



西地兰

强心苷 (cardiac glycosides)

- ❖ 历史
- ❖ 分类
- ❖ 西地兰药代动力学
- ❖ 药理作用
- ❖ 不良反应
- ❖ 给药方法

[来源]：二年生或多年生草本。第2~3年春于叶簇中央抽出花茎，高达1~1.5m，有短柄或近无柄，总状花序顶生，花冠钟形，下垂，偏向一侧，紫红色，内面带深紫色斑点。蒴果圆锥形，种子细小。花期5~6月，果期6~7月。原产于**欧洲**中部与南部山区。现中国**浙江**、上海、**江苏**与山东等地已有大量栽培。



- ❖ 1775年，英国植物学家及医生威瑟林听说，有位农妇能用一种家传的秘方治疗**水肿**病(即心力衰竭性水肿)，效果奇好。农妇的秘方虽含20多种药物，真正起作用的只有紫花洋地黄一种。他将洋地黄的花、叶、蕊等不同部分，分别制成**粉剂**、煎剂、酊剂、丸剂，比较其疗效；结果发现，以开花前采得的叶子研成的粉剂效果最好，还确定了用药的最适剂量为1—3格兰(1grain=64.8mg)，他用洋地黄共治疗了163名病人，积累了大量经验。1785年，他发表了专著《关于洋地黄》，成为世界名医。

❖ 1874年，德国最优秀的药物学家之一施密德伯格从洋地黄植物中提纯了洋地黄毒甙，并证明是有效的强心成份。现代临床上常用的地高辛，就是从毛花洋地黄中提取的有效成分；毒K是从绿毒毛旋花的种子中提取的各种甙的混合物；西地兰，则是毛花甙丙的脱乙酰基衍生物，作用迅速。

【分类】

- (1) 慢效类：如洋地黄毒苷 (digitoxin), 口服给药。
- (2) 中效类：如地高辛 (digoxin), 口服给药。
- (3) 快效类：静脉给药

毛花苷C (lanatoside C, 西地兰cedilanid)

毒毛花苷K (strophanthin K) 等

药物	起效	给药途径	t1/2
洋地黄毒苷	慢	PO	7 d
地高辛	中	PO	36 hr
毒毛花苷K	快	iv	11 hr
西地兰	快	iv	33-36hr

西地兰药代动力学

静脉注射

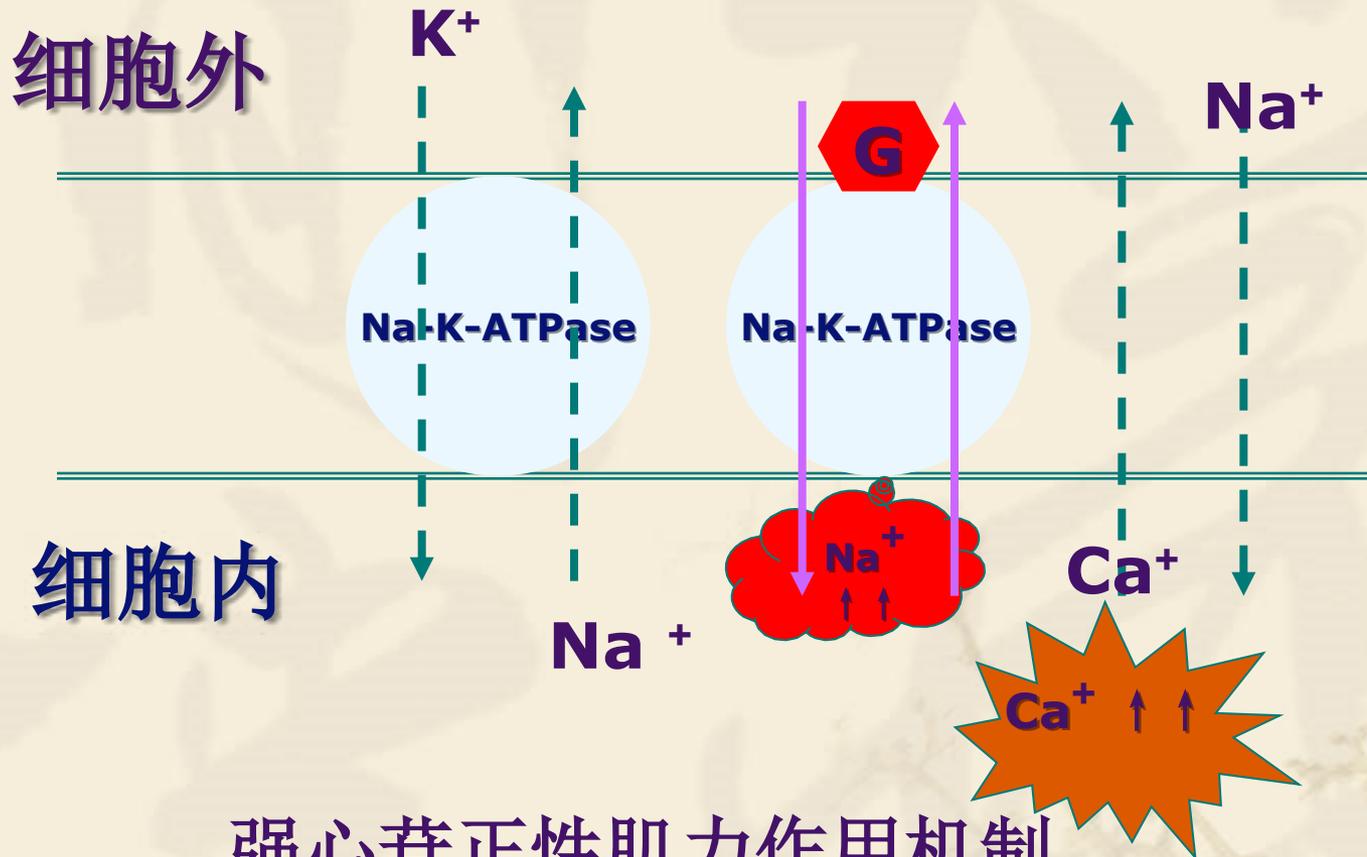
- ❖ 10-30分钟起效
- ❖ 1-3小时达高峰
- ❖ 持续2-5小时
- ❖ 蛋白结合率25%
- ❖ 半衰期33-36小时
- ❖ 3-6日作用完全消失，在体内转化为地高辛
- ❖ 经肾脏排泄，体内蓄积性较小

[药理作用及作用机制]

一、对心脏的作用

1. 正性肌力作用

- (1) 加强心肌收缩力，心肌张力 \uparrow ，缩短收缩时间，心肌收缩敏捷
- (2) 明显增加衰竭心脏的心输出量，总外周血管阻力 \downarrow
- (3) 不增加甚至降低衰竭心肌耗氧量



强心苷正性肌力作用机制



正性肌力作用机制：

强心苷+强心苷受体(Na⁺-K⁺-ATP酶)→抑制该酶活性→Na⁺和K⁺转运障碍→细胞内Na⁺↑→细胞内外Na⁺浓度差↓→外Na⁺交换内Ca²⁺ ↓,内Na⁺交换外Ca²⁺↑→细胞内Ca²⁺浓度↑→心肌收缩力↑。

2. 减慢心率作用

治疗量对正常人窦性心率影响小。



机制:

- 继发于正性肌力作用，使迷走神经兴奋。
- 加强心肌对迷走神经的敏感性。

减慢心率的意义

- ①负性频率→心动周期↑→舒张期↑
- { 心室充盈↑, 有利于心输出量↑;
心肌自身供血↑;
心肌获得充分休息→心功能改善。
- ②负性频率→心肌耗氧量↓。

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/878141124021007006>