

2012年口腔执业医师药理学辅导： 受体激动药 PDF转换可能丢失图片或格式，建议阅读原文

[https://www.100test.com/kao\\_ti2020/656/2021\\_2022\\_2012\\_E5\\_B9\\_B4\\_E5\\_8F\\_A3\\_c22\\_656222.htm](https://www.100test.com/kao_ti2020/656/2021_2022_2012_E5_B9_B4_E5_8F_A3_c22_656222.htm) 受体激动药包括 1, 2受体激动药, 1受体激动药。

一、 1, 2受体激动药 异丙肾上腺素 异丙肾上腺素 (isoprenaline) 是人工合成品, 化学结构是去甲肾上腺素氨基上的一个氢原子被异丙基所取代。是经典的 1, 2受体激动剂。【体内过程】口服易在肠粘膜与硫酸结合而失效, 气雾剂吸入给药, 吸收较快。舌下含药因能舒张局部血管, 少量可从粘膜下的舌下静脉丛迅速吸收。吸收后主要在肝及其它组织中被COMT所代谢。异丙肾上腺素较少被MAO代谢, 也较少被去甲肾上腺素能神经所摄取, 因此其作用维持时间较肾上腺素略长。【药理作用】对

受体有很强的激动作用, 对 1和 2受体选择性很低。1. 对心脏的作用 具典型的 1受体激动作用, 表现为正性肌力和正性缩率作用, 缩短收缩期和舒张期。与肾上腺素比较, 异丙肾上腺素加快心率、加速传导的作用较强, 对窦房结有显著兴奋作用, 也能引起心律失常, 但较少产生心室颤动。2. 对血管和血压的影响对血管有舒张作用, 主要是使骨骼肌血管舒张 (激动 2受体), 对肾血管和肠系膜血管舒张作用较弱, 对冠状血管也有舒张作用。当静脉滴注每分钟2~10  $\mu\text{g}$ , 由于心脏兴奋和外周血管舒张, 使收缩压升高而舒张压略下降 (图10-2), 此时冠脉流量增加; 但如静脉注射给药, 则可引起舒张压明显下降, 降低了冠状血管的灌注压, 冠脉有效血管流量不增加。3. 缓解支气管平滑肌痉挛 激动 2受体, 舒张支气管平滑肌比肾上腺素略强, 也具有抑制组胺

等过敏性物质释放的作用。但对支气管粘膜的血管无收缩作用，故消除粘膜水肿的作用不如肾上腺素。久用可产生耐受性。4. 其他 能增加组织的耗氧量.与肾上腺素比较,其升高血中游离脂肪酸作用相似,而升高血糖作用较弱。不易透过血脑屏障，中枢兴奋作用微弱。【临床应用】1. 支气管哮喘舌下或喷雾给药，用于控制支气管哮喘急性发作，疗效快而强。2. 房室传导阻滞治疗 、 度房室传导阻滞，采用舌下含药，或静脉滴注给药。3. 心脏骤停适用于心室自身节律缓慢，高度房室传导阻滞或窦房结功能衰竭而并发的心脏骤停，常与去甲肾上腺素或间羟胺合用作心室内注射。【不良反应】常见的是心悸、头晕。用药过程中应注意控制心率。在支气管哮喘病人，已具缺氧状态，加以用气雾剂剂量不易掌握，如剂量过大，可致心肌耗氧量增加，易引起心律失常，甚至产生危险的心动过速及心室颤动。禁用于冠心病、心肌炎和甲状腺功能亢进症等。二、  $\beta_1$ 受体激动药 多巴酚丁胺 临床应用的多巴酚丁胺（dobutamine）是含有右旋多巴酚丁胺和左旋多巴酚丁胺的消旋体。前者阻断  $\beta_1$ 受体，后者激动  $\beta_1$ 受体。两者都激动  $\beta_2$ 受体，但前者激动  $\beta_2$ 受体作用为后者的10倍，消旋多巴酚丁胺的作用是两者的综合表现。由于其对  $\beta_1$ 受体激动作用强于  $\beta_2$ 受体，故此药属于  $\beta_1$ 受体激动药。与异丙肾上腺素比较，本品的正性肌力作用比正性频率作用显著。这可能由于外周阻力变化不大和心脏  $\beta_1$ 受体激动时正性肌力作用的参与。而外周阻力的稳定又可能是因为  $\beta_1$ 受体介导的血管收缩作用与  $\beta_2$ 受体介导的血管舒张作用相抵消所致。静脉滴注短期治疗心脏手术后或心肌梗塞并发心力衰竭，可增加心输出量。连续应用可产生快速耐受性。梗阻

型肥厚性心肌病者禁用。 相关推荐：#0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：苯胺类 #0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：吡唑酮类 #0000ff>2012年口腔执业医师药理学辅导：磺胺类药 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)