

# 呼吸系统常用药物及其使用

平一医药剂科 张梁

```
graph TD; A((呼吸疾病常用药)) -.- B((镇咳药)); A -.- C((祛痰药)); A -.- D((平喘药));
```

## 呼吸疾病常用药

镇咳药

祛痰药

平喘药

# 镇咳药

中枢性镇咳

外周性镇咳

外周和中枢性镇咳

成瘾性

非成瘾性

可待因

右美沙芬

那可丁

喷托维林

# 镇咳药：可待因

- 1、对延髓咳嗽中枢选择性抑制，强而迅速，约为吗啡的1/10；
- 2、兼有镇痛、镇静作用，约为吗啡1/10-1/7
- 3、抑制支气管腺体分泌，使痰液黏稠

口服20min起效，便秘、呼吸抑制，作用持续4-6h；  
长期使用引起依赖；  
易透血脑、胎盘屏障

中毒：针尖样瞳孔

- 1、抗胆碱药：便秘、尿潴留加重
- 2、阿片类、巴比妥类药物，呼吸抑制增加
- 3、阿片受体激动剂，戒断症状

- 1、对本品过敏的患者禁用
- 2、多痰者禁用，防止痰液堵塞气道
- 3、12岁以下儿童禁用；哺乳期妇女禁用；CYP2D6超快代谢者禁用。

- 1、剧烈无痰干咳，对胸膜炎干咳伴胸痛者尤其适应；痰液较多可联用祛痰药
- 2、避免反复使用以免成瘾；
- 3、精麻处方，口服处方时长不可超过3d。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 镇咳药：右美沙芬

- 1、对延髓咳嗽中枢选择性抑制
- 2、镇咳强度与可待因相似或稍强

口服15-30min起效，作用持续3-6h

头晕头痛嗜睡口干；  
过量：神志不清

- 1、胺碘酮、奎尼丁致本品浓度升高；
- 2、氟西汀、单胺氧化酶抑制剂本品不良反应增加；
- 3、中枢神经抑制剂、酒精致中枢抑制增加。

- 1、妊娠3个月内孕妇、有精神病史者及哺乳期妇女禁用
- 2、服用单胺氧化酶抑制剂停药不满2周的患者禁用。

用于各种原因引起的干咳

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 镇咳药：喷托维林

1、外周和中枢性镇咳药，抑制咳嗽中枢、还可使痉挛的支气管平滑肌松弛，并有轻度阿托品样作用和局部麻醉作用

2、镇咳强度约为可待因的1/3

口服20-30min起效，作用持续4-6h  
便秘头晕头痛口干；

中枢神经系统抑制药，中枢抑制、呼吸抑制增加。

1、呼吸功能不全、心衰和因尿道疾病致尿潴留的患者。  
2、妊娠期、哺乳期妇女。

用于多种原因引起的无痰干咳；痰量多者宜与祛痰药联用。青光眼、心功能不全、大咯血者慎用。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 祛痰药

黏液溶解剂

刺激性祛痰药

裂解糖蛋白的  
蛋白质部分，  
直接降低痰液  
黏稠度

使痰液中的酸  
性粘蛋白纤维  
断裂

通过巯基与黏  
蛋白的二硫键  
互换使黏蛋白  
分子裂解，降  
低黏稠度

沙雷肽酶

氨溴索、溴己新

乙酰半胱氨酸

氯化铵

# 祛痰药：氯化铵

对胃黏膜的化学刺激引起轻度恶心，反射性引起气管和支气管腺体分泌增加，从而增加排痰，使痰液易于排出。

体内几乎完全降解，仅少量随粪便排出

恶心呕吐胃部不适；  
过量：酸中毒、低血钾

磺胺类药物可引起结晶尿致肾损，酸化尿液增加结晶尿风险。

物的排泄；  
2、与磺胺嘧啶、呋喃妥因呈配伍禁忌；  
3、增加四环素、青霉素类抗菌作用

1、肝肾功能严重损害，尤其是肝昏迷、肾功能衰竭、尿毒症者禁用  
2、代谢性酸中毒患者忌用

因其刺激性，多用于复制剂的组分之一使用。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 祛痰药：氨溴索

1、溶解黏痰，使痰液粘度恢复正常；  
2、促进呼吸道黏膜的纤毛运动，并刺激胃黏膜，引起反射性的恶心祛痰作用。

口服吸收迅速完全，2h左右血药浓度达峰值，肺组织浓度高。

轻微的上消化道反应（胃部灼烧、消化不良、恶心呕吐）；  
过敏反应

1、使阿莫西林、头孢呋辛、红霉素、多西环素等在肺组织浓度升高；  
2、破坏铜绿生物被膜，协同抗菌作用。  
3、与支扩剂有协同作用

1、对本品及其它成份过敏者  
2、妊娠前3个月内孕妇

1、用于痰液粘稠而不易咳出者；  
2、避免与强力镇咳药联用，以免稀化的痰液堵塞气道  
3、溴己新体内代谢产物

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 祛痰药：乙酰半胱氨酸

黏液稀化剂，巯基可使痰液中的黏蛋白双硫键断裂，降低痰黏度，使黏痰容易咳出

口服2-3h血药浓度达峰值；  
喷雾吸入1min起效，最大作用时间为5-10min

轻微的上消化道反应；  
过敏反应

1、硝酸甘油所致的低血压、低钾加重；  
2、降低青霉素、头孢菌素、四环素的药效。  
必要时间隔4小时使用。

哮喘患者禁用

用于痰液粘稠而不易咳出者

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药

磷酸二酯酶抑制剂

茶碱类

$\beta$ 2受体激动剂

SABA:  
沙丁胺醇、特布他林

LABA:  
沙美特罗、福莫特罗

SAMA:  
异丙托溴铵

LAMA:  
噻托溴铵

ICS:  
布地奈德、替奈卡松

全身激素:  
泼尼松、甲泼尼龙

白三烯受体阻滞剂

孟鲁司特

肥大细胞稳定剂

色甘酸钠、酮替芬

# 平喘药：茶碱

1、直接松弛支气管平滑肌，通过抑制磷酸二酯酶提高细胞内环磷腺苷含量，降低气道平滑肌张力，对痉挛的支气管更明显  
2、强心、利尿、兴奋呼吸中枢，低浓度抗炎

普通片达峰时间 2h;  
缓控释片 4-7h;  
缓释胶囊 8h

15-20ug/ml 头晕  
头疼恶心呕吐;  
≥20ug/ml 心动过速;  
≥40ug/ml 发热等,  
甚至致死

1、大环内酯类、喹诺酮类、林克唑霉素类、地尔卓、维拉帕米、美西律、西咪替丁使本品浓度升高，毒性加大;  
2、苯巴比妥、苯妥英钠、利福平使本品下降  
3、咖啡因等可加强其毒性

1、对本品过敏者  
2、活动性消化溃疡和未经控制的惊厥性疾病患者禁用。

1、治疗窗窄，个体差异大有条件行血药浓度监测；尤其老年人、肝肾功能不全者  
2、不建议作为哮喘一线用药和急性发作的一线用药；适用于COPD缓解期和急性加重期的治疗。  
3、餐后服药可减轻胃肠道不良反应  
4、与ICS或ICS/LABA联用协同平喘

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：沙丁胺醇

激动 $\beta_2$ 受体，松弛平滑肌

- 1、吸入3-5min起效，最大作用时间1-1.5h，维持3-6h；
- 2、口服30min起效，最大作用2-3h，维持6h

头痛、恶心、肌肉震颤；  
中毒：胸痛、头晕、持续头痛

- 1、其他肾上腺受体激动剂、茶碱使本品作用增强，不良反应增加；
- 2、单胺氧化酶抑制剂、三环类抗抑郁药，使本品不良反应增加
- 3、不与非选择性 $\beta$ 阻剂合用

对本品及成份过敏者

- 1、SABA常用沙丁胺醇、特步他林
- 2、首选于哮喘的急性发作
- 3、也可按需使用，用于COPD
- 4、长期用药可造成 $\beta$ 受体下调，致耐药。
- 5、吸入相比口服不良反应更少见。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：沙美特罗



激动 $\beta_2$ 受体，松弛平滑肌

吸入10-20min起效，2h达浓度峰值，作用持续12h

恶心呕吐肌肉震颤

- 1、其他肾上腺受体激动剂使本品作用增强，不良反应增加；
- 2、单胺氧化酶抑制剂、三环类抗抑郁药，使本品不良反应增加
- 3、非选择性 $\beta$ 拮抗药可抑制本品

- 1、对本品及成份过敏者
- 2、哮喘急性发作禁用

- 1、LABA常用沙美特罗、福莫特罗；
- 2、福莫特罗虽为长效制剂，但是起效快，可用于解救急性发作
- 3、可与ICS组成ICS/LABA复方制剂，协同平喘，用于哮喘缓解期。
- 4、长期单独使用LABA有增加哮喘死亡的风险，不推荐长期单独使用。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：异丙托溴铵

短效M受体胆碱拮抗剂。拮抗气道平滑肌M3胆碱受体，抑制胆碱能神经对气道平滑肌的作用，扩张气道

吸入后5min起效，30-60min达血药峰值，作用持续4-6h  
口干

肾上腺受体激动剂、茶碱使本品作用加强，不良反应增加；

对阿托品及其衍生物及对本品中组分过敏者禁用

- 1、SAMA扩张气道作用及起效时间弱于SABA
- 2、与SABA一样用于哮喘急性发作
- 3、与SABA一样按需用于COPD缓解期
- 4、SAMA与SABA具有互补作用。
- 5、妊早期、青光眼、前列腺肥大者慎用。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：噻托溴铵



长效M胆碱受体拮抗剂

吸入后5-7min 口干  
达血药浓度  
峰值，作用  
持续24h

与其它抗胆碱药合用产生叠加效应，避免联用。

对阿托品及其衍生物及对本品中组分过敏者禁用

- 1、COPD改善症状方面，LABA与LAMA无明显区别
- 2、预防急性发作方面，LAMA优于LABA

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：吸入用布地奈德



抗炎作用，抑制哮喘时炎症反应的多个环节发挥平喘作用

气雾吸入10min  
达血药峰值；  
粉雾吸入30min  
达血药峰值

声嘶、口咽部念珠菌感染

ICS/LABA复方制剂

对本品过敏者

清水漱口

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

- 1、控制哮喘的基础用药
- 2、COPD时非首选，血ESO $\geq$ 300/ul时可选用。

# 平喘药：泼尼松龙

抗炎作用

口服后1-2h血药浓度达峰值  
代谢紊乱  
溃疡.....

- 1、降糖药降压药调酯药
- 2、NSAIDs溃疡
- .....

1、对本品及其它糖皮质激素过敏者。  
2、严重的精神病、癫痫，活动性消化性溃疡，新近骨折、孕妇.....

用于ICS/LABA治疗后仍不能控制的哮喘；SABA治疗不佳；控制药物基础上急性发作推荐每天或隔天清晨服用，减少外源性激素对下丘脑-垂体-肾上腺轴抑制

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：孟鲁司特

选择性白三烯受体拮抗剂

3h达血药浓度峰值

腹痛头痛过敏反应嗜睡

咪哒唑仑、阿普唑仑竞争

对本品过敏者

CYP3A4，使本品代谢降低，浓度升高

- 1、除ICS外，唯一可单独用于哮喘长期控制性的药物，可作为轻度哮喘的替代治疗药物，或联合用于中重度。
- 2、不推荐用于哮喘急性发作。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌

# 平喘药：酮替芬



肥大细胞膜稳定剂，兼有H1受体拮抗及拮抗5HT和白三烯作用

口服3-4h达血药浓度峰值

嗜睡、困倦、口干

- 1、中枢神经系统抑制药、酒精使本品中枢抑制加强；
- 2、抗组胺药，本品作用增强；
- 3、阿托品类药物，本品不良反应增加

- 1、可与茶碱类、 $\beta_2$ 激动剂合用防治轻、中度哮喘。
- 2、不得驾驶机动车、船或精密仪器。

药效学

药动学

不良反应

相互作用

禁忌



# 平喘药

多种细胞及细胞组分参与的气道慢性炎症，以反复发作的喘息、气急、胸闷、咳嗽为主要表现



以气流受限为特征的可预防和治疗的疾病



ICS、全身性激素、白三烯受体调节剂、LABA、缓释茶碱

SABA、SAMA、短效茶碱

支扩剂

# 哮喘

仅白天有症状，  
且每月少于2次时。  
按需吸入缓解药  
物，推荐SAMA

## 第一级

口服SABA，吸入  
SAMA、短效茶碱，  
起效慢，不推荐。  
福莫特罗起效快，  
但是长期使用增  
加急性发作风险，  
不单独使用。

低剂量控制性药  
物+按需使用缓解  
药物。  
低剂量ICS+按需  
缓解药物；  
白三烯受体调节  
剂

## 第二级

缓释茶碱作用弱，  
不良反应明显，  
不推荐单独使用

1种或2种控制性药物  
+按需使用缓解药物。  
低剂量  
ICS/LABA+SABA；  
ICS/福莫特罗维持+  
缓解；  
中等剂量ICS+按需缓  
解药物；

## 第三级

2种或以上控制性药物  
+按需使用缓解药物。  
低剂量ICS/福莫特罗  
维持+缓解；  
中等剂量  
ICS/LABA+SABA；  
中等剂量ICS/LABA+  
一种控制性药物；

## 第四级

高剂量ICS+LABA，  
增加ICS剂量其获益有  
限，但不良反应明显  
增加。  
中等或高剂量的布地  
奈德，每天4次可增加  
疗效，其它ICS仍两次。

叠加治疗。  
ICS/LABA+LAM  
A；  
低剂量口服激素  
治疗。

## 第五级

# COPD

长效或短效支气管扩张剂，若有效则维持治疗。

推荐选用长效支气管扩张剂，其效果优于短效制剂；

LAMA与LABA改善症状并无明显区别；严重呼吸困难的患者，可双支扩联用。

起始治疗可以是一种长效支扩剂；

在预防急性加重方面，LAMA优于LABA，故推荐LAMA。

初始治疗推荐LAMA改善症状，降低急性加重；症状明显加重，特别是明显的呼吸困难或活动受限，双支扩剂联用LAMA+LABA；急性加重高风险、血ESR  $\geq 300/\mu\text{l}$ 、ACO者，考虑LABA+ICS的方案。

**A组**

症状少、风险低

**B组**

症状多、低风险

**C组**

症状少、高风险

**D组**

症状多、高风险

所有患者均可使用SABA、SAMA作为急救药物按需使用。



谢谢聆听