



第九章 胆碱受体阻滞药（Ⅱ） ——N胆碱受体阻滞药



Cholinoceptor-Blocking Drugs（Ⅱ）



**- nicotinic acetylcholine receptor
blocking agents**



内容提要



1. 神经节阻滞药

能与神经节的 N_N 受体结合，阻滞神经冲动在神经节中的传递。



2. 骨骼肌松弛药



① 去极化型肌松药

①

② 非去极化型肌松药

②



教学基本要求

掌握：琥珀胆碱的作用机制、临床应用及主要不良反应。

熟悉：筒箭毒碱的作用特点、机制和不良反应。

了解：神经节阻滞药的作用特点和用途。

第一节 神经节阻滞药

神经节阻滞药（ganglionic blocking drugs）又称为N_N胆碱受体阻滞药，能与ACh竞争神经节部位的N_N受体，使神经节前纤维末梢释放的ACh不能引起节后神经细胞去极化，从而阻滞神经冲动在神经节的传递。

第一节 神经节阻滞药

【药理作用】 美卡拉明（美加明），樟磺咪芬

作用特点： 对交感神经节和副交感神经节都有阻滞作用，其具体效应常视两类神经对该器官支配以何者占优势而定。

交感占优势： 血压显著下降，产生直立性低血压。

副交感占优势： 胃肠道、眼、膀胱和腺体等，产生便秘、扩瞳、尿潴留和口干等症状。

第一节 神经节阻滞药

自主神经节阻滞后感和副交感神经优势效应比较

| 作用部位 | 占优势的神经支配 | 神经节阻断效应 |
|------|-----------|------------------|
| 动脉 | 交感（肾上腺素能） | 舒张；增加外周血流；低血压 |
| 静脉 | 交感（肾上腺素能） | 舒张；回流减少；心输出量下降 |
| 心脏 | 副交感（胆碱能） | 心动过速 |
| 虹膜 | 副交感（胆碱能） | 瞳孔放大 |
| 睫状肌 | 副交感（胆碱能） | 睫状体麻痹—远视 |
| 胃肠道 | 副交感（胆碱能） | 蠕动减少；便秘；胃和胰腺分泌减少 |
| 膀胱 | 副交感（胆碱能） | 尿潴留 |
| 唾液腺 | 副交感（胆碱能） | 口干 |
| 汗腺 | 交感（肾上腺素能） | 无汗 |
| 生殖器 | 交感和副交感 | 兴奋性减退 |

第一节 神经节阻滞药

【临床应用】

1. 麻醉时控制性降压，减少手术出血。
2. 主动脉瘤手术时，减少因牵拉主动脉引起的交感神经兴奋。
3. 用于高血压危象，不做常规降压药。

【副作用】

嗜睡、口干、便秘、排尿困难及视物模糊等。

第二节 骨骼肌松弛药

骨骼肌松弛药（skeletal muscular relaxants）

N_M 胆碱受体阻滞药（ N_M receptor blocking drugs），又称骨骼肌松弛药（skeletal muscular relaxants），可与神经骨骼肌接头处骨骼肌细胞膜上的 N_M 受体结合，导致骨骼肌松弛。

肌松药只能使骨骼肌麻痹，而不产生麻醉作用，不能使患者的神志和感觉消失，也不产生遗忘作用。

第二节 骨骼肌松弛药

骨骼肌松弛药 (skeletal muscular relaxants)

按其作用机制不同，可将其分为两类：

去极化型肌松药

(depolarizing muscular relaxants)

非去极化型肌松药

(nondepolarizing muscular relaxants)

第二节 骨骼肌松弛药

一、去极化型肌松药

去极化型肌松药：又称为非竞争型肌松药，可与骨骼肌细胞膜上的 N_M 受体结合，产生与ACh相似的激动 N_M 受体的作用。

第二节 骨骼肌松弛药

去极化型肌松药作用特点

1. 最初可现短时肌束颤动，与药物对不同部位的骨骼肌除极化出现的时间先后不同有关；
2. 连续用药可产生快速耐受性；
3. 抗胆碱酯酶药不仅不能拮抗其肌松作用，反能加强之，因此过量时不能用新斯的明解救；
4. 治疗剂量并无神经节阻滞作用；
5. 目前临床应用的除极化型肌松药只有琥珀胆碱。

第二节 骨骼肌松弛药

去极化型肌松药代表药

—琥珀胆碱 (succinylcholine, 司可林 scoline)
是目前常用肌松药。

【体内过程】

1. po 不易吸收。

2. iv 被假性AChE迅速水解,少量肾排,作用短暂。

第二节 骨骼肌松弛药

琥珀胆碱

【药理作用】

1. iv 10~30mg, 先为肌束颤动, 1min转松弛, 2min肌松作用最强, 5~8min后作用消失。静脉滴注可延长肌松时间。

2. 治疗量

四肢、颈部 > 面、舌、咽喉部肌肉 > 呼吸肌
中毒时则致呼吸麻痹

第二节 骨骼肌松弛药

琥珀胆碱

【临床应用】

1. 气管内插管，气管镜、食管镜检查。
2. 辅助麻醉

第二节 骨骼肌松弛药

琥珀胆碱

【不良反应】

1. **窒息** 过量易致呼吸肌麻痹，多见于遗传性缺少AChE的患者。
2. **眼内压升高** 使眼外骨骼肌短暂收缩，引起眼内压升高，故禁用于青光眼等。
3. **肌束颤动** 肌松作用前有短暂肌束颤动，用药后有肩胛、胸部肌肉疼痛，可持续3~5天。
4. **血钾升高** 持续去极化，释放 K^+ 入血。
5. **其他** 腺体分泌增加，组胺增加，恶性高热。

第二节 骨骼肌松弛药

二、非去极化型肌松药

又称**竞争型肌松药**（**competitive muscular relaxants**）。能与ACh竞争神经肌肉接头的N_M胆碱受体，使骨骼肌松弛，其本身不引起突触后膜的去极化，抗胆碱酯酶药可拮抗其肌松作用。

第二节 骨骼肌松弛药

二、非去极化型肌松药

作用特点：

1. 骨骼肌松弛前无肌肉兴奋现象；
2. 肌肉松弛作用可被抗胆碱酯酶药所拮抗，过量时可用新斯的明解救；
3. 吸入性全麻药和氨基糖苷类抗生素能增强和延长本类药物的作用；
4. 肌肉松弛作用可被同类药物所增强；
5. 可有不同程度的神经节阻滞作用和组胺释放作用。

第二节 骨骼肌松弛药

二、非去极化型肌松药

——筒箭毒碱 (d-tubocurarine)

【体内过程】

口服吸收差

静脉给药后在2~3min产生肌松作用，
5min达高峰，可维持80~120min。

约70%药物以原型从肾排泄。



第二节 骨骼肌松弛药

二、非去极化型肌松药

——筒箭毒碱 (d-tubocurarine)

【药理作用】

1. 肌松作用 从眼和头面部开始，继之为颈部、躯干和四肢，最后是肋间肌松弛，如剂量过大累及膈肌，可因呼吸肌麻痹导致患者死亡。
2. 组胺释放作用 支气管痉挛、低血压、组胺样疹块等
3. 神经节阻滞作用 低血压、心率加快

第二节 骨骼肌松弛药

二、非去极化型肌松药

——筒箭毒碱 (d-tubocurarine)

【临床应用】

辅助全麻，适用于胸腹部手术及气管内插管等

【不良反应】低血压、心率快、支气管痉挛

过量 呼吸肌麻痹—— 新斯的明解救

第二节 骨骼肌松弛药

非去极化型肌松药作用特点

| 药物 | 肌松作用 | 起效时间 (min) | 药效持续时间 (min) |
|------|------|---------------|-----------------|
| 筒箭毒碱 | 长效 | 4~6 | 80~120 |
| 阿曲库铵 | 中效 | 2~4 | 30~60 |
| 多库铵 | 长效 | 4~6 | 90~120 |
| 咪库铵 | 短效 | 2~4 | 12~18 |
| 泮库铵 | 长效 | 4~6 | 120~180 |
| 哌库铵 | 长效 | 2~4 | 80~120 |
| 罗库铵 | 中效 | 1~2 | 30~60 |
| 维库铵 | 中效 | 2~4 | 60~90 |