

第五单元 循环系统疾病用药

抗心力衰竭药
抗心律失常药
抗心绞痛药
抗高血压药
调血脂药

第一节 抗心力衰竭药

主要药物：

- () 强心苷类——减轻症状和改善心功能。
- () 利尿剂。
- () 醛固酮受体阻断剂——螺内酯。
- () β 受体阻断剂——第二节。
- () 血管紧张素转换酶抑制剂 ()，显著降低死亡率——第四节。
- () 血管紧张素 II 受体阻断剂 ()，与 相近——用于因严重咳嗽而不能耐受 者——第四节。

第一亚类 强心苷类正性肌力药

一、药理作用与临床评价

(一) 作用特点

机制——抑制衰竭心肌细胞膜上 酶，使细胞内 水平升高，促进 交换，提高细胞内 水平——正性肌力。

强心苷正性肌力作用的机制：

- ①抑制心肌细胞膜上的强心苷受体 酶活性，导致钠泵失灵；
- ② 双向交换机制。

最终导致心肌细胞内 增加，心肌的收缩加强。

不产生耐受性，是唯一能保持左室射血分数持续增加的药物。

可缓解症状、改善临床状态；

不足——不能减少远期死亡率和改善预后。

- () 地高辛
- () 甲地高辛：效应较强、排泄速度较快、安全性高。
- () 去乙酰毛花苷（西地兰）：溶解性和稳定性好，为常用的注射液。速效。
- () 毛花苷丙（西地兰）：速效。
- () 洋地黄毒苷：长效。经肝脏代谢，受肾功能影响小，可用于肾功能不全者。体内消除缓慢，有蓄积性。

() 毒毛花苷：速效。以原形经肾脏排出，蓄积性低。

临床使用最多——地高辛和去乙酰毛花苷。

地高辛——口服

唯一被 确认能有效治疗慢性心力衰竭的正性肌力药。

更适用于心力衰竭伴有快速心室率的心房颤动患者。

急性心力衰竭

——并非地高辛的应用指征；

应使用其他治疗措施，而地高辛仅作为长期治疗措施的开始阶段而发挥部分作用。

注射液——毛花苷丙

增加急性心力衰竭者心排血量和降低左心室充盈压。

适用于并发快速室率诱发的慢性心力衰竭急性失代偿——尽快控制心室率。

（二）典型不良反应

洋地黄类药治疗指数窄，易发生中毒。

治疗量约为中毒量的 $\frac{1}{10}$ ，最小中毒量为最小致死量的 $\frac{1}{10}$ ——即使轻微的血药浓度变化，也会产生很严重的结果。

不良反应（中毒症状，极其重要！）：

胃肠道症状——洋地黄中毒的信号，表现为：厌食、恶心、呕吐或腹痛。

心血管系统——（ ）心律失常，最多见的是室性早搏、室上性心动过速；（ ）加重心力衰竭。

神经系统——意识丧失、眩晕、嗜睡、烦躁不安、神经异常、亢奋。

感官系统——色觉异常（红 绿、蓝 黄辨认异常）。

【洋地黄类药物——不良反应】

不良反应洋地黄，胃肠反应心失常。

红绿不分成色盲，神经亢奋睡得香。

（三）禁忌证：

预激综合征伴心房颤动或扑动者。

伴窦房传导阻滞、II度或高度房室阻滞又无起搏器保护者。

梗阻性肥厚性心肌病、重度二尖瓣狭窄。

室速、室颤。

急性心肌梗死后，特别是有进行性心肌缺血者。

简记——除了心衰伴有房颤、房扑之外。

（四）药物相互作用——跟各种药物合用，几乎都是增加洋地黄类药物的毒性。

与胺碘酮合用血清地高辛浓度增加 $2 \sim 3$ 倍。处理——剂量应减半。

与噻嗪类和袢利尿剂合用可引起低钾血症和低镁血症，增加洋地黄中毒的危险。

同时口服红霉素、克拉霉素和四环素等，地高辛生物利用度和血药浓度增加。

二、用药监护

（一）药物的选择和患者用药的依从性

（ ）严格审核剂量。

（ ）周内未用过洋地黄苷者，才能按照常规给予。以免重复用药，出现过量 and 中毒。

（ ）毒毛花苷 毒性剧烈，过量时可引起严重心律失常；近 1 周内用过洋地黄制剂者，不宜应用。

（二）关注患者中毒的易感因素

（ ）肾功能损害；肝功能不全者应选用不经肝脏代谢的地高辛；老年患者。

（ ）电解质紊乱——尤其是低钾血症、低镁血症、高钙血症可加大地高辛中毒的危险——心律失常。

（ ）甲状腺功能减退者。

（三）监护临床中毒的症状

（四）辨证对待治疗药物浓度监测

（ ）不能仅凭药物监测来调整剂量。血清地高辛的浓度为 $0.5 \sim 1.0$ ng/ml 相对安全。

（ ）不能单凭药物浓度来判定是否中毒。唯一可靠的方法是停用洋地黄后观察。

三、主要药品

地高辛

【适应证】

- ①急、慢性心力衰竭；
- ②控制心房颤动，心房扑动引起的快速心室率，室上性心动过速。

【注意事项】

- () 定期监测血浆浓度、血压、心率及心律，心电图，心功能，电解质尤其是血钾、镁及肾功能。
- () 不能与含钙注射液合用。
- () 如漏服，尽快服药弥补；如漏服时间超过，就不要补服，以免与下次服用时间靠得太近增加中毒危险。

去乙酰毛花苷

【适应证】

急性心力衰竭，慢性心力衰竭急性加重，控制心房颤动、心房扑动引起的快心室率。

第二亚类 非强心苷类正性肌力药

一、药理作用与临床评价

(一) 作用特点

β 受体激动剂

- () 多巴胺——急性心衰，以及各种原因引起的休克；
- () 多巴酚丁胺——多巴胺无效者。

二者半衰期都较短，需要持续静脉滴注，长期使用易发生耐药性。

磷酸二酯酶 () III抑制剂：米力农、氨力农。

仅限于短期使用，长期使用可增加死亡率。

机制——提高心肌细胞内环磷腺苷 () 水平而增强心肌收缩力，并扩张外周血管。



(二) 典型不良反应

β 受体激动剂

常见——胸痛、呼吸困难、心悸、心律失常、心搏快而有力。

长期用于周围血管病患者——手足疼痛或发冷，局部组织坏死或坏疽。

磷酸二酯酶III抑制剂

米力农较氨力农少见，主要可致：

- ①心律失常
- ②血小板减少

(三) 禁忌证

β 受体激动剂

多巴胺禁用于：

- () 快速型心律失常者。
- () 环丙烷麻醉者——室性心律失常发生的可能性增加。
- () 嗜铬细胞瘤患者。

多巴酚丁胺禁用于：梗阻性肥厚型心肌病患者。

磷酸二酯酶III抑制剂，禁用于：

- () 严重低血压。
- () 严重失代偿性循环血容量减少。
- () 室上性心动过速和室壁瘤。
- () 严重肾功能不全。
- () 急性心肌梗死急性期。
- () 严重的阻塞性心瓣膜病。
- () 梗阻性肥厚型心肌病。

(四) 药物相互作用

磷酸二酯酶III抑制剂可加强洋地黄的正性肌力作用，故应用期间不必停用洋地黄。

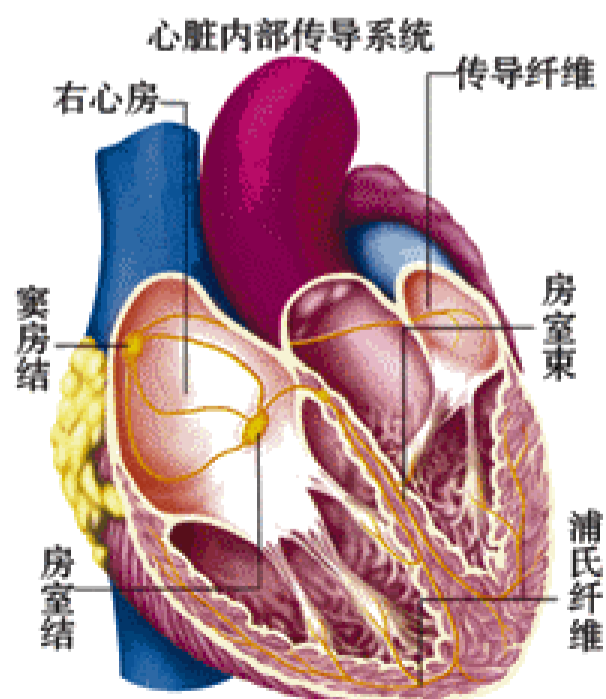
二、用药监护

(一) 多巴胺

- () 应用前须先纠正低血容量；
- () 休克纠正后应减慢滴速；突然停药可发生严重低血压，故应逐渐递减。
- () 有强烈的血管收缩作用，输液过程中不慎渗出血管，可致组织坏死——选用粗大的静脉（如中心静脉）给药；如已发生液体外溢：酚妥拉明。

(二) 磷酸二酯酶抑制剂

- () 在应用氨力农前宜先应用洋地黄制剂控制心室率。
- () 米力农在葡萄糖注射液中不稳定，宜使用 氯化钠注射液。



第二节 抗心律失常药

缓慢型——阿托品、异丙肾上腺素（记忆——阿丙）。

快速型（最常见）——抗心律失常药——通过影响心肌细胞，，的转运，纠正心肌电生理紊乱而发挥作用。

【补充】心脏传导通路——电路图

分类及代表药——重要考点

【总结】		【口诀】		
分类	钠通道阻滞剂	<u>I 类</u>	奎尼丁、普鲁卡因胺	<u>普通卡车装水泥</u>
		<u>I 类</u>	利多卡因、苯妥英钠、美西律	<u>一本万利，多美啊！</u>
		<u>I 类</u>	普罗帕酮、氟卡尼	<u>普通罗汉都怕佛</u>
	II类	普萘洛尔、艾司洛尔（ β 受体阻断剂）		
	III类	胺碘酮、溴苄胺、索他洛尔（延长动作电位时程药）		
	IV类	维拉帕米、地尔硫（卅卓）（钙通道阻滞剂）		
V类	腺苷、天冬酸钾镁和地高辛			

一、药理作用与临床评价

（一）作用特点

钠通道阻滞剂

（）I 类：奎尼丁、普鲁卡因胺——广谱。

主要用于心房颤动与心房扑动的复律、复律后窦律的维持和危及生命的室性心律失常。

不良反应——奎尼丁晕厥、诱发扭转型室速，因此治疗宜在医院内进行。

【补充】奎尼丁——金鸡纳树皮中提取。

（）I 类：

①利多卡因——仅用于室性心律失常。

②美西律——仅用于慢性室性心律失常（急性——利多卡因）。宜与食物同服，可减少消化道反应。

（）I 类——普罗帕酮

适用于室上性和室性心律失常。

β 受体阻断剂——唯一能降低心脏性猝死而降低总死亡率。

（）主要用于室上性和室性心律失常。

①窦性心动过速：尤其伴焦虑者，心肌梗死后、心功能不全、甲亢和 β 受体功能亢进状态者。

②交感神经兴奋相关的室性心律失常

包括运动诱发、心肌梗死、围术期和心力衰竭相关的心律失常。

③室上性快速性心律失常。

④心房扑动和心房颤动：

房扑——不能转复心房扑动，但能有效减慢心室率。

房颤——转复为窦性心律。

⑤起搏器或植入型心律转复除颤器置入后。

分为：

①非选择性 β 受体阻断剂——普萘洛尔：阻断 β_1 和 β_2 受体。

②选择性 β_1 受体阻断剂——比索洛尔、美托洛尔和阿替洛尔——适于肺部疾病或外周循环受损的患者（阿替、比索参加选美）。

③有周围血管舒张功能的 β 受体阻断剂，兼有阻断 α_1 受体，产生周围血管舒张作用——卡维地洛（慢

性心衰一线药）、拉贝洛尔；

④激动 β 受体——周围血管舒张——奈必洛尔。

() 改善心脏功能和增加左心室射血分数 ()；适用于所有慢性收缩性心力衰竭。

() 抗高血压。

延长动作电位时程药 (类)

通过阻断钾通道而延长心脏动作电位时程，从而增加心肌组织的不应期，用于治疗室上性和室性心律失常。

胺碘酮——具有所有四类的活性——广谱。

索他洛尔——II + III类。

钙通道阻滞剂

——维拉帕米和地尔硫(卅卓)。

抑制钙离子内流，延长窦房结和房室结有效不应期，减慢窦房结自律性和房室结传导。

静注——终止阵发性室上性心动过速和左心室特发性室性心动过速；

口服——减慢房颤、房扑和持续性房性心动过速的心室率。

维拉帕米

【适应证】阵发性室上性心动过速，原发性高血压，心绞痛。

【注意事项】

() 可能影响驾车和操作机械的能力。

() 不能与葡萄柚汁同服。

最该掌握的内容【 】

窦性——首选——普萘洛尔 (II类)

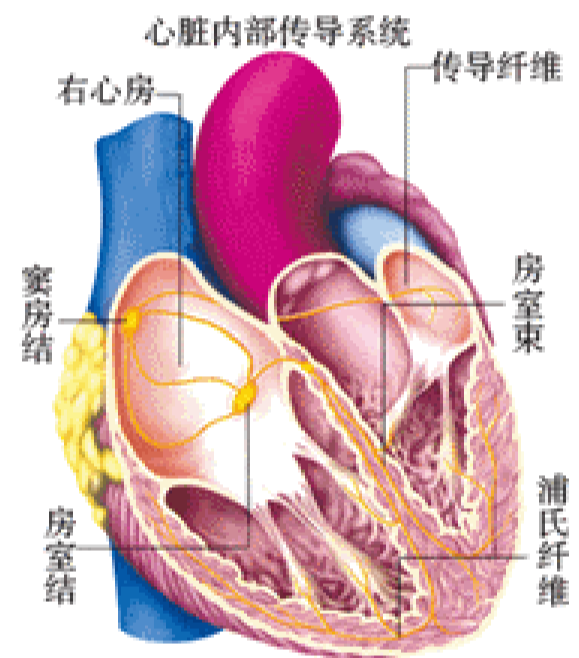
室上性——首选——维拉帕米 (IV类)

急性室性——首选——利多卡因 (I 类)

慢性室性——首选——美西律 (I 类)

广谱——胺碘酮 (III类)

再次回顾——重要考点



【总结 】			【口诀 】	
分类	钠通道阻滞剂	<u>I 类</u>	奎尼丁、普鲁卡因胺	<u>普通卡车装水泥</u>
		<u>I 类</u>	利多卡因、苯妥英钠、美西律	<u>一本万利，多美啊！</u>
		<u>I 类</u>	普罗帕酮、氟卡胺	<u>普通罗汉都怕佛</u>
	II类	普萘洛尔、艾司洛尔 (β 受体阻断剂)		
	III类	胺碘酮、溴苄胺、索他洛尔 (延长动作电位时程药)		
	IV类	维拉帕米、地尔硫(卅卓) (钙通道阻滞剂)		
V类	腺苷、天冬酸钾镁和地高辛			

【小结——抗心律失常药：共有的特点】

() 一个药物可以治疗不同的心律失常：

①普鲁卡因胺——属 I 类，但它的活性代谢产物具III类作用；奎尼丁兼具 I、III类作用；

②索他洛尔——既有 β 受体阻断 (II类) 作用，又有延长 间期 (III类) 作用；

③胺碘酮——同时表现 I、II、III、IV类的作用，还能阻断 α 、 β 受体。

() I、I、I 对不同的心肌细胞有不同的作用：

I 类——作用于心房、心室肌、浦氏纤维、窦房结、房室结、房室旁路——广谱；

I 类——心室肌和浦氏纤维——室性心律失常。

() 有负性肌力作用 (类)

维拉帕米和地尔硫（卅卓）——有器质性心脏病，合并心功能不全或心肌缺血的患者不宜选用。

（ ）均可引起心律失常——不良反应。

（二）典型不良反应

共性不良反应——心律失常：

（ ）缓慢性心律失常：洋地黄类药最为常见。

（ ）折返性心律失常加重：I 类风险最高。

（ ）尖端扭转型室性心动过速：I 类；III类索他洛尔最为常见。

（ ）血流动力学障碍。

常用药品的不良反应 禁忌症。

（ ）美西律——：

眩晕、震颤、运动失调、语音不清、视物模糊等，与食物同服可以减轻。

【禁忌症】II或III度房室传导阻滞者、严重心动过缓及病窦综合征者。

（ ）普罗帕酮——：

眩晕、头痛、运动失调、口腔金属异味。

可致狼疮样面部皮疹和发疹性脓疱病。

【禁忌症】

①窦房结功能障碍、严重房室传导阻滞、双束支传导阻滞；

②严重心力衰竭、心源性休克、严重低血压。

③冠心病心肌缺血、心肌梗死。

（ ） β 受体阻断剂——：

①支气管痉挛，可致气道阻力增加（ β 被阻断）——危及生命。

②严重心动过缓和房室传导阻滞。

③下肢间歇性跛行、雷诺综合征。

④掩盖低血糖反应。

【禁忌症】

①支气管痉挛性哮喘

②症状性低血压

③心动过缓（< 次/分）或II度以上房室传导阻滞

④下肢间歇性跛行——绝对禁忌证。

⑤心力衰竭合并显著水钠潴留需要大剂量利尿剂、血流动力学不稳定需要静脉使用心脏正性肌力药物。

【那么，问题来了】

支气管痉挛、跛行和雷诺综合征、低血糖恶化者怎么办？

——选择性 β_1 受体阻断剂。

比索洛尔、美托洛尔、阿替洛尔 妊娠期间心房颤动——心室率时：

首先考虑——地高辛和维拉帕米，

无效—— β 受体阻断剂。

（ ）胺碘酮——。

①心律失常——加重房颤；快速室性心律失常。

②肺毒性。

③甲状腺功能——减退 亢进；

④光过敏——显著。

【速记】

胺碘酮，含碘甲状腺受伤。

肺中毒，房子里面不见光。

【禁忌症】

() 甲状腺功能异常者。含碘，怀孕期间使用可以导致新生儿甲状腺肿大——妊娠期需权衡利弊。

() II度或III度房室传导阻滞，双束支传导阻滞和 间期延长者。病态窦房结综合征。

() 维拉帕米和地尔硫(卅卓)——。

①心律失常——缓慢性心律失常、暂时窦性停搏

②血压下降

③负性肌力——促发充血性心力衰竭

④肝脏转氨酶升高

【禁忌症】

() 病窦综合征患者和II或III度房室阻滞患者。心房扑动、心房颤动伴显性预激综合征者。

() 严重左心室功能不全和低血压患者。

二、用药监护

(一) 依据药品的排除途径选药

避免药物在肝肾疾病患者中的蓄积。

(二) 停用 β 受体阻断剂——反跳现象。

即原有症状加重或出现新的表现——亦称撤药综合征——处理：逐步缓慢停药。

(三) 特别关照“胺碘酮”同志

剂量的个体差异——多偏向小剂量：

年龄（老年用量小）

性别（女性用量小）

体重（体重轻用量小）

疾病（重症心衰耐量小）

心律失常类型（室上速、心房颤动用量小）

高度重视“胺碘酮”同志的不良反应问题

() 肺毒性——停药、糖皮质激素治疗。

() 严重消化系统不良反应——肝炎和肝硬化。

() 静脉推注可以诱发静脉炎，因此静脉注射最好不要超过 ~ 日，特别注意选用大静脉，最好是中心静脉。继以口服治疗。

() 低血压和心动过缓。

() 甲状腺功能异常。

【特别补充 ——奎尼丁】毒性大。

消化道反应：恶心、呕吐及腹泻。

心血管反应

() 低血压。

() 血管栓塞：治疗房颤——血栓脱落引起。

() 心律失常：抑制心脏——心动过缓甚至停搏。

金鸡纳反应——耳鸣、听力减退、视力模糊、神志不清。（前后联系 ——抗疟疾药：奎宁）

奎尼丁晕厥——意识丧失、呼吸停止、室颤而死亡。

变态反应（过敏）——皮疹、药热、血小板减少。

【小结】奎尼丁的不良反应

奎尼丁，真要命，胃肠反应不算轻。

会晕厥，会过敏，还有金鸡纳反应。

血压下降血管堵，心脏抑制心搏停！

第三节 抗心绞痛药

心绞痛：冠状动脉粥样硬化——斑块——血管管腔狭窄、痉挛或一过性阻塞——心肌急剧、短暂缺血。

【必要补充】

心绞痛分类

①稳定型：与冠状动脉内斑块形成有关。

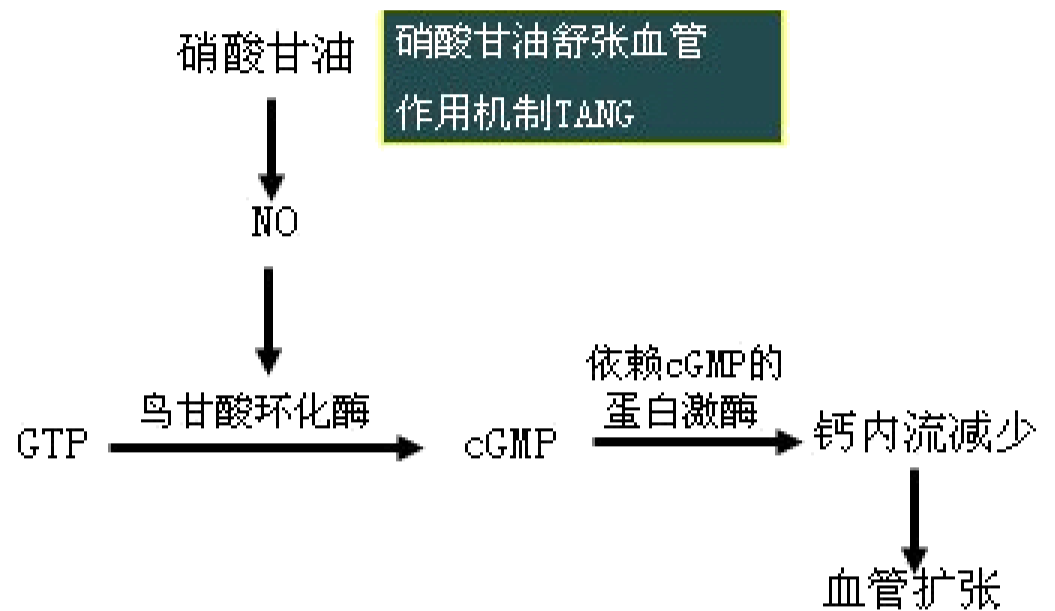
②不稳定型：由冠状动脉内斑块破溃、血小板聚集、血栓形成引起。

③变异型：由冠状动脉痉挛引起。

①硝酸酯类；

②β受体阻断剂（第二节，已讲）；

③钙通道阻滞剂。



第一亚类 硝酸酯类药

适用于各种类型心绞痛。

一、药理作用与临床评价

（一）作用特点

硝酸酯类进入平滑肌细胞分解为一氧化氮（NO），活化血管平滑肌细胞内的鸟苷酸环化酶，产生环鸟核苷单磷酸，它使钙离子从细胞释放而松弛平滑肌。

主要作用：

- （ ） 降低心肌氧耗量。
- （ ） 扩张冠状动脉和侧支循环血管，增加缺血区域尤其是心内膜下的血液供应。
- （ ）降低肺血管床压力和肺毛细血管楔压，增加左心衰竭患者的每搏输出量和心输出量，改善心功能。
- （ ）轻微的抗血小板聚集作用。

常用：硝酸甘油、硝酸异山梨酯以及 单硝酸异山梨酯。

硝酸甘油

①起效最快， ~ 起效， 达最大效应。

②作用持续时间最短——约 ~ ，半衰期仅为数分钟。

③舌下含服吸收迅速完全。

硝酸异山梨酯——中效。

口服起效时间 ~ ，持续时间 ~ 。

单硝酸异山梨酯

~ 起效，作用持续 ~ h；缓释片

～ 起效，作用持续约 。

在胃肠道吸收完全，无肝脏首关效应，生物利用度近 。

亚硝酸异戊酯
起效快，大约 ～ ，维持时间短——用于急性发作。

【如何选择？】

硝酸甘油舌下含服——心绞痛急性发作的首选，疼痛约在 ～ 消失；硝酸异山梨酯舌下含服亦可。

而舌下喷雾起效更快，几乎与静脉注射相近，但不能给予较大剂量（不良反应）。
发作频繁者——静脉给药。持续时间不应超过 ，以免出现耐药。

硝酸异山梨酯、单硝酸异山梨酯——预防缺血发生。
缓解期——缓释或长效制剂，如单硝酸异山梨酯、硝酸甘油皮肤贴片。
长期抗缺血治疗——联合应用β受体阻断剂或钙通道阻滞剂。

（二）典型不良反应

舒张血管——

搏动性头痛；
面部潮红或有烧灼感；
血压下降、晕厥 反射性心率加快；
血硝酸盐水平升高。

（三）禁忌证

- （ ）急性下壁伴右室心肌梗死——注 ；一般心肌梗死是适应症！
- （ ）严重低血压（收缩压< ）。
- （ ）肥厚性梗阻型心肌病、限制性心肌病。重度主动脉瓣和二尖瓣狭窄。心脏压塞或缩窄性心包炎。
- （ ）已使用 型磷酸二酯酶抑制剂药（西地那非等）。
- （ ）颅内压增高。

（四）药物相互作用

与抗高血压药或扩张血管药合用——体位性降压作用增强。禁止联合应用西地那非等 型磷酸二酯酶抑制剂——严重低血压。

与拟交感神经药（去氧肾上腺素、去甲肾上腺素、肾上腺素或麻黄碱）合用——降低本类药的抗心绞痛效应。

增强三环类抗抑郁药的低血压和抗胆碱效应。

二、用药监护

（一）合理使用各种剂型

硝酸甘油——常用片剂供舌下含服；气雾剂舌下喷雾。静脉滴注起效快。
长时间预防——硝酸甘油软膏剂定量涂擦皮肤；透皮贴剂贴敷于皮肤。

- （ ）含服时尽量采取坐位，用药后由卧位或坐位突然站立时必须谨慎——防止发生体位性低血压。
- （ ）使用喷雾剂前不宜摇动，使用时屏住呼吸，最好喷雾于舌下，每次间隔 。
- （ ）不应突然停止用药——避免反跳现象。

（二）防止耐药现象的发生——任何剂型连续使用 都可能。克服——偏离心脏给药方法：

- （ ）舌下含服或喷雾、帖敷持续应用须有 以上的间歇期。
- （ ）口服，保证 ～ 的无或低硝酸酯浓度期。
- （ ）小剂量、间断使用静滴硝酸甘油及硝酸异山梨酯，每日提供 ～ 的无药期。长期连续注射应采用低剂量维持疗效；静脉滴注给药连续超过 者应间隔一定时间给予。

【无硝酸酯覆盖的时段，怎么办？】

加用—— β 受体阻断剂、钙通道阻滞剂。

心绞痛一旦发作——临时舌下含服硝酸甘油。

三、主要药品

硝酸甘油——防治心绞痛，心肌梗死和充血性心力衰竭。

硝酸异山梨酯、单硝酸异山梨酯——冠心病的长期治疗，心绞痛的预防，心肌梗死后持续心绞痛的治疗，与洋地黄、利尿剂联合治疗慢性心功能衰竭。

第二亚类 钙通道阻滞剂

最重要的一句话！

——变异型心绞痛——首选——解除冠状动脉痉挛。

选择性钙通道阻滞剂

①二氢吡啶类——硝苯地平、拉西地平、尼卡地平；

②非二氢吡啶类——地尔硫（廿卓）和维拉帕米。

非选择性钙通道阻滞剂

氟桂利嗪和桂利嗪——主要作用于脑细胞和脑血管，解除脑血管痉挛。

一、药理作用与临床评价

（一）作用特点——“开源节流”。

阻滞细胞膜钙通道，抑制平滑肌 进入血管平滑肌细胞内——松弛血管平滑肌——改善心肌供血；

降低心肌收缩力——降低心肌氧耗。

【临床应用】

变异型心绞痛——最有效。

伴有哮喘和阻塞性肺疾病患者更为适用——扩张支气管平滑肌。

稳定型和不稳定型心绞痛——也有效。

高血压。

外周血管痉挛性疾病——雷诺综合征等。

【两个重要细节】

具有很强的血管选择性——

硝苯地平、氨氯地平、非洛地平和拉西地平——冠心病和高血压。

尼莫地平——缺血性脑血管病、脑血管痉挛、偏头痛。

补充 还有氟桂利嗪和桂利嗪（记忆：你不要莫我高贵的头！）。

抗高血压药对预防脑卒中的强度——

>利尿剂> > > β 受体阻断剂。

（二）典型不良反应

心脏抑制——严重：心脏停搏、心动过缓、房室传导阻滞和心力衰竭；

过度的扩血管——低血压、面部潮红、头痛、下肢及踝部水肿；

反射性交感神经兴奋——心功能不全。

牙龈增生。

硝苯地平——影响驾车和操作机械。

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/546141021012010050>