



肾上腺素受体阻断药

Adrenoceptor blocker



臧伟进 教授

2012.9

教学大纲

1. 熟悉 α 受体阻断药和 β 受体阻断药的分类。
2. 掌握 α 受体阻断药（酚妥拉明、酚苄明、哌唑嗪）和 β 受体阻断药的药理作用、临床应用和不良反应。
3. 了解常用 β 受体阻断药的作用特点和主要作用。

Q: 肾上腺素受体的分型和分布为何?

肾上腺素受体 Adrenoceptor

(血管、心脏、血压、内脏平滑肌、代谢... ..)

α -肾上腺素受体

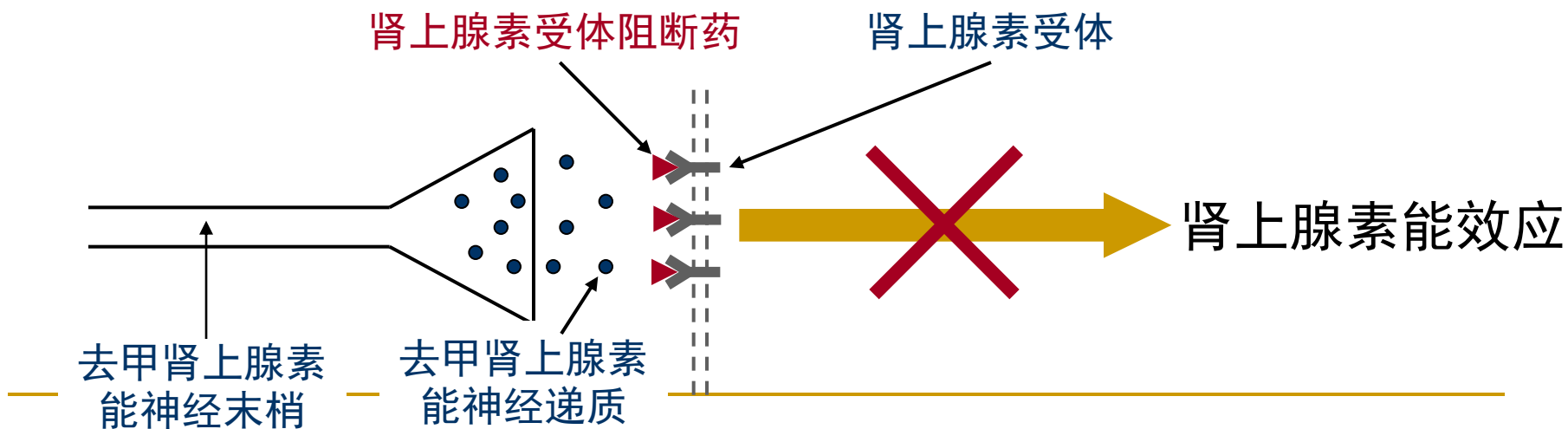
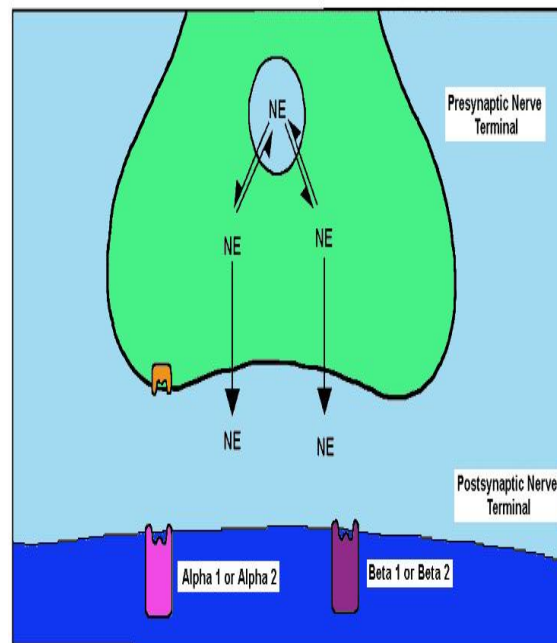
- α_1 —皮肤粘膜及内脏血管平滑肌—收缩
瞳孔—扩大
- α_2 —突触前膜—负反馈调节NA释放

β -肾上腺素受体

- β_1 —心脏—兴奋
- β_2 —骨骼肌血管—扩张
支气管平滑肌—松弛
突触前膜—正反馈调节NA释放
- β_3 —脂肪细胞—脂肪分解

肾上腺素受体阻断药 adrenoceptor blockers

- 能与肾上腺素受体结合，但本身不产生或较少产生拟肾上腺素作用，却能妨碍去甲肾上腺素能神经递质或外源性拟肾上腺素药与受体的结合，从而产生抗肾上腺素的作用。
- 这类药物依其对 α 和 β 受体的选择性不同，可分为 α 肾上腺素受体阻断药和 β 肾上腺素受体阻断药。



肾上腺素受体阻断药的分类

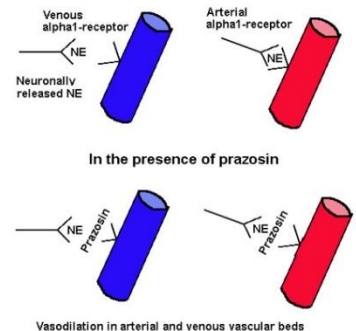
1. α 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 α 受体阻断药：酚妥拉明，酚苄明；
- ② 选择性 α 受体阻断药： α_1 受体阻断药：哌唑嗪；
 α_2 受体阻断药：育亨宾；

2. β 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 β 受体阻断药：普萘洛尔、吲哚洛尔；
- ② 选择性 β_1 受体阻断药：阿替洛尔，普拉洛尔；

3. α 、 β 肾上腺素受体阻断药：拉贝洛尔。



第一节 α 肾上腺素受体阻断药

α 肾上腺素受体阻断药（ α -adrenoceptor blockers）对 α 肾上腺素受体具有高度选择性，能与 α 受体结合，从而拮抗去甲肾上腺素能神经递质或拟肾上腺素的 α 型作用。

α 肾上腺素受体阻断药

① 非选择性 α 受体阻断药：酚妥拉明，酚苄明；

② 选择性 α 受体阻断药：

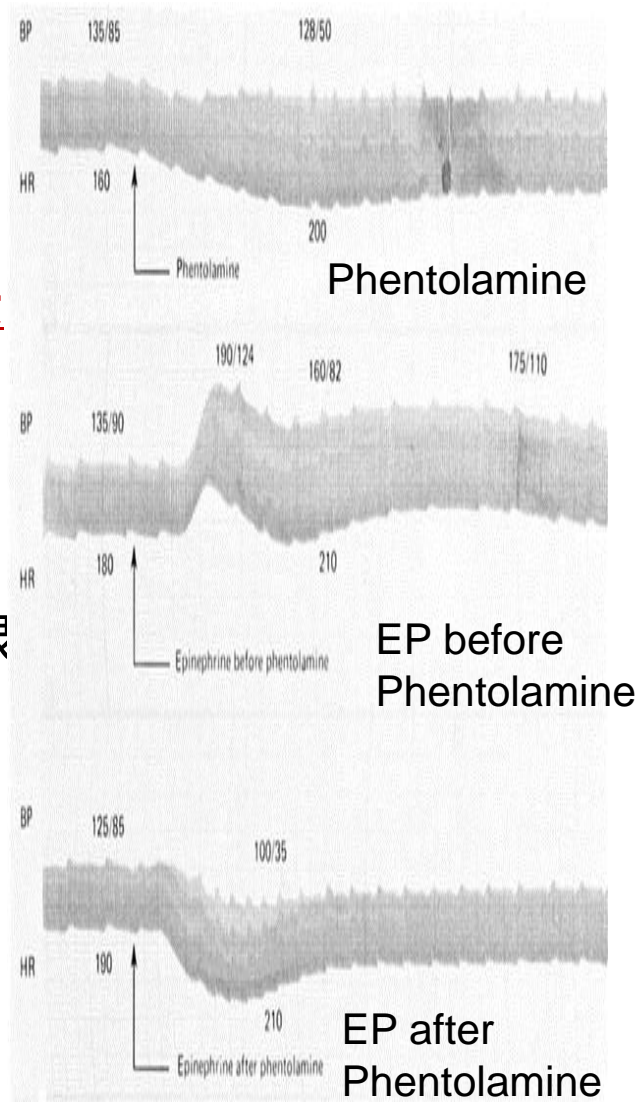
α_1 受体阻断药：哌唑嗪；

α_2 受体阻断药：育亨宾；

α 肾上腺素受体阻断药的特点

能将肾上腺素的升压作用翻转为降压，这一现象称为“**肾上腺素作用的翻转**”（adrenaline reversal）。 α 受体阻断药选择性阻断了与血管收缩有关的 α 受体，致使兼有 α 型作用和 β 型作用的肾上腺素的缩血管效应被取消，而 β_2 受体的舒张血管作用可充分表现出来，产生降压作用。

对主要作用于血管 α 受体的去甲肾上腺素，本类药物仅能取消或减弱其升压效应，无“翻转作用”。本类药物对主要作用于 β 受体的异丙肾上腺素降压作用无影响。



α 肾上腺素受体阻断药的分类

依 α 受体阻断药对 α_1 、 α_2 受体亚型的选择性不同，可分为：

1. 非选择性 α 肾上腺素受体阻断药：

- 1)短效类：酚妥拉明（phentolamine）；
- 2)长效类：酚苄明（phenoxybenzamine）。

2. 选择性 α 肾上腺素受体阻断药：

- 1)选择性 α_1 肾上腺素受体阻断药：哌唑嗪（prazosin）；
- 2)选择性 α_2 肾上腺素受体阻断药：育亨宾（yohimbine）。

一、非选择性 α 肾上腺素受体阻断药

酚妥拉明 (phentolamine, 苄胺唑啉, 立其丁, regitine)

- ✓ 为咪唑啉衍生物，以离子键、氢键与受体疏松结合，当药物浓度降低时，**极易解离**。
- ✓ 由于短效 α 肾上腺素受体阻断药与儿茶酚胺作用于相同受体，互相竞争与受体结合，因此这类抗肾上腺素药亦称为**竞争性 α 受体阻断药**。
- ✓ 竞争性受体阻断药可使激动药的量效曲线**平行右移**，增加激动药的剂量仍**可达到最大效应**。

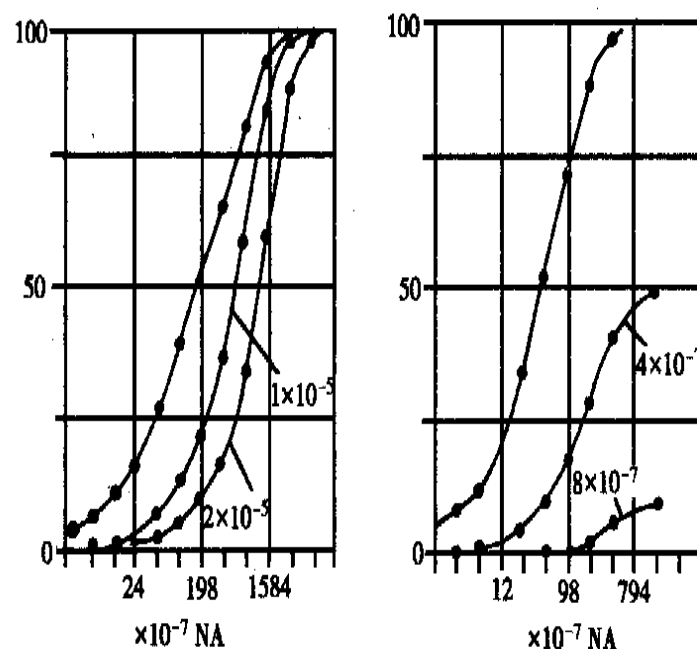


图 11-2 短效(左,妥拉唑啉)和长效(右,酚苄明)

α 受体阻断药对 NA 收缩猫脾脏条的影响

横坐标: NA 浓度; 纵坐标: 最大收缩的%; 图内为阻断药浓度

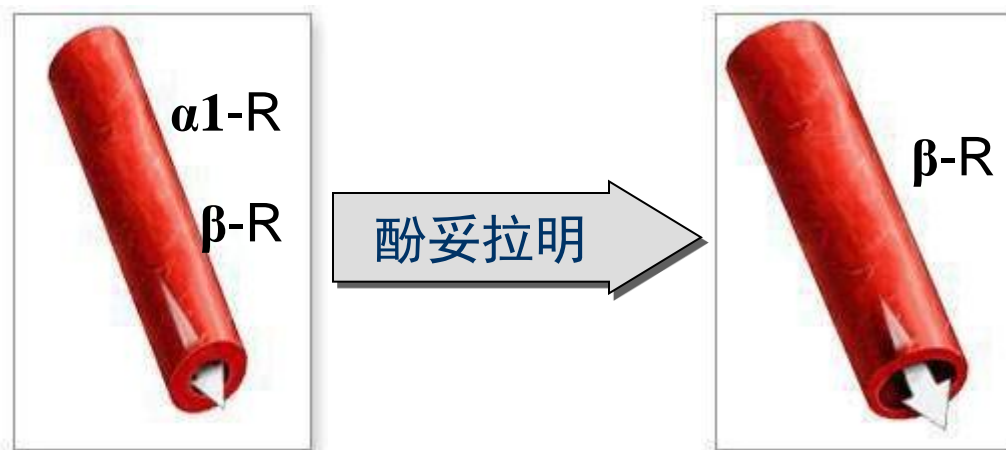
酚妥拉明 (phentolamine) 药理作用

短效、竞争性 α 受体阻断剂，阻断 α_1 、 α_2 受体。

1. α 受体阻断作用：血管扩张、兴奋心脏、肾上腺素作用的翻转

1) 血管扩张：阻断血管平滑肌 α_1 受体

直接松弛血管平滑肌 \rightarrow 外周血管阻力 \downarrow ，血压 \downarrow 。



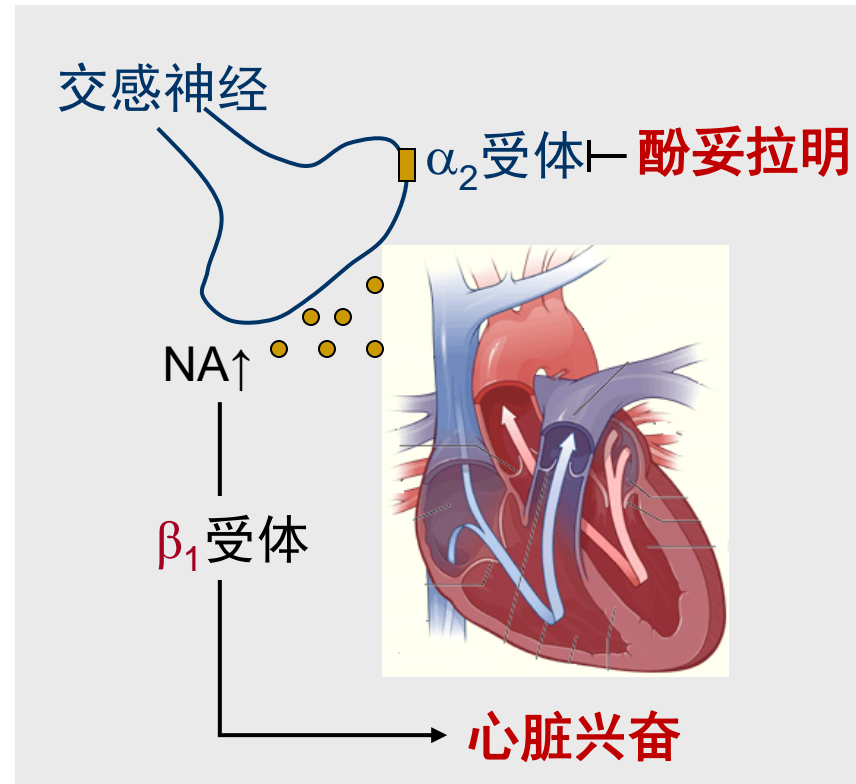
正常血管平滑肌

血管平滑肌舒张

2) **兴奋心脏**：心肌收缩力、心率、心输出量↑。

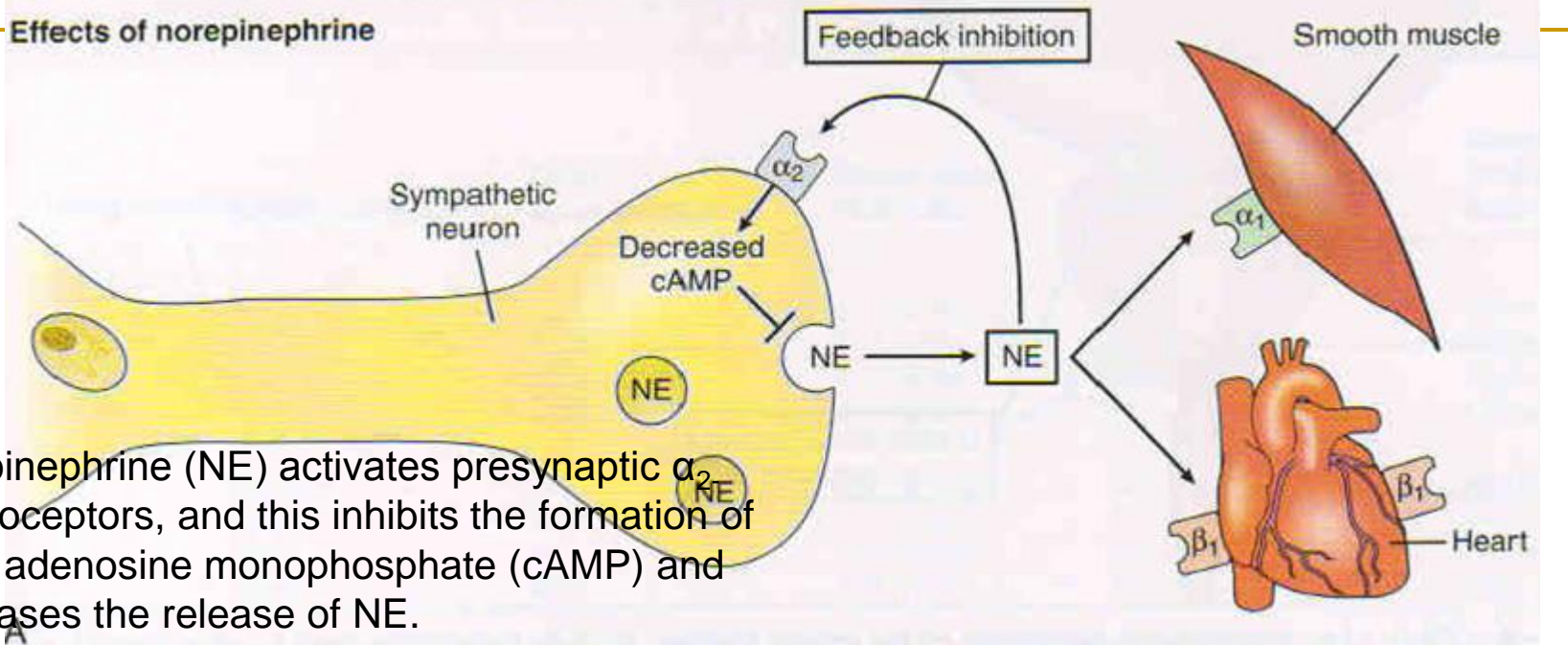
①血管扩张、血压下降反射性地兴奋交感神经；

②阻断去甲肾上腺素能神经末梢突触前膜 α_2 受体，取消负反馈，促进递质NA的释放，激动心脏 β_1 受体→心脏兴奋。



3) **肾上腺素作用的翻转**：酚妥拉明阻断 α_1 受体后，肾上腺素只能发挥其激动血管 β_2 受体的作用，使肾上腺素的升压作用翻转为降压作用。

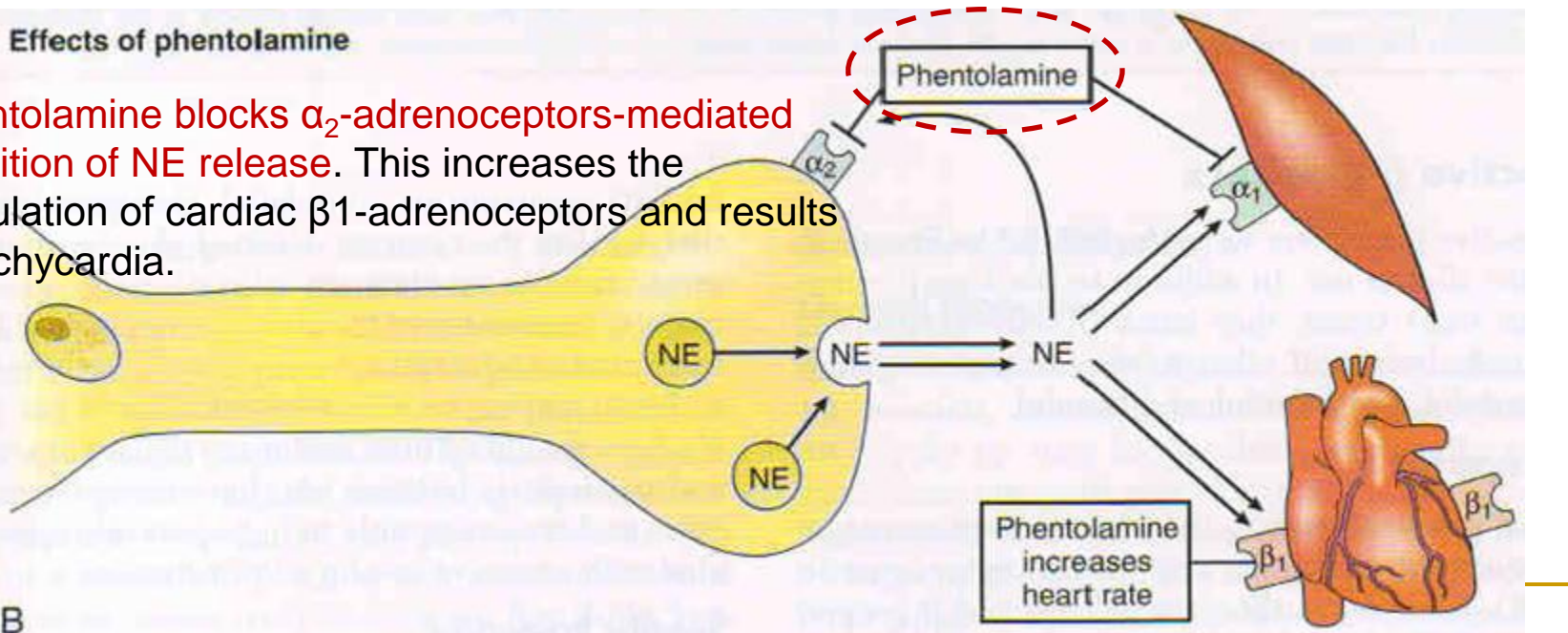
Effects of norepinephrine



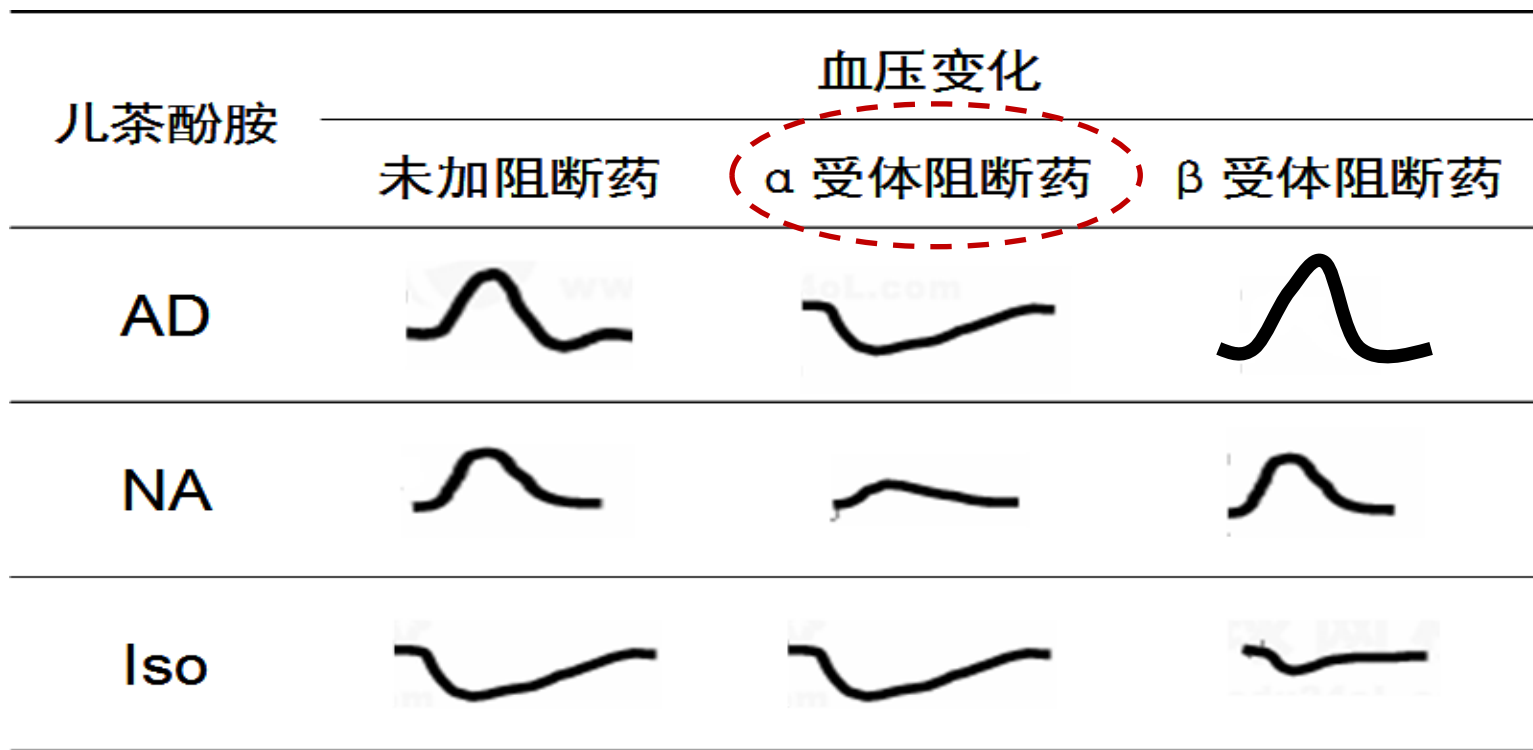
Norepinephrine (NE) activates presynaptic α_2 adrenoceptors, and this inhibits the formation of cyclic adenosine monophosphate (cAMP) and decreases the release of NE.

Effects of phentolamine

Phentolamine blocks α_2 -adrenoceptors-mediated inhibition of NE release. This increases the stimulation of cardiac β_1 -adrenoceptors and results in tachycardia.



B



酚妥拉明阻断 α_1 受体后，肾上腺素只能发挥其激动血管 β_2 受体的作用，使肾上腺素的升压作用翻转为[降压作用](#)。

2. 其他

激动M胆碱受体→胃肠道平滑肌兴奋,阿托品可拮抗。

促进肥大细胞释放组胺→胃酸分泌 \uparrow ，皮肤潮红。 具有**阻断5-HT**和阻滞钾通道的作用。

【临床应用】

1. **外周血管痉挛性疾病**：如肢端动脉痉挛（雷诺病）、血栓闭塞性脉管炎等。
2. **局部浸润**：拮抗NA静滴外漏，防止组织坏死。
3. **抗休克**：①扩张血管，降低外周阻力，减轻心脏负荷，增加血流灌注，改善微循环；②降低肺循环阻力，防止肺水肿；③增强心肌收缩力增加心搏出量；④适用低排高阻、已补足血容量的感染中毒性、心源性及神经性休克。
4. **急性心肌梗死和顽固性充血性心力衰竭**：心衰→RAAS激活→水钠潴留→血容量↑→心脏前负荷↑。酚妥拉明可扩张血管，降低外周阻力，降低心脏的前、后负荷和左室充盈压，增加心搏出量，改善心功能不全、肺水肿和全身性水肿。
5. 防治嗜铬细胞瘤患者的阵发性高血压和预防术中突发的高血压危象。

【不良反应】

常见为低血压。尚有恶心、呕吐等胃肠道反应（拟胆碱作用）。

酚苄明 (phenoxybenzamine, dibenzylamine, 苯苄胺)

与 α 受体形成**牢固共价键**，引起作用具**难逆性**、非竞争性，故称为**长效非竞争性 α 肾上腺素受体阻断药**。NA量效曲线**右移且压低**。酚苄明具有**起效慢、作用强而持久**的特点。

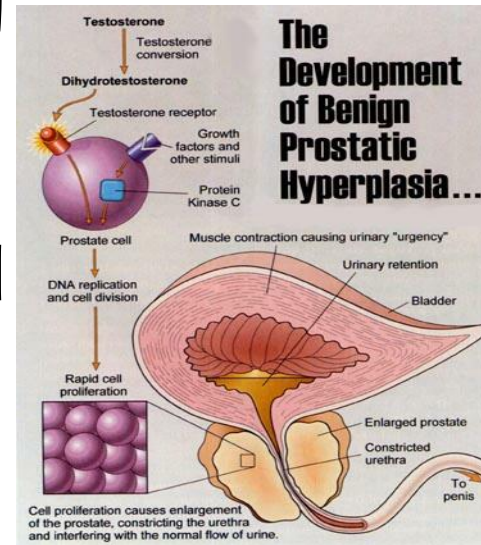
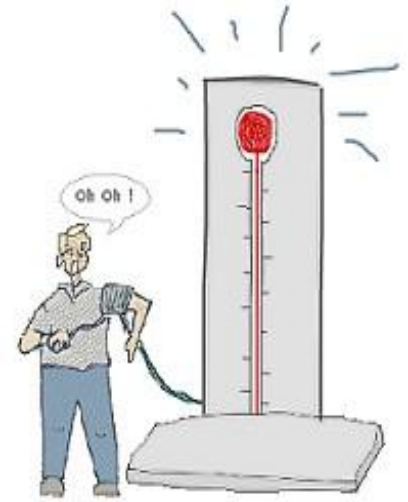
【药理作用与临床应用】

1. 阻断 α 受体，**舒张外周血管**，其作用取决于血管受去甲肾上腺素能神经控制的程度；
2. 当交感神经张力高，血容量减少或直立时，会引起**显著的血压下降**；
3. 因阻断神经突触前膜 α_2 受体和血压下降可引起**心率加快**。

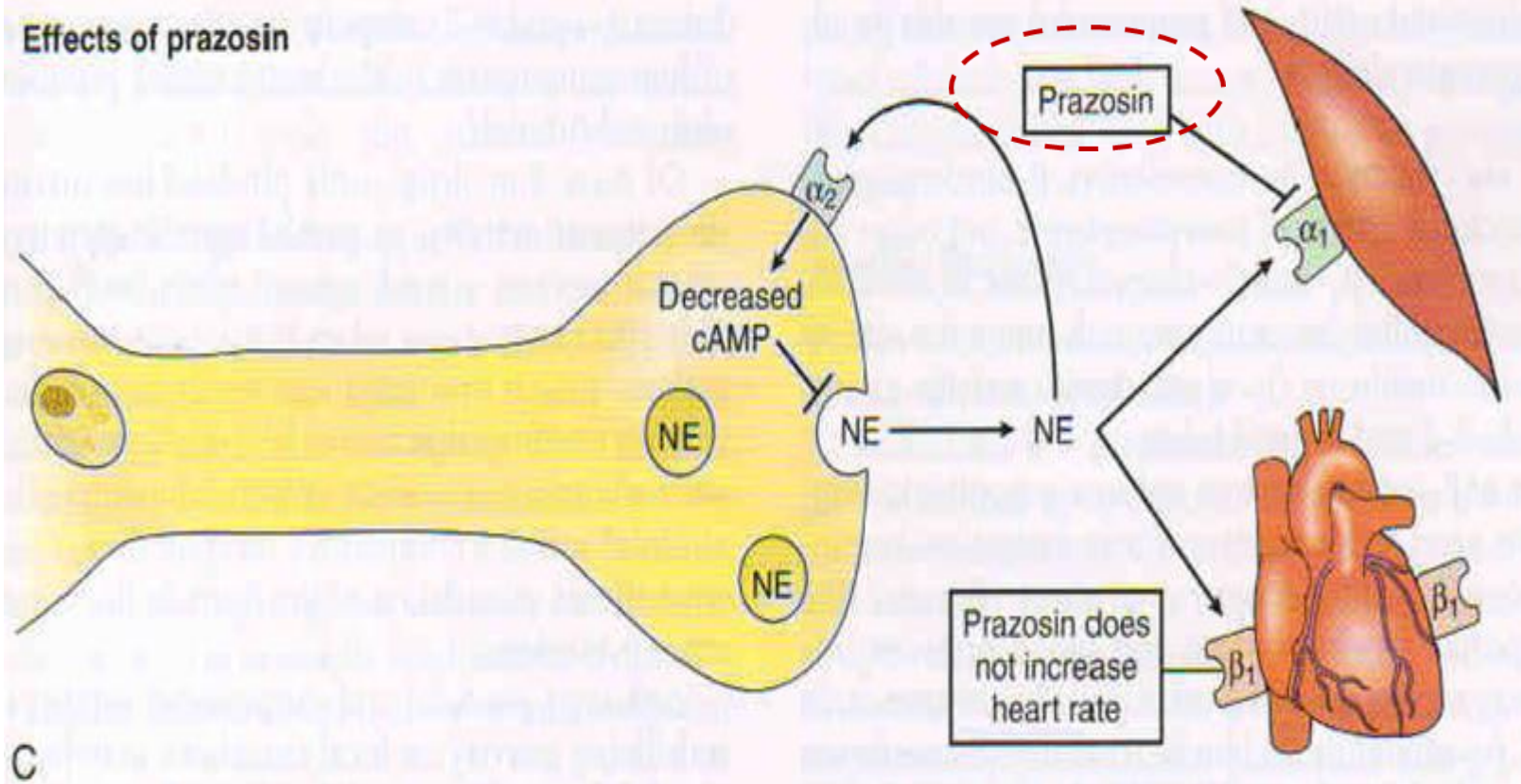
主要用于治疗**外周血管痉挛性疾病**，也用于休克和嗜铬细胞瘤的治疗。

二、选择性 α_1 肾上腺素受体阻断药

- 能选择性阻断动脉和静脉 α_1 受体，对去甲肾上腺素能神经突触前膜上 α_2 受体作用甚微。
- 扩张血管、降低外周阻力，降低血压，但加快心率的作用较温和。
- 临床常用**哌唑嗪**（prazosin）、特拉唑嗪（terazosin），主要治疗原发性高血压和顽固性心功能不全，也可用于良性前列腺肥大引起的排尿困难。
- **坦索洛新** 选择性阻断 α_{1A} 肾上腺素受体，松弛前列腺平滑肌而治疗前列腺肥大引起的排尿困难，对心率、血压没有明显影响。



Effects of prazosin

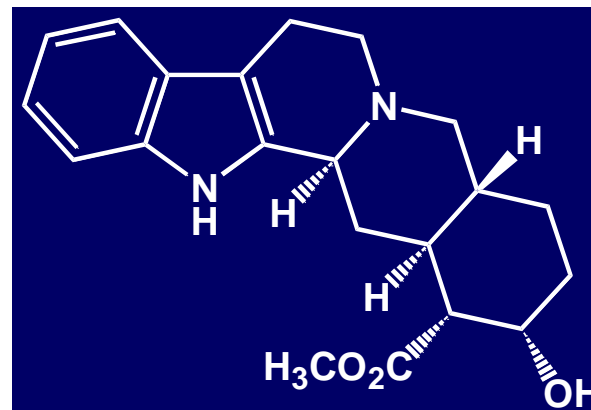


Prazosin, a selective α_1 -blocker, does not block α_2 -adrenoceptors-mediated inhibition of NE release. Therefore, prazosin causes less tachycardia than does phentolamine.

三、选择性 α_2 肾上腺素受体阻断药

育亨宾 (yohimbine)

选择性 α_2 肾上腺素受体阻断药。



【药理作用】

阻断外周及中枢 α_2 受体，促进去甲肾上腺素从未梢释放，增加交感张力，使血压升高，心率加快。

无临床应用意义，为实验研究工具药。

选择性 α 受体阻断药的特点

α_1 受体阻断药

α_{1A} 受体阻断药

α_2 受体阻断药

代表药物

哌唑嗪
特拉唑嗪

坦索洛尔

育亨宾

药理作用

扩张血管，降低
外周阻力，不增
加NA释放

松弛膀胱颈部和前
列腺平滑肌

促进NA释放，增
加交感张力

临床应用

高血压
心功能不全

良性前列腺肥大所
致的排尿困难

工具药

第二节 β 肾上腺素受体阻断药

(β -adrenoceptor blockers, β -adrenoceptor antagonists),

简称 β 受体阻断药 (β blockers), 竞争性 β 受体结合, 从而拮抗心脏兴奋、支气管、血管舒张作用。使激动药的量效曲线平行右移, 增加激动药的剂量仍可达到最大效应。

β 受体阻断药可选择性阻断与血管扩张有关的 β 受体, 致使兼具 α 型作用和 β 型作用的肾上腺素的扩血管效应被取消, 留下 α 型缩血管作用, 从而使升压作用略有增加。能拮抗或取消异丙肾上腺素的扩血管降压作用, 对主要作用于血管 α 受体的去甲肾上腺素的升压作用没影响。



- ✓ β 受体阻断药可选择性阻断与血管扩张有关的 β 受体，致使兼具 α 型作用和 β 型作用的肾上腺素的扩血管效应被取消，留下 α 型缩血管作用，从而使升压作用略有增加。
- ✓ 能拮抗或取消异丙肾上腺素的扩血管降压作用，对主要作用于血管 α 受体的去甲肾上腺素的升压作用没影响。

β 肾上腺素受体阻断药的分类

依对受体亚型选择性及是否具有内在活性的不同，分为：

1. 非选择性 β 受体阻断药：

- ✓ 无内在拟交感活性类：普萘洛尔（propranolol）、噻吗洛尔（timolol）、索他洛尔（sotalol）；
- ✓ 有内在拟交感活性类：吲哚洛尔（pindolol）；

2. 选择性 β_1 受体阻断药：

- ✓ 无内在拟交感活性类：阿替洛尔（atenolol）、美托洛尔（metoprolol）；
- ✓ 有内在拟交感活性类：普拉洛尔（practolol）；

3. α, β 肾上腺素受体阻断药：拉贝洛尔（labetalol）。

β 受体阻断药的分类和特征

药物名称	阻断 β 受体的作用强度	内在拟交感活性	膜稳定作用	首过消除(%)	主要消除器官
非选择性β受体阻断药					
普萘洛尔propranolol	1	-	+	60-70	肝
噻吗洛尔timolol	6-100	-	-	25-30	肝
吲哚洛尔 pindolol	6-15	++	+	10-13	肝肾
选择性β_1受体阻断药					
阿替洛尔 atenolol	0.5-1	-	-	0-10	肾
美托洛尔metoprolol	1	-	-	50-60	肝
α、β受体阻断药					
拉贝洛尔 labetalol	0.25	±	±	60	肝

β 受体阻断药的药理作用

1. β 受体阻断作用

1) 心血管系统：抑制心脏、降压

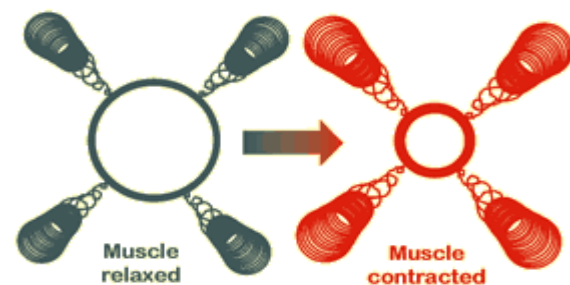
① 阻断心脏 β_1 受体 \rightarrow 心率、心肌收缩力、耗氧量、血压 \downarrow 。

② 非选择性 β 受体阻断药(如普萘洛尔)阻断血管 β_2 受体、抑制心脏 \rightarrow 反射性兴奋交感神经 \rightarrow 血管收缩，外周阻力增加 \rightarrow 肝、肾、骨骼肌及冠状动脉血流量 \downarrow 。

2) 支气管平滑肌：

阻断支气管平滑肌 β_2 受体 \rightarrow 支气管平滑肌收缩 \rightarrow 气道阻力 \uparrow

支气管哮喘患者可诱发或加重哮喘的急性发作。



β 受体阻断药的药理作用

3) 对代谢的影响:

①抑制肌糖原分解;

②抑制肝糖原分解;

③抑制脂肪分解;

④阻断 β 受体作用、抑制甲状腺素 (T_4) 转为活性更强的三碘甲状腺原氨酸 (T_3)，控制甲亢症状。

4) 对肾素的影响: 阻断肾小球旁细胞 β_1 受体 \rightarrow 肾素释放 \downarrow \rightarrow 降压。

5) 对眼的影响: 阻断睫状体 β 受体 \rightarrow 降低cAMP水平 \rightarrow 减少房水生成。

β 受体阻断药的药理作用

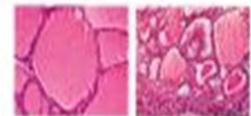
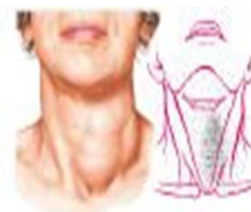
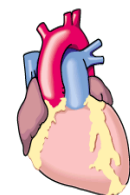
- 2. 内在拟交感活性**（intrinsic sympathomimetic activity, ISA）
有些 β 肾上腺素受体阻断药与 β 受体结合时多少也会产生激动效应，称内在拟交感活性（部分激动作用）。整体动物作用较弱，被其 β 受体阻断掩盖。应用于临床，其抑制心肌收缩力，收缩支气管作用一般较不具ISA的药物弱。
- 3. 膜稳定作用：**由于降低细胞膜对离子通透性，稳定心肌细胞膜电位，具局部麻醉和奎尼丁样作用，为膜稳定作用。

小结：

1. β 受体阻断作用：心血管、支气管平滑肌、代谢的影响及肾素分泌减少
2. 内在拟交感活性
3. 膜稳定作用
4. 其他 抗血小板作用，降低眼压

β 受体阻断药的临床应用

1. **原发性高血压**：适用于各型高血压。可单独使用，也常与其他抗高血压药合用。
2. **心律失常**：对交感神经兴奋性过高、甲亢、嗜铬细胞瘤所致的室上型心律失常效果良好。对由于运动或情绪紧张所致的室性心律失常或心肌缺血、强心苷中毒引起的心律失常效果好。
3. **心绞痛**
4. **充血性心力衰竭**
5. 其他：原发性开角型青光眼；**治疗甲亢和甲状腺危象**；偏头痛、肌震颤和乙醇中毒。



β 受体阻断药 β -adrenoceptor antagonists

【不良反应】

1. 一般不良反应：恶心、呕吐、轻度腹泻等。
2. **心血管反应**：对心脏 β_1 受体的阻断，心脏功能收到抑制，发生**心功能不全、窦性心动过缓和房室传导阻滞**等。阻断 β_2 受体，外周血管收缩，引起间歇性跛或雷诺现象。
3. **诱发或加重哮喘**。
4. **反跳现象**：长期使用 β 受体阻断药时如突然停药，可引起原来病症加重。故长期用药者应**逐渐减量直至停药**。
5. 其他：失眠、多梦和抑郁症；可引起血糖升高等。

【禁忌症】

严重心功能不全、窦性心动过缓、重度房室传导阻滞及支气管哮喘患者。

一、非选择性 β 受体阻断药

普萘洛尔 (propranolol, 心得安)

是最早成功应用于临床的 β 受体阻断药，对 β_1 和 β_2 受体选择性低，无内在拟交感活性，具有膜稳定作用。

【药理作用】

- 1、阻断心肌 β_1 受体：心率 \downarrow ，心收缩力 \downarrow ，心输出量 \downarrow ，心肌耗氧量 \downarrow 。
- 2、阻滞心脏起搏点电位的交感神经兴奋：抑制 Ca^{2+} 电流和起搏电流 \rightarrow 自律性 \downarrow 、传导 \downarrow 、有效不应期 $\uparrow \rightarrow$ 抗心律失常。
- 3、拮抗中枢和肾上腺素能神经元功能、抑制肾素，抗高血压。

【体内过程】口服吸收完全，生物利用度高，在肝脏灭活，由肾脏排泄。

英国科学家布莱克因制成治疗冠心病的 β -受体阻滞剂——心得安获得诺贝尔生理学或医学奖

- Propranolol is a standard antagonist.

It is a safe and effective drug for many indications



Sir James W. Black
The Nobel Prize in
Physiology or Medicine
1988

普萘洛尔 (propranolol)

【临床应用】

- 1、治疗多种**心律失常**：房性和室性期前收缩、窦性及室上性心动过速、心房颤动。
- 2、**心绞痛、心肌梗死**；
- 3、**高血压**、嗜铬细胞瘤；
- 4、甲亢(用作控制心率过快)等。

【不良反应】

- 1、一般不良反应：恶心、呕吐等胃肠道反应及乏力、嗜睡、多梦、头晕、失眠等中枢神经系统症状。
- 2、心血管：心动过缓、低血压，甚至充血性心力衰竭。
- 3、较少见有支气管痉挛、呼吸困难等

噻吗洛尔 (timolol, 噻吗心安)

- ✓ 噻吗洛尔为目前**最强的 β 受体阻断药**，无内在拟交感活性，无膜稳定作用。
- ✓ 降低cAMP水平，减少房水生成，降低眼压**治疗青光眼**，对瞳孔和视力无影响，效果优于毛果芸香碱。
- ✓ 禁用于支气管哮喘或有支气管哮喘病史者。

吲哚洛尔 (pindodol, 心得静)

- ✓ β 受体阻断作用为普萘洛尔的6-15倍；
- ✓ **有较强的内在拟交感活性**，主要激动血管平滑肌 β_2 受体（扩血管）。可治疗高血压、心律失常、心绞痛和甲亢等。

二、选择性 β_1 受体阻断药

阿替洛尔 (atenolol) 美托洛尔 (metoprolol)

- ①对 β_1 受体具有选择性阻断作用，无内在拟交感活性和膜稳定作用。对 β_2 受体作用弱。
- ②阿替洛尔不亦透过血脑屏障，中枢的不良反应少；
- ③美托洛尔作用较普萘洛尔持久；
- ④临床上治疗高血压、心绞痛、心律失常、甲亢等。

第三节 α 、 β 肾上腺素受体阻断药

本类药物兼有 α 和 β 受体阻断作用，但对 β 受体的阻断作用强于 α 受体的阻断作用。既能通过阻断 α 受体引起血管舒张，又能通过阻断 β 受体减少心输出量。代表药拉贝洛尔、卡维地洛等。

拉贝洛尔 (labetalol)

- ✓ 兼有 α 和 β 受体阻断，对 β 受体阻断作用比普萘洛尔弱，无心肌抑制作用；对 α 受体阻断比酚妥拉明弱。
- ✓ 临床用于中、重度高血压、心绞痛，静脉注射可治疗高血压危象。

卡维地洛 (carvedilol)

- ① 具有非选择性 β 阻滞、 α 阻滞和抗氧化作用。
- ② 选择性阻滞 α_1 受体而扩张血管，减少外周阻力；
- ③ β 阻滞抑制肾素-血管紧张素-醛固酮系统，降低血浆肾素活性；
- ④ 具有抗氧化特性，抑制自由基；
- ⑤ 无内在拟交感活性，有膜稳定性；
- ⑥ 用于原发性高血压及充血性心力衰竭的治疗。

In this chapter we have learned

肾上腺素受体阻断药的分类

1. α 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 α 受体阻断药：酚妥拉明，酚苄明；
- ② 选择性 α 受体阻断药： α_1 受体阻断药：哌唑嗪；
 α_2 受体阻断药：育亨宾；

2. β 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 β 受体阻断药：普萘洛尔、吲哚洛尔；
- ② 选择性 β_1 受体阻断药：阿替洛尔，普拉洛尔；

3. α 、 β 肾上腺素受体阻断药：拉贝洛尔。

教学大纲

1. 熟悉 α 受体阻断药和 β 受体阻断药的分类。
2. 掌握 α 受体阻断药（酚妥拉明、酚苄明、哌唑嗪）和 β 受体阻断药的药理作用、临床应用和不良反应。
3. 了解常用 β 受体阻断药的作用特点和主要作用。

思考题

1. 肾上腺素受体阻断药的分类及代表药。
2. 酚妥拉明和酚苄明的作用特点及临床应用。
3. 试述 β 受体阻断药的药理作用和临床应用。
4. 简述具有内在活性的 β 受体阻断药的临床应用。
5. 何谓“肾上腺素作用的翻转”？试举例说明。





传出神经系统药理概论

Introduction to pharmacology of efferent nervous system



臧伟进 教授

E-mail : zwj@mail.xjtu.edu.cn

2012.9

传出神经系统的分类

传出神经的解剖学分类

1. 自主神经

(autonomic nervous system)

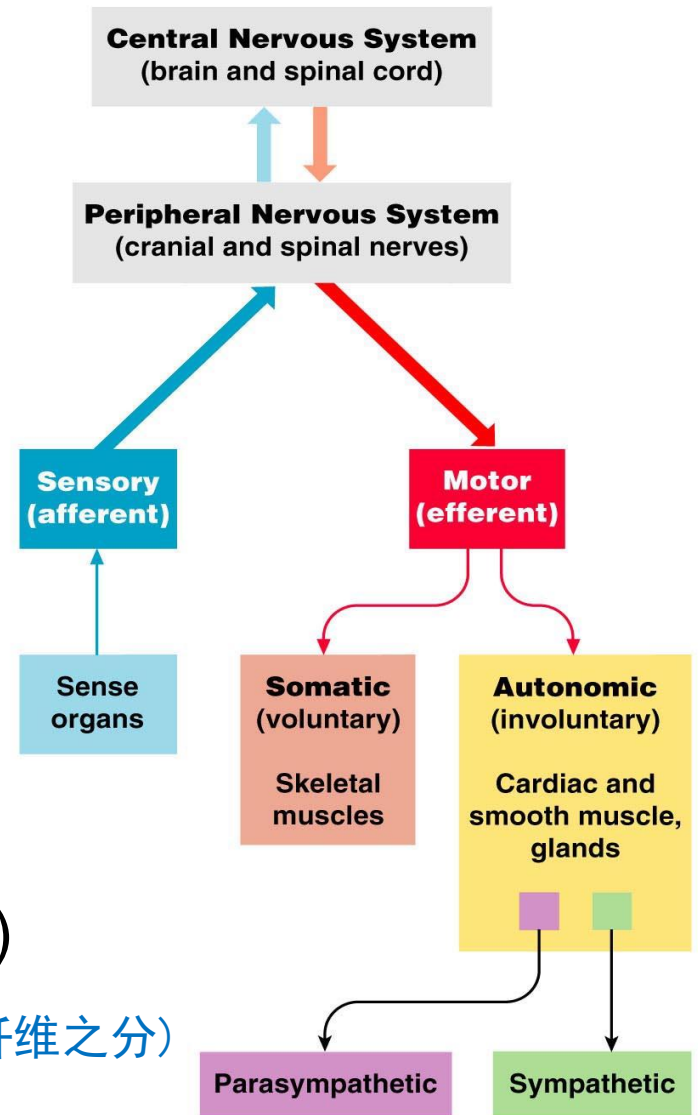
交感神经 } 心肌
副交感神经 } 平滑肌
腺体

(中枢发出、换神经元、有节前节后纤维)

2. 运动神经 → 骨骼肌

(somatic motor nervous system)

(中枢发出、不换神经元、直接到达, 无节前节后纤维之分)



传出神经按递质分类

1. 胆碱能神经 (cholinergic nerve)

- ①全部交感神经和副交感神经的节前纤维
- ②运动神经
- ③全部副交感神经的节后纤维
- ④极少数交感神经的节后纤维 (支配汗腺和骨骼肌血管舒张神经)
- ⑤支配肾上腺髓质的交感神经节前纤维

2. 去甲肾上腺素能神经 (adrenergic nerve)

几乎全部交感神经节后纤维

受体的亚型

乙酰胆碱受体（与ACh结合）

1) 毒蕈碱型受体 (Muscarinic R, M胆碱受体, M_{1-5}):

M_1 : 胃壁细胞—分泌增加

 中枢神经—兴奋

M_2 : 心脏—抑制

M_3 : 支气管、胃肠道平滑肌、睫状肌—收缩

 血管内皮、平滑肌—舒张

 腺体—分泌增加

2) 尼古丁型受体 (Nicotine):

N_1 (N_N) 受体: 神经节—兴奋

N_2 (N_M) 受体: 骨骼肌—收缩

肾上腺素受体

α -肾上腺素受体

- α_1 —皮肤粘膜及内脏血管平滑肌—收缩
瞳孔—扩大
- α_2 —突触前膜—负反馈调节NA释放

β -肾上腺素受体

- β_1 —心脏—兴奋
- β_2 —骨骼肌血管—扩张
支气管平滑肌—松弛
突触前膜—正反馈调节NA释放
- β_3 —脂肪细胞—脂肪分解

传出神经系统的生理功能

↑ 胆碱能神经兴奋效应：

- ✓ **M受体**：心脏抑制、血管扩张、内脏（支气管、胃肠道、子宫、膀胱等）平滑肌收缩、腺体分泌增多、瞳孔缩小。
- ✓ **N_N受体**：自主神经节兴奋。
- ✓ **N_M受体**：为骨骼肌收缩。

↑ 去甲肾上腺素能神经兴奋的效应：

- ✓ **α_1 受体**：血管（皮肤粘膜血管、肾、脑、肝、肠等内脏血管）收缩、瞳孔扩大等。
- ✓ **β_1 受体**：心脏兴奋、肾素分泌、脂肪分解等。
- ✓ **β_2 受体**：心脏、骨骼肌血管扩张、支气管平滑肌松弛、糖原分解等。



拟副交感神经药/拟胆碱药物

Parasympathomimetics/ Cholinomimetic Drugs



臧伟进 教授

2012.9

拟胆碱药物 (cholinergic drugs) 分类

一、胆碱受体激动药 (直接拟胆碱药物)

- 1、M、N 胆碱受体激动药：乙酰胆碱(ACh)
- 2、M 胆碱受体激动药：毛果芸香碱
- 3、N 胆碱受体激动药：烟碱

二、抗胆碱酯酶药 (抑制ACh的水解，提高突触间隙ACh浓度)

易逆性抗胆碱酯酶药：新斯的明、毒扁豆碱

难逆性抗胆碱酯酶药：有机磷酸酯类 (对人畜均有毒性，临床治疗价值不大，主要具毒理学意义) / (包括中毒治疗)。

三、促乙酰胆碱释放药：(在神经末梢增加ACh释放) 氨吡啶



胆碱受体阻断药

Cholinoceptor Blocking Drugs



臧伟进 教授

2012.9

胆碱受体阻断药分类及代表药

一、M胆碱受体阻断药（平滑肌解痉药）

- ✓ 阿托品和阿托品类生物碱：阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱
- ✓ 阿托品的合成代用品：合成扩瞳药：后马托品
合成解痉药：溴丙胺太林、贝那替秦
选择性M受体亚型阻断药：哌仑西平

二、N胆碱受体阻断药

- ✓ N_N 受体阻断药（神经节阻断药）：美加明
- ✓ N_M 受体（神经肌肉阻断药）
 - 除极型肌松药：琥珀胆碱
 - 除极型肌松药：筒箭毒碱



肾上腺素受体激动药

Adrenoceptor agonists



臧伟进 教授

2012.9

肾上腺素受体激动药

1. α 、 β 受体激动药：肾上腺素、多巴胺、麻黄碱；

2. α 受体激动药：

① α_1 、 α_2 受体激动药：去甲肾上腺素、间羟胺；

② α_1 受体激动药：去氧肾上腺素、甲氧明；

③ α_2 受体激动药：羟甲唑啉。

3. β 受体激动药：

① β_1 、 β_2 受体激动药：异丙肾上腺素；

② β_1 受体激动药：多巴酚丁胺

③ β_2 受体激动药：沙丁胺醇。



肾上腺素受体阻断药

Adrenoceptor blocker



臧伟进 教授

2012.9

肾上腺素受体阻断药的分类

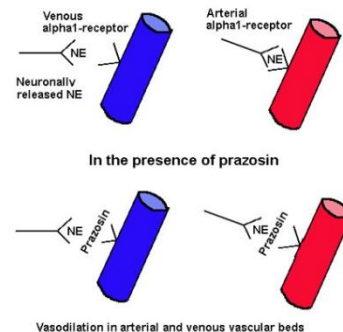
1. α 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 α 受体阻断药：酚妥拉明，酚苄明；
- ② 选择性 α 受体阻断药： α_1 受体阻断药：哌唑嗪；
 α_2 受体阻断药：育亨宾；

2. β 肾上腺素受体阻断药

- ① 非选择性 β 受体阻断药：普萘洛尔、吲哚洛尔；
- ② 选择性 β_1 受体阻断药：阿替洛尔，普拉洛尔；

3. α 、 β 肾上腺素受体阻断药：拉贝洛尔。



传出神经系统药物的基本作用和分类

一、拟胆碱药 M,N受体激动药：卡巴胆碱；
M受体激动药：毛果芸香碱
N受体激动药：烟碱
抗胆碱酯酶药：新斯的明

二、抗胆碱药 M受体阻断药：阿托品、东莨菪碱、山莨菪碱
N_N受体阻断药：美卡拉明（美加明）
N_M受体阻断药：琥珀胆碱，筒箭毒碱

三、拟肾上腺素药 α,β受体激动药：肾上腺素（Ad）
α受体激动药：去甲肾上腺素（NA）
β受体激动药：异丙肾上腺素（ISO）

四、抗肾上腺素药 α受体阻断药
非选择性α受体阻断药：酚妥拉明
α₁受体阻断药：哌唑嗪
β受体阻断药
非选择性β受体阻断药：普萘洛尔
β₁受体阻断药：美托洛尔
α,β受体阻断药：拉贝洛尔

Thank You for Your Attention

