

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

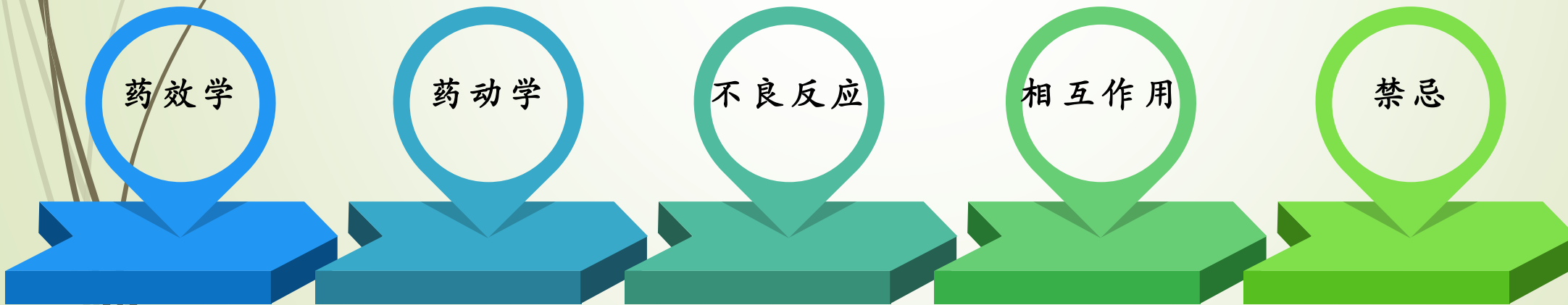
药效学

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

β 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、替奈松、氟替卡松

全身激素:
泼尼松、甲泼尼龙

糖皮质激素

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 15-20ug/ml 头晕
2h;
缓控释片4-7h;
缓释胶囊8h

≥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、地尔硫卓、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 β_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 β 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 β 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 β_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 β 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、降糖药降压药调脂药
- 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

CYP3A4，使本品代谢降低，浓度升高

对本品过敏者

- 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、 β_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

哮喘

COPD

以气流受限为特征的可预防和治疗的疾病

控制药物

缓解药物

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