

《药理学》辅导：组胺与抗组胺药 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\\_18488.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/18/2021_2022__E3_80_8A_E8_8D_AF_E7_90_86_E5_c23_18488.htm)

一、组胺和组胺受体  
激动药：1. 组胺又称组织胺，是一种具有强大而广泛生理作用的物质。这广泛存在于动物，植物中，人体细胞内也可自行合成，贮存和释放。2. 组胺受体：是指与组胺亲合后又产生一系列组胺效应的受体。分为三种类型，即组胺1受体（H1）和组胺2受体（H2）两型及新发现的H3受体。H1多分布于毛细血管，支气管，肠道平滑肌上，当H1活化时，可引起过敏性荨麻疹，血管性水肿伴随的瘙痒，喉痉挛和支气管痉挛效应，这些效应可被传统的抗组胺药所阻断和拮抗。H2多分布于心脏，血管，胃壁细胞上，当H2活化时，可引起胃酸分泌等效应，这一效应能被西咪替丁所拮抗。H3受体主要分布于神经突触前膜，参与组胺合成与释放的负反馈调节。3. 组胺的药理作用有：促进腺体分泌；兴奋平滑肌；扩张血管。4. 倍他司汀（betahistine）：是一种常见的组胺受体激动药。能导致血管扩张，但不增加毛细血管的通透性。可促进脑干和迷路的血液循环，纠正内耳血管痉挛，减轻膜迷路积水。尚有抗血小板聚集和抗血栓形成的作用。临床应用：1. 内耳眩晕病 2. 慢性缺血性脑血管病 3. 头痛  
不良反应：较小，偶有恶心、头晕、胃部不适等。有溃疡病者慎用；对原有哮喘、嗜铬细胞瘤等要避免使用。

二、组胺受体拮抗药（一）组胺H1受体拮抗剂 变态反应又称过敏反应，分为4型，临床最常见的是I型，又谓速发型过敏反应。组胺是I型过敏反应的重要介质之一。过去60年，抗组胺（主要

是组胺H1受体拮抗剂)已广泛用于临床抗变态反应性疾病,尤其是在非处方药方面,常与其他药物,如解热镇痛剂、去鼻塞剂等制成复方制剂用于感冒发热等。1937年开发第一个抗组胺药至今已有50余种H1受体拮抗剂 1. 药理作用:抗组胺药以其对细胞上组胺受体位点的可逆性竞争作用而阻止组胺作用于靶细胞的,以达到防止系列生理反应的发生。本章只介绍抗组胺H1受体药。它是通过阻滞和拮抗H1受体而发挥抗过敏作用。(1)抗组胺作用:H1受体拮抗剂与组胺竞争效应细胞上的H1受体,增加毛细血管的致密度,减少渗出,用于治疗荨麻疹,神经过敏性水肿及湿疹等;能扩张支气管平滑肌,用于治疗支气管哮喘,但此病的发生不单是组胺的作用,所以疗效常不理想。当血管上的H1受体被阻滞,可使血管收缩,按理可以引起血压升高,但因为有神经体液的调节,一般对血压不产生明显的影响。当上呼吸道发生过敏性病变时,它可防止鼻溢,喷嚏等轻微症状,这也是抗组胺药成为抗感冒药配方中常用组分的原因。但如不定时服药,或感冒症状较重,或感冒历时已久,则疗效较差。(2)中枢神经作用:H1受体拮抗剂可通过阻滞中枢神经的H1受体引起镇静及嗜静;若与乙醇或巴比类药物合用,可产生协同作用;偶尔还可引起病人烦躁不安。很多抗组胺药都有不同程度的中枢抑制作用,抑制强度因个体敏感性,药物的品种和剂量而异,因此可作为镇静助眠药使用。盐酸异丙嗪和苯海拉明在这方面的作用较强,常用其小剂量作为镇静剂。氯苯那敏几乎无这方面的作用,所以在荨麻疹及皮肤黏膜过敏的治疗中,常用氯苯那敏。(3)其它作用:大多数H1受体阻断药,具有抗乙酰胆碱、局部麻醉和奎尼丁样作用。2、第一

代与第二代抗组胺H1受体药的特点：80年代以前的为第一代包括苯海拉明、氯苯那敏（扑尔敏）、曲吡那敏（去敏灵）、异丙嗪（非那根）、美喹他嗪（玻丽玛朗）等80年代以后的为第二代包括特非那定（敏迪、敏必治、得敏功）、阿司咪唑（息斯敏）、氮斯汀（azelastine）、西替利嗪（仙特敏、赛特赞、斯特林、疾立静）、依巴斯汀、左卡巴斯汀、依美斯汀（emedastine）、酮替芬、咪唑斯汀（mizolastine）、奥沙米特(oxatomide)以及非索非那定。第一代H1受体阻断剂又称为镇静性抗组胺药。特点是中枢神经活性强，受体特异性差，故引致明显的镇静和抗胆碱作用，表现为安静、思睡，精神活动或工作能力难以集中。第二代H1受体阻断剂又称为非镇静抗组胺药。特点是H1受体选择性高，无镇静作用，抗胆碱作用与抗组胺作用相分离的特点。表现为中枢神经系统不良反应较少。

3. 临床应用：用于治疗变态反应性疾病和防治晕动病。

4. 不良反应 治疗量与中毒量之间的安全幅度较大，治疗剂量引起的不良反应一般较轻微停药数日后即可消失。最常见的是药物的镇静作用，白天思睡，多数病人都能在数日内耐受。同时饮酒或服用其他中枢神经系统抑制剂（如镇静催眠药，抗抑郁药），可使嗜睡情况加重。次常见的副作用是胃肠道症状，有食欲不振，恶心呕吐，腹部不适，便秘，腹泻等。这类副作用随药物使用时间延长而减轻或消失。

（二）组胺H2受体拮抗剂 竞争性拮抗H2受体，能抑制组胺、五肽胃泌素、M受体激动剂所引起的胃酸分泌。

药理作用 1、抑制胃酸分泌 2、心血管系统 3、免疫调节作用

临床应用 十二指肠溃疡、胃溃疡。临床常用药物 西米替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁。

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)