

第十章 抗肾上腺素药

抗肾上腺素药分类

类别	药物
(一) α 受体阻滞药	
1. α_1 、 α_2 受体阻滞药	
(1) 短效类	酚妥拉明
(2) 长效类	酚苄明
2. α_1 受体阻滞药	哌唑嗪
3. α_2 受体阻滞药	育亨宾
(二) β 受体阻滞药	
1. β_1 、 β_2 受体阻滞药	普萘洛尔
2. β_1 受体阻滞药	阿替洛尔
3. β_2 受体阻滞药	布他沙明
4. α 、 β 受体阻滞药	拉贝洛尔

第一节 α 受体阻滞药

一、 α_1 、 α_2 受体阻滞药

【分类】

短效类 酚妥拉明 与 αR 结合疏松 竞争性 作用弱、快、短
长效类 酚苄明 与 αR 结合牢固 非竞争性 作用强、慢、久

【作用】

1. 舒张血管

- 1) (-) 血管 $\alpha_1 R$
 - 2) 直接舒张血管
- } 扩张小 A、V $\rightarrow R \downarrow \rightarrow BP \downarrow$

特点：交感神经代偿性(+)越强，扩血管作用越明显

2. 兴奋心脏

- 1) 血管扩张， $BP \downarrow$ ，反射性(+)心脏
- 2) (-)NA 能神经末梢突触前膜 $\alpha_2 R$ ，阻抑负反馈，NA 释放 \uparrow
 \rightarrow 心脏(+) $\rightarrow HR \uparrow$ 、心收缩力 $\uparrow \rightarrow Co \uparrow$

3. 其他

酚妥拉明 拟胆碱、组胺样作用

酚苄明 抗胆碱、抗组胺、抗 5-HT

【用途】

1. **抗外周血管痉挛性疾病** 如：雷诺病、血栓闭塞性脉管炎
2. 防治组织缺血坏死 如，NA i.v.gtt.外漏 局部浸润注射
3. 抗休克 适应症：低排高阻型

扩张血管：解除血管痉挛、外周阻力高、尿少、肺水肿

兴奋心脏：解除心排血量低

注意：补足血容量；不用于血压过低者

联用：NA

用法：调速缓慢静脉滴注

4. 抗顽固性充血性心力衰竭

扩张血管 { 扩小 A → 心后负荷 ↓
扩小 V → 心前负荷 ↓

兴奋心脏 { 心肌收缩力 ↑
心率 ↑ } → Co ↑ → 改善心衰症状

5. 嗜铬细胞瘤 鉴别诊断及其防治其手术时发生的高血压危象

【不良反应】

1. 体位性低血压

防：平卧 头低足高位

治：必要时应用 NA，但禁用 Ad 依据：Ad 升压翻转

2. 其他

酚妥拉明 拟胆碱作用

【禁忌症】

冠心病；消化性溃疡等

二、 α_1 受体阻滞药

详见第二十二章（抗高血压药）

三、 α_2 受体阻滞药（了解）

第二节 β 受体阻滞药

【药动学】

药动学规律与药物脂溶性的关系

脂溶性	p.o.吸收	首过效应	消除	$t_{1/2}$	个体差异
高	易	明显	肝代谢为主	短	大→个体化用药
低	差	较少	原形肾排为主	较长	小

【作用】

1. β 受体阻断作用

1) 心血管系统

(1) 抑制心脏:

机制: $(-)\beta_1R$

特点: 交感(+)时, 作用明显

(2) 收缩血管:

机制: $(-)$ 血管 β_2R

$(-)$ 心脏 \rightarrow 反射性交感(+)

2) 收缩支气管平滑肌

机制: $(-)\beta_2R$ 诱发或加剧支气管哮喘——禁忌症

3) 代谢

$(-)$ 交感兴奋时的脂肪、肝糖原分解

$(-)$ Ad 的升血糖反应

延长胰岛素后血糖恢复正常的时间

4) 抑制肾素释放

机制: $(-)$ 肾小球旁器细胞 $\beta_1R \rightarrow (-)RAAS \rightarrow BP \downarrow$

2. 内在拟交感活性

某些 βR 阻滞药 是 βR 受体的部分激动剂

意义: 具有内在拟交感活性的 β 受体阻滞药,

对心脏抑制、支气管收缩作用较弱

3. 膜稳定作用

降低细胞膜对 Na^+ 、 K^+ 等阳离子的通透性

此作用与临床抗心律失常无关

【用途】

1. 抗快速型心律失常，详见第二十五章（抗心律失常药）
2. 抗心绞痛和心肌梗死，详见第二十三章（抗心绞痛药）
3. 抗高血压，详见第二十二章（抗高血压药）
4. 抗充血性心力衰竭，详见第二十六章（抗慢性心功能不全药）
5. 抗甲状腺功能亢进症，详见第三十四章（抗甲状腺药）
6. 其他，如：

噻吗洛尔滴眼治疗青光眼

机制：(-)房水生成 → ↓眼内压

特点：不影响瞳孔、睫状肌及视力

适应症：原发性开角型青光眼

普萘洛尔辅助治疗偏头痛，联用氟桂利嗪

【不良反应】

1. 一般不良反应 消化道症状、中枢神经系统症状等
2. 心血管反应 抑制心脏、收缩血管
3. 反跳现象 与受体上调有关

【禁忌症】

禁忌症	依据
支气管哮喘	(-)支气管平滑肌 β_2R ，收缩支气管，诱发或加重气管哮喘
窦性心动过缓	(-)心脏窦房结 β_1R ，减慢心率
重度房室传导阻滞	(-)心脏传导系统 β_1R ，减慢传导
严重左室心功能不全	(-)心脏窦房结 β_1R ，减慢心率， (-)心肌 β_1R ，减弱心肌收缩力； 两者都降低心输出量
外周血管痉挛性疾病	(-)血管 β_2R → 收缩血管 反射性交感(+) → 收缩血管