины подвергаются дальнейшему разрушению моноаминооксидазой (МАО).
* При применении резерпина постепенно снижается систолическое и диастолическое артериальное давление при разных формах и стадиях артериальной гипертензии.
* Гипотензивный эффект развивается постепенно (на 6-8 сутки) и относительно долго сохраняется после прекращения приема резерпина.
* Резерпин снижает содержание катехоламинов и серотонина в ЦНС, тем самым оказывает седативное и слабое антипсихотическое действие, способствует наступлению сна.
* При применении резерпина отмечаются нежелательные эффекты: сонливость, депрессия, заложенность носа, спазмы желудка и кишечника, диарея, усиление секреции пищеварительных желез, боли в желудке.
* Выпускается ЛП Раунатин, содержащее сумму алкалоидов раувольфии.