

基础精讲班

# 药 学 专 业 知 识 二

国 家 注 册 执 业 药 师 执 业 资 格 考 试

主讲老师：孔 汲

2019

## 第六章 血液系统疾病用药

---

- 1. 促凝血药
- 2. 抗凝血药
- 3. 溶栓药
- 4. 抗血小板药
- 5. 抗贫血药
- 6. 升白细胞药

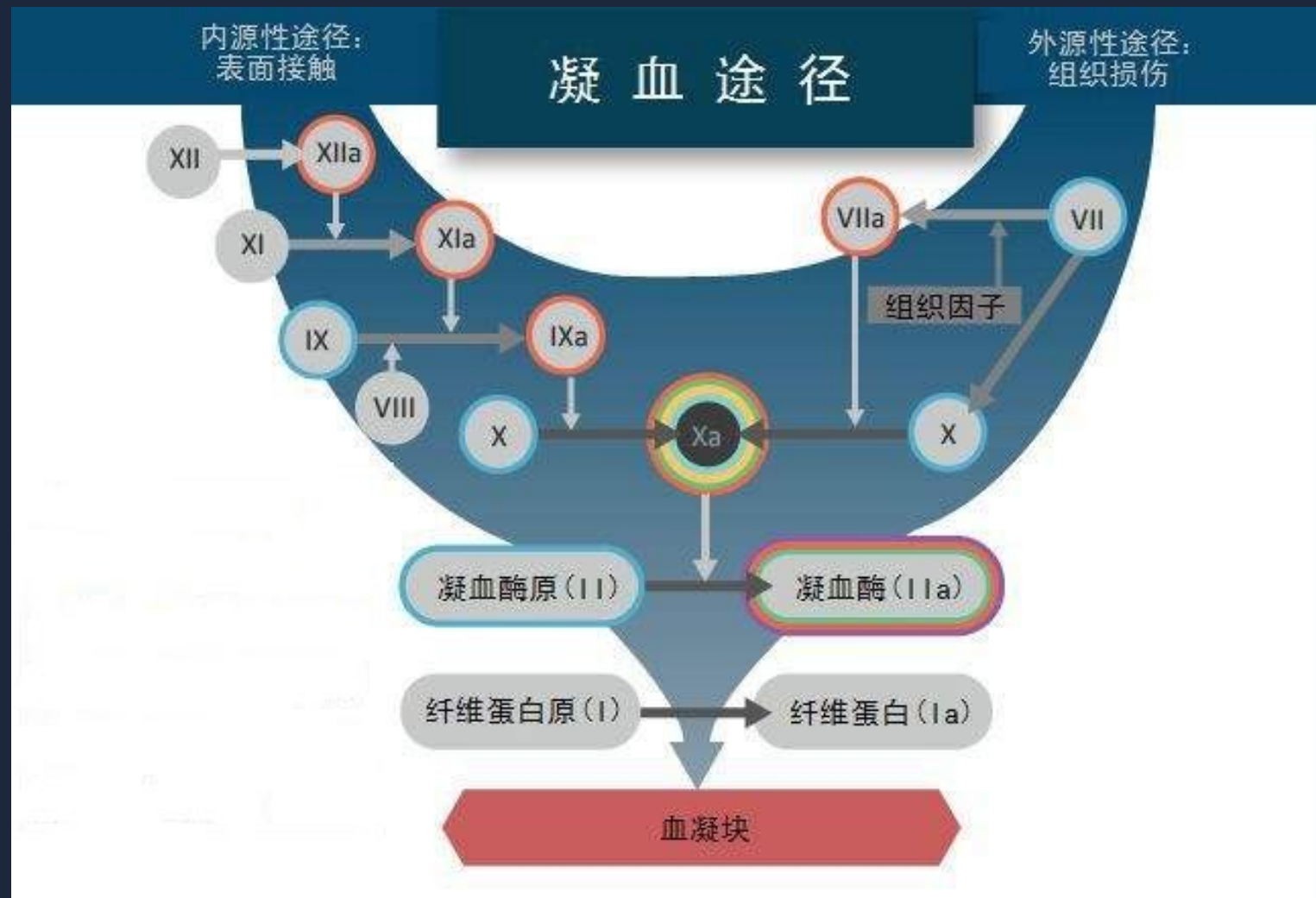
2019

5073

## 》第一节 促凝血药

分类	代表药物
促凝血因子合成	维生素K1
促凝血因子活性	酚磺乙胺
抗纤维蛋白溶解药	氨基己酸、氨甲苯酸、氨甲环酸
影响血管通透性	卡巴克络
拮抗肝素	鱼精蛋白
凝血酶	蛇毒血凝酶

## 第一节 促凝血药



## 》第一节 促凝血药

### 一、促凝血药药理作用与临床评价

药物类别	药物	作用特点	口诀
促凝血因子合成	维生素K1	1、 维生素K1 是凝血因子Ⅱ、Ⅶ、Ⅸ、Ⅹ合成所必需的物质，促进凝血因子合成 2、用于新生儿出血 （穿过胎盘屏障，妊娠期妇女出血，避免使用维生素K1）	
促凝血因子活性	酚磺乙胺	1、增强血小板聚集性和黏附性，促进血小板释放凝血活性物质，使血管收缩，出血和凝血时间缩短 2、与其他抗凝药合用，增加止血效果。 与氨基己酸混合注射，可引起中毒	
抗纤维蛋白溶解药	氨基己酸、 氨甲苯酸、 氨甲环酸	抑制纤维蛋白的赖氨酸与纤溶酶结合	酰胺酸

## ➤ 第一节 促凝血药

### 一、促凝血药药理作用与临床评价

药物类别	药物	作用特点	记忆口诀
影响血管通透性	卡巴克络	降低毛细血管血管的通透性，促进受损的毛细血管端回缩	血管卡壳了
拮抗肝素	鱼精蛋白	1、特异性拮抗肝素的抗凝作用 2、口服无效，仅限于静脉注射	鱼肝油
凝血酶	矛头蝮蛇血凝酶	具有类凝血酶样作用 促进血管破损部位的血小板聚集 完整无损的血管内无促进血小板聚集作用	

## ▶▶ 第一节 促凝血药

---

### 二、用药监护

#### (一) 注意监测血栓形成

1. 共性的不良反应——形成**血栓**。两种促凝血药合用，应警惕血栓形成。

2. 定期**监测凝血酶原时间**，来调整剂量和给药时间

#### (二) 监测血凝酶的合理应用

(1) **妊娠期**妇女出血时，**避免使用维生素K1** 和**矛头蝮蛇血凝酶**

注意：新生儿出血时，宜再补充维生素K

(2) **血凝酶**应用**过量**，止血作用会降低。

(3) 监测**出、凝血时间**。

2019

5073

## ➤ 第二节 抗凝血药

### 抗凝血药分类

分类	代表药物	口诀
维生素K拮抗剂	华法林	
肝素与低分子肝素		
凝血酶抑制剂	达比加群酯	
凝血因子X 抑制剂	间接抑制剂：磺达肝癸钠 依达肝素	见大肝
	直接抑制剂：利伐沙班 阿哌沙班	直接下班



## 》 第二节 抗凝血药

### 第一亚类 维生素K拮抗剂——华法林

机制	竞争性拮抗维生素K，产生无凝血活性的Ⅱ、Ⅶ、Ⅸ、Ⅹ因子，阻止凝血因子合成 对凝血的各个环节均有作用
作用特点	起效缓慢（3-5天）、作用过于持久、不易控制、体外无效
不良反应	出血，男性骨质疏松
用药监护	1、起效时间滞后，初始治疗宜联合肝素，肝素与华法林序贯疗法——两者至少重叠使用4日，达到治疗标准2天后停用肝素。 肝素（最大作用时间2min）+华法林（口服起效时间至少3天） 2、华法林初始剂量宜小：一般为3mg 3、增加男性骨质疏松性骨折的风险，联用β受体阻断剂降低该风险。 4、华法林过量出血，用维生素K1纠正 用药期间——进食富含维生素K的食物 5、服用后，监测凝血酶原时间（PT），国际标准化值（INR） 理想的INR应维持在2~3，>4时出血危险性增加

## » 第二节 抗凝血药

补充总结

药物不良反应导致骨折

罗格列酮	导致女性骨折风险	女——萝莉
华法林	增加男性骨质疏松性骨折的风险	男——花心
奥美拉唑	导致老年人髌骨、腕骨骨折	老人——懊恼
糖皮质激素	导致所有人骨质疏松	所有人——吃糖

2019

5073

## 》 第二节 抗凝血药

### 第二亚类 肝素与低分子肝素

机制	对凝血的各个环节均有作用 a. 抑制凝血酶原转变为凝血酶——起始阶段 b. 抑制凝血酶活性 c. 阻碍纤维蛋白原转变为纤维蛋白 d. 防止血小板凝集和破坏
作用特点	①在体内、体外均可延缓和阻止血液凝固 ②起效迅速，对抗急性凝血的首选
不良反应	血小板减少症
用药监护	1、关注肝素所致的血小板减少症 血小板减少症：血小板 $<150 \times 10^9/L$ ，或：较用药前最高值下降50%以上 方法：1) 停肝素，包括用于冲洗静脉通路的肝素。 2) 替代治疗：应用直接凝血酶抑制剂——阿加曲班。 2、监护肝素所致的出血——静脉注射硫酸鱼精蛋白注射液 鱼精蛋白1mg在体内能中和肝素钠100U

## 》 第二节 抗凝血药

### 第二亚类 肝素与低分子肝素

低分子肝素 代表药物	依诺肝素：皮下注射——生物利用度好，出血倾向小 那屈肝素钙：抗血栓，且可溶栓 达肝素钠：血浆半衰期长2倍 替他肝素：较肝素生物利用度高，作用时间长
---------------	--

2019

## 》 第二节 抗凝血药

### 第三亚类 直接凝血酶抑制剂

药物	达比加群酯
机制	抑制凝血 II a 和Xa 因子，与凝血酶的纤维蛋白特异位点结合，阻止纤维蛋白原裂解为纤维蛋白，从而阻止凝血瀑布反应的最后步骤及血栓形成。
作用特点	1、选择性高。作用与凝血途径单酶的某一部位，治疗剂量下不会引起血小板减少。 2、与纤维蛋白结合的凝血酶仍可被灭活 3、较少与血浆蛋白结合，可以预测抗凝效果，无需监测INR 4、长期服用安全性好，抗凝作用与维生素K无关
用药监护	1、重视肾功能不全者的监测 直接凝血酶抑制剂（阿加曲班除外）主要经肾脏排泄，肾功能不全患者易致药物蓄积 2、警惕严重心血管不良事件 达比加群酯与心肌梗死、急性冠脉综合征的危险升高有关

## 》 第二节 抗凝血药

### 第四亚类 凝血因子X 抑制剂

机制	竞争性的与凝血因子Xa活性位点结合，抑制游离和结合的因子Xa及凝血酶原活性
作用特点	<ul style="list-style-type: none"><li>1、作用直接、选择性高</li><li>2、既有强大抗凝作用，又不影响已形成的凝血酶的正常生理凝血</li><li>3、治疗窗宽，无需监测INR</li><li>4、对肾脏依赖性小于达比加群酯，肾功能不全者使用后出血风险低</li><li>5、半衰期较长，无相应的阻滞剂，一旦发生出血极难处理</li></ul>

## ➤ 第二节 抗凝血药

直接抑制 剂	利伐沙班	
	阿哌沙班	
间接抑制 剂	磺达肝癸钠	与肝素相比，导致血小板计数减少症的风险最低，极少引起出血
	依达肝素	半衰期130h，一周给药一次，无相应的阻滞剂 一旦发生出血，极难处理
	生物素化依达肝素	第一个长效、易中和的抗凝血药。 可被亲和素中和而减弱抗凝血作用，在紧急需要时可逆转抗凝血作用

## » 第三节 溶栓药

促进纤溶酶原激活，形成纤溶酶，纤维蛋白溶解而溶解血栓



2019

5073



## » 第三节 溶栓药

药物	作用特点	相互作用
尿激酶	1、对新产生的血栓溶栓效果好 2、急性缺血性脑卒中者，发病6h内，用尿激酶 3、尿激酶中加入人体白蛋白作为稳定剂	链激酶、尿激酶溶栓治疗应与阿司匹林联用，可增加疗效，不增加严重出血的发生率
链激酶	1、溶栓作用无选择性 2、本品输注后可产生抗体，5天~1年内重复给药，其疗效可能降低，故一年内不宜重复给药	
阿替普酶	1、选择性地激活血栓部位的纤溶酶原 2、血浆半衰期短，须连续静脉给药 3、不适用18岁以下，80岁以上急性脑卒中患者	
瑞替普酶	1、半衰期长，栓塞开通率高 2、对纤维蛋白的特异性强 3、给药方便，赢得时间 4、纤溶活性：阿替<瑞替<链激酶 5、治疗时间窗宽，溶栓效果好且安全	静脉溶栓治疗首选阿替普酶或瑞替普酶，无条件时，用尿激酶替代

## » 第三节 溶栓药



最佳选择题 2017A

1. 使用后可以产生抗体，一年内不宜再次使用的药物是

- A. 尿激酶
- B. 链激酶
- C. 瑞替普酶
- D. 阿替普酶
- E. 血凝酶

答案：B

2019

5073

## » 第三节 溶栓药

### 二、用药监护

#### (一) 监测出血

严重出血时立即停药，必要时输注新鲜血或红细胞、纤维蛋白原等。也可试用氨基己酸等抗纤溶药注射止血

#### (二) 监护溶栓药的治疗时间窗——尽早用药

- 急性脑卒中梗死在60min内形成。
- 急性脑卒中发作后，不稳定的血流3—4h小时仍不改善，可能出现代谢衰竭
- 溶栓药治疗时间窗一般3-4h内，超过6h 的缺血性脑卒中者可给予尿激酶。

## » 第三节 溶栓药



最佳选择题 2017A

2. 急性缺血性脑卒中发作，应用溶栓药治疗时间窗是在发病后

- A. 3小时内
- B. 8小时内
- C. 12小时内
- D. 24小时内
- E. 48小时内

答案：A

2019

5073

## ▶▶ 第四节 抗血小板药

---

抑制血小板聚集，从而抑制血栓形成



2019

2019

## » 第四节 抗血小板药

### 抗血小板药分类

分类	代表药物		口诀
环氧化酶抑制剂	阿司匹林		
二磷酸腺苷P2Y <sub>12</sub> 受体阻断剂	氯吡格雷、替格雷洛、替格瑞洛		那个朋友 (PY)
磷酸二酯酶阻断剂	双嘧达莫		二双
整合素受体阻断剂 (血小板膜糖蛋白受体阻断剂)	单克隆抗体	阿昔单抗	替你整合
	非肽类抑制剂	替罗非班	
	合成肽类抑制剂	依替非巴肽	
血小板腺苷环化酶刺激剂	肌苷、前列环素		
血栓烷合成酶抑制剂	奥扎格雷		

## » 第四节 抗血小板药

### 第一亚类 环氧酶抑制剂

机制	使血小板的环氧酶（COX）乙酰化，减少血栓素TXA2 的生成，对TXA2 诱导的血小板聚集产生不可逆地抑制作用
作用特点	<p>1、所有急性缺血性心血管事件的患者，如：心肌梗死、不稳定型心绞痛、缺血性脑卒中、一过性脑缺血发作等，若无禁忌，应尽快给予阿司匹林，每日150-300mg，1-7日后每日75-150mg，长期服用</p> <p>2、阿司匹林已成为心血管事件一、二级预防的“基石”</p> <p>A、不进行溶栓患者——脑卒中后尽早（48h内）开始使用</p> <p>B、溶栓患者——溶栓24h后使用阿司匹林，或阿司匹林与双嘧达莫复合制剂每日150-300mg，4周后每日75-150mg，长期服用</p> <p>3、小剂量抗血小板，大剂量解热镇痛药</p>

## » 第四节 抗血小板药

第一亚类      环氧酶抑制剂

不良反应	为您扬名易
用药监护	<p>用药监护——应对阿司匹林抵抗</p> <p>(1) 应用最佳剂量75-100mg/d。尽量服用肠溶阿司匹林制剂。</p> <p>(2) 避免服用其他非甾体抗炎药。</p> <p>(3) 控制血压(<math>\leq 140/90\text{mmHg}</math>)、血糖、血脂达标。</p> <p>对2型糖尿病、血脂异常者注意筛查胰岛素抵抗、肥胖等因素的干扰。</p>



## » 第四节 抗血小板药

### 第二亚类      二磷酸腺苷P2Y<sub>12</sub> 受体阻断剂

机制	阻断血小板二磷酸腺苷P2Y <sub>12</sub> 受体，抑制血小板聚集		
作用特点	氯吡格雷	3h血药浓度达峰值	1、用于新近心肌梗死、脑卒中、周围动脉病变患者 2、阿司匹林过敏患者，氯吡格雷可替代阿司匹林
	噻氯匹定	24-48h作用才显现	
	替格瑞洛	起效快速	作用直接、迅速、可逆，第一个在所有急性冠脉综合征人群中均能降低心血管事件发生和死亡率的抗血小板药

## » 第四节 抗血小板药

### 二、用药监护

（一）警惕潜在的相互作用可抵销氯吡格雷对心血管的保护作用

阿司匹林、氯吡格雷——不良反应：诱发胃灼热、胃肠黏膜溃疡和出血

故：合用PPI——降低再出血的风险

但：氯吡格雷+PPI合用——增加心脏突发事件及病死率

改进措施：

（1）PPI改用雷贝拉唑、泮托拉唑

H<sub>2</sub>受体阻断剂（雷尼替丁、法莫替丁（不可用西咪替丁））

胃粘膜保护剂（米索前列醇、硫糖铝）

（2）选用不经CYP2C19酶代谢，不受PPI影响的抗血小板药——替格瑞洛替代

（3）两种药间隔2 个血浆半衰期服用（晨起氯吡格雷、睡前服用PPI）

## » 第四节 抗血小板药

### （二）正视抗血小板药的“抵抗”问题

常规剂量的氯吡格雷治疗者约有4%—30%出现氯吡格雷抵抗或称“治疗反应变异”（治疗低反应或无反应性）。

应对：1、增加剂量，首剂量600mg，继以75mg/d维持剂量。

2、联合应用黏蛋白整合素受体阻断剂——替罗非班

### （三）择期手术者需权衡抗血小板药的应用

（1）应于术前1周停用抗血小板药，否则易致术中出血或术后有穿刺部位出血和血栓形成。

（2）对由创伤、手术和其他病理情况而致的出血危险增加时——禁用抗血小板药，以减少患者的出血量。

2019

5073

## » 第四节 抗血小板药

### 第三亚类 磷酸二酯酶抑制剂

机制	抑制磷酸二酯酶对cAMP的降解作用,使血小板内CAMP浓度增高而产生抗血小板作用		
代表药物	双嘧达莫	1、增强前列环素活性,抑制血小板聚集,故,人体存在前列环素时才有效。当前列环素缺乏或应用了大剂量的阿司匹林时则无效。 2、与小剂量阿司匹林联用用于脑卒中二级预防	用于治疗缺血性心脏病时,可能发生“冠状动脉窃血”,导致病情恶化
	西洛他唑		

## » 第四节 抗血小板药



最佳选择题 2016A

可使血小板内环磷腺苷(CAMP) 浓度增高而产生抗血小板作用的药品是

- A. 阿司匹林
- B. 氯吡格雷
- C. 双嘧达莫
- D. 替罗非班
- E. 噻氯匹定

答案：C

2019

5073

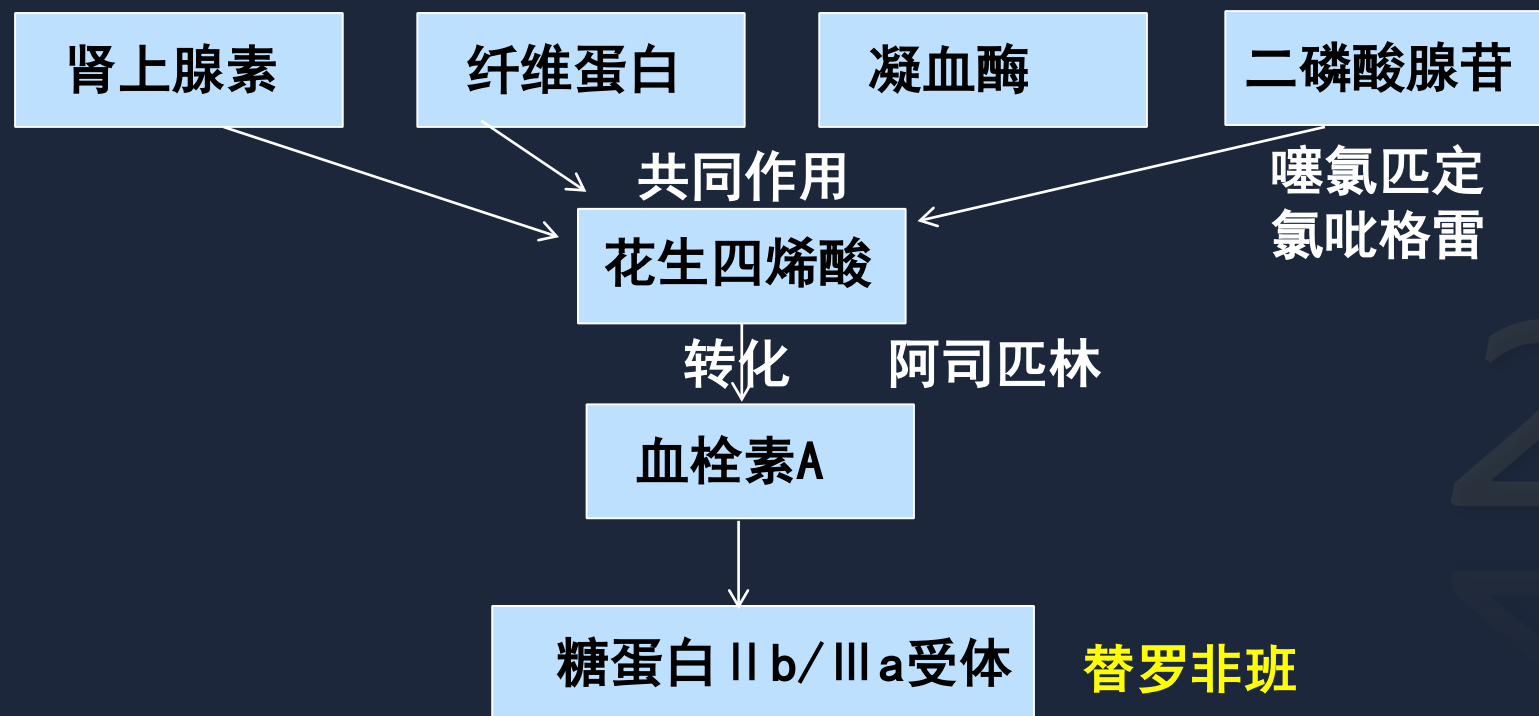
## » 第四节 抗血小板药

第四亚类 整合素受体阻断剂

作用特点——用于各种因素导致的血小板聚集

替罗非班——抑制纤维蛋白原与血小板膜表面糖蛋白 II b/III a受体的结合，

阻碍血小板相互结合并凝集成团，阻断血小板聚集最后共同通路



## 第五节 抗贫血药

贫血——单位容积的血液中，红细胞计数、血红蛋白量或红细胞比积  
低于正常值者

分类	发病机制及特点	治疗
缺铁性贫血	体内铁元素缺乏，使血红蛋白合成减少，但红细胞不低	铁剂
巨幼红细胞性贫血	体内缺乏叶酸和维生素B <sub>12</sub> 等造血因子，使幼稚红细胞在发育中的脱氧核糖核酸(DNA)合成出现障碍，细胞的分裂受阻，形成畸形的巨幼红细胞，并伴有神经症状(神经炎、神经萎缩)。	叶酸 维生素B <sub>12</sub>
	应用叶酸拮抗剂甲氨蝶呤、乙胺嘧啶所引起	亚叶酸钙

## 第五节 抗贫血药

### 第一亚类 铁 剂

代表药物	硫酸亚铁、富马酸亚铁、琥珀酸亚铁
机制	补充二价铁
适应症	以口服制剂为首选，以吸收较高的亚铁制剂为首选
不良反应	口服： 铁剂有收敛性，常见恶心、胃部或腹痛、腹泻、便秘、黑便、食欲减退，口服糖浆铁剂后易使牙齿变黑（使用吸管吸，可以避免）
药物相互作用	1、维生素C与铁剂同服——铁剂吸收增加，但也易导致胃肠道反应 2、口服铁剂与抗酸药（碳酸氢钠、磷酸盐类）抑酸药（质子泵抑制剂、H <sub>2</sub> 受体阻断剂），抑制吸收 3、与含鞣酸的药物或饮料同用——易产生沉淀而影响吸收。



## 第五节 抗贫血药

### 二、用药监护

#### (一) 选择二价铁

(1)对胃酸缺乏者，宜与稀盐酸并用，有利于铁剂的解离

(2)维生素 C ——还原剂——促进铁转变为二价铁，或与铁形成络合物，从而促进吸收——口服铁剂应同时并用维生素 C。

#### (二) 注意预防铁负荷过重

误服、摄入量过大或使用铁制品来煎煮酸性食物——血循环中游离铁过量——细胞缺氧、酸中毒、休克

处理——洗胃和对症治疗——去铁胺

2019

5073

## » 第五节 抗贫血药

### 二、用药监护

#### (三) 选择适宜的病期、疗程和监测

(1) 妊娠期妇女补充铁剂以在妊娠中、后期最为适当

(此时铁摄入量减少而需要量增加)

(2) 补充铁剂在血红蛋白恢复正常后，仍需继续服用 3-6 月，以补充缺失的

贮存铁量。

观察治疗效果：血清铁蛋白与血清铁、血红蛋白、网织红细胞数。

(3) 不应与浓茶同服（含鞣酸，可与铁形成沉淀）

(4) 颗粒剂不宜用开水冲服，以免影响吸收，服用时应用吸管，服后漱口，以防牙齿变黑

## 第五节 抗贫血药

### 第二亚类 巨幼红细胞性贫血治疗药

药物	叶酸、维生素B <sub>12</sub>
机制	叶酸还原成具有活性的四氢叶酸——体内转移“一碳单位”的载体，“一碳单位”与维生素B <sub>12</sub> 共同促进红细胞
适应症	<p>1、叶酸小剂量——用于妊娠期预防胎儿神经管畸形</p> <p>2、叶酸缺乏所致的巨幼红细胞贫血——补叶酸+VB<sub>12</sub></p> <p>3、维生素B<sub>12</sub>缺乏——补VB<sub>12</sub>或VB<sub>12</sub>+叶酸</p> <p>4、恶性贫血——叶酸可以纠正异常血象，但不能改善VB<sub>12</sub>导致的神经损害症状，故以维生素B<sub>12</sub>为主，叶酸为辅。</p> <p>（但恶性贫血患者，VB<sub>12</sub>需肌肉注射，并终身使用，不能静脉注射，口服给药无效）</p>

## 第五节 抗贫血药

药物相互作用	不宜与维生素C同服——维生素C可抑制叶酸吸收，并可破坏维生素B <sub>12</sub> ，导致叶酸与维生素B <sub>12</sub> 活性降低
用药监护	1、服用叶酸、维生素B <sub>12</sub> 治疗后宜补钾 2、妊娠期妇女避免使用维生素B <sub>12</sub> ， 妊娠期妇女叶酸日剂量>0.8mg时，可能给胎儿带来危害

2019  
5073

## » 第五节 抗贫血药



最佳选择题 2017A

1. 应用维生素B12治疗巨幼红细胞性贫血48小时内，应监测的电解质是

- A. 钠
- B. 钾
- C. 锂
- D. 钙
- E. 锌

答案：B

2019

5073

## 第五节 抗贫血药



配伍选择题 2016B

- A. 维生素B1
- B. 维生素B2
- C. 维生素B12
- D. 依诺肝素
- E. 酚磺乙胺

2. 服用叶酸治疗巨幼红细胞贫血，需要同时联合使用的药品是

3. 华法林起效缓慢，深静脉栓塞治疗的初期，需同时联合使用的药品是

答案：CD

2019

## 第五节 抗贫血药

### 第三亚类 重组人促红素

机制	与红系祖细胞表面受体结合，促进红细胞的繁殖和分化，促进红细胞成熟，增加红细胞和血红蛋白含量
适应症	用于慢性肾功能不全合并贫血患者（即：肾性贫血） 内源性人促红素主要由肾脏、肝脏产生，若生成不足，外源补充
相互作用	重组人促红素与大剂量维生素C合用可导致心功能受损
禁忌症	难以控制的高血压患者
用药监护	1、储存和用药前切勿震荡，冷处储存，会改变人促红素二级结构，使人促红素具抗原性，刺激人体产生抗体——出现纯红细胞再生障碍性贫血 2、用药期间监测转铁蛋白、血钾水平 因红细胞造血而动用体内储存铁，应同时补充铁剂 用药后可出现血钾升高（严重者可致高钾血症），应适当调整饮食和剂量，直至血钾恢复正常水平。

## » 第六节 升白细胞药

症状	选药的分类	代表药物
造血功能不足	兴奋骨髓造血功能药	肌苷、利可君、腺嘌呤、小檗胺
对由免疫抗体形成而破坏中性粒细胞者	糖皮质激素	糖皮质激素
肿瘤化疗引起的中性粒细胞减少症	粒细胞集落刺激因子	非格司亭
非恶性淋巴瘤、恶性淋巴瘤、急性淋巴细胞白血病、骨髓移植后促进定位	粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子	沙格司亭



## 第六节 升白细胞药

分类（机制）	药物	作用特点
兴奋骨髓造血功能	肌苷	人体的正常成分，参与体内核酸代谢、能量代谢、蛋白质合成
	腺嘌呤	核酸成分，参与 DNA 和 RNA 合成，连续使用2-4周才显效
	小檗胺	促进造血功能，增加末梢白细胞数量。
粒细胞集落刺激因子	非格司亭	1、细胞毒性化疗前后24h禁用沙格司亭和非格司亭
粒细胞-巨噬细胞集落刺激因子	沙格司亭	2、对乙酰氨基酚或非甾体抗炎药可治疗非格司亭导致的骨痛 3、非格司亭不宜与抗肿瘤药物合用，停用化疗药1-3日后给药

# 感谢观看

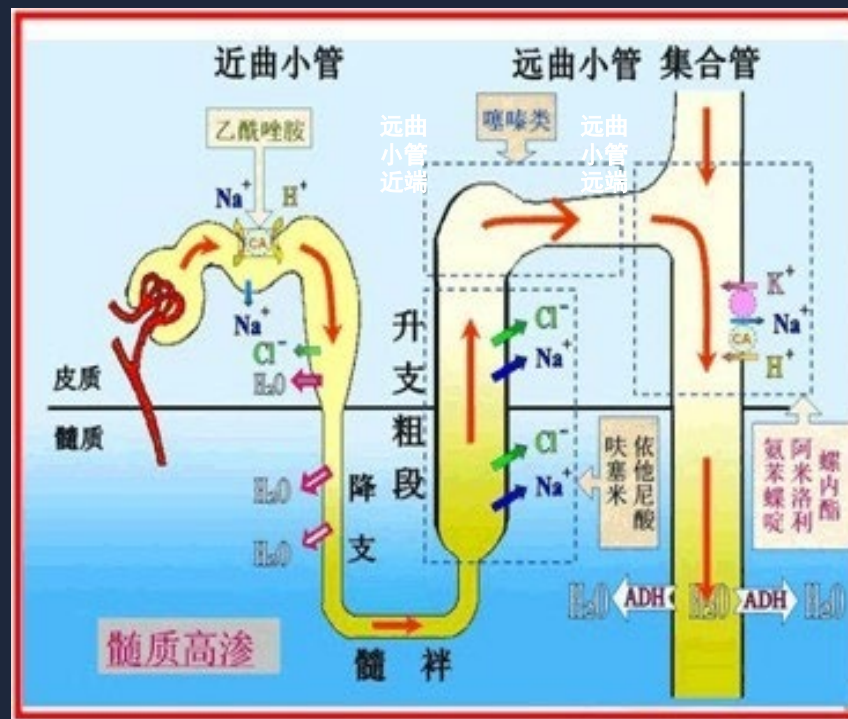
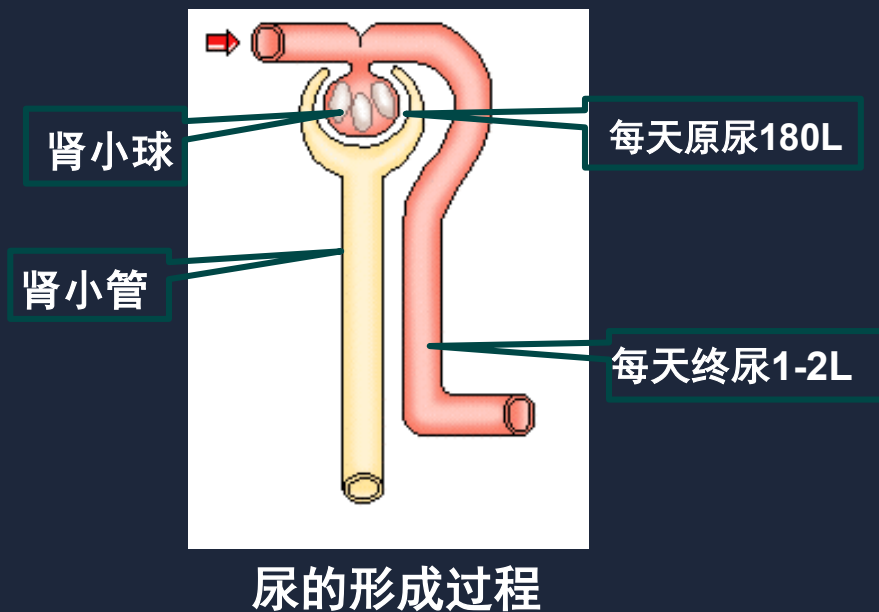
---

请继续关注，精彩课程内容待续……

2019

5073

## 第七章 利尿剂与泌尿系统疾病用药



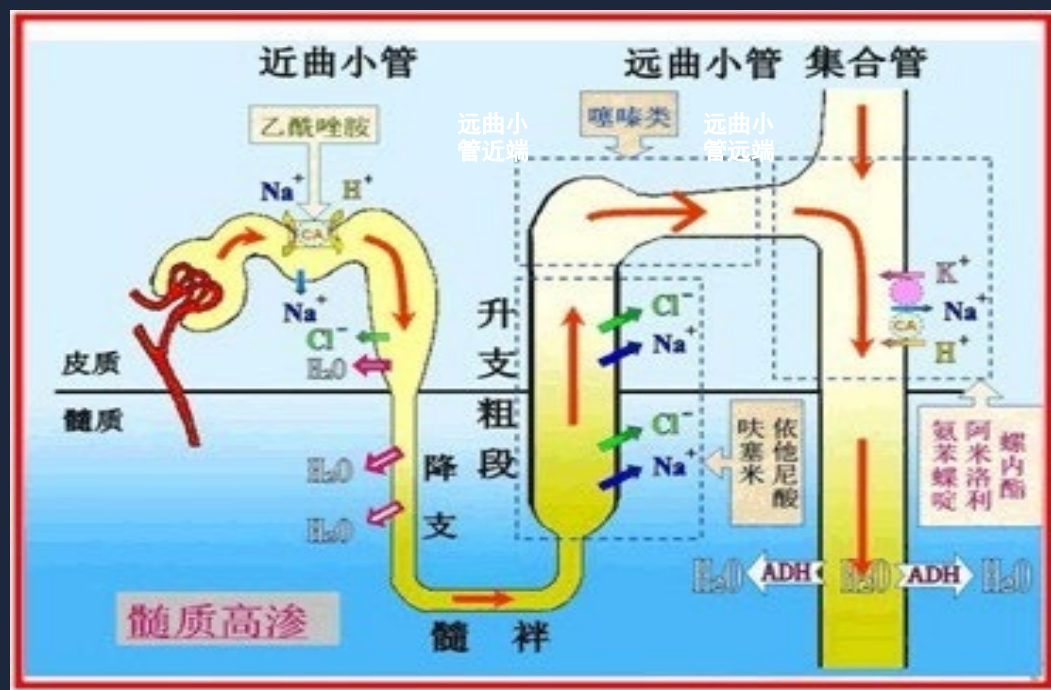
## 第一节 利尿剂

效能	分类	肾小管作用部位	作用机制	代表药物
速效	袢利尿剂	髓袢升支粗段	干扰 $\text{Na}^{+}-\text{K}^{+}-2\text{Cl}^{-}$ 同向转运系统	呋塞米、布美他尼、依他尼酸
中效	噻嗪类利尿剂	远曲小管近端	抑制 $\text{Na}^{+}-\text{Cl}^{-}$ 同向转运系统	噻嗪类、吡达帕胺、氯噻酮
低效	留钾利尿剂	远曲小管远端与集合管	直接阻滞肾小管管腔 $\text{Na}^{+}$ 通道	氨苯喋啶、阿米洛利
			醛固酮受体抑制药	螺内酯、坎利酸钾
极弱	碳酸酐酶利尿剂	近曲小管	抑制碳酸酐酶	乙酰唑胺

## 》第一节 利尿剂

### 第一亚类 碳酸酐酶抑制剂

——近曲小管



2019

## ➤ 第一节 利尿剂

### 第一亚类 碳酸酐酶抑制剂

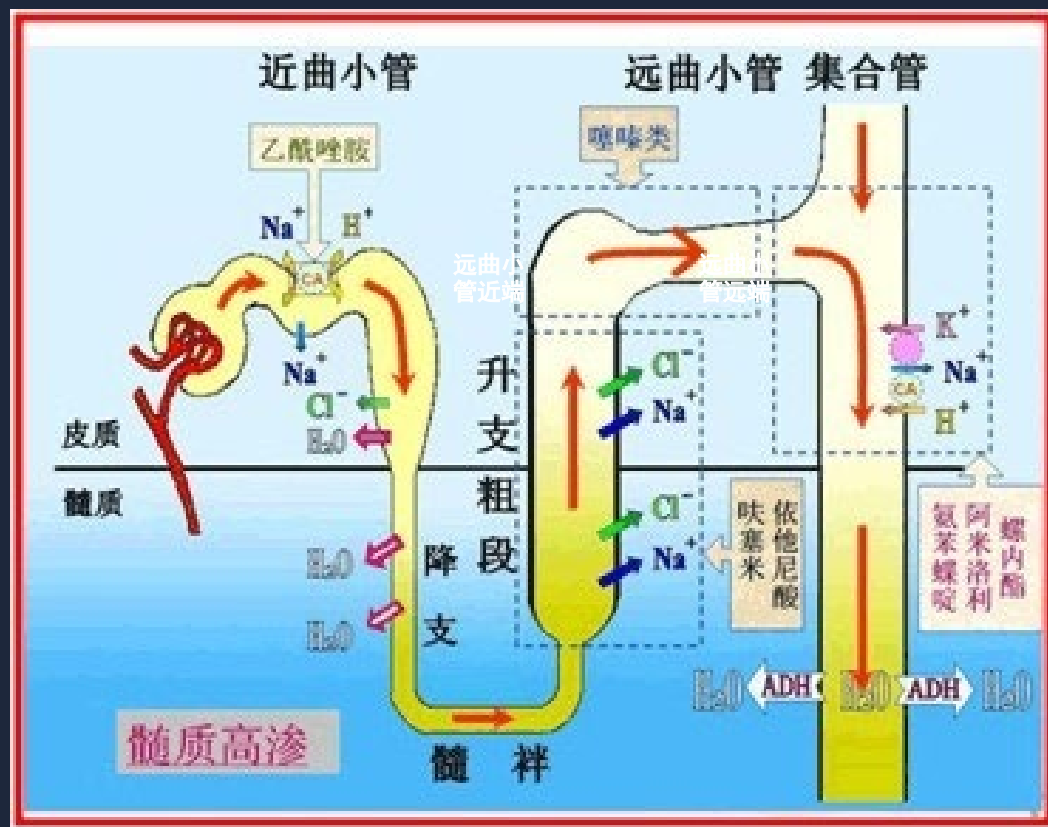
#### ——近曲小管

机制	抑制细胞内碳酸酐酶，降低细胞内H <sup>+</sup> 产生，减少H <sup>+</sup> -Na <sup>+</sup> 交换，Na <sup>+</sup> 减少、水重吸收减少
代表药物	乙酰唑胺
适应症	1、治疗各种青光眼（减少房水生成，降低眼内压） 2、伴随水肿的妊娠子痫
注意事项	长期使用乙酰唑胺，要补充碳酸氢盐。

## 》第一节 利尿剂

### 第二亚类 袢利尿剂

——髓袢升支粗段



# >> 第一节 利尿剂

## 第二亚类 袢利尿剂

——髓袢升支粗段

机制	抑制髓袢升支粗段 $\text{Na}^+-\text{K}^+-2\text{Cl}^-$ 同向转运子，抑制 $\text{NaCl}$ 重吸收，排出尿液。
代表药物	呋塞米、布美他尼、依他尼酸
适应症	(1) 急性肺水肿和脑水肿 (2) 急、慢性肾衰竭——首选 无尿者——禁用 (3) 明显液体潴留心力衰竭——首选 (4) 肝硬化腹水。 (5) 加速某些毒物的排泄。 (6) 高 $\text{Ca}^{2+}$ , $\text{K}^+$ , $\text{Mg}^{2+}$ 血症，稀释性低 $\text{Na}^+$ 血症



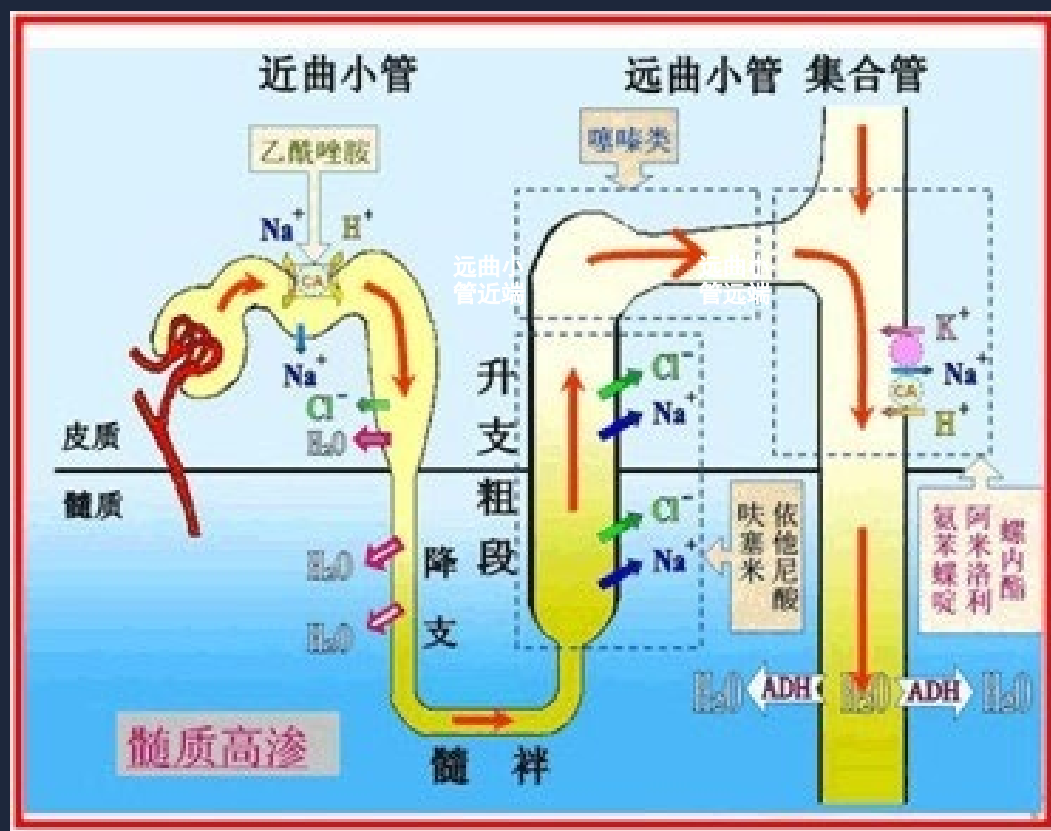
## 》第一节 利尿剂

不良反应	<p>1. 水、电解质紊乱： 过度利尿——低血容量、低钠、低钙、低镁、低钾、低氯性碱中毒。</p> <p>2. 长期使用高尿酸血症</p> <p>3. 糖尿病患者对胰岛素敏感性下降</p> <p>4. 耳毒性——剂量依赖性耳聋。常发生于快速静脉注射。</p> <ul style="list-style-type: none"><li>●依他尼酸——最易引起，可发生永久性耳聋。</li><li>●布美他尼——耳毒性最小——适用于听力有缺陷及急性肾衰者。</li></ul> <p>5. 过敏反应（因为有磺酰胺基） 依他尼酸——不含有磺酰胺基——很少过敏。</p>	
药物相互作用	氨基糖苷类 利尿剂+第一、二代头孢菌素类 顺铂	耳毒性加重

## 第一节 利尿剂

### 第三亚类 噻嗪类利尿剂

——远曲小管近端



## 》第一节 利尿剂

### 第三亚类 噻嗪类利尿剂

#### ——远曲小管近端

机制	抑制远曲小管初段的 $\text{Na}^+$ - $\text{Cl}^-$ 共转运子功能，减少 $\text{Na}^+$ 、 $\text{Cl}^-$ 和水的排出。
	中效利尿剂： 效能高，作用短——中效
代表 药物	噻嗪类——**噻嗪 结构：噻嗪环+磺胺结构
	类噻嗪类——吲达帕胺、氯噻酮（氯酞酮）、美托拉宗 结构：无噻嗪环，有磺胺结构

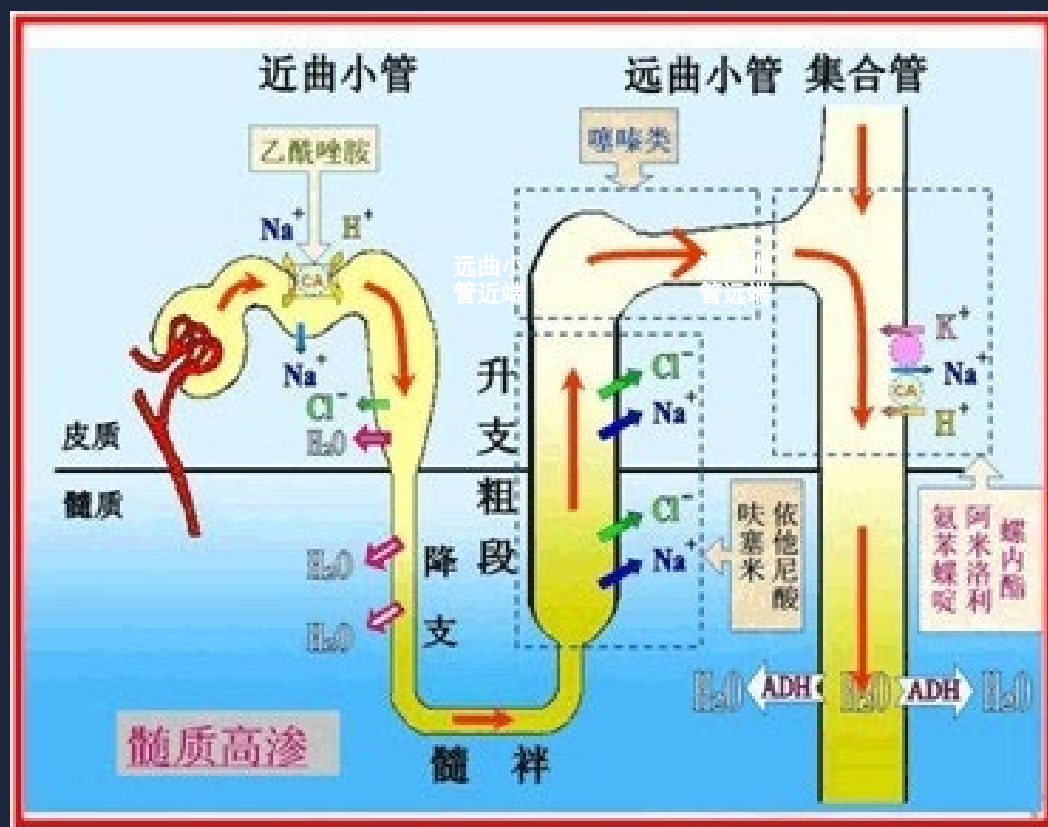
## 》第一节 利尿剂

适应症	<p>氢氯噻嗪</p> <ol style="list-style-type: none"><li>1. 水肿性疾病、充血性心力衰竭（轻中度的水肿，严重的必须袪利尿剂）</li><li>2. 高血压——低剂量可提供接近全效的降压作用<ul style="list-style-type: none"><li>●早期——通过利尿、减少血容量而降压；</li><li>●长期用药——通过扩张外周血管而产生降压作用。</li></ul></li><li>3. 中枢性或肾性尿崩症</li><li>4. 肾结石（结石是因为<math>\text{Ca}^{2+}</math>太多，氢氯噻嗪使血钙增多，尿钙减少，预防含钙盐成分形成结石）</li></ol>
不良反应	<p>共性：高尿酸、高血糖，电解质紊乱，过敏反应</p> <p>不同：呋塞米——低钾，低镁，低钠，低钙</p> <p>氢氯噻嗪——低钾，低镁。低钠，高钙</p> <p>氢氯噻嗪升血糖能力更强</p> <p>呋塞米升尿酸能力更强</p>

## 》第一节 利尿剂

### 第四亚类 留钾利尿剂

——远曲小管远端和集合管



# >> 第一节 利尿剂

## 第四亚类 留钾利尿剂

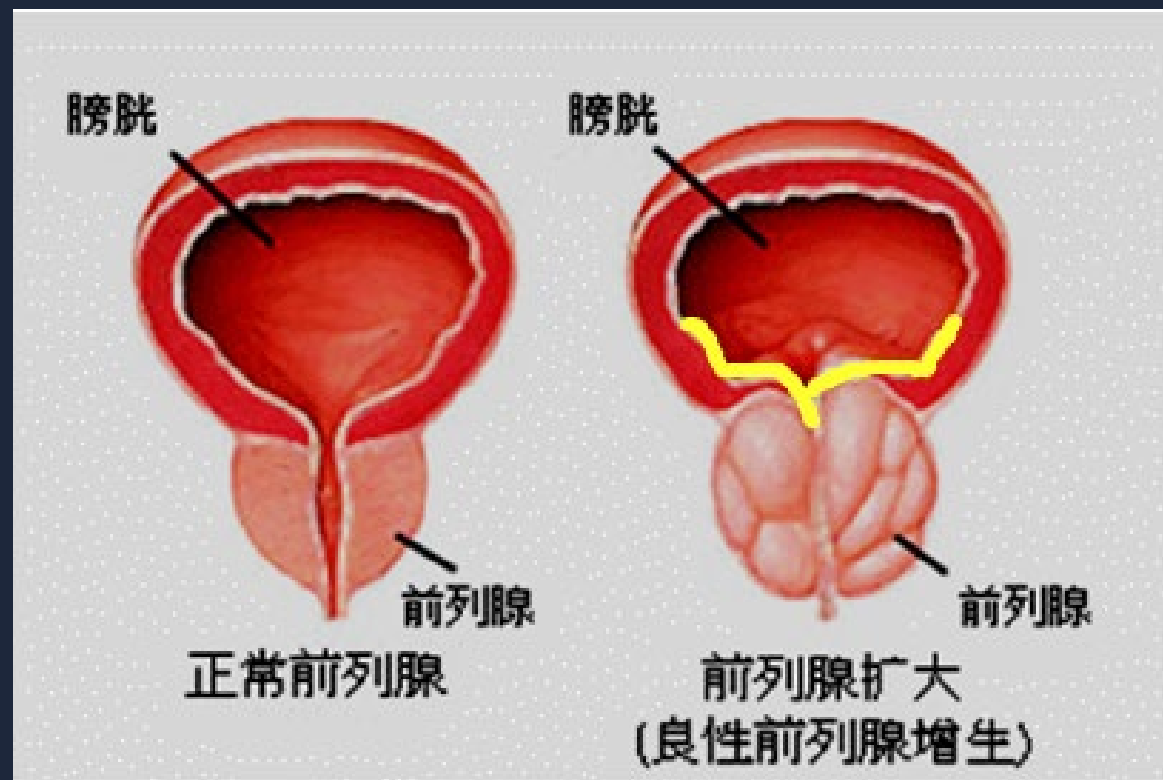
——远曲小管远端和集合管

机制	抑制远曲小管远端和集合管上Na <sup>+</sup> -K <sup>+</sup> 交换，减少K <sup>+</sup> 排出
代表 药物	醛固酮受体阻断剂——螺内酯、依普利酮、坎利酮、坎利酸钾
	肾小管上皮细胞Na <sup>+</sup> 通道抑制剂——氨苯蝶啶、阿米洛利
作用 特点	醛固酮受体阻断剂——醛固酮的竞争性拮抗药——阻止醛固酮-受体复合物的核转位——拮抗醛固酮。 螺内酯：治疗与醛固酮升高有关的顽固性水肿——肝硬化和肾病综合征水肿 <b>最有效</b> 依普利酮：对醛固酮受体具有高度选择性，而对肾上腺糖皮质激素、黄体酮和雄激素受体的亲和性较低—— <b>克服了螺内酯的促孕激素和抗雄激素等副作用</b>

## 》第一节 利尿剂

作用特点	肾小管上皮细胞钠离子通道抑制剂： 阿米洛利 ——保钾利尿剂中作用最强。 氨苯蝶啶 ——半衰期较短，每天需多次给药。
不良反应	1. 高钾血症——心律失常为首发表现。 （用药期间，随访血钾和心电图） 2. 性激素异常——依普利酮除外 男性乳房发育、阳痿、性功能减退； 女性乳房胀痛、声音变粗、毛发增多、月经失调、性功能下降。

## 》 第二节 抗前列腺增生药



2019  
5073



## 》 第二节 抗前列腺增生药



2019

5073

## ➤ 第二节 抗前列腺增生药

	机制	特点	适用情况
$\alpha_1$ 受体阻断剂	阻滞分布在前列腺和膀胱颈部平滑肌 $\alpha_1$ 受体， <b>松弛平滑肌，缓解膀胱出口压力——减少动力因素</b>	治标	<b>起效快</b> ，适用急性症状者
5 $\alpha$ 还原酶抑制剂	抑制5 $\alpha$ 还原酶，进而 <b>抑制双氢睾酮产生——前列腺上皮细胞萎缩</b> ，缩小前列腺体积——减少静力因素	治本	<b>起效慢</b> ，适用前列腺增大40g患者，长久用药甚至终身

## 第二节 抗前列腺增生药

	分类	代表药物	不良反应	作用特点
α <sub>1</sub> 受体阻断剂	第一代 非选择性 α <sub>1</sub> 受体阻断剂	酚苄明	体位性低血压	48小时起效
	第二代 选择性 α <sub>1</sub> 受体阻断剂	哌唑嗪 **唑嗪		
	第三代 高选择性 α <sub>1</sub> 受体阻断剂	坦洛新 西洛多辛		
5α还原酶抑制剂	II型5α还原酶抑制剂	非那雄胺 依立雄胺	性欲减退 阳痿 射精障碍	1. 缩小前列腺体积，降低PSA水平 2. 非那雄胺3个月见效 3. 度他雄胺1个月见效 4. 非那雄胺促进头发生长
	I型、II型5α还原酶抑制剂	度他雄胺		

## » 第二节 抗前列腺增生药

### 二、用药监护

#### 1、明确用药指征——PSA

5 $\alpha$  还原酶抑制剂——仅适用于前列腺增生>40g者（一旦用药，终身用药）

#### 2、联合用药必须有明确指征：

作用机制不同，两种可以联合应用

#### 3、掌握药物治疗的持续时间

5 $\alpha$  还原酶抑制剂作用可逆，维持用药时间必须长久，甚至终身。

非那雄胺、依立雄胺——起效慢，见效时间3~6个月；

度他雄胺（双重作用）——显效快，1个月内。1个月缓解症状， 2周

降低

双氢睾酮水平，缩小前列腺体积20—30%，显著降低前列腺癌的发生率。

2019

5073

## 》 第三节     治疗男性勃起功能障碍药

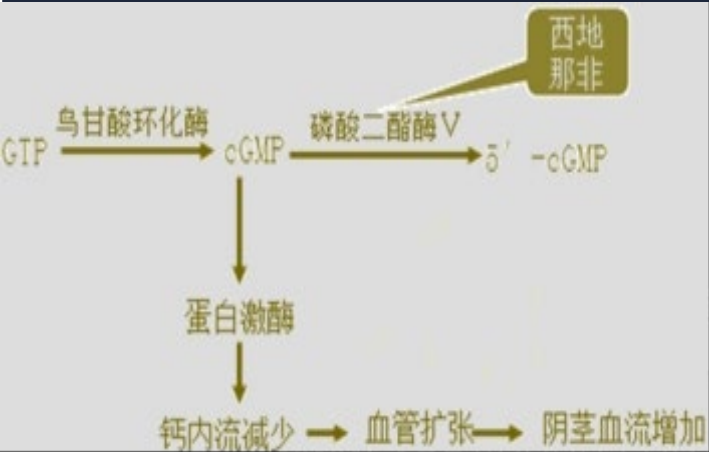
一线	选择性5型磷酸 二酯酶(PDE5)抑制剂(XX那非) 雄激素水平降低者——十一酸睾酮
二线	阴茎海绵体内药物注射或经尿道给药罂粟碱、酚妥拉明、前列腺素E1
三线	手术

2019  
5073

# >> 第三节 治疗男性勃起功能障碍药

## 第一亚类 5型磷酸二酯酶(PDE5)抑制剂

代表药物	西地那非、伐地那非、他达那非
机制	选择性抑制5磷酸酯酶（PDE5）的活性，激活鸟苷酸环化酶，导致cGMP升高，平滑肌松弛，海绵窦扩张，血液流入
作用特点	1. 脂溶性：西地那非、伐地那非，为脂溶性药物他达那非吸收不受油脂性食物的影响 2. 蛋白结合率：西地那非、伐地那非，作用时间短，4h他达那非作用时间长，24h 3. 性生活前1h服用，治疗阴茎勃起功能障碍



## » 第三节 治疗男性勃起功能障碍药

不良反应	<ol style="list-style-type: none"><li>1. 头痛、面部潮红</li><li>2. 光感增强，视物模糊、复视、蓝绿色盲</li><li>3. 低血压</li></ol>
用药监护	<ol style="list-style-type: none"><li>1. 硝酸酯类药（硝酸甘油、硝普钠、其他有机硝酸酯类）同时使用，导致严重的低血压；</li><li>2. 勃起功能正常者无效（不是壮阳药，对正常人没有意义）；</li><li>3. 诱发心脏疾病的风险；</li><li>4. 对视力的影响（蓝绿色盲）。</li></ol>

## 》 第三节 治疗男性勃起功能障碍药

### 第二亚类 雄激素

代表药物	十一酸睾酮、丙酸睾酮
机制	睾酮替代治疗： 1. 提高性欲，直接兴奋雄激素受体，维持正常性冲动； 2. 激活NO合成酶（NO：性活动的启动因子）
作用特点	1. 显效时间较长、需要几天甚至几周 2. 具有天花板效应，睾酮水平超过上限，增加剂量疗效不增加 3. 十一酸睾酮——治疗男性性功能低下最有效、经济的方法



## 》 第三节 治疗男性勃起功能障碍药

用药监护	<p>1、明确用药指征 补充雄激素前，进行前列腺直肠检查、PSA测定 睾酮水平正常者——不用</p> <p>2、明确给药方法 生理分泌：清晨浓度最大，傍晚浓度最低 丙酸睾酮——1周3次 环戊丙酸睾酮——隔周1次</p> <p>3、长期应用高剂量雄激素注意监测电解质、性功能与肝功能。</p> <p>4、采用适宜的给药方法 甲睾酮——舌下含服，剂量减半 丙酸睾酮——深部肌肉注射</p>
------	--

# 感谢观看

---

请继续关注，精彩课程内容待续……

2019

5073