

2007年执业药师考试考点汇总与解析-药理学-胆碱受体阻断药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/263/2021\\_2022\\_\\_EF\\_BC\\_92\\_EF\\_BC\\_90\\_EF\\_BC\\_90\\_EF\\_c23\\_263763.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/263/2021_2022__EF_BC_92_EF_BC_90_EF_BC_90_EF_c23_263763.htm) 胆碱受体阻断药

**考点1：抗胆碱药分类** 胆碱受体阻断药能与乙酰胆碱或其拟似药竞争与胆碱受体结合，但无内在活性，阻碍拟胆碱药对胆碱受体的激动作用，而发挥抗胆碱作用。按其作用机制，可分为下列两大类：1. M胆碱受体阻断药 能阻断节后胆碱能神经支配的效应器细胞上的M胆碱受体，发挥抗M样作用。典型药物是阿托品。由于本类药物对平滑肌松弛作用较强，又称平滑肌解痉药。2. N胆碱受体阻断药 又可分为N1受体阻断药和N2受体阻断药。N1受体阻断药又称神经节阻断药，能选择性地阻断神经节细胞上的N1胆碱受体。代表药物有六甲双铵、美加明等。曾作降血压药用，但目前已基本不用。N2受体阻断药又称骨骼肌松弛药，能选择性地阻断骨骼肌运动终板后膜上的N2胆碱受体，松弛骨骼肌，常用作麻醉辅助药物。代表药物有琥珀胆碱、筒箭毒碱等。

**考点2：阿托品【药动学】** 口服易吸收，1h血药浓度达峰值。吸收后血药浓度下降较快，药物分布于全身组织，可以通过血脑屏障和胎盘屏障进入中枢或胎儿循环。本品对眼的作用持续72h，对其他器官的作用维持约4h。肌注12h，大部分从尿排出，其中60%为原形药物，其余为水解物与葡萄糖醛酸结合的代谢物。**【药理作用】** 阿托品竞争性拮抗ACh或拟胆碱药对M胆碱受体的激动作用，对不同M受体亚型的选择性低。阿托品作用广泛，但各器官对阿托品敏感性不同。最敏感的组织为唾液腺、支气管腺体和汗腺，脏器

平滑肌、心脏对阿托品反应的敏感性为中等，胃壁细胞胃酸分泌敏感性较低。给药后，各脏器效应将随剂量增大依次增强。

1. 内脏平滑肌。阿托品对胆碱能神经支配的内脏平滑肌均有松弛作用，在平滑肌处于过度活动或痉挛状态时，松弛作用更明显。其作用强度依次为：胃肠道平滑肌，膀胱逼尿肌，输尿管、胆管、支气管及子宫平滑肌。对括约肌的作用不恒定，取决于给药时的机能状态。

2. 腺体分泌。阿托品阻断M胆碱受体，减少腺体分泌。其中对唾液腺与汗腺的作用最明显，可引起口干及皮肤干燥。其次为泪腺及呼吸道腺体，但阿托品对胃酸的分泌影响较小，因为胃酸分泌的调节除M胆碱受体外，还受其他多种因素的影响。

3. 眼。阿托品对眼的作用正好与毛果芸香碱相反，表现为：

(1) 扩瞳：阿托品阻断瞳孔括约肌上的M受体，括约肌松弛，而扩大肌受交感神经支配，对阿托品不敏感，仍保持其原有张力，结果瞳孔扩大。

(2) 眼内压升高：由于扩瞳作用，虹膜退向周围边缘，阻碍房水回流，造成眼内压升高。因此阿托品禁用于青光眼患者。

(3) 调节麻痹：阿托品阻断睫状肌M受体，睫状肌松弛而使悬韧带拉紧，晶状体变扁平，屈光度减低，因此不能将近物清晰地成像于视网膜上，造成看近物模糊不清。这种作用称为调节麻痹。

4. 心血管系统

(1) 心脏：使用低剂量（0.5mg）阿托品，在外周M受体还未出现明显阻断作用之前，部分病人的心率即轻度、短暂地减慢。这种作用可能与阿托品减弱ACh反馈性抑制神经末梢递质释放有关。中高剂量（1~2mg）阿托品阻断窦房结M受体，拮抗迷走神经对心脏的抑制作用，使心率加速。心率加速的程度取决于迷走神经控制心脏的张力，青壮年迷走张力较高，作用明

显。此外，阿托品能对抗迷走神经过度兴奋所致的房室传导阻滞和由于窦房结功能低下而出现的室性异位节律。（2）血管与血压：大多数血管缺乏胆碱能神经支配，因而阿托品对血管与血压无明显影响。但大剂量使用时，可扩张皮肤血管，特别是脸部血管扩张而出现颜面潮红，此作用机制不明，但与M受体阻断无关。大剂量阿托品对感染性休克病人能解除微血管痉挛，增加组织的有效灌注，改善微循环，缓解休克症状。

5. 中枢神经系统。治疗量对中枢神经系统作用不明显，但随剂量增大，可依次出现延脑呼吸中枢兴奋和大脑兴奋，出现烦躁不安、多言、谵妄等反应；中毒剂量则产生幻觉、定向障碍、运动兴奋，以至惊厥，严重中毒由兴奋转入抑制，出现昏迷。

【临床应用】

1. 解除平滑肌痉挛。用于各种内脏绞痛，能使胃肠道绞痛迅速缓解。对幽门梗阻疗效较差。对胆绞痛及肾绞痛疗效也较差，常与镇痛药合用。胆绞痛需配用哌替啶。由于阿托品能松弛膀胱逼尿肌及增加括约肌张力，可治疗遗尿症。对尿频、尿急等刺激症状，阿托品也有效。
2. 抑制腺体分泌。用于减少全身麻醉时呼吸道腺体的分泌，还可用于制止盗汗和治疗流涎症。
3. 解救有机磷中毒。对于有机磷中毒，大剂量阿托品注射是重要的解毒措施，剂量视病情轻重而定。对于严重中毒昏迷者，要足量和反复持续用，使之出现“阿托品化”，表现为瞳孔扩大、颜面潮红、腺体分泌减少、口干、轻度躁动不安等体征。此后，适当减量维持。在中度和重度中毒病例，应同时使用胆碱酯酶复活剂，从根本上解除有机磷中毒，才能提高抢救效果。应当指出，中毒病人在胆碱酯酶活力极度低下时，对阿托品常有超常耐受力。注射胆碱酯酶复活剂后，随着

胆碱酯酶的活力逐渐恢复，机体对阿托品的耐受力也随之降低，此时必须随时减少阿托品的用量，否则就易发生阿托品中毒。

4. 眼科 (1) 虹膜睫状体炎。阿托品溶液滴眼，松弛瞳孔括约肌和睫状肌，解除睫状肌痉挛，减少炎症组织活动，使之充分休息，有利于炎症消退。又因散瞳，虹膜退向边缘，可防止虹膜与晶状体粘连。(2) 眼底检查。阿托品溶液滴眼扩瞳，用于眼科检查，但扩瞳作用维持很长，视力恢复较慢。(3) 验光。阿托品使睫状肌松弛，晶状体固定，有利于较好测定晶状体的屈光度。但由于作用时间长，现已少用。但儿童的睫状肌调节功能较强，须用阿托品充分发挥调节麻痹作用。

5. 抗休克。阿托品解除血管痉挛，改善微循环障碍，提高心脏功能，对休克早期疗效较好。主要用于感染中毒性休克，如暴发性流行性脑脊髓膜炎、中毒性肺炎和中毒性痢疾等引起的休克，也用于出血性休克。对休克伴有心动过速或高热者，不宜应用。

6. 缓慢型心律失常。用于治疗迷走神经功能过高引起的窦房阻滞、房室阻滞等缓慢型心律失常，也用于继发于窦房结功能低下而出现的室性异位节律。

【不良反应】 常见有口干、心率加快、视力模糊、皮肤干燥、小便困难、心悸等，一般在停药后逐渐消失，不需特殊处理。极少数过敏者可发生皮疹。

【应用注意事项】 治疗休克时要补充血容量；体温在39℃以上时，用阿托品前要先降温；青光眼、眼压升高者及前列腺肥大患者禁用，前列腺肥大患者可能因使尿道括约肌收缩而加重排尿困难。

【阿托品中毒的解救】 用镇静药或抗惊厥药对抗其中枢兴奋症状，同时用拟胆碱药毛果芸香碱或毒扁豆碱对抗其周围作用，用毒扁豆碱还能透过血脑屏障对抗其中枢症状。呼吸抑制

可采用人工呼吸和吸氧。体温过高可用物理降温处理。

**考点3：东莨菪碱【作用与用途】** 本品为外周抗胆碱药，除具有平滑肌解痉作用外，尚有阻滞神经节及神经肌肉接头的作用，但对中枢的作用较弱。能选择性地缓解胃肠道、胆管及泌尿道平滑肌痉挛和抑制蠕动，而对心脏、瞳孔及唾液腺的影响很小，对呼吸中枢有兴奋作用。抗眩晕及抗震颤麻痹作用均较阿托品强，并有显著的镇静作用。临床用于麻醉前给药，治疗震颤麻痹症、晕动病以及极重型流脑呼吸衰竭、感染中毒性休克等。**【剂量与用法】** 口服，10~20mg/次，3~5次/日。1岁以上儿童，5~10mg/次，3次/日。婴儿，5mg/次，3次/日。肌注、静注或静脉滴注，20mg/次，间隔20~30分钟可再用20mg。**【不良反应】** 可出现口干，心律加快、视力调节障碍、嗜睡、心悸、面部潮红、恶心、呕吐、眩晕及头痛等；如过量可引起谵妄、激动不安甚至惊厥、呼吸衰竭乃至死亡，可用拟胆碱药对症处理。**【禁忌证】** 青光眼、前列腺肥大所致排尿困难、严重心脏病、器质性幽门狭窄或麻痹性肠梗阻病人禁用。乳幼儿、小儿慎用。

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)