

# 肾上腺素受体 阻断药



# 第七章

## 肾上腺素受体阻断药

01

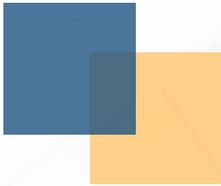
第一节  $\alpha$ 受体阻断药

02

第二节  $\beta$ 受体阻断药

03

第三节  $\alpha$ 、 $\beta$ 受体阻断药



## 学习目标

---

- 1.掌握酚妥拉明、普萘洛尔的药理作用、用途、不良反应及注意事项；
- 2.了解吲哚洛尔、拉贝洛尔的药理作用、用途、不良反应及注意事项；
- 3.初步具有根据普萘洛尔的药理作用、用途、不良反应及注意事项制定护理措施及对患者家属进行相关的护理宣教能力

## 案例导入

患者，女，37岁，因心悸、出汗、多食、进行性消瘦2年，加重1周入院，经查体和实验室检查，诊断为甲状腺功能亢进。口服甲巯咪唑片10mg/次，3次/天；普萘洛尔片10mg，3次/天；用药第四天早餐后突感头晕、心悸、出冷汗、全身软弱无力、双手颤动，无意识障碍，测血压90/65mmHg，心电图示窦性心动过速，空腹血糖：1.78mmol/L（参考值：3.9～6.1mmol/L），静脉注射50%葡萄糖60ml后症状缓解，停用普萘洛尔后未出现上述症状。复查空腹血糖：4.4mmol/L。

请思考：

- 1.为什么患者应用普萘洛尔出现低血糖反应？
- 2.应用普萘洛尔可能产生哪些不良反应？应如何进行用药监护？

# 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

## 酚妥拉明

### 【药理作用】

- 1.血管 酚妥拉明具有阻断血管平滑肌 $\alpha_1$ 受体和直接扩张血管作用。静脉注射能使血管舒张，血压下降，静脉和小静脉扩张明显，舒张小动脉使肺动脉压下降，外周血管阻力降低。
- 2.心脏 酚妥拉明可兴奋心脏，使心肌收缩力增强，心率加快，心排出量增加。这种兴奋作用部分由血管舒张、血压下降，反射性兴奋交感神经引起；部分是阻断神经末梢突触前膜 $\alpha_2$ 受体，从而促进去甲肾上腺素释放，激动心脏 $\beta_1$ 受体的结果。偶致心律失常。此外，酚妥拉明尚具有阻滞钾通道的作用。

## 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

### 酚妥拉明

#### 【药理作用】

3.其他 本药也能阻断5-HT受体，激动M胆碱受体和 $H_1$ ， $H_2$ 受体，促进肥大细胞释放组胺。其兴奋胃肠道平滑肌的作用可被阿托品拮抗。酚妥拉明可引起皮肤潮红等。

# 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

## 酚妥拉明

### 【临床应用】

1. 治疗外周血管痉挛性疾病 如肢端动脉痉挛的雷诺综合征、血栓闭塞性脉管炎及冻伤后遗症。
2. 去甲肾上腺素滴注外漏 长期过量静脉滴注去甲肾上腺素或静脉滴注去甲肾上腺素外漏时，可致皮肤缺血、苍白和剧烈疼痛，甚至坏死，此时可用酚妥拉明溶于生理盐水中做皮下浸润注射。

## 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

### 酚妥拉明

#### 【临床应用】

3.治疗顽固性充血性心力衰竭和急性心肌梗死 心力衰竭时，由于心排出量不足，导致交感张力增加、外周阻力增高、肺充血以及肺动脉压力升高，易产生肺水肿。应用酚妥拉明可扩张血管、降低外周阻力，使心脏后负荷明显降低、左室舒张末压与肺动脉压下降、心排出量增加，心力衰竭得以减轻。用酚妥拉明等血管扩张药治疗其他药物无效的急性心肌梗死及充血性心脏病所致的心力衰竭。

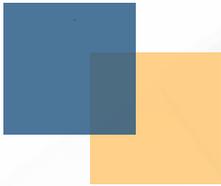
## 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

### 酚妥拉明

#### 【临床应用】

4.抗休克 酚妥拉明舒张血管，降低外周阻力，使心排出量增加，并能降低肺循环阻力，防止肺水肿的发生，从而改善休克状态时的内脏血液灌注，解除微循环障碍。尤其对休克症状改善不佳而左心室充盈压增高者疗效好。适用于感染性、心源性和神经源性休克。但给药前必须补足血容量。

5.肾上腺嗜铬细胞瘤 酚妥拉明降低嗜铬细胞瘤所致的高血压，用于肾上腺嗜铬细胞瘤的鉴别诊断、骤发高血压危象以及手术前的准备。作鉴别诊断试验时，可引起严重低血压，曾有致死的报道，故应特别慎重。

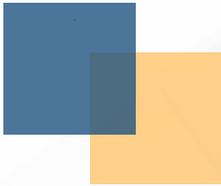


## 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

### 酚妥拉明

#### 【临床应用】

6. 药物引起的高血压 用于肾上腺素等拟交感胺药物过量所致的高血压。亦可用于突然停用可乐定或应用单胺氧化酶抑制药患者食用富含酪胺食物后出现的高血压危象。

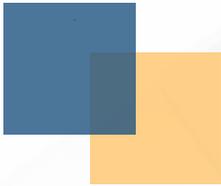


## 第一节 $\alpha$ 肾上腺素受体阻断药

### 酚妥拉明

#### 【不良反应】

常见的反应有低血压，胃肠平滑肌兴奋所致的腹痛、腹泻、呕吐和诱发溃疡病。静脉给药可能引起严重的心律失常和心绞痛，因此需缓慢注射或滴注。胃炎、胃十二指肠溃疡病、冠心病患者慎用。



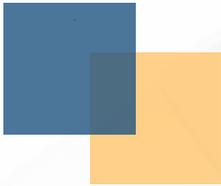
## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 【药理作用】

#### 1. $\beta$ 受体阻断作用

(1) 心血管系统： $\beta$ 受体阻断药对正常人血压影响不明显，而对高血压患者具有降压作用。

(2) 支气管平滑肌：非选择性的 $\beta$ 受体阻断药阻断支气管平滑肌的 $\beta_2$ 受体，收缩支气管平滑肌而增加呼吸道阻力。但这种作用较弱，对正常人影响较少，只有在支气管哮喘或慢性阻塞性肺疾病的患者，有时可诱发或加重哮喘。选择性 $\beta_1$ 受体阻断药的此作用较弱。



## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 【药理作用】

#### 1. $\beta$ 受体阻断作用

##### (3) 代谢

①脂肪代谢

②糖代谢

③有效控制甲亢的症状。

(4) 肾素： $\beta$ 受体阻断药通过阻断肾小球旁器细胞的 $\beta_1$ 受体而抑制肾素的释放，这可能是其降血压作用原因之一。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 【药理作用】

2. 内在拟交感活性 有些 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药除了能阻断 $\beta$ 受体外，对 $\beta$ 受体亦具有部分激动作用，也称内在拟交感活性。由于这种作用较弱，通常被其 $\beta$ 受体阻断作用所掩盖。内在拟交感活性较强的药物在临床应用时，其抑制心肌收缩力，减慢心率和收缩支气管作用较不具内在拟交感活性的药物弱。
3. 膜稳定作用 实验证明，有些 $\beta$ 受体阻断药具有局部麻醉作用和奎尼丁样作用，这两种作用都由于其降低细胞膜对离子的通透性所致，故称为膜稳定作用。
4. 眼 降低眼压，治疗青光眼。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 【临床应用】

- 1.心律失常 对多种原因引起的快速型心律失常有效，尤其对运动或情绪紧张、激动所致心律失常或因心肌缺血、强心苷中毒引起的心律失常疗效好。
- 2.心绞痛和心肌梗死 对心绞痛有良好的疗效。对心肌梗死，早期应用普萘洛尔、美托洛尔和噻吗洛尔等均可降低心肌梗死患者的复发和猝死率。
- 3.高血压  $\beta$ 受体阻断药是治疗高血压的基础药物。
- 4.充血性心力衰竭  $\beta$ 受体阻断药对扩张型心肌病的心力衰竭治疗作用明显，现认为与以下几方面因素有关：①改善心脏舒张功能；②缓解由儿茶酚胺引起的心脏损害；③抑制前列腺素或肾素所致的缩血管作用；④使 $\beta$ 受体上调，恢复心肌对内源性儿茶酚胺的敏感性。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 【临床应用】

5. 甲状腺功能亢进 近年将普萘洛尔用于治疗甲状腺功能亢进(甲亢)。甲亢时儿茶酚胺的过度作用，引起的多种症状与 $\beta$ 受体兴奋有关，特别是心脏和代谢方面的异常，因此应用 $\beta$ 受体阻断药治疗效果明显。

6. 其他 噻吗洛尔局部应用减少房水形成，降低眼压，用于治疗原发性开角型青光眼。新开发的治疗青光眼的 $\beta$ 受体阻断药有左布诺洛尔、美替洛尔等。另外， $\beta$ 受体阻断药还可用于偏头痛、减轻肌肉震颤以及酒精中毒等。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

【不良反应及禁忌证】一般不良反应有恶心、呕吐、轻度腹泻等消化道症状，偶见过敏性皮疹和血小板减少等。严重的不良反应常与应用不当有关，可导致严重后果，主要包括：

1. 心血管反应

2. 诱发或加重支气管哮喘

3. 反跳现象

4. 其他 偶见眼-皮肤黏膜综合征，个别患者有幻觉、失眠和抑郁症状。少数人可出现低血糖及加强降血糖药的降血糖作用，掩盖低血糖时出汗和心悸的症状而出现严重后果。

禁忌证：禁用于严重左室心功能不全、窦性心动过缓、重度房室传导阻滞和支气管哮喘的患者。心肌梗死患者及肝功能不良者应慎用。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 一、非选择性 $\beta$ 受体阻断药

#### 普萘洛尔

【药理作用与临床应用】普萘洛尔具有较强的 $\beta$ 受体阻断作用，对 $\beta_1$ 和 $\beta_2$ 受体的选择性很低，无内在拟交感活性。用药后心率减慢，心肌收缩力和心排出量降低，冠脉血流量下降，心肌耗氧量明显减少，对高血压患者可使其血压下降，支气管阻力也有一定程度的增高。用于治疗心律失常、心绞痛、高血压、甲状腺功能亢进等。

## 第二节 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 二、选择性 $\beta_1$ 受体阻断药

#### 美托洛尔

美托洛尔对 $\beta_1$ 受体有选择性阻断作用，缺乏内在拟交感活性，对 $\beta_2$ 受体作用较弱，故增加呼吸道阻力作用较轻，但对哮喘患者仍需慎用。

口服用于治疗各型高血压、心绞痛、心律失常、甲状腺功能亢进、心脏神经官能症等。静脉注射用于室上性快速型心律失常、预防和治疗心肌缺血、急性心肌梗死伴快速型心律失常和胸痛的患者。

## 第三节 $\alpha$ 、 $\beta$ 肾上腺素受体阻断药

### 拉贝洛尔

#### 【药理作用与临床应用】

拉贝洛尔兼有 $\alpha$ 、 $\beta$ 受体的阻断作用，由于对 $\beta_2$ 受体的内在拟交感活性及药物的直接作用，可使血管舒张，增加肾血流量。

拉贝洛尔多用于中度和重度的高血压、心绞痛，静注可用于高血压危象，与单纯 $\beta$ 受体阻断药相比能降低卧位血压和外周阻力，一般不降低心排出量，可降低立位血压，引起直立性低血压。

#### 【不良反应】

常见不良反应有眩晕、乏力、恶心等。哮喘及心功能不全者禁用。儿童、孕妇及脑出血者忌用静注。注射液不能与葡萄糖盐水混合滴注。