
第六章

胆碱受体激动药 (cholinoceptor agonist)

第六章 胆碱受体激动药

□ 胆碱受体激动药

是一类作用与胆碱能神经递质乙酰胆碱（**acetylcholine, ACh**）相似的药物。

□ 按其胆碱受体亚型的选择性分为：

- 毒蕈碱型胆碱受体（**M**胆碱受体）激动药
 - 烟碱型胆碱受体（**N**胆碱受体）激动药
-

第一节

M胆碱受体激动药

第一节 M胆碱受体激动药

□ M胆碱受体激动药包括两大类：

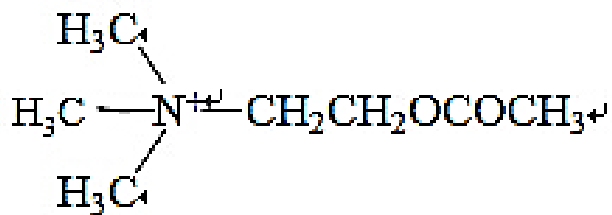
乙酰胆碱和胆碱酯类药物：

乙酰胆碱、醋甲胆碱、卡巴胆碱和贝胆碱

生物碱类：毛果芸香碱、毒蕈碱、槟榔碱

第一节 M胆碱受体激动药

□ 一、乙酰胆碱 (acetylcholine, ACh)



乙酰胆碱⁺

ACh是胆碱能神经递质，化学性质**不稳定**，在体内被乙酰胆碱酯酶和血浆中的丁酰胆碱酯酶迅速水解而失效，故**无临床应用价值**，在研究中可作为**工具药**使用。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

ACh可直接激动M受体和N受体，产生M样作用和N样作用。

1. M样作用

（1）心血管系统：

- ① 激动心脏M₂受体，产生负性肌力、负性频率和负性传导作用。
 - ② 小剂量静脉注射，可产生一过性血压下降，伴随反射性心动过速。
 - ③ 大剂量可引起心率减慢和房室传导减慢。
-

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

激动血管内皮细胞的M₃受体→导致内皮细胞一氧化氮释放→ NO扩散至邻近血管平滑肌细胞→引起平滑肌舒张→血管扩张。

激动交感神经末梢突触前膜M₁受体→抑制去甲肾上腺素能神经末梢释放去甲肾上腺素→间接参与血管扩张和心脏抑制效应。

抑制心肌收缩，对心房肌的作用强于对心室肌的作用。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

（2）胃肠道、泌尿道：

- ①可使胃肠道平滑肌张力增高、收缩幅度和蠕动频率增加。
 - ②使泌尿道平滑肌兴奋，膀胱逼尿肌收缩，促进膀胱排空。
-

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

（3）其他：

①可使副交感神经支配的腺体分泌增加，包括泪腺、汗腺、唾液腺、气管和支气管腺体、消化道腺体。

②在呼吸系统，ACh除增加气管支气管分泌外，还收缩支气管，兴奋颈动脉体和主动脉体的化学感受器。

③滴眼可引起瞳孔缩小。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

2. N样作用

- ① 大剂量**ACh**可激动神经节**N_N**受体
胃肠道、膀胱等器官平滑肌收缩
腺体分泌增加
小血管收缩，血压升高
 - ② 兴奋肾上腺髓质嗜铬细胞的**N_N**受体：肾上腺素释放。
 - ③ 激动神经肌肉接头处的**N_M**受体：引起骨骼肌收缩。
-

第一节 M胆碱受体激动药

□ 二、醋甲胆碱 (methacholine)

特点：

- 被胆碱酯酶水解的速度慢，作用时间比ACh长。
- 具有选择性M样作用，N样作用很弱。
- 小剂量可产生明显的心血管作用。

应用：临床上仅用于口腔黏膜干燥症。

禁忌证：支气管哮喘、甲状腺功能亢进、冠状动脉缺血和溃疡病患者。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 三、卡巴胆碱 (carbacholine)

特点：

- 作用与ACh相似，能直接激动M和N受体。
- 本药不被胆碱酯酶水解，故作用持久。

应用： 主要局部治疗青光眼。

禁忌证： 支气管哮喘、甲状腺功能亢进、冠状动脉缺血和溃疡病患者(同醋甲胆碱)。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 四、毛果芸香碱 (pilocarpine)

是从毛果芸香属植物中提取的生物碱，为叔胺类化合物，水溶液稳定，现已人工合成。

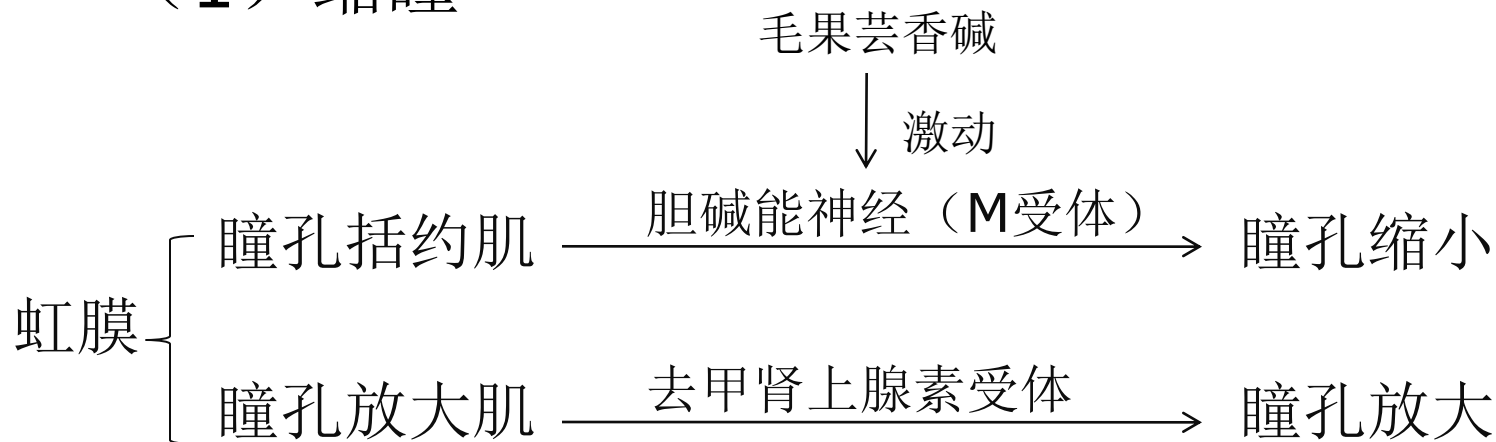
毛果芸香碱能直接激动副交感神经（包括支配汗腺的交感神经）节后纤维支配的效应器官的**M胆碱受体**，对**眼**和**腺体**的作用最明显。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

1. 眼

(1) 缩瞳



第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

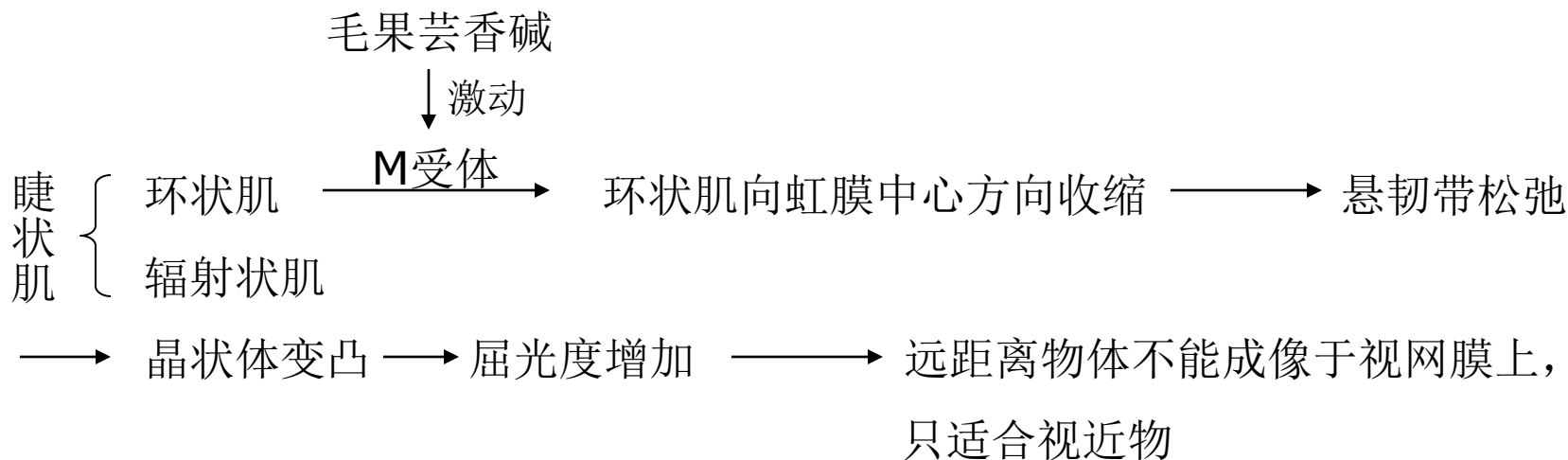
(2) 降低眼内压

毛果芸香碱 → 缩瞳 → 虹膜根 → 前房角 → 促进房水 → 眼内压
 作用 部变薄 放大 回流 降低

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

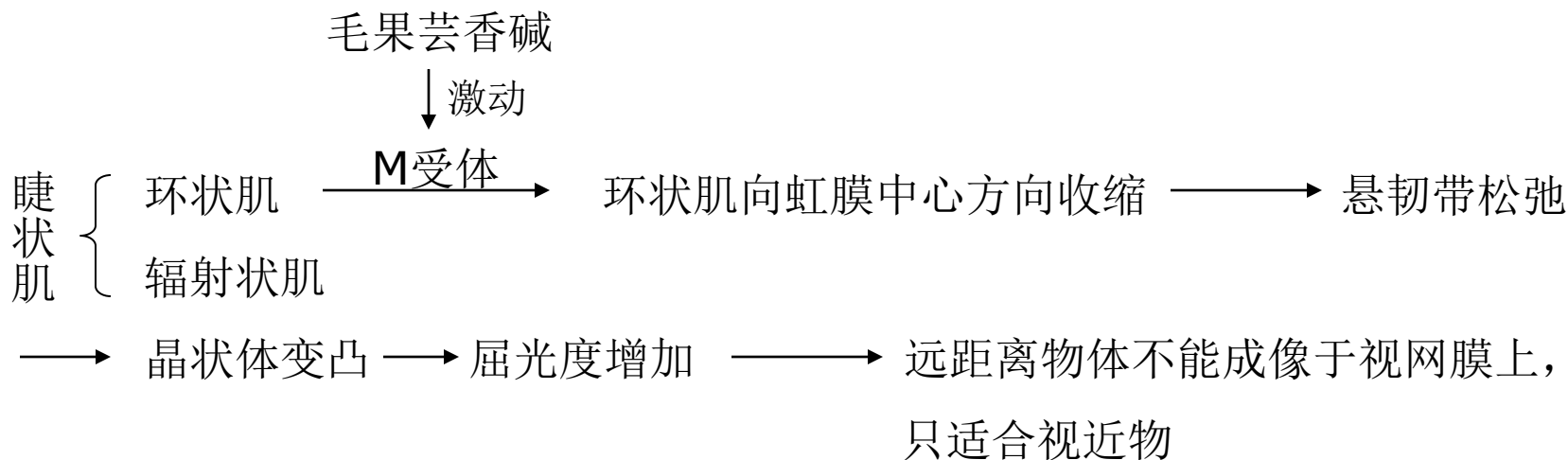
(3) 调节痉挛



第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

(3) 调节痉挛



第一节 M胆碱受体激动药

□ 【药理作用和作用机制】

2. 腺体

激动腺体的M受体，使腺体分泌增加，以汗腺和唾液腺分泌增加最为明显。

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【临床应用】

1. 青光眼

闭角型；开角型

2 虹膜炎

第一节 M胆碱受体激动药

□ 【不良反应】

全身给药或滴眼吸收入血后可引起汗腺分泌、流涎、哮喘、恶心、呕吐、视物模糊、头痛等。滴眼时应压迫内眦，避免药液经鼻泪管流入鼻腔吸收而产生副作用。

第二节

N胆碱受体激动药

第二节 N胆碱受体激动药

□ N胆碱受体激动药:

烟碱 (nicotine)、洛贝林 (lobeline) 等。

烟碱可兴奋N_M和N_N受体，作用广泛复杂，无临床应用价值，仅具毒理学意义。
