

# ***DROGAS QUE ATUAM NO SISTEMA NERVOSO AUTÔNOMO***

ADRENÉRGICOS E BLOQUEADORES

\* Atualizado 29/10/17

# ***SISTEMA NERVO***

**INTRODUÇÃO**

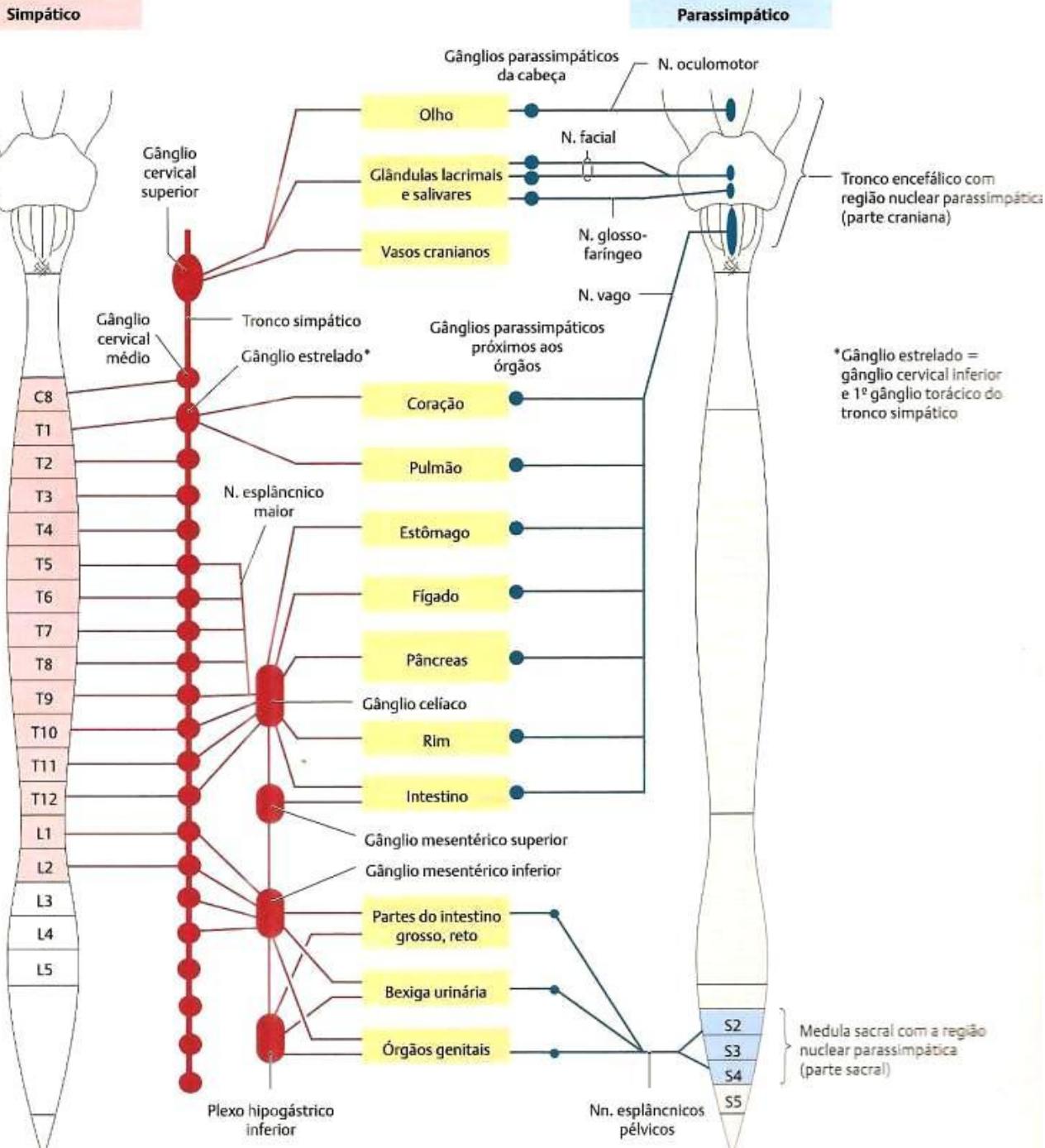
# CONSTITUIÇÃO DO SIMPÁTICO

---

Morfologicamente, este sistema, é caracterizado pela existência de uma cadeia de gânglios que se estende ao lado da coluna dorsal

Origem das fibras → toracolombar

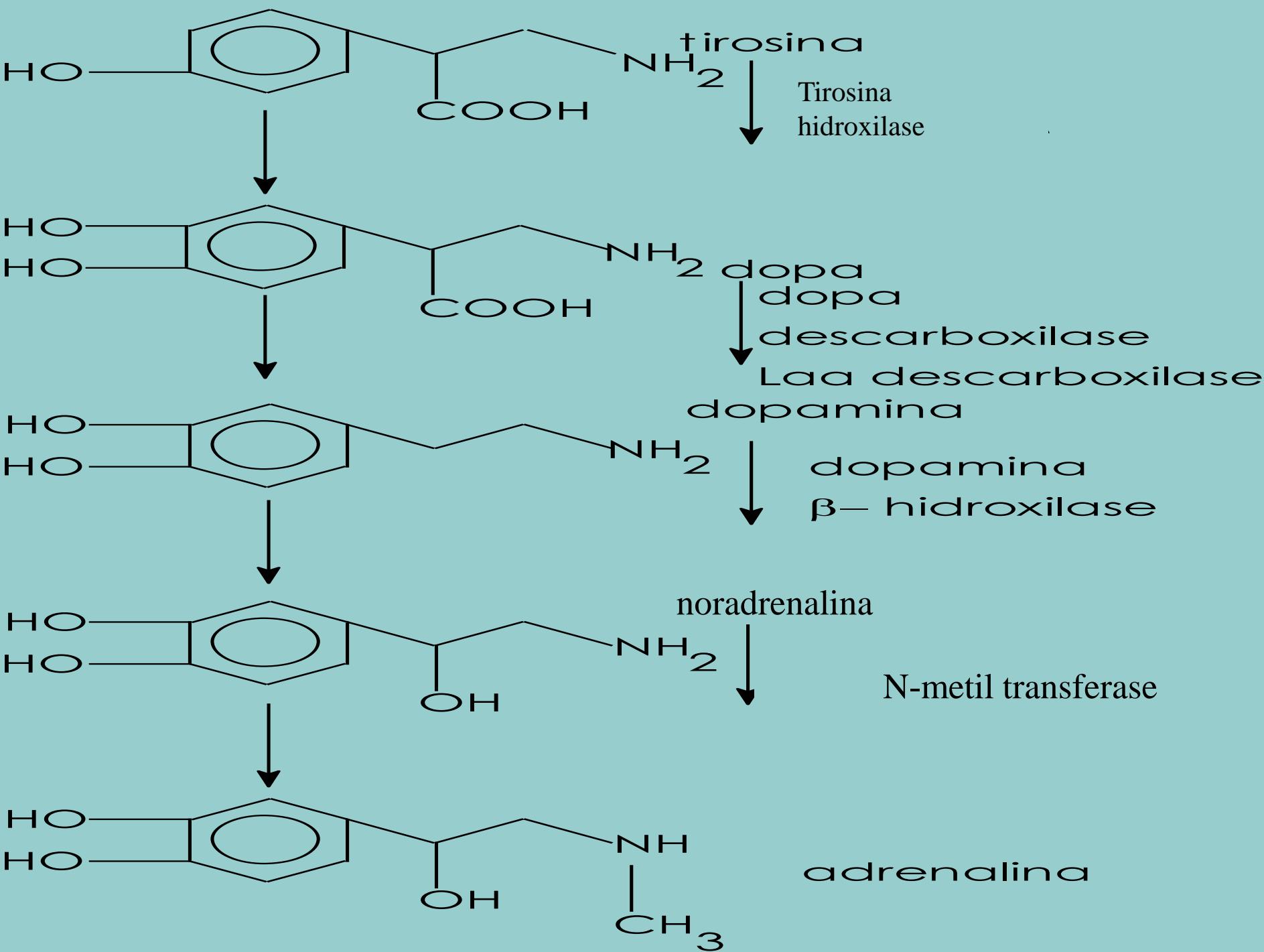
# Fisiologia antagônica do SNA



# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

- ✓ É caracterizada por possuir a noradrenalina como neurotransmissor.
- ✓ Esta sinapse pode ser encontrada no SNC e SNA (sinapses neuroefetoras do sistema simpático).



# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

## ✓ ARMAZENAMENTO

Ocorre na forma ligada no interior das vesículas com ATP e cromograminas.

## ✓ LIBERAÇÃO

- Liberação espontânea;
- Liberação ou perda espontânea;
- Com o efeito do potencial de ação.

# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

## ✓ LIBERAÇÃO

- ✓ 1. Chegada do potencial de ação ao terminal axônico;
- ✓ 2. Despolarização da membrana axonal pré-sináptica;
- ✓ 3. Liberação de ACH;
- ✓ 4. A ach aumenta a permeabilidade à entrada de  $\text{Ca}^{2+}$ ;
- ✓ 5. Entrada do  $\text{Ca}^{2+}$  no axoplasma;
- ✓ 6. Possível influência das prostaglandinas como moduladoras;
- ✓ 7. Liberação da NA na fenda sináptica.

# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

- ✓ LOCALIZAÇÃO DOS RECEPTORES ADRENÉRGICOS
- ✓  $\alpha_1$  situa-se na membrana pós-sináptica  
Vasos sanguíneos, de resistência, da pele, dos músculos, dos rins. Provocam vasoconstricção.

# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

- ✓  $\alpha_2$
- ✓ Situa-se na membrana pré-sináptica de terminais simpáticos.  
Terminais simpáticos pré-sinápticos (feedback negativo);  
Tronco cerebral e outras áreas do SNC, em locais pré e pós-  
sinápticos reduzindo a pressão sanguínea;  
Músculos lisos vasculares provocando vasoconstricção;  
Neurônios periféricos do plexo mioentérico, inibindo a ação da  
ACh e a resposta contráctil.

# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

- ✓  $\beta$  São responsáveis pela liberação de NA.  
Miocárdio, produzindo excitação ( $\beta_1$ )  
Artérias e arteríolas do músculo esquelético, brônquios,  
onde produzem inibição. ( $\beta_2$ )
- ✓  $\beta_3$ : não total// esclarecido (sítios metabólicos, modula  
funcional// de Beta 1)

# SINAPSE ADRENÉRGICA

---

## ✓ INATIVAÇÃO

### Processo enzimático:

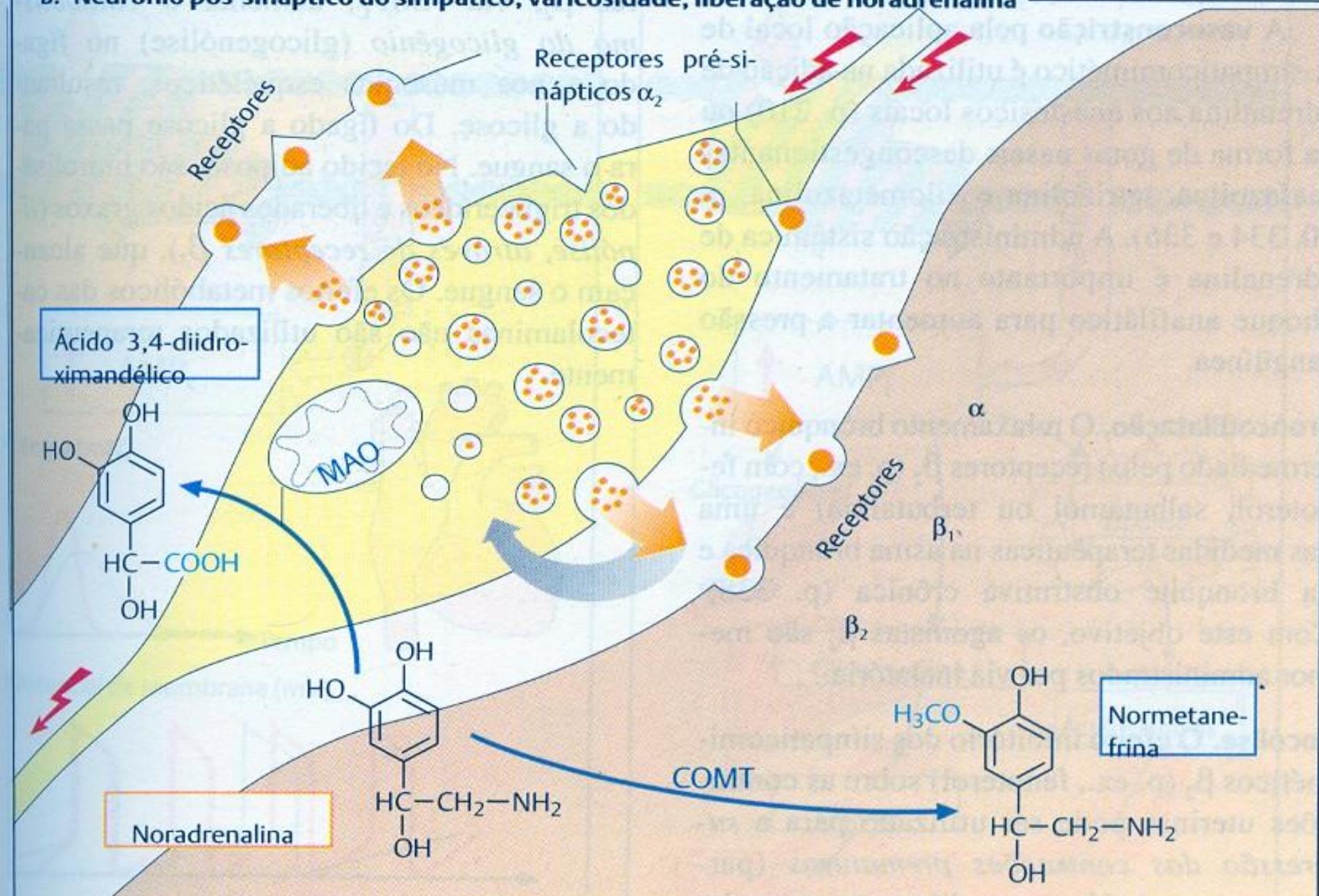
- MAO = desaminadora, retirando o grupamento NH<sub>2</sub>;
- COMT = transforma a NA em compostos metametoxilados (metanefrina e normetanefrina)

### Processo de recaptação:

Ocorre através de transporte ativo , semelhante à bomba de sódio.

### Difusão para fora da fenda

## B. Neurônio pós-sináptico do simpático, varicosidade, liberação de noradrenalina



# AGENTES ADRENÉRGICOS DIRETOS

---

- Ação sobre os receptores:
- $\alpha_1$  (Rang, H.P. et al., 2001)
  - Fosfolipase C  $\rightarrow$  fosfatidilinositol (inositol trifosfato e diacilglicerol)
  - Canais de  $\text{Ca}^{++}$
  - Canais de  $\text{Na}^+$
- $\alpha_2 \rightarrow$  diminuição de  $\text{AMP}_c$
- $\beta_1, \beta_2$  e  $\beta_3$ 
  - Adenilciclase  $\rightarrow$  aumento de  $\text{AMP}_c$

# RECEPTORES ADRENÉRGICOS

## Tecidos e

## efeitos

	$\alpha_1$	$\alpha_2$	$\beta_1$	$\beta_2$
Vasos sanguíneos	constrição	constrição		dilatação
brônquios	<b>constrição</b>			<b>dilatação</b>
TGI	relaxamento	Relaxamento (efeito pré-sináptico)		relaxamento
Esfíncteres GI	<b>contração</b>			

# RECEPTORES ADRENÉRGICOS

Tecidos e efeitos	$\alpha 1$	$\alpha 2$	$\beta 1$	$\beta 2$
Útero		contração		relaxamento
Bexiga				relaxamento
Esfíncter Bexiga		contração		
Vias seminais		contração		relaxamento

# RECEPTORES ADRENÉRGICOS

Tecidos e efeitos	$\alpha_1$	$\alpha_2$	$\beta_1$	$\beta_2$
Íris (músculo radial) contração				
Músculo ciliar				relaxamento
Coração/ frequência			aumento	
Coração/força contrátil			aumento	

# RECEPTORES ADRENÉRGICOS

Tecidos e efeitos

$\alpha_1$

$\alpha_2$

$\beta_1$

$\beta_2$

fígado

glicogenólise

glicogenólise

Ilhotas/pâncreas

secreção  
↓  
insulina

Segundos  
mensageiros

Ativação da  
fosfolipase C  
 $IP_3$ , DAG e  
 $Ca^{++}$

$AMP_c \downarrow$   
 $Ca^{++}$   
 $K^{+}$

$AMP_c \uparrow$

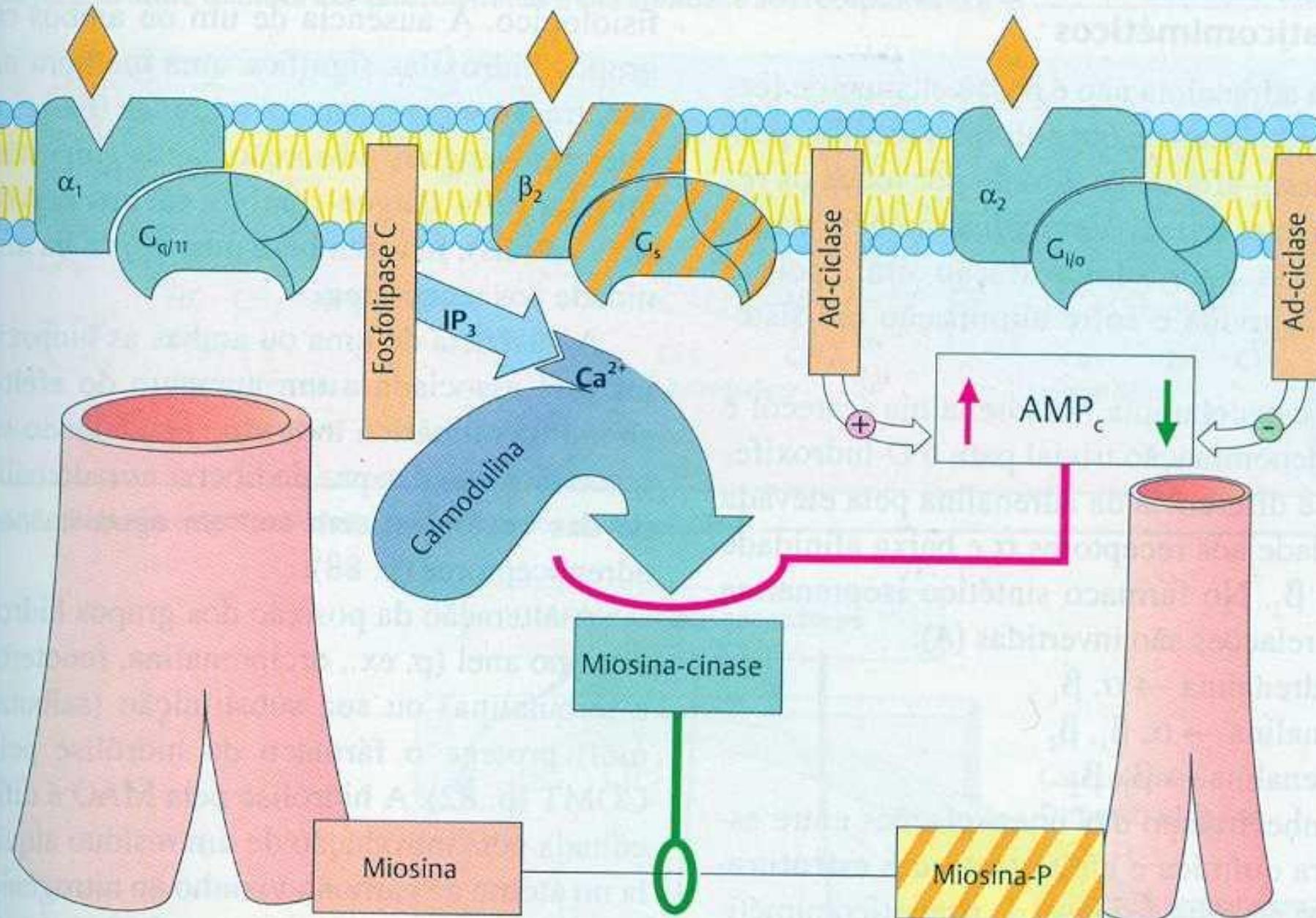
$AMP_c \uparrow$

# RECEPTORES ADRENÉRGICOS

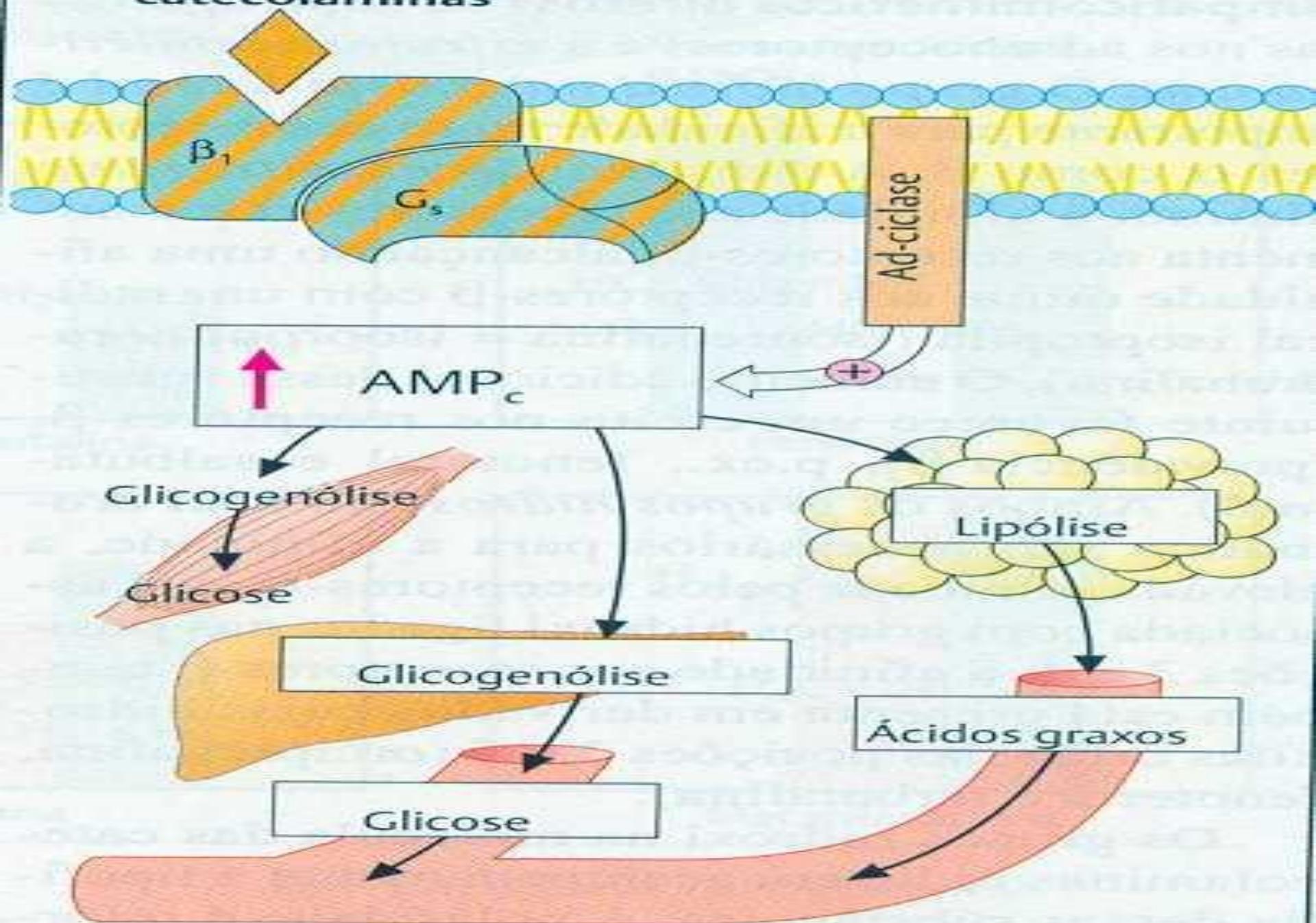
---

- $\beta 3 \rightarrow$
- Termogênese (músculatura esquelética)
- Lipólise
- Aumenta AMP cíclico
- Funcionamento de Beta 1

### A. Efeitos das catecolaminas sobre o diâmetro vascular



### C. Efeitos metabólicos das catecolaminas



# DROGAS ADRENÉRGICAS

---

- São conhecidas como simpaticomiméticas, adrenomiméticas ou simplesmente adrenérgicas. Estimulam as funções do Sistema Nervoso Simpático, por ativarem receptores  $\alpha$  e  $\beta$  adrenérgicos.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

---

Podem ser:

1. **Adrenérgicos Diretos**
2. Adrenérgicos Indiretos;
  - a . Atuam na biossíntese, estocagem, liberação e recaptação do neuro-transmissor;
  - b . Atuam no sistema enzimático responsável pela inativação natural do neurotransmissor;

# ESTIMULANTES DIRETOS DOS RECEPTORES

---

- Adrenalina,
- Noradrenalina,
- Dopamina,
- Dobutamina
- Isoproterenol,
- Agonistas  $\beta_2$ ,
- Fenilefrina,
- Nafazolina e derivados.

# **PROMOTORES DA LIBERAÇÃO DE NORADRENALINA**

---

- Anfetamina e Derivados,
- Efedrina e derivados.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

---

## **CATECOLAMINAS**

- **ADRENALINA**

Secretada diretamente na corrente sanguínea pelas células cromafins da medula das glândulas adrenais .

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

### **ADRENALINA**

#### **Ações Farmacológicas**

##### **Coração**

- É um estimulante cardíaco muito potente. Possui ação nos receptores  $\beta_1$  adrenérgicos excitando tanto as fibras do miocárdio quanto do sistema de condução do coração;
- É um agente cronobatmo-dromo-inotrópico + (aumenta o automatismo, excitabilidade, condução e contratilidade).

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

#### **Ações Farmacológicas**

##### **Vasos sanguíneos**

- Age nos receptores  $\alpha_1$ , causando redução do fluxo sanguíneo cutâneo, mesentérico e renal;
- Age nos receptores  $\beta_2$ , estimulando predominantemente os vasos da musculatura esquelética com conseqüente vasodilatação e aumento do fluxo.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

Ações Farmacológicas

Pressão arterial

- A pressão arterial média não se altera.

Efeitos metabólicos

- A ativação de receptores  $\alpha$  e  $\beta$  provoca o aumento da glicemina por glicogenólise e lipólise.
- A secreção de insulina por estímulo  $\beta$  é diminuída por estímulo  $\alpha$ .

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

Ações Farmacológicas

Efeitos respiratórios

- A estimulação  $\beta$  ( $\beta_2$ ) provoca broncodilatação.

SNC

- Não ocorrem pela dificuldade de atravessar a BHE. Ansiedade, inquietação, tremores.

# ADRENÉRGICOS DIRETOS

## CATECOLAMINAS

---

### ADRENALINA

#### Ações Farmacológicas

#### Músculo liso de órgãos ôcos (**predomínio do parassimp.**)

- Os efeitos vão depender dos receptores predominantes no músculo;
- Estímulo  $\alpha$  e  $\beta$  relaxa toda a musculatura intestinal;
- Estímulo  $\alpha$  contrai o piloro e o trígono vesical;
- Estímulo  $\beta$  relaxa o cardíaco;
- Estímulo  $\beta_2$  relaxa o útero gravídico e o músculo destrusor da bexiga.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

#### **Absorção, Metabolismo e Excreção**

- Principal via I.V., tb local e inalatória
- É degradada pela MAO e COMT e seus metabólicos são excretados na urina.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

#### **Usos Clínicos:**

Alívio do broncoespasmo, parada cardiorespiratória, hipotensão grave e reações alérgicas graves (choque anafilático).

#### **Reações Adversas:**

Podem variar desde tremores até palpitações e arritmias graves.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ADRENALINA**

Preparações no Brasil

É encontrada na forma de ampolas –  
Adrenalina / Epinefrina



# ADRENÉRGICOS DIRETOS CATECOLAMINAS

---

## NORADRENALINA

É o mediador químico das fibras pós-ganglionares do sistema simpático. Também é conhecida por Levarterenol e Norepinefrina.



# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **NORADRENALINA**

#### **Ações Farmacológicas**

É um potente estimulador  $\alpha$  (maior afinidade) e  $\beta_1$ , com fraca estimulação no  $\beta_2$ .

- **Coração**

Aumento da pressão sistólica e diastólica, aumento da resistência periférica e aumento da pressão média;

Débito cardíaco cai ou permanece inalterado;

Redução do fluxo cardíaco para os rins, fígado e músculo esquelético;

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **NORADRENALINA**

#### **Ações Farmacológicas**

- SNC – idem demais catecolaminas
- Metabólicos

A ativação de  $\alpha$  receptores proporciona o aumento da glicemia.

- Músculo liso não vascular

Efeitos muitos discretos e sem relevância.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **NORADRENALINA**

Absorção, Metabolismo e Excreção

Via I.V.

É degradada pela MAO e COMT e seus metabólicos são excretados na urina.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ISOPROTERENOL**

É uma catecolamina sintética também conhecida por isopropilnoradrenalina e isoprenalina. Maior afinidade pelos receptores  $\beta$ -adrenérgico das catecolaminas.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ISOPROTERENOL**

#### **Ações Farmacológicas**

- **Coração**

Redução da pressão média pela discreta elevação sistólica e evidente queda da diastólica;

Débito cardíaco incrementado pelos efeitos inotrópicos e cronotrópicos positivos;

Fluxo sanguíneo vascular esquelético se eleva acentuadamente;

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ISOPROTERENOL**

#### **Ações Farmacológicas**

- **Metabólicos**

A glicogenólise e a hiperglicemia é menos pronunciada;

Ocorre lipólise comparável à que ocorre com a adrenalina;

Pela estimulação  $\beta$  nas células pancreáticas ocorre aumento da liberação da insulina.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ISOPROTERENOL**

Absorção, Metabolismo e Excreção

Via I.V.. Sua absorção oral e sublingual é irregular e não confiável.

A degradação metabólica é feita pela COMT, sendo resistentes à ação da MAO.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **ISOPROTERENOL**

#### **Usos Clínicos**

Asma brônquica, bloqueio átrio-ventricular, choque cardiogênico e parada cardíaca.

#### **Reações Adversas**

São comuns: palpitações nos asmáticos.

Preparações Comerciais: ISUPREL<sup>R</sup>

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

**ESTIMULADORES SELETIVOS DOS RECEPTORES**

**ADRENÉRGICOS  $\beta_2$**

---

São substâncias que, partindo-se do isoproterenol, foram sintetizadas com ação específica nos receptores  $\beta_2$ :

- Metaproterenol (ALUPENT<sup>R</sup>),
- Terbutalina (BRYCANIL<sup>R</sup>),
- Salbutamol (AEROLIN<sup>R</sup>),
- Fenoterol (BEROTEC<sup>R</sup>), dentre outros

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

**ESTIMULADORES SELETIVOS DOS RECEPTORES**

**ADRENÉRGICOS  $\beta_2$**

## **Usos Clínicos**

A principal indicação é no alívio do broncoespasmo. Também eficazes contra o parto prematuro e no tratamento do aborto evitável.

## **Reações Adversas**

Os principais efeitos colaterais são; tremores, ansiedade, palpitações, taquicardia, arritmias cardíacas.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **DOPAMINA**

É uma catecolamina endógena, sendo um neurotransmissor central de grande importância.

Atua em receptores específicos dopaminérgicos e também em receptores  $\alpha$  e  $\beta$ .

É degradada pela MAO e COMT, não atravessa a BHE quando injetada.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **DOPAMINA**

#### **Ações Farmacológicas**

- **Efeitos cardiovasculares**

Possui efeito inotrópico positivo no miocárdio por ação direta nos receptores  $\beta_1$  ;

Freqüência cardíaca se eleva menos do que o que ocorre com o isoproterenol;

Os efeitos dopaminérgicos causam aumento da filtração glomerular, fluxo sanguíneo renal e da excreção de sódio (grande diferença)

# ADRENÉRGICOS DIRETOS

## CATECOLAMINAS

### DOPAMINA

#### Usos Clínicos

É usada na hipotensão arterial persistente, com resistência periférica baixa ou normal .

#### Preparações

No Brasil encontra-se em ampolas. DOPAMINA / DOPAMIN<sup>R</sup> / REVIVAN<sup>R</sup> .



#### Dopamina

- Solução de Dopamina (Revivan)  
Dopamina 50mg/10mL-----5 ampolas=50 mL  
SG 5,0%-----200 mL
- Dose: 2 a 50 microgramas/kg/min
- 1 mL = 1 mg = 1.000 microgramas
- p.ex.: 10microgramas X 50kg X 60 min. = 15.000 microgramas/hora = 15 mL/h
- Veia central.

# ADRENÉRGICOS DIRETOS CATECOLAMINAS

---

## DOBUTAMINA

É uma catecolamina sintética muito utilizada. Provoca estimulação nos receptores  $\beta_1$ .



# ADRENÉRGICOS DIRETOS

## CATECOLAMINAS

---

### DOBUTAMINA

#### Dobutamina

- Solução de Dobutamina (Dobutrex)  
Dobutamina 250mg/20mL-----20 ml  
ISG5,0%-----230 ml
- Dose: 2 a 30 microgramas/ min
- 1 ml= 1 mg= 1.000 microgramas
- **Veia periférica ou central**

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **DOBUTAMINA**

Doses excessivas podem provocar taquicardia, arritmias, cefaléias, ansiedade e tremores.

Tem ação rápida (2 minutos) e sua meia-vida plasmática é curtíssima (2 a 3 minutos).

Sua metabolização é rápida no fígado através da COMT.

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

### **DOBUTAMINA**

É a droga de escolha inicial para aumentar o inotropismo cardíaco na depressão da contratilidade miocárdica.

Pode ser encontrada em ampolas →  
**DOBUTAMINA / INOTAN<sup>®</sup> / DOBUTREX<sup>®</sup>**





Download from  
[DownloadTime.com](http://DownloadTime.com)

10000  
[DownloadTime.com](http://DownloadTime.com)

# **ADRENÉRGICOS DIRETOS**

## **CATECOLAMINAS**

---

- Nafazolina,
- tetraidrozolina,
- oximetazolina
- xilometazolina;
- Descongestionante nasal,
- Vasoconstrictor ocular

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **EFEDRINA**

Por ser  $\alpha$ -metilada resiste a ação da MAO e pode ser administrada oralmente. Sua meia-vida é longa se comparada às catecolaminas. Atua por liberação da NA e é um agonista direto em receptores  $\alpha$  e  $\beta$ .

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **EFEDRINA**

#### **Ações Farmacológicas**

- Seus efeitos cardiovasculares são semelhantes à adrenalina. Aumento da freqüência cardíaca, elevação da pressão média, sendo que a duração desses efeitos é dez vezes superior ao da adrenalina.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

### **EFEDRINA**

#### **Ações Farmacológicas**

- Pela ativação dos receptores  $\beta_2$  provoca broncodilatação e sua aplicação tópica provoca midríase por estimulação  $\alpha$ .
- Apresenta ações no SNC que se traduzem por: excitação, tremores e ansiedade.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **EFEDRINA**

Usos Clínicos

Tratamento da asma brônquica.

Reações Adversas

Insônia, agitação, ansiedade, tremores.

Palpitações, arritmias e elevação da pressão arterial.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **EFEDRINA**

#### **Preparações**

Geralmente são associadas a um tranquilizante e teofilina (broncodilatador).

**EFEDRINA / ARGYROPHEDRINE<sup>R</sup> / RINISONE<sup>R</sup>**



# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **METARAMINOL**

É utilizado exclusivamente na hipotensão arterial, sendo esse efeito hipertensor perdura por aproximadamente 90 minutos.

No Brasil é comercializado em ampolas.

**ARAMIN<sup>R</sup>.**

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **FENILEFRINA**

Eficaz por via oral, usado como descongestionante das vias aéreas superiores.

Na grande maioria das preparações encontra-se associado a um antihistamínico e/ou analgésico.

**EFEDRIN<sup>R</sup> / CORISTINA D<sup>R</sup> / RESPRIN<sup>R</sup> / COLDRIN<sup>R</sup>.**

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **ANFETAMINAS**

Tem ação predominante no SNC.

Seu mecanismo de ação consiste em liberar a NA nos terminais adrenérgicos e tem ação direta nos receptores.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **ANFETAMINAS**

#### **Ação Farmacológica**

Possui efeitos no SNC e pode provocar no sistema cardiovascular e no sistema respiratório ações semelhantes à efedrina.

#### **Uso Clínico**

obesidade (Anfepramona, Femproporex), hoje proibido

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

### **ANFETAMINAS**

#### **Reações Adversas**

Dependência psíquica, insônia, nervosismo, fadiga e tremores após o término do efeito. Doses elevadas causam efeitos psicóticos.

No Sistema Cardiovascular pode provocar palpitações, taquicardia, arritmias e crises hipertensivas.

# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

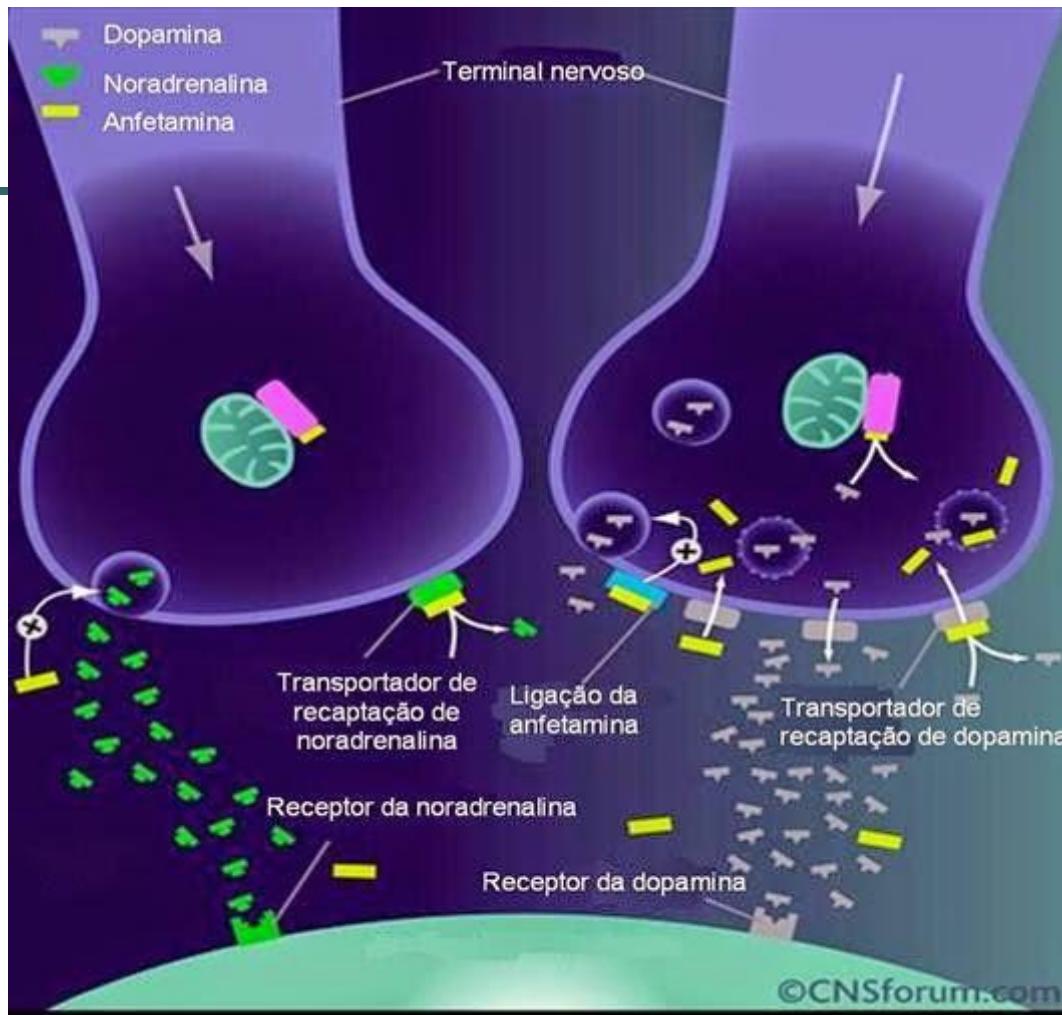
---

### **ANFETAMINAS**

Preparações Comerciais

Anfepramona- HIPOFAGIN S<sup>R</sup>,  
INIBEX S<sup>R</sup>.

Femproporex- DESOBESI-M<sup>R</sup>,  
LIPOMX AP<sup>R</sup>, NOBESE AP<sup>R</sup>.



# **DROGAS ADRENÉRGICAS**

## **AMINAS DE AÇÃO INDIRETA E MISTA**

---

INIBIDORES DA MAO → inibe o metabolismo das catecolaminas;

ANTIDEPRESSIVOS TRICÍCLICOS → inibem a recaptação da noradrenalina no SNC.

**SEM USO CLÍNICO EM VETERINÁRIA**

# **SNA**

**BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS**

# BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS

---

## 1. Diretos

- a) Anti $\alpha$ -adren.
- b) Anti $\beta$ -adren.

## 2. Indiretos : bloqueadores de neurônios adrenérgicos/depletores de catecolaminas

# BLOQUEADORES ALPHA ADRENÉRGICOS

## Seletividade relativa de antagonistas alpha 1 e 2

Prazosina	α 1
Trimazosina	
Corinatina	
Fenoxibenzamina	
Acepromazina	
Clorpromazina	
Fentolamina	
Piperoxano	
Tolazolina	
Ioimbina	
Rauwolscina	α 2

# BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS

---

## ALFA-BLOQUEADORES-PRAZOZIN

- Mecanismo de Ação

Interfere na transmissão simpática em local separado do receptor alfa, mas suficientemente próximo para alterar sua função, ou atua de forma singular no próprio receptor ( $\alpha_1$ ).

O efeito nos receptor  $\alpha_1$  provoca queda da resistência periférica e do retorno venoso ao coração, sendo observada a vasodilatação.

# BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS

---

## ALFA-BLOQUEADORES-PRAZOZIN

- Absorção, Metabolismo Excreção  
Absorvido por via oral;  
Liga-se fortemente à proteínas plasmáticas  
É extensamente biotransformado pelo fígado e eliminado pela urina. Sua  $\frac{1}{2}$  vida é de 3 horas.

# BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS

---

## ALFA-BLOQUEADORES-PRAZOZIN

- Ações Farmacológicas: as de maior interesse são as ações vasculares.
- No Homem o fluxo renal e a filtração glomerular não são alterados por essa droga.
- Usos Clínicos : é indicado na hipertensão pressão arterial.
- Preparações Comerciais: *MINIPRESS<sup>R</sup>*.

## **BLOQUEADORES ADRENÉRGICOS**

---

- $\beta$  bloqueadores seletivos para os receptores  $\beta_1$  e não seletivos;

# BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS

droga	Bloq. beta1	Bloq. Beta 2	T1/2	Dose “per os” mg - tid
Propranolol	+	+	1-2	5-40
Timolol	+	+	1-2	0,5-1
Nadolol	+	+	3-8	5-40
Oxeprenolol	+	+	2	5-40
Alprenolol	+	+	2	20-80
Metoprolol	+	-	1-2	5-40
Atenolol	+	-	3-6	20-80
Acebutolol	+	-	3-6	20-80
Bisoprolol				
Nebivolol				

# **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

## **Farmacocinética**

- Absorvidos por via oral
- Concentração plasmática é diferente de uma substância para outra.
- Excretados pelos rins

# **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

## Ações Farmacológicas

### 1. Coração

De modo geral os  $\beta$ -bloq. causam poucos efeitos no coração normal, se há uma potente ação adrenérgica os efeitos do  $\beta$ -bloq. são evidentes, havendo redução da freqüência cardíaca.

### 2. Brônquios

Impedem a broncodilatação simpática .

# **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

## Ações Farmacológicas

### 3. Útero

Como os estimulantes  $\beta_2$  reduzem a contratilidade uterina no parto prematuro, os  $\beta$ -bloqueadores inibem esse efeito podendo ocorrer o parto prematuro.

### 4. TGI

Os estímulos  $\beta$ -adrenérgicos inibem a musculatura gastro-intestinal.

## **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

### Ações Farmacológicas

#### 5. Olho

Estímulo  $\beta$ -adrenérgico leva à dilatação pupilar, e pela ação dos  $\beta$ -bloqueadores. é possível impedir-se a midríase.

# **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

## Usos Clínicos

Os  $\beta$ -bloqueadores têm sido usados principalmente na hipertensão arterial, podem também ser usados no infarto do miocárdio, angina, arritmias cardíacas, miocardiopatias, síndrome cardíaca funcional, glaucoma.

Em combinação com drogas vasodilatadoras

## **BLOQUEADORES BETA ADRENÉRGICOS**

---

### Reações Adversas

Insuficiência cardíaca, bloqueio átrio-ventricular, vasoconstrição periférica, broncoespasmos, bradicardia, hipoglicemia e hipotensão.

.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **RESERPINA**

- Mecanismo de Ação

Causa depleção de catecolaminas. das fibras simpáticas pós-ganglionares e da medula das adrenais.

A reserpina impede que a NA que sofreu recaptação seja estocada nas vesículas sinápticas.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **RESERPINA**

- Cinética

É absorvida por via oral, e em decorrência do seu efeito cumulativo requer de 2 a 3 semanas para exibir seu efeito máximo.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **RESERPINA**

- **Usos Clínicos**

Para o tratamento de hipertensos. Deve-se usar a dose oral.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **RESERPINA**

- Reações Adversas

Há casos de intensa depressão o que pode levar ao suicídio.

Aumenta a acidez gástrica.

Obstrução nasal, diarréia, impotência sexual, aumento de peso.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **RESERPINA**

- Preparações comerciais  
SERPASO<sup>R</sup> - comprimidos ou ampolas.

## **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

### **$\alpha$ -METILDOPA**

- Mecanismo de Ação  
É convertida em alfa-metilnorepinefrina, atua nos receptores pré-sinápticos reduzindo a neurotransmissão adrenérgica.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **$\alpha$ -METILDOPA**

- Usos clínicos  
Hipertensão arterial.
- Reações Adversas  
Sonolência, tontura, congestão nasal, redução da libido, sedação.
- Preparações  
Comprimidos de ALDOMET<sup>R</sup>

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **CLONIDINA**

- **Mecanismo de Ação**

Agonista alfa-adrenérgico com ação predominante nos receptores pré-sinápticos.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **CLONIDINA**

- **Usos Clínicos**

Além de sua eficácia anti-hipertensiva, tem sido usada em doses baixas na profilaxia da enxaqueca.

# **DROGAS QUE REDUZEM A FUNÇÃO DO NEURÔNIO ADRENÉRGICO**

---

## **CLONIDINA**

- Reações Adversas

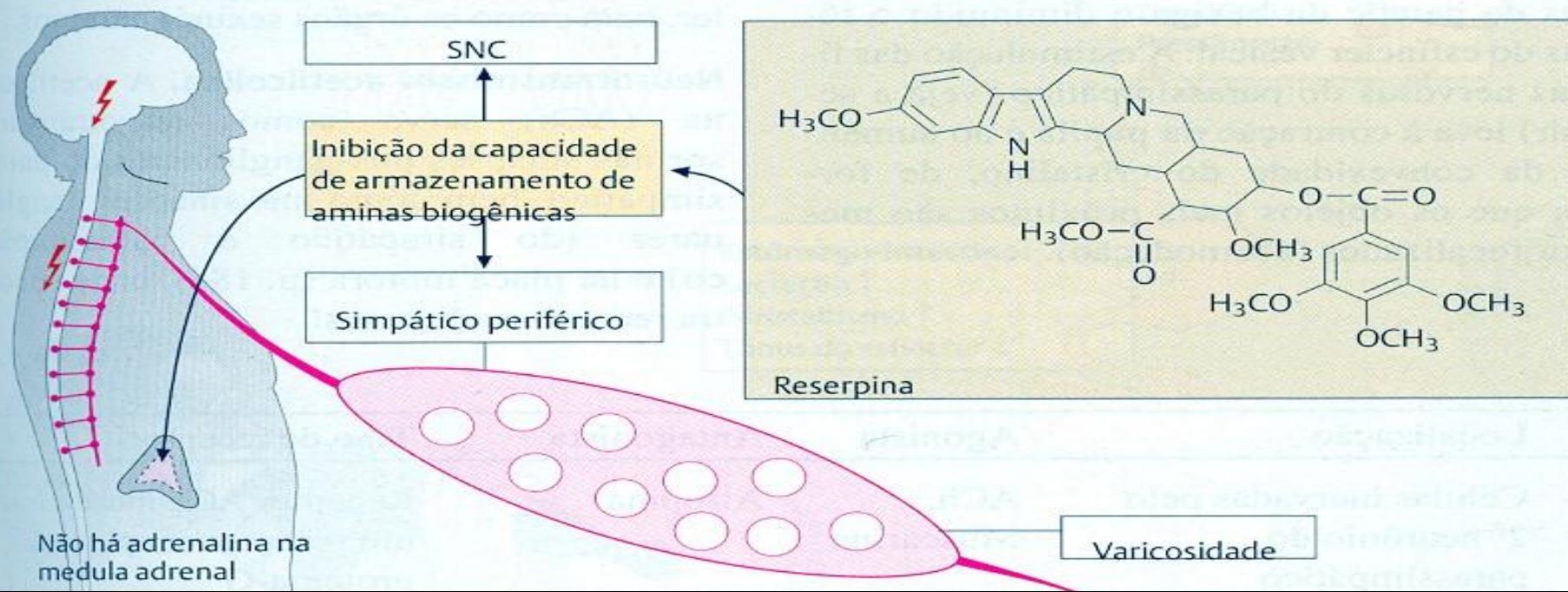
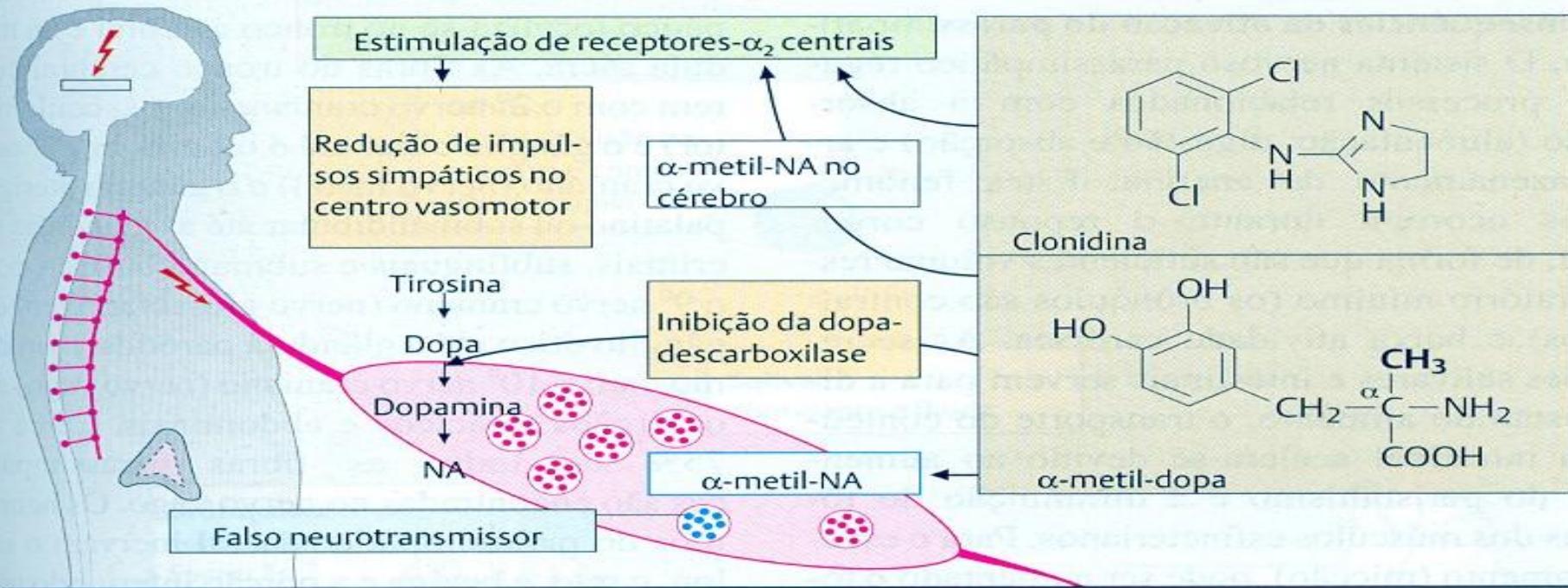
Sedação, hipotensão, impotência menor que o que ocorre com a alfa-metildopa.

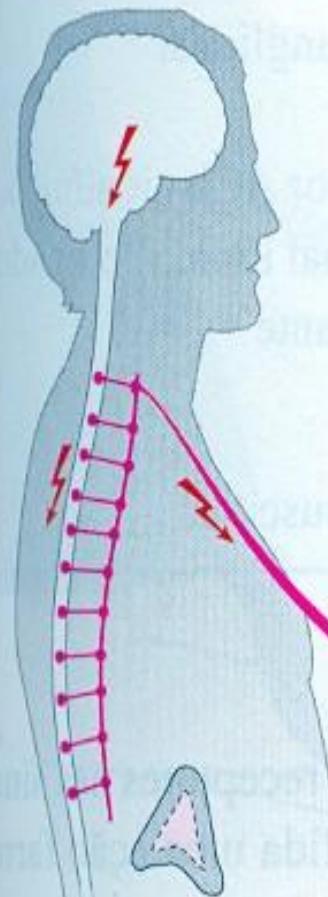
A suspensão de seu uso pode provocar uma hipertensão grave.

- Preparações

Comprimidos de ATENSINA<sup>®</sup> e CATAPRESAN<sup>®</sup>

## **A. Anti-simpaticotônicos**

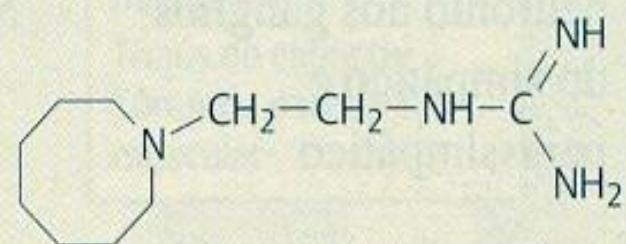




Inibição da propagação  
do estímulo elétrico no  
simpático periférico

Captação ativa e armazena-  
mento em lugar da no-  
radrenalina, sem neuro-  
transmissor

Sem interferência na liberação de  
adrenalina da adrenal



Guanetidina

Varicosidade

# EFEITOS ADVERSOS

---

- HIPOTENSÃO
- BRADICARDIA
- BRONCOCONSTRIÇÃO
- SEDAÇÃO
- DEPRESSÃO SNC

---

- **Fim**