

第一章

精神与中枢神经系统疾病用药

第一节 镇静与催眠药

考点1 药理作用与临床评价

1. 作用特点、典型不良反应、禁忌证

分类及代表药	作用特点	典型不良反应	禁忌证
巴比妥类 (苯巴比妥)	一般剂量: 镇静、催眠; 中等剂量: 麻醉; 大剂量: 昏迷, 甚至死亡	后遗效应、 <u>依赖性</u> 、 <u>成瘾性</u> 、 <u>致死性剥脱性皮炎</u>	严重肺功能不全、肝硬化、贫血、未被控制的糖尿病、过敏者
苯二氮草类 (地西泮、艾司唑仑)	<u>激动苯二氮草受体</u> 。镇静催眠, <u>中枢性肌松</u> , <u>抗焦虑</u> 。 <u>大剂量不引起麻醉</u>	嗜睡、 <u>依赖性</u> 、 <u>步履蹒跚</u> 、 <u>撤药症状</u>	过敏者、妊娠期妇女、新生儿。呼吸抑制、呼吸无力、严重肝损害者禁用硝西泮、氟西泮
其他类 (佐匹克隆、唑吡坦)	佐匹克隆, 艾司佐匹克隆: 镇静催眠、抗焦虑、肌肉松弛和抗惊厥等。 <u>唑吡坦, 仅具有镇静催眠作用</u>	<u>精神紊乱</u>	严重呼吸功能不全、睡眠呼吸暂停综合征、严重及急慢性肝功能不全、肌无力及过敏者

2. 药物相互作用

(1) 巴比妥类 肝药酶诱导剂, 长期用药加速自身代谢, 加速其他经肝药酶代谢的药物的代谢。使疗效降低。

(2) 苯二氮草类 与易成瘾和其他可能成瘾药物合用, 成瘾危险性增加; 增强抗高血压药或利尿降压药的降压效果; 与钙通道阻滞剂合用, 加重体位性低血压; 与普萘洛尔合用, 可致癫痫发作类型或频率改变。

(3) 其他类 唑吡坦: 延长氯丙嗪的药效; 与丙米嗪合用可增加嗜睡反应和逆行遗忘的发生。佐匹克隆: 与肌松药或其他中枢神经抑制剂合用可增强镇静作用; 与苯二氮草类抗焦虑药或催眠药合用, 可增加戒断症状的出现。

易错题解析

1. 多项选择题: 下列属于苯二氮草类药物的是

A. 帕罗西汀

B. 氟西泮

C. 奥沙西泮

D. 佐匹克隆

E. 艾司唑仑

[答案与解析] BCE。帕罗西汀: 5-HT 再摄取抑制剂(抗抑郁药); 氟西汀、奥沙西汀、艾司唑仑: 苯二氮䓬类; 佐匹克隆: 环吡咯酮类。因此应选择 BCE。

2. 多项选择题: 下面属于苯二氮䓬类药物具有的优点是

- A. 成瘾性小 B. 仅具有镇静催眠作用
C. 无肝药酶诱导作用 D. 突然停药无反跳现象
E. 大剂量不会引起麻醉

[答案与解析] ACE。苯二氮䓬类与巴比妥类相比成瘾性小; 除有镇静催眠作用外, 还有抗焦虑、抗惊厥、抗癫痫等作用; 无肝药酶诱导作用; 突然停药后可产生撤药症状; 大剂量不会引起麻醉。因此应选择 ACE。

一般苯二氮䓬类与巴比妥类相比较的突出特点是苯二氮䓬类大剂量不引起麻醉。

考点 2 用药监护

1. 依据睡眠状态选择用药

睡眠状态	选药	注释
入睡困难	首选艾司唑仑或扎来普隆	起效快, 醒后无不适感
焦虑型、夜间醒来次数较多或早醒者	氟西汀或三唑仑	
睡眠时间短且夜间易醒早醒者	夸西汀	
老年失眠者	10% 水合氯醛糖浆	起效快, 无蓄积, 醒后无宿醉
改善入睡难和夜间觉醒或夜间觉醒过早	唑吡坦、艾司佐匹克隆	不良反应少, 尤其无镇静和宿醉现象, 临床优势明显

2. 注意用药的安全性

①交替使用, 尽量避免长期使用一种药。②服用后避免驾车、操纵机器和高空作业。③在服药期间不宜饮酒。

3. 关注巴比妥类的合理应用

①确定是否对该类药物过敏, 一旦出现皮疹等, 应立即停药。②静脉注射巴比妥类药, 特别是快速给药时, 容易出现呼吸抑制。应严格控制静脉给药剂量。③作为抗惊厥药使用时, 应定期监测血浆药物浓度。

4. 关注老年人对苯二氮䓬类的敏感性和“宿醉”现象

①老年人静脉注射更易出现呼吸抑制、低血压、心动过缓甚至心跳停止。②服用后, 可产生过度镇静、肌肉松弛作用, 觉醒后可发生震颤、思维迟缓、步履蹒跚、肌无力等“宿醉”现象, 极易跌倒和受伤。须告之患者晨起时小心, 避免跌倒。

 真题回放

1. 最佳选择题：与青年人相比，老年人应用后敏感性增高易引起“晨起跌倒”，的药物是（2014）

- A. 美洛西林 B. 地西泮 C. 沙美特罗
D. 克伦特罗 E. 罗红霉素

[答案] B

2. 最佳选择题：老年人对苯二氮草类药较为敏感，用药后可致平衡功能失调，觉醒后可发生步履蹒跚、思维迟钝等症状，在临床上被称为（2015）

- A. 震颤麻痹综合征 B. 老年期痴呆
C. “宿醉”现象 D. 戒断综合征
E. 锥体外系反应

[答案] C

 易错题解析

最佳选择题：适合老年人使用，起效快，无蓄积，醒后无宿醉的催眠药是

- A. 地西泮 B. 唑吡坦 C. 苯巴比妥
D. 三唑仑 E. 水合氯醛

[答案与解析] E。地西泮、苯巴比妥、三唑仑均有宿醉现象。水合氯醛起效快，无蓄积，醒后无宿醉，适合老年人使用。所以选 E。

唑吡坦虽无明显宿醉，但老年患者服用易出现共济失调、精神紊乱。

考点 3 主要药品

1. 地西泮

(1) 适应证 焦虑、镇静催眠、抗癫痫和抗惊厥，可缓解炎症引起的反射性肌肉痉挛；惊厥症、肌紧张性头痛；家族性、老年性和特发性震颤；麻醉前给药。

(2) 注意事项 ①对苯二氮草类药过敏者禁用。②急性酒精中毒、昏迷或休克时注射地西泮药效增强。③严重的精神抑郁者可使病情加重。④加重重症肌无力患者的病情。⑤除癫痫持续状态外，原则上不应作连续静脉滴注。⑥长期使用不要突然停药。⑦妊娠及分娩妇女、哺乳妇女禁用。

2. 佐匹克隆

(1) 适应证 失眠。

(2) 注意事项 ①哺乳期妇女、15 岁以下儿童不宜使用。②大量长期用药突然停药可引起戒断症状。连续用药时间不宜超过 4 周。③服药后不宜驾车、操作机械或高空作业等。

3. 唑吡坦

(1) 适应证 偶发失眠和暂时失眠。

(2) 注意事项 ①急性酒精中毒者应用可致命。②有酒精或药物滥用或依赖史者对本品可能产生依赖性。③有精神抑郁者,可使症状加重。④应用时,如出现腹部或胃部痉挛、激惹神经症、肌肉痉挛、不明原因疲劳无力等症状,需立即停药,并在停药 48h 后随访。

真题回放

最佳选择题: 静脉注射地西泮速度过快时引起的不良反应是 (2014)

- A. 惊厥 B. 心跳加快 C. 血钙下降
D. 血糖升高 E. 呼吸暂停

[答案] E

易错题解析

最佳选择题: 下列药物中仅具有镇静催眠作用的是

- A. 地西泮 B. 苯巴比妥 C. 氟西泮
D. 唑吡坦 E. 佐匹克隆

[答案与解析] D. 地西泮、苯巴比妥、氟西泮、佐匹克隆: 除具有镇静催眠作用外还有抗惊厥(或抗癫痫)等作用; 唑吡坦: 仅具有镇静催眠作用。因此选择 D。

地西泮是苯二氮革类的代表药, 重点掌握其适应证。

第二节 抗癫痫药

考点 1 药理作用与临床评价

1. 作用特点、典型不良反应、禁忌证

分类及代表药	作用特点	典型不良反应	禁忌证
巴比妥类 (苯巴比妥、异戊巴比妥钠、扑米酮)	抗癫痫机制: 增强 γ -氨基丁酸 A 型受体活性, 抑制谷氨酸兴奋性, 抑制中枢神经系统单突触和多突触的传递	后遗效应、依赖性、成瘾性、致死性剥脱性皮炎	严重肺功能不全、肝硬化、贫血、未被控制的糖尿病、过敏者
苯二氮革类 (地西泮、氯硝西泮、硝西泮)	GABA 受体激动剂。抑制病灶异常放电向周围脑组织的扩散	嗜睡、依赖性、步履蹒跚、 <u>撤药症状</u>	过敏者、妊娠期妇女、新生儿。呼吸抑制、呼吸无力、严重肝损害者禁用硝西泮、氟西泮

续表

分类及代表药	作用特点	典型不良反应	禁忌证
乙内酰脲类 (苯妥英钠)	减少钠离子内流,产生膜稳定作用,抑制异常放电的扩散	行为改变、步态不稳、共济失调、眼球震颤、 <u>齿龈增生</u> , <u>不良反应与血药浓度密切相关</u>	对乙内酰脲类过敏者及阿斯综合征、Ⅱ~Ⅲ度房室阻滞、窦房结阻滞、窦性心动过缓等心功能损害者禁用
二苯并氮䓬类 (卡马西平、奥卡西平)	机制:阻滞电压依赖性钠通道,抑制异常放电,阻断神经递质释放。 <u>卡马西平诱导肝药酶</u> ,加速自身代谢,代谢物有活性	常见:视物模糊、复视、眼球震颤、头痛	对卡马西平或三环类抗抑郁药过敏者、有心脏房室传导阻滞、血常规及血清铁异常以及骨髓功能抑制等病史时禁用卡马西平
γ -氨基丁酸 (GABA)类似物 (加巴喷丁、氨基烯酸)	GABA的类似物或衍生物,是GABA氨基转移酶抑制剂		
脂肪酸类 (丙戊酸钠)	可能机制:抑制GABA的降解。 <u>可透过胎盘,也可经乳汁分泌</u>	少见过敏性皮炎、血小板减少症、 <u>肝脏中毒</u> ; <u>2岁以下儿童多药治疗时可能有致死性肝功能障碍发生</u>	对丙戊酸钠过敏者及有明显肝脏功能损害患者禁用

2. 药物相互作用

(1) 乙内酰脲类 ①苯妥英钠诱导肝药酶,可加速卡马西平、糖皮质激素、含雌激素的口服避孕药、促皮质激素、环孢素、左旋多巴等药物代谢,疗效降低。②香豆素类抗凝血药、氯霉素、异烟肼等可降低苯妥英钠的代谢,使苯妥英钠的血浆浓度增高。③与丙戊酸钠竞争血浆蛋白结合。④与大量抗精神病药或三环类抗抑郁药合用可能会诱发癫痫发作。

(2) 二苯并氮䓬类 ①卡马西平与对乙酰氨基酚合用使肝毒性增加,并降低对乙酰氨基酚的疗效;因诱导肝药酶,使香豆素类血药浓度降低,抗凝作用减弱。②与锂盐合用可引起严重的神经毒性。③与单胺氧化酶抑制剂合用可引起高热或高血压危象、严重惊厥甚至死亡,两药应用至少间隔14日。

(3) 脂肪酸类 ①丙戊酸钠与麻醉药、氟哌啶醇、马普替林、单胺氧化酶

抑制剂、吩噻嗪类 and 三环类抗抑郁药等合用, 中枢抑制作用增强。②与华法林或肝素等抗凝血药及溶栓药合用, 竞争血浆蛋白结合, 易引起出血。与阿司匹林或双嘧达莫合用, 使出血时间延长。③与卡马西平合用, 由于后者对肝药酶的诱导而使两者血浆浓度降低。

真题回放

[1-4] 配伍选择题 (2013)

- A. 乙琥胺 B. 苯妥英钠 C. 丙戊酸钠
D. 苯巴比妥 E. 卡马西平

1. 癫痫精神运动发作选用
2. 癫痫大发作选用
3. 癫痫大发作合并小发作选用
4. 癫痫小发作选用

[答案] 1. E 2. B 3. C 4. A

易错题解析

最佳选择题: 治疗大发作和小发作混合型癫痫应选用

- A. 丙戊酸钠 B. 乙琥胺 C. 苯妥英钠
D. 苯巴比妥 E. 劳拉西泮

[答案与解析] A。乙琥胺仅对小发作有效; 苯妥英钠、苯巴比妥仅用于大发作; 丙戊酸钠是广谱抗癫痫药, 因此选 A。

劳拉西泮虽属于苯二氮革类, 但为短效制剂, 不用于抗癫痫。

考点 2 用药监护

1. 提倡有规律用药

(1) 长期、规则应用, 从低剂量开始, 逐渐增加, 直到癫痫发作被控制而又无明显不良反应, 即为最佳剂量。

(2) 给药次数要根据血浆半衰期确定。儿童患者需要频繁地调整剂量并按体重计算给药量。

2. 换药与停药应有专业医师的指导

除非必须, 应避免突然停药, 尤其是巴比妥类及苯二氮革类。换药时也应谨慎, 只有当新的服药法已大致确立 (一般 1~2 周), 才可渐减第 1 种药。接受几种抗癫痫药治疗时, 不能同时停, 只能先停一种药, 无碍时再停另一种药。

3. 关注特殊人群的安全性

(1) 患者只能在已有 1 年无发作, 或已确定在 3 年中只在睡眠时发作而无觉醒发作, 才可驾驶小型车; 且应于撤药 6 个月后再驾车。有晕厥的患者不应驾驶或操作机械。

(2) 妊娠及哺乳期妇女有致畸风险。拟妊娠或妊娠期妇女应向专家咨询, 并进行产前筛查(甲胎蛋白检测和孕中期超声波检查)。

(3) 为降低神经管缺陷的风险, 在妊娠前和妊娠期应补充叶酸。抗癫痫药的剂量在妊娠期和分娩后应小心监测, 并根据临床情况随时调整。在妊娠后期3个月给予维生素K以有效预防任何抗癫痫药相关的新生儿出血的风险。



易错题解析

最佳选择题:正在接受抗癫痫药治疗的育龄期妇女, 为降低神经管缺陷的风险, 在妊娠前和妊娠期应补充下列哪种药物

A. 维生素K

B. 维生素C

C. 叶酸

D. 铁制剂

E. 钙制剂

[答案与解析] C。为降低神经管缺陷的风险, 在妊娠前和妊娠期应补充叶酸。

在妊娠后期3个月给予维生素K以有效预防任何抗癫痫药相关的新生儿出血的风险。

考点3 主要药品

1. 卡马西平

(1) 适应证 用于治疗癫痫、躁狂症、三叉神经痛、神经源性尿崩症、糖尿病神经病变引起的疼痛; 预防或治疗躁郁症。

(2) 注意事项 ①冠状动脉硬化等心脏病、肝、肾疾病或尿潴留者、糖尿病、青光眼、使用其他药物有血液系统不良反应史者。②老年人对本品较为敏感, 可引起认知功能障碍、精神错乱、焦虑、房室传导阻滞或心动过缓, 再生障碍性贫血。③应监测全血细胞计数及血清铁。经常复查项目包括尿常规、血尿素氮、肝功能、血浆药物浓度及眼科检查。④遇以下情况需停止使用卡马西平: a. 肝脏中毒症状或活动性肝病, 有骨髓功能抑制的明显证据。但如癫痫只有应用本品才能控制, 其他药物无效时可考虑减量, 密切随访白细胞计数, 如停止下降并回升, 则加大剂量以达到控制癫痫发作; b. 出现心血管系统不良反应或皮疹; c. 用于特异性疼痛综合征时, 如疼痛完全缓解, 应每月试行减量或停药。

2. 丙戊酸钠

(1) 适应证 用于各种类型的癫痫; 也可用于双相情感障碍相关的躁狂发作。

(2) 注意事项 ①妊娠期妇女用药应权衡利弊, 哺乳期妇女慎用。②3岁以下儿童使用本品发生肝功能损害的危险较大, 因本品可蓄积在发育的骨骼内。③应监测全血细胞计数、出凝血时间、肝肾功能, 必要时监测血浆丙戊酸钠浓度。④服用本品患者出现腹痛、恶心、呕吐时应及时检查血清淀粉酶。⑤用药

期间禁酒。⑥停药时应渐减量。⑦避免与具有肝毒性的药物合用。

3. 苯妥英钠

(1) 适应证 用于治疗强直-阵挛性发作(精神运动性发作、颞叶癫痫)、单纯及复杂部分性发作(局限性发作)、继发性全面发作和癫痫持续状态;其他:三叉神经痛、隐性营养不良性大疱性表皮松懈症、发作性舞蹈手足徐动症、发作性控制障碍、肌强直症及三环类抗抑郁药过量时心脏传导障碍、洋地黄中毒所致的室性及室上性心律失常。

(2) 注意事项 ①可致畸;哺乳期妇女应停止哺乳。②儿童应经常监测血浆药物浓度,以决定用药次数和用量。③监测血常规、肝功能、血钙、脑电图和甲状腺功能等,静脉使用本品时应进行持续的心电图、血压监测。④老年患者应用苯妥英钠时须慎重,用量应偏低。⑤患者应用后需观察9~14日,当患者不能耐受或有过敏反应时,须立即停药。如果皮疹为片状、紫癜状、大疱性或红斑狼疮样,则不能再次应用。⑥若出现中枢神经或小脑中毒症状时,减量或停药症状可改善或消失。

4. 苯巴比妥

(1) 适应证 用于治疗焦虑、失眠、癫痫及运动障碍。

(2) 注意事项 新生儿可发生低凝血酶原血症及出血,可应用维生素K治疗或预防。

真题回放

最佳选择题:丙戊酸钠的临床应用是(2014)

- A. 剧烈疼痛
- B. 帕金森病
- C. 癫痫小发作
- D. 精神分裂症
- E. 风湿性关节炎

[答案] C

易错题解析

最佳选择题:能够治疗三叉神经痛,且具有抗躁狂作用的抗癫痫药是

- A. 卡马西平
- B. 苯妥英钠
- C. 乙琥胺
- D. 丙戊酸钠
- E. 苯巴比妥

[答案与解析] A。运用排除法。上述药物均可抗癫痫,但只有卡马西平和苯妥英钠能治疗三叉神经痛。但苯妥英钠不用于抗躁狂。所以选A卡马西平。

本考点的几种代表药,除可用于抗癫痫外,均有其他临床应用,且有所不同。要区别记忆。

第三节 抗抑郁药

考点 1 药理作用与临床评价

1. 分类及作用特点

分类	主要药物	特点
三环类	阿米替林、丙米嗪、氯米帕明、多塞平	易出现不良反应
四环类	马普替林	马普替林广泛应用，疗效与三环类相当，但不良反应少
选择性 5-HT 再摄取抑制剂	舍曲林、西酞普兰、艾司西酞普兰	疗效与三环类抗抑郁药几无差异，但安全性和耐受性有很大改进。突然停药，易出现戒断反应
单胺氧化酶抑制剂	吗氯贝胺	
5-HT 及去甲肾上腺素再摄取抑制剂	文拉法辛、度洛西汀	本类药物对难治性抑郁症的疗效明显优于 5-羟色胺再摄取抑制剂，甚至对多种不同抗抑郁药治疗失败者有效
去甲肾上腺素能及特异性 5-HT 能抗抑郁药	米氮平	
5-HT 受体阻断剂/再摄取抑制剂	曲唑酮	
去甲肾上腺素再摄取抑制剂	瑞波西汀	

2. 典型不良反应

(1) 三环类 抗胆碱能效应（口干、出汗、便秘、尿潴留、排尿困难、视物模糊、眼内压升高、心动过速）、心律失常、溢乳、嗜睡、体重增加、心电图异常、性功能障碍等。

(2) 四环类 抗胆碱能效应；偶见肝脏氨基转移酶 AST 及 ALT 升高、眩晕、嗜睡、体重改变等。

(3) 选择性 5-HT 再摄取抑制剂 常见焦虑、震颤、嗜睡、睡眠异常（梦境反常、失眠）、欣快感等；少见多梦、感觉异常；性功能减退或障碍（射精延

迟、性高潮缺乏)、阴茎勃起功能障碍;偶见躁狂、精神紊乱、人格障碍、动作异常、癫痫发作;罕见5-羟色胺综合征;高泌乳素血症、溢乳、痛经、闭经、抗利尿素分泌异常综合征。当曲坦类抗偏头痛药、单胺氧化酶抑制剂、苯丙胺等与本类药联合应用时,应警惕引发5-羟色胺综合征。

(4) 单胺氧化酶抑制剂 常见多汗、口干、失眠、困倦、心悸等;少见震颤、AST及ALT升高、可逆性意识模糊。

(5) 其他 ①文拉法辛常见嗜睡、失眠、焦虑、性功能障碍等;严重不良反应有粒细胞缺乏、紫癜。②度洛西汀常见嗜睡、眩晕、疲劳、性功能障碍等。

③米氮平常见体重增加、困倦;严重不良反应有急性骨髓功能抑制。

3. 禁忌证

(1) 共性 对各种制剂本身及赋形剂过敏者、正在服用单胺氧化酶抑制剂者禁用。

(2) 严重心脏病、高血压、肝肾功能不全、青光眼、排尿困难、尿潴留禁用阿米替林。对苯二氮䓬类药过敏、心肌梗死急性发作期禁用氯米帕明。严重心脏病、近期有心梗发作史、癫痫、青光眼、尿潴留、甲状腺功能亢进、肝功能损害、谵妄、粒细胞减少禁用多塞平。

(3) 急性心肌梗死或心脏传导阻滞、癫痫或有惊厥病史、窄角型青光眼、尿潴留患者禁用马普替林。

(4) 有意识障碍、嗜铬细胞瘤患者、儿童及正在服用选择性5-HT再摄取抑制剂、三环类抗抑郁药者禁用吗氯贝胺。

(5) 严重的心脏病或心律失常者、意识障碍者禁用曲唑酮。未经治疗的窄角型青光眼患者禁用度洛西汀。

4. 药物相互作用

各类药与单胺氧化酶抑制剂合用或先后用药,可引起严重不良反应,主要为5-羟色胺综合征,如高血压、高热、肌阵挛、意识障碍等。

(1) 三环类 ①肝药酶抑制剂,使血药浓度升高,易引起或加重不良反应,甚至中毒。肝药酶诱导剂可加速代谢,降低血药浓度,减弱抗抑郁作用。②与抗惊厥药合用,可降低癫痫阈值,降低抗惊厥药作用。③氯米帕明、丙米嗪、多塞平等与华法林等抗凝血药合用,可降低抗凝血药的代谢,增加出血风险。④氯米帕明与抗组胺药或抗胆碱药合用,可增强抗胆碱作用;与雌激素合用,可降低氯米帕明的抗抑郁作用,并增加不良反应;与肾上腺素受体激动剂合用,可引起严重的高血压和高热;与5-HT受体激动剂合用,可产生5-HT综合征。

(2) 四环类 ①马普替林与抗组胺药合用可增强抗胆碱作用;与甲状腺激素合用可增加心律失常的危险;可使抗癫痫药疗效降低。②与具有中枢抑制作用的药物合用可导致过度嗜睡。

(3) 选择性 5-HT 再摄取抑制剂 ①与增强 5-HT 能神经功能的药物合用可引起 5-HT 综合征。②帕罗西汀能增强华法林和强心苷的药效。舍曲林与锂盐合用可能出现震颤,与华法林合用可延长凝血酶原时间。氟伏沙明与苯二氮革类药合用可升高氟伏沙明的血浆药物浓度。

(4) 单胺氧化酶抑制剂 ①与加强单胺类神经功能药合用,可出现高血压危象或 5-HT 综合征等严重不良反应。②与肝药酶诱导剂合用,血药浓度降低;与肝药酶抑制剂合用,血药浓度增高,产生不良反应。

(5) 其他 ①文拉法辛、米氮平、曲唑酮与乙醇合用可增强中枢抑制作用。②文拉法辛、曲唑酮与增强 5-HT 能神经功能的药物合用可引起 5-HT 综合征。③文拉法辛与三环类抗抑郁药合用,两类药的毒性均可增加;文拉法辛与华法林合用,可使凝血酶原时间延长;米氮平可加重苯二氮革类药的镇静作用。

真题回放

1. 最佳选择题: 丙米嗪的药理作用是 (2013)

- A. 抗精神病 B. 抗抑郁作用 C. 镇吐作用
D. 收缩外周血管作用 E. 抗癫痫作用

[答案] B

[2-4] 配伍选择题 (2015)

- A. 阿米替林 B. 氟西汀 C. 吗氯贝胺
D. 文拉法辛 E. 米氮平

2. 属于选择性 5-羟色胺再摄取抑制剂的是
3. 属于 A 型单胺氧化酶抑制剂的是
4. 属于 5-羟色胺和去甲肾上腺素再摄取抑制剂的是

[答案] 2. B 3. C 4. D

易错题解析

最佳选择题: 李女士来到药房咨询, 主诉最近服用下列药品后体重有所增加, 请药师确认可能增加体重的药品是 (2014 年)

- A. 二甲双胍 B. 辛伐他汀 C. 米氮平
D. 阿司匹林 E. 硝酸甘油

[答案与解析] C。二甲双胍是降血糖药, 具有降低体重作用。辛伐他汀为降血脂药也不会增加体重。阿司匹林、硝酸甘油没有增加体重的不良反应。米氮平为抗抑郁药, 有体重增加的不良反应。

备选答案中的二甲双胍和辛伐他汀的作用与体重有一定的关联。但都是降低体重, 干扰性较大。

考点 2 用药监护

1. 用药宜个体化

(1) 选药时, 须全面考虑患者症状特点、年龄、躯体状况、药物的耐受性、

有无合并症,予以个体化合理用药。

(2) 从小剂量开始,逐增剂量,尽可能采用最小有效量,使不良反应减至最少,以提高服药依从性。疗效不佳时,可根据不良反应和患者对药物的耐受情况,逐渐增至足量(有效剂量上限)。

(3) 若患者的经济条件允许,最好使用每日服用1次、不良反应轻微、起效较快的氟西汀、帕罗西汀、舍曲林、文拉法辛、米氮平等。

2. 切忌频繁换药

抗抑郁药起效缓慢(一般4~6周),米氮平和文拉法辛起效较快(1周左右),因此应用时要有足够的耐心,切忌频繁换药。只有在足量、足疗程使用某种抗抑郁药仍无效时,方可考虑换用同类另一种或作用机制不同的另一类药。

3. 换用抗抑郁药时要谨慎

换用不同种类的抗抑郁药时,应该停留一定的时间,以利于药物的清除,防止药物相互作用。氟西汀需停药5周才能换用单胺氧化酶抑制剂,其他5-HT再摄取抑制剂需2周。单胺氧化酶抑制剂在停用2周后才能换用5-HT再摄取抑制剂。选择性5-HT再摄取抑制剂如迅速停药,可出现戒断反应(胃肠道紊乱、头晕、感觉障碍、睡眠障碍、恶心、出汗、激惹、震颤、意识模糊等)。应逐渐减量。

真题回放

最佳选择题: 5-羟色胺再摄取抑制剂若与单胺氧化酶抑制剂同时服用可能出现5-羟色胺综合征,严重者可致死亡,二者交替使用的时间间隔应不少于(2014年)

- A. 2日 B. 4日 C. 7日
D. 10日 E. 14日

[答案] E

易错题解析

多项选择题: 使用抗抑郁药应注意

- A. 抗抑郁药起效缓慢,切忌频繁换药
B. 为加快起效,开始治疗时应足量给药
C. 为提高疗效,可采用联合用药
D. 换用不同种类的抗抑郁药时,应间隔一段时间
E. 选择性5-HT再摄取抑制剂不可突然停药

[答案与解析] ADE。参看用药监护项下:起效缓慢,切忌频繁换药, A对;从小剂量开始,逐增剂量,使不良反应减至最少, B错;换用不同种类的抗抑郁药时,应该停留一定的时间,以利于药物的清除,防止药物相互作用, D对;选择性5-HT再摄取抑制剂如迅速停药,可出现戒断反应, E对。

为提高疗效,可采用联合用药,虽然用药监护没有明确提到不可联合用药,但通过“药物相互作用”的论述以及“换用不同种类的抗抑郁药时,应该停留一定的时间,以利于药物的清除,防止药物相互作用”的表述,可以得出结论:不可联合用药。所以 C 错。

考点 3 主要药品

1. 氟西汀

(1) 适应证 抑郁症、强迫症、神经性贪食症。

(2) 注意事项 ①癫痫、心脏病、糖尿病、闭角型青光眼、有躁狂病史、出血性疾病者慎用。驾驶车辆、高空作业、操纵机器人员应慎用。②轻、中度肝功能不全者应减少初始剂量;明显肝功能不全者慎用;明显肾功能不全者慎用;妊娠期或哺乳期妇女不宜服用。

2. 帕罗西汀

(1) 适应证 抑郁症、强迫症、惊恐障碍及社交恐怖障碍等。

(2) 注意事项 同氟西汀。

3. 舍曲林

(1) 适应证 抑郁症的相关症状,伴随焦虑、有或无躁狂史;强迫症。

(2) 注意事项 同氟西汀。

4. 西酞普兰

(1) 适应证 各种类型的抑郁症。

(2) 注意事项 同氟西汀。

5. 氯米帕明

(1) 适应证 抑郁症、强迫症、社交恐惧症。

(2) 注意事项 ①支气管哮喘、心血管疾病、癫痫、青光眼、肝功能异常、甲状腺功能亢进、前列腺增生、精神分裂症、尿潴留;有自杀倾向者、卟啉代谢障碍者、妊娠及哺乳期妇女慎用。②儿童对本品较敏感,宜从小剂量开始。③老年人对本品敏感,用量应减小。④用药前后及治疗期应监测血细胞计数、血压、心电图、肝功能等。⑤突然停药时可产生头痛、恶心等不适,宜在 1~2 个月期间逐渐减少用量。

6. 文拉法辛

(1) 适应证 各种类型抑郁障碍、广泛性焦虑障碍。

(2) 注意事项 ①以下情况慎用:肝肾功能不全、近期心肌梗死、不稳定型心绞痛、血液病、癫痫、躁狂、青光眼及有出血倾向;司机和机械操纵者、儿童、妊娠及哺乳期妇女。②定期监测血压。③用药过量时给予对症支持治疗。

7. 米氮平

(1) 适应证 抑郁症。

(2) 注意事项 ①妊娠及哺乳期妇女避免使用。②儿童、严重肝肾功能不全、心血管疾病、癫痫、器质性脑综合征、糖尿病、黄疸、排尿困难、青光眼等患者、司机或机械操作者慎用。③老年人增加剂量应在医师的密切观察下进行。

8. 度洛西汀

(1) 适应证 各种抑郁症。

(2) 注意事项 ①以下情况慎用：肝功能不全者、严重肾功能不全者，尤其是终末期肾病、妊娠及哺乳期妇女、儿童、既往有癫痫发作史者、已稳定的窄角型青光眼者慎用。②对部分老年人应酌减剂量；③监测血压。④建议不要骤停药物，并注意观察患者停药后的反应。



易错题解析

最佳选择题：对伴有躁狂史的抑郁症患者应选用

A. 丙戊酸钠

B. 舍曲林

C. 氟西泮

D. 唑吡坦

E. 吡拉西坦

[答案与解析] B。丙戊酸钠、氟西泮为抗癫痫药；唑吡坦为催眠药；吡拉西坦为改善脑功能药。唯有舍曲林是抗抑郁药，所以选B。

氟西泮药名类似抗抑郁药氟西汀为干扰答案。

第四节 脑功能改善及抗记忆障碍药

考点1 药理作用与临床评价

1. 作用特点、典型不良反应、禁忌证

分类及代表药	作用特点	典型不良反应	禁忌证
酰胺类中枢兴奋药 (吡拉西坦、茴拉西坦、奥拉西坦)	改善各种类型的脑缺氧和脑损伤，提高学习和记忆能力	①吡拉西坦常见兴奋、易激动、头晕和失眠等；②茴拉西坦常见口干、嗜睡、全身皮疹	对本类药物过敏者；锥体外系疾病、亨廷顿病患者禁用吡拉西坦；对其他吡咯酮类药物不能耐受者禁用茴拉西坦；严重肾功能损害者禁用奥拉西坦
乙酰胆碱酯酶抑制剂 (多奈哌齐、利斯的明、石杉碱甲)	抑制胆碱酯酶活性，缓解因胆碱能神经功能缺陷所引起的记忆和认知功能障碍	①多奈哌齐常见幻觉、易激惹、攻击行为、昏厥、失眠、肌肉痉挛、尿失禁、疼痛；②利斯的明常见嗜睡、震颤、意识模糊、出汗、体重减轻	对多奈哌齐、六环吡啶类衍生物过敏者及妊娠期妇女禁用多奈哌齐；对利斯的明、氨基甲酸衍生物过敏者及严重肝损伤者禁用利斯的明；癫痫、肾功能不全、机械性肠梗阻、心绞痛患者禁用石杉碱甲

续表

分类及代表药	作用特点	典型不良反应	禁忌证
其他 (胞磷胆碱钠、 艾地苯醌、银 杏叶提取物)			对艾地苯醌、银杏或银杏叶提取物中任何成分过敏者禁用。与抗血小板药物或抗凝血药合用者禁用银杏叶提取物

 真题回放

1. 最佳选择题：下列药品中，属于酰胺类脑功能改善及抗记忆障碍药的是（2014 年）

- A. 吡拉西坦片 B. 胞磷胆碱 C. 利斯的明
D. 多奈哌齐 E. 石杉碱甲

[答案] A

[2-3] 配伍选择题 (2013 年)

- A. 激动中枢阿片受体
B. 抑制中枢神经系统胆碱酯酶
C. 抑制纹状体单胺氧化酶
D. 阻断中枢神经系统胆碱受体
E. 激动黑质纹状体通路多巴胺受体

2. 多奈哌齐的药理作用是

3. 司来吉兰的药理作用是

[答案] 2. B 3. C

易错题解析

多项选择题：用药后常引起兴奋、失眠的药物是

- A. 地西洋 B. 吡拉西坦 C. 利斯的明
D. 多奈哌齐 E. 米氮平

【答案与解析】BCD。地西洋为镇静催眠药，肯定不会引起兴奋、失眠；吡拉西坦、利斯的明、多奈哌齐三药为脑功能改善药，均有引起失眠的不良反应。所以选BCD。

注意米氮平为抗抑郁药，没有失眠的不良反应。

考点2 主要药品

1. 吡拉西坦

(1) 适应证 用于脑外伤、脑动脉硬化、脑血管病等多种原因所致的记忆及思维功能减退。

(2) 注意事项 ①哺乳期妇女、老年人、肝肾功能不全者、大多数外科手术后患者及有严重出血倾向者慎用。②用药期间避免突然停药。

2. 多奈哌齐

(1) 适应证 用于轻、中度老年期痴呆症状。

(2) 注意事项 病态窦房结综合征或其他室上性传导阻滞、消化道溃疡、哮喘及慢性阻塞性肺病患者慎用。

3. 石杉碱甲

(1) 适应证 用于良性记忆障碍，对痴呆患者和脑器质性病变引起的记忆障碍也有改善作用。

(2) 注意事项 心动过缓、支气管哮喘者慎用。

4. 银杏叶提取物

适应证：用于脑部、周边等血液循环障碍。①急慢性脑功能不全及其后遗症如中风、注意力不集中、记忆力衰退、痴呆；②耳部血流及神经障碍如耳鸣、眩晕、听力减退、耳迷路综合征；③眼部血流及神经障碍如糖尿病引起的视网膜病变及神经障碍、老年黄斑变性、视物模糊、慢性青光眼；④末梢循环障碍如各种动脉闭塞症、间歇性跛行症、手脚麻痹冰冷、四肢酸痛。



真题回放

[1-2] 配伍选择题 (2014 年)

- | | | |
|--------|---------|---------|
| A. 氟西汀 | B. 多奈哌齐 | C. 卡比多巴 |
| D. 舒必利 | E. 碳酸锂 | |

1. 与左旋多巴合用治疗帕金森病的药物是
2. 治疗阿尔茨海默病的药物是

[答案] 1. C 2. B



易错题解析

多项选择题：下列可用于治疗阿尔茨海默病的药物有

- | | | |
|---------|---------|---------|
| A. 度洛西汀 | B. 文拉法辛 | C. 卡马西平 |
| D. 多奈哌齐 | E. 石杉碱甲 | |

[答案与解析] DE。度洛西汀、文拉法辛均属于抗抑郁药；卡马西平是抗癫痫药。只有多奈哌齐和石杉碱甲为脑功能改善药，可用于治疗阿尔茨海默病。

首先要明确老年痴呆也称为阿尔茨海默病。其次要掌握代表药物。

第五节 镇痛药

考点 1 药理作用与临床评价

1. 作用特点

镇痛药分类

(1) 麻醉性镇痛药。

(2) 非麻醉性镇痛药：非甾体抗炎药；中枢性镇痛药：曲马多、羟考酮、布桂嗪等。

麻醉性镇痛药

(1) 阿片生物碱 吗啡、可待因和罂粟碱。

(2) 半合成吗啡样镇痛药 双氢可待因、丁丙诺啡、氢吗啡酮和羟吗啡酮等。

(3) 合成阿片类镇痛药 哌替啶、芬太尼、舒芬太尼和阿芬太尼、美沙酮、右丙氧芬、左啡诺、布托啡诺、喷他佐辛、非那佐辛。

根据止痛强度分为弱、强两类。弱：可待因、双氢可待因，主要用于轻、中度疼痛和癌性疼痛的治疗；强：吗啡、哌替啶、芬太尼主要用于全身麻醉的诱导和维持、术后止痛以及中到重度癌性疼痛、慢性疼痛的治疗。

阿片类镇痛药通过作用于中枢的阿片受体而解除对疼痛的感受和伴随的心理行为反应。激动不同亚型的阿片受体，除镇痛作用外，还可产生镇静、欣快感和依赖性，引起呼吸抑制、心动过缓、胃肠道运动抑制和恶心呕吐；血压下降、缩瞳、镇咳等作用。其中止泻（胃肠道运动抑制）是通过局部与中枢作用来改善肠道蠕动功能的。

2. 典型不良反应

常见呼吸抑制、支气管痉挛；少见瞳孔缩小、黄视；罕见视觉异常或复视。产生身体和精神依赖性，可成瘾；但对于晚期中、重度癌痛患者，如治疗适当，少见耐受性或依赖性。喷他佐辛等阿片受体部分激动剂可引起情绪紧张不安或失眠等反应。

3. 禁忌证

(1) 对吗啡过敏者、婴幼儿（缓、控释片）、未成熟新生儿、妊娠期及哺乳期妇女、临盆产妇以及呼吸抑制已显示发绀、颅内压增高和颅脑损伤、支气管哮喘、肺源性心脏病代偿失调、甲状腺功能减退、皮质功能不全、前列腺肥大、排尿困难及严重肝功能不全、休克尚未纠正前、麻痹性肠梗阻等患者禁用吗啡。

(2) 室上心动过速、颅脑损伤、颅内占位性病变、慢性阻塞性肺病、严重肺功能不全患者禁用哌替啶。哌替啶严禁与单胺氧化酶抑制剂合用。

(3) 对曲马多及其赋形剂过敏者，妊娠期妇女，1岁以下儿童，酒精、镇静剂、镇痛药、阿片类或神经类药物急性中毒患者，正在接受单胺氧化酶抑制剂治疗或过去14天内服用过此类药物的患者禁用曲马多。

(4) 支气管哮喘、呼吸抑制、呼吸道梗阻、对芬太尼特别敏感的患者及重症肌无力患者禁用芬太尼。

4. 药物相互作用

(1) 阿片类镇痛药与抗胆碱药尤其是阿托品合用，不仅加重便秘，还可增加麻痹性肠梗阻和尿潴留危险。

(2) 广谱抗生素、头孢菌素、青霉素或林可霉素、克林霉素等诱发的伪膜