

药理学笔记：药物的药理作用与机制 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E7_c23_17656.htm 1. 毛果芸香碱：M样作用（用阿托品拮抗）。缩瞳、调节眼内压和调节痉挛。用于青光眼。 2. 新斯的明：胆碱酯酶抑制剂。用于重症肌无力，术后腹气胀及尿潴留，阵发性室上性心动过速，肌松药的解毒。禁用于支气管哮喘，机械性肠梗阻，尿路阻塞。M样作用可用阿托品拮抗。 3. 碘解磷定：胆碱酯酶复活药，有机磷酸酯类中毒的常用解救药。应临时配置，静脉注射。 4. 阿托品：M受体阻滞药。竞争性拮抗ACh或拟胆碱药对M胆碱受体的激动作用。用于解除平滑肌痉挛，抑制腺体分泌，虹膜睫状体炎，眼底检查，验光，抗感染中毒性休克，抗心律失常，解救有机磷酸酯类中毒。禁用于青光眼及前列腺肥大患者禁用。用镇静药和抗惊厥药对抗阿托品中枢兴奋症状，同时用拟胆碱药毛果芸香碱或毒扁豆碱对抗“阿托品化”。同类药物莨菪碱。合成代用品：扩瞳药：后马托品。解痉药：丙胺太林。抑制胃酸药：哌仑西平。溃疡药：溴化甲基阿托品。 5. 东莨菪碱山莨菪碱作用特点：东莨菪碱中枢镇静及抑制腺体分泌作用强于阿托品。还有防晕止吐作用，可治疗帕金森氏病。山莨菪碱可改善微循环。主要用于各种感染中毒性休克，也用于治疗内脏平滑肌绞痛，急性胰腺炎。 6. 筒箭毒碱：肌松作用，全麻辅助药。呼吸肌麻痹用新斯的明解救。来源：考试大 7. 琥珀胆碱：速效短效肌松药，插管时作为全麻辅助药。禁用于胆碱酯酶缺乏症病人，与氟烷合用体温巨升的遗传病人，青光眼，高血钾患者（持续去极化，释

放K过多)如偏瘫、烧伤病人,以免引起心脏意外。使用抗胆碱脂酶药患者禁用。来源:考试大 8. 去甲肾上腺素: α 受体激动药。用于休克,上消化道出血。不良反应有局部组织坏死,急性肾功能衰竭,停药后的血压下降。禁用于高血压、动脉粥样硬化,器质性心脏病,无尿病人与孕妇。主要机理为收缩外周血管。 9. 去氧肾上腺素(苯肾上腺素): α_1 受体激动药,防治脊髓麻醉或全身麻醉的低血压。速效短效扩瞳药。 10. 可乐定: α_2 受体激动药。用于降血压。中枢性降压药。降压快而强,使用于中度高血压。尚可用于偏头痛以及开角型青光眼的治疗,也用于吗啡类镇痛药成瘾者的戒毒。(见后) 11. 肾上腺素: α 、 β 受体激动药。用于心脏停搏,过敏性休克,支气管哮喘,减少局麻药的吸收,局部止血。不良反应:剂量过大可发生心律失常,脑溢血,心室颤动。禁用于器质性心脏病,高血压,冠状动脉粥样硬化,甲状腺机能亢进及糖尿病。主要机理为兴奋心脏,兴奋血管,舒张支气管平滑肌。 12. 多巴胺: α 、 β 受体激动药。作用特点:主要激动多巴胺受体,也能激动 α 和 β_1 受体,用于抗休克。可与利尿药合用治疗急性肾功能衰竭。(对肾脏的特色是直接激动肾脏的多巴胺受体,增加肾脏血流量,排钠利尿,注意补充血容量,纠正酸中毒)。可用于抗慢性心功能不全。来源:考试大 13. 间羟胺作用特点:激动 α 受体,作用弱而持久,用于各种休克早期。 14. 麻黄碱: α 、 β 受体激动药,较肾上腺素弱而持久。特点是有中枢作用。可产生快速耐药性,停药一定时间后可恢复。用于防止低血压,治疗鼻塞,过敏,缓解支气管哮喘。大量长期应用可引起失眠、不安、头痛、心悸。 15. 异丙肾上腺素: β 受体激动药。能兴奋心脏

，松弛支气管平滑肌及扩张骨骼肌血管。用于支气管哮喘（可产生耐受性），房室传导阻滞，心脏骤停，休克。禁用于冠心病，心肌炎，甲状腺机能亢进病人。（对支气管哮喘病人用量过大可因心肌缺氧而导致心律失常）。16. 多巴酚丁胺：作用于 β_1 受体，有耐受性，适用于短期治疗急性心肌梗死伴有的心力衰竭，中毒性休克伴有心肌收缩力减弱或心力衰竭。禁用于心房颤动患者。17. 沙丁胺醇：作用于 β_2 受体。舒张支气管平滑肌，用于支气管哮喘。18. 酚托拉明：阻断 α 受体，舒张血管，降血压。用于治疗外周血管痉挛性疾病和血栓闭塞性脉管炎，抗休克（需补充血容量），缓解因嗜铬细胞瘤分泌大量肾上腺素而引起的高血压及危象，用于充血性心力衰竭。不良反应：腹痛，腹泻，恶心，呕吐，胃酸过多等拟M样作用。注射量较大时，可引起心动过速及心绞痛、体位性低血压。故消化道溃疡及冠心病患者慎用，严重动脉硬化及肾功能不全者禁用。19. 哌唑嗪：阻断 α_1 受体，降血压而不增加心率。来源：考试大20. 普萘洛尔： β 阻滞作用。心功能全降。用于心绞痛，心率失常，高血压，甲状腺机能亢进。糖尿病慎用，支气管哮喘及房室传导阻滞禁用。停用反跳作用。对心律失常：增加窦房节自律性，延长房室结ERP,减慢房室传导。主要用于室上性心律失常如房颤、房扑或阵发性室上性心动过速。对室性心律失常一般无效。对抗高血压机制为：1.阻滞心脏 β_1 受体2.阻滞肾脏 β_1 受体3.阻滞中枢 β 受体4.阻滞突触前膜 β_2 受体。降压作用缓慢，适用于轻度和中度高血压。很少发生体位性低血压。与利尿药和血管扩张药合用可增强疗效。心衰、支气管哮喘病人禁用。（见后）21. 阿替洛尔： β_1 受体阻滞作用，适用与糖尿病人

，临床用于高血压、心绞痛和心律失常。22. 局麻药包括普鲁卡因，丁卡因，利多卡因，布比卡因。23. 地西泮（安定）：苯二氮卓类（包括西泮类和唑仑类）镇静催眠药。具有抗焦虑作用，镇静催眠作用，加大剂量也不产生麻醉，但长期应用引起依赖性。抗惊厥、癫痫作用，是治疗癫痫持续状态的首选药。中枢性肌肉松弛作用。增加其它中枢抑制药的作用。药动：口服吸收快而完全，肝肠循环。由于脂溶性大，作用快而短暂。主要经肝药酶转化。机制：中枢抑制神经元 γ 氨基丁酸（GABA）能神经末梢的突触后膜上有高亲和力的特异结合位点苯二氮卓类受体。不良反应：依赖性，戒断症状。嗜睡、头晕、乏力等，大剂量时偶有共济失调。24. 巴比妥类镇静催眠药：对中枢神经系统有普遍性抑制作用，可起到镇静、催眠、抗惊厥和麻醉作用。大剂量可抑制心血管中枢，中毒量可致呼吸中枢麻痹而死亡。机制：催眠剂量主要抑制多突触反应，减弱易化，增强抑制。可增强GABA介导的Cl⁻离子内流，减弱谷氨酸介导的除极，延长Cl⁻通道开放时间，增加Cl⁻离子内流，引起神经细胞的超极化。在较高剂量时，还能抑制Ca²⁺离子依赖性动作电位，抑制Ca²⁺离子依赖性递质的释放，产生与GABA相似的作用。苯巴比妥：中枢抑制作用。长效抗惊厥药，抗癫痫药。口服易吸收，进入脑的速度与药物脂溶性成正比。较高剂量能抑制Na⁺离子内流和K⁺离子外流，能抑制异常神经元的放电和冲动扩散。不良反应有困倦，过敏反应，依赖性，轻度抑制呼吸中枢。具有肝药酶诱导作用。25. 硫酸镁：注射用为抗惊厥药。口服有泻下和利胆作用。外敷有消炎消肿作用。机制为拮抗Ca²⁺离子的作用，从而抑制神经化学传递和骨骼肌收缩，使肌肉松弛。作用于

中枢神经系统可引起感觉和意识消失。血镁过高可抑制呼吸、引起血压骤降甚至死亡。除立即进行人工呼吸外，静脉缓慢注射氯化钙，可即刻消除镁离子的作用。

26. 其它镇静催眠药及抗惊厥药：奥沙西洋、硝西洋、氟西洋、劳拉西洋、氟硝西洋、三唑仑、夸西洋、氟硝西洋、艾司唑仑，去甲西洋、阿普唑仑、依替唑仑、美沙唑仑、恶唑仑。水合氯醛、格鲁米特、溴化钾、溴化钠、三溴片。

27. 苯妥英钠：乙内酰脲类抗癫痫药。对大脑皮层运动区有高度选择性抑制作用。可抑制异常高频放电的发生和异常放电的扩散。对各种可兴奋膜（神经元和心脏细胞膜）有膜稳定作用，降低兴奋性。本品为钠通道阻滞药，可减少钠离子内流，对高频异常放电有效，对低频放电无明显影响。还可抑制钙离子内流和钾离子外流，延长动作电位时程。还可以通过抑制神经末梢对GABA的摄取，间接增强GABA的作用，使氯离子内流增加，神经细胞膜超极化。所有这些作用可使癫痫发作停止，但无明显的镇静作用。临床用于治疗癫痫大发作的首选药，对小发作无效。治疗三叉神经痛和舌咽神经痛等中枢疼痛中枢。抗心律失常。不良反应有局部刺激眩晕，共济失调，眼球震颤，贫血，过敏反应。偶致畸胎。苯妥英钠为肝药酶诱导剂能加速皮质激素、避孕药等的代谢而降低疗效。苯巴比妥和卡马西平等通过肝药酶诱导作用而加速苯妥英钠的代谢。从而降低其血药浓度。水杨酸类、苯二氮卓类和口服抗凝血药等可与苯妥英钠竞争血浆蛋白结合部位。使游离型血药浓度增加。（苯妥英钠仅对癫痫小发作无效）。苯妥英钠可用于抗心律失常。

28. 乙琥胺：对小发作的疗效不及氯硝西洋。治疗小发作的常用药。机制为抑制T型Ca离子通道。不良反

应有嗜睡、眩晕、呃逆、食欲不振及恶心、呕吐等。偶见嗜酸性粒细胞增多。粒细胞缺乏，严重者可发生障碍性贫血。

来源：考试大 29. 卡马西平：阻滞钠通道，抑制癫痫病灶及其周围神经元放电。对精神运动性发作最有效。对神经元尿崩症、躁狂抑郁症亦有效。还有广谱抗癫痫药丙戊酸钠。 30. 其它抗癫痫药：卡马西平、扑米酮、丙戊酸钠、氟硝西泮、硝西泮、氯巴占、氯柳双胺、氨己西酸、氟桂利嗪、奥卡西平、非氨酯、拉莫三嗪。 31. 氯丙嗪：二甲胺类抗精神病药。口服易吸收，血浆蛋白结合率达90%。经肝微粒体酶代谢，给药剂量个体化。多巴胺（DA）受体阻滞剂。对 α 受体和M受体也有阻断作用。临床应用：抗精神病作用（可产生耐受性）。镇吐作用较强。调节体温进行人工冬眠，可用于严重感染性休克、高热及甲状腺危象等的辅助治疗。加强中枢抑制药的作用。可阻断黑质纹状体通路的D₂受体，使胆碱能神经的功能占优势，而导致锥体外系反应。有 α 受体阻滞作用，使肾上腺素的升压作用反转。阻断结节漏斗通路的D₂受体，减少下丘脑释放催乳素释放因子，使催乳素释放增加，引起乳房肿大和泌乳，乳腺癌患者禁用。抑制促性腺释放激素的分泌，引起排卵延迟。可抑制垂体生长激素的分泌，试用于巨人症的治疗。不良反应：嗜睡、无力、鼻塞、体位性低血压（注射后应卧床休息）。过敏反应，急性中毒，锥体外系反应（帕金森氏综合症，静坐不能，急性肌张力障碍；可用中枢性胆碱受体阻滞药安坦等缓解）迟发性运动障碍（抗胆碱药可使症状加重）禁用于有癫痫或惊厥史者，青光眼、肝障碍者禁用，冠心病及伴心血管疾病的老年患者慎用。 32. 米帕明：三环类抗抑郁药。 33. 碳酸锂：抗躁狂抑郁药。作用机

制为抑制脑内NA和DA的释放，并促进其再摄取，降低突触间隙NA浓度。还能抑制肌醇磷酸酶活性，抑制脑组织中肌醇的生成，减少PIP₂的含量。来源：考试大 34. 其它抗精神病药：泰尔登，珠氯噻醇，氯哌噻吨，氟哌噻吨、替沃噻吨。氟哌啶醇、氟哌利多，三氟哌多，五氟利多。舒必利，氯氮平。

35. 左旋多巴：抗帕金森病药。本身无药理活性，进入中枢脱羧成多巴胺后才起治疗作用。口服后通过芳香族氨基酸的主动转运系统从小肠上端迅速吸收。临床用于抗帕金森氏综合症，对吩噻嗪类抗精神病药引起的帕金森氏病无效，因其已阻断了受体。可引起轻度直立性低血压，短暂心动过速和轻度心律失常。减少催乳素的分泌。不良反应包括胃肠道反应（溃疡出血可用多潘立酮消除），心血管反应（体位性低血压），不自主异常动作（开关现象），精神障碍。禁与单胺氧化酶抑制剂、麻黄碱、利舍平以及拟肾上腺素合用。消化道溃疡、高血压、精神病、心率失常及闭角型青光眼患者禁用。维生素B₆是多巴脱羧酶的辅基，可增强左旋多巴的外周副作用。

36. 苯海索（安坦）：胆碱受体阻滞类抗帕金森氏病药。对中枢纹状体的胆碱受体有明显的阻断作用，外周抗胆碱作用较弱，因此不良反应轻。窄角型青光眼、前列腺肥大者慎用。

37. 抗帕金森病药还有卡比多巴、苄丝肼、金刚烷胺、溴隐亭、培高利特、卡马特灵。

38. 吗啡：阿片类镇痛药（最有效的镇痛部位在导水管周围灰质）。口服后有较强的首过消除。阿片受体激动剂，有镇痛镇静、抑制呼吸、镇咳作用。可使血管扩张。可兴奋胃肠道平滑肌。临床用于镇痛，心源性哮喘（休克、昏迷和严重肺功能不全者禁用），止泻。不良反应包括眩晕、呼吸抑制、排尿困难，胆绞痛，体

位性低血压，耐受性和依赖性（可乐定可抑制蓝斑核放电，故可缓解吗啡的戒断症状），可引起呼吸肌麻痹（可用纳洛酮等来拮抗）。禁用于颅内压升高，严重肝功能损害及儿童等禁用吗啡。

39. 哌替啶（度冷丁）：阿片激动类镇痛药。口服易吸收，注射更快。可起到镇痛、镇静作用，兴奋胃肠道平滑肌，血管扩张。临床用于镇痛、麻醉前给药（与氯丙嗪、异丙嗪组成冬眠合剂）、心源性哮喘和肺水肿。治疗量哌替啶可引起眩晕、出汗、口干、恶心呕吐、心悸、体位性低血压等。反复应用可产生依赖性，大剂量可抑制呼吸。来源：考试大

40. 镇痛药还有可待因、芬太尼、安那度、美沙酮、曲马朵、强痛定、喷他佐辛、丁丙诺非、四氢帕马丁。拮抗药：纳洛酮、纳曲酮。

41. 咖啡因：兴奋大脑皮层的中枢兴奋药。机制可能与阻断腺苷受体有关。

42. 尼克刹米：兴奋延脑呼吸中枢的中枢兴奋药。

43. 中枢兴奋药还有咖啡因、哌醋甲酯、匹莫林、甲氯芬酯、比拉西坦、尼克刹米。

44. 解热镇痛药：共同的作用机制是抑制环加氧酶，减少前列腺素（PG）的生物合成。由于是通过抑制PG的合成来发挥解热作用，所以对直接注射PG引起的发热无效。只能缓解致痛物质引起的持续性钝痛。除苯胺类解热镇痛药外，其余都有一定的抗炎作用。

45. 乙酰水杨酸（阿司匹林）：非选择性环加氧酶抑制药。口服在小肠吸收，肝代谢。药理作用主要是解热镇痛抗炎抗风湿，影响血栓生成（低浓度阿司匹林可使环加氧酶活性中心的丝氨酸乙酰化而失活，减少了血小板中血栓素TXA₂的合成，从而抑制了血小板的聚集和血栓形成。但大剂量的阿司匹林也可明显抑制血管内皮细胞中的环加氧酶，减少PGI₂合成，降低或抵消小剂量阿司匹林的抗血栓形成作用

)。不良反应有胃肠道反应（机制可能是对胃粘膜的刺激和抑制对胃粘膜有保护作用的PG的合成。可饭后服药、服用抗酸药、肠溶片避免）、凝血障碍（可用维生素K预防，严重肝功能损害、低凝血酶原血症、维生素K缺乏症和血友病禁用本品。）、过敏反应（哮喘、鼻息肉及慢性荨麻疹患者禁用）、水杨酸反应（静脉滴注碳酸氢钠碱化尿液，加速水杨酸盐排泄）、瑞夷综合症（10岁以下儿童，患流感或水痘者禁用）。药物相互作用：可提高香豆素的抗凝血作用，易致出血。增强甲苯磺丁脲的降血糖作用，易致低血糖。增强肾上腺素的抗炎作用，增加诱发溃疡的作用。影响甲胺蝶呤从肾小管的分泌而增强其毒性。呋塞米可竞争肾小管分泌系统减少水杨酸排泄，使后者易致蓄积中毒。100Test 下载频道开通，各类考试题目直接下载。详细请访问 www.100test.com