

临床用药手册丛书

心血管 药物手册

○主编 周茂金 苏美英 张卫东

心血管疾病是危害人类健康的严重疾病，是造成人类死亡的主要原因之一。药物是治疗心血管疾病的重要手段。

中国医药科技出版社

临床用药手册丛书

心血管药物手册

主编 周茂金 苏美英 张卫东

中国医药科技出版社

内 容 提 要

药物治疗始终是心血管病最常用的有效治疗方法。本书介绍了 300 多种临床广泛应用的心血管药物, 主要包括钙通道阻滞剂、抗心律失常药、抗心绞痛药、周围血管扩张药、降血压药、调节血脂及抗动脉粥样硬化药、强心药、抗肾上腺素药物。

本书适合临床医师、药师应用。

图书在版编目 (CIP) 数据

心血管药物手册/周茂金, 苏美英, 张卫东主编.

—北京: 中国医药科技出版社, 2013. 10

(临床用药手册丛书)

ISBN 978 - 7 - 5067 - 6445 - 2

I. ①心… II. ①周… ②苏… ③张… III. ①心脏
血管疾病 - 药物 - 手册 IV. ①R972 - 62

中国版本图书馆 CIP 数据核字 (2013) 第 245803 号

美术编辑 陈君杞

版式设计 郭小平

出版 中国医药科技出版社

地址 北京市海淀区文慧园北路甲 22 号

邮编 100082

电话 发行: 010 - 62227427 邮购: 010 - 62236938

网址 www.cmstp.com

规格 880 × 1230 ¹/₃₂

印张 16 ¹/₈

字数 392 千字

版次 2013 年 10 月第 1 版

印次 2013 年 10 月第 1 次印刷

印刷 北京金信诺印刷有限公司

经销 全国各地新华书店

书号 ISBN 978 - 7 - 5067 - 6445 - 2

定价 39.00 元

本社图书如存在印装质量问题请与本社联系调换

编委会

主 编 周茂金 苏美英 张卫东
副主编 张进明 刘庆勇 辛爱萍 肖新建
鲍 颖 宁中军 曹强庚 孟兆珂
方 敬 许加夫 舒 东 董 立
丛绍强 周庆秋

编 委 (按姓氏笔画排序)

王 莉 吕建萍 刘福梅 安新明
孙 颖 李 刚 苏泉美 汪晓云
张萍萍 周婷婷 郑桂香 赵秀兰
郭 娜 董希英 董燕霞

前言

心血管疾病已经成为 21 世纪威胁人类生命健康的头号杀手。随着人类生活水平的提高，生活方式的转变，更多心血管疾病的潜在危机还在不断增加。世界心脏病联盟（World Heart Federation）的统计资料显示，在全世界范围内，80% 死于心血管疾病的患者来自中低收入国家和地区，且这些国家和地区心血管疾病的死亡率随着肥胖和吸烟人数的增加继续呈上升趋势，预计至 2020 年全球心血管病死亡率将增加 50%，达 2500 万人，其中 1900 万人发生在发展中国家。因此，心血管疾病目前以及将来很长的时期内都会成为我国的重大公共卫生问题，如何有效治疗和预防心血管疾病成为我国医药卫生学界面临的重大课题和艰巨的任务。

药物治疗始终是心血管疾病的基础治疗，非药物治疗如介入、激光、射频等要么建立在药物充分治疗的前提下，要么在非药物治疗后仍然需要药物治疗维持。对于大多数心血管疾病患者而言，药物治疗始终是最基本、最常用的有效治疗方法。

本书由长期从事临床药学工作的临床药师编写而成。我们编写此书的目的，是以药学思维和循证思维为指导，注重心血管治疗药物的药效和药动学数据的收集，注重药学循证科学的新证据、新发现的收集。在收集证据和编写本书的具体过程中，有意识地针对心血管疾病临床治疗的具体要求，撷取侧重于临床的药学学科理论和实践最新进展，以期对心血管疾病的临床治疗提供

专业的药学数据和资料。本书共收集目前临床广泛应用的心血管药物 300 多个品种，主要包括钙通道阻滞剂、抗心律失常药、抗心绞痛药、周围血管舒张药、降血压药、调节血脂药及抗动脉粥样硬化药、强心药、抗肾上腺素药等。本书在编写过程中参阅了大量的国内外最新资料，大大丰富了每个药物的信息量，但具体用药需以药品说明书为准或遵医嘱。希望本书能够成为临床医师、护师以及广大药学技术人员的参考书。本书编写分工如下：第一章由周茂金、苏美英、王莉、刘庆勇编写；第二章由苏美英、丛绍强、刘福梅、孙颖、辛爱萍编写；第三章由鲍颖、丛绍强、安新明、张萍萍、宁中军编写；第四章由肖新建、李刚、汪晓云、曹强庚、辛爱萍编写；第五章由宁中军、周庆秋、苏泉美、周婷婷、肖新建编写；第六章由曹强庚、郑桂香、赵秀兰、周茂金、张卫东编写；第七章由方敬、郭娜、董希英、舒东、张卫东编写；第八章由许加夫、鲍颖、董燕霞、苏美英、张进明编写；第九章由董立、周庆秋、周茂金、吕建萍、张进明编写；第十章由舒东、董立、丛绍强、刘庆勇、张卫东编写。

由于编者学识和水平有限，书中难免存在不足和错误，敬请广大读者批评指正。

编 者

2013 年 9 月

目录

第一章 总论 (1)

第一节 钙通道阻滞剂的临床应用 (1)

第二节 抗心律失常药物的临床应用 (5)

第三节 抗心绞痛药物的临床应用 (10)

第四节 血管紧张素转换酶抑制剂的临床应用 (12)

第五节 血管紧张素 II 受体拮抗剂的临床应用 (15)

第六节 调血脂药物的临床应用 (19)

第七节 强心苷类药物的临床应用 (22)

第二章 钙通道阻滞剂 (27)

维拉帕米 27 加洛帕米 31 噻帕米 32

法利帕米 32 阿尼帕米 33 硝苯地平 33

尼鲁地平 37 尼群地平 37 尼索地平 39

尼莫地平 41 非洛地平 43 氨氯地平 45

左氨氯地平 47 乐卡地平 51 依拉地平 53

尼伐地平 54 马尼地平 55 拉西地平 55

贝尼地平 57 巴尼地平 60 地尔硫革 62

桂利嗪 65 氟桂利嗪 66 利多氟嗪 69

粉防己碱 69

第三章 抗心律失常药 (71)

阿普林定 71 阿齐利特 72 阿义吗啉 72

安他啉 73 胺碘酮 74 巴芦卡尼 80

2 目 录

苯妥英钠	80	吡美诺	88	吡西卡尼	89
蝙蝠葛碱	89	丙吡胺	89	多非利特	92
恩卡尼	96	氟卡尼	96	卡泊酸	97
奎尼丁	98	利多卡因	101	氯非铵	105
氯卡尼	105	美西律	106	门冬氨酸钾镁	110
莫地卡尼	112	莫雷西嗪	112	普拉马林	115
普鲁卡因胺	116	普罗帕酮	119	瑞卡南	124
双氢奎尼丁	124	司巴丁	125	妥卡胺	125
西苯唑啉	127	烯丙尼定	127	腺苷	128
溴苄胺	129	依布利特	130	依地酸二钠	131
乙酰卡尼	131				

第四章 抗心绞痛药 (133)

奥昔非君	133	苯碘达隆	133	川芎嗪	134
醋柳黄酮	136	大豆总黄酮	137	丹参	137
丹参酮 IIA 磺酸钠	139	地奥心血康	140	地拉革	140
丁四硝酯	141	辅酶 I	141	冠心舒	142
冠心苏合丸	142	海索苯定	142	环常绿黄杨碱 D	143
环磷腺苷	143	卡波罗孟	144	凯林	145
毛冬青	145	毛冬青甲素	146	尼可地尔	147
曲美他嗪	147	曲匹地尔	150	三七冠心宁	151
麝香酮	151	薯蓣皂苷	152	双丁酰环磷腺苷	152
双嘧达莫	153	戊四硝酯	155	硝酸甘油	155
硝酸异山梨酯	164	单硝酸异山梨酯	166	硝乙醇胺	171
亚硝酸异戊酯	171	乙氧黄酮	171	银杏叶提取物	172
愈风宁心片	173	雷诺嗪	174		

第五章 周围血管舒张药 (176)

二氢麦角碱	176	烟酸	177	烟酸肌醇酯	178
-------	-----	----	-----	-------	-----

维生素E 烟酸酯 179	罂粟碱 181	西地那非 183
环扁桃酯 186	长春西汀 187	托哌酮 189
倍他司丁 190	地芬尼多 191	依前列醇 192
血管舒缓素 192	氢麦角胺 193	尼麦角林 194
长春胺 195	灯盏细辛 196	灯盏花素 197

第六章 降血压药 (199)

第一节 α 受体阻断药 (199)

哌唑嗪 199	多沙唑嗪 202	特拉唑嗪 203
阿夫唑嗪 205	乌拉地尔 206	胍法辛 209
胍那苄 209		

第二节 血管紧张素转换酶抑制剂 (210)

卡托普利 210	依那普利 213	咪达普利 214
喹那普利 216	贝那普利 217	西拉普利 220
阿拉普利 223	雷米普利 224	赖诺普利 228
培哚普利 231	福辛普利 233	佐芬普利 237
地拉普利 239	螺普利 239	

第三节 血管紧张素受体拮抗药 (241)

伊贝沙坦 241	氯沙坦 242	缬沙坦 245
替米沙坦 247	坎地沙坦酯 250	奥美沙坦酯 254
依普罗沙坦 257	沙拉新 258	

第四节 血管扩张药 (259)

硝普钠 259	肼屈嗪 261	米诺地尔 263
地巴唑 265	二氮嗪 265	布屈嗪 266
卡屈嗪 267	双肼屈嗪 267	

第五节 中枢降压药 (269)

可乐定 269	甲基多巴 272	莫索尼定 276
利美尼定 278		

第六节 去甲肾上腺素能神经末梢阻断药 (278)

利血平 278 硫酸胍乙啶 282 胍那克林 284

降压灵 285 降压平 285 帕吉林 286

第七节 神经节阻断药 (287)

喷托铵 287 美加明 287 潘必啉 287

六甲溴铵 288 咪芬 288

第八节 其他降压药 (289)

吡那地尔 289 酮色林 289 吲哒帕胺 290

利降平片 295 环轮宁 295

第七章 抗休克血管活性药 (297)

去甲肾上腺素 297 去氧肾上腺素 300 甲氧明 303

间羟胺 304 肾上腺素 306 美芬丁胺 311

多巴胺 312 多巴酚丁胺 316 血管紧张素胺 318

苯赖加压素 319

第八章 调节血脂药及抗动脉粥样硬化药 (320)

阿西莫司 320 氯贝丁酯 321 非诺贝特 325

环丙贝特 328 苯扎贝特 329 吉非贝齐 330

洛伐他汀 332 辛伐他汀 335 普伐他汀 339

氟伐他汀 342 阿托伐他汀 347 瑞舒伐他汀 350

匹伐他汀钙 356 普罗布考 357 泛硫乙胺 359

地维烯胺 360 依折麦布 361 考来烯胺 364

亚油酸 365 月见草油 366 ω -3 脂肪酸 368

血脂康 370 考来维纶 371 心脑血管康 372

右旋糖酐硫酸酯钠 372 硫酸软骨素 A 373 藻酸双酯钠 374

夫拉扎勃 376 右旋甲状腺素钠 376 吡卡酯 377

弹性酶 378 氯贝酸铝 378 双贝特 379

益多酯 379 苯扎贝特 381 苧氯贝特 382

谷甾醇 383	降胆葡胺 DEAE 383	降脂宁 383
脑心舒 384		

第九章 强心药 (385)

洋地黄 385	洋地黄毒苷 388	地高辛 395
甲地高辛 406	毛花苷丙 409	去乙酰毛花苷 409
毒毛花苷 K 415	氨力农 415	米力农 417
羊角拗苷 419	黄夹苷 419	铃兰毒苷 420
依诺昔酮 420		

第十章 抗肾上腺素药 (422)

第一节 α 、 β 受体阻断剂 (422)

阿罗洛尔 422	氨磺洛尔 424	卡维地洛 424
----------	----------	----------

第二节 α 受体阻断剂 (430)

酚妥拉明 430	酚苄明 432	莫西塞利 435
----------	---------	----------

吲哚拉明 435

第三节 β 受体阻断剂 (436)

普萘洛尔 436	噻吗洛尔 442	纳多洛尔 446
索他洛尔 447	吲哚洛尔 450	阿普洛尔 451
氧烯洛尔 452	左布诺洛尔 453	贝凡洛尔 456
卡替洛尔 458	阿替洛尔 461	美托洛尔 464
倍他洛尔 474	比索洛尔 475	奈必洛尔 478
醋丁洛尔 482	苯呋洛尔 484	布非洛尔 484
布库洛尔 485	布拉洛尔 487	丁非洛尔 488
卡拉洛尔 489	氟司洛尔 491	莫普洛尔 492
美替洛尔 493	托利洛尔 494	妥拉洛尔 495
塞利洛尔 495	塞他洛尔 498	二醋洛尔 499
依泮洛尔 500	艾司洛尔 500	

第一章 总 论

第一节 钙通道阻滞剂的临床应用

钙通道阻滞剂 (calcium channel blockers, CCB) 又称钙离子拮抗剂 (calcium antagonists), 能抑制跨膜钙内流及细胞内的钙释放, 降低细胞内游离钙浓度及其利用率, 抑制 ATP 酶的活性, 降低心肌收缩力, 使平滑肌细胞松弛, 血管扩张, 降低外周血管阻力。根据化学结构的不同, 钙通道阻滞剂可分为 4 类: 二氢吡啶类 (Dihydropyridines, DHPs)、苯 烷 胺 类 (Phenylalkylanines)、苯 并 硫 类 (Benzothiazepines) 和二苯基哌嗪类等。其中, 苯烷胺类以维拉帕米为代表, 苯硫类以地尔硫草为代表, 二氢吡啶类以硝苯地平为代表。二氢吡啶类 (DHPs) 钙通道阻滞剂是 20 世纪 60 年代后期研究开发的一类新型药物, 属于 1,4-二氢吡啶的衍生物, 自从 1975 年第一个二氢吡啶类钙拮剂硝苯地平 (Nifedipine) 上市以来, 又相继开发和上市了尼群地平 (Nitrendipine)、尼莫地平 (Nimodipine)、尼卡地平 (Nicardipine)、尼鲁地平 (Niludipine)、尼索地平 (Nisoldipine)、乐卡地平 (Lercanidipine)、依拉地平 (Isradipine)、非洛地平 (Felodipine)、拉西地平 (Lacidipine)、氨氯地平 (Amlodipine)、左氨氯地平 (Levamlodipine)、尼伐地平 (Nivaldipine)、马尼地平 (Manidipine)、贝尼地平 (Benidipine)、巴尼地平 (Barnidipine) 和阿折地平 (Achedipine) 等多个品种, 它们与第一代二氢吡啶类钙离子拮抗剂硝苯地平相比, 具有不良反应少、作用持续时间长、选择性强、降压作用温和等优点, 因此得到广泛应用。

二氢吡啶类钙离子拮抗剂的构效关系：1,4-二氢吡啶环和-NH是必需基团，若二氢吡啶环氧化或还原，就会失去活性；3,5位酯基为必需基团，酯基中烷氧基不同时活性增大；4位为苯环取代，苯环邻位或间位有吸电子基团时活性增强；2,6位多为低级烷基，至少一侧为低级烷基时有利于增加活性；1,4-二氢吡啶环为船式结构，苯环上的邻位或间位取代基使苯环同二氢吡啶环呈垂直状态，苯环上的取代基与4位H同侧，这种构象能增强与受体结合能力。

苯烷胺类（Phenylalkylamines）主要包括维拉帕米（Verapamil）和噻帕米（Tiapamil）。维拉帕米是临床上常用的钙通道阻滞剂，主要用于治疗心律失常、心绞痛和高血压，该药首过代谢明显，去甲维拉帕米（Norverapamil）是维拉帕米N-甲基化的代谢物，具原型药物20%的活性，血浆累计程度与原型药物相当甚至更大。因而其活性代谢物去甲维拉帕米的作用也引起了重视。CYP3A4参与维拉帕米代谢，当CYP3A4酶活性下降，肝功能异常或肝血流量减少时将直接影响维拉帕米的代谢和消除。维拉帕米相互作用与CYP3A这一代谢酶有关。维拉帕米可通过抑制CYP3A活性升高地高辛、洋地黄毒苷、硫嘌呤、环孢素、西罗莫司和非索非那定的血浆浓度；苯巴比妥和利福平可通过诱导CYP3A活性而降低维拉帕米的水浆浓度。地尔硫草（Diltiazem）是苯并噻氮衍生物中唯一可供临床应用的钙通道阻滞剂，其通过拮抗钙离子直接作用于血管平滑肌，而扩张冠状血管和末梢血管，降低外周阻力，降低血压，减慢心率，减轻心脏运动量和降低心脏耗氧量。本品对CYP3A有抑制作用，地尔硫草可通过抑制CYP3A活性升高苯妥英钠、西沙必利、三唑仑、甲泼尼龙的水浆浓度。二氢吡啶类药物主要与血管平滑肌和血管以外的平滑肌痉挛有关，是细胞膜慢通道阻滞药，阻滞钙在血管和非血管平滑肌细胞内外的转运，抑制平滑肌细胞的钙内流，选择性拮抗钙离子通道，阻断平滑肌的兴奋-收缩偶联，扩张血管，对血管及血管平滑肌起松弛作用，解除平滑肌痉挛抑制血小板聚集，改善微循环。本类药物对细胞色素没有抑制或诱导作用，与药物发生相互作用主

要与其他药物抑制此类药物的代谢有关。

近年来,人们对二氢吡啶药物不断进行结构改造,使其在作用时间、生物利用度和选择性等方面取得了显著改善,一些具有明显化学和生物特点的新品种不断涌现。近期研制的品种有下述几种。

1. 阿雷地平 (Aranidipine) 是日本 Maruko Seiyaku 公司研发的强效、长效钙通道阻滞剂,1996 年首次在日本上市。本品兼有 L 型和 T 型钙通道阻滞作用,还有开放钾通道的作用,临床对原发性高血压有较好的疗效,能降低外周血管阻力,增强射血功能。此外,还能降低脑卒中、肝脏纤维化、增生性纤维样小动脉炎以及恶性硬化的发生率,其经胃肠道迅速吸收,在体内分布快,口服 30 分钟后达到最大血药浓度,血浆蛋白结合率为 84% ~ 95%。降压作用为硝苯地平的 3 倍,口服,每日一次,每次 3 ~ 10 mg。

2. 克尼地平 (Cinildipine) 是日本富士株式会社 1996 年上市的长效二氢吡啶类钙通道阻滞剂,其酯基中双键为反式结构,具有钙通道阻滞作用,能缓慢抑制钙通道,阻滞钙离子内流,并能抑制细胞内钙离子的释放,从而起到缓慢长效降压作用。其口服 2 小时后达到最大血药浓度,半衰期为 8 ~ 9 小时,体内血浆蛋白结合率为 77% ~ 86%。口服,每日一次,每次 5 ~ 20 mg,可治疗各种程度的高血压。

3. Watanidipine 是由日本 Green Cross 公司研制,是目前正在进行Ⅲ期临床研究,具有长期降压作用的二氢吡啶类药物,其 5 位酯侧链为取代氨基苯烷基结构。通过苯环的脂溶性和大的取代基团的空间位阻,影响药物与受体的结合,从而改变药物的药动学性质,延迟代谢。该药没有首过效应,降压作用为尼群地平的 10 倍,具有长效高效的特点。此外,还能选择性地作用于双侧颈动脉,可减少脑水肿和脑卒中的发生,并能改善长期高血压引起的脑血管损害,可适用于某些脑血管疾病治疗。

4. Efonidipine 是日本 Nissan 公司于 1994 年上市的新型结构的二氢吡啶类钙拮抗剂。其 5 位以独特的环磷酸酯代替了以往的酯基

结构,使药物具有了良好的亲水性和较好的生物利用度。口服3小时后达到最大血药浓度,药效维持时间为9小时,不良反应小,没有药物积蓄现象,长期服用未见耐受性和反弹现象,该药可与ACE抑制剂合用治疗高血压。口服,每日一次,每次20~40 mg,为一新型长效降压药物。DHP-218也是二氢吡啶的环磷酸酯化合物,目前正处于Ⅲ期临床,其活性是硝苯地平的7倍。含有环磷酸酯基团的二氢吡啶类钙拮抗剂是该类药物在结构上的一个重大突破,这使得药物亲水性和生物利用度大为改善。

5. 二氢吡啶的硝酸酯衍生物 临床上有机硝酸酯药物可与二氢吡啶类药物同时服用,用于伴有心绞痛的高血压患者的治疗。日本的Taiho公司合并两类药物结构于同一分子中,设计合成了一类新型结构的化合物,并筛选出CD-349应具有最佳生物活性。药理实验表明,CD-349同硝苯地平有相同的药理活性,其与受体的结合和解离常数分别为尼群地平的10.4倍和8倍,具有起效慢、分布好和代谢慢的特点,为一长效钙拮剂。另一进入Ⅲ期临床的有机硝酸酯的二氢吡啶类药物CD-832是将新的有机硝酸酯药物尼可地尔(Nicorandil,抗心绞痛药)分成两部分,分别接在二氢吡啶类药物的两个酯基侧链上。CD-832能抑制钙离子内流,并选择性地扩张血管。降压迅速,口服给药后6分钟内达到最大作用,使静脉血管平滑肌松弛。还能选择性作用于冠状动脉,解除冠状动脉痉挛。发挥了钙通道阻滞剂和有机硝酸酯抗心绞痛的双重作用。

6. Palonidipine 是由日本Teijin公司开发的4位苯环2',5'位双取代的新型二氢吡啶类药物,目前正在进行Ⅲ期临床。人们在二氢吡啶类药物酯基侧链中引入水溶性基团改善吸收,引入大基团延缓代谢,用不同的吸电基团对尼卡地平分子的上的苯的2,3位和2,5位进行取代,合成了在苯环上具有不同取代基团双取代的二氢吡啶类化合物。通过对侧链酯基的改造,在2,5位双取代氨基酯中得到的Palonidipine具有最佳药理活性。其降压作用为尼卡地平的7~14倍,作用时间为其2倍, $t_{1/2\alpha}$ 和 $t_{1/2\beta}$ 分别达到42.9~56.2小时和61.5小

时,口服吸收迅速,1~2 小时后达到最大血药浓度,血浆蛋白结合率为 86%。长期服用未见耐受性和反弹现象,是一个被临床看好的药物。

7. Elgodipine 是新一代的二氢吡啶类药物,由 IQB 公司研制,目前正在进行Ⅲ期临床。苯环 2,3 位有甲缩醛的氧桥连接,水溶性好,可制成口服液,对光和热稳定,高选择性,对血管平滑肌的作用是对心肌作用的 10~100 倍,强效的抑制钙通道作用,良好的耐受性,不良反应小。8 天内每天口服该药双倍剂量 ($20\text{mg} \times 2$),5 天后达到稳定血药浓度,半衰期为 18 小时。

8. Lemidipine 为新型结构的二氢吡啶类药物,人们在对 4 位苯环 3,5 位酯基侧链改造的同时,也对 2,6 位低级烷烃进行结构修饰,合成了 2 位氮羰氧基取代的化合物,目前在进行Ⅲ期临床,显示了较突出的药理活性。其毒性小,小鼠口服 LD_{50} 达 5 g/kg 。口服每天 10~20 mg,有良好的降压作用,可与 ACE 抑制剂或 β 受体阻断剂同时服用以治疗高血压。

临床上钙拮抗剂主要用于治疗高血压、心绞痛、心律失常、充血性心肌病及缺血性心脏病等。此外,还用于原发性肺动脉高压、缺血性脑卒中、肥厚性心肌病等,是一类应用广泛的心血管药物。

第二节 抗心律失常药物的临床应用

抗心律失常药物的分类已沿用了近 30 年,由 Vaughan Williams 提出,又经 Harris 等补充而完善。Vaughan Williams 分类法根据药物作用的电生理特点将药物分为四类。

I 类药物:阻滞快钠通道,降低 0 相上升速率,减慢心肌传导,有效地终止钠通道依赖的折返。I 类药物根据药物与通道作用动力学和阻滞强度的不同又可分为 Ia、Ib 和 Ic 类。此类药物与钠通道的结合/解离动力学有很大差别,结合/解离时间常数 $< 1\text{s}$ 者为 Ib 类药物, $\geq 12\text{s}$ 者为 Ic 类药物;介于二者之间者为 Ia 类药物。

I类药物与开放和失活状态的通道亲和力大，因此呈使用依赖。对病态心肌、重症心功能障碍和缺血心肌特别敏感，应用要谨慎，尤其Ic类药物，易诱发致命性心律失常。Ia类阻滞Na⁺离子内流，延长APD或Q-T间期，常用药物有奎尼丁、丙吡胺、普鲁卡因胺；Ib类阻滞I⁺Na⁺内流，缩短APD或Q-T间期，常用药物有利多卡因、苯妥英、美西律、妥卡尼；Ic类阻滞I⁺Na⁺内流，对APD或Q-T间期无影响，常用药物有氟卡尼、普罗帕酮、莫雷西嗪。

II类药物：阻滞 β 受体，降低交感神经效应，减轻由 β 受体介导的心律失常。此类药能降低I_{Ca-L}、起搏电流，由此减慢窦律，抑制自律性，也能减慢房室结的传导。对病态窦房结综合征或房室传导障碍者作用特别明显。长期口服对病态心肌细胞的复极时间可能有所缩短，能降低缺血心肌的复极离散度，并能提高致颤阈值，由此降低冠心病的猝死率。常用的 β_1 受体阻滞剂有阿替洛尔、美托洛尔、艾司洛尔；兼有 β_1 和 β_2 受体阻滞剂有纳多洛尔、普萘洛尔、索他洛尔。

III类药物：基本为钾通道阻滞剂，延长心肌细胞动作电位时程，延长复极时间，延长有效不应期，有效地终止各种微折返，因此能有效地防颤、抗颤。此类药物以阻滞I_K为主，偶可增加I_{Na-S}，也可使动作电位时间延长。钾通道种类很多，它们各有相应的阻滞剂。选择性I_{Kr}阻滞剂如右旋索他洛尔、多非利特（Dofetilide）及其他新开发的药物如司美利特（Sematili）和阿莫兰特（Almokalant）等。选择性I_{Ks}阻滞剂多为混合性或非选择性I_K阻滞剂，既阻滞I_{Kr}，又阻滞I_{Ks}或其他钾通道，如胺碘酮、伊波利特（Ibutilide）、替他沙米（Tedisamil）和溴苄胺等。

IV类药物：钙通道阻滞剂，主要阻滞心肌细胞I_{Ca-L}介导的兴奋收缩偶联，减慢窦房结和房室结的传导，对早后除极和晚后除极电位及I_{Ca-L}参与的心律失常有治疗作用。常用的有维拉帕米和地尔硫草。

常用抗心律失常药物的作用机制：奎尼丁（Quinidine）用于各