

消化系统用药

药剂科

2016年4月21日



消化系统结构与功效

消化道包含口腔、咽、食道、胃、小肠（十二指肠、空肠、回肠）和大肠（盲肠、阑尾、结肠、直肠、肛管）等部。临床上常把口腔到十二指肠这一段称上消化道，空肠以下部分称下消化道。消化腺有小消化腺和大消化腺两种。小消化腺散在于消化管各部管壁内，大消化腺有三对唾液腺（腮腺、下颌下腺、舌下腺）、肝和胰。消化系统是人体八大系统之一。

组成 { 消化道
消化腺

功能 {

消化食物
吸收营养
排出废物

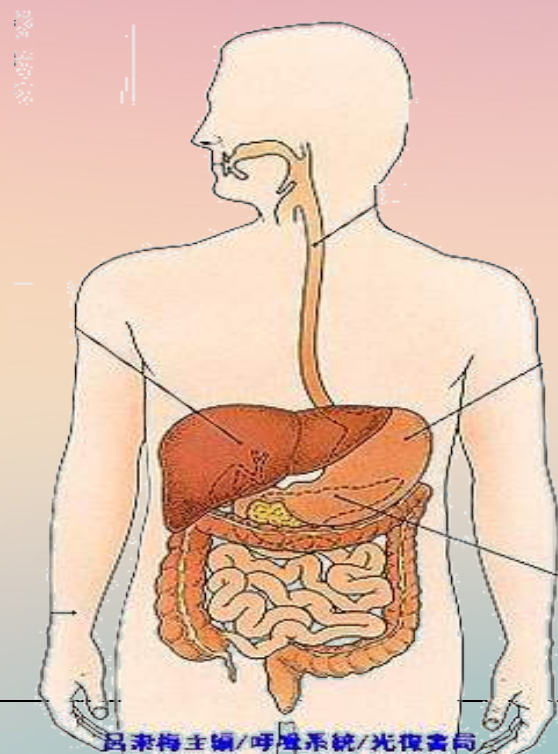


消化系统疾病

- (1) 食管疾病：食管炎、食管癌、贲门失弛缓症、食管静脉曲张
- (2) 胃、十二指肠疾病：急、慢性胃炎、十二指肠炎、消化性溃疡、胃癌、功能性消化不良
- (3) 小肠疾病：急性肠炎、出血坏死性肠炎、肠结核、吸收不良综合征、小肠肿瘤
- (4) 大肠疾病：痢疾、炎症性肠病、结肠癌、直肠癌、阑尾炎、肠易激综合征
- (5) 肝脏疾病：急慢性肝炎、肝硬化、肝脓肿、肝癌、肝寄生虫病、脂肪肝
- (6) 胆道疾病：胆石症、胆囊炎、胆管炎、胆道蛔虫、胆囊癌、胆管癌、胆囊息肉
- (7) 胰腺疾病：急慢性胰腺炎、胰腺癌
- (8) 腹膜和肠系膜疾病：急慢性腹膜炎、腹膜癌、肠系膜淋巴结结核

消化系统药品类别

- ! 一、助消化药
- ! 二、抗酸药及抗消化性溃疡药
- ! 三、泻药和止泻药
- ! 四、止吐药及胃肠动力药
- ! 五、肝胆疾病辅助用药



一、助消化药

消化液成份：胃蛋白酶（+稀盐酸）

胰酶

乳酶生

酵母

用于消化道分泌功效减弱，消化不良



三、助消化药

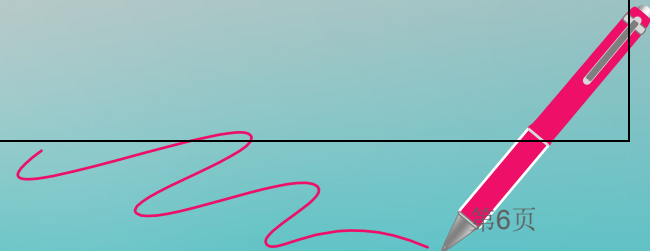
多为消化成份，用于消化成份缺乏引发消化不良。

稀盐酸

10%盐酸溶液，代替胃酸不足。

作用：促进胃蛋白酶原→胃蛋白酶，并提升酶活性。

应用：各种原因胃酸缺乏（胃炎、胃癌）消化不良（腹胀、暖气）。



惯用助消化药

药品	作用	用途
稀盐酸胃蛋白酶	增加胃液酸度， 增强胃蛋白酶 活性	胃酸缺乏症
胰酶	分解蛋白质	胃蛋白酶缺乏症 及过量饮食引发 消化不良
乳酶生	分解糖类产生乳酸， 抑制肠内腐败菌，降 低发酵和产气	肠内异常发酵引发消化 不良·腹胀及小儿消化不 良性腹泻
干酵母	富含B族维生素	食欲不振，消化不良和B族维 生素缺乏症



胃蛋白酶

家畜胃粘膜提取，酸中稳定。

作用：水解胃中蛋白质。

应用：适用稀盐酸，用于消化不良。



乳酶生

干燥活乳酸杆菌制品。

作用：在肠内分解糖类→生成乳酸（pH下降），抑制腐败菌腐败、产气作用。

应用：消化不良，多用于小儿消化不良性腹泻。

禁忌：不与抗菌药、吸附药适用。



第一节助消化药 (digestants)

代表药	作用机理
稀盐酸	增加胃酸酸度
胃蛋白酶	分解蛋白质
胰酶	消化脂肪、蛋白质及淀粉
干酵母	含B族维生素
乳酶生	含活乳酶杆菌
抗生素	杀幽门螺杆菌

多为消化液中成份或促进消化液分泌药品

助消化药

促进胃肠道消化功效药品，多数是消化液主要成份，如胃蛋白酶，稀盐酸等，临床上常与健胃药配合使用



惯用助消化药

药品	作用	用途
稀盐酸胃蛋白酶	增加胃液酸度， 增强胃蛋白酶 活性	胃酸缺乏症
胰酶	分解蛋白质	胃蛋白酶缺乏症 及过量饮食引发 消化不良
乳酶生	分解糖类产生乳酸， 抑制肠内腐败菌，降 低发酵和产气	肠内异常发酵引发消化 不良·腹胀及小儿消化不 良性腹泻
干酵母	富含B族维生素	食欲不振，消化不良和B族维 生素缺乏症



助消化药 Drugs Promoting Ingestion

胃蛋白酶 pepsin

- ! 牛、猪、羊等胃粘膜提取；
- ! 临床消化功效减弱；
- ! 对胃癌、恶心贫血可改进消化不良。

胰酶 pancreatin

- ! 动物牛、猪、羊胰腺提取物；
- ! 能消化蛋白质、淀粉、脂肪；
- ! 临床用于胰腺炎、胰腺纤维化、消化障碍。

助消化药 Drugs Promoting Ingestion

乳酶生 Lactasin

! 乳酸杆菌干燥物，可分解糖类，产生乳酸，提升肠内酸性，抑制腐败细菌生长、繁殖及预防蛋白质发酵，降低肠内产气，促进消化和止泻作用。

! 临床应用：消化不良、腹胀、小儿消化不良性腹。

酵母

! 酵母菌：含各种B族维生素， B_1 、 B_2 、 B_6 、 B_{12} 、叶酸等。

! 临床应用：食欲不振、消化不良。

抗消化性溃疡药品

分类:

☺ 一、抗酸药

☺ 二、抑制胃酸分泌药

抗胆碱药

H₂受体阻断药

质子泵抑制药

胃泌素受体阻断药

☺ 三、增强胃粘膜屏障功效药

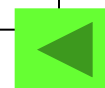


消化性溃疡药

Drugs Used in Peptic Ulcers

分类

- ! **抗酸药**：氢氧化铝、氢氧化镁等
- ! **H₂-受体阻断药**：西咪替丁、雷尼替丁等
- ! **M-胆碱受体阻断药**：阿托品等
- ! **胃壁细胞H⁺泵抑制剂**：奥美拉唑
- ! **胃泌素阻断药**：丙谷胺
- ! **胃粘膜保护药**：前列腺素衍生物



第一节 抗消化性溃疡药

1

抗酸药

2

胃酸分泌抑制药

3

黏膜保护药

4

抗幽门螺杆菌药

抗消化性溃疡药分类

抗胃酸



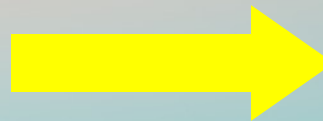
抗酸药
H₂受体阻断药
M受体阻断药
质子泵抑制药

保护粘膜



粘膜保护药

根除HP



抗幽门螺旋菌药



一、抗溃疡病药品

分类	代表药	作用机理
抗酸剂	氢氧化铝	中和胃酸
抑酸剂	法莫替丁	阻断H ₂ 受体
	哌仑西平	阻断M ₁ 受体
	丙谷胺	阻断胃泌素受体
	奥美拉唑	质子泵抑制剂
胃粘膜保护剂	硫糖铝	保护胃粘膜
杀Hp药	抗生素	杀幽门螺杆菌

治疗目标：降低攻击因子、增强防御屏障

溃疡治疗策略

胃酸破坏

胃粘膜屏障减弱

幽门螺杆菌

中和或抑制胃酸

增强粘膜屏障

抑制幽门螺杆菌

一、抗酸剂

理想抗酸药应具备以下特点：

1. 对粘膜及溃疡面有保护收敛作用
2. 抗酸作用强、快速、持久
3. 不产生CO₂气体
4. 无便秘或腹泻作用
5. 不易吸收，无碱血症

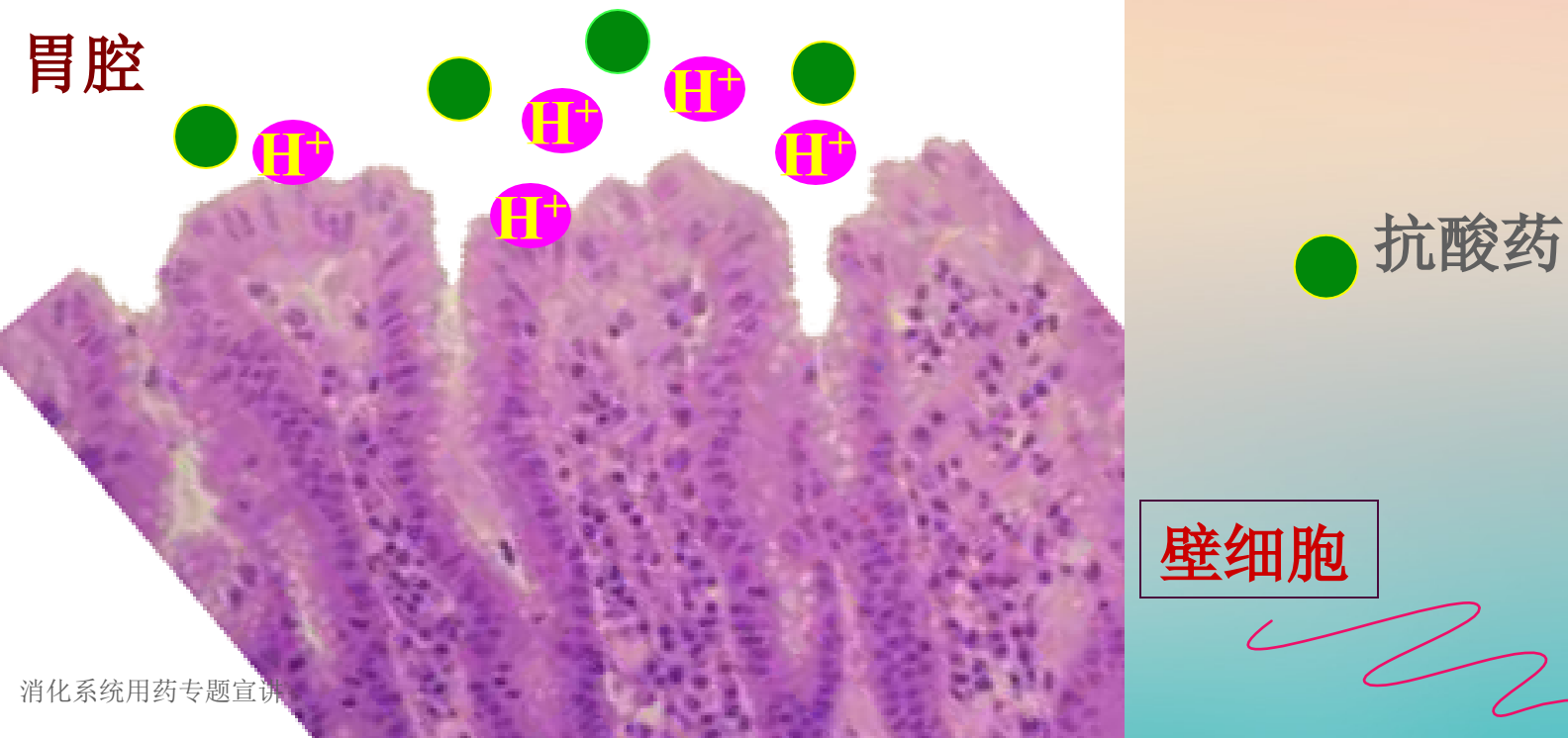


一、抗酸药



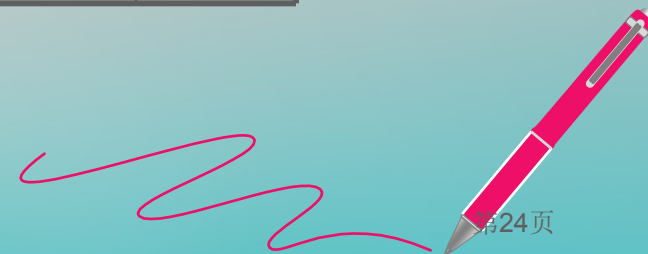
抗酸药作用机制：

- 1、中和胃酸
- 2、抑制胃蛋白酶活性



惯用抗酸药

	碳酸氢钠	氢氧化铝	三硅酸镁	碳酸钙	氢氧化镁
抗酸强度	强	中	弱	慢	强
显效时间	快	慢	慢	快	慢
维持时间	短	较长	较长	久	较长
溃疡面保护	无	有	有	无	无
碱血症	有	无	无	无	无
产生CO ₂	有	无	无	有	无
排便影响	无	便秘	轻泻	便秘	轻泻



惯用抗酸药比较

药 物	作 用	不良反应
碳酸钙	作用较强，快且持久，可产生CO ₂	暖气、腹胀、反跳性胃酸分泌增加
氧化镁	作用强，缓解且持久	腹泻
氢氧化镁	作用较强且快	腹泻，肾功能不良可致高血镁
三硅酸镁	作用弱、慢且持久；胃内产生SiO ₂ 可保护溃疡面	导泻、肾结石
氢氧化铝	作用强、慢且持久；有收敛、止血作用	便秘、能降低磷酸盐吸收
碳酸氢钠	作用强、快且短暂；有碱化尿液作用	暖气、腹胀、胃酸分泌增加；碱血症

现有抗酸药

- 无机弱碱类

{ 氢氧化铝
氧化镁/三硅酸镁
碳酸氢钠

- 多数为复方制剂

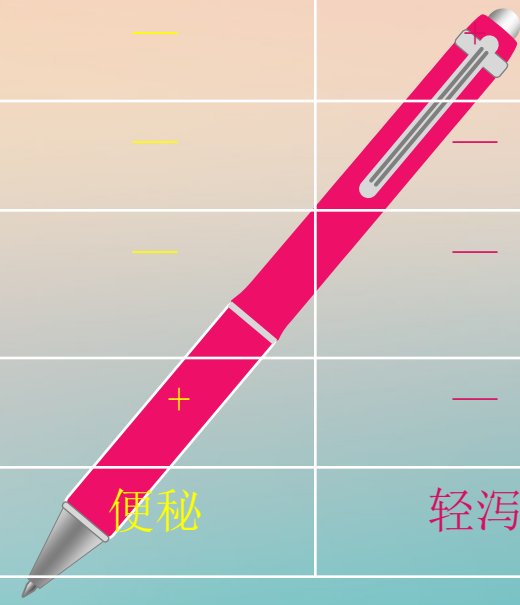
- 液体剂>粉剂>片剂(嚼碎)

临床上常制成复方制剂适用，取长补短



抗酸药作用比较

	碳酸氢钠	氧化镁	氢氧化铝	碳酸钙	三硅酸镁
抗酸强度	强	强	中	强	弱
起效时间	快	慢	慢	慢	慢
连续时间	短	久	久	久	久
保护作用	—	—	+	—	—
收敛作用	—	—	+	—	—
碱中毒之危险性	+	—	—	—	—
CO ₂ 之产生	+	—	—	+	—
大便	无影响	轻泻	便秘	便秘	轻泻



（一）抗酸药

抗酸药是一类弱碱性物质。口服后能中和胃酸而降低胃内容物酸度，从而解除胃酸对胃、十二指肠粘膜侵蚀和对溃疡面刺激，并降低胃蛋白酶活性，发挥缓解疼痛和促进愈合作用。餐后服药可延长药品作用时间。

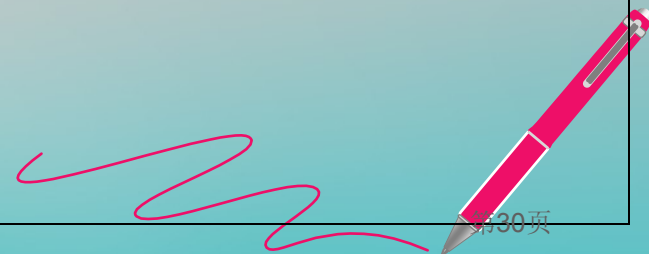
理想抗酸药应该是作用快速持久、不吸收、不产气、不引发腹泻或便秘，对粘膜及溃疡面有保护、收敛作用。单一药品极难抵达这些要求，故惯用复方制剂。惯用抗酸药有氢氧化镁、三硅酸镁、氢氧化铝、碳酸钙、碳酸氢钠等。



理想抗酸药

- (1) 作用快速、持久、不吸收
- (2) 中和胃酸不产气
- (3) 不干扰胃肠机能（不引发腹泻或便秘）
- (4) 对粘膜及溃疡面有收敛、止血作用。

！ 临床上多用复方制剂P171表24-2



理想抗酸药应该是作用快速持久、不吸收、不产气、不引发腹泻或便秘，对粘膜及溃疡面有保护、收敛作用。单一药品极难到达这些要求，故惯用复方制剂，取长补短。

胃舒平片：每片含氢氧化铝：	0.245g
三硅酸镁：	0.105g
颠茄流浸膏：	0.026g



二、胃酸分泌抑制药

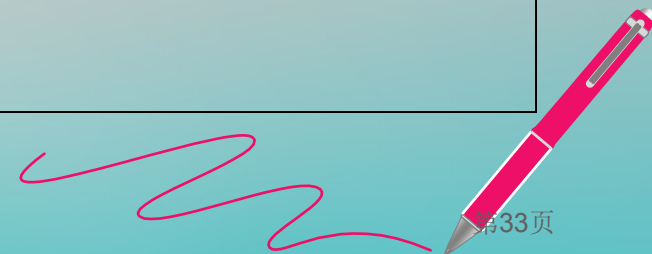


(二) 胃酸分泌抑制药

壁细胞经过受体(M1、H2受体、胃泌素受体)、第二信使和H⁺, K⁺-ATP酶三个步骤分泌胃酸。(P289,图25-1)

H2受体阻断药； M胆碱受体阻断药；

胃泌素受体阻断药； 胃壁细胞H⁺泵抑制药



H₂受体阻断药

西米替丁（**cimetidine**，甲氰米胍）

H₂受体阻断作用；轻度胃黏膜保护作用。

免疫功效调整

雷尼替丁（**ranitidine**）

法莫替丁（**famotidine**，噻唑咪胺）：**抑酸作用强大**

药品相互作用：西米替丁对肝药酶有抑制作用，可延长苯妥英钠、地西洋、华法林、茶碱等消除。



1、H₂受体阻断药

! 组胺(H): 存在于皮肤、支气管粘膜肥大细胞及嗜碱性细胞中。组胺与靶细胞上受体结合, 产生效应(胃肠绞痛, 刺激胃壁细胞, 胃酸分泌增加)

! 目标: H₂受体阻断药 抑制胃酸分泌, 促进溃疡愈合。

第一代: 西咪替丁

第二代: 雷尼替丁

第三代: 法莫替丁

作用持久

抑酸活力增强

对肝药酶抑制降低

抗雄激素等ADR降低

H₂受体阻断药

【临床应用】

- ! 十二指肠溃疡，胃溃疡（6 ~ 8周）；
- ! 胃肠混合溃疡，消化道出血也可用。

【副作用】

- ! 长久服用耐受良好，偶见便秘、腹泻、腹胀及头痛、皮疹

长久服用西咪替丁，男性可引发阳痿，性欲下降，乳房发育。

- ! 治疗溃疡病疗程短，溃疡愈合率较高，不良反应较少，但突然停药时，会造成胃酸分泌反跳性增加。

西咪替丁 (cimetidine)

不良反应:

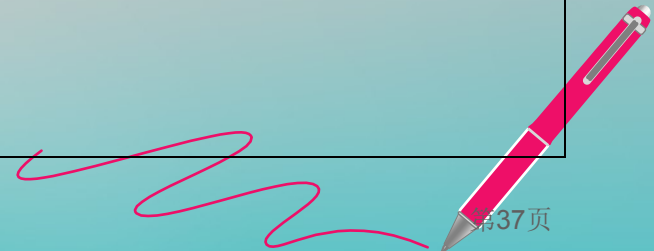
多, 现少用

! 中枢神经

! 消化系统

! **抗雄激素作用**: 男性青年, 可引发阳痿、性欲消失及乳房发育

! 抑制细胞色素P-450肝药酶活性 (雷尼替丁较弱, 其它同类药品无)



用药注意：

！可透过胎屏障，并经过乳汁排泄

！不可与硫糖铝类药适用

其它药品：

雷尼替丁（ranitidine）（第二代）

比西米替丁强5~10 倍

法莫替丁（famotidine）（第三代）

比雷尼替丁强7 倍

2、胃壁细胞质子泵抑制剂

! **质子泵抑制药** (proton pump inhibitor) 又称 H^+-K^+-ATP 酶抑制药, 是新型抗消化性溃疡药。疗效确切, 不良反应少, 近年来被广泛应用。

临床惯用有

! **奥美拉唑** (omeprazole)

! **兰索拉唑** (lansoprazole)

! **泮托拉唑** (pantoprazole)

! **雷贝拉唑** (rabeprazole)



2. H⁺泵抑制药

作用机制:作用于壁细胞胃酸分泌终末步骤中关键酶H⁺-K⁺-ATP 酶, 使其不可逆地失去活性, 造成胃酸分泌抑制。

奥美拉唑 (Omeprazole 洛赛克)

! 抗溃疡机制

抑制H⁺泵功效

促进胃粘膜血流循环, 修复胃粘膜



奥美拉唑 Omeprazole

又称洛赛克 (losec) 第一代质子泵抑制剂

【药理作用与作用机制】

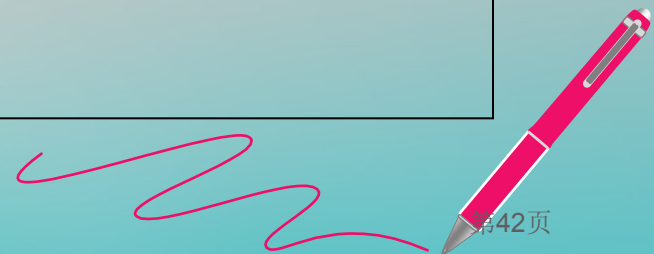
- ! 胃 H^+-K^+-ATP 酶又称质子泵，由 α 和 β 两个亚单位组成。
- ! H^+-K^+-ATP 酶抑制药与 H^+-K^+-ATP 酶 α 亚单位结合，使酶失去活性，抑制 H^+ 分泌。
- ! 其抑酸作用强而持久，可使胃内pH值升高至7，一次用药后大部分胃酸分泌被抑制24 h以上，
- ! 同时胃蛋白酶分泌也有降低。

! 对幽门螺杆菌有抑制作用。

奥美拉唑 omeprazole

〔临床应用〕

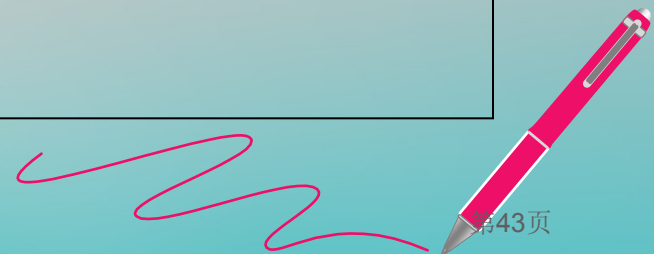
- ! 反流性食道炎, 有效率达75%~85%。
- ! 消化性溃疡, 服用1~6月, 溃疡愈合率达97%, 其它类药品无效用4周, 愈合率达90%。
- ! 幽门螺杆菌感染, 幽门螺旋杆菌83%~88%转阴。
- ! 上消化道出血。



【副作用】

! 1% ~2% 头痛、头晕、口干、恶心、腹胀、失眠，偶见皮疹，男性乳头女性化。

! 长久服用，胃内细菌过分生长。



药理作用

1. 抑制胃酸分泌

- 奥美拉唑→亚磺酰胺衍生物→与 H^+-K^+-ATP 酶上巯基结合→抑制 H^+ 泵→抑制胃酸、胃蛋白酶分泌
- 对胃泌素、组胺、ACh、食物等原因引发胃酸分泌均可抑制

2. 胃粘膜保护作用：

动物试验证实，对阿司匹林、乙醇、应激所致胃黏膜损伤有保护作用。机制尚不清楚：↑粘膜血流量

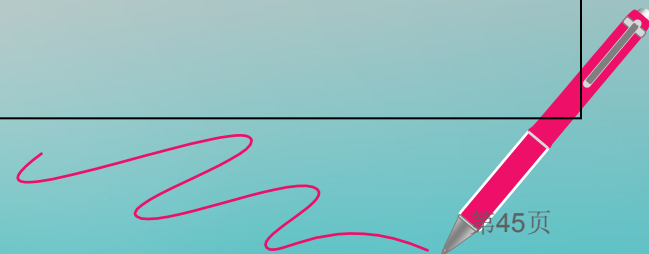
3. 有抗幽门螺旋杆菌作用

可能经过抑制细菌ATP酶活性而抑制细菌生长。



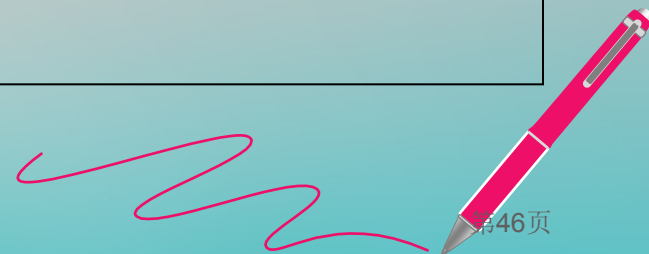
兰索拉唑 Lansoprazole

- ! 是第二代质子泵抑制药。
- ! 抑制胃酸分泌、升高血胃泌素、胃粘膜保护作用及抗幽门螺杆菌作用。
- ! 抑制胃酸分泌作用及抗幽门螺杆菌作用较奥美拉唑 (omeprazole) 强。



泮托拉唑 Pantoprazole

- ! 与雷贝拉唑（rabeprazole）属第三代质子泵抑制药。
- ! 抗溃疡病作用与奥美拉唑相同。
- ! 雷贝拉唑（rabeprazole）在抗胃酸分泌能力和缓解症状、治愈粘膜损害临床效果方面远优于其它抗酸药品。



质子泵抑制剂与H₂阻断药作用比较

质子泵抑制剂

作用强大，完全阻止各种刺激引发胃酸分泌

连续用药无耐受性

作用持久、递增，3-5天后达稳态

胃内pH维持平稳

治愈率高，复发率低

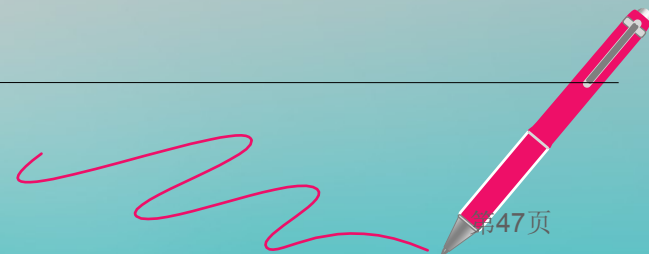
H₂阻断药

对组胺及夜间胃酸分泌抑制强，其它作用弱

逐步产生耐受性

屡次用药后作用减弱、增加剂量不能克服

胃内pH波动较大



胃泌素受体阻断药

丙谷胺(**proglumide**)可竞争性阻断胃泌素受体，降低胃酸分泌。并对胃粘膜有保护和促进愈合作用。但临床疗效比**H₂**受体阻断剂差，已少用于治疗溃疡病。



3、促胃泌素受体阻断药

丙谷胺

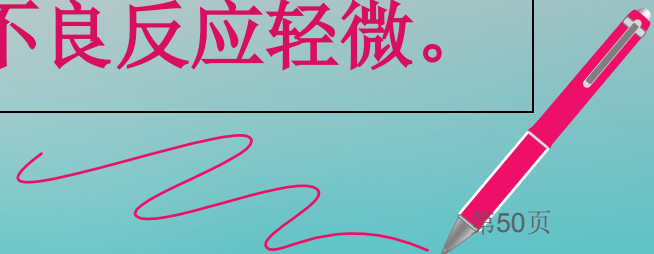
- ☺ 竞争性阻断胃泌素受体；
- ☺ 降低胃酸分泌；
- ☺ 增加胃黏液中己糖胺；
- ☺ 促进蛋白质合成，增强屏障；
- ☺ 用于胃十二指肠溃疡；
- ☺ 也用于急性上消化道出血。

M胆碱受体阻断药

阿托品及其合成代用具可降低胃酸分泌、解除胃肠痉挛。但在普通治疗剂量下对胃酸分泌抑制作用较弱，增大剂量则不良反应较多，较少单独应用。

哌仑西平(pirenzepine, 必舒胃)

与引发胃酸分泌M₁胆碱受体亲和力较高，而与唾液腺、平滑肌、心房M胆碱受体亲和力低。治疗效果与西咪替丁相仿，而不良反应轻微。



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/747140063032006132>