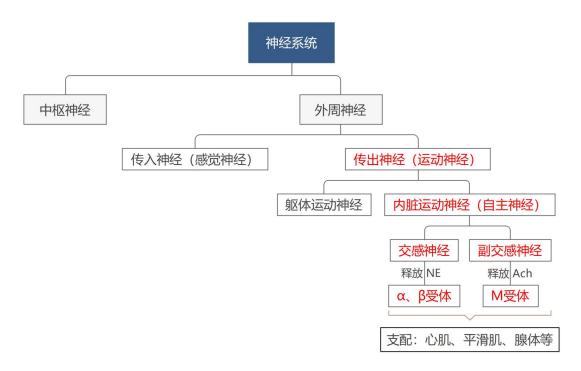
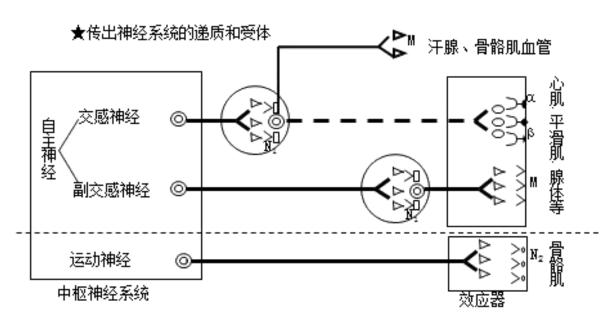
第一章 传出神经系统药理学概论

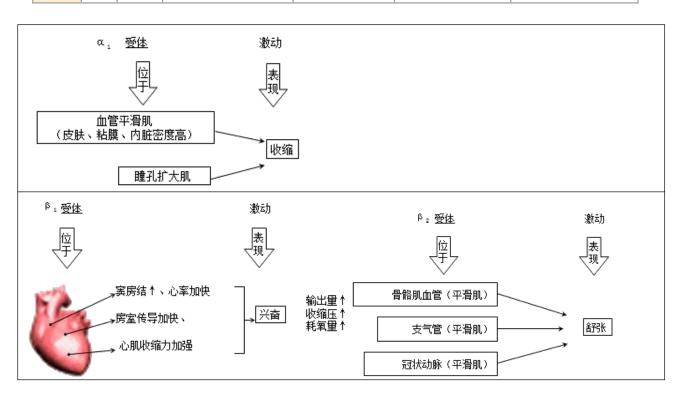
一、传出神经系统的组成



二、传出神经系统的递质和受体

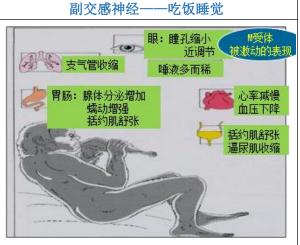


| | 受体 | | 位置 | 作用 | 激动剂 | 拮抗剂 |
|----------------|-----------------|-----------|---------------------------------|-----------------------|---------------|-----------------------------|
| 胆碱 | N 受 体 | N1 受体 | 中枢神经系统、自主神经节后神经元 | 神经节的兴奋 传递 | 烟碱 | 六烃季铵 美加明 筒箭毒碱 银环蛇毒 |
| 能受体 | | N2 受体 | 神经-骨骼肌终板膜 | 骨骼肌收缩 | | 十烃季铵 戈拉碘铵 |
| | M受体 | | 副交感神经节后纤 维、少数交感神经节 后纤维 | 副交感神经兴 奋的表现 | 毒蕈碱 | 阿托品 |
| | α 受 体 | α 1 受体 | 血管平滑肌(皮肤、 黏膜、内脏密度高) 瞳孔开大肌 | 收缩 瞳孔扩大 | 去甲肾上腺素 | 哌唑嗪 酚妥拉明 |
| 肾上 腺素 能受 | 44 | α 2 受体 | 小肠平滑肌、腺体 | 舒张 | 去甲肾上腺素 可乐定 | 育亨宾 酚妥拉明 |
| 体 | β 受 体 | β1 受体 | 心肌 | 心率加快 传导加快 收缩力增强 | 肾上腺素 | 美托洛尔 阿替洛尔 普萘洛尔 |
| | 14 4 | β2 受体 | 骨骼肌血管、支气 管、冠状动脉平滑肌 | 舒张 | 肾上腺素 特步他林 | 心得乐 普萘洛尔 |



三、传出神经系统的生理功能





四、传出神经系统药物分类

| 拟似药 | | 拮抗药 | |
|-----------|--|-----------|---|
| 胆碱受 体激动 药 | M、N 受体激动药(卡巴胆碱) M 受体激动药(毛果芸香碱) N 受体激动药(烟碱) | 胆碱受 体阻断 药 | M 受体阻断药 非选择性 M 受体阻断药 (阿托品) M1 受体阻断药 (哌仑西平) M2 受体阻断药 (戈拉碘铵) M3 受体阻断药 N 受体阻断药 N 受体阻断药 NN 受体阻断药 (六甲双铵) NM 受体阻断药 (琥珀胆碱) |
| 抗胆碱酯 | 指酶药 (新斯的明) | 胆碱酯酶 | 5复活药(碘解磷定) |
| | 1.α 受体激动药 | | 1.α受体阻断药 |
| | α ₁ 、α ₂ 受体激动药(去甲肾上腺素) α ₁ 受体激动药(去氧肾上腺素) | | α_1 、 α_2 受体阻断药(酚妥拉明、酚苄明) α_1 受体阻断药(哌唑嗪) |
| 肾上腺 | α2受体激动药(可乐定) | 肾上腺 | α2 受体阻断药(育亨宾) |
| 素受体 | 2.α、β受体激动药(肾上腺素) | 素受体 | $\begin{bmatrix} 2. \alpha_1, \alpha_2, \beta_1, \beta_2 \emptyset$ 体阻断药 (拉贝洛尔) |
| 激动药 | 3.β 受体激动药 | 阻断药 | 3.β受体阻断药 |
| | β1、β2受体激动药(异丙肾上腺素) | | β ₁ 、β ₂ 受体阻断药(普萘洛尔) |
| | β 1 受体激动药(多巴酚丁胺) | | β1 受体阻断药(阿替洛尔) |
| | β2受体激动药(沙丁胺醇) | | β₂ 受体阻断药 (布他沙明) |

第二章 胆碱受体激动药

| M 胆碱受体激动药 | 胆碱酯类 | 乙酰胆碱、醋甲胆碱、卡巴胆碱、贝胆碱 |
|--------------------|------|--------------------|
| WI四侧文件像列列 | 生物碱类 | 毛果芸香碱、毒蕈碱 |
| N 胆碱受体激动药 烟碱 (尼古丁) | | 丁) |

| | M 受体激动药 |
|----|---|
| | 一、心血管系统 |
| | 1. 心脏: 负性频率作用(大剂量)、负性肌力作用、负性传导作用、缩短心房不应 |
| | 期 |
| | 2. 血管: 全身血管扩张 |
| | 3. 血压: 短暂↓,反射性心率加快 |
| | 二、平滑肌系统 |
| | 1. 胃肠道: 收缩幅度和频率↑分泌↑。 |
| | 2. 泌尿道:输尿管和逼尿肌收缩、括约肌舒张 |
| 乙酰 | 3. 支气管: 收缩 |
| 胆碱 | 4. 子宫: 收缩(未孕),已孕舒张 |
| | 三、眼 |
| | 瞳孔缩小、调节痉挛(近视) |
| | 四、腺体 |
| | 泪腺、气管和支气管腺体、唾液腺、消化道腺体、汗腺分泌增加 |
| | 五、神经节和骨骼肌 |
| | 收缩 |
| | 六、中枢 |
| | 不易透过血脑屏障进入中枢 |
| 醋甲 | 1.主要用于口腔粘膜干燥症或偶用于支气管高敏性的诊断 |
| 胆碱 | 2.禁忌症: 支哮、甲亢、冠脉缺血、溃疡病 |
| ьп | 1 .对肠道和膀胱作用明显,用于 <mark>术后腹气胀和尿潴留</mark> |
| 卡巴 | 2.主要用于局部滴眼治疗青光眼 |
| 胆碱 | |
| 贝胆 | 兴奋胃肠道和泌尿道平滑肌,广泛用于 <mark>术后腹气胀、胃张力缺乏症及胃滞留</mark> |
| 碱 | |

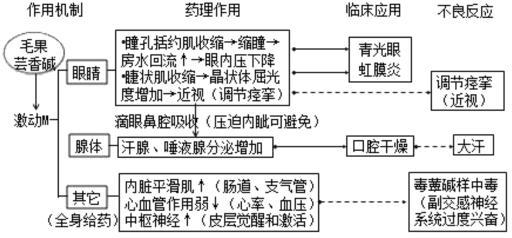
毛果芸香碱 1.眼:瞳孔缩小,降低眼内压,调节痉挛 2.腺体: 汗腺、唾液腺分泌明显增加,泪腺、胃腺、胰腺、小肠腺体和呼吸道黏膜分 泌增加 药理 3.平滑肌: 兴奋胃肠道平滑肌、支气管平滑肌 作用 4.心血管系统: 小剂量静脉注射→心率血压短暂下降 先用 N 受体阻断药,再用毛→升压 M 受体阻断药可拮抗上述两种作用(机制不清) 1.青光眼: 闭角型疗效好, 开角型有一定疗效. 临床 2.虹膜炎: 与扩瞳药交替应用 应用 3.胆碱受体阻断药阿托品中毒解救 4.头颈部肿瘤放疗的干燥综合征 1.过量可出现 M 胆碱受体过度兴奋状态,可用阿托品解救 不良

【毛果芸香碱的药理作用、临床应用和不良反应】

2.滴眼时应压迫内眦,避免药业流入鼻腔

3.支气管哮喘禁用

反应



| N 胆碱受体激动药 | | |
|-------------|-------------------------|--|
| | 可兴奋自主神经节和神经肌肉接头的 N 胆碱受体 | |
| 烟碱(尼古丁) | 作用呈双向性: 先兴奋、后抑制 | |

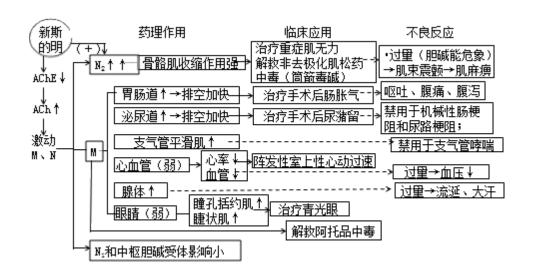
第三章 乙酰胆碱酯酶抑制药和复活药

一、易逆性胆碱酯酶抑制剂

| 作用机制 | 抑制 AChE 的活性, 致使 ACh 不能被水解而大量堆积, 从而激动 M 受体和 N |
|------------|--|
| | 受体,产生 M 样作用和 N 样作用 |
| | 1. 眼:缩瞳、调节痉挛 |
| | 2. 胃肠道: 兴奋 |
| 药理作用 | 3. 骨骼肌神经肌肉接头: 兴奋 |
| | 4. 心血管系统:心脏抑制(三负)、大剂量血压下降 |
| | 5. 其他部位: 腺体分泌,细支气管、输尿管平滑肌收缩 |
| | 1. 重症肌无力: 新斯的明、溴吡斯的明、安贝氯铵 |
| | 2. 腹气胀和尿潴留: 新斯的明 |
| 临床应用 | 3. 青光眼: 毒扁豆碱、地美溴铵 |
| 個/水巡用 | 4. 解毒: 竞争性神经肌肉阻滞药过量中毒时解毒,主要用新斯的明、依酚氯 |
| | 铵和加兰他敏 |
| | 5. 阿尔兹海默病: 多奈哌齐、利凡斯的明、加兰他敏 |

二、常用的易逆性胆碱酯酶抑制剂

| | | 1.兴奋骨骼肌(也可直接兴奋) | |
|---------------|----------------------------------|-------------------------------|--|
| | 药理作用 | 2.兴奋胃肠道平滑肌 | |
| | | 3.心血管系统 | |
| | | 1.重症肌无力 | |
| 新斯的明 | 体中共田 | 2.非除极(竞争性)肌松药中毒(如筒箭毒碱) | |
| | 临床应用 | 3.腹气胀,尿潴留 | |
| | | 4.阵发性室上性心动过速 | |
| | 不良反应 | 胆碱能神经过度兴奋,阿托品解救 | |
| | 禁忌症 | 机械性肠梗阻、泌尿道阻塞者 | |
| 溴吡斯的明 | 似新斯的明,缓效长效;重症肌无力、麻痹性肠梗阻、术后尿潴留 | | |
| 丰 白三74 | 局部治疗青 | 光眼; 比毛果芸香碱强效长效 | |
| 毒扁豆碱 | 阿托品等抗 | 胆碱药中毒可用毒扁豆碱 | |
| (依色林) | 全身毒性反 | 应较重,大剂量可致呼吸麻痹 | |
| 依酚氯铵 | 不宜用于治疗用药,用于 <mark>诊断重症肌无力</mark> | | |
| 安贝氯铵 | 重症肌无力 | | |
| 加丝仙樹 | 重症肌无力 | 、脊髓灰白质炎后遗症、竞争性神经肌肉阻滞药过量中毒时解毒、 | |
| 加兰他敏 | 阿尔兹海默 | 病 | |
| 地美溴铵 | 无晶状体畸形开角型青光眼 | | |



三、难逆性抗胆碱酯酶药



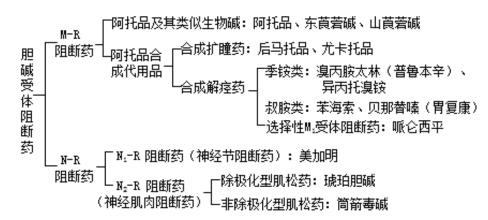
四、AChE 复活药

| 有效基团 | 肟基 |
|------------|---|
| | 1. 碘解磷定(碘化醛肟吡胺,派姆):静脉给药,用于中、重度有机磷酸酯类 |
| 代表药物 | 重度,可使 AChE 复活,但对"老化"的磷酰化 AChE 无效,故需 <mark>早期使用</mark> 。 |
| 1人农到初 | 2. 氯解磷定: 较多用,静注或肌注 |
| | 3. 双复磷:用于重度中毒患者 |
| | ①复活胆碱酯酶——肟基与磷酰基结合,AChE 游离复活 |
| | ②与体内游离的有机磷酸酯直接结合——阻止其与 AChE 结合 |
| | ③对神经肌肉接头处的 N2 受体有明显作用——迅速制止肌束震颤 |
| 药理作用 | ④可改善中枢中毒症状,对 M 样作用弱 |
| 约理作用 | ⑤对体内堆积的 ACh 无作用——故 <mark>应与阿托品合用</mark> |
| | ⑥对乐果中毒无效 |
| | ⑦t1/2 短,需重复用药 |
| | ⑧对老化的胆碱酯酶无效 |

<u>拟胆碱药</u>

拟胆碱药分两类,兴奋受体抑制酶; 毛果芸香作用眼,外用治疗青光眼; 新斯的明抗酯酶,主治重症肌无力; 毒扁豆碱毒性大,作用眼科降眼压。

第四章 胆碱受体阻断药

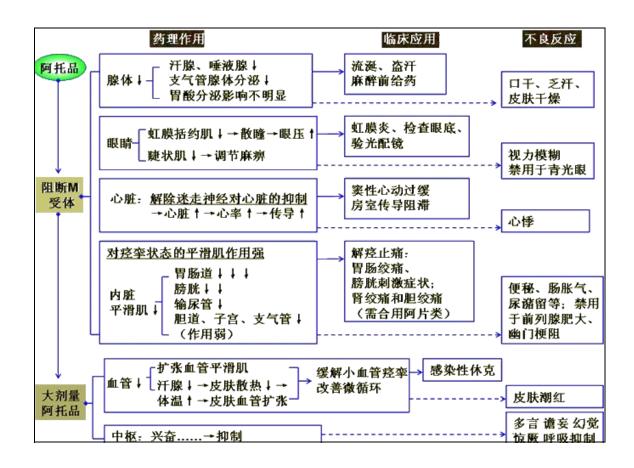


一、M 胆碱受体阻断药

| | <mark>阿托品</mark> |
|------------|---|
| | 1.心脏: 心率短暂 ↓ (阻突触前 M1 受体), 较大剂量使心率 ↑ (阻突触后 |
| | M2 受体); 房室传导↑ |
| | 2.血管: 治疗量阿托品对血管、血压 <mark>无明显影响</mark> ,较大剂量可引起 <mark>血管舒张</mark> , |
| | 机制不明,可能是由于出汗减少,机体体温升高所致。 |
| 药理作用 | 3.平滑肌: 松弛,胃肠道>输尿管和膀胱>胆道、支气管和子宫;对胃酸形成无 |
| 到理作用 | 影响,对消化性溃疡无效 |
| | 4.眼:扩瞳,升高眼内压,调节麻痹 |
| | 5.腺体:分泌减少 。对 唾液腺和汗腺 作用最强, 汗腺抑制→体温↑; 对胃酸(组 |
| | 胺)、胰腺胆汁肠液(体液)作用效微。 |
| | 6.中枢: 大剂量兴奋 |
| | 1.抗心律失常:治疗窦性心动过缓、窦房阻滞、房室传导阻滞等缓慢型心律失 |
| | 常。加速心率而加重心肌缺血,缺血性心脏病慎用。 |
| | 2.抗休克:严重感染致中毒性休克解除血管痉挛,改善微循环,但伴高热心动 |
| | 过速时不用。 |
| 临床应用 | 3.解除平滑肌痉挛: 缓解内脏绞痛(胆绞痛、肾绞痛需与镇痛药合用)、遗尿 |
| | 4.眼科应用: 虹膜睫状体炎、验光、检查眼底 |
| | 5.抑制腺体:麻醉前给药,盗汗、流涎症 |
| | 6.有机磷酸酯类中毒和某些含胆碱能物质的蘑菇中毒解救(进入 CNS 能力在这 |
| | 些治疗中重要) |
| 不占己出 | 与剂量有关,当一种药理作用作为治疗作用时,其他作用即成为副作用 |
| 不良反应 | 随剂量增大依次为: 腺眼平心血中枢 |
| 禁忌症 | 青光眼,幽门梗阻,前列腺肥大,休克伴心动过速或高热 |
| 体内过程 | 脂溶性高,口服后由胃肠道迅速吸收。血浆蛋白结合率 50% |

阿托品

莨菪碱类阿托品,抑制腺体平滑肌; 瞳孔扩大眼压升,调节麻痹心率快; 大量改善微循环,中枢兴奋须防范; 作用广泛有利弊,应用注意心血管。 临床用途有六点,胃肠绞痛立即缓; 抑制分泌麻醉前,散瞳配镜眼底检; 防止"虹晶粘",能治心动缓; 感染休克解痉挛,有机磷中毒它首选。



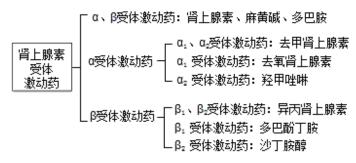
| 后马托品 | 扩瞳药 ,用于成人眼底检查 | | |
|-----------|--|----------------------|--|
| 溴化丙胺太林 | 解痉药季铵类,口服差,用于胃和十二指肠溃疡,胃肠痉挛,泌尿道痉挛, | | |
| (普鲁本辛) | 遗尿症, 妊娠呕吐 | | |
| 贝那替秦 | 解痉药叔铵类,用于兼有焦虑症的溃疡 | 汤病患者 (抑胃酸,安定) | |
| 苯海索 | 易通过血脑屏障,中枢作用强 →帕金 | 森病 | |
| 异丙托溴铵 | →慢性阻塞性肺疾病、支气管哮喘 | | |
| 哌仑西平 | 选择性 M1 受体阻断,减少胃酸和胃蛋白酶的分泌,用于 <mark>胃和十二指肠溃</mark> | | |
| 替仑西平 | 疡,不易进入 CNS | | |
| | 【药理作用】 | 【临床应用】 | |
| | ①抑制腺体分泌, 抑制中枢强 | ①麻醉前给药 (优于阿托品) | |
|) 东莨菪碱 | ②抑制神经内耳功能,大脑皮质功能, | ②晕动症,妊娠呕吐 | |
| 3,000,000 | 胃肠道蠕动 | ③帕金森病 (震颤流涎) | |
| | ③中枢抗胆碱 | 不良反应、禁忌症同阿托品 | |
| | | 【临床应用】 | |
| | ①抑制腺体分泌弱,扩瞳弱, 无中枢 | ①感染中毒性休克(似阿托品) | |
| 山莨宕碱 | 作用 | ②内脏平滑肌绞痛 | |
| | ②解除血管平滑机痉挛,微循环障碍 | 不良反应、禁忌症同阿托品 | |
| | ③解除平滑肌痉挛 | | |

二、M 胆碱受体阻断药

| ····································· | | | |
|---------------------------------------|------------------------------------|--|--|
| | 骨骼肌松弛作用快而短暂,易于控制。颈部开始,至肩胛、四肢、腹部。颈 | | |
| | 部四肢作用最明显,呼吸肌最弱,但对喉头和气管肌作用强。 | | |
| 药理作用 | 1. 抗胆碱药加重本类药物肌松作用 | | |
| 约垤117用 | 2. 最初出现短暂不协调的肌束颤动 | | |
| | 3. 连续用药可出现快速耐受 | | |
| | 4. 治疗量无神经节阻断作用 | | |
| | 1. 静注适用于气管内插管、气管镜、食管镜等短时操作 | | |
| 临床应用 | 2. 全麻辅助药 | | |
| 個/水巡用 | 3. 电休克治疗 | | |
| | 个体差异大 | | |
| | 1. 窒息或呼吸暂停: 特别是遗传性胆碱酯酶缺乏 | | |
| | 2. 肌束颤动 | | |
| 不良反应 | 3. 血钾升高 | | |
| | 4. 发热 | | |
| | 5. 增加腺体分泌,促进组胺释放 | | |
| 禁忌症 | ①清醒患者 | | |
| | ②血钾较高者 | | |
| | ③青光眼、白内障摘除患者 | | |
| | ④胆碱酯酶缺陷、严重肝功能不全、营养不良和电解质紊乱者慎用 | | |
| 体内过程 | 进入血液被假性胆碱酯酶水解,新斯的明抑制假性 AchE, 延长其作用 | | |

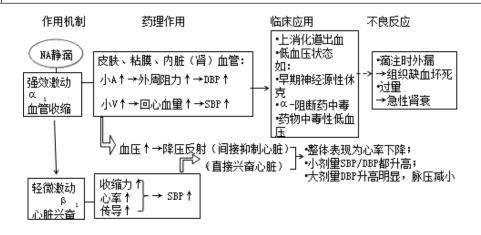
| | 筒箭毒碱 |
|-----------|--|
| 计四 | 肌松从眼和头部开始,至颈部四肢躯干,继而肋间隙松弛出现腹式呼吸,剂 |
| 药理作用 | 量过大累及膈肌,呼吸麻痹死亡 恢复次序相反 |
| 临床应用 | 快速肌肉松弛, <mark>全麻辅助用药</mark> ,作用时间较长,用药后不易逆转,不良反应 |
| | 多,现已少用 |
| 不良反应 | 阻断神经节,释放组胺,使心率减慢,血压下降,支气管痉挛唾液分泌过多 |
| | 大剂量呼吸肌麻痹,进行人工呼吸,用 <mark>新斯的明</mark> 对抗 |
| 禁忌症 | 重症肌无力,支气管哮喘,严重休克 |
| 体内过程 | 口服难吸收,主要静注给药 |

第五章 肾上腺素受体激动药



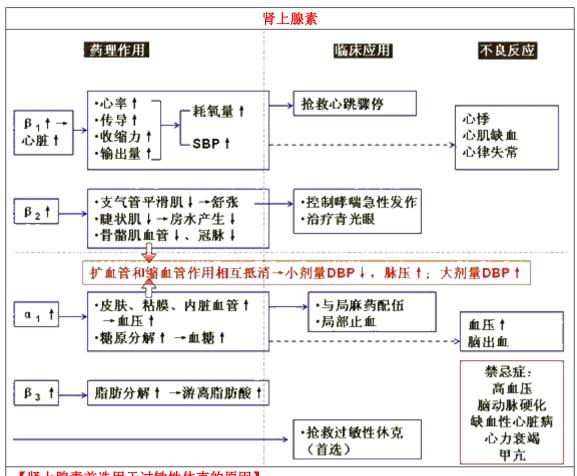
一、α 受体激动药

去甲肾上腺素 主要激动 α 受体,对心脏β ,受体也有较弱的激动作用 1. 血管: ①激动血管 a, 受体: 使血管收缩。具体表现为小动脉和小静脉收缩, 以皮肤黏膜血管 收缩最明显,其次是对肾血管的收缩,脑、肝、肠系膜、骨骼肌血管也呈收缩反应,结 果使外周阻力明显增加,器官血流量减少。 药理 ②激动心脏β,受体:心脏兴奋,心肌代谢产物(如腺苷)增加→直接舒张冠状血管 作用 2. 心脏: 激动心脏 β, 受体, 使心肌收缩性增强、心率加快、传导加速、心排血量增加。 但是在整体情况下,由于血压急剧↑,反射性兴奋迷走神经,使心率减慢。此外,由于 外周阻力增加,心排血量不变或反而下降。 3. 血压: ①小剂量→心脏兴奋,收缩压 ↑,血管收缩不明显,舒张压升高不多→脉压 ↑ ②大剂量→收缩压、舒张压均明显 ↑ , 脉压变小, 组织灌流量 ↓ 1. 休克(暂时措施): 升高血压,主要用于各种休克早期血压骤降,还可用于休克补足 临床 血容量后血压仍不能回升者或外周阻力明显降低及心排量减少者,如心源性休克。 应用 2. 上消化道出血: 食管静脉曲张破裂出血及胃出血,去甲肾上腺素稀释后分次口服。 3. 药物中毒性低血压:中枢神经系统抑制药中毒引起的低血压(特别是氯丙嗪)。 1. 局部组织缺血坏死:滴注液外漏或注射部位皮肤苍白、疼痛→立即停止注射,热敷, 并用普鲁卡因或 α 受体阻断药酚妥拉明局部浸润注射,以扩张收缩的血管。 不良 2. 急性肾衰竭: 肾血管收缩导致少尿、无尿和肾实质损伤→用药期间尿量至少保持在每 反应 小时 25m1 以上, 否则立即减量或停用, 必要时甘露醇利尿。 3. 停药后血压下降: 长期处于收缩状态的静脉在停药后迅速扩张,有效循环血量↓,血 压↓,故应逐渐减少剂量和减慢滴速后停药。 高血压、动脉粥样硬化、器质性心脏病、少尿、无尿、严重微循环障碍以及孕妇禁用 禁忌症



| | ①既能直接激动 a 受体,也可促进去甲肾上腺素 (NA) 的释放发挥间接作用。 |
|-------|---|
| 间羟胺 | ②收缩血管,升高血压作用较去甲肾上腺素 <mark>弱而持久</mark> 。 |
| (阿拉明) | ③对肾脏血管的收缩作用也较弱,不易引起肾衰和心律失常,因此已取代去甲肾 |
| | 上腺素用于抗休克。 |
| | ①主要激动 a 受体,作用弱而持久,能产生长时间的血管收缩效应 |
| 去氧肾上 | ②耳鼻喉科:缓解由于鼻黏膜充血引起的鼻塞 |
| 腺素 | ③眼科:滴眼液用于 <mark>散瞳</mark> |
| | ④升高血压,通过反馈机制终止室上性心动过速 |
| 甲氧明 | 用于终止 <mark>室上性心动过速</mark> ,缓解手术氟烷麻醉时出现 <mark>低血压</mark> 。 |

二、α、β 受体激动药



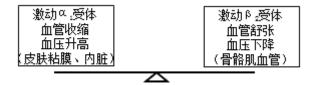
【肾上腺素首选用于过敏性休克的原因】

- ①收缩小 A 和毛细血管前括约肌, 使血管通透性降低, 减少渗出消除水肿→缓解喉头水肿
- ②改善心脏功能,强心→升压
- ③解除支气管平滑肌痉挛→扩张气管,改善通气功能
- ④抑制过敏介质释放→抑制过敏反应的发生

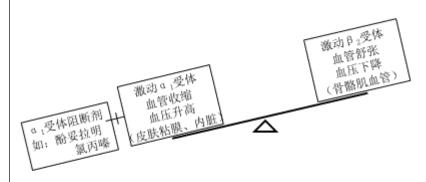
【肾上腺素升压作用的翻转】

如果事先给予 α 受体阻断药(如酚妥拉明),再给予肾上腺素,则升压作用翻转为降压作用。

①肾上腺素对血管的作用:



②肾上腺素与α,受体阻断药同时存在时对血管的作用:



③故: α.受体阻断剂引起的低血压不能用肾上腺素解救,只能用 α.受体的激动剂,即去甲肾上腺素来解救。如:氯丙嗪

去甲肾上腺素

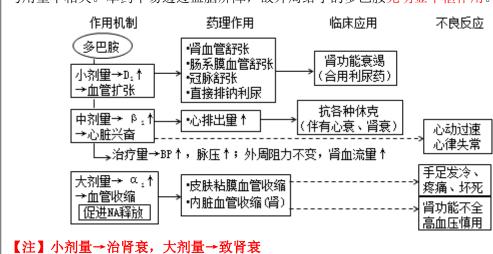
去甲强烈缩血管,升压作用不翻转, 只能静滴要缓慢,引起肾衰很常见, 用药期间看尿量,休克早用间羟胺。

肾上腺素

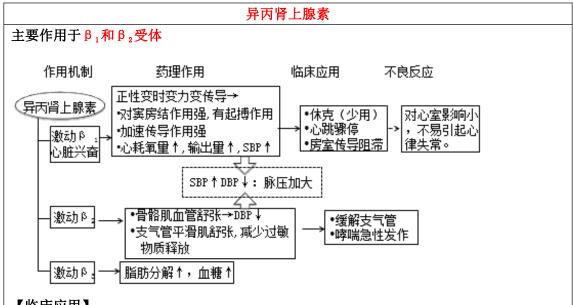
α、β受体兴奋药,肾上腺素是代表; 血管收缩血压升,局麻用它延时间, 局部止血效明显,过敏休克当首选, 心脏兴奋气管扩,哮喘持续它能缓, 心跳骤停用"三联",应用注意心血管, α 受体被阻断,升压作用能翻转。

多巴胺("尿多")

口服无效,主要静脉给药;5min 内起效,t1/2 约为 2min,持续 $5\sim10min$,作用时间的长短与用量不相关。本药不易透过血脑屏障,故外周给予的多巴胺<mark>无明显中枢作用</mark>。



三、β 受体激动药



【临床应用】

- (1) 支气管哮喘: 用于控制支气管哮喘急性发作, 舌下或喷雾给药, 起效快, 作用强。
- (2) 房**室传导阻滞:** 治疗 II、Ⅲ度房室传导阻滞,舌下含药或静脉滴注给药。
- (3) 心脏骤停: 适用于心室自身节律缓慢,高度房室传导阻滞或窦房结功能衰竭而并发的 心搏骤停,常与去甲肾上腺素或间羟胺合用作心室内注射。
- (4) 休克: 适用于血容量已补足而心排血量较低、外周阻力较高的休克患者。

【禁忌证】冠心病、心肌炎、甲亢

异丙肾上腺素

异丙扩张支气管,哮喘急发它能缓,

扩张血管治"感染",血容补足效才显。

兴奋心脏复心跳,加速传导律不乱,

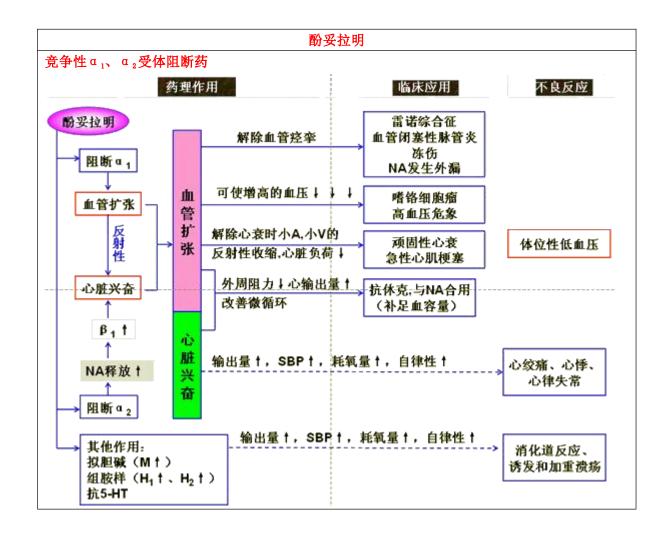
哮喘耐受防猝死,甲亢冠心切莫选。

| | ⊙选择性激动β.受体,兴奋心脏 |
|-------|--|
| 多巴酚丁胺 | ●主要增强心肌收缩力和增加心排出量,对心率影响弱 |
| | ○主要用于治疗心肌梗塞并发心力衰竭(短时使用) |
| | 心脏手术后心排血量降低的休克 |
| | ◆选择性激动支气管平滑肌上的β。受体 ┏┓ |
| 沙丁胺醇 | ◆ → ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ ・ |
| (舒喘灵) | ₹> |
| | ❖是临床上治疗支气管哮喘的—线药物 |
| | \triangle |
| | ◆同类药物:克仑特罗、沙美特罗、特布他林、奥西那林。 |

第六章 肾上腺素受体阻断药

一、 α 受体阻断药

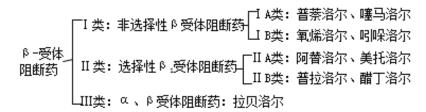
| 酚苄明 | | |
|------------|--|--|
| 药理作用 | 非选择性 a 受体阻断药,非竞争性结合 a 1、 a 2 受体,起效慢、作用强、持久、不可逆 | |
| | 1. 心血管: 阻断外周血管收缩,外周阻力下降→反射性心率加快 | |
| | 2. 肾上腺素"翻转"作用: 酚苄明与肾上腺素联合用药→血压下降 | |
| 临床应用 | 主要用于治疗嗜铬细胞瘤 | |
| 不良反应 | 直立性低血压、心悸、恶心、呕吐。 | |
| | 可诱发心动过速,禁用于冠状动脉灌注量减少的病人。 | |



哌唑嗪、特拉唑嗪、多沙唑嗪

- ①选择性 α , 受体竞争性阻断药
- ②主要用于治疗高血压,也可用于肾上腺嗜铬细胞瘤和休克的治疗
- ③首剂效应: 首次应用时,因严重低血压可能导致患者晕厥或昏迷,可减量或睡觉时服药
- ④可减少膀胱颈和前列腺平滑肌张力,适用于良性前列腺肥大患者
- ⑤不良反应: 直立性低血压、头晕、头痛、嗜睡、鼻充血、能量缺乏。

二、β受体阻断药



注: A类药物均无内在拟交感活性(ISA)

(ISA)

B类药物均有内在拟交感活性(ISA) 普萘洛尔 非选择性 β 受体阻断药 1. 心脏: 心率、收缩力、传导↓,心排血量和心肌耗氧减少 药理 2. 外周血管: 心排量 ↓ 导致外周血流量减少→降低血压 作用 3. 支气管平滑肌: 收缩→诱发或加重哮喘急性发作 4. 增加钠潴留: 血压降低可减少肾血流量→增加钠潴留和血流量→可合用利尿剂 5. 干扰糖代谢:减少糖原分解和胰高血糖素分泌→合用胰岛素可导致严重低血糖 6. 阻断异丙肾上腺素作用 1. 高血压 2. 青光眼: 减少睫状小体房水分泌,降低眼压,主要用于慢性青光眼 临床 3. 偏头痛: 阻断儿茶酚胺类引起的脑血管收缩 应用 4. 甲亢: 用于甲亢及甲状腺中毒 5. 心绞痛: 减少劳力性心绞痛发生,对慢性稳定型心绞痛有效,对急性心绞痛无效 6. 心肌梗死: 有心梗病史患者预防性服用可对抗心梗再次发作 1. 支气管收缩: 禁用于阻塞性通气障碍患者 不良 2. 反跳现象: 不能突然停药, 否则因停药反跳引起严重心律失常、心绞痛、高血压等 反应 3. 性功能障碍 4. 代谢紊乱: 合用胰岛素可导致严重低血糖 作用机制 药理作用 临床应用 不良反应 ・心室下降 →輸出量減少 •慢性心力衰竭 ● 蓄蒸洛尔 > 诱发急性左心衰 - 收缩力下降 → 耗氧量下降 •心绞痛 1加重房室传导阻滞 阻断β •传导减慢 •高血压 →血压下降 心脏抑制 •窦速(首选) 肾素分泌 →血压下降 ≯甲亢 | 抑制T4→T3 诱发变异性心绞痛 •冠脉收缩 •支气管平滑肌收缩 诱发支气管哮喘 阻断り 手脚冰凉 •骨骼肌血管收缩 合用胰岛素,可 •糖异生↓、糖原分解↓ 导致严重的低血 メ脂肪分解↓、VLDL↑、TG↑ 阻断件。 大剂量→膜稳定作用(奎尼丁样作用) 抗血小板聚集 •青光眼、偏头痛 其它作用 无内在拟交感活性

β 受体阻断药 (洛尔类)

洛尔兄弟一大片,对抗交感降血压; 临床治疗高血压,心律失常心绞痛。 三条禁忌记心间,哮喘心衰心动缓。 β1-长在心脏上,阻断效果是四降; 降率降传降耗氧,降低输出降血压; β2-长在气管上,还有冠脉和腿上; 阻断无益反不良,哮喘急冠和肢凉。

| 美托洛尔 艾司洛尔 | ①选择性β ₁ 受体阻断药→可消除对支气管的收缩作用 ②可用于伴有肺功能受损的高血压病人、心绞痛 ③对呼吸道作用不肯定,哮喘病人仍需慎用 |
|--------------|--|
| 吲哚洛尔 | ① B 受体阻断药,有内在拟交感活性,ISA(弱的激动 B 1 和 B 2 受体作用) ②有 ISA 作用的药物抑制心肌收缩力、减慢心率和收缩支气管作用较弱 ③用于伴有中度心动过缓的高血压 |
| 拉贝洛尔 | ①具有β和α ₁ 受体阻断作用,可降低血压 ②用于治疗因外周血管阻力增加所致的中度或重度高血压、妊娠高血压 ③不良反应:直立性低血压、眩晕 |