

《药理学》辅导：a肾上腺素受体阻断药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/18/2021\\_2022\\_E3\\_80\\_8A\\_E8\\_8D\\_AF\\_E7\\_90\\_86\\_E5\\_c23\\_18356.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022_E3_80_8A_E8_8D_AF_E7_90_86_E5_c23_18356.htm) 按对受体的选择性分为：  
：按作用时间：分长效和短效类  
一、 短效类 酚妥拉明和妥拉唑啉 ( phentolamine, tolazoline ) 两药对 1、 2 均有竞争性拮抗作用(见图9 - 1)  
1 血管：抑制 1受体和直接扩血管作用。对静脉和小静脉作用大于小动脉，肺动脉和外周血管阻力降低。  
2 心脏：兴奋心脏，收缩力增加、心率增加、心输出量增加 ( 见图9-3 ) 血压下降 反射性激动心脏 阻断神经末梢突触前膜 2受体 NA释放增加 ( ) 心脏 1受体 ( 见图9-2 ) 抑制K 通道  
3 其他： 拟胆碱作用 ( ) 胃肠平滑肌 组胺样作用 胃酸分泌增加、皮肤潮红 唾液腺和汗腺分泌增加 [体内过程] 生物利用度低，口服效果仅为注射给药的20%，口服后半小时达血浓度高峰。维持3-6小时。  
。肌注维持30~40分钟，大多以无活性的代谢产物形式从尿中排泄。妥拉唑啉 ( tolazoline ) 口服吸收缓慢，排泄快，以注射给药为主。  
[临床应用]  
1 外周血管痉挛性疾病:如，肢端动脉痉挛性病变  
2 去甲肾上腺外漏  
3 肾上腺嗜铬细胞瘤：诊断、高血压危象、术前准备  
4 抗休克：扩张血管作用，改善内脏血液灌注，改善微循环，增加心输出量 适用于感染中毒性休克、心源性、神经性休克。应注意补充血容量，也主张和NA合用。  
5 急性心肌梗死、充血性心衰 降低后负荷、降低左室舒张末期压，降低肺动脉压，心输出量增加 [不良反应] 低血压、腹痛、腹泻、呕吐、诱发溃疡 ( 拟胆碱作用 ) 。Iv 时，可使心率增加，诱发心律失常、心绞痛。  
注意事项：1

缓慢注射或滴注 2 胃炎、胃、十二指肠溃疡、冠心病慎用。

二、长效类 酚苄明 ( phenoxybenzamine ) 又名苯苄

胺(dibenzyline) 特点 : ? 与 受体呈共价键结合 , 属非竞争拮抗 ( 见图 9-1 ) ? 起效慢 , 因为氯乙胺基转变为乙撑亚胺基才能与 受体结合。 ? 维持久 : 一次用药 , 维持 3-4 天 , 排泄慢 , 脂溶性高 , 可积蓄脂肪组织 , 然后缓慢释放 作用 : 1.

扩张血管 , 降低血压 , 主要使舒张压降低 心率增加 : 血压下降 反射性心率增加 ; 阻断 2 受体 , 降低了突触前面的负反馈作用 增加 NA 释放。 抑制摄取 1 和摄取 2 , 使突触间隙 NA 增加。 2. 抗组胺和抗 5-HT 作用。 [ 体内过程 ] 口服吸收 20%-30% , 局部刺激性 , 只做静脉注射 , 脂溶性高 , 可积蓄脂肪组织 , 然后缓慢释放 , 一周后尚有少量药物存溜体内。 [ 临床应用 ] 1 外周血管痉挛性疾病 2 抗休克 : 出血性 、 创伤性、感染性休克特别见于补充血容量后 , BP 不回升的病人 3 嗜铬细胞瘤 : 不宜手术或恶性嗜铬细胞瘤患者可持续应用 , 嗜铬细胞瘤术前准备 4 前列腺增生引起的阻塞性排尿困难 , 改善症状 , 阻断前列腺和膀胱底部的 受体 , 作用缓慢。 [ 不良反应 ] 体位性低血压、反射性心动过速、心律失常 、 鼻塞。口服可出现恶心、呕吐、疲乏。 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)