

第八章 抗胆碱药

抗胆碱药分类

类别	代表药物
(一) 胆碱受体阻滞药	
1. M受体阻滞药	
(1) 非选择性M受体阻滞药	阿托品、山莨菪碱、东莨菪碱
(2) M ₁ 受体阻滞药	哌仑西平
(3) M ₂ 受体阻滞药	tripitramine
(4) M ₃ 受体阻滞药	达非那新
2. N受体阻滞药	
(1) N ₁ 受体阻滞药	美加明
(2) N ₂ 受体阻滞药	
① 除极化型肌松药	琥珀胆碱
② 非除极化型肌松药	筒箭毒碱
(二) 胆碱酯酶复活药	碘解磷定、氯解磷定

第一节 M受体阻滞药

一、阿托品类生物碱

阿托品 (atropine)

【机制】 与 ACh 竞争性阻断胆碱受体

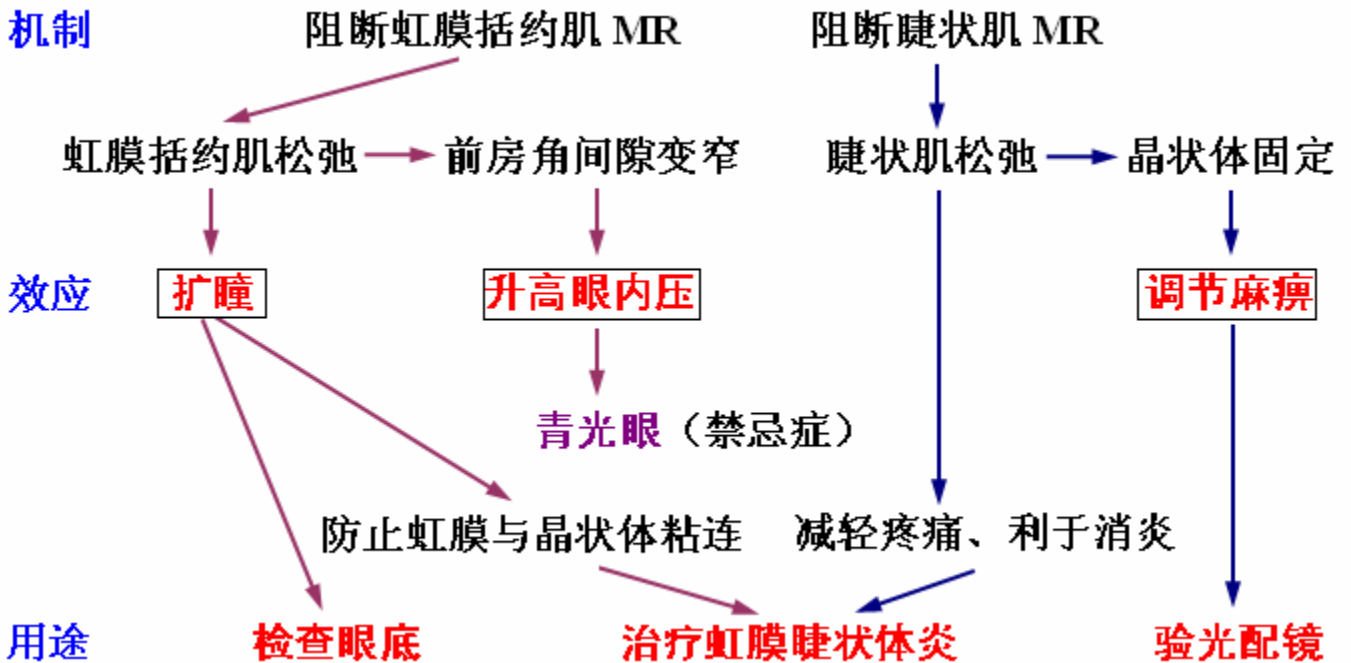
【作用和用途】

1. 抑制腺体分泌

作用部位	用途
唾液腺	→ 治疗流涎症
汗腺	→ 治疗严重盗汗
呼吸道腺体	→ 麻醉前给药 (避免阻塞呼吸道、吸入性肺炎)
胃腺 (胃肠解痉)	} 治疗胃、十二指肠溃疡 (取代药: 哌仑西平)

2. 眼 作用与毛果芸香碱相反

机制



效应

用途

(替代药: 后马托品)

用法: 局部给药——滴眼

3. 解除平滑肌痉挛 治疗内脏绞痛

(替代药: 山莨菪碱、溴丙胺太林)

选择性: 胃肠道 > 膀胱逼尿肌 > 胆道 输尿管 支气管

适应症: 胃肠绞痛 膀胱刺激征 胆绞痛 肾绞痛

禁忌症: 前列腺肥大、尿潴留

治疗胆绞痛、肾绞痛应联用镇痛药, 如哌替啶

依据:

两者单用时, 缓解疼痛都不理想;

两者缓解疼痛的作用机制不同, 联用时疗效协同;

阿托品对抗镇痛药收缩胆道、输尿管平滑肌的致痛作用。

4. 兴奋心脏

加快心率 → 治疗窦性心动过缓

加快传导 → 治疗房室传导阻滞

5. 扩张血管, 改善微循环 与阻断 MR 无关

作用 大剂量 (1) 扩张皮肤、内脏血管

(2) 解除微血管痉挛, 改善微循环

用途 治疗感染中毒性休克 (取代药: 山莨菪碱)

应用前提: 补足血容量 (扩血管药抗休克的共性要求)

6. 兴奋中枢神经系统

大剂量	低	高
	兴奋 (惊厥)	抑制 (麻痹)

7. 拮抗 ACh, 解救有机磷中毒
(替代药: 山莨菪碱、东莨菪碱)
综合应用以上六个方面的作用

【不良反应】

1. 治疗量时 副作用常见
排尿困难—逼尿肌松弛; 口干—抑制唾液腺分泌
视力模糊—调节麻痹; 皮肤潮红—扩张血管; 心悸—兴奋心脏
2. 过量中毒 中枢兴奋
3. 严重时 中枢抑制 甚至死于呼吸衰竭

【禁忌症】

青光眼 前列腺肥大

【中毒解救】

1. 对症治疗: 中枢抑制药, 如地西洋对抗中枢兴奋
2. 药物拮抗 (针对机制)

(1) MR 激动剂: 毛果芸香碱 (i.h.) 吸收作用

(2) 易逆性抗胆碱酯酶药: 新斯的明、毒扁豆碱

抢救有机磷中毒时, 阿托品过量所致中毒, 则不选用 (2) 解救

依据: 有机磷中毒时, ACh 已过量堆积, 再用易逆性抗胆碱酯酶药, 则 ACh 更过度堆积, 在阿托品随代谢而减少的过程中, 有机磷中毒加重。故, 抢救中重度有机磷中毒时阿托品应联用胆碱酯酶复活药, 后者恢复 AChE 活性, 加速 ACh 水解灭活而发挥解救有机磷中毒的作用。

山莨菪碱 (anisodamine; 654-2)

- 【作用特点】
1. 外周 平滑肌解痉、心血管作用相似
抑制唾液腺分泌、扩瞳作用弱
 2. 中枢 不易透 BBB, 中枢兴奋很弱

【优点】 选择性高, 副作用少

- 【用途】
1. 替代阿托品 治疗胃肠绞痛、解救有机磷中毒
 2. 取代阿托品 治疗感染中毒性休克
 3. 治疗多种与微循环障碍有关的疾病: 如血管神经性头痛

【不良反应、禁忌症及中毒处理】 与阿托品相似

东莨菪碱 (scopolamine)

【作用特点】 1. 外周 抑制腺体分泌、扩瞳、调节麻痹作用较强
平滑肌解痉、心血管作用较弱

2. 中枢 除兴奋呼吸中枢外，表现为抑制

【用途】 1. 麻醉前给药 依据：外周抑制腺体分泌 + 中枢镇静
2. 治疗感染中毒性休克，解救有机磷中毒
3. 东莨菪碱静脉复合麻醉（中药麻醉）
4. 防治晕动病、妊娠呕吐、放射病呕吐
5. 抗帕金森病 依据：中枢抗胆碱作用

二、阿托品的合成代用品

（一）合成扩瞳药

后马托品 (homatropine)

扩瞳：快、短 眼底检查

调节麻痹：快、短、弱 验光配镜

注：儿童验光仍须用阿托品，以达到完全调节麻痹

（二）合成解痉药

溴丙胺太林 (propantheline bromide, 普鲁本辛)

【作用特点】 对胃肠 MR 选择性高，解除胃肠平滑肌痉挛作用强而持久，能延缓胃排空时间，并能抑制胃酸分泌

【用途】 主要治疗胃、十二指肠溃疡；缓解胃肠绞痛

（三）选择性 M₁R 阻滞药

哌仑西平 (pirenzepine)

【作用特点】 选择性阻断胃粘膜壁细胞上的 M₁R，抑制胃酸分泌
对其它脏器作用很弱

不易透 BBB

【用途】 主要治疗胃、十二指肠溃疡

第二节 N 受体阻滞药（了解）