



МЕДИЦИНСКИ УНИВЕРСИТЕТ – ПЛЕВЕН
ФАКУЛТЕТ „ФАРМАЦИЯ“

ЦЕНТЪР ЗА ДИСТАНЦИОННО ОБУЧЕНИЕ

Лекция № 17

АНТИСТЕНОКАРДНИ ЛЕКАРСТВА

Проф. Пламен Пейков, дф

Сърцето осъществява своята дейност посредством свивания на сърдечната мускулатура в резултат на ритмични електрически импулси.

В сърдечния мускул се намират клетъчни структури с особено устройство, които образуват възбудно-проводната система на сърцето.

Основни електрофизиологични свойства на сърцето:
автоматизъм, проводимост, възбудимост и рефрактерност.

Автоматизъм - способност на клетките на възбудно-проводната система да създават електрически импулси спонтанно, през определен интервал от време.

Проводимост - свойство на всички миокардни клетки да провеждат тези електрически импулси към съседни клетки.

Възбудимост - способност на миокардните мускулни клетки да се активизират електрически от различни дразнители.

Рефрактерност - невъзможност на тези клетки да се активизират по време на съкращението на сърцето.

Антистенокардни лекарства

Донори на азотен оксид

Непреки донори на NO (органични нитрати): Glyceryl trinitrate; Isosorbide dinitrate; Isosorbide-5- mononitrate; Pentaerithrityl tetranitrate.

Преки донори на NO (сиднон имини): Molsidomine.

С друг химичен строеж

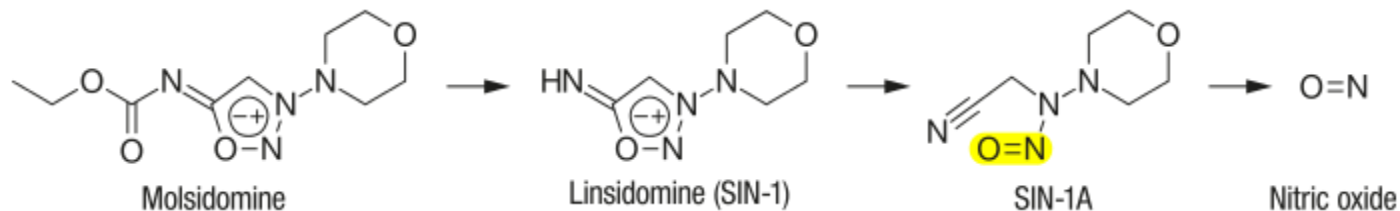
ATC Code

C01DX12

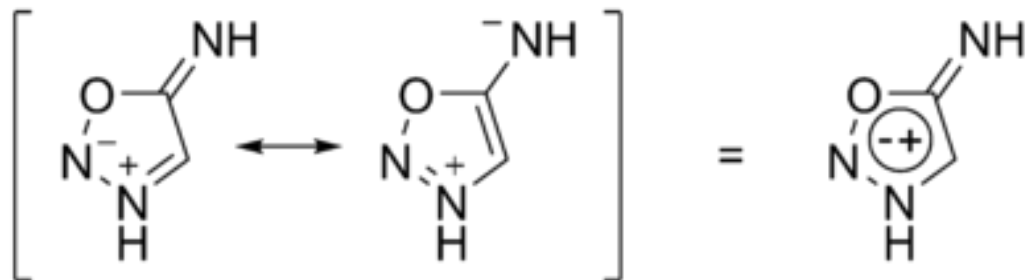
Molsidomine се метаболизира чернодробно до **Linsidomine**.

Linsidomine освобождава азотния оксид (NO) от ендотелните клетки и действа като активен вазодилатиращ метаболит, отговорен за фармакологичните ефекти на **Molsidomine**.

N-(Ethoxycarbonyl)-3-(4-morpholinyl)sydnone imine



Сиднон имин (Sydnone imine)



Сиднон имин е мезоионното съединение - хетероцикличната структура е диполярна и има както отрицателни, така и положителни заряди –делокализирани.

Glyceryl trinitrate – активен метаболит NO

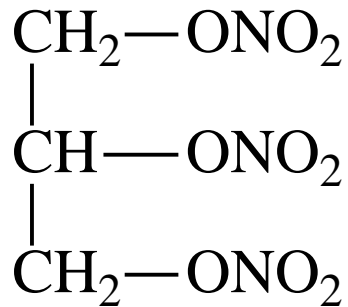
1,2-глицерил динитрат (GDN) и NO и че тази реакция се катализира чрез митохондриална алдехид дехидрогеназа (ALDH2 или mtALDH).

Нитроглицеринът образува свободен радикал азотен оксид (NO), който активира гуанилат циклазата, което води до увеличаване на гуанозин 3'5' монофосфат (цикличен GMP) в гладката мускулатура и други тъкани. Тези събития водят до дефосфорилиране на леки вериги на миозин, които регулират контрактилното състояние в гладката мускулатура и водят до вазодилатация.

Антистенокардни лекарствени продукти (C01D)

Естери на азотната киселина (нитрати, нитровазодилататори)

Nitroglycerin



Glyceryl Trinitrate Solution

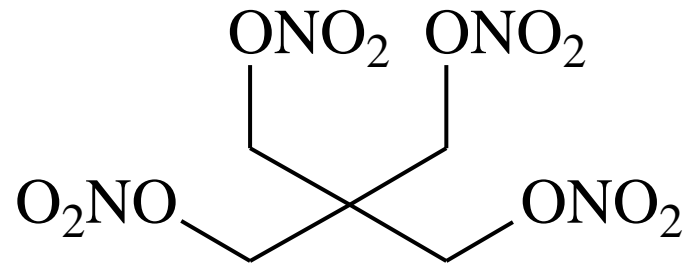
Ph Eur

propane-1,2,3-triyl trinitrate

1,2,3-пропантриол тринитрат
(1,3-динитроокспропан-2-ил нитрат)
(Glyceryl trinitrate)

Основното фармакологично действие на нитроглицерина е релаксация на съдовата гладка мускулатура и последваща дилатация на периферни артерии и вени – увеличава се кръвотока и кръвното налягане се понижава.

Pentaerythritol tetranitrate

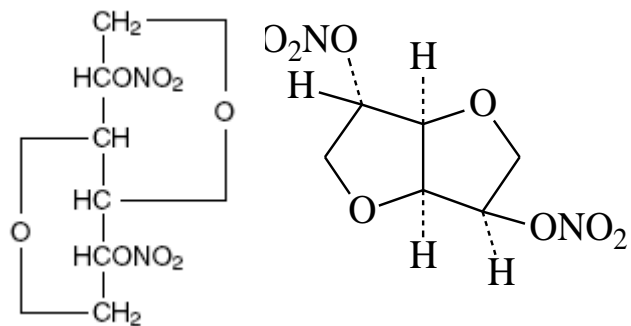


2,2-бис[(нитроокси)метил]-
1,3-пропандиол динитрат (естер)

Diluted Pentaerythrityl Tetranitrate

2,2-bis (hydroxymethyl)propane-1,3-diol tetranitrate.

ISOSORBIDE DINITRATE



(3*R*,3*aS*,6*S*,6*aS*)-hexahydrofuro[3,2-*b*]furan-3,6-diyl dinitrate

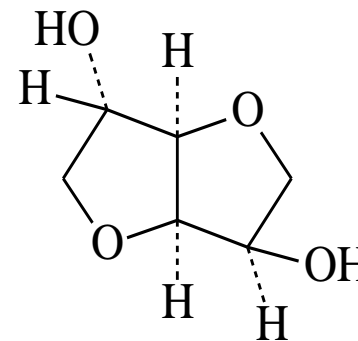
Основно фармакологично действие - релаксация на съдовата гладка мускулатура и последваща дилатация на периферни артерии и вени.

Isosorbide mononitrate

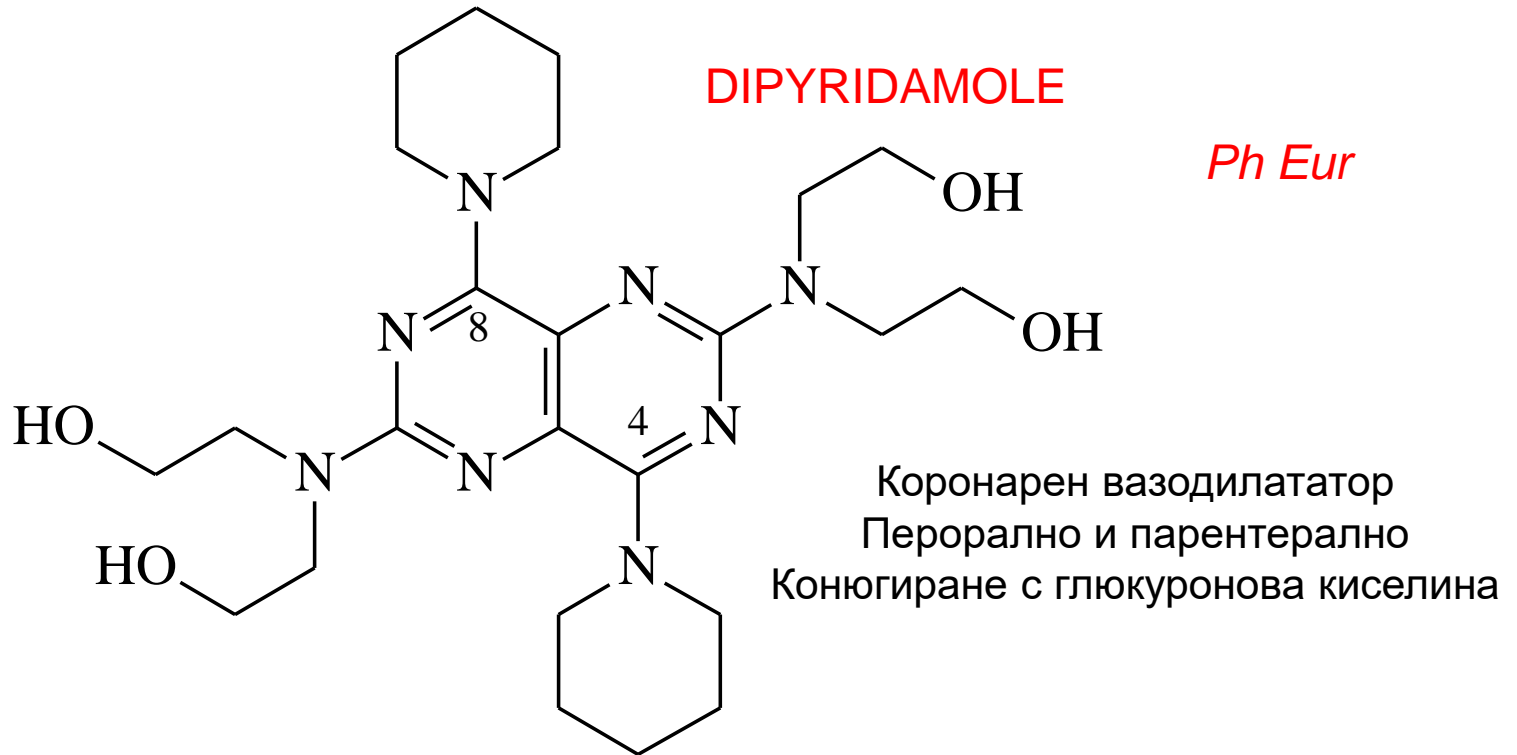
8-nitrooxy-2,6-dioxabicyclo[3.3.0]octan-4-ol

ISOSORBIDE

ДИУРЕТИК



С друг строеж

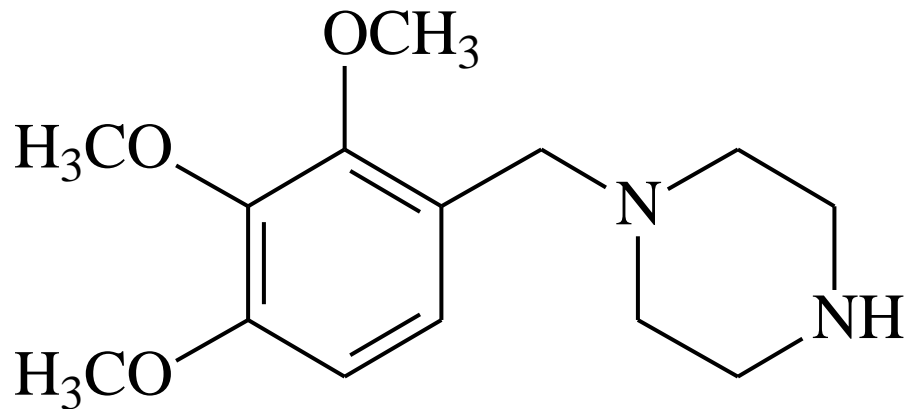


2,6-бис(диетаноламино)-4,8-ди-пиперидинопиримидо-
[5,4-d]пиримидин

IUPAC

2-{[9-(bis(2-hydroxyethyl)amino)-2,7-bis(1-piperidyl)-
3,5,8,10-tetraza-bicyclo[4.4.0]deca-2,4,7,9,11-pentaen-
4-yl]-(2-hydroxyethyl)amino}ethanol

TRIMETAZIDINE



1-[(2,3,4-ТРИМЕТОКСИФЕНИЛ)МЕТИЛ]ПИПЕРАЗИН ДИХИДРОХЛОРИД

Ph Eur

1-(2,3,4-trimethoxybenzyl)piperazine dihydrochloride

Trimetazidine Hydrochloride

Ivabradine

3-[3-({[(7S)-3,4-диметоксибицикло[4.2.0]окта-1,3,5-триен-7-ил]метил})(метил)амино)пропил]-7,8-диметокси-2,3,4,5-тетрахидро-1H-3-бензазепин-2-он хидрохлорид

Намалява сърдечния ритъм /намалява нуждата на сърцето от кислород/ и увеличава кръвотока.

Селективен и специфичен инхибитор на If-смесените натриево-калиеви канали в синусовия възел.

Одобрен от Европейската агенция по лекарствата през 2005 г.
За симптоматично лечение на хронична и стабилна ангина пекторис.

