

(医疗药品管理) 第九章心血管系统疾病 的常用药物

第九章

心血管系统疾病的常用药物

主要内容

- 一、心脑血管疾病概述
- 二、高血压的常用药物
- 三、高血脂的常用药物
- 四、其他疾病

一、心脑血管疾病概述

高血压病

高血脂症冠状动脉粥样硬化

性心脏病

心力衰竭

心律不齐病毒

性心肌炎

缺血性脑血管病、

出血性脑血管病帕

金森病老年痴呆症

常见心脑血管疾病诱因

心脑血管疾病的流行，与社会的发展和人们生活水平的提高是分不开的。

现代人劳累过度心理压力过大不注意合理安排饮食没有养成好的生活习惯较少参加必需的运动抽烟、过量饮酒、肥胖等

这些也都是心脑血管疾病发病的诱因。

二、高血压的常用药物

高血压病 国

JNC-VI(1997):1、2、3期

WHO/ISH(1999): 1、2、3级人
140/90mmHg 第

西医临床:缓进型高血压病和急进型恶性高血压病——

中医临床:肝阳上亢型、痰湿内阻型

阴虚阳亢型、阴阳两虚型 病

高血压病易患人群

- 中、老年人
- 情绪激动、精神紧张的人
- 饮食过咸的人
- 嗜好吸烟的人
- 长期过量饮酒的人
- 生活懒散，缺少运动的人。
- 血糖、血脂升高的人



高血压的并发症

- 高血压病患者由于动脉压持续性升高，引发全身小动脉硬化，从而影响组织器官的血液供应，造成各种严重的后果，成为高血压病的并发症。

在高血压的各种并发症中，以心、脑、肾的损害最为显著。

- 脑血管意外
- 肾动脉硬化和尿毒症高血压合并肾功能衰竭约占10%。
- 高血压性心脏病最终导致心力衰竭。
- 冠心病出现心绞痛、心肌梗死、心力衰竭等。

据世界卫生组织MONICA方案的调查材料，欧美国家成人（35~64岁）患病率在20%以上，同一国家不同种族间患病率也有相差，如美国黑人的高血压患病率约为白人的两倍。

- 我国高血压病的发病率不如西方国家高，但呈升高趋势。

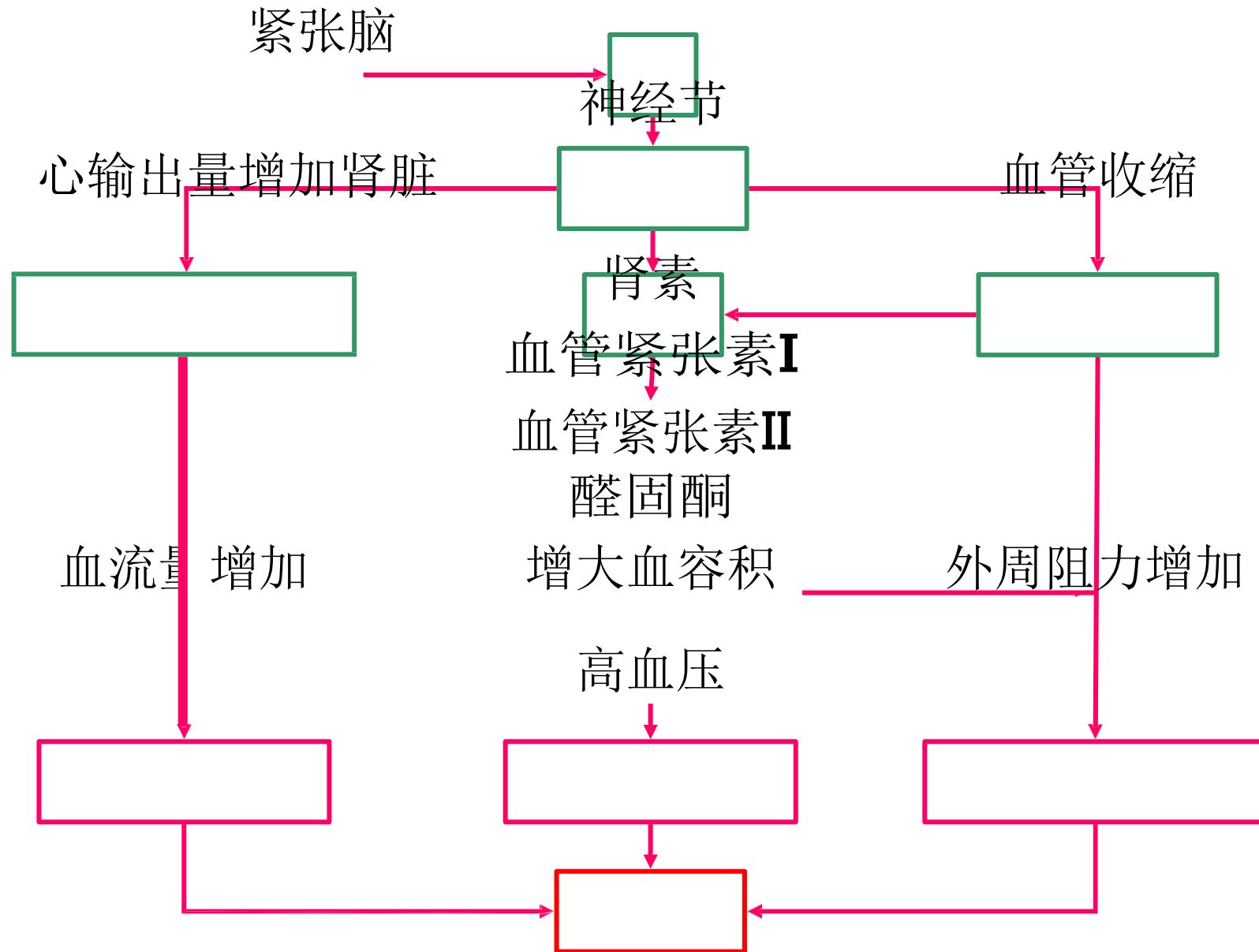
1991年全国的平均患病率为11.88%。

2004年北京市20%

高血压的预防

- 养成健康的生活习惯：劳逸结合，避免过度劳累紧张；要戒烟、少喝酒，因尼古丁和酒精都会令血压升高。控制体重在正常范围。避免进食高糖分、高脂肪和高胆固醇食品。
- 适当运动
- 药物治疗：选用适当的降压药物；服药要规律，不要随便停药，否则易引起血压波动，加重血管损害；降血压不宜过低，以免造成脑缺血甚至脑梗死。
- 定期测量血压：随时观察血压高低，并酌情加减降压药物。
- 低盐饮食：世界卫生组织建议人们每日摄入食盐3-5克。

血压的影响因素及抗高血压药物的作用部位



抗高血压药物按其作用机理分类

作用于**RAS**系统的药物

- 1.血管紧张素转化酶抑制剂
- 2.血管紧张素II受体拮抗剂

作用于离子通道的药物

- 1.钙拮抗剂
- 2.钾通道开放剂

外周肾上腺素能受体拮抗剂

- 1.受体拮抗剂
- 2.受体拮抗剂

抗交感神经药物、血管扩张药物

- 1.利尿药
- 2.影响肾上腺素能神经递质的药物

其他药物

- 3.中枢 α_2 受体激动剂
- 4.作用于毛细小动脉的药物

主要内容

- 抗高血压药物
 - 一、影响**RARS**系统药物
 - 二、交感神经药物
 - 三、血管扩张药物
 - 四、钙离子拮抗剂
 - 五、其他药物

影响RAS系统的抗高血压药

- 血管紧张素转化酶抑制剂**ACEI**
- 血管紧张素**II**受体拮抗剂：氯沙坦
- 肾素抑制剂

药物作用类型	代表药物
含巯基的 ACE 抑制剂	卡托普利 Captopril
含二羧基的 ACE 抑制剂	依那普利 Enalapril
含磷酸基的 ACE 抑制剂	福辛普利 Fosinpril

钙通道阻滞剂

作用机制

药物类型	药物结构类型	作用机制	代表药物
选择性钙通道阻滞剂	1, 4- 二氢吡啶类	阻塞钙通道的入口	硝苯地平
	芳烷基胺类	作用于慢通道内侧,降低慢通道的激活速度	维拉帕米
	苯硫氮卓类	作用于钙通道的变构部位,改变钙通道的构型	地尔硫卓
非选择性钙通道阻滞剂	二苯基哌嗪类		氟桂利嗪
	二氨基丙醇醚类		苜普地尔, 普尼拉明

交感神经药物

主要包括：

中枢作用的降压药物、神经节的阻断药物、
 β_1 -肾上腺素受体拮抗剂、 α_1 -肾上腺素受体拮抗剂、混合 α / β_1 -肾上腺素受体拮抗剂及肾上腺素能神经元阻滞剂。

药物作用类型	代表药物
作用于中枢神经系统的药物	盐酸可乐定胍那苄胍法辛
	莫索尼定利美尼定
作用于神经末梢的药物	利舍平胍乙啶
神经节阻断药	美卡拉明潘必定

血管扩张药

作用机制：血管扩张药为不通过调节血压的交感神经和体液系统而直接松弛血管平滑肌的药物，此类药物具有较强的降压作用，并且由于不抑制交感神经活性，所以体位性低血压作用不明显。

药物作用类型	代表药物
钾通道调节剂	胍屈嗪双胍屈嗪托屈嗪布屈嗪
	米诺地尔
	吡那地尔
NO供体药物	硝酸甘油硝酸异山梨酯（详见抗心绞痛药物）
	硝普钠

利尿药

药物结构类型	代表药物
碳酸酐酶抑制剂	乙酰唑胺
$\text{Na}^+ - \text{Cl}^-$ 协转运抑制剂	氢氯噻嗪
$\text{Na}^+ - \text{K}^+ - 2 \text{Cl}^-$ 协转运抑制剂	呋塞米依他尼酸
肾小管上皮 Na^+ 通道阻断剂	氨苯喋啶
盐皮质激素受体阻断剂	螺内酯

一、影响RAS系统的抗高血压药

肾素—血管紧张素—醛固酮系统RASorRAAS

(**Renin-angiotensin-aldosteronesystem**)

一种复杂、高效调节血流量，电解质平衡以及动脉血压所必需的高效系统。

两个主要部分——肾素和血管紧张素转移酶。

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-Phe-His-Leu-Leu-Val-Tyr-Ser

血管紧张素原Angiotensinogen

肾素Renin

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-Phe-His-Leu

血管紧张素I Angiotensin I

血管紧张素转化酶

ACE Angiotensin-converting enzyme

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-Phe

血管收缩 血压升高

血管紧张素II Angiotensin II

醛固酮 Aldosterone 血容量增加

Arg-Pro-Arg-Gly-Phe-Ser-Pro-Phe-Arg

缓激肽 B

radynin

ACE

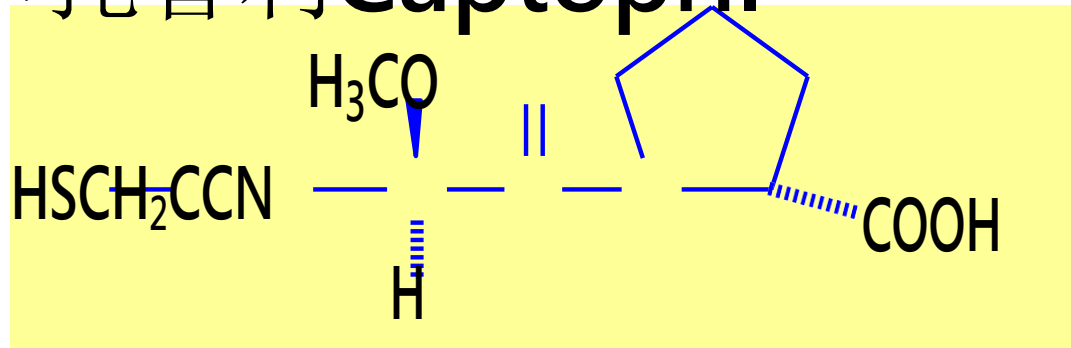
Arg-Pro-Pro-Gly-Phe-Ser-

Pro

血管舒张

血压下降

卡托普利 Captopril



- 分子中有两个不对称碳原子，呈左旋性，为**SS**构型
- 不稳定，见光或在水溶液中，易氧化生成二硫化物
- 鉴别：与亚硝酸作用，生成亚硝酰硫醇酯，呈红色
- 口服后**70%**肠道吸收，以原形或其二硫化物的半胱氨酸结合物从尿中排泄
- 用于高血压和充血性心力衰竭
- 副作用：咳嗽，皮疹，味觉改变



血管紧张素II受体拮抗剂——ARB

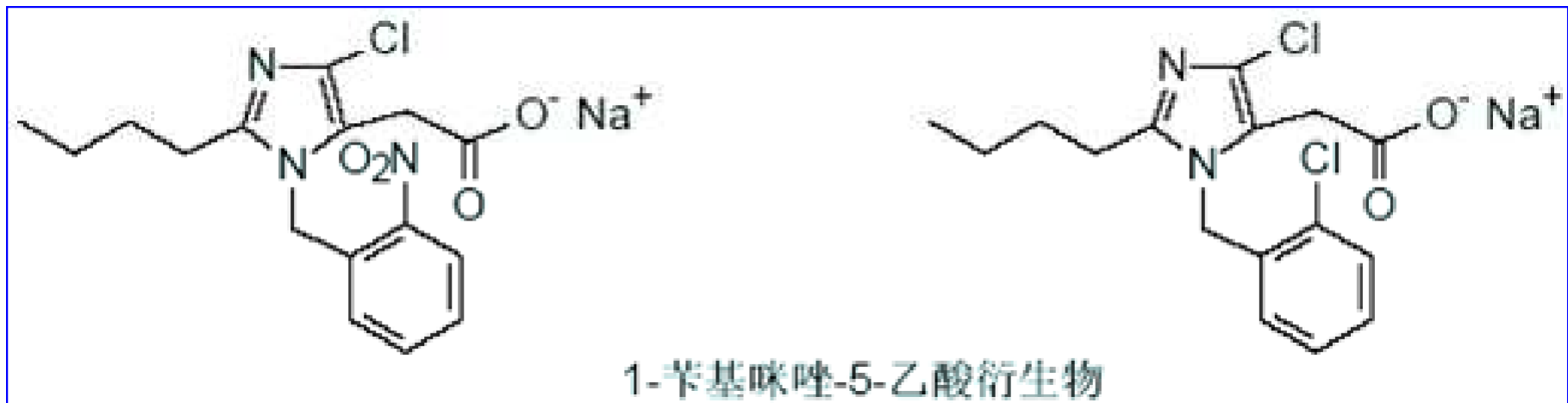
20世纪70年代早期，AII作为阻断高血压蛋白原酶-血管紧张素途径的靶点，以天然激动剂类似物为基础肽类研究

Asp-Arg-Val-Tyr-Ile-His-Pro-PheAII

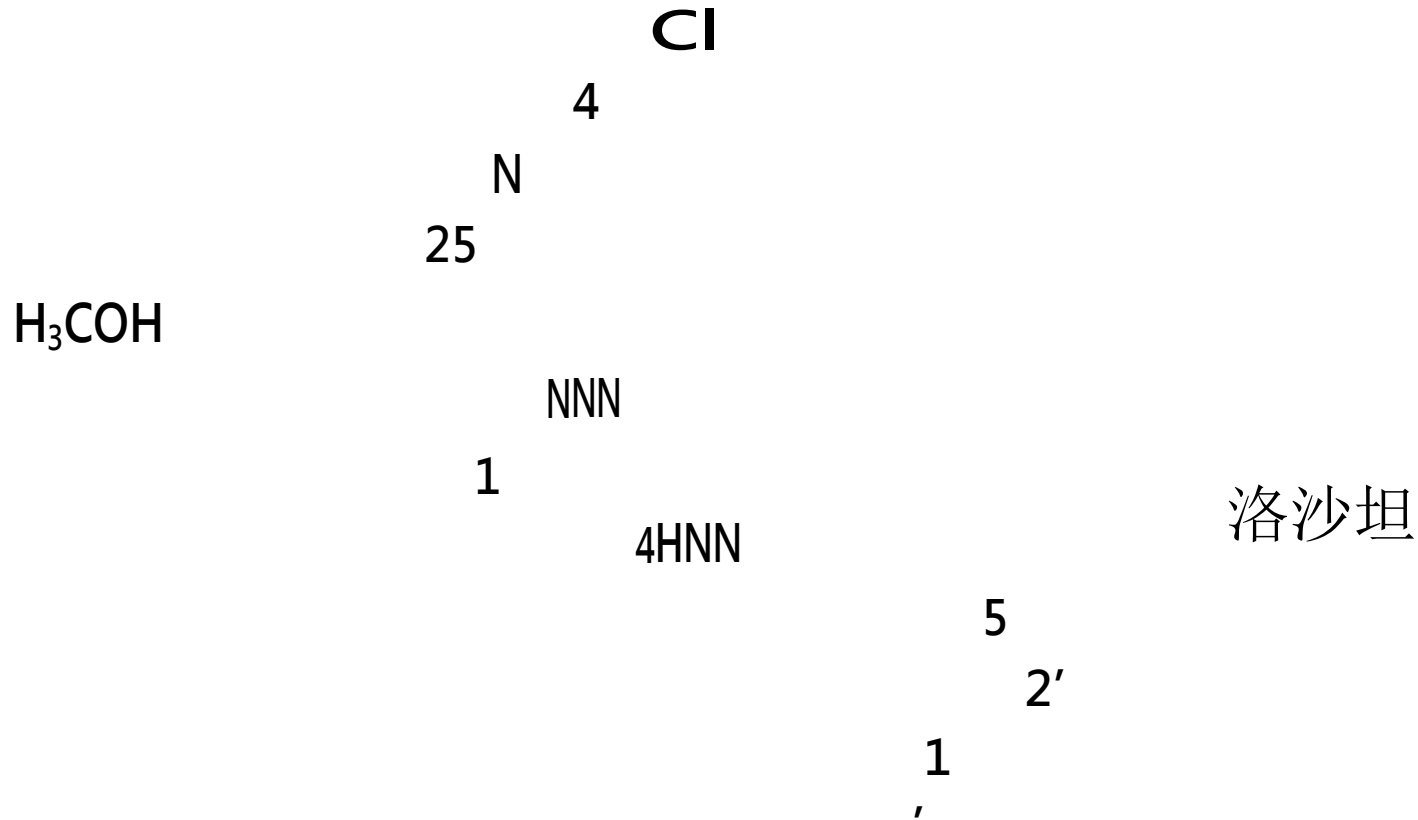
Sar-Arg-Val-Tyr-Val-His-Pro-AlaSaralasin

发现70s发现1-苄基咪唑-5-乙酸衍生物在体外能拮抗血管紧张素II的受体, 作用很弱, 有较好的选择性, 口服吸收差

S-8308



氯沙坦 Losartan



化学名:

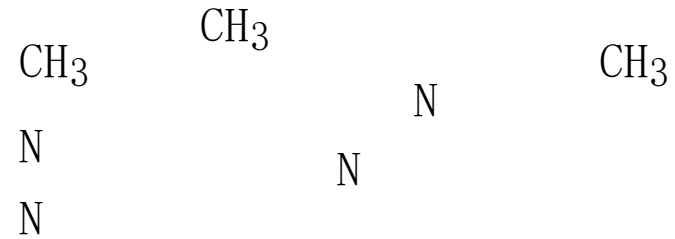
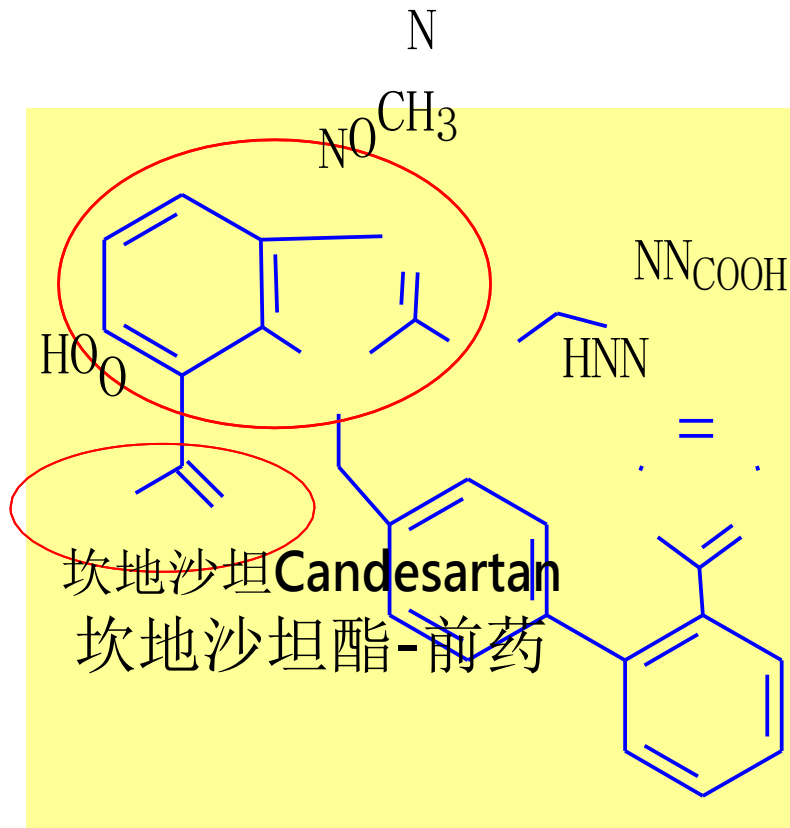
2-丁基-4-氯-1-[[2' - (1H-四唑-5-基) [1, 1' -联苯]-4-基]甲基]-1H-咪唑-5-甲醇

第一个上市的A II 受体拮抗剂

疗效与常用的ACE抑制剂相似, 具有良好的抗高血压、

抗心肌肥厚、抗心衰、利尿作用

血管紧张素II受体拮抗剂

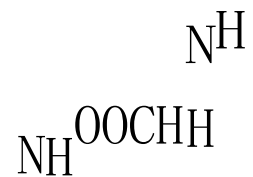


替米沙坦Telmisartan

特点:

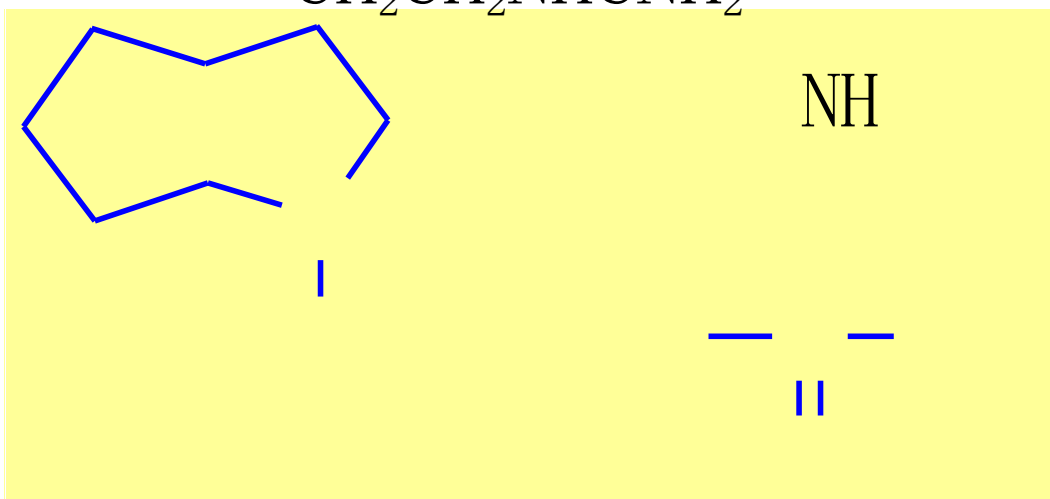
- ★结构中含有苯并咪唑环
- ★提高与受体的疏水结合能力

作用于神经末梢的药物



利舍平

胍乙啶



钙通道阻滞剂的分类

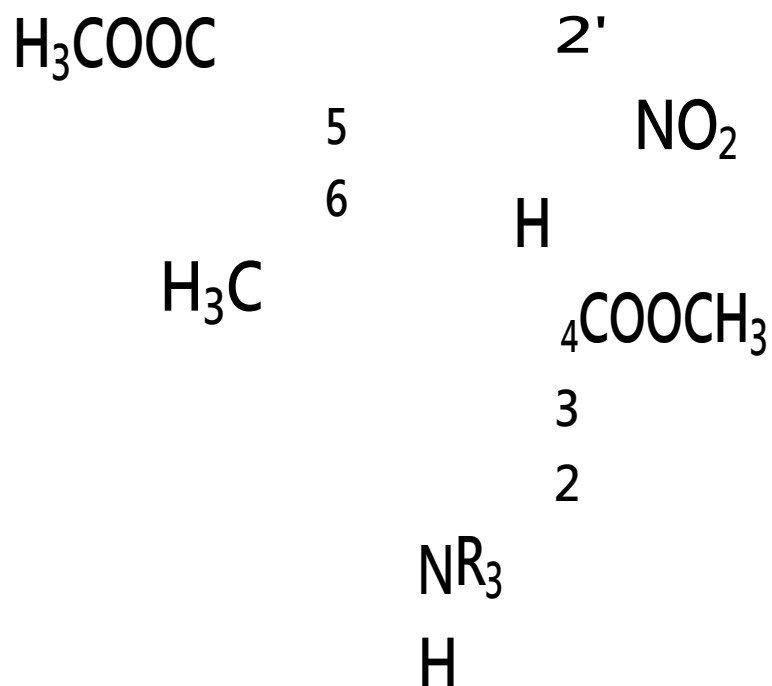
药物类型	药物结构类型	作用机制	代表药物
选择性钙通道阻滞剂	1, 4-二氢吡啶类	阻塞钙通道的入口	硝苯地平
	芳烷基胺类	作用于慢通道内侧,降低慢通道的激活速度	维拉帕米
	苯硫氮卓类	作用于钙通道的变构部位,改变钙通道的构型	地尔硫卓
非选择性钙通道阻滞剂	二苯基哌嗪类		氟桂利嗪
	二氨基丙醇醚类		苜普地尔, 普尼拉明

临床应用:

抗心绞痛、抗心率失常、抗高血压、其它作用

硝苯地平 Nifedipine

二氢吡啶类



作用特点:

- ★特异性高
- ★有很强的扩血管作用
- *在整体条件下不抑制心脏，用于预防和治疗冠脉痉挛、高血压、心肌梗塞等。可与β₁-受体阻滞剂、强心甙合用，
- ★但不用于抗心律失常。

化学名:

2, 6-二甲基-4-(2-硝基苯基)-1, 4-二氢-3, 5-吡啶-二甲酸二甲酯

1, 4-Dihydro-2, 6-dimethyl-4-(2-nitrophenyl)-pyridin-3, 5-dicarboxylic acid dimethylester

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/687006200016010005>