

2007年执业药师考试考点汇总与解析-药理学-组胺和组胺受体阻断药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文
https://www.100test.com/kao_ti2020/292/2021_2022__EF_BC_92_EF_BC_90_EF_BC_90_EF_c67_292905.htm 组胺和组胺受体阻断药

考点1：组胺组胺是机体自身存在的一种活性物质，主要存在于肥大细胞和嗜碱性粒细胞中，尤其是肺、皮肤黏膜、支气管黏膜、胃黏膜和胃壁细胞含量较高。当组织受刺激后，可引起肥大细胞释放组胺，释放的组胺与组胺受体结合，产生病理生理学反应。组胺基本不作药用。【药理作用】1．心血管。加强心肌收缩力，提高心率。兴奋H1受体和H2受体引起小动脉和小静脉扩张，外周阻力降低。H1受体兴奋还引起毛细血管的通透性增加，水分渗出，引起水肿甚至休克。2．平滑肌。兴奋H1受体，使支气管平滑肌收缩，气道阻力增加，引起呼吸困难，哮喘患者尤其敏感。此外，还兴奋胃肠平滑肌及子宫平滑肌，导致痉挛性腹痛等。3．腺体。激动胃壁细胞H2受体，增加胃酸分泌，还使胃蛋白酶分泌增加，对唾液腺和支气管腺的分泌作用较弱。4．三联反应。小剂量组胺皮下注射扩张毛细血管出现红斑，随后因毛细血管通透性增加而在红斑位置形成丘疹，最后因轴索反应使小动脉舒张而出现红晕，即所谓三联反应。对于局部神经受损者，如麻风病患者皮内注射组胺不产生三联反应。5．神经系统。组胺刺激神经末梢引起痛和痒的感觉，激动中枢组胺受体引起中枢兴奋。

考点2：H1受体阻断药常见的H1受体阻断药见下表：【药动学】多数H1受体阻断药口服或注射吸收完全，15～30min起效，作用维持时间长短不一，可在几个小时到几天不等。大部分在肝内代谢，代谢物及

原形药均由肾脏排出。本类药具有肝药酶诱导作用。【药理作用】1. H₁受体阻断。选择性阻断H₁受体，可拮抗组胺引起的胃肠道、支气管收缩作用，对组胺引起的血管扩张、毛细血管通透性增加、局限性水肿有一定对抗作用。对H₂受体兴奋所致胃酸分泌无影响。2. 中枢作用。多数可通过血脑屏障阻断中枢的H₁受体，产生镇静催眠作用。其中以异丙嗪、苯海拉明作用最强，吡苾明次之，氯苯那敏较弱，苯茛胺偶尔引起轻度中枢兴奋。阿司咪唑难以通过血脑屏障，无中枢作用。3. 其他。抗胆碱作用，影响中枢时表现为镇静、镇吐，影响外周引起阿托品样副作用。此外还有微弱的受体阻断作用和局麻作用。【临床应用】1. 变态反应性疾病。用于防治因组胺释放所致的荨麻疹、过敏性鼻炎、枯草热，可减轻症状。对昆虫咬伤、药疹和接触性皮炎等的瘙痒、水肿效果良好。氮斯汀、酮替芬等可抑制组胺、白三烯、血小板激活因子等炎性介质释放，可用于过敏性哮喘的预防。本类药对过敏性休克无效。2. 晕动病和呕吐。用于晕动病、放射病等引起的恶心呕吐，常用药物为苯海拉明、异丙嗪、茶苯海明等。3. 镇静、催眠。异丙嗪、苯海拉明的中枢抑制作用较强，可治疗失眠。【不良反应】常见嗜睡、乏力等，驾驶员和高空作业者不宜使用。还可引起视物模糊、便秘、尿潴留及消化道反应如恶心、呕吐、腹泻。【禁忌证】孕妇忌用。

考点3：H₂受体阻断药本类药特异性阻断胃壁细胞H₂受体，抑制胃酸分泌。常用的药物有：西咪替丁、雷尼替丁、法莫替丁、尼扎替丁、罗沙替丁。【药动学】大多口服吸收良好，部分药物有首关效应。在体内代谢后大部分以原形经肾排出。【作用与用途】H₂受体阻断药通过阻断H₂

受体而抑制胃酸分泌。对五肽胃泌素、迷走神经兴奋等引起的胃酸分泌也有明显的抑制作用，见抗溃疡药部分。对心血管无影响，但可拮抗组胺的舒血管作用。西咪替丁尚有免疫增强作用。临床主要用于胃及十二指肠溃疡，改善症状，加速溃疡愈合。也用于胃酸分泌过多症。【不良反应】不良反应少，偶致便秘、腹泻、腹胀、皮疹、头痛、头晕等症。长期应用可致阳痿、男性乳房肿大，据推测西咪替丁有抗雄激素作用。还能抑制肝药酶。【禁忌证】小儿、肝肾功能不全者慎用西咪替丁和雷尼替丁，孕妇忌用。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