



“小药片，大使命”之美托洛尔

文 / 北京市密云区鼓楼社区卫生服务中心 高艳玲



高艳玲，北京市密云区鼓楼社区卫生服务中心主管药师、临床药师，执业西药师；药学硕士。擅长慢病患者的用药重整、用药指导、用药宣教以及特殊给药装置使用，目前主要从事药品不良反应上报以及科普宣传等工作。

每种药片一从药厂出来就带着自己的使命：有的发挥抗菌作用，有的发挥抗凝作用，有的发挥降压作用，有的……，而美托洛尔是个多面手，不仅仅在降压方面表现出色，而且几乎能应用于所有心血管疾病的治疗中，是各国指南一致推荐的心血管疾病防治基石药物。因此，可以毫不夸张地说，美托洛尔有点优秀哦！

爱“美”之心，人皆有之。说到这里，相信很多人已经迫不及待地想要全面地了解美托洛尔了。别急，下面我将从美托洛尔常见的剂型、发挥药效的机制、临床应用、注意事项和特殊人群用药等几个方面为大家进行简单介绍。

一、市场常见的剂型

美托洛尔有口服和注射两种



剂型,其中口服的包括普通片和缓释片。不同剂型的比较见表1。

二、发挥药效的机制

1.选择性的 β_1 受体阻滞剂

肾上腺受体可以分为 α 及 β 受体,而 β 受体又分为 β_1 、 β_2 、 β_3 三种亚型。三种 β 受体的分布见表2。

首先我们需要知道一点:药物对受体的选择性越高,药效就越好,不良反应也越少。与临床上常用的非选择性 β 受体阻滞剂(如普萘洛尔、索他洛尔等)相比,美托洛尔对分布在心脏的 β_1 受体的选择性更高。其通过阻断 β_1 受体,可以抑制过度激活的交感神经活性,减弱与生理和心理负荷有关的儿茶酚胺的作用,最终达到减慢心率,降

低心排出量、耗氧及血压的目的。

不过,美托洛尔对 β_1 受体的选择性也是相对的。研究显示,美托洛尔对心脏中的 β_1 受体产生作用所需的剂量,低于其对外周血管和支气管上的 β_2 受体产生作用所需的剂量。随着美托洛尔给药剂量的增加,血浆浓度升高,其对 β_1 受体的选择性可能降低。

2.美托洛尔无 β 受体激动作用

β 受体激动作用也可简称为内在拟交感活性,即有些 β 受体阻滞剂除了能拮抗 β 受体外,还有部分激活作用。该作用会导致药效减弱,比如减慢心率作用减弱、收缩支气管作用减弱、抑制心肌收缩力作用减弱。常见有 β 受体激动作用的药物如醋丁洛尔、吲哚洛尔等;

而美托洛尔无 β 受体激动作用。

3.美托洛尔几乎无膜激活作用

膜激活作用也可简称为膜稳定作用,就是部分 β 受体阻滞剂能降低细胞膜对 Na^+ 的通透性;但是,这种作用在常规剂量下通常不明显,同时也被认为与治疗作用无关。常见有膜稳定作用的药物如普萘洛尔、醋丁洛尔等;而美托洛尔几乎无膜激活作用。

三、药代动力学参数

美托洛尔是中度脂溶性药物,其首过效应约为50%,生物利用度为40%~50%;主要在肝脏经CYP2D6代谢,尿中原形药物的比例仅为5%~10%。

四、主要临床应用

1.高血压

美托洛尔主要用于高血压合并心率增快的患者。如果血压控制不佳,可以与钙离子拮抗剂(CCB)、利尿剂等联合使用。

2.心绞痛

美托洛尔可以作为稳定型心绞痛的初始治疗药物,能降低心肌梗死后稳定型心绞痛患者死亡和再梗死的风险。但是,对于变异型心绞痛应首选CCB,而不宜用 β 受体阻滞剂。

3.心肌梗死

对于出现心肌梗死患者,无论是否进行了溶栓治疗,在最初的几小时内使用美托洛尔都可以获益。可以先静脉注射3次,每次5 mg,每次大约间隔2分钟;后面转换为口服制剂进行维持治疗。

4.心力衰竭

临床研究显示,美托洛尔对

表1 美托洛尔不同剂型的比较

药品名称	规格	是否可以掰开使用	剂量转换
酒石酸美托洛尔片	25 mg/片; 50 mg/片; 100 mg/片	可以掰开使用	25 mg酒石酸美托洛尔=23.75 mg琥珀酸美托洛尔; 其他剂量换算以此类推即可
酒石酸美托洛尔缓释片	25 mg/片; 50 mg/片; 100 mg/片	不可以掰开使用。 原因: 酒石酸美托洛尔缓释片的溶解度大, 只能制备成骨架型缓释片, 一旦掰开就破坏了缓释结构, 变成了普通片剂	
琥珀酸美托洛尔缓释片	23.75 mg/片; 47.5 mg/片	可以掰开使用, 但不可以嚼碎服用。 原因: 琥珀酸美托洛尔缓释片的溶解度小, 制备成膜控型缓释微丸, 即使掰开也不会破坏缓释结构	
注射用酒石酸美托洛尔		2 mg/瓶; 5 mg/瓶	
酒石酸美托洛尔注射液		2 mg:2 mL; 5 mg:5 mL	

表2 β 受体不同的亚型的分布

受体	亚型	分布
β 受体	β_1 受体	主要分布在心脏、肾小球旁系细胞,也有一些分布在瞳孔的开大肌
	β_2 受体	主要分布于平滑肌(如支气管、心肌及血管的平滑肌)、骨骼肌、肝脏等
	β_3 受体	主要分布在白色和棕色的脂肪组织中

于射血分数降低的心力衰竭患者非常有益。美托洛尔与血管紧张素受体脑啡肽酶抑制剂（ARNI）或血管紧张素转换酶抑制剂/血管紧张素转换酶抑制剂（ACEI/ARB）、钠-葡萄糖共转运蛋白2抑制剂（SGLT2i）、盐皮质激素受体拮抗剂组成的“新四联”，能够大幅度改善射血分数降低的心力衰竭患者预后。

5. 心律失常

美托洛尔为Ⅱ类抗心律失常药，主要用于治疗成人室上性快速型心律失常；对于心肌缺血、急性心梗伴快速型心律失常和胸痛，尽早使用美托洛尔也能从中获益。

6. 冠心病

美托洛尔不仅能够降低血压，保护心脑血管，同时还是冠心病治疗中不可缺少的药物。在冠心病的治疗过程中，美托洛尔既可以单独使用，也可与硝酸酯类、CCB类联用，以改善缺血、减轻症状；与抗血小板药物、他汀类药物、ACEI/ARB联用，能预防心肌梗死、改善疾病预后。

除此之外，美托洛尔还可以用于肥厚型心肌病以及甲状腺功能亢进的治疗。

五、特殊人群用药

特殊人群用药情况见表3。

六、注意事项

（1）美托洛尔个体差异较大，因此给药剂量更强调个体化。对于心力衰竭及老年高血压患者，应从小剂量开始，逐渐增加剂量；对于一般成人高血压患者，可以正常剂

量使用。另外，若无特殊理由，不能自己突然停药，否则可能会出现“药物反跳”现象。

（2）用药期间应监测血压、心率及心电图。一般来说，要求用药后静息心率降至55~60次/分，如果心率小于55次/分，就应该减少药物剂量同时密切关注患者的病情变化情况。

（3）酒石酸美托洛尔片应空腹服用；不要在进餐时服用，否则可使美托洛尔的生物利用度增加，药效不好控制。缓释片的生物利用度不受食物影响，只要固定时间服用即可。

（4）美托洛尔可以与β₂受体激动剂（如沙丁胺醇）合用，治疗合并有支气管哮喘或慢性阻塞性肺疾病的患者；但是，合用时需要谨慎，因为其选择性也是相对的。

（5）长期大量使用美托洛尔可能会对糖脂代谢产生影响，因此代谢综合征、糖代谢异常者应该慎用，必要时监测血糖、尿酸、血脂等指标。

（6）可引起外周血管痉挛，加重外周血管缺血，导致四肢冰冷、雷诺现象等。

（7）下列情况应该禁用美托洛尔，包括心源性休克、病态窦房结综合征、Ⅱ/Ⅲ度房室传导阻滞、有症状的心动过缓或低血压、伴有坏疽危险的严重外周血管疾病等患者。

美托洛尔自研发上市至今已经走过了半个多世纪，其间它陪伴了一代又一代的患者。随着近年来我国人口老龄化的不断加快，心血管疾病已成为严重威胁国民健康的一大类疾病，所以美托洛尔未来更加值得期待。希望大家按照相应的指南、工具书等合理使用美托洛尔，让美托洛尔这个小药片真正发挥它的作用，完成它的使命。

最后，送给大家一首顺口溜，帮助大家记住优秀的美托洛尔——美托洛尔本领大，对抗交感降血压，降率降传降耗氧，降低输出样样强。平片切记要空腹，琥珀缓释可掰服。贝塔受体选择高，不良反应已减少。禁忌千万不要忘，必须牢牢记心上。心源休克及病窦，传导阻滞心动缓。美托比索及阿替，他们三个是兄弟，合理使用疗效棒，一代更比一代强。

药物与人

表3 特殊人群用药情况

特殊人群	注意事项
老年患者	现有资料显示，老年人服用美托洛尔后的药代动力学参数相比年轻人没有明显改变。所以，对于大部分老年患者，用药剂量无需调整；个别患者敏感性高，需要降低剂量
儿童患者	主要用于高血压、心律失常、心绞痛的治疗。目前尚无心力衰竭、心肌梗死的相关用法用量指导
肝功能不全者	起始治疗剂量应低于给定适应证推荐的剂量。因为美托洛尔由肝脏代谢，肝功能差时，其血药浓度可能会明显升高
肾功能不全者	无需调整剂量，经肾脏的排泄量很少
妊娠期	为妊娠期C级药物，可能有害
哺乳期	为哺乳期L2级药物，相对安全