

《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 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 α_1 、 α_2 均有竞争性拮抗作用(见图9 - 1) 1 血管：抑制 α_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 α_2 受体 NA释放增加 () 心脏 α_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 2 去甲肾上腺素外漏 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(dibenzylamine) 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 α_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