



中等职业教育护理专业“双元”新形态教材



## 第二章 传出神经系统药物与用药护理

---



主编：XXX  
主讲：XXX

# 学习目标

## 1. 知识目标

(1) 能陈述传出神经系统各型受体激动时的生理效应。

(2) 能理解代表药物毛果芸香碱、新斯的明、阿托品、肾上腺素、去甲肾上腺素、酚妥拉明、普萘洛尔等的药理作用、临床应用、不良反应和用药护理要点。

(3) 能陈述有机磷酸酯类中毒的机制、症状、解救药物及其护理要点。

## 2. 能力目标

(1) 具备根据传出神经系统药物的不同药理作用特点和用药注意事项，为患者开展用药护理的能力。

(2) 具备监测传出神经系统药物疗效和不良反应，并遵循医嘱及时调整药物治疗方案的能力。

3. 素质目标 具有良好的医疗安全意识和辩证思维能力，学会关爱病人，养成良好的职业素养和细心严谨的工作作风。



# 目录

- > 第一节 认识传出神经系统药物
- > 第二节 拟胆碱药与用药护理
- > 第三节 抗胆碱药与用药护理

- > 第四节 拟肾上腺素药与用药护理
- > 第五节 抗肾上腺素药与用药护理

# 第一节 认识传出神经系统药物

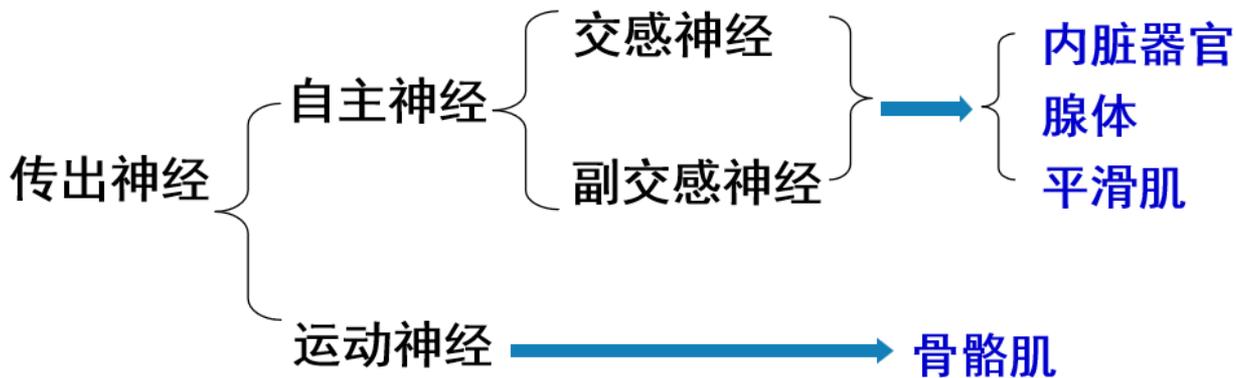
## 一、概述

### (一) 定义

悬灸是用点燃的艾条或其他灸条悬于选定的穴位或病痛部位之上，通过艾或药物的温热和药力作用刺激穴位或病痛部位，达到温经散寒、扶阳固脱、消瘀散结、防治疾病的一种操作方法。

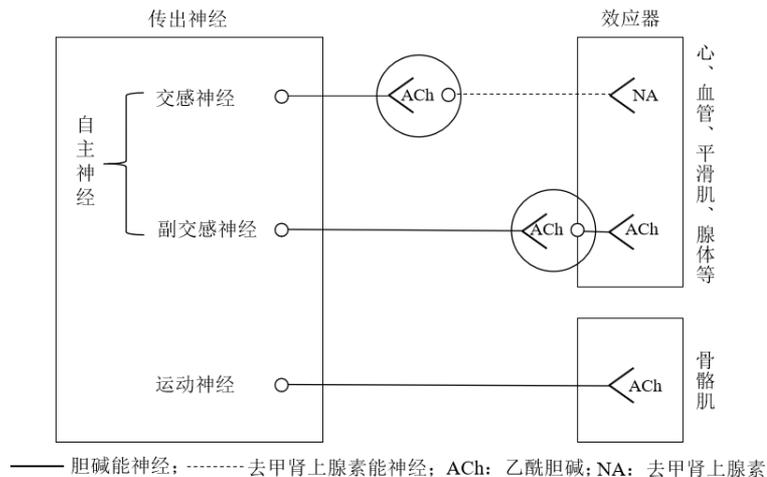
# 一、传出神经系统的分类及递质

## (一) 传出神经按解剖学分类



## (二) 传出神经按递质分类

- 1. 胆碱能神经 (兴奋时释放ACh)
- 2. 去甲肾上腺素能神经 (兴奋时释放NA)

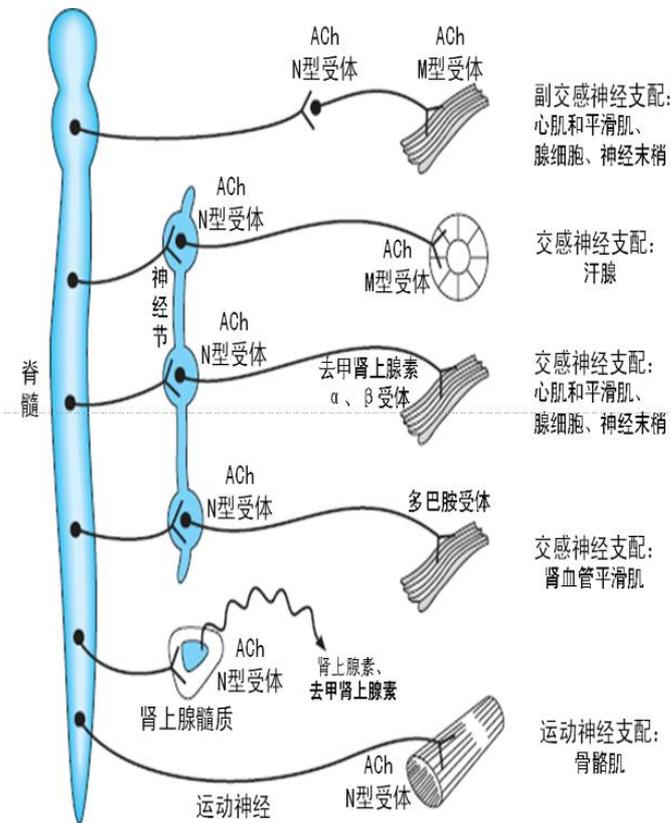


## 胆碱能神经：

- 1.全部交感神经和副交感神经的节前纤维
- 2.运动神经
- 3.副交感神经的节后纤维
- 4.少数交感神经节后纤维

## 去甲肾上腺素能神经：

几乎全部交感神经节后纤维



## 二、传出神经递质的合成与代谢

### (一) 乙酰胆碱的合成与代谢过程

1.合成：主要在胆碱能神经末梢合成



2.贮存：ACh以结合型贮存于囊泡或以游离型存于胞浆

3.释放：神经冲动→神经膜去极化→Ca<sup>2+</sup>内流→囊泡前移→神经膜裂口→ACh外排→受体→效应

4.代谢：胆碱酯酶水解  $\text{ACh} \xrightarrow{\text{AChE}} \text{乙酸} + \text{胆碱} (\text{重新利用})$

## (二) 去甲肾上腺素的合成与代谢过程

1. 合成：主要在去甲肾上腺素能神经末梢合成



2. 贮存：合成的NE与ATP和嗜铬颗粒蛋白结合贮存于囊泡中

3. 释放：神经冲动→神经膜去极化→Ca<sup>2+</sup>内流→囊泡前移→神经膜裂口→外排→受体→效应

4. 降解：（1）摄取1：再摄入神经末梢囊泡中贮存

（2）摄取2：少量在非神经组织，被COMT和MAO灭活

## 三、传出神经系统受体类型及生理效应

### (一) 胆碱受体及效应

能选择性与ACh结合的受体为胆碱受体，可分为毒蕈碱型胆碱受体（M受体）和烟碱型胆碱受体（N受体）

**1.M胆碱受体：**分为M<sub>1</sub>、M<sub>2</sub>、M<sub>3</sub>、M<sub>4</sub>、M<sub>5</sub>5种亚型

M受体分布：心脏、腺体、平滑肌、中枢神经系统

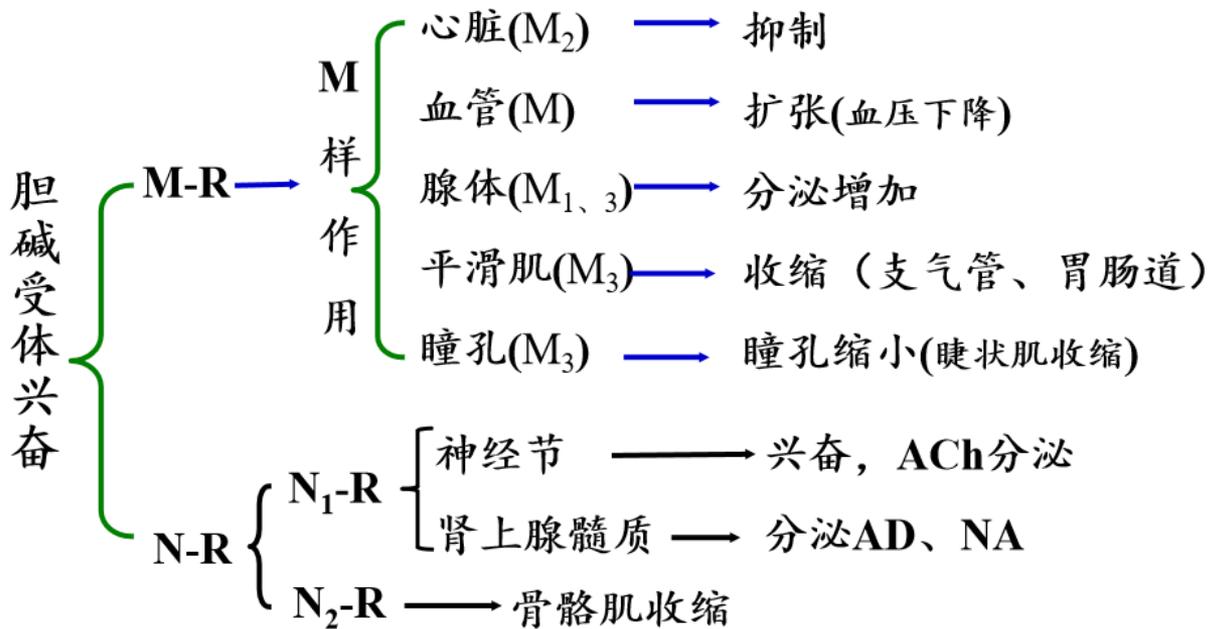
M受体效应：心脏抑制（心肌收缩力减弱、心率减慢、传导减慢）、支气管及胃肠道等平滑肌收缩、腺体分泌（唾液腺、汗腺、泪腺）、瞳孔缩小、视物不清等

## (一) 胆碱受体及效应

### 2.N胆碱受体（烟碱型胆碱受体）

$N_N$ 受体：分布于神经节，兴奋时交感神经和副交感神经同时兴奋

$N_M$ 受体：分布于神经肌肉接头，受体兴奋使骨骼肌收缩



## (二) 肾上腺素受体及效应

能选择性地与去甲肾上腺素或肾上腺素结合的受体为肾上腺素受体，可分为 $\alpha$ 肾上腺素受体和 $\beta$ 肾上腺素受体。

**1.  $\alpha$ 肾上腺素受体 ( $\alpha$ 受体)：**分为 $\alpha_1$ 受体和 $\alpha_2$ 受体两个亚型

$\alpha_1$ 受体：主要分布交感神经节后纤维支配的效应器，主要效应：皮肤黏膜内脏血管收缩（血压升高）

$\alpha_2$ 受体：主要分布去甲肾上腺素能神经末梢的突触前膜，主要效应：反馈性抑制NA释放

## (二) 肾上腺素受体及效应

2.  $\beta$ 肾上腺素受体 ( $\beta$ 受体)：分为 $\beta_1$ 受体、 $\beta_2$ 受体和 $\beta_3$ 受体等亚型

$\beta_1$ 受体：主要分布心脏、肾小球旁系细胞，激动时可引起心脏兴奋（收缩力增强、心率加快、传导加快）、肾素分泌增加。

$\beta_2$ 受体：主要分布于支气管、骨骼肌血管、冠脉血管和肝脏，激动时可引起支气管平滑肌松弛、血管扩张、糖原分解增加等，此外， $\beta_2$ 受体还分布于突触前膜，激动后可正反馈地促进突触前膜释放NA

$\beta_3$ 受体：主要分布于脂肪组织，激动时可促进脂肪分解。

### (三) 多巴胺受体及效应

能选择性与多巴胺结合的受体称为多巴胺受体，简称D受体，有1~4四种亚型。主要位于肾血管、肠系膜血管、冠状动脉等，激动时可引起以上血管扩张。

效应器	胆碱能神经元兴奋		去甲肾上腺素能神经元兴奋		
	受体类型	效应	受体类型	效应	
心脏	窦房结	M <sub>2</sub>	心率↓	β <sub>1</sub>	心率↑
	传导系统	M <sub>2</sub>	传导↓	β <sub>1</sub>	传导↑
	心肌	M <sub>2</sub>	收缩力↓	β <sub>1</sub>	收缩力↑
血管平滑肌	皮肤、黏膜、内脏			α	收缩
	骨骼肌血管			β <sub>2</sub> 、α	舒张
	冠状动脉			β <sub>1</sub>	舒张
内脏平滑肌	支气管、膀胱	M <sub>3</sub>	收缩	β <sub>2</sub>	舒张
	胃肠	M <sub>3</sub>	收缩	α <sub>2</sub> 、β <sub>2</sub>	舒张
	膀胱括约肌	M <sub>3</sub>	舒张	α <sub>1</sub>	收缩
	子宫	M <sub>3</sub>	收缩	β、α	舒张、收缩
	瞳孔开大肌			α <sub>1</sub>	收缩
眼内肌	瞳孔括约肌	M <sub>3</sub>	收缩		
	睫状肌	M <sub>3</sub>	收缩	β	舒张
腺体	汗腺、唾液腺	M	分泌↑	α	分泌↑
骨骼肌	骨骼肌	N <sub>2</sub>	收缩		
	肝脏			β <sub>2</sub> 、α	肝糖原分解
	肾脏			β <sub>1</sub>	肾素释放
	骨骼肌			β <sub>2</sub>	肌糖原分解
代谢	脂肪			β <sub>2</sub>	脂肪分解
	神经节	N <sub>1</sub>	兴奋		
	肾上腺髓质	N <sub>1</sub>	分泌AD		

## 四、传出神经系统药物的作用方式及分类

### (一) 传出神经系统药物的作用方式

#### 1. 直接作用于受体

- (1) 激动药（拟似药）：胆碱受体激动药、肾上腺素受体激动药
- (2) 阻断药（拮抗药）：胆碱受体阻断药、肾上腺素受体阻断药

## (一) 传出神经系统药物的作用方式

### 2. 影响递质

(1) 影响递质生物合成：密胆碱、 $\alpha$ -甲基酪氨酸

(2) 影响递质释放：麻黄碱、间羟胺、卡巴胆碱

(3) 影响递质的转运和贮存：利血平、可卡因

利血平 $\rightarrow$ 囊泡摄取NE $\downarrow$  $\rightarrow$ 递质耗竭 $\rightarrow$ 释放 $\downarrow$

(4) 影响递质的生物转化：胆碱酯酶抑制药

## (二) 传出神经系统药物分类

传出神经系统药物可按作用性质及对受体选择性的不同进行分类。

激动药	阻断药
一、胆碱受体激动药 1. M、N受体激动药（乙酰胆碱） 2. M受体激动药（毛果芸香碱） 3. N受体激动药（烟碱） 二、胆碱酯酶抑制药（新斯的明） 三、肾上腺素受体激动药 （一） $\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药（肾上腺素） （二） $\alpha$ 受体激动药 1. $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体激动药（去甲肾上腺素） 2. $\alpha_1$ 受体激动药（去氧肾上腺素） 3. $\alpha_2$ 受体激动药（可乐定） （三） $\beta$ 受体激动药 1. $\beta_1$ 、 $\beta_2$ 受体激动药（异丙肾上腺素） 2. $\beta_1$ 受体激动药（多巴酚丁胺） 3. $\beta_2$ 受体激动药（沙丁胺醇）	一、胆碱受体阻断药 （一）M受体阻断药 1. 非选择性M受体阻断药（阿托品） 2. $M_1$ 受体阻断药（哌仑西平） （二）N受体阻断药 1. $N_1$ 受体阻断药（樟磺咪芬） 2. $N_2$ 受体阻断药（泮库溴铵） 二、肾上腺素受体阻断药 （一） $\alpha$ 受体阻断药 1. $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体阻断药（酚妥拉明） 2. $\alpha_1$ 受体阻断药（哌唑嗪） 3. $\alpha_2$ 受体阻断药（育亨宾） （二） $\beta$ 受体阻断药 1. $\beta_1$ 、 $\beta_2$ 受体阻断药（普萘洛尔） 2. $\beta_1$ 受体阻断药（阿替洛尔） （三） $\alpha$ 、 $\beta$ 受体阻断药（拉贝洛尔）

## 第二节 拟胆碱药与用药护理

### 一、M受体激动药

#### (一) 定义

M受体激动药是一类选择性地与M受体结合并激动受体，产生M样作用的药物。代表药物为毛果芸香碱（pilocarpine）。

## 一、M受体激动药

### 毛果芸香碱 pilocarpine

毛果芸香碱又名匹鲁卡品，是从毛果芸香属植物中提取出的生物碱，现临床使用人工合成品。

**体内过程：**为叔胺类化合物，其水溶性稳定，滴眼后易透过眼角膜进入眼房，其作用迅速、温和而短暂，10分钟后可见眼内压下降，30分钟达到高峰，持续4~8小时。

## 一、M受体激动药

**药理作用：**毛果芸香碱直接作用于副交感神经节后纤维支配的效应器官的M受体，尤其对眼和腺体的作用较明显。

1. 对眼的作用。滴眼后可出现缩瞳、降低眼压和调节痉挛作用。

(1) 缩瞳：直接激动瞳孔括约肌上的M受体，使瞳孔括约肌收缩，瞳孔缩小。

(2) 降低眼内压：通过缩瞳作用使虹膜向中心拉紧，虹膜根部变薄，前房角间隙扩大，有利于房水通过滤帘进入巩膜静脉窦，使眼内压降低。

(3) 调节痉挛：能激动睫状肌上的M受体，使睫状肌向瞳孔中心方向收缩，悬韧带松弛，晶状体因本身弹性变凸，屈光度增加。

2. 其他作用：能激动腺体上的M受体，使腺体尤其是汗腺和唾液腺分泌明显增加。也能兴奋内脏平滑肌，使内脏平滑肌收缩。

## 一、M受体激动药

### 临床应用：

1. 青光眼：低浓度的毛果芸香碱（2%以下）滴眼对闭角型青光眼（也称充血性青光眼）疗效较好，对开角型青光眼早期也有一定疗效，作用温和，迅速而短暂。
2. 虹膜睫状体炎：与扩瞳药交替使用，以防止虹膜晶状体粘连。
3. 其他：口服可用于治疗口腔干燥。全身给药用于对抗阿托品等M受体阻断药中毒引起的外周症状。

## 一、M受体激动药

### 不良反应及注意事项：

滴眼液以1%~2%为宜，浓度过高可因缩瞳和调节痉挛而发生暂时性近视、眉间痛、眼眶痛和头痛。滴眼时注意压迫内眦，以减少药物经鼻泪管流入鼻腔吸收而产生全身作用。

该药过量可产生M受体过度兴奋的症状，表现出汗、流涎、恶心、呕吐、腹痛、腹泻、支气管痉挛等，可用阿托品对抗处理、维持血压和人工呼吸等。

同类药物还有酷甲胆碱、卡巴胆碱、贝胆碱等。

## 二、胆碱酯酶抑制药

### (一) 定义

能抑制胆碱酯酶的活性，从而导致胆碱能神经末梢释放的ACh蓄积，激动M受体和N受体，产生拟胆碱作用。

分为易逆性胆碱酯酶抑制药和难逆性胆碱酯酶抑制药

## (一) 易逆性胆碱酯酶抑制药

### 新斯的明 (neostigmine)

**体内过程：**新斯的明为人工合成的季胺类化合物，脂溶性低，口服吸收少而不规则，不易通过血脑屏障，故无明显的中枢作用。滴眼时不易透过眼角膜进入前房，故对眼的作用较弱。进入体内的新斯的明一部分被血浆中的胆碱酯酶水解，水解产物与原型部分从尿中排泄。

## (一) 易逆性胆碱酯酶抑制药

### 药理作用：

新斯的明可逆性抑制胆碱酯酶，间接产生M样和N样作用。新斯的明对不同的组织器官有一定的选择性，对骨骼肌的兴奋作用最强，对胃肠道和膀胱平滑肌作用较强，对心血管、腺体、眼和支气管平滑肌的作用较弱。

本品除通过抑制胆碱酯酶的活性而发挥作用外，还可直接激动骨骼肌运动终板上的N<sub>2</sub>受体并能促进运动神经末梢释放乙酰胆碱。

## (一) 易逆性胆碱酯酶抑制药

### 临床应用：

1. 重症肌无力 可明显改善肌无力症状，主要用于重症肌无力的治疗。一般口服给药，重症或紧急时可皮下或肌肉注射。
2. 术后腹气胀和尿潴留 兴奋胃肠平滑肌和膀胱逼尿肌，促进排气和排尿，常用于治疗手术后腹气胀和尿潴留，促进胃肠道和膀胱功能的恢复。
3. 阵发性室上性心动过速 通过拟胆碱的M样作用，使房室传导减慢，心率减慢。
4. 非除极化型肌松药中毒的解救 可对抗非除极化型肌松药（竞争性神经肌肉阻滞药）如筒箭毒碱过量时的中毒反应。

## (一) 易逆性胆碱酯酶抑制药

### 不良反应及注意事项:

治疗量时不良反应较少，过量可引起恶心、呕吐、腹痛、心动过缓、呼吸困难、肌肉震颤等，中毒量可致“胆碱能危象”，导致骨骼肌持久性去极化而阻断神经肌肉接头的正常传导，加重肌无力症状，严重者可引起呼吸肌麻痹。因此，在治疗重症肌无力时应注意鉴别疾病与药物过量引起的肌无力症状。如患者用药后症状不仅无改善，反而加重，应警惕发生胆碱能危象，一旦确认，及时停药，采用阿托品和胆碱酯酶复活药对抗治疗。机械性肠梗阻、尿路梗阻和支气管哮喘病人禁用。一般不做静脉注射，以免引起心动过缓甚至心搏骤停。

## (二) 难逆性胆碱酯酶抑制药

### 有机磷酸酯类

#### 中毒机制：

有机磷酸酯类可经消化道、呼吸道、皮肤黏膜等途径吸收进入体内。吸收进入体内的有机磷酸酯类可与胆碱酯酶牢固结合，形成难以水解的磷酰化胆碱酯酶，使胆碱酯酶丧失水解乙酰胆碱的能力，导致乙酰胆碱在体内堆积，过度激动胆碱受体而出现一系列中毒症状。若不及时抢救，胆碱酯酶会进一步“老化”，即生成更稳定的单烷基或单烷氧基磷酰化胆碱酯酶，此时，即时再用胆碱酯酶复活药，也不能是恢复酶的活性。因此，一旦中毒，应尽早使用胆碱酯酶复活药。

## (二) 难逆性胆碱酯酶抑制药

### 中毒表现:

轻度中毒以M样症状为主，中度中毒可同时表现M样和N样症状，重度中毒除M样和N样症状外，还有显著的中枢神经系统症状。

### 中毒解救:

1. 清除毒物：发现中毒时，应立即把患者移出现场，去除污染衣物。
2. 解毒治疗：常用阿托品，以缓解症状。对中重度中毒者必须合用胆碱酯酶复活药，常用的有碘解磷定和氯解磷定。
3. 对症治疗：对患者进行吸氧、输液以加速毒物排泄、纠正电解质紊乱、人工呼吸等。

### (三) 胆碱酯酶复活药

#### 氯解磷定 (pralidoxime chloride)

氯解磷定水溶液较稳定，使用方便，可肌肉注射或静脉给药，作用极快，不良反应较少，临床较为常用。

#### 药理作用和临床应用：

既能夺取磷酸化胆碱酯酶中的磷酸基，使失活的胆碱酯酶恢复活性；又能与体内游离的有机磷酸酯类直接结合，形成无毒的磷酸化氯解磷定从尿中排出，阻止游离的有机磷酸酯类与胆碱酯酶继续结合。氯解磷定主要用于中度和重度有机磷酸酯类中毒的治疗，对“老化”的磷酸化乙酰胆碱酯酶无效。使用后能迅速解除肌束震颤等N样症状，也能减轻部分中枢中毒症状，但对M样症状效果差，需合用M受体阻断药。

### (三) 胆碱酯酶复活药

#### 不良反应及注意事项：

一般治疗量时，不良反应少见。静脉给药过快可引起头痛、乏力、恶心、呕吐、眩晕、视物模糊、心动过速等症状。剂量过大时，药物本身亦能抑制胆碱酯酶，引起神经肌肉传导阻滞，加重中毒反应。

同类药物还有碘解确定，是最早的胆碱酯酶复活药。但该药水溶液不稳定，对不同的有机磷酸酯类中毒的解救效果存在差异，对内吸磷、对氧磷、马拉硫磷等中毒的疗效好，对敌百虫、敌敌畏中毒疗效较差，对乐果中毒无效。

## 第三节 抗胆碱药与用药护理

### 一、M受体拮抗药

#### (一) 定义

能拮抗神经节后胆碱能神经纤维所支配的效应器细胞上的M受体。常用的药物有：阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱以及相应的人工合成代用品等。

## (一) 阿托品及其类似生物碱

### 阿托品 (atropine)

**体内过程：**为叔胺类生物碱，易透过血脑屏障和胎盘屏障，并易透过眼结膜。口服吸收迅速，1小时后血药浓度达峰值，生物利用度为50%， $t_{1/2}$ 约为4小时，作用可维持3~4小时。吸收后很快分布于全身组织，主要以原型或代谢产物经尿排出。局部用于滴眼时，因通过房水循环消除比较缓慢，其作用可维持数天。

## (一) 阿托品及其类似生物碱

### 药理作用：

竞争性阻断ACh或M受体激动药对M受体的激动作用。阿托品对M受体有较高的选择性，但大剂量时对神经节N1受体也有阻断作用。阿托品对M受体各个亚型的选择性较低，组织选择性不高，作用广泛。各器官对其敏感性各异，主要作用于心血管、平滑肌、眼和腺体等组织器官。随着剂量增加依次出现腺体分泌减少、瞳孔扩大和调节麻痹、心率加快、胃肠道平滑肌及膀胱逼尿肌松弛，大剂量可出现中枢症状。

## (一) 阿托品及其类似生物碱

### 临床应用：

1. 缓解各种内脏绞痛
2. 麻醉前给药
3. 眼科：虹膜睫状体炎、验光配镜、检查眼底
4. 治疗缓慢型心律失常
5. 抗休克
6. 解救有机磷酸酯类中毒

## (一) 阿托品及其类似生物碱

### 不良反应及注意事项：

常见口干、视力模糊、瞳孔扩大、畏光、便秘、排尿困难、心悸、颜面潮红及体温升高等，停药后可逐渐自行消失。随着剂量增加，出现明显的中枢中毒症状。

给予大剂量阿托品前，应备好对抗药物毛果芸香碱、毒扁豆碱、新斯的明以及抗惊厥药物地西泮等，同时注意观察用药反应。

此外，阿托品抗休克须在补足血容量的基础上应用，休克伴有高热或心率加快者不宜使用。

### 禁忌症：

老年人、心动过速病人慎用。青光眼或有眼压升高倾向的病人以及前列腺肥大<sup>39</sup>病人禁用。

## (二) 阿托品的合成代用品

### 1. 合成扩瞳药

药物	浓度%	扩瞳维持时间 (d)	调节麻痹时间 (d)
硫酸阿托品	1.0	7~10	7~12
氢溴酸后马托品	1.0~2.0	1~2	1~2
托吡卡胺	0.5~1.0	0.25	<0.25
环喷托酯	0.5	1	0.25~1
尤卡托品	2.0~5.0	0.08~0.25	无明显调节麻痹作用

## (二) 阿托品的合成代用品

### 2. 合成解痉药

#### (1) 季铵类解痉药

常用药有异丙托溴铵、溴丙胺太林、季铵类解痉药尚有溴甲后马托品、溴化甲哌佐酯奥芬溴铵、格隆溴铵。

#### (2) 叔胺类解痉药

常用药有贝那替秦、羟苄利明、黄酮哌酯和奥昔布宁。

#### (3) 选择性M受体阻断药

常用药有哌仑西平、替仑西平。

### (三) N受体拮抗药

N胆碱受体拮抗药可阻碍ACh 或胆碱受体激动药与神经节或运动终板上的N胆碱受体结合，表现出相应部位胆碱能神经的阻断和抑制效应。N胆碱受体阻药可分为N1受体阻断药（神经节阻滞药）和N2受体阻断药（骨骼肌松弛药）

## 第四节 拟肾上腺素药与用药护理

### (一) 定义

拟肾上腺素药也称肾上腺素受体激动药，是一类化学结构及药理作用和肾上腺素、去甲肾上腺素相似，能与肾上腺素受体结合并激动受体，产生拟肾上腺素样作用的药物。它们都是胺类，作用亦与交感神经兴奋的效应相似，故又称拟交感胺类。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体激动药

### 肾上腺素 (adrenaline, AD)

#### 体内过程:

肾上腺素易在胃肠道被破坏，口服无效。皮下注射因收缩局部血管而吸收缓慢，作用时间长。肌肉注射吸收较快，维持时间约30分钟。紧急情况下也可采用静脉给药或心内注射。可通过胎盘屏障，不易通过血脑屏障。

## 药理作用：

1. 兴奋心脏： 激动  $\beta_1$ 受体，收缩力 $\uparrow$ ，心率 $\uparrow$ ，传导 $\uparrow$ ，输出量 $\uparrow$ 。

激动  $\beta_1$ 受体，扩张冠状血管，心肌供血增加。

### 对心肌不利方面：

心肌代谢 $\uparrow$ ，心肌氧耗量 $\uparrow$ ，可引起心律失常。

### 2. 收缩和舒张血管：

$\alpha_1$	{	小动脉及毛细血管-----收缩
		皮肤、粘膜血管 $\alpha$ (++)-----收缩 (最强烈)
		肾、脾、肠系膜血管 $\alpha$ (+)-----收缩
$\beta_2$	{	脑、肺-----收缩 (微弱)
		冠状、骨骼肌、肝脏-----舒张(小剂量敏感)

## 药理作用：

3. 血压 小剂量：收缩压↑；舒张压 →或↓，平均动脉压

$\beta_2$ 敏感 (双重性)

大剂量：收缩压↑；舒张压↑，平均动脉压↑

## 4. 平滑肌

支气管：

(+)  $\beta_2$ ——支气管平滑肌舒张；  
抑制组胺等过敏物质的释放；  
(+)  $\alpha_1$ ——支气管粘膜血管收缩，通透性↓，  
消除粘膜水肿

胃肠：张力↓，收缩频率、幅度↓；

子宫：抑制妊娠末期子宫张力和收缩；

膀胱：逼尿肌  $\beta$ —舒张；括约肌  $\alpha$ —收缩；引起排尿困难和尿潴留

## 药理作用：

### 5. 提高代谢

- 1) 促使肝糖元分解，血糖升高； (+)  $\alpha$ 、 $\beta_2$
  - 2) 加速脂肪分解，使游离脂肪酸升高。 (+)  $\beta_2$ 、 $\beta_3$
- 组织的耗氧量显著增加（20%~30%），体温升高。

6. CNS 大剂量时出现中枢兴奋症状：激动、呕吐、肌强直、惊厥等。

## 临床应用：

- 1. 心脏骤停** 用于溺水、麻醉和手术过程中的意外、药物中毒、传染病和心脏传导阻滞等所致  
**两点注意：**注射点：心室内；需配合：心脏按摩、人工呼吸和纠正酸中毒等措施。
- 2. 过敏性休克**（皮下或肌肉注射、静脉注射）  
抢救药物（青霉素等）或异性蛋白（免疫血清等）引起的**过敏性休克首选药**。
- 3. 支气管哮喘**（仅用于**急性**发作） 皮下或肌肉注射能于数分钟内奏效。
- 4. 与局麻药配伍** 利用其收缩血管的作用可与局麻药的配伍。
- 5. 局部止血** 将浸有**0.1%盐酸肾上腺素**的纱布或棉球用于鼻粘膜和齿龈出血处。
- 6. 治疗青光眼** 降低眼内压

### 不良反应：

主要不良反应：心悸、烦躁、头痛、血压升高等；

★大剂量： 血压 ↑↑ —— 脑出血、  
心肌缺血、心律失常

**禁忌证：**禁用于高血压、脑动脉硬化、器质性心脏病、糖尿病、甲亢等

## 二、 $\alpha$ 受体激动药

### 去甲肾上腺素 (noradrenaline)

#### 体内过程:

口服使胃黏膜血管收缩，又易被碱性肠液破坏，故口服无效。皮下或肌肉注射因强烈收缩血管，吸收很少，且易致局部组织坏死，故禁止皮下或肌肉注射。一般采用静脉滴注给药方式。

## 药理作用：

对  $\alpha$  受体有强大的激动作用；对心脏  $\beta_1$  受体作用较弱；对  $\beta_2$  受体几乎无作用。

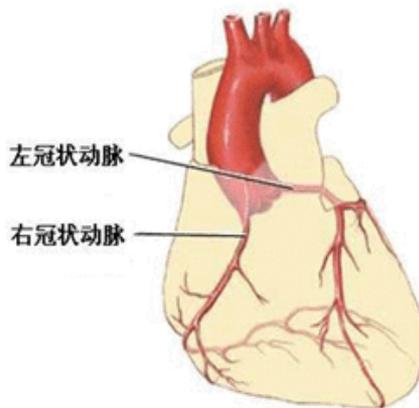
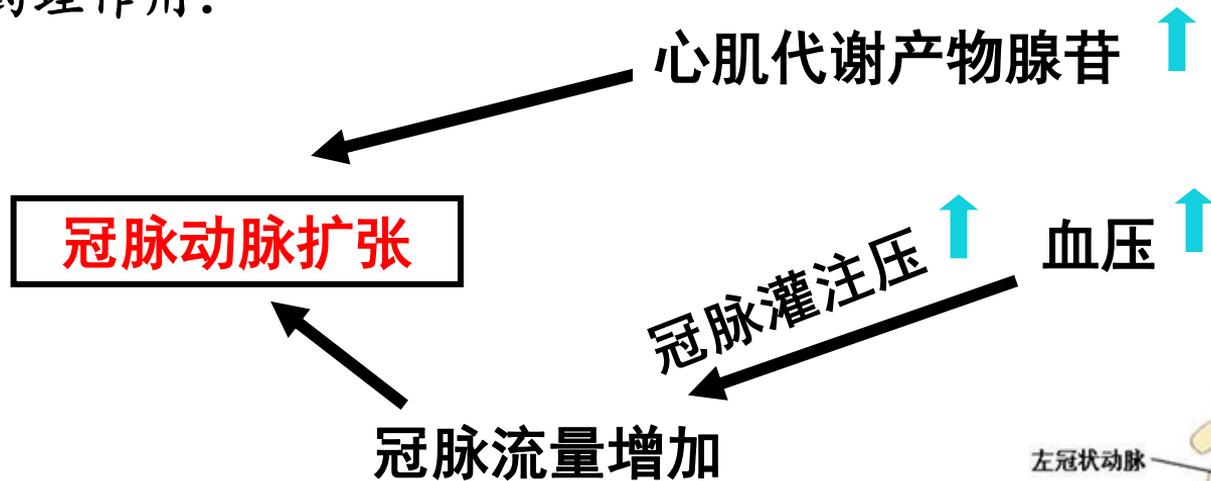
### 1. 血管

激动血管  $\alpha_1$  受体，使血管收缩。

血管收缩强度顺序是：

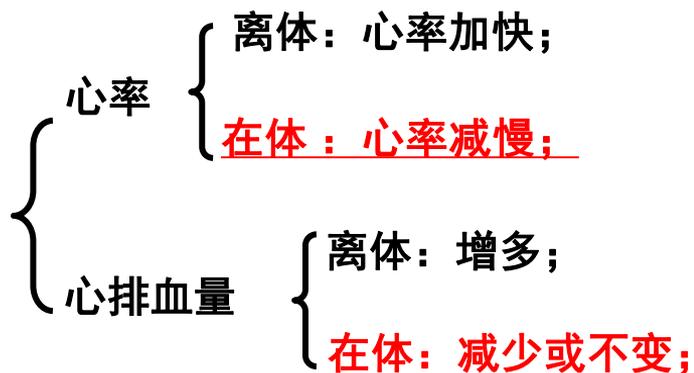
皮肤、粘膜血管 → 肾脏血管 →  
脑、肝、肠系膜血管 → 骨骼肌血管

药理作用：



## 药理作用：

### 2. 心脏 (较弱) $\beta_1(+)$ , 心肌收缩性 $\uparrow$ , 传导 $\uparrow$ 。



?

血压升高，反射性兴奋迷走神经使心率减慢\*

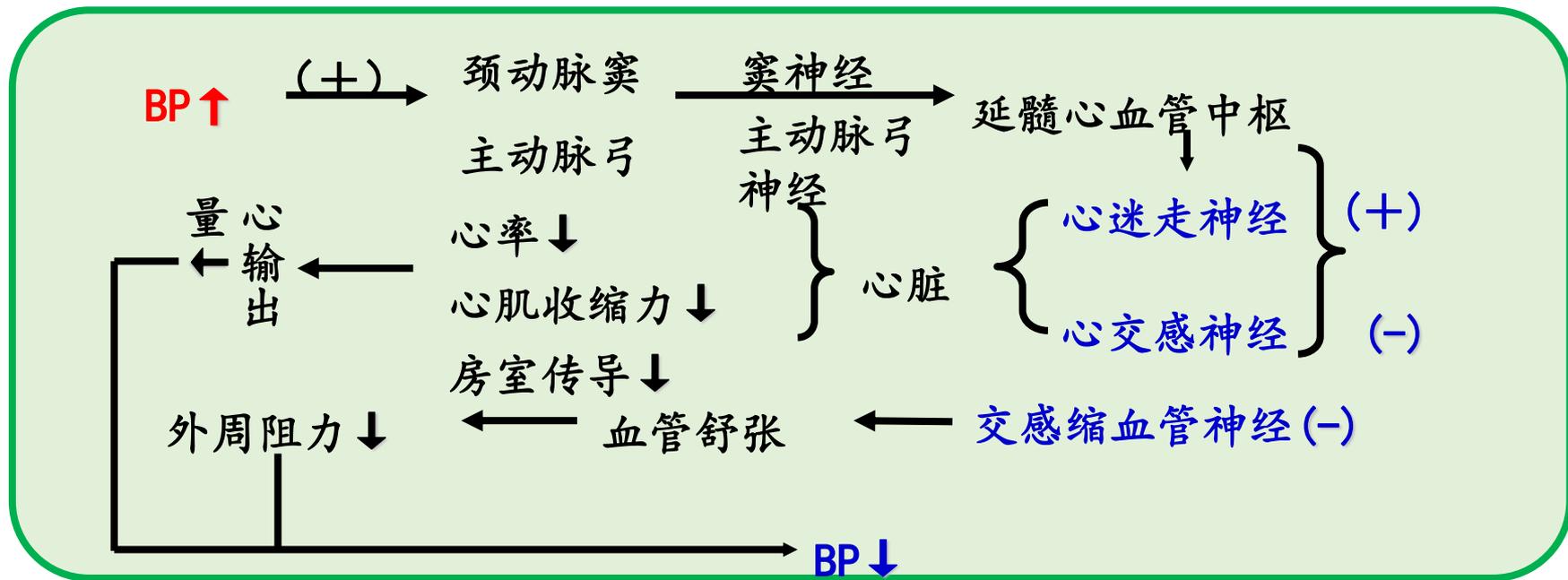
血管收缩，总外周阻力增加，心射血阻力增加

### 对心肌不利方面：

心肌代谢 $\uparrow$ , 心肌耗氧量 $\uparrow$ 。可引起心律失常，甚至引起心室纤颤。

药理作用：

### 减压反射



## 药理作用：

### 3. 血压

- 小剂量时：

收缩压  $\uparrow$  ( $\beta_1$ )；舒张压 = 或  $\uparrow$  ( $\alpha_1$  和  $\beta_2$  竞争)，脉压差  $\uparrow$ ，平均动脉压  $\uparrow$

- 较大剂量静脉注射时：

收缩压  $\uparrow$  ( $\beta_1$ )；舒张压  $\uparrow$  ( $\alpha_1$ )，脉压差  $\downarrow$ ，平均动脉压  $\uparrow$

脉压差 = 收缩压 - 舒张压

平均动脉压 = 舒张压 +  $1/3$ 脉压差 =  $2/3$ 舒张压 +  $1/3$ 收缩压

药理作用：

#### 4. 其他

★对其他平滑肌作用较弱，可使孕妇子宫收缩频率加快；

★大剂量升高血糖；

★无中枢作用。

? 去甲肾上腺素能否用于孕妇

## 临床应用:

### ① 休克——早期神经源性休克

(动脉阻力调节功能障碍, 血管张力丧失, 引起血管扩张, 外周阻力降低所致血压下降的休克)

### ② 药物中毒性低血压

如: 中枢抑制药 (氯丙嗪— $\alpha$ 受体阻断) 中毒的解救。

### ③ 上消化道出血 (食管和胃黏膜血管收缩)

1~3mg 适当稀释后口服。\*

## 不良反应：

### 1. 局部组织缺血坏死：

静注时间过长、浓度过高或药液漏出血管。

措施：① 热敷；② 酚妥拉明局部浸润注射。

### 2. 急性肾衰竭：

滴注时间过长或剂量过大，肾血管剧烈收缩。产生少尿、无尿和肾实质损伤。

注意尿量的变化， $<25\text{mL/h}$ ，则减量、停药。

## 禁忌证：

高血压、动脉硬化症、器质性心脏病，少尿、无尿、严重微循环障碍患者、孕妇禁用（增加子宫收缩力）。

## 三、 $\beta$ 受体激动药

### (一) $\beta_1$ 、 $\beta_2$ 受体激动药

#### 异丙肾上腺素 (isoprenaline)

异丙肾上腺素为人工合成品，药用为其盐酸盐。

#### 体内过程：

异丙肾上腺素在肠道易被破坏，口服无效。气雾吸入或舌下给药吸收快，也可静脉滴注。主要在肝脏及其他组织中被COMT代谢，较少被MAO代谢，原型药及其代谢产物主要经肾脏排泄。

### 临床应用：

1. **心脏骤停**：可与NA或间羟胺合用，心室内注射。
2. **房室传导阻滞**：II、III度房室传导阻滞，舌下给药或静滴；
3. **支气管哮喘**：控制急性发作（舌下或喷雾）。
4. **感染性休克（少用）**：扩张周围血管，解除小动脉痉挛，兴奋心脏，输出量↑，改善微循环。

### 不良反应与注意事项：

常见头晕、心悸；

用量大或静注过快时，因心肌氧耗量增加，引起心肌缺血、心律失常等。

禁用于冠心病、心肌炎、甲亢等。

## (二) $\beta_1$ 受体激动药

### 多巴酚丁胺 (dobutamine)

多巴酚丁胺为人工合成品，以消旋化合物的形式存在。口服无效，一般采用静脉给药。多巴酚丁胺为选择性 $\beta_1$ 受体激动药，与异丙肾上腺素相比，其正性肌力作用显著，能加强心肌收缩力，增加心输出量，但对心率影响不明显。主要用于治疗心肌收缩力减弱的心力衰竭，临床作为短期支持治疗。连续应用可产生快速耐受性。梗阻性肥厚型心肌病患者禁用。

### （三） $\beta_2$ 受体激动药

本类药物有沙丁胺醇、特布他林、奥西那林、克仑特罗、沙美特罗等，选择性激动 $\beta_2$ 受体，使支气管扩张。口服有效，作用维持时间较长，是目前临床上治疗支气管哮喘的主要药物（见第七章）。

## 第五节 抗肾上腺素药与用药护理

抗肾上腺素药又称肾上腺素受体阻断药、肾上腺素受体拮抗药，根据药物对受体的选择性不同，分为 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药， $\alpha$ 受体拮抗药和 $\beta$ 受体拮抗药。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 拉贝洛尔 (labetalol)

拉贝洛尔有两个光学中心，有4种光学异构体，各异构体具有不同的活性，故药理作用复杂。

**体内过程：**拉贝洛尔口服吸收良好，口服生物利用度20~40%，主要由肝脏代谢，代谢产物和55~60%的原型药经肾脏排泄。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 药理作用：

能阻断 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体，对 $\beta_1$ 和 $\beta_2$ 受体的作用相似，对 $\alpha_1$ 受体作用较弱，对 $\alpha_2$ 受体无作用。

1. 阻断 $\alpha_1$ 受体可引起血管扩张，血压下降，直立位时作用更显著；阻断 $\beta_1$ 受体也可产生降压作用
2. 激动 $\beta_2$ 受体可扩张肾血管、增加肾血流量。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 临床应用:

临床主要用于外周血管阻力增加所致的**中度或重度高血压**，静脉给药可抢救高血压危象。此外，还可治疗心绞痛、嗜铬细胞瘤等疾病。

**不良反应:** 常见不良反应有眩晕、乏力、恶心等。大剂量可引起体位性低血压。该药对支气管收缩作用不强，但有支气管哮喘史的患者仍应谨慎用药。注射液不宜与葡萄糖氯化钠注射液混合滴注。口服个体差异大，宜个体化给药。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 卡维地洛(carvedilol)

卡维地洛是第一个被正式批准用于治疗心衰的 $\beta$ 受体阻断药。

**体内过程：**卡维地洛口服吸收迅速，食物可减缓其吸收，但不影响生物利用度。首过效应显著，生物利用度仅25%，血浆蛋白结合率约98%，主要经肝脏代谢，粪便排泄，16%经肾排出。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 药理作用：

卡维地洛是一个新型的同时具有 $\alpha_1$ 、 $\beta_1$ 、 $\beta_2$ 受体阻断作用的药物，无内在拟交感活性，有膜稳定作用，此外还有抗氧化、抗炎、抗细胞凋亡作用， $\alpha$ 和 $\beta$ 受体阻断作用的比率为1:10，无内在拟交感活性。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 临床应用:

临床主要用于外周血管阻力增加所致的中度或重度高血压，静脉给药可抢救高血压危象。此外，还可治疗心绞痛、嗜铬细胞瘤等疾病。

**不良反应:** 常见不良反应有眩晕、乏力、恶心等。大剂量可引起体位性低血压。该药对支气管收缩作用不强，但有支气管哮喘史的患者仍应谨慎用药。注射液不宜与葡萄糖氯化钠注射液混合滴注。口服个体差异大，宜个体化给药。

## 一、 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体拮抗药

### 卡维地洛(carvedilol)

卡维地洛口服吸收迅速，食物可减缓其吸收，但不影响生物利用度。首过效应显著，生物利用度仅25%，血浆蛋白结合率约98%，主要经肝脏代谢，粪便排泄，16%经肾排出。

## 二、 $\alpha$ 受体拮抗药

### (一) 非选择性 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体拮抗药

#### 1. 短效类 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体拮抗药

酚妥拉明 (phentolamine)

#### 体内过程:

口服生物利用度低，主要注射给药。肌肉注射持续30-45分钟，静脉注射后2~5分钟起效，大部分药物以代谢产物形式经肾排泄。

### 药理作用：

酚妥拉明可竞争性阻断 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体，作用温和，维持时间短。

1. 扩张血管：使血管扩张，外周血管阻力降低，血压下降。
2. 兴奋心脏：酚妥拉明可兴奋心脏，使心收缩力加强，心输出量增加。此作用与血管扩张、血压下降，反射性兴奋交感神经有关，也与阻断神经末梢突出前膜的 $\alpha_2$ 受体，促进去甲肾上腺素的释放有关。
3. 其他：有拟胆碱作用和组胺样作用，使胃肠平滑肌兴奋、胃酸分泌增加。

### 临床应用：

- 1、外周血管痉挛性疾病：肢端动脉痉挛的雷诺综合征等
- 2、NA滴注外漏时，皮下浸润注射可防止局部组织坏死
- 3、顽固性充血性心力衰竭（辅助治疗）
- 4、休克 适于：感染性、心源性、神经源性休克
- 5、肾上腺嗜铬细胞瘤的诊断、骤发高血压危象以及手术前的准备。
- 6、药物引起的高血压：拟交感胺类药物过量所致高血压

### 不良反应：

- 1、低血压；
- 2、胃肠平滑肌兴奋：腹痛、腹泻、呕吐和诱发溃疡病。胃炎，胃、十二指肠溃疡患者慎用；
- 3、心律失常和心绞痛。冠心病患者慎用；

## 二、 $\alpha$ 受体拮抗药

### (一) 非选择性 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体拮抗药

#### 2. 长效类 $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ 受体拮抗药

酚苄明 ( phenoxybenzamine)

#### 体内过程:

口服仅20%~30%吸收，数小时后起效，作用可持续3~4日。因刺激性强不作肌肉或皮下注射，仅作静脉注射。静脉给药1小时后可达最大效应。 $t_{1/2}$ 为24小时，在肝内代谢，经肾和胆汁排出。



谢谢观看

