

SIMPATICOMIMETICI DIRETTI NON SELETTIVI

| | |
|---------------|---|
| Adrenalina | sia α che β Uso: anestesia locale gravi reazioni allergiche arresto cardiaco |
| Noradrenalina | prevalentemente α Uso: nessuno |
| Dopamina | a basse concentrazioni: D_1 di vasi renali, mesenterici e coronarici a concentrazioni medie: anche β_1 e effetti indiretti a concentrazioni alte: anche α_1 e 5HT: vasocostrizione Uso: stati a bassa gettata cardiaca con compromessa funzione renale: shock ipovolemico, cardiogeno |

SIMPATICOMIMETICI INDIRETTI

Simpaticomimetici Indiretti

Agiscono stimolando il rilascio di catecolamine dai terminali nervosi

L'efficacia della risposta dipende da quante catecolamine sono presenti nel terminale nervoso. Di conseguenza l'uso ripetuto, (che causa continua perdita di neurotrasmettitore) provoca una riduzione della intensità della risposta, fenomeno che viene detto "Tolleranza" (tachifilassi se la tolleranza si instaura molto rapidamente)

Molti simpaticomimetici indiretti sono anche agonisti diretti dei recettori α_1

Sono prevalentemente utilizzati come vasocostrittori locali (decongestionanti vasali) oppure come eccitanti (sostanze d'abuso).

| | |
|-------------------|--|
| Amfetamina | Attivo in SNC anche su sistemi D e 5HT Uso: psicostimolante riduzione dell'appetito attention deficit hyperactivity disorders |
| Efedrina e simili | Attivo prevalentemente in periferia (passano con difficoltà la barriera emato-encefalica): uso come decongestionante nasale |

AGONISTI BETA NON SELETTIVI

| | |
|----------------|---|
| Isoproterenolo | β -selettivo solo a basse concentrazioni Uso: bradicardia grave e arresto cardiaco |
| Dobutamide | isomero (-): potente agonista α_1 isomero (+): potente antagonista α_1 e agonista β Uso: trattamento acuto di scompenso in cardiocirurgia o da infarto (emivita 2 min) |

AGONISTI BETA₂ SELETTIVI

| | |
|--------------------------|---|
| Metaproterenolo | |
| Terbutalina | |
| Albuterolo (Salbutamolo) | Uso: asma |
| Ritodrina | Uso: ritardare travaglio prematuro |
| Complicanze | Ansia e tremori muscolari (sia SNC che SNP): iniziare con bassi dosaggi Tachicardia (no in asma grave) Riduzione pO ₂ atriale per vasodilatazione del territorio polmonare Aumento nel sangue di glucosio, lattato, FFA Riduzione nel sangue di K ⁺ Tolleranza |

AGONISTI ALFA NON SELETTIVI

| | |
|--------------|--|
| Metossamina | α_1 (β): aumento P.A. con bradicardia Uso: ipotensione tachicardia parossistica atriale con ipotensione |
| Fenilefrina | α_1 Uso: ipotensione |
| Mefentermina | agonista α e agonista indiretto Uso: ipotensione in anestesia spinale |
| Efedrina | α e β e agonista indiretto Uso: decongestionante nasale e congiuntivale |

AGONISTI ALFA₂ SELETTIVI

| | |
|---------------------|--|
| Clonidina | α_2 periferici e centrali Effetti collaterali: sedazione e bocca secca nel 50% disfunzioni sessuali e bradicardia Eliminabili in parte per via transdermica Uso: ipertensione (aumenta riassorbimento di Na^+ , H_2O e NaHCO_3) sindrome da astinenza |
| α -Metildopa | falso neurotrasmettitore agonista α_2 |

ANTAGONISTI ALFA

α_1 : diminuiscono le resistenze periferiche: ipotensione ortostatica

α_2 : aumentano attività simpatica sia periferica che centrale

Fenossibenzamina irreversibile

Uso: feocromocitoma
ostruzione benigna prostatica (allevia)

Fentolamina Uso: feocromocitoma

crisi ipertensive da tiramina o da sospensione brusca
di terapia con clonidina

Prazosina

1000x più attivo su α_1 ; inibisce PDE

Uso: ipertensione. Riduce le resistenze periferiche senza
provocare tachicardia o aumento della
gettata cardiaca

insuff cardiaca congestizia: utile la venodilatazione
(riduzione del precarico)

Effetti collaterali: first dose phenomenon: ipotensione
posturale o sincope 60-90 min dopo prima sommin.

Alcaloidi dell'Ergot

antagonisti/agonisti su α_1 , 5HT, D

Uso: contrazione utero postparto
emicrania

ANTAGONISTI BETA

Antagonisti beta (anche detti "beta-bloccanti")

Si distinguono in base a:

- 1) relative affinità β_1/β_2
- 2) attività simpaticomimetica (agonista parziale)
- 3) blocco recettori α
- 4) farmacocinetica

ANTAGONISTI BETA NON SELETTIVI

| | |
|--------------|--|
| Propranololo | $\beta_1=\beta_2$; no att. simpaticom; no blocco α ; chinidino \approx |
| Nadololo | $\beta_1=\beta_2$; no att. simpaticom; no blocco α ; no chinidino \approx |
| Timolo | $\beta_1=\beta_2$; no att. simpaticom; no blocco α ; chinidino \approx ; $t_{1/2}$ breve Uso: ipertensione angina? glaucoma |
| Pindololo | $\beta_1=\beta_2$; att. simpaticom. a Uso: ipertensione in pazienti con ridotte riserve cardiache o propensione a bradicardia |
| Labetololo | 4 isomeri: $\beta_1=\alpha_1$; att. simpaticom β_2 ; inibitore reuptake 1 Uso: emergenze ipertensive |

ANTAGONISTI BETA₁ SELETTIVI

| | |
|-------------|---|
| Metoprololo | |
| Atenololo | $\beta_1 \gg \beta_2$; no att. simpaticom; no blocco α ; chinidino \approx Uso: ipertensione |