

肾上腺素受体 激动药



第五章

肾上腺素受体激动药

01

第一节 肾上腺素受体激动药 分类

02

第二节 α 、 β 受体激动药

03

第三节 α 受体激动药

04

第四节 β 受体激动药



学习目标

- 1.掌握肾上腺素、去甲肾上腺素、异丙肾上腺素、多巴胺药理作用、用途、不良反应及注意事项；
- 2.了解麻黄碱、多巴酚丁胺的药理作用、用途、不良反应及注意事项；
- 3.初步具有根据肾上腺素的药理作用、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

第一节 肾上腺素受体激动药分类

概念

• 肾上腺素受体激动药是一类与肾上腺素受体结合后可激动该受体，产生肾上腺素样作用的药物，又称拟肾上腺素药。

分类

肾上腺素受体激动药

α ， β 受体激动药

α 受体激动药

β 受体激动药

传出神经系统受体的类型及效应

α_1 受体	皮肤、粘膜、内脏 血管平滑肌	收缩
	瞳孔开大肌	扩瞳
α_2 受体	突触前膜	负反馈调节 抑制NA分泌
β_1 受体	心脏	心率，传导，收缩力 ↑
β_2 受体	支气管平滑肌	舒张
	冠脉、骨骼肌血管	舒张
	肝脏	肝糖元分解

肾上腺素受体激动药分类

根据它们对
肾上腺素受体
选择性

1. 激动 α 和 β 受体的拟肾上腺素药

肾上腺素 麻黄碱 多巴胺

2. 主要激动 α 受体的拟肾上腺素药

去甲肾上腺素 间羟胺 新福林等

3. 主要激动 β 受体的拟肾上腺素药

异丙基肾上腺素 多巴酚丁胺



案例导入

患者,女,16岁,学生。因发热、咽痛就诊。应用普鲁卡因青霉素肌肉注射。患者青霉素皮试(-)。青霉素80万单位肌肉注射后,患者感头昏,护士当即让其躺在观察床上,并测得BP: 120/80mmHg, P:80次/分。医生嘱:肌肉注射“非那根” 25mg。注射5分钟后,患者感心慌、心悸伴寒战。查体:患者神志清楚,面色潮红,表情痛苦。HR:156次/分。经查实,护士误将盐酸异丙肾上腺素当成盐酸异丙嗪(非那根)给患者注射。

请思考:

- 1.患者注射青霉素后的症状后是否符合药物过敏的表现?
- 2.此事给我们怎样的教训?



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、去甲肾上腺素相似的药物，与肾上腺素受体结合并激动受体，产生肾上腺素样作用，又称拟肾上腺素药。它们都是胺类，作用亦与兴奋交感神经的效应相似，故又称拟交感胺类。

按其对不同肾上腺素受体类型的选择性而分为三大类:① α 肾上腺素受体激动药；
② α 、 β 肾上腺素受体激动药；③ β 肾上腺素受体激动药



第二节 α 肾上腺素受体激动药

去甲肾上腺素 (NA)

去甲肾上腺素化学性质不稳定，见光、遇热易分解，口服因局部作用使胃黏膜血管收缩而影响其吸收，在肠内易被碱性肠液破坏。

【药理作用】

激动 α 受体作用强大，对心脏 β_1 受体作用较弱，对 β_2 受体几乎无作用。

- 1.血管 激动血管 α_1 受体，使血管收缩，主要使小动脉和小静脉收缩。
- 2.心脏 较弱激动心脏的 β_1 受体，使心肌收缩性加强，心率加快，传导加速，心排出量增加。



第二节 α 肾上腺素受体激动药

去甲肾上腺素 (NA)

【药理作用】

3.血压 小剂量静脉滴注血管收缩作用尚不十分剧烈时，由于心脏兴奋使收缩压升高，而舒张压升高不明显，故脉压加大。较大剂量时，因血管强烈收缩使外周阻力明显增高，故收缩压升高的同时舒张压也明显升高，脉压减小。

4.其他 对机体代谢的影响较弱，仅在大剂量时才出现血糖升高。对中枢神经系统的作用较弱。对于孕妇，可增加子宫收缩的频率。



第二节 α 肾上腺素受体激动药

去甲肾上腺素（NA）

【临床应用】

去甲肾上腺素仅限于早期神经源性休克以及嗜铬细胞瘤切除后或药物中毒时的低血压。本药稀释后口服，可使食管和胃黏膜血管收缩，产生局部止血作用。



第二节 α 肾上腺素受体激动药

去甲肾上腺素 (NA)

【不良反应及禁忌证】

- 1.局部组织缺血坏死 静脉滴注时间过长、浓度过高或药液漏出血管，可引起局部缺血坏死，如发现外漏或注射部位皮肤苍白，应停止注射或更换注射部位，进行热敷，并用 α 受体阻断药酚妥拉明作局部浸润注射，以扩张血管。
 - 2.急性肾衰竭 滴注时间过长或剂量过大，可使肾脏血管剧烈收缩，产生少尿、无尿和肾实质损伤，故用药期间尿量应保持在每小时25ml以上。
- 伴有高血压、动脉硬化症、器质性心脏病、少尿、无尿、严重微循环障碍的患者及孕妇禁用。



第二节 α 肾上腺素受体激动药

间羟胺

间羟胺的化学性质较去甲肾上腺素稳定，主要作用是直接激动 α 受体，对 β_1 受体作用较弱。短时间内连续应用，产生快速耐受性。在产生耐受性时，适当加用小剂量去甲肾上腺素可恢复或增强其升压作用。

间羟胺收缩血管，升高血压作用较去甲肾上腺素弱而持久，略增加心肌收缩性，使休克患者的心排出量增加。对心率的影响不明显，有时因血压升高反射性减慢心率，但很少引起心律失常；对肾脏血管的收缩作用较去甲肾上腺素弱，但仍能显著减少肾脏血流量。

间羟胺用于各种休克早期及手术后或脊髓麻醉后的休克。也可用于阵发性房性心动过速，特别是伴有低血压的患者，反射性减慢心率，并对窦房结可能具有直接抑制作用，使心率恢复正常。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

肾上腺素化学性质不稳定，见光易失效；在中性尤其是碱性溶液中，易氧化变色失去活性。口服后在碱性肠液、肠黏膜及肝内易被破坏氧化失效，不能达到有效血药浓度。

【药理作用】

肾上腺素主要激动 α 和 β 受体。

1.心脏 作用于心肌、传导系统和窦房结的 β_1 及 β_2 受体，加强心肌收缩性，加速传导，加快心率，提高心肌的兴奋性。由于心肌收缩力增强，心率加快，故心排出量增加。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

【药理作用】

2.血管 激动血管平滑肌上的 α 受体，血管收缩；激动 β_2 受体，血管舒张。

3.血压 在皮下注射治疗量肾上腺素或低浓度静脉滴注时，由于心脏兴奋，皮肤黏膜血管收缩，使收缩压和舒张压升高；由于骨骼肌血管的舒张作用，抵消或超过了皮肤黏膜血管收缩作用的影响，故舒张压不变或下降；此时脉压加大，身体各部位血液重新分配，有利于紧急状态下机体能量供应的需要。较大剂量静脉注射时，由于缩血管反应使收缩压和舒张压均升高。肾上腺素的典型血压改变多为双相反应，即给药后迅速出现明显的升压作用，而后出现微弱的降压反应，后者持续作用时间较长。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

【药理作用】

4.平滑肌

激动支气管平滑肌的 β_2 受体，发挥强大的舒张支气管作用，并能抑制肥大细胞释放组胺等过敏性物质。

5.代谢 肝糖原分解，升高血糖作用较去甲肾上腺素显著。肾上腺素加速脂肪分解，使血液中游离脂肪酸升高。

6.中枢神经系统 肾上腺素不易透过血脑屏障，治疗量时一般无明显中枢兴奋现象，大剂量时出现中枢兴奋症状，如激动、呕吐、肌强直，甚至惊厥等。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

【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的心脏骤停，可用肾上腺素做心室内注射，使心脏重新起搏同时进行心脏按压、人工呼吸和纠正酸中毒等措施。对电击所致的心脏骤停，用肾上腺素配合心脏除颤器或利多卡因等除颤。

2.过敏性疾病

- (1) 过敏性休克：为治疗过敏性休克的首选药。
- (2) 支气管哮喘：本品由于不良反应严重，仅用于急性发作者。
- (3) 血管神经性水肿及血清病



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

【临床应用】

- 3.局部应用 肾上腺素与局麻药配伍，可延缓局麻药的吸收，延长局麻药作用时间。一般局麻药中肾上腺素的浓度为1:250000，一次用量不超过0.3mg。将浸有肾上腺素的纱布或棉球(0.1%)用于鼻黏膜和牙龈表面，可使微血管收缩，用于局部止血。
- 4.治疗青光眼 通过促进房水流出以及使 β 受体介导的眼内反应脱敏感化，降低眼压。

。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

肾上腺素

【不良反应及禁忌证】

主要不良反应为心悸、烦躁、头痛和血压升高等。剂量过大时， α 受体过度兴奋使血压骤升，有发生脑出血的危险，故老年人慎用。当 β 受体兴奋过强时，可使心肌耗氧量增加，引起心肌缺血和心律失常，甚至心室纤颤，故应严格掌握剂量。禁用于高血压、脑动脉硬化、器质性心脏病、糖尿病和甲状腺功能亢进症等。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

多巴胺 (DA)

口服后易在肠和肝中被破坏而失效。一般用静脉滴注给药。

【药理作用】

多巴胺主要激动 α 、 β 和外周的多巴胺受体，并促进神经末梢释放NA。

1. 心血管 多巴胺对心血管的作用与用药浓度有关，低浓度时主要与位于肾脏、肠系膜和冠脉的多巴胺受体(D_1)结合，通过激活腺苷酸环化酶，使细胞内cAMP水平提高而导致血管舒张。高浓度的多巴胺激动心脏 β_1 受体，使心肌收缩力增强，心排出量增加。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

多巴胺 (DA)

【药理作用】

2. 血压 多巴胺在高剂量可增加收缩压，但对舒张压无明显影响或轻微增加，脉压增大。由于心排出量增加，而肾和肠系膜血管阻力下降，其他血管阻力基本不变，总外周阻力变化不大。继续增加给药浓度，多巴胺可激动血管的 α 受体，导致血管收缩，引起总外周阻力增加，使血压升高，这一作用可被 α 受体阻断药所拮抗。

3. 肾脏 多巴胺在低浓度时作用于 D_1 受体，舒张肾血管，使肾血流量增加，肾小球的滤过率也增加。同时多巴胺具有排钠利尿作用，可能是多巴胺直接对肾小管 D_1 受体的作用。大剂量时兴奋肾血管的 α 受体，可使肾血管明显收缩。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

多巴胺 (DA)

【临床应用】

用于各种休克，如感染中毒性休克、心源性休克及出血性休克等。多巴胺作用时间短，需静脉滴注，可根据需要逐渐增加剂量。滴注给药时必须适当补充血容量，纠正酸中毒。用药时应监测心功能改变。多巴胺与利尿药联合应用于急性肾衰竭。对急性心功能不全，具有改善血流动力学的作用。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

多巴胺 (DA)

【不良反应】

一般较轻，偶见恶心、呕吐。如剂量过大或滴注太快可出现心动过速、心律失常和肾血管收缩导致肾功能下降等，一旦发生，应减慢滴注速度或停药。如仍不消失，可用酚妥拉明拮抗。与单胺氧化酶抑制药或三环类抗抑郁药合用时，多巴胺剂量应酌减。室性心律失常、闭塞性血管病、心肌梗死、动脉硬化和高血压患者慎用。嗜铬细胞瘤患者禁用。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

麻黄碱

口服易吸收，可通过血脑屏障。

【药理作用】

麻黄碱可直接和间接激动肾上腺素受体，它的直接作用在不同组织可表现为激动 α_1 、 α_2 、 β_1 和 β_2 受体，另外可促进肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素而发挥间接作用。与肾上腺素比较，麻黄碱具有下列特点：

- ①化学性质稳定，口服有效；
- ②拟肾上腺素作用弱而持久；
- ③中枢兴奋作用较显著；
- ④易产生快速耐受性。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

麻黄碱

【药理作用】

- 1.心血管 兴奋心脏，使心肌收缩力加强、心排出量增加。
- 2.支气管平滑肌 松弛支气管平滑肌作用较肾上腺素弱，起效慢，作用持久。
- 3.中枢神经系统 具有较显著的中枢兴奋作用，较大剂量可兴奋大脑和皮质下中枢，引起精神兴奋、不安和失眠等。
- 4.快速耐受性 麻黄碱短期内反复给药，作用逐渐减弱，称为快速耐受性，也称脱敏。停药后可以恢复。每日用药小于3次则快速耐受性一般不明显。麻黄碱的快速耐受性产生的机制，一般认为有受体逐渐饱和与递质逐渐耗损两种因素。



第三节 α 、 β 肾上腺素受体激动药

麻黄碱

【临床应用】

- 1.用于预防支气管哮喘发作和轻症的治疗，对于重症急性发作疗效较差。
- 2.消除鼻黏膜充血所引起的鼻塞，常用0.5% -1.0%溶液滴鼻，可明显改善黏膜肿胀。
- 3.防治某些低血压状态，如用于防治硬膜外和蛛网膜下腔麻醉所引起的低血压。
- 4.缓解荨麻疹和血管神经性水肿的皮肤黏膜症状。

【不良反应】

有时出现中枢兴奋所致的不安、失眠等，晚间服用宜加镇静催眠药防止失眠。连续滴鼻治疗过久，可产生反跳性鼻黏膜充血或萎缩。禁忌证同肾上腺素。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素

异丙肾上腺素口服易失效；气雾剂吸入给药，吸收较快。吸收后主要在肝及其他组织代谢。

【药理作用】主要激动 β 受体，对 β_1 和 β_2 受体选择性很低。对 α 受体几乎无作用。

1.心脏 对心脏 β_1 受体具有强大的激动作用，表现为正性肌力和正性频率作用，缩短收缩期和舒张期。与肾上腺素相比，异丙肾上腺素加快心率、加速传导的作用较强，心肌耗氧量明显增加，对窦房结有显著兴奋作用，也能引起心律失常，但较少产生室颤。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素

【药理作用】

2.血管和血压 对血管有舒张作用，主要是激动 β_2 受体使骨骼肌血管舒张，对肾血管和肠系膜血管舒张作用较弱，对冠状血管也有舒张作用，也有增加组织血流量的作用。由于心脏兴奋和外周血管舒张，使收缩压升高而舒张压略下降，此时冠脉流量增加；但如静脉注射给药，则可引起舒张压明显下降，降低了冠状血管的灌注压，冠脉有效血流量不增加。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素

【药理作用】

3.支气管平滑肌 可激动 β_2 受体，舒张支气管平滑肌，作用比肾上腺素略强，并具有抑制组胺等过敏性物质释放的作用。但对支气管黏膜的血管无收缩作用，故消除黏膜水肿的作用不如肾上腺素。久用可产生耐受性。

4.其他 能增加肝糖原、肌糖原分解，增加组织耗氧量。其升高血中游离脂肪酸作用与肾上腺素相似，而升高血糖作用较弱。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素

【临床应用】

- 1.心脏骤停 异丙肾上腺素对停搏的心脏具有起搏作用，使心脏恢复跳动。适用于心室自身节律缓慢，高度房室传导阻滞或窦房结功能衰竭而并发的心脏骤停，常与去甲肾上腺素或间羟胺合用作心室内注射。
- 2.房室传导阻滞 舌下含药或静脉滴注给药，治疗二、三度房室传导阻滞。
- 3.支气管哮喘 用于控制支气管哮喘急性发作，舌下或喷雾给药，疗效快而强。
- 4.休克 适用于中心静脉压高、心排出量低的感染性休克，但要注意补液及心脏毒性。目前临床已少用。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

异丙肾上腺素

【不良反应】常见的是心悸、头晕。用药过程中应注意控制心率。在支气管哮喘患者，已处于缺氧状态，加之气雾剂剂量不易掌握，如剂量过大，可致心肌耗氧量增加，引起心律失常，甚至产生危险的心动过速及心室颤动。禁用于冠心病、心肌炎和甲状腺功能亢进症等。



第四节 β 肾上腺素受体激动药

多巴酚丁胺

多巴酚丁胺口服无效，仅供静脉注射给药。

【药理作用】主要激动 β_1 受体。

【临床应用】主要用于治疗心肌梗死并发心力衰竭，多巴酚丁胺可增加心肌收缩力，增加心排出量和降低肺毛细血管楔压，并使左室充盈压明显降低，使心功能改善，继发地促进排钠、排水、增加尿量，有利于消除水肿。

【不良反应】用药期间可引起血压升高、心悸、头痛、气短等不良反应。偶致室性心律失常。梗阻性肥厚型心肌病患者禁用，因其可促进房室传导。心房纤颤、心肌梗死和高血压患者慎用。