

# 拟胆碱药

# Cholinergic Drugs

# 拟胆碱药定义及分类

## · 定义

是一类作用与胆碱能神经递质乙酰胆碱**Ach**作用相似的药物，即 **拟似药**（激动药）。

## · 分类

### - 直接激动受体药

完全拟胆碱药：乙酰胆碱，卡巴胆碱

M受体激动药：**毛果芸香碱**

N受体激动药：烟碱

### - 抗胆碱酯酶药 **新斯的明**，毒扁豆碱 有机磷酸酯类

# 毛果芸香碱 pilocarpine

- 药理作用

- 眼:

- \* 缩瞳

- \* 降低眼内压

- \* 调节痉挛

- 腺体:

- 汗腺、唾液腺的分泌 ↑



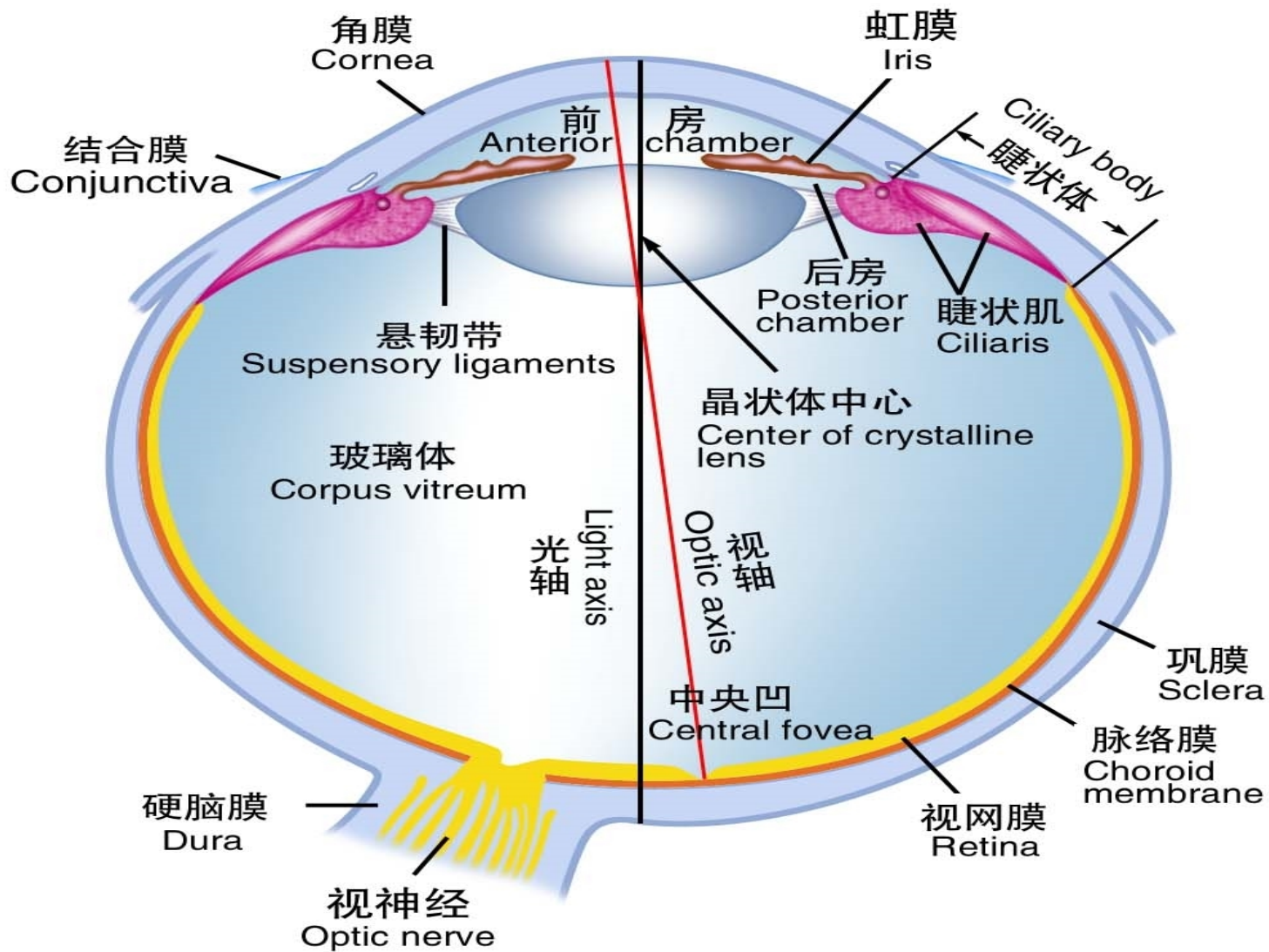
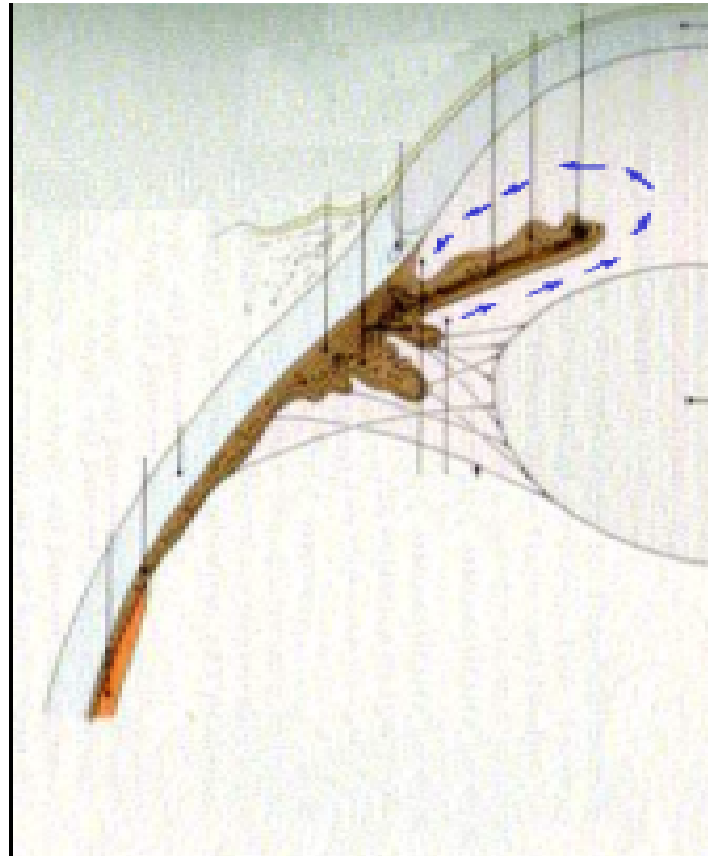
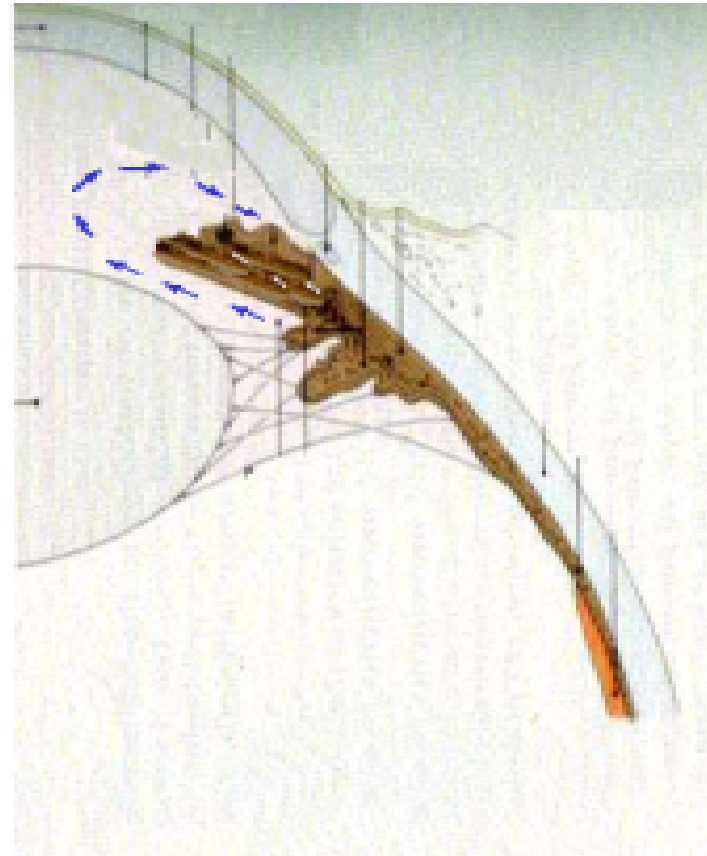


图 眼球的水平切面

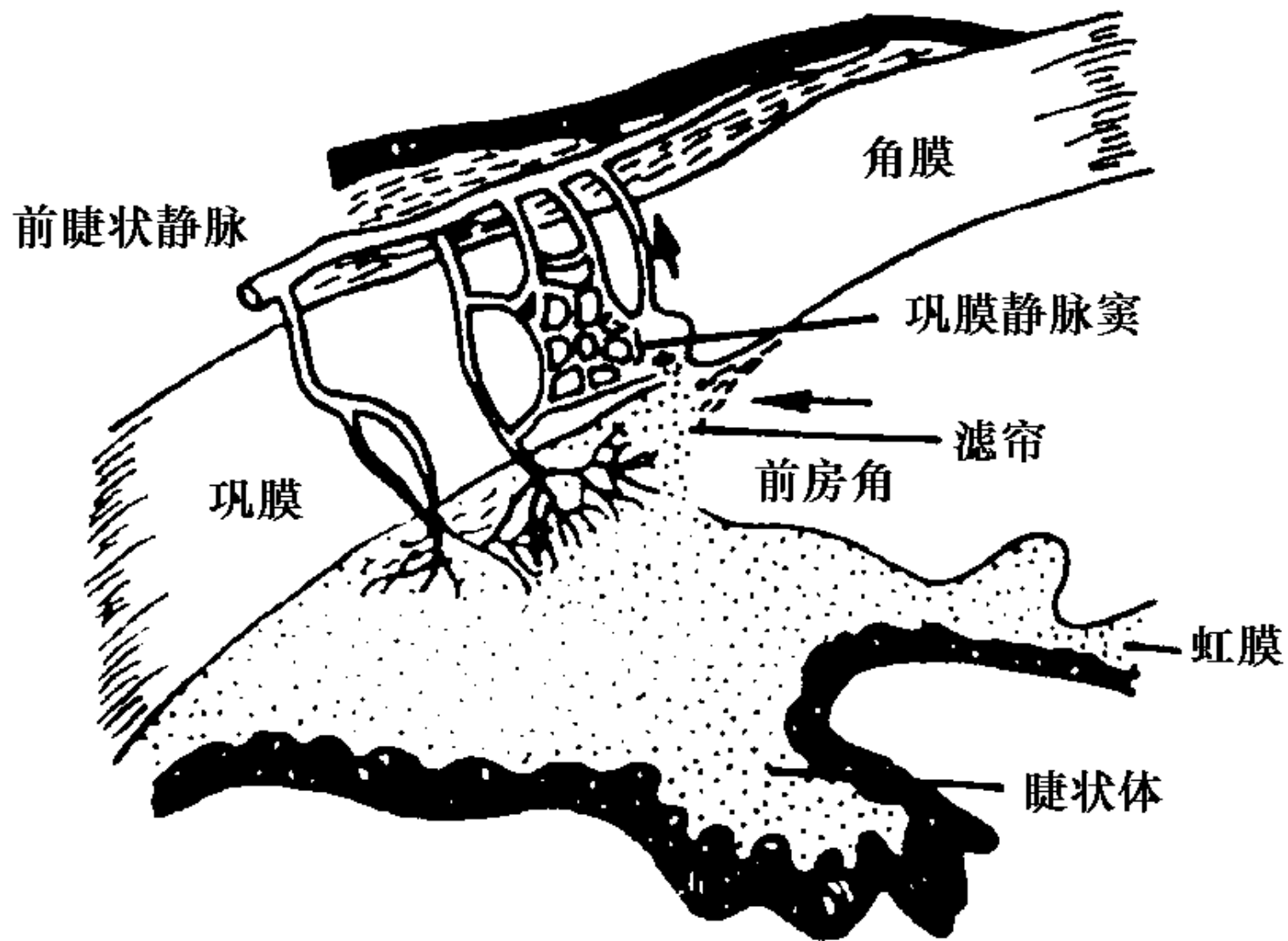


**M**受体兴奋



正常

瞳孔变化及眼房水循环



# 药理作用

- 瞳孔缩小

**M**受体兴奋→瞳孔括约肌收缩→缩瞳

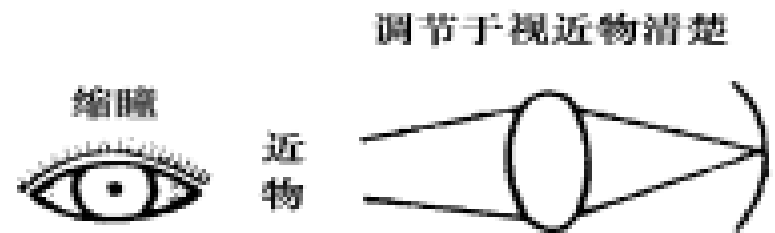
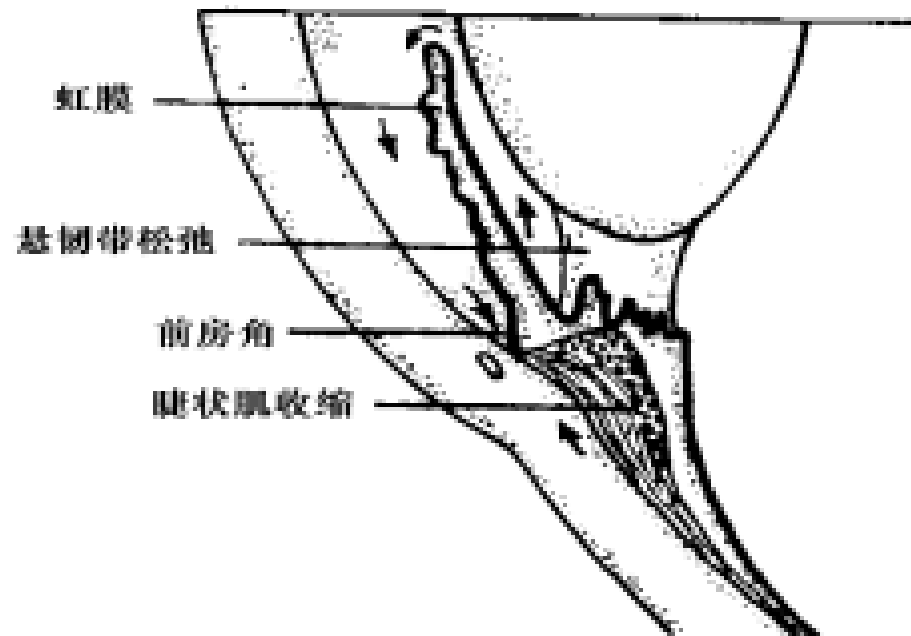
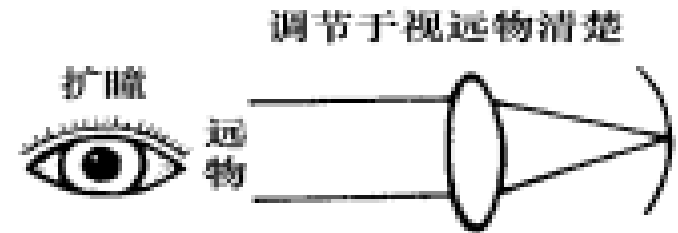
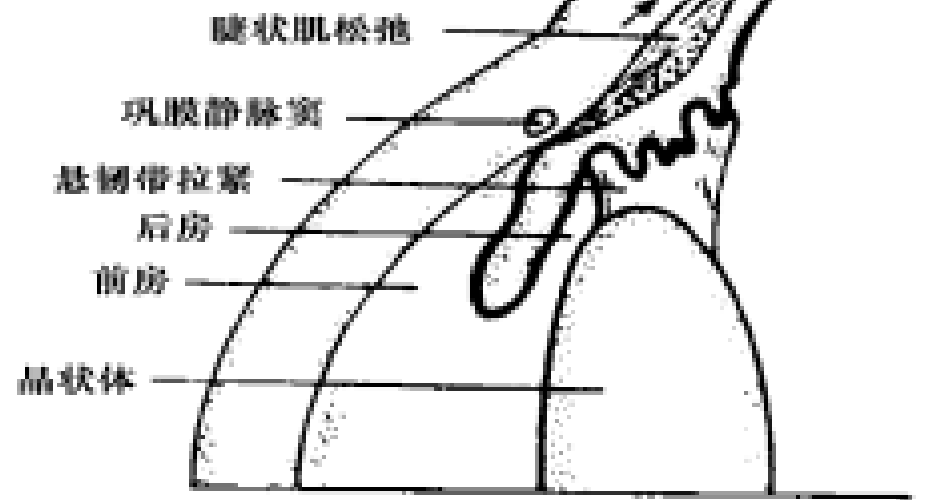
- 眼内压↓

**M**受体兴奋→瞳孔括约肌收缩→虹膜向中心拉紧→前房角间隙加大→房水回流↑→眼压↓

- 调节痉挛

**M**受体兴奋使睫状肌的环形纤维向瞳孔中心方向收缩，造成悬韧带放松，晶状体变凸，屈光度增加，此时只适合于视近物，而难以看清远物。这种作用称为调节痉挛。

# 调节麻痹



# 调节痉挛



# 临床应用

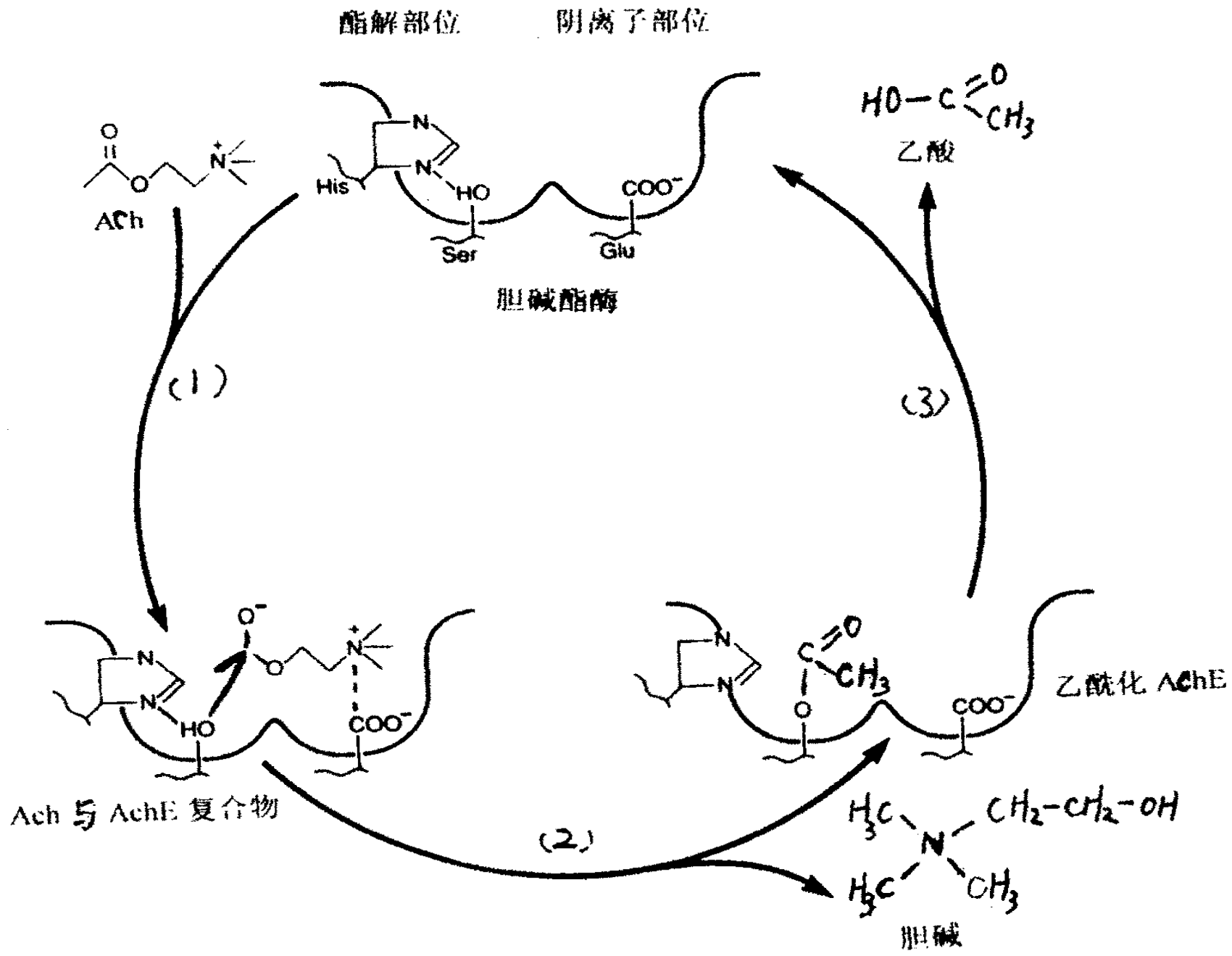
- 青光眼
- 虹膜炎
- 对抗扩瞳药作用

# 抗胆碱酯酶药

## —— 胆碱酯酶

- **真性胆碱酯酶** 也称为乙酰胆碱酯酶(**AchE**)
  - 主要存在部位 胆碱能神经元、神经肌肉接头、红细胞和体内其它组织内
  - 作用 **水解乙酰胆碱**
- **假性胆碱酯酶** 也称为丁酰胆碱酯酶
  - 主要存在部位 血浆、肝、肾、肠及神经胶质细胞中
  - 作用 对乙酰胆碱的作用较弱，可水解其它胆碱酯类，如琥珀胆碱。

# 乙酰胆碱酯酶水解乙酰胆碱过程

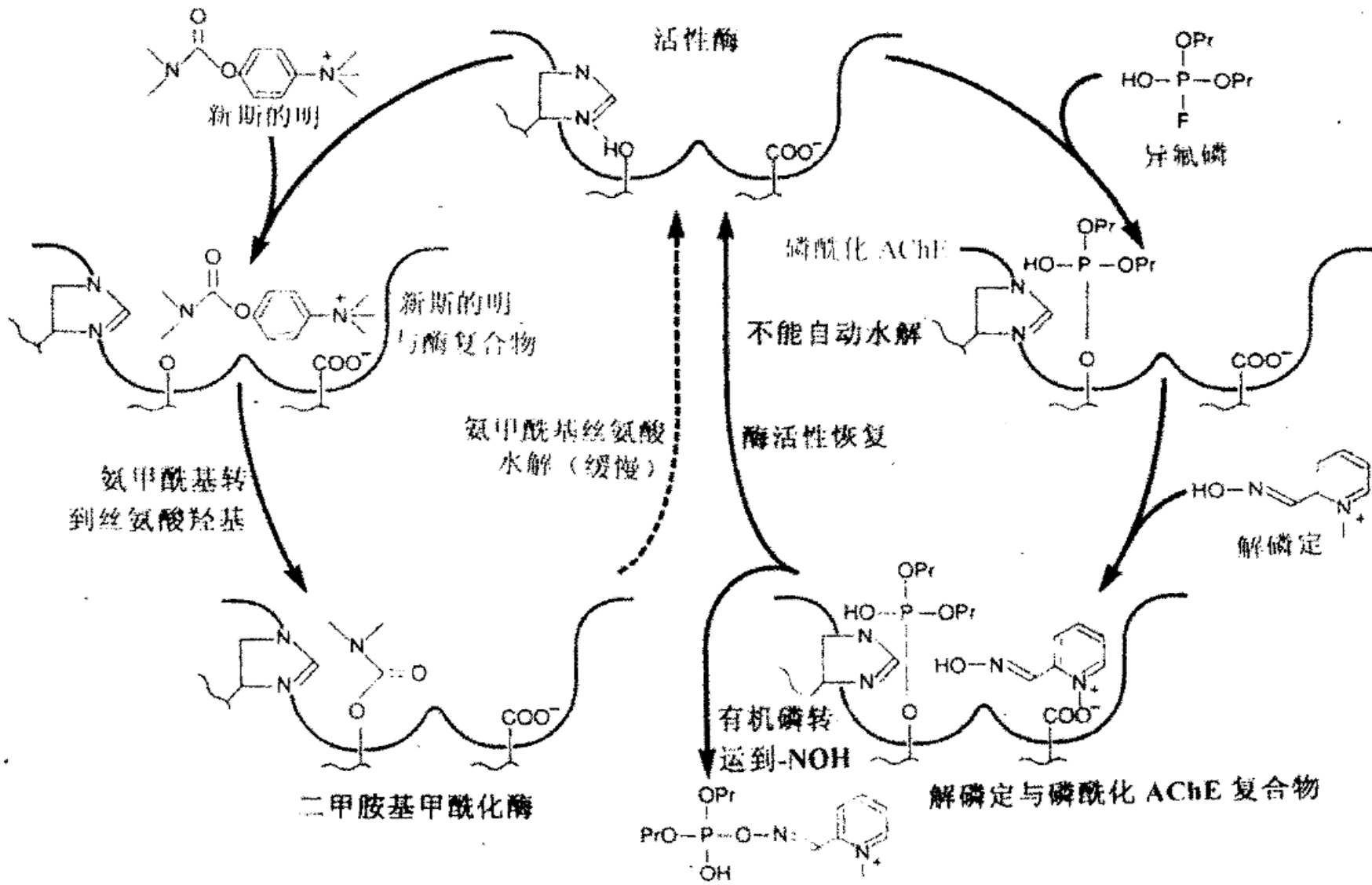


# 抗胆碱酯酶药

- 抗胆碱酯酶药能抑制乙酰胆碱酯酶，使胆碱能神经末梢释放的乙酰胆碱免遭水解而大量堆积，表现出**M**和**N**样作用。
- 根据抗胆碱酯酶药与乙酰胆碱酯酶结合后水解速度的快慢，可将其分为两类：
  - \* 易逆性抗胆碱酯酶药  
(新斯的明、毒扁豆碱)
  - \* 难逆性抗胆碱酯酶药 (有机磷酸酯类)

易逆性抗胆碱酯酶药

难逆性抗胆碱酯酶药



抗胆碱酯酶药作用

# 抗胆碱酯酶药

## ——新斯的明neostigmine (1)

### · 作用机制

与**Ach**竞争与**AchE**结合，使酶活性↓，Ach↑，突触部位**M**和**N**样作用↑

### · 药理作用

#### - 骨骼肌兴奋作用强，机制：

\*抑制**AchE**，Ach↑，**N<sub>2</sub>**受体↑

\*直接激动骨骼肌运动终板上的**N<sub>2</sub>**受体

\*促进运动神经末梢释放乙酰胆碱

- 对胃肠道和膀胱平滑肌的兴奋作用较强

- 对心血管、腺体、眼和支气管平滑肌作用弱

# 抗胆碱酯酶药

## ——新斯的明（2）

### · 临床应用

- 重症肌无力
- 手术后腹气胀和尿潴留
- 阵发性室上性心动过速
- 肌松药过量中毒（限非去极化型肌松药）
- 阿托品中毒

### · 不良反应

- 进行性流涎、恶心、呕吐、腹痛、腹泻
- **胆碱能危象** 表现为大量出汗、尿便失禁、瞳孔缩小、睫状肌痉挛、前额疼痛和心律失常。

使用阿托品控制毒蕈碱样作用

以上内容仅为本文档的试下载部分，为可阅读页数的一半内容。如要下载或阅读全文，请访问：<https://d.book118.com/425114332302011342>