



# 第十一章 肾上腺素受体阻滞药

---

山东大学  
医学院药理系  
刘慧青



# 分类

---

- 1.  $\alpha$ -R阻滯药
- 2.  $\beta$ -R阻滯药
- 3.  $\alpha$ 、 $\beta$ -R阻滯药



# 第一节 $\alpha$ 受体阻滞药

## I. $\alpha_1, \alpha_2$ -R阻滞药

短效类：酚妥拉明、妥拉唑林

长效类：酚苄明

II.  $\alpha_1$ -R阻滞药：哌唑嗪

III.  $\alpha_2$ -R阻滞药：育亨宾



# $\alpha$ -R阻滞药的基本作用

## 1.CVS 作用

### (1) $\alpha_1$ -R 阻滞作用:

阻滞内源性儿茶酚胺: 直立性低血压 (Postural hypotension)

阻滞外源性儿茶酚胺: 肾上腺素作用的翻转(adrenaline reversal)

### (2) $\alpha_2$ -R 阻滞作用:

- 阻滞突触前膜  $\alpha_2$  R -NE 释放  $\uparrow$

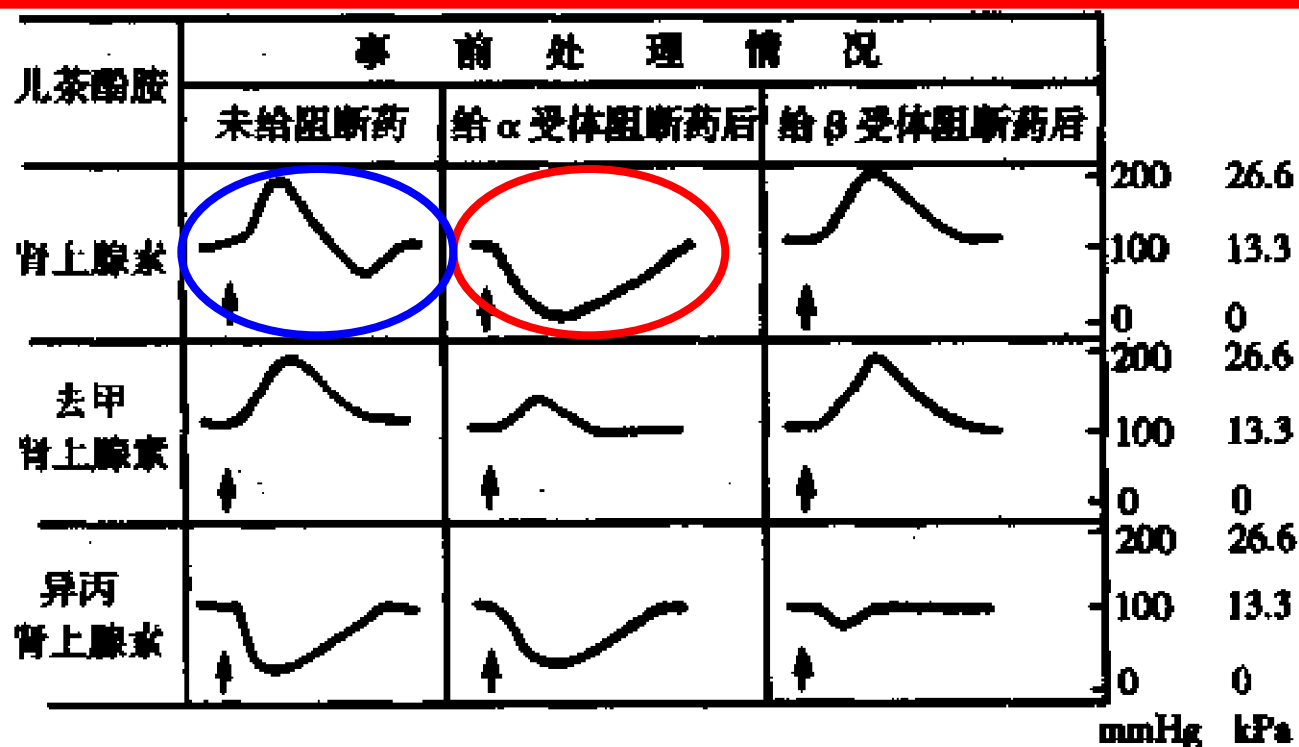


图 11-1 在给肾上腺素受体阻断药前后, 儿茶酚胺对狗血压的作用



# $\alpha$ -R阻滯药的基本作用

---

## 2. 心血管以外作用

(1) 前列腺  $\alpha_1$ -R 阻滯: 舒张

(2) 胰岛  $\alpha_2$ -R 阻滯: insulin  $\uparrow$



## $\alpha_1$ 、 $\alpha_2$ -R阻滯药：

酚妥拉明(phentolamine, 立其丁, regitine)

### 【药理作用】 阻滯 $\alpha$ -R

1. 血管和血压：血管舒张，BP↓

①直接作用

②阻滯血管 $\alpha_1$ -R — “adrenaline reversal”

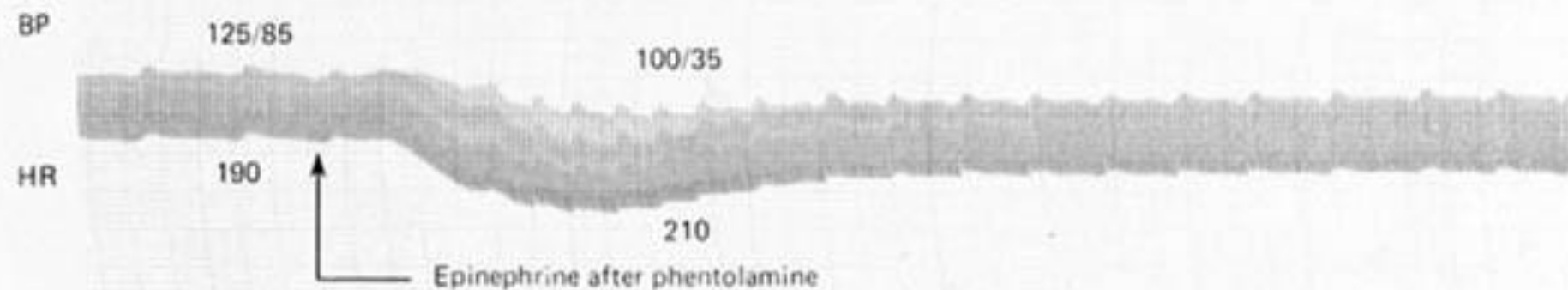
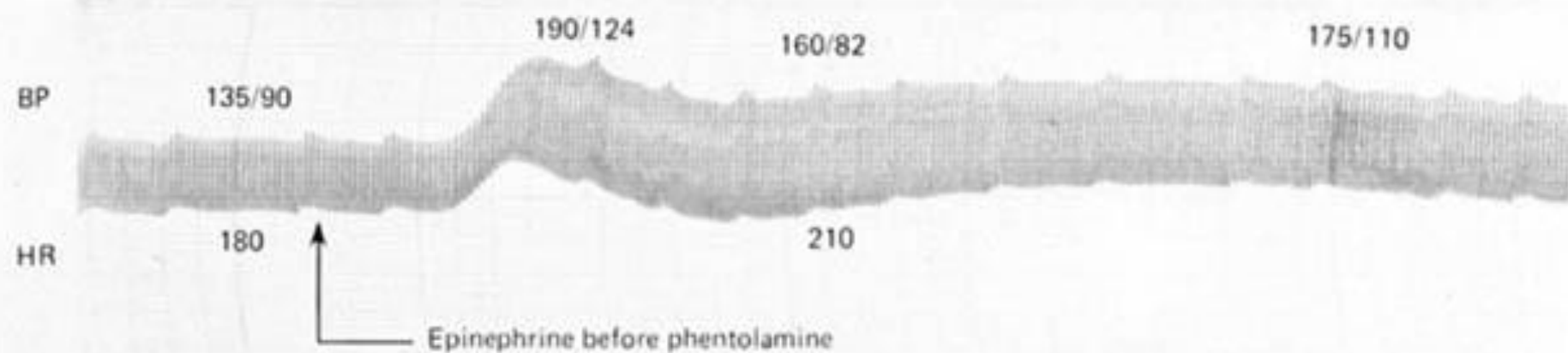
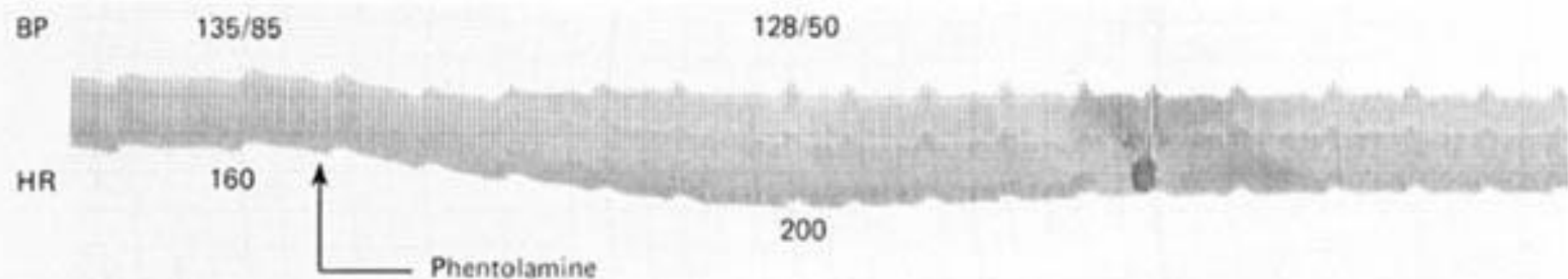
2. 心脏：兴奋，CO↑，HR↑

①BP下降，反射性兴奋心脏

②阻滯NA能神经末梢突触前膜 $\alpha_2$ -R，NA释放↑

3. 其他：拟胆碱作用

组胺样作用







# 临床应用

---

## 1. 外周血管痉挛性疾病：

eg：雷诺综合征, 伯格氏病（血管闭塞性脉管炎）

## 2. ivd NA外漏

## 3. 肾上腺嗜铬细胞瘤的诊治

## 4. 抗休克

## 5. 充血性心力衰竭（CHF），急性心肌梗死（AMI）

## 6. 男性性功能障碍

**甲磺酸酚妥拉明分散片**



# 不良反应

---

## 1.心血管系统：

低血压；心动过速、心律失常、心绞痛

## 2.消化系统：

腹痛、腹泻、呕吐、诱发溃疡等



# 妥拉唑林 (Tolazoline)

---

## 特点 (vs. 酚妥拉明)

1.  $\alpha$ -R阻滯作用弱
2. 拟胆碱及组胺样作用强
3. 主要用于血管痉挛性疾病及ivd NA外漏



# 酚苄明(phenoxybenzamine)

长效非竞争性  $\alpha$ -R阻滞药

作用特点：

1. 起效慢 (1h), 作用持久 (3~4d)
2. 5-HT 和 HA-R 阻滞作用

用途

1. 外周血管痉挛性疾病
2. 嗜铬细胞瘤
3. 休克
4. 前列腺肥大所致排尿困难



# $\alpha_1$ -R 阻滞药

- 哌唑嗪 ( Prazosin )
- 特拉唑嗪 ( Terazosin )
- 多沙唑嗪 ( Doxazosin )
- 坦洛新 ( tamsulosin )

## 用途

1. HBP
2. CHF
3. 前列腺肥大:坦洛新



# $\alpha_2$ -R阻滯药

---

## 育亨宾 (yuhimbine)

- 主要为实验研究工具药;
- 临床可用于男性性功能障碍(痿必治)



## 第二节 $\beta$ 受体阻滞药

$\beta_1, \beta_2$ -R 阻滞药

$\beta_1$ -R 阻滞药

$\alpha$ 、 $\beta$ -R 阻滞药

# [化学结构]

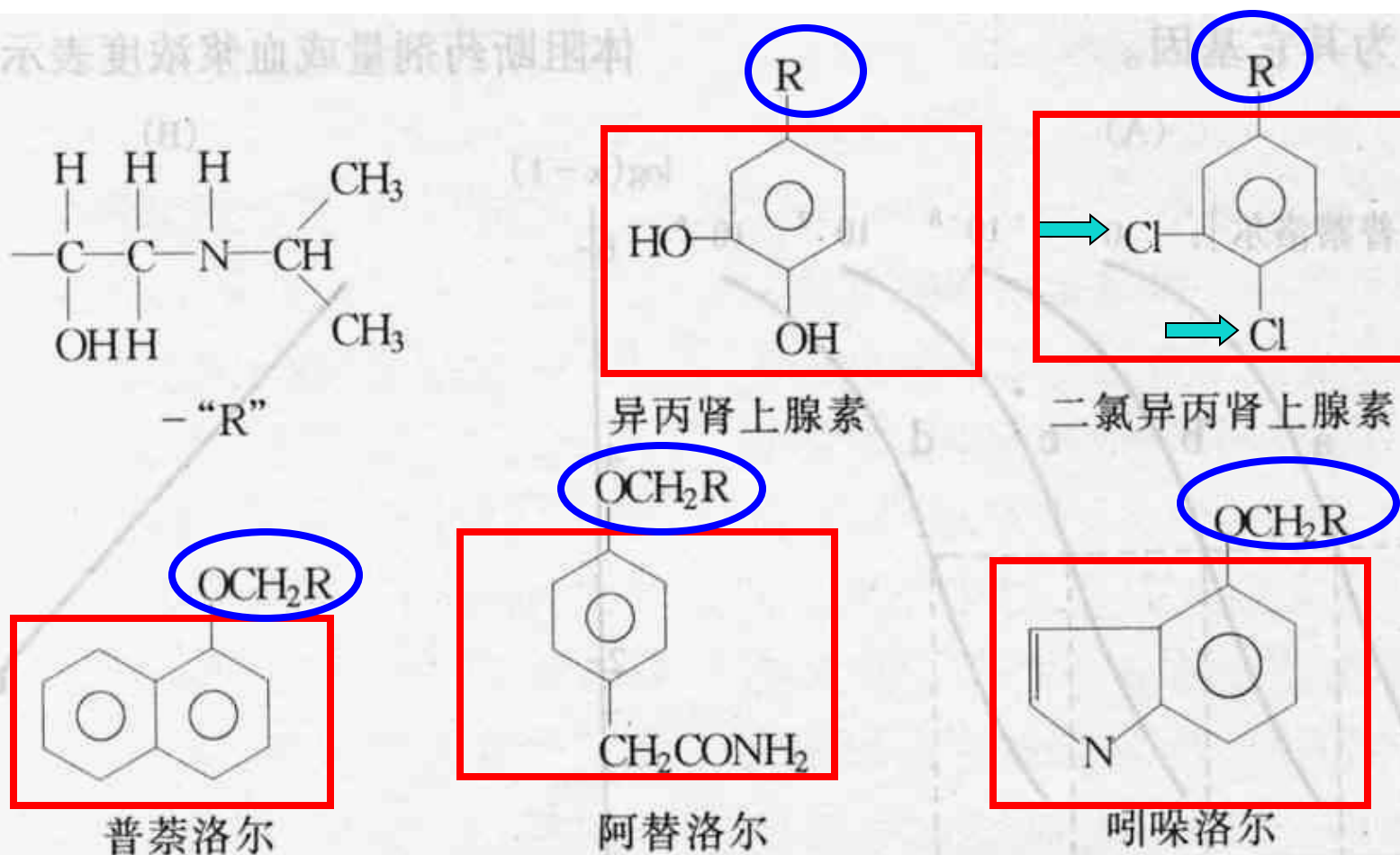


图 28-1 典型的  $\beta$ -受体激动药和  $\beta$ -受体阻断药的化学结构





# 体内过程: 受脂溶性影响

---

1. 吸收: 首过消除
2. 分布: BBB
3. 消除:  $t_{1/2}$
4. 个体差异



# $\beta$ -R阻滯藥的基本藥理作用

## 1. $\beta$ -R阻滯作用

### (1) 心血管系統：

心臟抑制 ( $\beta_1$ )，血管收縮 ( $\beta_2$ )，BP

### (2) 支氣管平滑肌：收縮( $\beta_2$ )

### (3) 代謝：抑制肝糖原和脂肪分解 ( $\beta_{2,3}$ )

注：DM+HBP

### (4) 腎素：釋放↓ ( $\beta_1$ -R)

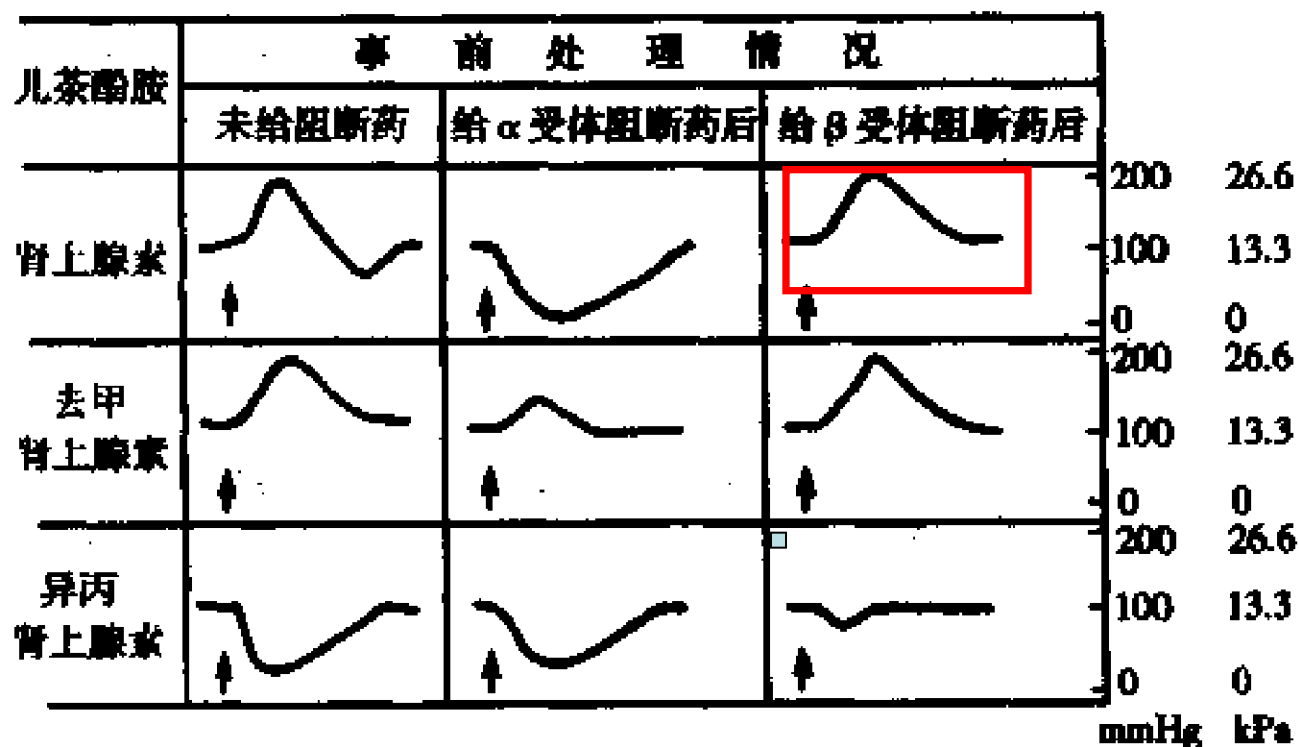


图 11-1 在给肾上腺素受体阻断药前后, 儿茶酚胺对狗血压的作用



# $\beta$ -R阻滯藥的基本藥理作用

---

2. 內在擬交感活性 (ISA)

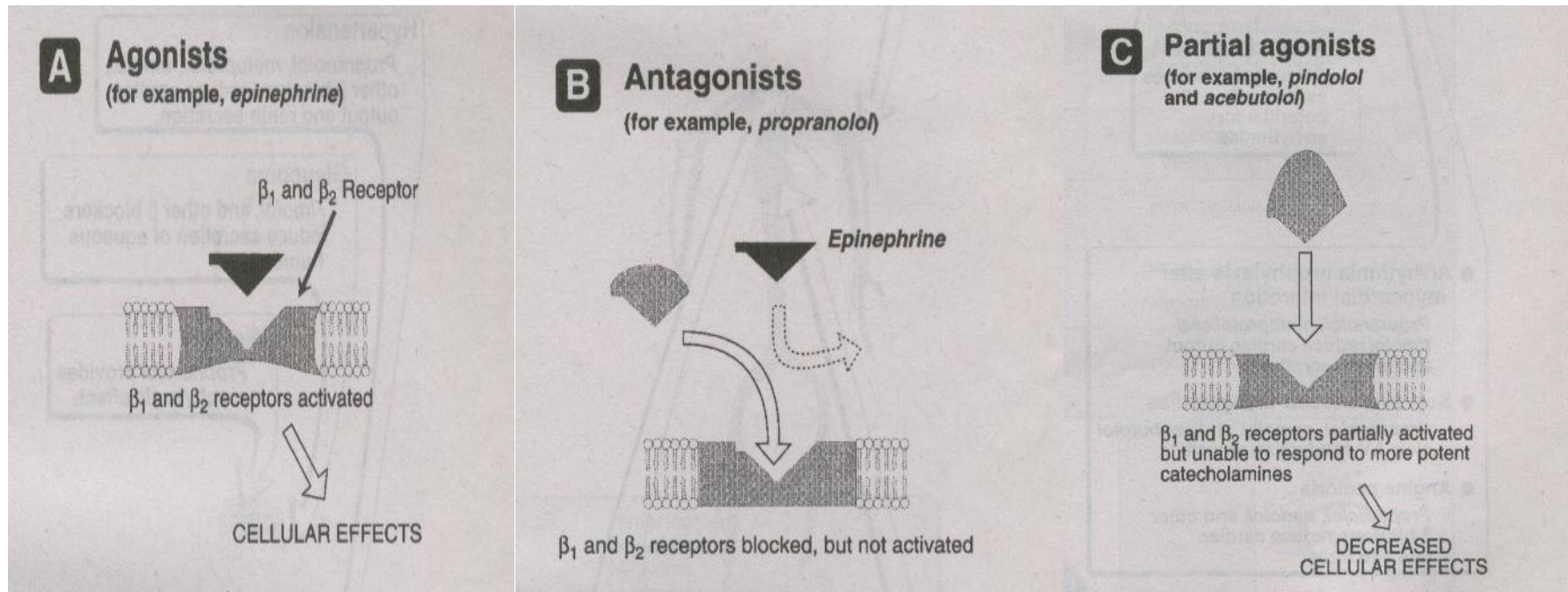
3. 膜穩定作用 高劑量

4. 其他 抗PLT聚集 (普萘洛爾)

↓ 眼內壓 (噻嗎洛爾)



# 内在拟交感活性, ISA; 部分激动活性, PAA





# 临床应用

---

- 1.心律失常
- 2.缺血性心肌病
- 3.高血压
- 4.充血性心力衰竭
- 5.甲状腺功能亢进
- 6.青光眼
- 7.偏头痛



# 不良反应与禁忌证

---

- 1.一般不良反应
- 2.诱发或加重支气管痉挛
- 3.心血管系统抑制
- 4.反跳现象
- 5.其他：抑郁，血糖↓



**Figure 7.10**  
Summary of  $\beta$ -adrenergic antagonists.





# 药物分类

---

## 1A

- Propranolol(普萘洛尔), Timolol (噻吗洛尔)

## 1B

- Pindolol (吲哚洛尔)

## 2A

- Atenolol (阿替洛尔) Metoprolol (美托洛尔)

## 2B

- Acebutolol(醋丁洛尔)

## 3

- Labetolol (拉贝洛尔)



## 第三节 常用 $\beta$ 受体阻滞药

### 1A

普萘洛尔(propranolol, 心得安):脂溶性高

噻吗洛尔(timolol): 作用最强, 治疗青光眼

### 1B

吲哚洛尔

### 2A

选择性 $\beta_1$ -R阻滞药

阿替洛尔、美托洛尔



## 3类 $\alpha$ 、 $\beta$ -R阻滯药

### 拉贝洛尔 (labetolol)

- 1.  $\beta$ -R阻滯作用<普萘洛尔,  
 $\alpha$ -R阻滯作用<酚妥拉明
- 2.  $\beta$ -R阻滯作用> $\alpha$ -R阻滯作用
- 3. 有内在拟交感活性 ( $\beta_2$ -R), 血管舒张
- 4. 多治疗高血压、心绞痛



## $\alpha$ 、 $\beta$ -R 阻滯药

---

### 卡维地洛 (carvedilol)

- 1.  $\alpha$ -R 阻滯作用 <  $\beta$ -R 阻滯作用
- 2. HBP(1995, FDA)  
CHF(1997, FDA)