



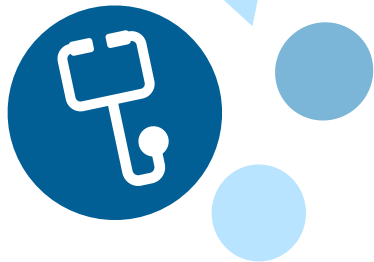
第三章

呼吸系统疾病用药



呼吸系统疾病症状





第一节

镇咳药

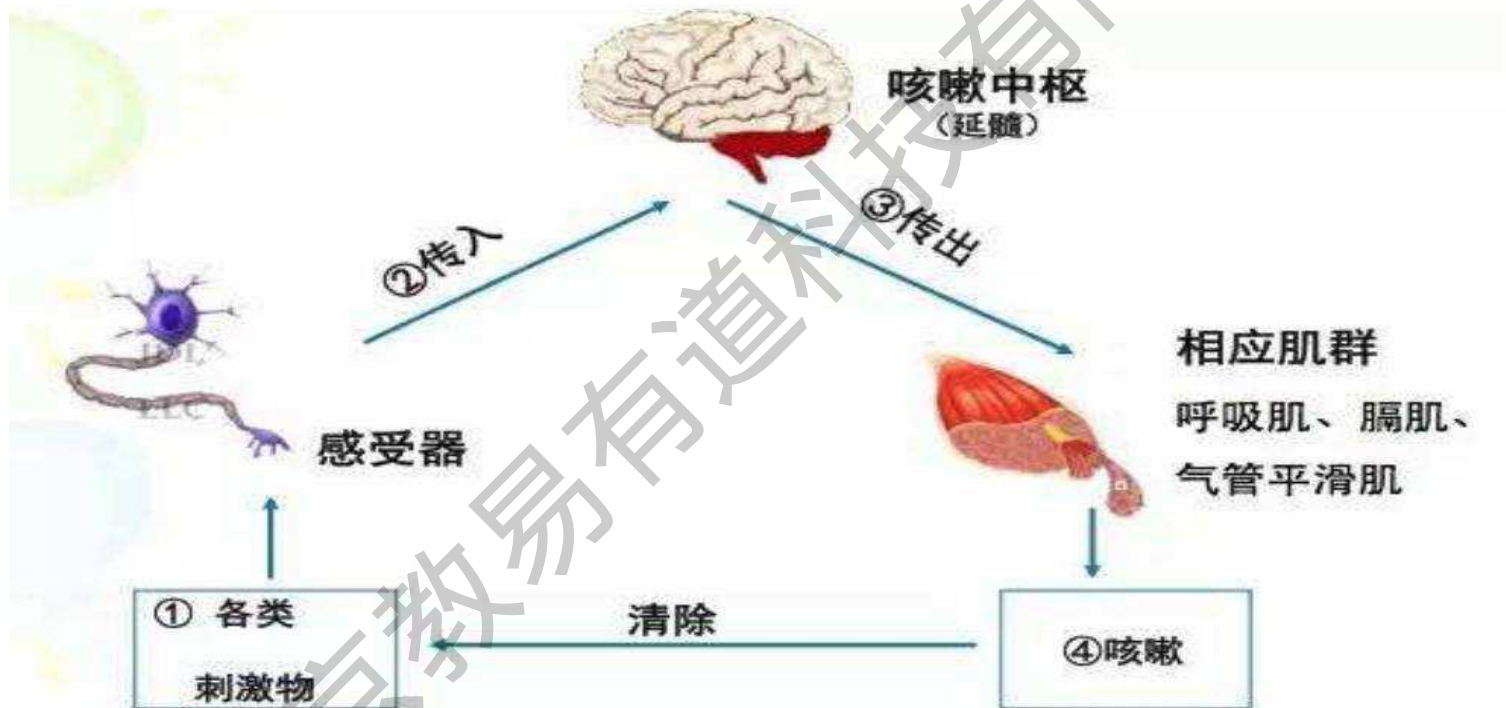


引起咳嗽的原因

1. 疾病--急性或慢性支气管炎、支气管哮喘、鼻炎
2. 药物--血管紧张素转换酶抑制剂、抗心律失常药胺碘酮、抗结核药对氨基水杨酸钠、抗肿瘤药博来霉素或环磷酰胺
3. 环境--吸烟、雾霾、环境污染



咳嗽反射

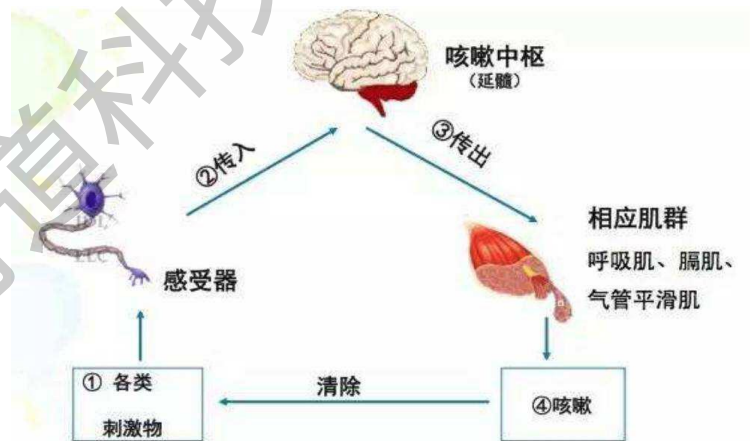


镇咳药分类

药物类型		代表药物
中枢性	麻醉性	可待因、福尔可定
	非麻醉性	右美沙芬、喷托维林
外周性		——
中枢兼外周		苯丙哌林、依普拉酮

一、药理作用与作用机制

中枢性镇咳药选择性地抑制延髓的咳嗽中枢，抑制支气管腺体的分泌，产生中枢性镇咳作用。



二、临床用药评价



(一) 作用特点

1. 中枢性镇咳药可使痰液黏稠，黏痰难以咳出，故痰多黏稠患者不宜单独使用，痰多者宜与祛痰药合用。
2. 特别适用于无痰、干咳患者。
3. 高龄患者、肝功能不全患者、肾功能不全患者宜从小剂量开始，逐步增加至适宜剂量。
4. 除镇咳外，中枢性镇咳药通常还有较强的镇痛、镇静作用，可用于中度以上疼痛、局麻或全麻时镇静。

二、临床用药评价

可待因

- ①镇咳作用强而迅速，约为吗啡的 $1/4$
- ②适用于各种原因引起的剧烈干咳和刺激性咳嗽，尤其适合于伴有胸痛的剧烈干咳，
- ③具有成瘾性



二、临床用药评价

喷托维林

- ①镇咳作用强度约为可待因的1/3
- ②对普通感冒、支气管炎或鼻窦炎等疾病引起的干咳效果较好。
- ③奋乃静、丁螺环酮、水合氯醛、溴苯那敏等药可增强本品中枢神经系统和呼吸系统的抑制作用
- ④禁用于2岁以下儿童

二、临床用药评价

福尔可定

- ①具有与可待因相似的镇咳、镇痛作用，
缓解干咳的效果比可待因好
- ②成瘾性比可待因小，呼吸抑制较吗啡弱
- ③儿童对福尔可定耐受性较好
- ④不引起便秘或消化功能紊乱



二、临床用药评价



苯丙哌林

①非麻醉性镇咳药，兼具中枢性及外周性镇咳作用，并具有罂粟碱样平滑肌解痉作用

②镇咳作用较强，为可待因的2-4倍

③不抑制呼吸，不引起胆道和十二指肠痉挛、便秘

④无成瘾性，未发现耐受性

⑤服用时需整粒吞服，切勿嚼碎，以免引起口腔麻木

二、临床用药评价

右美沙芬

①镇咳强度与可待因相等或略强

②无镇痛作用，主要用于干咳

③治疗剂量不抑制呼吸

④长期应用未见耐受性和成瘾性

⑤用于各种原因引起的干咳，包括上呼吸道感染(如感冒和咽炎)、支气管炎等引起的咳嗽



二、临床用药评价



中枢性镇咳药属于对症治疗药物，用药7日如症状未缓解，宜停药就诊。

并且服药期间不得驾驶车、船，从事高空作业、机械作业及操作精密仪器。

(二) 典型不良反应和禁忌

1. 典型不良反应包括成瘾性、兴奋、幻想、惊厥、便秘、心率增快、情绪激动、耳鸣、口干、口咽喉部麻木感等。
2. 患者重复使用中枢性镇咳药可产生耐药性，久用有成瘾性，但常用量引起的依赖性比吗啡类药物弱。
3. 长期用药要预防便秘。

(三) 药物相互作用

1. 乙醇及其他中枢系统抑制剂可增强中枢性镇咳药的中枢抑制(镇静)作用，故用药期间不宜饮酒。

2. 与单胺氧化酶抑制剂合用可出现痉挛、反射亢进、异常发热、昏睡等，故正在使用单胺氧化酶抑制剂患者及单胺氧化酶抑制剂停药不满2周的患者禁用。



(四) 特殊人群用药

1. 中枢性镇咳药通常可透过胎盘屏障，使胎儿成瘾，引起新生儿的戒断症状(啼哭、打喷嚏、打哈欠、腹泻、呕吐等)，呼吸抑制，故妊娠期妇女禁用。

多数可自乳汁排出，哺乳期妇女慎用。

2. 由于呼吸抑制、镇静的副作用，一般不宜给儿童应用，1岁以下儿童禁用。

三、代表药品

可待因

【适应证】

- ①镇咳，用于较严重的频繁干咳，如痰液量较多宜并用祛痰药。
- ②镇痛，用于中度以上的疼痛。
- ③镇静，用于局麻或全麻时。



三、代表药品

【临床应用注意】

1. 可待因系麻醉药品，有成瘾性，采购、运输、储存、处方开具、使用等环节必须遵守麻醉药品相关规定。
2. 胆结石患者使用本品可引起胆管痉挛。
3. 可引起瞳孔变小，故颅脑外伤或颅内病变者慎用。
4. 前列腺肥大患者使用本品易引起尿潴留而加重病情。
5. 前药，若儿童为超快代谢型基因，易出现嗜睡、呼吸困难、中毒甚至致死，因此12岁以下儿童禁用。



应用分析

【2017A】关于镇咳药作用强度的比较，正确的是（ ）。

- A. 喷托维林>苯丙哌林>可待因
- B. 可待因>苯丙哌林>喷托维林
- C. 苯丙哌林>喷托维林>可待因
- D. 苯丙哌林>可待因>喷托维林
- E. 喷托维林>可待因>苯丙哌林

应用分析

【2017A】关于镇咳药作用强度的比较，正确的是（ ）。

- A. 喷托维林>苯丙哌林>可待因
- B. 可待因>苯丙哌林>喷托维林
- C. 苯丙哌林>喷托维林>可待因
- D. 苯丙哌林>可待因>喷托维林
- E. 喷托维林>可待因>苯丙哌林

【答案】D

【2016B 48-49】

- A. 右美沙芬
- B. 氯化铵
- C. 可待因
- D. 苯丙哌林
- E. 羧甲司坦

48. 具有成瘾性的中枢性镇咳药是()。

49. 没有成瘾性，兼有中枢和外周镇咳作用的药品是()。

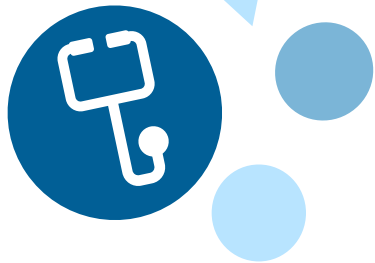
【2016B 48-49】

- A. 右美沙芬
- B. 氯化铵
- C. 可待因
- D. 苯丙哌林
- E. 羧甲司坦

48. 具有成瘾性的中枢性镇咳药是()。

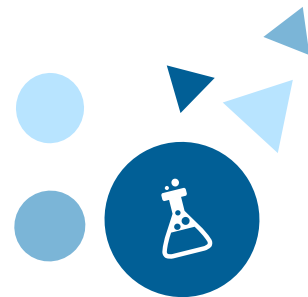
49. 没有成瘾性，兼有中枢和外周镇咳作用的药品是()。

【答案】CD



第二节

祛痰药



按作用机制分类

- 恶心性祛痰药
- 刺激性祛痰药
- 黏痰溶解剂
- 黏液稀释剂



第一亚类

恶性性祛痰药



一、药理作用与作用机制



1. 作用机制

刺激胃黏膜→轻微的恶心→支气管黏膜腺体分泌增加→降低痰液黏性→易于咳出

2. 临床应用

适用于呼吸道感染引起的咳嗽、多痰

二、临床用药评价



1. 尤其适用于干咳、咳嗽伴黏稠痰的患者。
2. 对症治疗，不宜长期使用，用药7日症状未缓解应停药。
3. 中枢性不良反应，如头晕、嗜睡外，由于对胃黏膜刺激作用较强，故存在胃肠道反应，表现为恶心、呕吐、胃肠不适等。

三、代表药品

氯化铵

【适应证】

- ①干咳以及痰不易咳出等。
- ②酸化尿液。
- ③纠正代谢性碱中毒。



三、代表药品

【临床应用注意】

1. 吸收后，氯离子进入血液和细胞外液，使尿液酸化，可纠正代谢性碱中毒，但代谢性酸中毒患者忌用。
2. 本品与磺胺嘧啶、呋喃妥因呈配伍禁忌。
3. 肝、肾功能严重损害，尤其是肝昏迷、肾功能衰竭、尿毒症患者禁用。

三、代表药品



愈创甘油醚

【适应证】用于呼吸道感染引起的咳嗽、多痰。

【临床应用注意】

1. 肺出血、肾炎、急性胃肠炎患者禁用。
2. 妊娠3个月内妇女禁用。
3. 消化道溃疡者、过敏体质者、妊娠期及哺乳期妇女慎用。

第二亚类

黏痰溶解剂



一、药理作用与作用机制

1. 药物：溴己新、氨溴索、乙酰半胱氨酸
2. 分解痰液中的黏液成分，如黏多糖和黏蛋白，使黏痰液化，痰液黏度降低而易于咳出。
3. 本类药物均适用于痰液黏稠不易咳出的患者。
4. 桉柠蒎由桃金娘科桉属和芸香科桔属及松科松属植物的提取物所组成，主要成分为桉油精、柠檬烯及 α -蒎烯，与标准桃金娘油有效成分相似。

二、临床用药评价

1. 祛痰作用：氨溴索 > 溴己新

2. 乙酰半胱氨酸(祛痰解毒)

①具有较强的黏痰溶解作用，不仅能溶解白色黏痰，也能溶解脓性痰，雾化吸入祛痰效果显著优于氨溴索、溴己新、糜蛋白酶。

②口服吸收后存在首关效应，生物利用度极低。

③适用于大量黏痰阻塞而引起的呼吸困难。

④还可用于对乙酰氨基酚中毒的解救，治疗环磷酰胺引起的出血性膀胱炎。

二、临床用药评价



3. 桉柠蒎

①除促进黏痰溶解外，还有抗炎作用

②减轻支气管黏膜肿胀、扩张支气管，可用于支气管造影术后促进造影剂的排出。

4. 属于对症治疗，如使用7日后未见好转，应及时就医。避免与中枢性镇咳药(右美沙芬等)同时使用，以免稀化的痰液堵塞气道。

三、代表药品

氨溴索

【适应证】用于伴有痰液分泌异常或排痰功能不良引起的痰液黏稠而不易咳出者。

【临床应用注意】

氨溴索注射液(pH5.0)不能与pH大于6.3的溶液混合，因为pH升高会导致本品游离，产生沉淀。

三、代表药品



乙酰半胱氨酸

【适应证】用于痰液黏稠引起的呼吸困难、咳痰困难

【临床应用注意】

1. 颗粒剂用温开水(禁用80℃以上热水)溶解后直接服用, 也可加入果汁服用。
2. 酸性药物降低疗效, 加服适量碳酸氢钠能增强疗效。
3. 本品与镇咳药不应同时服用, 因为镇咳药对咳嗽反射的抑制作用可能会导致支气管分泌物的积聚。

三、代表药品

4. 本品能减弱青霉素、头孢菌素、四环素类药物的抗菌活性，故不宜与这些抗菌药物合用。必需合用时，间隔4小时以上或交替用药。

5. 与硝酸甘油合用会导致明显的低血压并增强颞动脉扩张。如必须合用，应监控患者是否有低血压现象(可能引起严重的低血压)，并警告头痛发生率增加。

6. 不可与活性炭同服。



三、代表药品

7. 巯基化合物，易被氧化，可与金属离子络合，储存期间应避免接触空气、氧化剂、某些金属、橡胶。

8. 吸入溶液或水溶液中有硫化氢的臭味，部分患者可引起恶心、呕吐、流涕、胃炎等，偶可引起咯血。

9. 对呼吸道黏膜有刺激作用，故有时引起呛咳或支气管痉挛。支气管哮喘、有消化道溃疡病史者慎用。

第三亚类

黏液稀释剂



一、药理作用与作用机制

羧甲司坦是较常用的黏液稀释剂，药理作用为：

- ①分裂黏蛋白、糖蛋白多肽链上的分子间的二硫键，使分子变小，降低痰液的黏度，并改变其组分和流变学特性，调节黏液分泌。
- ②增加黏膜纤毛的转运，从而增加痰液排出。
- ③改善呼吸道分泌细胞的功能，修复黏膜，促进气管分泌。

④抑制支气管杯状细胞的增生。

⑤对抗炎症和修复黏膜，增加抗菌药物向支气管黏膜和上皮组织的渗透，提高抗菌药物在气道药物浓度，并抑制血浆的渗出。

【适应证】主要适用于慢性支气管炎、支气管哮喘等疾病引起的痰液黏稠、咳出困难。

二、临床用药评价



1. 用药7日后如症状未缓解，应立即就医。
2. 消化道溃疡活动期禁用。妊娠期、哺乳期妇女，消化道溃疡史患者，过敏体质者，2岁以下儿童慎用。
3. 避免同时服用强效镇咳药，以免痰液堵塞气道。



应用分析

【2015A】伴有大量痰液并阻塞呼吸道的病毒性感冒患者，在服用镇咳药的同时，应及时联合应用的药品是（ ）。

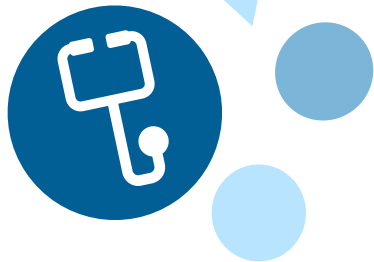
- A. 左氧氟沙星
- B. 羧甲司坦
- C. 泼尼松龙
- D. 多索茶碱
- E. 右美沙芬

应用分析

【2015A】伴有大量痰液并阻塞呼吸道的病毒性感冒患者，在服用镇咳药的同时，应及时联合应用的药品是（ ）。

- A. 左氧氟沙星
- B. 羧甲司坦
- C. 泼尼松龙
- D. 多索茶碱
- E. 右美沙芬

【答案】B



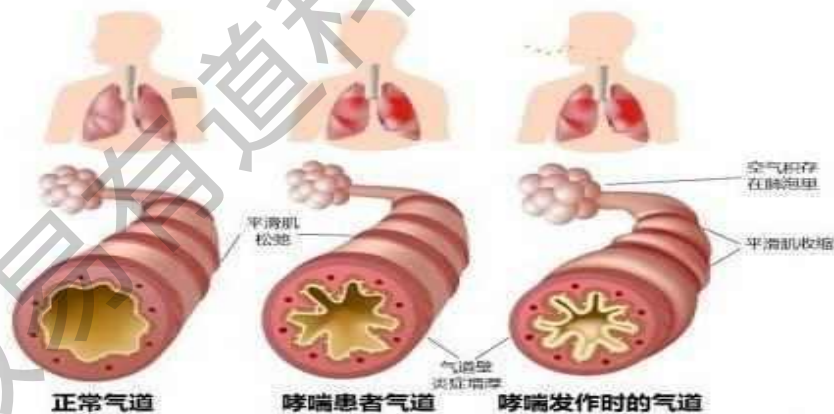
第三节

平喘药



哮喘

哮喘发病的本质基础是支气管平滑肌广泛性收缩(痉挛)，使气道通气受阻而引起呼气性呼吸困难，呈现喘息性吸入困难，并伴有哮鸣音的肺部变态反应。



平喘药按治疗目的分类



- ①第一类是控制症状类药物(抗炎)——每日使用
- 吸入性肾上腺皮质激素(ICS)，ICS与长效 β_2 受体激动剂复方制剂(ICS/LABA)，全身性肾上腺皮质激素，白三烯调节剂(LTRA)，缓释茶碱，抗IgE单克隆抗体
- ②第二类是缓解症状类药物(急救药物)——按需使用
- 速效吸入和短效口服 β_2 受体激动剂(SABA)、ICS与福莫特罗复方制剂、全身性肾上腺皮质激素、吸入型抗胆碱能药物、短效茶碱

平喘药按作用机制分类

- ① β_2 受体激动剂：沙丁胺醇、特布他林、沙美特罗
- ② M胆碱受体阻断剂：异丙托溴铵
- ③ 黄嘌呤类药物：XX茶碱
- ④ 过敏介质阻释剂
- 肥大细胞膜稳定剂色甘酸钠
- H_1 受体阻断剂酮替芬
- ⑤ 肾上腺皮质激素：XXXX松、XX奈德
- ⑥ 白三烯调节剂，孟鲁司特、扎鲁司特、普鲁司特



第一亚类

β_2 肾上腺素受体激动剂



一、药理作用与作用机制

1. 激动呼吸道平滑肌和肥大细胞 β_2 受体，激活腺苷酸环化酶，使细胞内的环磷腺苷含量增加，游离 Ca^{2+} 减少，松弛支气管平滑肌；

2. 减少肥大细胞和嗜碱粒细胞脱颗粒和介质释放，降低微血管通透性，增加气道上皮纤毛摆动。



二、临床用药评价

分类	药物	应用
短效	沙丁胺醇、 特布他林	速效、短效、高选择性（ β_2 受体） 缓解轻、中度急性哮喘症状首选药
长效	福莫特罗、 沙美特罗、 丙卡特罗、 班布特罗、 沙丁胺醇控 释片	①不单用，与吸入性糖皮质激素联合应用于需 要长期用药的患者 ②福莫特罗——哮喘急性发作，特别适用于哮喘 夜间发作患者缓解短程症状 ③沙美特罗——防治夜间哮喘发作

记忆技巧——短沙特，长特罗

二、临床用药评价

1. 可能会引起低钾血症。
2. 与黄嘌呤类药物、肾上腺皮质激素、利尿药合用及缺氧都可能增加低钾血症的发生，需监测血钾水平。
3. 告诫患者有诱发低血钾而造成心律不齐的可能性，特别是联用洋地黄类药物患者。

三、代表药品

沙丁胺醇

【适应证】用于治疗支气管哮喘或喘息性慢性支气管炎伴支气管痉挛。

【临床应用注意】

1. 动物实验显示可舒张子宫平滑肌，导致畸胎，故妊娠期妇女禁用片剂。
2. 长期使用可形成耐药性，药效降低，使支气管痉挛不易缓解，哮喘加重。



三、代表药品

3. 合用其他 β_2 受体激动剂，药效增加，不良反应增加。
4. 并用茶碱类药物，药效增加，不良反应增加。
5. 本品与 β_2 受体阻断剂合用，则药效减弱或消失。
6. 不良反应常见震颤、恶心、心悸、头痛、失眠等，尤其可能引起严重的血钾过低。
7. 运动员、哺乳期妇女以及高血压、冠状动脉供血不足、心血管功能不全、糖尿病、甲状腺功能亢进等患者慎用。

三、代表药品



沙美特罗

【适应证】用于长期常规治疗哮喘的可逆性呼吸道阻塞和慢性支气管炎。还可用于须常规使用支气管扩张剂的患者，以及预防夜间哮喘发作或控制日间哮喘的不稳定（如运动前或接触致敏原前）。

三、代表药品

【临床应用注意】

1. 本品不可取代口服或吸入型肾上腺皮质激素，哮喘控制过程中如出现突发和渐进性恶化，有可能危及生命，应考虑进行肾上腺皮质激素治疗或增加肾上腺皮质激素的用量；正在使用其他预防药物（如吸入型肾上腺皮质激素）的患者在开始使用本品时应继续使用预防药物，不可停用或减量。

三、代表药品

2. 起效相对较慢，故不适用于急性哮喘发作患者，先用短效 β_2 受体激动剂。
3. 不适用于冠心病、高血压、心律失常、惊厥、甲状腺毒症的哮喘患者及对所有拟交感神经药物高度敏感的哮喘患者。
4. 急性哮喘发作时，可能出现血钾过低。
5. 与短效 β_2 受体激动剂联用，不增加心血管不良反应发生率。

三、代表药品

6. 正使用单胺氧化酶抑制剂和三环类抗抑郁剂的患者或2周内停止使用上述药物的患者，慎用沙美特罗。

7. 哮喘患者一般不能使用 β 受体阻断剂，但在特定情况下，没有其他药物可替代 β 受体阻断剂治疗，可以考虑谨慎地使用心血管选择性 β 受体阻断剂。

8. 推荐剂量内不良反应最常见为头痛、呕吐、肌痉挛、颤抖、心悸等。



三、代表药品

福莫特罗

【适应证】用于治疗支气管哮喘及慢性阻塞性肺疾病伴支气管痉挛。

【临床应用注意】

1. 本品不宜用于治疗急性支气管痉挛。
2. 连续过量口服本品可引起心律失常甚至心搏停止。
3. 不与单胺氧化酶抑制剂合用。
4. 常规使用可产生耐受性。



三、代表药品

特布他林

【适应证】用于支气管哮喘、慢性支气管炎、肺气肿和其他伴有支气管痉挛的肺部疾病。

【临床应用注意】

1. 长期应用可产生耐受性。
2. 大剂量口服给药可使有癫痫病史的患者发生酮症酸中毒。
3. 并用茶碱类药品可增加疗效，但不良反应也加重。

应用分析

【2017A】对中、重度哮喘患者的长期维持治疗的推荐方案是()。

- A. 吸入性糖皮质激素+长效 β_2 受体激动剂
- B. 吸入性糖皮质激素+短效 β_2 受体激动剂
- C. 长效 β_2 受体激动剂+长效M胆碱受体阻断剂
- D. 长效M胆碱受体阻断剂+白三烯受体阻断剂
- E. 长效 β_2 受体激动剂+白三烯受体阻断剂

应用分析

【2017A】对中、重度哮喘患者的长期维持治疗的推荐方案是()。

- A. 吸入性糖皮质激素+长效 β_2 受体激动剂
- B. 吸入性糖皮质激素+短效 β_2 受体激动剂
- C. 长效 β_2 受体激动剂+长效M胆碱受体阻断剂
- D. 长效M胆碱受体阻断剂+白三烯受体阻断剂
- E. 长效 β_2 受体激动剂+白三烯受体阻断剂

【答案】A

第二亚类

M胆碱受体阻断剂



一、药理作用与作用机制

M胆碱受体阻断剂为阿托品衍生物，能选择性拮抗M₃受体，扩张支气管平滑肌，缓解哮喘症状。



二、临床用药评价

1. 舒张支气管的作用比 β_2 受体激动剂弱，起效较慢，联用对慢性哮喘患者产生协同效果。

2. COPD患者往往副交感神经亢进，而 β_2 受体数减少，因此，对M胆碱受体阻断剂更为敏感。COPD患者应选用无分泌抑制作用的M胆碱受体阻断剂。

3. 噻托溴铵

与 M_3 受体的亲和力是异丙托溴铵的10倍，松弛气道平滑肌作用更强。

二、临床用药评价

4. 异丙托溴铵

①强效抗胆碱(M受体)作用，对支气管平滑肌有较高的选择性，对呼吸道腺体和心血管系统的作用不明显，喷吸后无刺激性咳嗽，对平喘、气憋的效果明显。

②用于防治支气管哮喘和哮喘型慢性支气管炎，尤其适用于因用 β 受体激动剂产生肌肉震颤、心动过速而不能耐受此类药物的患者。

③与 β_2 受体激动剂合用可相互增强疗效。

三、代表药品



异丙托溴铵

【适应证】主要用于慢性阻塞性肺疾病的维持治疗，也可用于支气管哮喘。

【临床应用注意】

1. 对于急性或迅速恶化的呼吸困难，可考虑使用雾化吸入液。

三、代表药品

2. 由于可出现沉淀，雾化吸入液和含有防腐剂苯扎氯铵的色甘酸钠雾化吸入液不要在同一个雾化器中同时吸入使用。

3. 最常见的非呼吸道不良反应是头痛、恶心和口干，可出现瞳孔扩大、眼压增高。

4. 对大豆卵磷脂、大豆、花生、阿托品及其衍生物过敏者禁用气雾剂，青光眼、前列腺肥大患者忌用气雾剂，闭角型青光眼患者慎用。



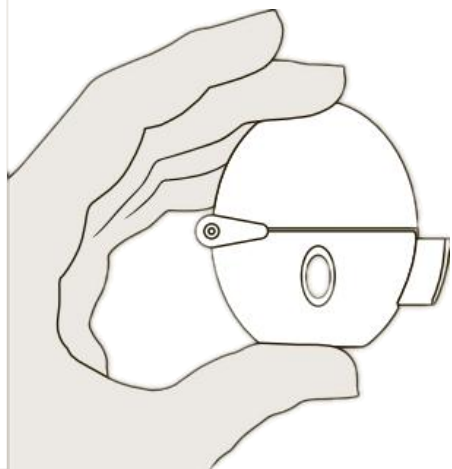
三、代表药品

噻托溴铵

【适应证】适用于慢性阻塞性肺疾病的维持治疗，包括慢性支气管炎和肺气肿，伴随性呼吸困难的维持治疗及急性发作的预防。

【临床应用注意】

1. 胶囊仅供吸入，不能口服。
2. 每天用药不得超过1次。



三、代表药品

3. 起效慢，不作支气管痉挛急性发作的抢救治疗药物。
4. 药粉误入眼内可能引起或加重窄角型青光眼、眼睛疼痛或不适、短暂视物模糊、视觉晕轮或彩色影像，并伴有结膜充血引起的红眼和角膜水肿的症状。
5. 与肾上腺素及异丙肾上腺素等儿茶酚胺类药物合用时，可能引起心律不齐，甚至可能导致心搏停止。
6. 本品可增加洋地黄类药物导致心律失常的易感性。

三、代表药品

9. 肾上腺皮质激素，利尿药或茶碱和本品合用，可加重血钾浓度的降低，并有可能发生高血糖症。

10. 不良反应常见口干、咳嗽(多数患者继续使用症状会消失)，常见咽炎、上呼吸道感染、口苦、短暂性变态反应、头痛、兴奋、眩晕，可能引起吸入性支气管痉挛，长期使用可引起龋齿。

11. 不推荐小于18岁患者使用，闭角型青光眼、前列腺增生、膀胱颈梗阻、心律失常者慎用。

【2016B 46-47】

- A. 沙美特罗
- B. 沙丁胺醇
- C. 多索茶碱
- D. 布地奈德
- E. 噻托溴铵

46. 属于长效 β_2 受体激动剂的平喘药是()。

47. 属于长效M胆碱受体阻断剂的平喘药是()。

【2016B 46-47】

- A. 沙美特罗
- B. 沙丁胺醇
- C. 多索茶碱
- D. 布地奈德
- E. 噻托溴铵

46. 属于长效 β_2 受体激动剂的平喘药是()。

47. 属于长效M胆碱受体阻断剂的平喘药是()。

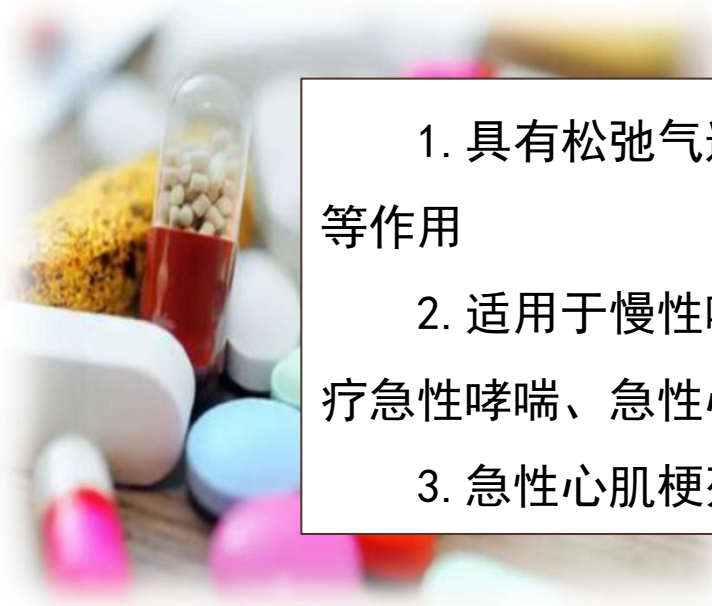
【答案】AE

第三亚类

黄嘌呤类药物



一、药理作用与作用机制

- 
1. 具有松弛气道平滑肌、呼吸兴奋、强心等作用
 2. 适用于慢性喘息的治疗和预防，辅助治疗急性哮喘、急性心功能不全和心源性哮喘
 3. 急性心肌梗死伴血压显著降低患者禁用。



二、临床用药评价



(一) 作用特点

1. 当哮喘急性发作单用 β_2 受体激动剂疗效不佳时，配合静脉滴注黄嘌呤类药物可增强疗效。
2. 茶碱为代表药物。
3. 茶碱衍生物，如多索茶碱、二羟丙茶碱、羟丙茶碱、巴米茶碱，这些茶碱衍生物对胃肠道刺激较小，但药理作用比茶碱弱。
4. 茶碱缓释制剂血药浓度波动小，降低了茶碱中毒风险，适用于慢性哮喘，尤其是夜间发作的哮喘患者。

(二) 药物相互作用

1. 可提高茶碱血药浓度，毒性也同时增强的药物：

- 红霉素、罗红霉素、克拉霉素
- 克林霉素
- 依诺沙星、环丙沙星、氧氟沙星、左氧氟沙星
- 西咪替丁
- 地尔硫草、维拉帕米
- 咖啡因
- 美西律



(二) 药物相互作用

2. 茶碱与苯巴比妥、利福平合用，茶碱血药浓度下降。

3. 茶碱与苯妥英钠相互干扰吸收，二者血药浓度均下降，合用时，二者均需要增加剂量。



(三) 典型不良反应和禁忌

1. 须监测茶碱血药浓度来调整剂量，预防中毒。
2. 茶碱血药浓度在 $15\text{--}20\ \mu\text{g/ml}$ 时会出现毒性反应，早期多见恶心、呕吐、易激动、失眠等；当血药浓度超过 $20\ \mu\text{g/ml}$ 时会出现心动过速、心律失常；当血药浓度超过 $40\ \mu\text{g/ml}$ 时会出现发热、失水、惊厥，严重者呼吸、心跳停止，甚至致死。
3. 通常血药浓度在 $10\ \mu\text{g/ml}$ 时可达到有效的治疗浓度， $20\ \mu\text{g/ml}$ 以上会出现毒性反应。

三、代表药品



茶碱

【适应证】用于支气管哮喘、喘息型支气管炎、阻塞性肺气肿等，缓解喘息症状；也可用于心源性肺水肿引起的哮喘。

三、代表药品

【临床应用注意】

1. 对胃肠道刺激性大，可见血性呕吐物或柏油样大便。
2. 老年人因血浆清除率降低，潜在毒性增加。
3. 禁用于活动性消化性溃疡和未经控制的惊厥性疾病患者，不适用于哮喘持续状态或急性支气管痉挛发作的患者，慎用于低氧血症、高血压、消化道溃疡病史、妊娠期妇女、哺乳期妇女、55岁以上患者。

三、代表药品

多索茶碱

【适应证】用于支气管哮喘、喘息性慢性支气管炎及其他支气管痉挛引起的呼吸困难。



三、代表药品

【临床应用注意】

1. 个体差异较大，必要时监测血药浓度，维持在 $10\sim 20\text{ }\mu\text{g/ml}$ 范围内有效且比较安全。
2. 进食可使峰浓度降低、达峰时间延迟，增加剂量。
3. 少数患者出现心悸、窦性心动过速、呕吐、头痛、兴奋、失眠、呼吸急促、高血糖、蛋白尿等症状。
4. 过量使用会出现严重心律不齐、阵发性痉挛，此症状为初期中毒表现，应暂停用药并监测血药浓度，在上述中毒症状完全消失后仍可继续使用。

第四亚类 过敏介质阻释剂



一、药理作用与作用机制

肥大细胞膜稳定剂——色甘酸钠、曲尼司特
 H_1 受体阻断剂——酮替芬、西替利嗪、氯雷他定



一、药理作用与作用机制

1. 色甘酸钠

- ①稳定肺组织肥大细胞膜，抑制过敏介质释放。
- ②阻断引起支气管痉挛的神经反射，降低哮喘患者的气道反应性。

2. 曲尼司特

- ①除与色甘酸钠相似外，还能直接拮抗组胺和白三烯的支气管平滑肌收缩作用。
- ②与 β_2 受体激动剂联合应用，提高平喘效果，防止 β_2 肾上腺素受体向下调节而稳定 β_2 受体激动剂的疗效。

一、药理作用与作用机制

3. H_1 受体阻断剂——酮替芬、西替利嗪、氯雷他定

①高选择性地抑制 H_1 受体，抑制组胺诱导的气道高反应性；

②稳定肺组织肥大细胞膜和拮抗其他介质，降低急性、慢性哮喘反应的作用；

③用于预防哮喘发作，若与平喘药、肾上腺皮质激素联合应用于哮喘发作期也有一定协同作用。



二、临床用药评价

1. 色甘酸钠：对速发型过敏反应有良好的预防作用。

2. 酮替芬

①兼具很强的组胺 H_1 受体阻断作用和抑制过敏反应介质释放的作用。

②抗组胺作用较氯苯那敏强约10倍，且具长效。

二、临床用药评价

3. 酮替芬

①抑制支气管周围黏膜下肥大细胞释放组胺、慢反应物质，也抑制血液中嗜酸性粒细胞释放组胺、慢反应物质，产生很强的抗过敏作用，并较色甘酸钠强。

②能抑制抗原、组胺、阿司匹林和运动诱发的气道痉挛，防治支气管哮喘。

③尤其对过敏性哮喘疗效显著，对预防各种支气管哮喘发作及外源性哮喘的疗效比对内源性哮喘更好，可减少哮喘的发作频率与严重程度。

二、临床用药评价

H₁受体阻断剂不良反应

常见嗜睡、倦怠，故用药期间不得驾驶车、船，从事高空作业、机械作业及操作精密仪器。



三、代表药品

色甘酸钠

【适应证】用于预防支气管哮喘和过敏性鼻炎。

【临床应用注意】

1. 对于支气管哮喘患者应在易发病季节之前2~3周提前用药。
2. 开始用药时若哮喘加重，可先吸入少许沙丁胺醇。
3. 起效较慢，连用数日甚至数周后才起作用，对正在发作的哮喘无效。

三、代表药品

酮替芬



【适应证】用于预防支气管哮喘或其他过敏性疾病。

【临床应用注意】

1. 与多种中枢神经抑制剂或乙醇合用，可增强本品的镇静作用，应避免。
2. 不得与口服降血糖药合用。
3. 不良反应常见嗜睡、倦怠，以及口干、恶心等胃肠道反应，偶见头痛、头晕、迟钝以及体重增加。

第五亚类

吸入型肾上腺皮质激素



一、药理作用与作用机制

1. 抑制参与哮喘发病的多种炎症介质及免疫细胞，具有强大抗炎、抗免疫作用，并具有抗过敏、减少微血管渗漏、减轻黏膜水肿作用，从多个环节阻断哮喘的发生，缓解哮喘症状。

2. 哮喘患者早期即可大剂量使用，对频发性及持续性哮喘具有较好疗效，适用于重症哮喘(哮喘持续状态)、慢性反复发作的哮喘、激素依赖性哮喘。



二、临床用药评价

(一) 作用特点

1. 吸入型肾上腺皮质激素

①局部抗炎作用强、全身不良反应少的优点，可增加患者的肺功能，降低气道高反应性，减少支气管扩张剂的应用，故而被国内外权威的哮喘诊治指南推荐为治疗哮喘的一线药物。

②布地奈德属于强效肾上腺皮质激素，适用于轻度持续型哮喘的长期治疗，吸入剂用于哮喘和COPD的预防和长期维持治疗。

二、临床用药评价

③氟替卡松作用强于布地奈德，适用于轻度持续型(2级以上)哮喘的长期治疗以及抗过敏反应。气雾剂可以缓解哮喘和过敏性鼻炎的症状，对支气管喘息的疗效比口服更有效。

④肾上腺皮质激素与 β_2 受体激动剂配伍而成的复方制剂如沙美特罗替卡松粉吸入剂等，为目前治疗哮喘夜间发作和哮喘维持治疗的理想方案。



二、临床用药评价

2. 全身性使用肾上腺皮质激素

①可引起高血压、消化性溃疡、糖尿病和骨质疏松等严重的不良反应而受到限制。

②对于原来依赖口服肾上腺皮质激素而后改为吸入剂的患者，不应突然停止口服制剂。



(二) 典型不良反应和禁忌

1. 少数长期吸入给药患者可能引起口腔、咽喉部的白假丝酵母菌感染，表现为声音嘶哑、咽部不适，吸药后用水漱口及局部应用抗霉菌药物可降低发生率。
2. 吸入给药患者较常见上呼吸道感染、咽喉刺激、鹅口疮、咳嗽、头痛，长期大剂量应用可引起骨质疏松症、高血压、糖尿病、下丘脑垂体与肾上腺轴的抑制、肥胖症、白内障、青光眼、肌无力、皮肤变薄导致皮纹和瘀斑。



(二) 典型不良反应和禁忌

3. 伴有结核病、寄生虫感染、骨质疏松、青光眼、糖尿病、严重忧郁或消化性溃疡的哮喘患者应慎用。

4. 为了预防激素对儿童生长发育的影响，长期使用肾上腺皮质激素(包括吸入剂)的患儿应定期监测身高。



【2018B 48-50】

- A. 噻托溴铵 B. 孟鲁司特
C. 茶碱 D. 布地奈德 E. 沙美特罗

48. 属于糖皮质激素类药物的是()。

49. 属于M胆碱受体阻断剂的平喘药是()。

50. 属于 β_2 受体激动剂的平喘药是()。

【2018B 48-50】

- A. 噻托溴铵 B. 孟鲁司特
C. 茶碱 D. 布地奈德 E. 沙美特罗

48. 属于糖皮质激素类药物的是()。

49. 属于M胆碱受体阻断剂的平喘药是()。

50. 属于 β_2 受体激动剂的平喘药是()。

【答案】DAE

第六亚类

白三烯拮抗剂



一、药理作用与作用机制

1. 【作用机制】

抑制半胱氨酰白三烯与CysLT₁受体结合，抑制炎症细胞的黏附、聚集和增殖，诱导炎症细胞凋亡，促进细胞因子及抑制炎症介质释放，降低气道高反应性，降低毛细血管通透性和减少腺体黏液分泌，抑制气道重塑及抗肺纤维化作用，降低呼出气体中一氧化氮的含量，显著改善哮喘炎症指标，减轻过敏性鼻炎引起的症状。



一、药理作用与作用机制



2. 【药理作用】

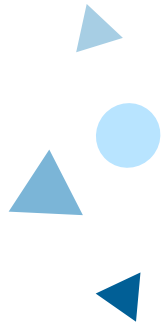
适用于哮喘的长期治疗和预防，包括预防白天和夜间的哮喘症状，治疗对阿司匹林敏感的哮喘以及预防运动诱发的支气管收缩，减轻过敏性鼻炎引起的症状。

二、临床用药评价

白三烯拮抗剂具有如下特点：

- ①不良反应少而轻。
- ②起效慢，一般连续应用4周显效。
- ③作用较弱，相当于色甘酸钠。

仅适用于轻、中度哮喘和稳定期的控制，或合并应用以减少肾上腺皮质激素和 β_2 受体激动剂的剂量。



作用特点

1. 治疗哮喘时白三烯拮抗剂不宜单独应用。
2. 不应当用白三烯拮抗剂突然替代吸入型糖皮质激素。
3. 白三烯拮抗剂通常不宜用于治疗急性哮喘发作
4. 12岁以下儿童、妊娠期及哺乳期妇女宜慎重权衡利弊后决定是否应用。

孟鲁司特

【适应证】成人及儿童哮喘的预防和长期治疗。适用于减轻过敏性鼻炎引起的症状。

联合用药





联合用药

(1) β_2 受体激动剂+黄嘌呤类药物

通过不同方式增加细胞内环磷酸腺苷(cAMP)的浓度而达到增强彼此平喘疗效的目的，为相加作用。

(2) H1受体阻断剂+ β_2 受体激动剂

酮替芬能有效防止 β_2 受体的向下调节

(3) 肾上腺皮质激素+ β_2 受体激动剂

①沙美特罗-氟替卡松、布地奈德-福莫特罗

②布地奈德福莫特罗粉吸入剂不用于哮喘初始治疗



联合用药 ▼

(4) M胆碱受体阻断剂+ β_2 受体激动剂±黄嘌呤类

①以上2种(或3种)平喘药具有相加作用

②该种联合尤其适用于老年人。例如吸入用复方异丙托溴铵溶液、复方异丙托溴铵气雾剂。



联合用药

(5) 肾上腺皮质激素+支气管扩张剂(β_2 受体激动剂、黄嘌呤类药物)

①肾上腺皮质激素作为强效抗炎药，可以从多个不同环节对抗气道炎症，其平喘作用较弱、较慢。

②支气管扩张剂能迅速、强力地舒张气道，但在气道炎症明显的重症、顽固性哮喘患者疗效不佳。

③肾上腺皮质激素可以减轻气道炎症，恢复或增加气道对这些支气管扩张剂的敏感性。



应用分析

【2017A】对中、重度哮喘患者的长期维持治疗的推荐方案是()。

- A. 吸入性糖皮质激素+长效 β_2 受体激动剂
- B. 吸入性糖皮质激素+短效 β_2 受体激动剂
- C. 长效 β_2 受体激动剂+长效M胆碱受体阻断剂
- D. 长效M胆碱受体阻断剂+白三烯受体阻断剂
- E. 长效 β_2 受体激动剂+白三烯受体阻断剂

应用分析

【2017A】对中、重度哮喘患者的长期维持治疗的推荐方案是()。

- A. 吸入性糖皮质激素+长效 β_2 受体激动剂
- B. 吸入性糖皮质激素+短效 β_2 受体激动剂
- C. 长效 β_2 受体激动剂+长效M胆碱受体阻断剂
- D. 长效M胆碱受体阻断剂+白三烯受体阻断剂
- E. 长效 β_2 受体激动剂+白三烯受体阻断剂

【答案】A