

药理学第二十六章组胺和组胺受体阻滞药(考前辅导) 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\\_17866.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/17/2021_2022__E8_8D_AF_E7_90_86_E5_AD_A6_E7_c23_17866.htm)

熟悉H1受体阻滞药的药理作用特点。熟悉临床常用的H2受体阻滞药的药理作用特点。组胺(histamine)是广泛存在于人体组织的自身活性物质。组织中的组胺主要含于肥大细胞及嗜碱细胞中。因此，含有较多肥大细胞的皮肤、支气管粘膜和肠粘膜中组胺浓度较高，脑脊液中也有较高浓度。肥大细胞颗粒中的组胺常与蛋白质结合，物理或化学等刺激能使肥大细胞脱颗粒，导致组胺释放。组胺与靶细胞上特异受体结合，产生生物效应；如小动脉、小静脉和毛细血管舒张，引起血压下降甚至休克；增加心率和心肌收缩力，抑制房室传导；兴奋平滑肌，引起支气管痉挛，胃肠绞痛；刺激胃壁细胞，引起胃酸分泌。组胺受体有H1、H2、H3亚型。各亚型受体功能见表29-1。组胺的临床应用已逐渐减少，但其受体阻断药在临床上却有重大价值。

受体类型	所在组织	效应	阻断药
H1	支气管，胃肠，子宫等平滑肌皮肤血管心房，房室结	收缩扩张收缩增强，传导减慢	苯海拉明 异丙嗪及氯苯那敏等
H2	胃壁细胞 血管心室，窦房结	分泌增多 扩张收缩加强，心率加快	西米替丁 雷尼替丁等
H3	中枢与外周神经末梢	负反馈性调节组胺合成与释放	thioperamide

第一节 H1受体阻断药

人工合成的H1受体阻断药多具有乙基胺的共同结构，乙基胺与组胺的侧链相似，对H1受体有较大亲和力，但无内在活性，故能竞争性阻断之。

【药理作用】1. 抗外周组胺H1受体效应 H1受体被激动后即能通过G蛋白而激活磷脂酶C，产生

三磷酸肌醇 (IP<sub>3</sub>) 与二酰基甘油 (DG) , 使细胞内Ca<sup>2+</sup> 增加, 蛋白激酶C活化, 从而使胃、肠、气管、支气管平滑肌收缩。又释放血管内皮松弛因子 (EDRF) 和PGI<sub>2</sub> , 使小血管扩张, 通透性增加。H<sub>1</sub>受体阻断药可拮抗这些作用。如先给H<sub>1</sub>受体阻断药, 可使豚鼠接受百倍致死量的组胺而不死亡。对组胺引起的血管扩张和血压下降, H<sub>1</sub>受体阻断药仅有部分拮抗作用, 因H<sub>2</sub>受体也参与心血管功能的调节。

2. 中枢作用 治疗量H<sub>1</sub>受体阻断药有镇静与嗜睡作用。作用强度因个体敏感性和药物品种而异, 以苯海拉明、异丙嗪作用最强; 阿司咪唑、特非那丁因不易通过血脑屏障, 几无中枢抑制作用。苯茛胺略有中枢兴奋作用。它们引起中枢抑制可能与阻断中枢H<sub>1</sub>受体有关。个别患者也出现烦躁失眠。它们还有抗晕、镇吐作用, 可能与其中枢抗胆碱作用有关。

3. 其他作用 多数H<sub>1</sub>受体阻断药有抗乙酰胆碱、局部麻醉和奎尼丁样作用。

表 常用H<sub>1</sub>-受体阻断药作用特点的比较

药物	镇静程度	止吐作用	抗胆碱作用	作用时间 (小时)
苯海拉明	4~6			4~6
异丙嗪	4~6			4~6
吡苾明	4~6			4~6
氯苯那敏	4~6			4~6
布可立嗪	16~18			16~18
美克洛嗪	12~24			12~24
阿司咪唑	---	10 (天)		---
特非那定	---	12~24		---
苯茛胺	略兴奋	6~8		100Test

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](http://www.100test.com)