

Farmaci beta-bloccanti

Il nome "**betabloccanti**" deriva dal loro meccanismo d'azione: essi, infatti, agiscono legandosi in maniera specifica (o selettiva) ad una proteina, chiamata **recettore**. Il recettore a cui si lega è lo stesso a cui si legano anche gli ormoni e neurotrasmettitori **adrenalina e noradrenalina** (da qui il nome di **recettori β -adrenergici**). Adrenalina e noradrenalina sono chiamate anche **catecolamine** e, tra le loro diverse azioni, sono in grado di aumentare la frequenza cardiaca, di provocare un restringimento dei vasi sanguigni e di aumentare la pressione arteriosa. Il legame ai recettori β -adrenergici viene detto "competitivo", proprio perchè il farmaco betabloccante instaura con l'adrenalina e la noradrenalina una vera e propria gara a chi si lega ad un numero più alto di recettori.

In generale si distinguono **tre diversi tipi di recettori β -adrenergici**:

- β_1 , localizzati nel cuore, nel [rene](#) e negli occhi;
- β_2 , localizzati a livello della muscolatura liscia di diversi organi tra cui quelli dell'apparato genito-urinario, quello gastrointestinale e quello bronchiale. I β_2 , però, si trovano anche a livello della muscolatura scheletrica, come ad esempio quella del fegato;
- β_3 , localizzati soprattutto sulle membrane delle cellule di grasso, dove stimolano la digestione dei lipidi.

Nella terapia delle malattie cardiovascolari, i **betabloccanti più utilizzati** sono quelli con selettività per i recettori β_1 .

Come vengono classificati i farmaci betabloccanti?

Non esiste una classificazione univoca per categorizzare i farmaci betabloccanti. Essi sono generalmente classificati sia sulla base della loro interazione con i recettori adrenergici e sia su base "gerarchica", come:

- non selettivi, o di prima generazione;
- β_1 selettivi (particolarmente indicati per le patologie cardiovascolari) o di seconda generazione;
- β_1 selettivi con azione vasodilatatoria o di terza generazione.

I **betabloccanti di prima generazione** sono principi attivi che agiscono sia sui **recettori β_1 che β_2 -adrenergici in maniera non selettiva**. È in questa categoria che si trova il **propranololo**, a cui si uniscono altre tre importanti molecole: il *nadololo*, *pindololo* e il *timololo*.

Tra i **betabloccanti di seconda generazione** troviamo l'*atenololo*, il *bisoprololo*, l'*acebutololo*, il *metoprololo* e l'*esmololo* (solo in casi di emergenza): queste molecole svolgono un'**azione selettiva sui recettori β_1 localizzati a livello cardiaco**. Ad alte dosi, però, interagiscono anche sui recettori β_2 . I betabloccanti di seconda generazione sono particolarmente indicati nei pazienti che soffrono anche di altre patologie come il [diabete](#), l'asma o la Bronco Pneumopatia Cronica Ostruttiva (BPCO), malattia respiratoria cronica, poiché non vengono coinvolti meccanismi che possono provocarne il peggioramento.

I **betabloccanti di terza generazione**, come il *carvedilolo* e il *labetalolo*, sono caratterizzati da **effetti aggiuntivi dovuti all'interazione con altri recettori specifici** (gli α_1 adrenergici), che provocano una dilatazione dei vasi sanguigni (azione vasodilatatoria).

Esiste poi anche un altro gruppo di betabloccanti di terza generazione, capaci sia di stimolare un'azione vasodilatatoria, mediante l'ossido nitrico, sia di svolgere un'azione selettiva sui recettori β_1 adrenergici. Le molecole che possiedono queste caratteristiche sono il *celiprololo* e il *nebivololo*.

Qual è il meccanismo d'azione dei farmaci betabloccanti?

Anche se hanno tutti profili di attività simili (fenomeno chiamato effetto di classe), i **betabloccanti** differiscono tra di loro per le seguenti caratteristiche:

- affinità per i recettori β_1 e β_2 ;
- capacità di evitare ritmi cardiaci troppo lenti (attività simpaticomimetica intrinseca);
- capacità di evitare aritmie cardiache;
- attività competitiva o antagonistica anche nei confronti dei recettori α .

Questi farmaci sono in grado di influenzare la forza di contrazione del cuore e la frequenza cardiaca. Inoltre, possono stimolare vie secondarie che regolano la pressione arteriosa e la vasodilatazione, interagendo con un sistema localizzato a livello renale (il sistema renina-angiotensina) o con il rilascio di ossido nitrico (NO), un potente vasodilatatore.

Quando vengono utilizzati i farmaci betabloccanti?

I **farmaci betabloccanti** sono usati sia da soli (mono-terapia) che insieme ad altri farmaci (poli-terapia).

Le patologie per cui è prevista la loro prescrizione sono tante e molto diverse tra di loro: in tutte sono stati dimostrati i loro benefici.

La patologia per eccellenza, comunque, per cui i farmaci betabloccanti sono considerati “salva vita” è l'**insufficienza cardiaca**, ovvero quando il cuore è incapace di pompare sangue nelle arterie in maniera sufficiente.

Di seguito elenchiamo altri casi in cui i **farmaci betabloccanti** sono utilizzati:

- in seguito ad infarto miocardico, come prevenzione secondaria;
- per prevenire o trattare irregolarità del battito cardiaco come aritmie o fibrillazione atriale;
- dolore al petto (angina pectoris);
- per curare l'emicrania;
- come trattamento del tremore essenziale;
- per controllare stati di ansia e tachicardia su base ansiosa;
- come coadiuvante nella terapia per curare un eccesso di ormoni tiroidei (tireotossicosi);
- come trattamento di disturbi del cuore come la cardiomiopatia ipertrofica ostruttiva;
- come trattamento di un tumore raro delle ghiandole surrenali, chiamato feocromocitoma;
- come profilassi della ipertensione della vena porta nel paziente affetto da cirrosi;
- come terapia degli emangiomi cutanei del neonato.

Quali sono gli effetti collaterali dei farmaci betabloccanti?

Data la molteplicità di meccanismi d'azione, molto diversi anche all'interno della stessa categoria, è possibile che gli **effetti collaterali provocati dai farmaci betabloccanti** siano di diversa natura.

In generale queste molecole sono ben tollerate e la maggior parte degli effetti indesiderati è di grado lieve.

Eventuali **effetti collaterali** più gravi dipendono dall'**azione betabloccante** e possono essere:

- peggioramento dell'insufficienza cardiaca;
- blocco cardiaco, cioè un ritardo nella conduzione della corrente elettrica nel cuore;
- broncospasmo, cioè una contrazione anomala ed eccessiva della muscolatura liscia dei bronchi, che porta al loro restringimento e quindi ad una riduzione del passaggio di aria nei polmoni con conseguente difficoltà respiratoria. Il broncospasmo viene osservato con maggior frequenza nei pazienti con disturbi ostruttivi ai bronchi. In questo caso i farmaci betabloccanti β_1 selettivi sono quelli più indicati, visto che i recettori dei bronchioli sono di tipo β_2 .

Altri effetti indesiderati più frequentemente riportati, con una forte componente soggettiva, sono **stanchezza** e **estremità fredde**. Inoltre, i **farmaci betabloccanti** possono interferire con il **metabolismo degli zuccheri**, destabilizzando il controllo della glicemia; per questo motivo devono essere usati con cautela, soprattutto nei pazienti con diabete difficile da controllare.

È stato riportato anche un calo della libido con casi di impotenza maschile: l'incidenza di questo effetto è comunque molto bassa, anche se è stata enfatizzata, nonostante la mancanza di evidenze scientifiche.

Non sono state riportate reazioni indesiderate nei neonati [allattati al seno](#) da madri in cura con *propranololo* o con altri farmaci betabloccanti.